

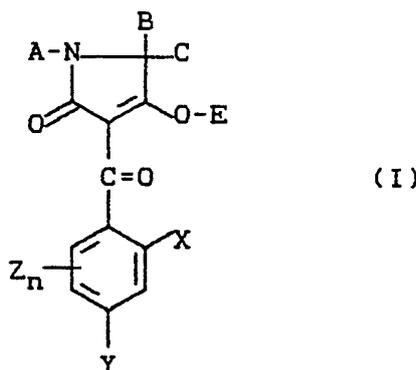


**PCT** WELTORGANISATION FÜR GEISTIGES EIGENTUM  
Internationales Büro  
INTERNATIONALE ANMELDUNG VERÖFFENTLICHT NACH DEM VERTRAG ÜBER DIE  
INTERNATIONALE ZUSAMMENARBEIT AUF DEM GEBIET DES PATENTWESENS (PCT)

<p>(51) Internationale Patentklassifikation <sup>5</sup> : C07D 207/38, 209/54, 471/04 A01N 43/36, 43/38, 43/90 // (C07D 471/04, 221:00, 209:00)</p>	<b>A1</b>	<p>(11) Internationale Veröffentlichungsnummer: <b>WO 94/01401</b></p> <p>(43) Internationales Veröffentlichungsdatum: 20. Januar 1994 (20.01.94)</p>
<p>(21) Internationales Aktenzeichen: PCT/EP93/01690</p> <p>(22) Internationales Anmeldedatum: 30. Juni 1993 (30.06.93)</p> <p>(30) Prioritätsdaten: P 42 23 015.2                      13. Juli 1992 (13.07.92)                      DE</p> <p>(71) Anmelder (für alle Bestimmungsstaaten ausser US): BAYER AKTIENGESELLSCHAFT [DE/DE]; Bayerwerk, D-51368 Leverkusen (DE).</p> <p>(72) Erfinder; und</p> <p>(75) Erfinder/Anmelder (nur für US) : FISCHER, Reiner [DE/DE]; Nelly-Sachs-Strasse 23, D-40789 Monheim (DE). BRETSCHNEIDER, Thomas [DE/DE]; Scheerengasse 7-9, D-53721 Siegburg (DE). SANTEL, Hans-Joachim [DE/DE]; Grünstrasse 9a, D-51371 Leverkusen (DE). LÜRSEN, Klaus [DE/DE]; August-Kierspel-Strasse 145, D-51469 Bergisch-Gladbach (DE). SCHMIDT, Robert, R. [DE/DE]; Im Waldwinkel 110, D-51469 Bergisch-Gladbach (DE). ERDELEN, Christoph [DE/DE]; Unterbüscherhof 22, D-42799 Leichlingen (DE).</p>	<p>(74) Gemeinsamer Vertreter: BAYER AKTIENGESELLSCHAFT; Bayerwerk, D-51368 Leverkusen (DE).</p> <p>(81) Bestimmungsstaaten: AU, BR, BY, CA, CZ, HU, JP, KR, KZ, NZ, RU, SK, UA, US, europäisches Patent (AT, BE, CH, DE, DK, ES, FR, GB, GR, IE, IT, LU, MC, NL, PT, SE).</p> <p><b>Veröffentlicht</b> <i>Mit internationalem Recherchenbericht.</i></p>	

(54) Title: HERBICIDAL AND INSECTICIDAL 3-BENZOYL-PYRROLIDIN-2,4-DIONE DERIVATES

(54) Bezeichnung: HERBIZIDE UND INSEKTIZIDE 3-BENZOYL-PYRROLIDIN-2,4-DION-DERIVATE



(57) Abstract

New substituted 3-benzoyl-pyrrolidin-2,4-dione derivatives are disclosed having general formula (I), in which A, B, C, E, X, Y, Z and n have the meanings given in the description, as well as several processes for preparing the same, new intermediate products for preparing the same and their use as herbicides, insecticides and acaricides.

(57) Zusammenfassung

Die Erfindung betrifft neue substituierte 3-Benzoyl-pyrrolidin-2,4-dion-Derivate der allgemeinen Formel (I) in welcher A, B, C, E, X, Y, Z und n die in der Beschreibung angegebenen Bedeutungen haben, mehrere Verfahren zu ihrer Herstellung, neue Zwischenprodukte zu ihrer Herstellung und ihre Verwendung als Herbizide, Insektizide und Akarizide.

**LEDIGLICH ZUR INFORMATION**

Code, die zur Identifizierung von PCT-Vertragsstaaten auf den Kopfbögen der Schriften, die internationale Anmeldungen gemäss dem PCT veröffentlichen.

AT	Österreich	FI	Finnland	MR	Mauritanien
AU	Australien	FR	Frankreich	MW	Malawi
BB	Barbados	GA	Gabon	NE	Niger
BE	Belgien	GB	Vereinigtes Königreich	NL	Niederlande
BF	Burkina Faso	GN	Guinea	NO	Norwegen
BG	Bulgarien	GR	Griechenland	NZ	Neuseeland
BJ	Benin	HU	Ungarn	PL	Polen
BR	Brasilien	IE	Irland	PT	Portugal
BY	Belarus	IT	Italien	RO	Rumänien
CA	Kanada	JP	Japan	RU	Russische Föderation
CF	Zentrale Afrikanische Republik	KP	Demokratische Volksrepublik Korea	SD	Sudan
CG	Kongo	KR	Republik Korea	SE	Schweden
CH	Schweiz	KZ	Kasachstan	SI	Slowenien
CI	Côte d'Ivoire	LI	Liechtenstein	SK	Slowakischen Republik
CM	Kamerun	LK	Sri Lanka	SN	Senegal
CN	China	LU	Luxemburg	TD	Tschad
CS	Tschechoslowakei	LV	Lettland	TG	Togo
CZ	Tschechischen Republik	MC	Monaco	UA	Ukraine
DE	Deutschland	MG	Madagaskar	US	Vereinigte Staaten von Amerika
DK	Dänemark	ML	Mali	UZ	Usbekistan
ES	Spanien	MN	Mongolei	VN	Vietnam

5

10

HERBIZIDE UND INSEKTIZIDE 3-BENZOYL-PYRROLIDIN-2,4-DION-DERIVATE

15 Die Erfindung betrifft neue substituierte 3-Benzoyl-pyrrolidin-2,4-dion-Derivate, mehrere Verfahren zu ihrer Herstellung, neue Zwischenprodukte zu ihrer Herstellung und ihre Verwendung als Herbizide, Insektizide und Akarizide.

20

Von 3-Acyl-pyrrolidin-2,4-dionen sind pharmazeutische Eigenschaften vorbeschrieben (S. Suzuki et. al. Chem. Pharm. Bull. 15 1120 (1967), S Toda et al. J. Antibiotics 33, 173 (1980), Reichart Jr. K.L. et al. J. Am. Chem. Soc. 100, 4225 (1978).

25

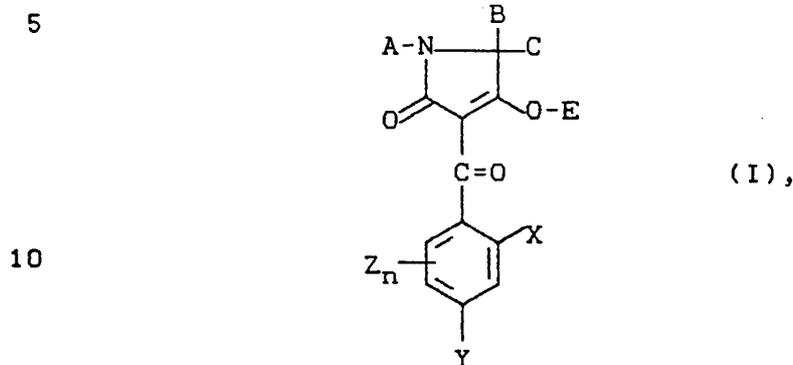
In WO 8804-652 werden 3-Benzoyl-furan-2-on-Derivate mit herbiziden Eigenschaften beschrieben, unter anderem die Verbindung 3-(2,4-Dichlorbenzoyl)-4-hydroxy-6-methyl-N-methyl-pyridon-2.

30

Es wurden nun neue substituierte 3-Benzoyl-pyrrolidin-2,4-dion-Derivate gefunden, die durch die Formel (I) dargestellt sind

35

- 2 -



in welcher

15

X für Wasserstoff, Alkyl, Halogen, Alkoxy, Halogenalkyl, Halogenalkoxy, Nitro, Alkoxy-carbonyl, Carboxy, Cyano oder  $-S(O)_m-R^1$  steht,

20

Y für Wasserstoff, Alkyl, Halogen, Alkoxy, Halogenalkyl, Halogenalkoxy, Nitro, Alkoxy-carbonyl, Carboxy, Cyano oder  $-S(O)_m-R^1$  steht,

25

Z für Alkyl, Halogen, Alkoxy, Halogenalkyl, gegebenenfalls durch Halogen substituiertes Alkoxy, Alkoxyalkyl oder Alkoxy-carbonyl steht,

n für eine Zahl von 0-3 steht,

30

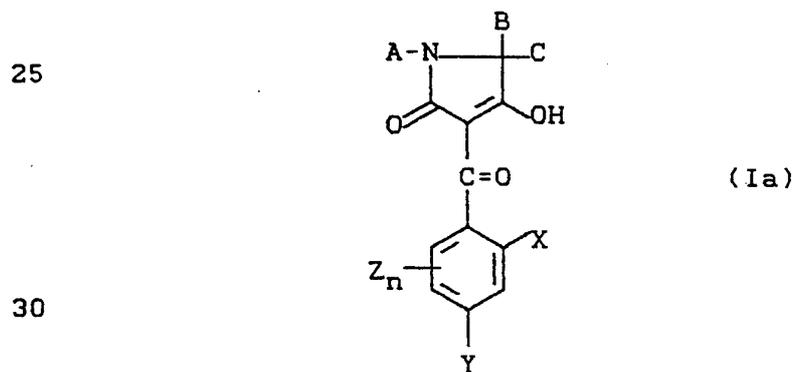
m für eine Zahl von 0-2 steht,

35

A für Wasserstoff, gegebenenfalls durch Halogen substituiertes Alkyl, Alkoxyalkyl, Polyalkoxyalkyl, Alkylthioalkyl, Alkenyl, Alkynyl, gegebenenfalls durch Heteroatome unterbrochenes Cycloalkyl oder gegebenenfalls durch Halogen-, Alkyl-, Halogen-

- 5 alkyl-, Alkoxy-, Nitro substituiertes Phenyl oder Arylalkyl steht,
- B für Wasserstoff, gegebenenfalls durch Halogen substituiertes Alkyl, Cycloalkyl, Alkoxyalkyl, Alkylthioalkyl oder gegebenenfalls durch Alkyl, 10 Alkoxy, Halogen, Nitro, Halogenalkyl, substituiertes Phenyl oder Aralkyl steht,
- C für Wasserstoff, oder gegebenenfalls durch 15 Halogen substituiertes Alkyl steht,
- oder worin
- A und B gemeinsam mit den Atomen, an die sie gebunden 20 sind, einen gegebenenfalls durch Halogen oder gegebenenfalls halogeniertes Alkyl oder Alkoxy substituierten gesättigten oder ungesättigten Cyclus bilden, der durch Sauerstoff und/oder Schwefel unterbrochen sein kann, 25
- oder worin
- B und C gemeinsam mit dem Kohlenstoffatom, an das sie 30 gebunden sind, einen gesättigten oder ungesättigten Cyclus bilden, der durch Halogen, oder gegebenenfalls durch halogeniertes Alkyl oder Alkoxy substituiert sein kann und durch Sauerstoff und/oder Schwefel unterbrochen sein kann, 35

- 5 E für Wasserstoff (= E<sup>1</sup>), oder für gegebenenfalls durch Halogen substituiertes Alkyl, Alkenyl, Alkynyl, Alkoxyalkyl, Aralkyl (= E<sup>2</sup>), für eine Gruppe CO-R<sup>2</sup> (= E<sup>3</sup>) oder für ein Metallion oder Metallequivalent (= E<sup>4</sup>) steht,
- 10 R<sup>1</sup> für gegebenenfalls durch Halogen substituiertes Alkyl oder für einen gegebenenfalls substituierten Phenylrest steht und
- 15 R<sup>2</sup> für gegebenenfalls durch Halogen substituiertes Alkyl, Alkenyl, Alkoxy, Alkoxyalkyl, Alkylthio oder gegebenenfalls substituiertes Phenyl oder Aralkyl steht.
- 20 Weiterhin wurde gefunden, daß man 3-Benzoyl-pyrrolidin-2,4-dion-Derivate der Formel (I) bzw. deren Enole der Formel (Ia)

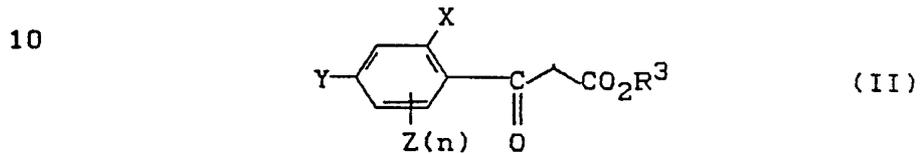


in welcher

- 35 A, B, C, X, Y, Z und n die oben angegebenen Bedeutungen haben,

5 erhält, wenn man

A) Benzoylessigester der Formel (II)

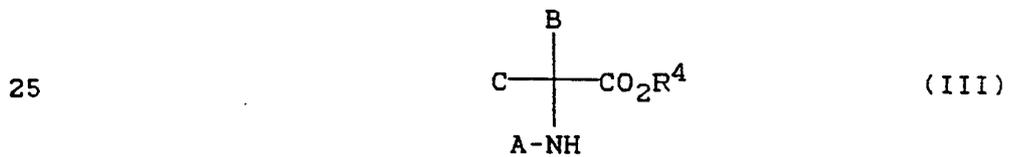


15 in welcher

X, Y, Z und n die oben angegebenen Bedeutungen  
haben und

20  $R^3$  für Alkyl steht

mit Aminosäureestern der allgemeinen Formel (III)



in welcher

30 A, B und C die oben angegebenen Bedeutungen haben  
und

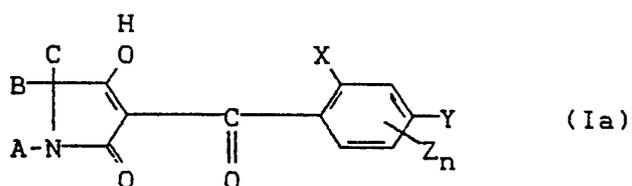
$R^4$  für Alkyl steht,

35

5  
 und in Gegenwart einer Base kondensiert, oder daß  
 man

B) Verbindungen der Formel (Ia)

10



15

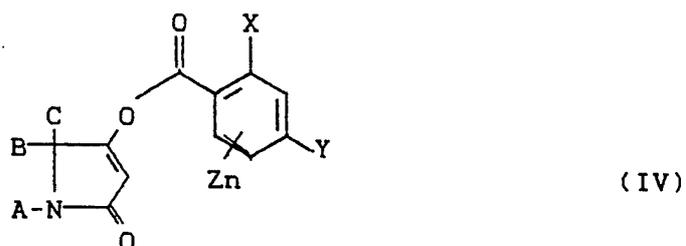
in welcher

A, B, C, X, Y, Z, und n die oben angegebenen  
 Bedeutungen haben,

20

erhält, wenn man 4-Benzoyloxy-pyrrolin-2-one der  
 Formel (IV)

25



30

35

- 7 -

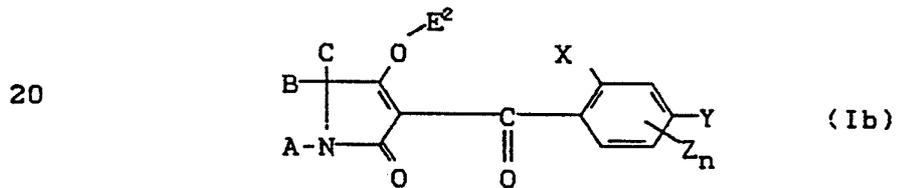
5 in welcher

A, B, C, X, Y, Z und n die oben angegebenen Bedeu-  
tungen haben,

10 gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungs-  
mittels, gegebenenfalls in Gegenwart einer  
Base und gegebenenfalls in Gegenwart eines  
geeigneten Katalysators umlagert,  
oder daß man

15

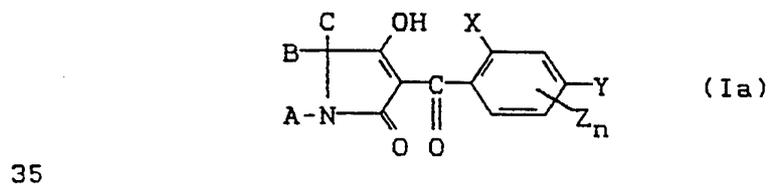
C) Verbindungen der Formel (Ib)



25 in welcher

A, B, C, E<sup>2</sup>, X, Y, Z und n die oben angegebenen  
Bedeutungen haben,

30 erhält, wenn man Verbindungen der Formel (Ia),



5 in welcher

A, B, C, X, Y, Z und n die oben angegebenen  
Bedeutungen haben,

10 mit Alkylierungsmitteln der allgemeinen Formel (V)



in welcher

15

$E^2$  die oben angegebene Bedeutung hat und

L für Halogen,  $-OSO_2$ -Alkyl,  $-OSO_2O$ -Alkyl oder  
 $-OSO_2$ -Aryl steht,

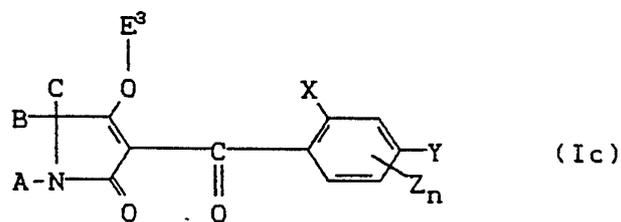
20

gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungs-  
mittels und gegebenenfalls in Gegenwart einer  
Base umgesetzt, oder daß man

25

D) Verbindungen der Formel (Ic)

30

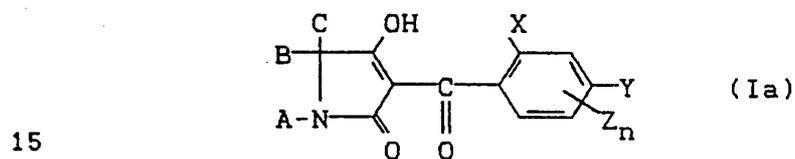


35

5 in welcher

A, B, C, E<sup>3</sup>, X, Y, Z und n die oben angegebenen  
Bedeutungen haben,

10 erhält, wenn man Verbindungen der Formel (Ia)



in welcher

20 A, B, C, X, Y, Z und n die oben angegebenen Bedeu-  
tungen haben

mit Acylierungsreagenzien der Formel (VI)

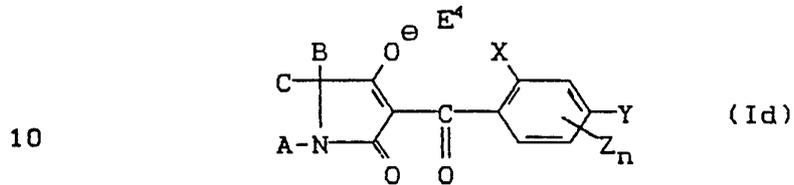
25  $E^3 - M$  (VI)

in welcher

30 E<sup>3</sup> die oben angegebene Bedeutung hat und  
M für Halogen, -OE<sup>3</sup>, CN, O-SO<sub>2</sub>-Alkyl, O-  
SO<sub>2</sub>-Aryl und Imidazolyl steht,

35 gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungs-  
mittels und gegebenenfalls in Gegenwart einer  
Base umgesetzt, oder daß man

5 E) Verbindungen der allgemeinen Formel (Id)



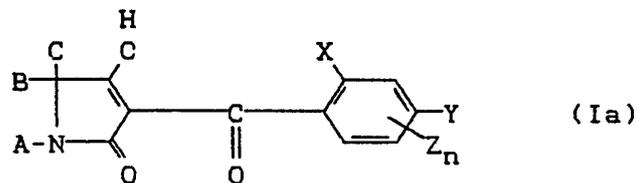
in welcher

15

X, Y, Z, A, B, C, E<sup>+</sup> und n die oben angegebenen Bedeutungen haben,

erhält, wenn man Verbindungen der Formel (Ia)

20



25

in welcher

30

X, Y, Z, A, B, C und n die oben angegebenen Bedeutungen haben,

mit Metallhydroxiden oder Aminen der allgemeinen Formel (VII) und (VIII)

35



- 5 in welchen
- Me für ein- oder zweiwertige Metallionen,
- s und t für die Zahlen 1 und 2 stehen und
- 10  $R^4$ ,  $R^5$  und  $R^6$  unabhängig voneinander für Wasserstoff und Alkyl stehen,
- gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels, umgesetzt.
- 15
- Überraschenderweise wurde gefunden, daß die neuen 3-Benzoyl-pyrrolidin-2,4-dion-Derivate der Formel I sich durch sehr gute herbizide Wirkungen auszeichnen.
- 20 Bevorzugt sind substituierte 3-Benzoyl-pyrrolidin-2,4-dion-Derivate der Formel (I), in welcher
- X für Wasserstoff,  $C_1-C_6$ -Alkyl, Halogen,  $C_1-C_6$ -Alkoxy,  $C_1-C_6$ -Halogenalkyl,  $C_1-C_6$ -Halogenalkoxy, Nitro,  $C_1-C_6$ -Alkoxy-carbonyl,  $C_1-C_6$ -Carboxy, Cyano oder  $S(O)_m-R^1$  steht,
- 25
- Y für Wasserstoff,  $C_1-C_6$ -Alkyl, Halogen,  $C_1-C_6$ -Alkoxy,  $C_1-C_4$ -Halogenalkyl,  $C_1-C_6$ -Halogenalkoxy, Nitro,  $C_1-C_6$ -Alkoxy-carbonyl,  $C_1-C_6$ -Carboxy, Cyano oder  $S(O)_m-R^1$  steht,
- 30
- Z für  $C_1-C_6$ -Alkyl, Halogen,  $C_1-C_6$ -Alkoxy,  $C_1-C_6$ -Halogenalkyl,  $C_1-C_6$ -Halogenalkoxy,  $C_1-C_6$ -Alkoxy-
- 35

- 12 -

- 5 C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkoxy-C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-alkyl, C<sub>1</sub>-  
C<sub>6</sub>-Alkoxy-C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-halogenalkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkoxy-carbonyl  
oder C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkoxy-carbonyl steht,
- 10 n für eine Zahl von 0-3 steht,
- m für eine Zahl von 0-2 steht,
- 15 A für Wasserstoff oder gegebenenfalls durch Halogen  
substituiertes geradkettiges oder verzweigtes C<sub>1</sub>-  
C<sub>12</sub>-Alkyl, C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>-Alkenyl, C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>-Alkinyl, C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub>-  
Alkoxy-C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>-alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-Polyalkoxy-C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>-alkyl,  
C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub>-Alkylthio-C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>-alkyl, Cycloalkyl mit 3-8  
20 Ringatomen, das durch Sauerstoff und/oder Schwefel  
unterbrochen sein kann oder gegebenenfalls durch  
Halogen, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkyl-, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Haloalkyl-, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-  
Alkoxy-, Nitro substituiertes Phenyl oder Aryl-  
C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkyl steht,
- 25 B für Wasserstoff, geradkettiges oder verzweigtes und  
gegebenenfalls durch Halogen substituiertes C<sub>1</sub>-C<sub>12</sub>-  
Alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-Alkoxy-C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-Alkyl-C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-  
thioalkyl, Cycloalkyl mit 3-8 Ringatomen, das durch  
Sauerstoff und/oder Schwefel unterbrochen sein  
30 kann, oder gegebenenfalls durch Halogen, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-  
Alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkoxy, Nitro  
substituiertes Phenyl oder Aryl-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkyl steht,
- C für Wasserstoff oder gegebenenfalls durch Halogen  
substituiertes C<sub>1</sub>-C<sub>12</sub>-Alkyl steht, oder worin  
35

5 A und B gemeinsam mit den Atomen, an die sie gebunden  
sind, einen 5 bis 8-gliedrigen gesättigten oder  
ungesättigten Cyclus bilden, der durch Sauerstoff  
und/oder Schwefel unterbrochen und durch gegebene-  
10 nenfalls halogeniertes C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkoxy  
oder Halogen substituiert sein kann,

oder worin

15 B und C gemeinsam mit dem Kohlenstoffatom, an das sie  
gebunden sind einen 3 bis 8-gliedrigen gesättigten  
oder ungesättigten Cyclus bilden, der durch Sauer-  
stoff und/oder Schwefel unterbrochen und durch  
Halogen oder gegebenenfalls halogeniertes C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-  
20 Alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkoxy substituiert sein kann,

E für E<sup>1</sup> = Wasserstoff,  
für E<sup>2</sup> = C<sub>1</sub>-C<sub>12</sub>-Alkyl, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkyl, C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>-  
Alkenyl, C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>-Alkinyl, C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>-Halogenalkenyl, C<sub>3</sub>-  
C<sub>8</sub>-Halogenalkinyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkoxy-C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-  
25 Halogenalkoxy-C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-alkyl, Aryl-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkyl,  
für E<sup>3</sup> = eine Gruppe CO-R<sup>2</sup> oder  
für E<sup>4</sup> = ein Metallion oder ein Metallequivalent  
steht,

30 R<sup>1</sup> für gegebenenfalls durch Halogen substituiertes  
C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-Alkyl, oder für gegebenenfalls durch Halogen,  
Nitro, Cyano, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkoxy, C<sub>1</sub>-  
C<sub>4</sub>-Alkylthio, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkylthio, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl,  
C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkyl substituiertes Phenyl steht und  
35

5 R<sup>2</sup> für gegebenenfalls durch Halogen substituiertes  
C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-Alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-Alkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-Alkylthio, C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>-  
Alkenyl, C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-Alkoxy-C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>-alkyl oder für gege-  
benenfalls durch Halogen, C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-Halogenalkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-  
Alkyl oder C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-Alkoxy substituiertes Phenyl, für  
10 gegebenenfalls durch Halogen, C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-Alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-  
Halogenalkyl oder C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-Alkoxy substituiertes Aryl-  
C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkyl steht.

15 Besonders bevorzugt sind Verbindungen der Formel (I) in  
welcher

X für Wasserstoff, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl, Halogen, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Al-  
koxy, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkoxy,  
Nitro, Cyano, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy-carbonyl, Carboxy oder  
20 S(O)<sub>m</sub>-R<sup>1</sup> steht,

Y für Wasserstoff, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkyl, Halogen, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-  
Alkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>-Halogenalkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkoxy,  
Nitro, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy-carbonyl, Carboxy, Cyano oder  
25 S(O)<sub>m</sub>-R<sup>1</sup> steht,

Z für C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl, Halogen, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-  
Halogenalkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy-C<sub>2</sub>-  
C<sub>4</sub>-alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkoxy-C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>-alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Al-  
koxy-C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>-halogenalkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy-carbonyl oder  
30 C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkoxy-carbonyl steht,

n für eine Zahl von 0-3 steht,

35

- 5 m für eine Zahl von 0-2 steht,
- A für Wasserstoff oder gegebenenfalls durch Halogen  
substituiertes geradkettiges oder verzweigtes C<sub>1</sub>-  
C<sub>10</sub>-Alkyl, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-Alkenyl, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-Alkynyl, C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-  
10 Alkoxy-C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Polyalkoxy-C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-alkyl,  
C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-Alkylthio-C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-alkyl, Cycloalkyl mit 3-7  
Ringatomen, das durch 1-2 Sauerstoff- und/oder  
Schwefelatome unterbrochen sein kann oder gegebe-  
nenfalls durch Halogen, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl-, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halo-  
15 alkyl-, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy oder Nitro substituiertes  
Phenyl oder Aryl-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alkyl steht,
- B für Wasserstoff, geradkettiges oder verzweigtes und  
gegebenenfalls durch Halogen substituiertes C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub>-  
20 Alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkoxy-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkylthio-C<sub>1</sub>-  
C<sub>6</sub>-alkyl, Cycloalkyl mit 3-7 Ringatomen das durch  
1-2 Sauerstoff und/oder Schwefelatome unterbrochen  
sein kann oder gegebenenfalls durch Halogen, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-  
Alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy oder Nitro  
25 substituiertes Phenyl oder Aryl-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alkyl steht,
- C für Wasserstoff oder gegebenenfalls durch Halogen  
substituiertes C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-Alkyl steht, oder worin
- 30 A und B gemeinsam mit den Atomen, an die sie gebunden  
sind, einen 5 bis 7-gliedrigen gesättigten oder un-

5 gesättigten Cyclus bilden, der durch C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy, Fluor oder Chlor substituiert und der durch Sauerstoff und/oder Schwefel unterbrochen sein kann,

10 oder worin

B und C gemeinsam mit dem Kohlenstoffatom, an das sie gebunden sind, einen 3 bis 7-gliedrigen gesättigten oder ungesättigten Cyclus bilden, der durch Sauerstoff und/oder Schwefel unterbrochen und durch  
15 Fluor, Chlor, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkoxy substituiert sein kann,

20 E für E<sup>1</sup> = Wasserstoff  
für E<sup>2</sup> = C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-Alkyl, C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkyl, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-Alkenyl, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-Alkinyl, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkenyl, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkinyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy-C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>-alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkoxy-C<sub>2</sub>-  
25 C<sub>4</sub>-alkyl, Aryl-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alkyl,

für E<sup>3</sup> = eine Gruppe CO-R<sup>2</sup> oder

für E<sup>4</sup> = ein Metallion oder ein Metallequivalent steht,

30

R<sup>1</sup> für gegebenenfalls durch Halogen substituiertes C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkyl oder für gegebenenfalls durch Fluor, Chlor, Brom, Nitro, Cyano, C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>-Alkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>-Halogenalkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>-Alkylthio, C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>-Halogenalkylthio, C<sub>1</sub>-  
35

- 5 C<sub>3</sub>-Alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>-Halogenalkyl substituiertes Phenyl,  
steht und
- 10 R<sup>2</sup> für gegebenenfalls durch Halogen substituiertes C<sub>1</sub>-  
C<sub>6</sub>-Alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkylthio, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-Al-  
kenyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkoxy-C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-alkyl oder für gegebenen-  
falls durch Halogen, C<sub>1</sub>-C<sub>5</sub>-Halogenalkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>5</sub>-Alkyl  
oder C<sub>1</sub>-C<sub>5</sub>-Alkoxy substituiertes Phenyl, für gege-  
benenfalls durch Halogen, C<sub>1</sub>-C<sub>5</sub>-Alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>5</sub>-Halo-  
genalkyl oder C<sub>1</sub>-C<sub>5</sub>-Alkoxy substituiertes Aryl-C<sub>1</sub>-  
15 C<sub>4</sub>-alkyl steht.

Ganz besonders bevorzugt sind Verbindungen der Formel  
(I) in welcher

- 20 X für Wasserstoff, Methyl, Ethyl, Propyl, i-Propyl,  
Fluor, Chlor, Brom, Methoxy, Ethoxy, Trifluormethyl,  
Difluormethyl, Trifluormethoxy, Nitro, Methoxy-  
carbonyl, Ethoxycarbonyl, Cyano oder S(O)<sub>m</sub>R<sup>1</sup> steht,
- 25 Y für Wasserstoff, Methyl, Ethyl, Propyl, i-Propyl,  
Butyl, i-Butyl, tert.-Butyl, Fluor, Chlor, Brom,  
Methoxy, Ethoxy, Trifluormethyl, Trifluormethoxy,  
Difluormethyl, Nitro, Methoxycarbonyl, Ethoxycarbo-  
nyl, Cyano oder S(O)<sub>m</sub>R<sup>1</sup> steht,
- 30

- 5 Z für Methyl, Ethyl, i-Propyl, Butyl, i-Butyl, tert.-  
Butyl, Fluor, Chlor, Brom, Methoxy, Ethoxy, Tri-  
fluormethyl, Difluormethyl, Trifluormethoxy,  
Methoxyethyl, Ethoxyethyl, Propoxyethyl, Isoproxy-  
ethyl, Methoxycarbonyl, Ethoxycarbonyl steht,  
10
- n für eine Zahl von 0-3 steht,
- m für eine Zahl von 0-2 steht,
- 15 A für Wasserstoff, gegebenenfalls durch Halogen sub-  
stituiertes geradkettiges oder verzweigtes C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-  
Alkyl, C<sub>3</sub>-C<sub>4</sub>-Alkenyl, C<sub>3</sub>-C<sub>4</sub>-Alkinyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkoxy-  
C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>-alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Polyalkoxy-C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>-alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-  
Alkylthio-C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>-alkyl, Cycloalkyl mit 3-6 Ring-  
20 atomen, das durch 1-2 Sauerstoff- und/oder Schwe-  
felatome unterbrochen sein kann oder gegebenen-  
falls durch Fluor-, Chlor-, Brom-, Methyl-, Ethyl-,  
Propyl-, iso-Propyl-, Methoxy-, Ethoxy-, Trifluor-  
methyl-, Nitro substituiertes Phenyl oder Aryl-C<sub>1</sub>-  
25 C<sub>3</sub>-alkyl steht,
- B für Wasserstoff, geradkettiges oder verzweigtes und  
gegebenenfalls durch Halogen substituiertes C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-  
Alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkylthio-C<sub>1</sub>-  
30 C<sub>4</sub>-alkyl, Cycloalkyl mit 3-6 Ringatomen, das durch  
1-2 Sauerstoff und/oder Schwefelatome unterbrochen  
sein kann oder gegebenenfalls durch Halogen,
- 35

5 C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy oder Nitro substituiertes Phenyl oder Aryl-C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>-alkyl steht,

10 C für Wasserstoff, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkyl oder C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkyl steht,

oder worin

15 A und B gemeinsam mit den Atomen, an die sie gebunden sind, einen 5 bis 6-gliedrigen gesättigten oder ungesättigten Cyclus bilden, der durch C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>-Alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>-Alkoxy, Fluor oder Chlor substituiert und der durch Sauerstoff und/oder Schwefel unterbrochen sein kann,

20

oder worin

25 B und C gemeinsam mit dem Kohlenstoff, an das sie gebunden sind, einen 3 bis 6-gliedrigen gesättigten oder ungesättigten Cyclus bilden, der durch Sauerstoff und/oder Schwefel unterbrochen und durch Fluor, Chlor, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy, Trifluormethyl oder Trifluormethoxy substituiert sein kann,

30 E für E<sup>1</sup> = Wasserstoff steht,  
für E<sup>2</sup> = C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkyl, C<sub>2</sub>-C<sub>3</sub>-Halogenalkyl, C<sub>3</sub>-C<sub>4</sub>-Alkenyl, C<sub>3</sub>-C<sub>4</sub>-Alkinyl, C<sub>3</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenal-

35

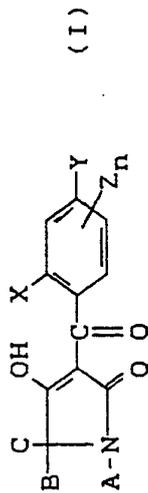
- 20 -

- 5 kenyl, C<sub>3</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkinyl, C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>-Alk-  
oxy-C<sub>2</sub>-C<sub>3</sub>-alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>-Halogenalkoxy-C<sub>2</sub>-  
C<sub>3</sub>-alkyl, Aryl-C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>-alkyl steht,  
für E<sup>3</sup> = eine Gruppe CO-R<sup>2</sup> oder  
für E<sup>4</sup> = Li<sup>⊕</sup>, Na<sup>⊕</sup>, K<sup>⊕</sup>, NH<sub>4</sub><sup>⊕</sup> steht,
- 10 R<sup>1</sup> für gegebenenfalls durch Fluor substituiertes C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-  
Alkyl oder für gegebenenfalls durch Fluor, Chlor,  
Brom, Nitro, Cyano, C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>-Alkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>-Fluoralkoxy,  
C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>-Chloralkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>-Alkylthio, C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>-Fluor-  
15 alkylthio, C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>-Chloralkylthio, C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>-Alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>-  
Fluoralkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>-Difluoralkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>-Trifluoralkyl,  
C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>-Chloralkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>-Dichloralkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>-Tri-  
chloralkyl substituiertes Phenyl steht,
- 20 R<sup>2</sup> für gegebenenfalls durch Fluor, Chlor, Brom  
substituiertes C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-  
Alkylthio, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy-(C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>)alkyl oder für  
gegebenenfalls durch Fluor, Chlor, Brom, Trifluor-  
methyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl oder C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy substituiertes  
25 Phenyl, für gegebenenfalls durch Fluor, Chlor, Brom,  
C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl, Trifluormethyl oder C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy  
substituiertes Aryl-C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>-alkyl steht.

30 Im einzelnen seien außer den bei den Herstellungsbei-  
spielen genannten Verbindungen die folgenden substitu-  
ierten 3-Benzoyl-pyrrolidin-2,4-dion-Derivate der all-  
gemeinen Formel I genannt:

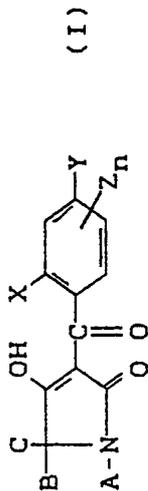
35

Table 1



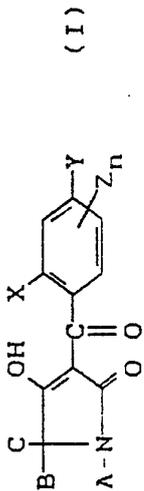
X	Y	Zn	A	B	C
Cl	Cl	H	H	H	H
Cl	Cl	H	H	CH <sub>3</sub>	H
Cl	Cl	H	H	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H
Cl	Cl	H	H	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
Cl	Cl	H	H	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	CH <sub>3</sub>
Cl	Cl	H	H	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
Cl	Cl	H	H	C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	CH <sub>3</sub>
Cl	Cl	H	H	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	CH <sub>3</sub>
Cl	Cl	H	H	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -	
Cl	Cl	H	H	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -	
Cl	Cl	H	H	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -	
Cl	Cl	H	H	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H
Cl	Cl	H	H	C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	H
Cl	Cl	H	H	CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H
Cl	Cl	H	H	CH-C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>   CH <sub>3</sub>	H

Tabelle 1 (Fortsetzung)



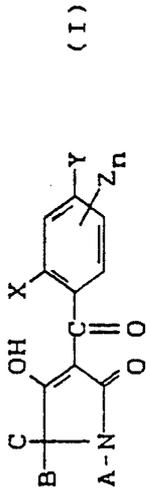
X	Y	Zn	A	B	C
NO <sub>2</sub>	H	H	H	H	H
NO <sub>2</sub>	H	H	H	CH <sub>3</sub>	H
NO <sub>2</sub>	H	H	H	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H
NO <sub>2</sub>	H	H	H	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
NO <sub>2</sub>	H	H	H	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	CH <sub>3</sub>
NO <sub>2</sub>	H	H	H	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
NO <sub>2</sub>	H	H	H	C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	CH <sub>3</sub>
NO <sub>2</sub>	H	H	H	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	CH <sub>3</sub>
NO <sub>2</sub>	H	H	H		-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -
NO <sub>2</sub>	H	H	H		-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -
NO <sub>2</sub>	H	H	H		-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -
NO <sub>2</sub>	H	H	H	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H
NO <sub>2</sub>	H	H	H	C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	H
NO <sub>2</sub>	H	H	H	CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H
NO <sub>2</sub>	H	H	H	CH-C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H
				CH <sub>3</sub>	

Tabella 1 (Fortsetzung)



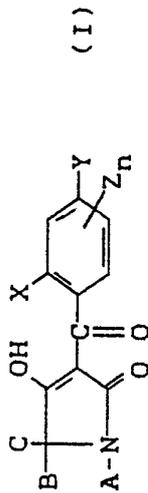
X	Y	Zn	A	B	C
H	NO <sub>2</sub>	H	H	H	H
H	NO <sub>2</sub>	H	H	CH <sub>3</sub>	H
H	NO <sub>2</sub>	H	H	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H
H	NO <sub>2</sub>	H	H	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
H	NO <sub>2</sub>	H	H	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	CH <sub>3</sub>
H	NO <sub>2</sub>	H	H	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
H	NO <sub>2</sub>	H	H	C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	CH <sub>3</sub>
H	NO <sub>2</sub>	H	H	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	CH <sub>3</sub>
H	NO <sub>2</sub>	H	H		-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -
H	NO <sub>2</sub>	H	H		-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -
H	NO <sub>2</sub>	H	H		-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -
H	NO <sub>2</sub>	H	H	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H
H	NO <sub>2</sub>	H	H	C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	H
H	NO <sub>2</sub>	H	H	CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H
H	NO <sub>2</sub>	H	H	CH-C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>   CH <sub>3</sub>	H

Tabelle 1 (Fortsetzung)



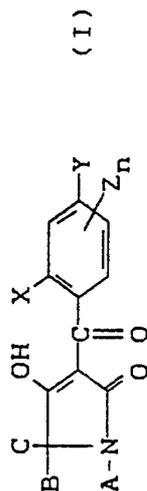
X	Y	Zn	A	B	C
NO <sub>2</sub>	Cl	H	H	H	H
NO <sub>2</sub>	Cl	H	H	CH <sub>3</sub>	H
NO <sub>2</sub>	Cl	H	H	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H
NO <sub>2</sub>	Cl	H	H	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
NO <sub>2</sub>	Cl	H	H	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	CH <sub>3</sub>
NO <sub>2</sub>	Cl	H	H	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
NO <sub>2</sub>	Cl	H	H	C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	CH <sub>3</sub>
NO <sub>2</sub>	Cl	H	H	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	CH <sub>3</sub>
NO <sub>2</sub>	Cl	H	H		-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -
NO <sub>2</sub>	Cl	H	H		-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -
NO <sub>2</sub>	Cl	H	H		-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -
NO <sub>2</sub>	Cl	H	H	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H
NO <sub>2</sub>	Cl	H	H	C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	H
NO <sub>2</sub>	Cl	H	H	CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H
NO <sub>2</sub>	Cl	H	H	CH-C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H
				CH <sub>3</sub>	

Tabelle 1 (Fortsetzung)



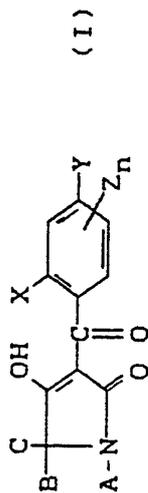
X	Y	Zn	A	B	C
Cl	SO <sub>2</sub> Me	H	H	H	H
Cl	SO <sub>2</sub> Me	H	H	CH <sub>3</sub>	H
Cl	SO <sub>2</sub> Me	H	H	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H
Cl	SO <sub>2</sub> Me	H	H	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
Cl	SO <sub>2</sub> Me	H	H	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	CH <sub>3</sub>
Cl	SO <sub>2</sub> Me	H	H	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
Cl	SO <sub>2</sub> Me	H	H	C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	CH <sub>3</sub>
Cl	SO <sub>2</sub> Me	H	H	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	CH <sub>3</sub>
Cl	SO <sub>2</sub> Me	H	H		-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -
Cl	SO <sub>2</sub> Me	H	H		-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -
Cl	SO <sub>2</sub> Me	H	H		-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -
Cl	SO <sub>2</sub> Me	H	H	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H
Cl	SO <sub>2</sub> Me	H	H	C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	H
Cl	SO <sub>2</sub> Me	H	H	CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H
Cl	SO <sub>2</sub> Me	H	H	CH-C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H
				CH <sub>3</sub>	

Tabelle 1 (Fortsetzung)



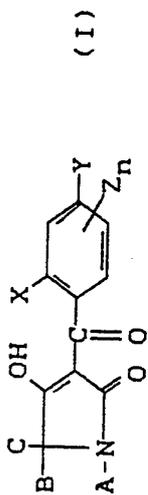
X	Y	Zn	A	B	C
Cl	SO <sub>2</sub> Me	3-O-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -OCH <sub>3</sub>	H	H	H
Cl	SO <sub>2</sub> Me	"	H	H	CH <sub>3</sub>
Cl	SO <sub>2</sub> Me	"	H	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H
Cl	SO <sub>2</sub> Me	"	H	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
Cl	SO <sub>2</sub> Me	"	H	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	CH <sub>3</sub>
Cl	SO <sub>2</sub> Me	"	H	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
Cl	SO <sub>2</sub> Me	"	H	C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	CH <sub>3</sub>
Cl	SO <sub>2</sub> Me	"	H	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	CH <sub>3</sub>
Cl	SO <sub>2</sub> Me	"	H	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub>	
Cl	SO <sub>2</sub> Me	"	H	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub>	
Cl	SO <sub>2</sub> Me	"	H	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub>	
Cl	SO <sub>2</sub> Me	"	H	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H
Cl	SO <sub>2</sub> Me	"	H	C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	H
Cl	SO <sub>2</sub> Me	"	H	CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H
Cl	SO <sub>2</sub> Me	"	H	CH-C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H
				CH <sub>3</sub>	

Tabelle 1 (Fortsetzung)



X	Y	Zn	A	B	C
Cl	Cl	H	CH <sub>3</sub>	H	H
Cl	Cl	H	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	H
Cl	Cl	H	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H
Cl	Cl	H	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	CH <sub>3</sub>	H
Cl	Cl	H	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H
Cl	Cl	H	C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	CH <sub>3</sub>	H
Cl	Cl	H	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	CH <sub>3</sub>	H
Cl	Cl	H		-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -	H
Cl	Cl	H		-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -	H
Cl	Cl	H	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	H
Cl	Cl	H	C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	H	H
Cl	Cl	H	CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	H
Cl	Cl	H	CH-C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>   CH <sub>3</sub>	H	H

Tabelle 1 (Fortsetzung)

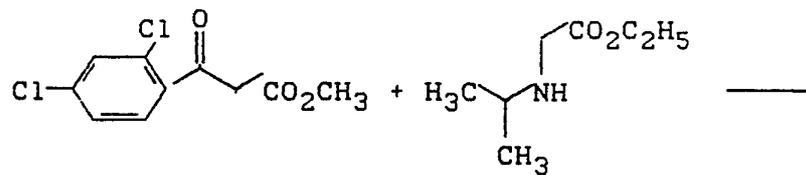


X	Y	Zn	A	B	C
Cl	Cl	H	Cyc. -C <sub>3</sub> H <sub>5</sub>	H	H
Cl	Cl	H	Cyc. -C <sub>3</sub> H <sub>5</sub>	CH <sub>3</sub>	H
Cl	Cl	H	Cyc. -C <sub>5</sub> H <sub>9</sub>	H	H
Cl	Cl	H	Cyc. -C <sub>5</sub> H <sub>9</sub>	CH <sub>3</sub>	H
Cl	Cl	H	Cyc. -C <sub>6</sub> C <sub>11</sub>	H	H
Cl	Cl	H	Cyc. -C <sub>6</sub> H <sub>11</sub>	CH <sub>3</sub>	H
Cl	Cl	H	Phenyl	H	H
Cl	Cl	H	Phenyl	CH <sub>3</sub>	H
Cl	Cl	H	Benzyl	H	H
Cl	Cl	H	Benzyl	CH <sub>3</sub>	H
Cl	Cl	H	CH <sub>2</sub> =CHCH <sub>2</sub>	H	H
Cl	Cl	H	CH <sub>2</sub> =CHCH <sub>2</sub>	CH <sub>3</sub>	H
Cl	Cl	H	CH <sub>3</sub>	Benzyl	H
Cl	Cl	H	CH <sub>3</sub>	Phenyl	H

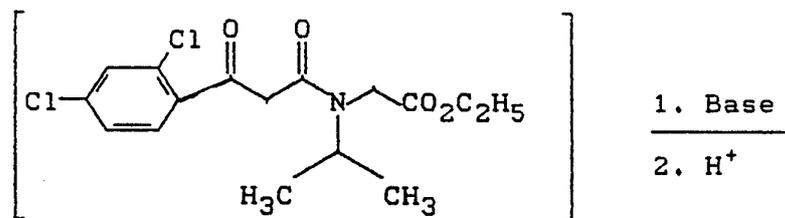
5

Verwendet man gemäß Verfahren (A) 2,4-Dichlor-benzoyl-essigsäure-methylester und N-Isopropyl-glycin-ethylester als Ausgangsstoffe und Natriumethylat als Base, so kann der Verlauf des erfindungsgemäßen Verfahrens durch folgendes Reaktionsschema wiedergegeben werden:

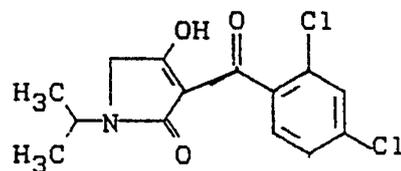
10



15



20

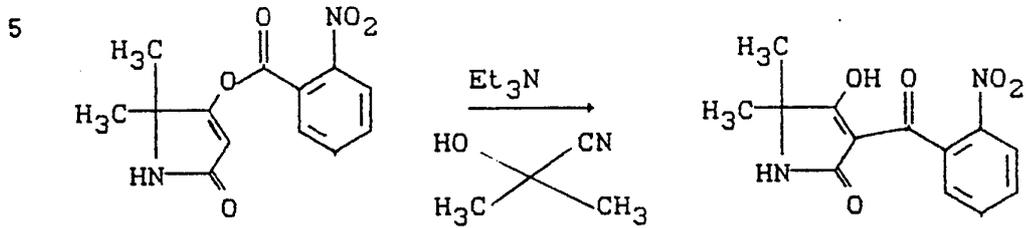


25

Verwendet man gemäß Verfahren (B) 4-(2-Nitrobenzoyloxy)-5,5-dimethyl-pyrrolin-2-on, Triethylamin als Base und Acetoncyanhydrin als Katalysator (EP 186 117), so kann das erfindungsgemäße Verfahren durch folgendes Reaktionsschema beschrieben werden:

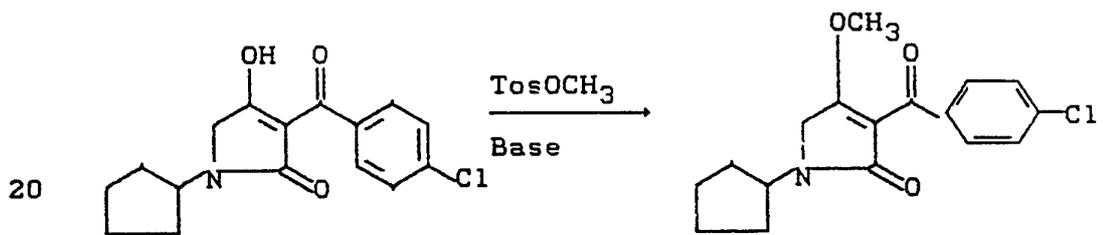
30

35



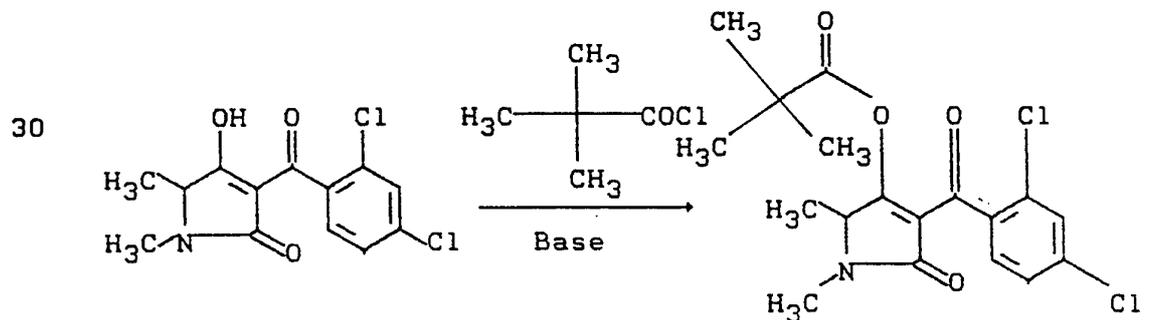
Verwendet man gemäß Verfahren (C) 3-(4-Chlorbenzoyl)-1-cyclopentanyl-pyrrolidin-2,4-dion und Toluolsulfonsäuremethylester, so kann der Verlauf des erfindungsgemäßen Verfahrens durch folgendes Reaktionsschema wiedergegeben werden.

15

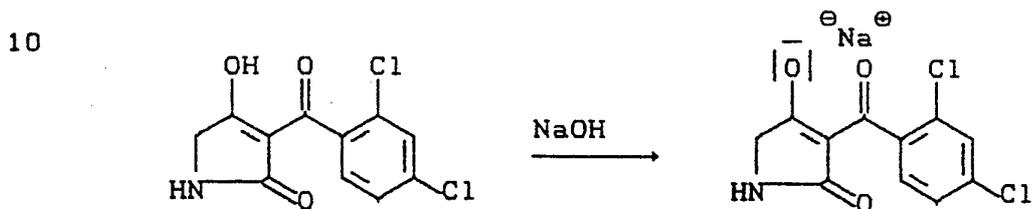


Verwendet man gemäß Verfahren (D) 1,5-Dimethyl-3-(2,4-dichlorbenzoyl)-pyrrolidin-2,4-dion und Pivaloylchlorid, so kann der Verlauf des erfindungsgemäßen Verfahrens durch folgendes Reaktionsschema wiedergegeben werden:

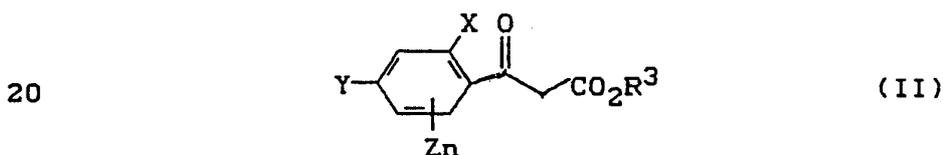
25



5 Verwendet man gemäß Verfahren (E) 3-(2,4-Dichlor-  
benzoyl)-pyrrolidin-2,4-dion und Natriumhydroxid, so  
kann der Verlauf des erfindungsgemäßen Verfahrens durch  
folgendes Reaktionsschema wiedergegeben werden:



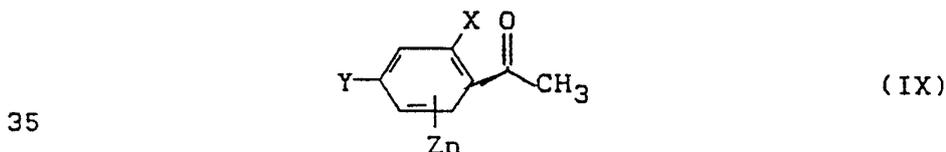
15 Die bei dem obigen Verfahren (A) als Ausgangsstoffe be-  
nötigten Verbindungen der Formel II



in welcher

25  $R^3$ , X, Y, Z und n die oben angegebenen Bedeutungen  
haben,

sind teilweise bekannt oder lassen sich nach bekannten  
Methoden in einfacher Weise herstellen. So erhält man  
30 z.B. Benzoylessigester der Formel (II), wenn man  
Acetophenone der Formel (IX)



5 in welcher

X, Y, Z und n die oben angegebenen Bedeutungen haben,

mit Alkylcarbonaten der Formel (X)

10



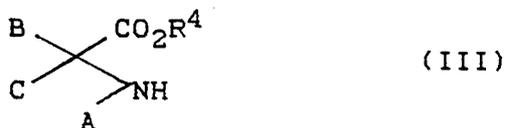
in welcher

15  $R^3$  die oben angegebenen Bedeutungen hat,

in Gegenwart von Basen kondensiert (Brändström, A., Acta chem. scand. 4, 1315 (1950)).

20 Die bei dem obigen Verfahren (A) als Ausgangsstoffe weiterhin benötigten Verbindungen der Formel (III)

25



in welcher

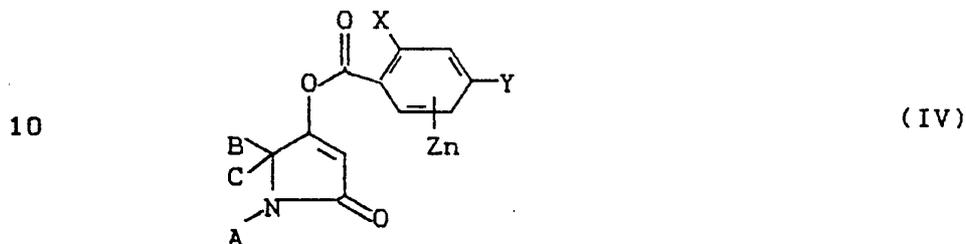
30 A, B, C und  $R^4$  die oben angegebenen Bedeutungen haben,

sind teilweise bekannt oder lassen sich nach bekannten Verfahren, wie sie in der Literatur beschrieben werden, herstellen, wenn man z.B.  $\alpha$ -Halogencarbonsäuren bzw.

35

-ester mit Aminen umgesetzt (Advanced Organic Chemistry, J. March, S, 377 (Mc Graw-Hill Inc. 1977)).

5 Die bei dem obigen Verfahren (B) als Ausgangsstoffe benötigten Verbindungen der Formel (IV)

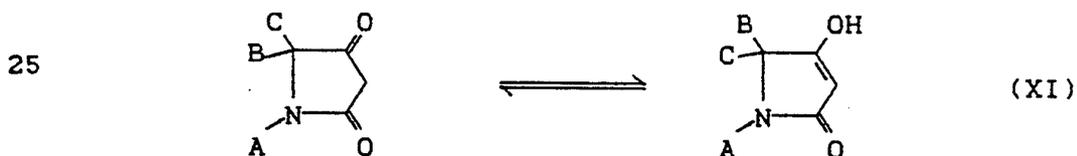


15 in welcher

A, B, C, X, Y, Z und n die oben angegebenen Bedeutungen haben,

20 sind neu und sind ebenfalls Teil des Anspruchs.

Die Verbindungen (IV) erhält man, wenn man Verbindungen der Formel (XI)



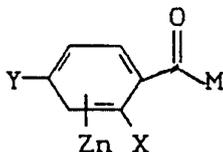
in welcher

30 A, B und C die oben angegebenen Bedeutungen haben,

mit Benzoylverbindungen der Formel (XII)

35

5



(XII)

10

in welcher

X, Y, Z und n die oben angegebenen Bedeutungen  
haben,

15

und M für Halogen oder Cyano steht

in Gegenwart eines Verdünnungsmittels und gegebenenfalls  
in Gegenwart eine Base umgesetzt.

20

Die Verbindungen (XI) sind teilweise bekannt oder  
lassen sich nach literaturbekannten Verfahren her-  
stellen, z.B. Matsuo, Tanaka; Chem. Pharm. Bull. 32,  
3724 (1984); Noland, Sundberg, J. Org. Chem. 28, 3150,  
25 (1963).

Verbindungen der Formel (XII) sind teilweise käuflich,  
oder sind nach allgemein bekannten Literaturverfahren  
einfach herzustellen.

30

Das Verfahren (A) ist dadurch gekennzeichnet, daß man  
Verbindungen der Formel (II), in welcher X, Y, Z, n und  
R<sup>3</sup> die oben angegebenen Bedeutungen haben, mit Amino-  
säureester der Formel (III), in welcher A, B, C und R<sup>4</sup>  
35 die oben angegebenen Bedeutungen haben, in Substanz oder  
in Gegenwart eines Lösungsmittels umgesetzt und die dabei  
erhaltenen Verbindungen mit einer Base kondensiert.

- 5 Als Verdünnungsmittel können bei dem erfindungsgemäßen  
Verfahren (A) alle üblichen inerten organischen Solven-  
tien eingesetzt werden. Vorzugsweise verwendbar sind  
Kohlenwasserstoffe, wie Toluol, Xylol, Dekalin,  
Tetralin, Mesitylen, Triisopropylbenzol, ferner Ether,  
10 wie Dibutylether, Tetrahydrofuran, Dioxan, Glykoldi-  
methylether und Diglykoldimethylether, außerdem polare  
Lö-sungsmittel, wie Dimethylsulfoxid, Sulfolan, Di-  
methylformamid und N-Methyl-pyrrolidon.
- 15 Als Deprotonierungsmittel können bei der Durchführung  
des erfindungsgemäßen Verfahrens (a) alle üblichen  
Protonenakzeptoren eingesetzt werden. Vorzugsweise ver-  
wendbar sind Alkalimetall- und Erdalkalimetall-oxide,  
-hydroxide und -carbonate, wie Natriumhydroxid, Kalium-  
20 hydroxid, Magnesiumoxid, Calciumoxid, Natriumcarbonat,  
Kaliumcarbonat und Calciumcarboat, die auch in Gegenwart  
von Phasentransferkatalysatoren wie z.B. Triethyl-  
benzylammoniumchlorid, Tetrabutylammoniumbromid, Adogen  
464 und TDA 1 eingesetzt werden können. Ferner sind  
25 Alkalimetall- und Erdalkalimetallamide und -hydride, wie  
Natriumamid, Natriumhydrid und Calciumhydrid, und außer-  
dem auch Alkalimetall-alkoholate, wie Natrium-methylat,  
Natriummethylat und Kalium-tert.-butylat einsetzbar.

30

- 
- 35 Adogen 464 = Methyltrialkyl(C<sub>8</sub>-C<sub>10</sub>)ammoniumchlorid  
TDA 1 = Tris-(methoxyethoxyethyl)-amin

5 Die Reaktionstemperaturen können bei der Durchführung  
des erfindungsgemäßen Verfahrens (A) innerhalb eines  
größeren Bereiches variiert werden. Im allgemeinen ar-  
beitet man bei Temperaturen zwischen 0° C und 250° C,  
vorzugsweise zwischen 50° C und 200° C.

10

Das erfindungsgemäße Verfahren (A) wird im allgemeinen  
unter Normaldruck durchgeführt.

15

Bei der Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens  
(A) setzt man die Reaktionskomponenten der Formeln (II)  
und (III) und die deprotonierenden Basen im allgemeinen  
in etwa äquimolaren Mengen ein. Es ist jedoch auch mög-  
lich, die eine oder andere Komponente in einem größeren  
Überschuß (bis zu 3 Mol) zu verwenden.

20

Das Verfahren (B) ist dadurch gekennzeichnet, daß Enol-  
ester der Formel (IV), in welcher A, B, C, X, Y, Z und  
n die oben angegebenen Bedeutungen haben in Gegenwart  
eines Lösungsmittels, gegebenenfalls in Gegenwart einer  
25 Base und in Gegenwart eines geeigneten Katalysators  
umgelagert werden.

30

Als Katalysator sind vorzugsweise verwendbar, z.B.  
Lewissäuren wie  $ZnCl_2$ ,  $AlCl_3$ ,  $BF_3$ -Etherat,  $Ti^{4+}$ -Salze  
etc., sowie Acylierungskatalysatoren wie z.B. 4-N,N-Di-  
methylaminopyridin oder 4-Pyrrolidino-pyridin, wie auch  
Verbindungen die prinzipiell Cyanid abspalten können.

35

- 5 Cyanid-abspaltende Reagenzien sind Verbindungen, die während der Reaktion Cyanwasserstoff und/oder Cyanid-Anionen abspalten.
- 10 Zwei Verfahrensvarianten sind dabei möglich. Bei der einen wird das Verfahren in Gegenwart katalytischer Mengen des Cyanid- oder Cyanwasserstoff-abspaltenden Reagens zusammen mit einem molaren Überschuß einer milden Base durchgeführt.
- 15 Bevorzugte Cyanid-abspaltende Reagenzien sind Alkali-cyanide wie Natrium- und Kaliumcyanid; Cyanhydrine von methyl-alkyl-Ketonen mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen im Alkylrest wie Aceton- oder Methylisobutylketon-cyanhydrin; Cyanhydrine des Benzaldehyd oder C<sub>2</sub>-C<sub>5</sub>-Alkyl
- 20 substituierter Aldehyde wie Acetaldehyd, Propionaldehyd, Zinkcyanid, tri(nieder-Alkyl)silylcyanid wie Trimethylsilylcyanid und Cyanwasserstoff. Zu bevorzugen ist Cyanwasserstoff, da es sehr schnell reagiert und kostengünstig ist. Desweiteren kann es in flüssiger Form oder
- 25 gasförmig eingesetzt werden. Wird es als Gas eingesetzt, kann es aus einer Vorratsflasche oder durch Reaktion einer Säure mit einem Metallcyanid gewonnen werden. Unter den Cyanhydrinen wird Aceton-cyanhydrin bevorzugt.
- 30 Bei der Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (B) wird das Cyanid-liefernde Reagens in einer Konzentration von 1 bis 50 Mol-% in Bezug auf der Enolester eingesetzt. Bevorzugt werden 1-10 Mol-%.
- 35

5 Bei der Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens  
(B) wird ein Überschuß an milder Base in Bezug auf den  
Enolester eingesetzt. Mit milder Base bezeichnet man  
Basen deren Basizität zwischen starken Basen wie Alkali-  
hydroxidlösungen (die im vorliegenden Fall Hydrolyse des  
10 Enolesters zur Folge hätten) und schwacher Base wie Al-  
kalibicarbonate (die im vorliegenden Fall keine Reaktion  
zur Folge hätten) liegen. Zu den milden Basen gehören  
organische Basen wie tertiäre Amine und anorganische  
Basen wie Alkalimetallcarbonate und Alkalimetallphos-  
15 phate. Bevorzugt organische Basen sind Trialkylamine wie  
Triethylamin oder Trialkanolamine wie Triethanolamin und  
Pyridin.

Bevorzugte anorganische Basen sind Kaliumcarbonat und  
20 Trinatriumphosphat.

Die Base wird in einer Konzentration zwischen 1 und 4  
Mol pro Mol Enolester eingesetzt, bevorzugt in einer  
25 Konzentration von 2 Mol.

Ist das Cyanid-abspaltende Reagens ein Alkalicyanid,  
z.B. Kaliumcyanid, kann ein Phasen-transfer-Katalysator  
zugesetzt werden. Bevorzugt werden Kronenether einge-  
30 setzt. Als gegebenenfalls eingesetzte Verdünnungsmittel  
kommen nur Lösungsmittel in Frage, die mit dem Säure-  
chlorid oder dem acylierten Produkt keine Reaktion  
eingehen. Bevorzugt wird 1,2-Dichlorethan eingesetzt.  
Weitere mögliche Verdünnungsmittel je nach Reaktanden  
oder Produkte sind Toluol, Acetonitril, Methylenchlorid,  
35 Ethylenacetat, Dimethylformamid und Methylisobutyl-  
keton.

5 Das Herstellungsverfahren (B) wird in Abhängigkeit vom  
Cyanid-liefernden Reagens und der Reaktanten bei einer  
Temperatur von 80° C durchgeführt. In einigen Fällen,  
wenn zum Beispiel viel Nebenprodukte entstehen, was bei  
Einsatz von Ortho-Cyanobenzoylhalogenid und Alkalime-  
10 tallcyanid oder Aceton-cyanhydrin auftreten kann, sollte  
die Reaktionstemperatur bei 40° C ihr Maximum haben.

In der zweiten Verfahrensvariante des Herstellungsver-  
fahrens (B) dient Kalium oder Lithiumcyanid als Cyanid-  
15 Quelle, die ohne Einsatz einer zusätzlichen Base jedoch  
in stöchiometrischer Menge eingesetzt wird. Hinzugefügt  
wird nur noch eine katalytische Menge an Phasentrans-  
ferkatalysator, in der Regel ein Kronenether oder ein  
acyclisches Analogon. Bevorzugter Kronenether ist  
20 18 Krone 6. Andere hexadentale Reagenzien wie Cyclo-  
hexyl-18-Krone-6, Dibenzo-18-Krone-6, und acyclische  
Verbindungen wie Pentaethylenglycoldimethylether können  
ebenfalls verwendet werden.

25 Für Lithiumcyanid empfiehlt sich 15-Krone-5 als Phasen-  
transferkatalysator.

Diese zweite Verfahrensvariante ist zu bevorzugen für  
die Herstellung von Verbindungen der Formel (I), insbe-  
30 sondere wenn unter milden Reaktionsbedingungen verfahren  
werden muß und Nebenprodukte zu vermeiden sind, wie sie  
z.B. bei der Reaktion mit ortho-cyanophenyl-substituierten  
benzoylierten Cyclohexandionen bekannt sind. Diese

35

5 zweite Verfahrensvariante des Herstellungsverfahrens (B) wird bei Raumtemperatur durchgeführt. Die verwendeten Verdünnungsmittel entsprechen denen, wie sie in der ersten Verfahrensvariante des Verfahrens (B) verwendet werden, wobei Acetonitril bevorzugt wird.

10

Beide Verfahrensvarianten des Herstellungsverfahrens (B) werden mit dem Enol-Ester der Formel (IV) als Ausgangssubstanz durchgeführt.

15

Der Enolester kann aber auch in situ hergestellt werden, zum Beispiel durch Reaktion des Acylierungsreagens mit einem Diketon, wobei mit Enolester der Enolester einer Carbonsäure gemeint ist. Wird der Enolester als Ausgangssubstanz in beiden Verfahrensvarianten vorgelegt, so kann er zuvor nach literaturbekannten Verfahren hergestellt werden z.B. durch Acylierung einer  $\beta$ -Dicarbonylverbindung mit Säurehalogeniden.

20

25

Die Synthese der acylierten Pyrrolidin-2,4-dione nach dem Herstellungsverfahren (B), beginnend mit dem Acylierungsreagens und Pyrrolidindion (z.B. Säurehalogenid wie Benzoylchlorid und Pyrrolidindion) kann mit oder ohne Isolierung des intermediär gebildeten Enolesters erfolgen.

30

Im ersten Fall läßt man das Säurehalogenid oder ein anderes acylierendes Reagens und das Pyrrolidindion in Gegenwart einer milden Base wie Triethylamin reagieren. Der daraus anfallende Enolester kann durch bekannte

35

5 Methoden aus der organischen Chemie isoliert werden.  
Diese Verfahrensweise empfiehlt sich dann, wenn im  
zweiten Reaktionsschritt ein anderes Lösungsmittel  
eingesetzt wird, um den Enolester in ein acyliertes  
Diketon umzulagern. Der getrocknete Enolester wird dazu  
10 in einem geeigneten Lösungsmittel wie Acetonitril- oder  
1,2-Dichlorethan gelöst und mit dem Cyanid-liefernden  
Reagens der Wahl und einer schwachen Base oder einem  
Kronenether versetzt. Die Reaktionstemperatur richtet  
sich dabei nach der Verfahrensvariante.

15  
Als Alternative steht die Eintopfvariante zur Verfügung,  
wobei der Enolester im Reaktionsmedium verbleibt und  
direkt in der zweiten Stufe in demselben Lösungsmittel  
mit dem Cyanid-liefernden Reagens und gegebenenfalls  
20 einer Base versetzt wird.

In einer weiteren Verfahrensvariante erhält man das  
acylierte Pyrrolidindion in einer Einstufenreaktion durch  
in situ Synthese und Umlagerung des Enolesters, indem  
25 man das Säurehalogenid oder andere acylierende Reagen-  
zien mit Pyrrolidindionen in Gegenwart geeigneter Mengen  
Cyanid-liefernden Reagens' und milder Base oder  
Kronenether umsetzt, je nachdem, welches  
Herstellungsverfahren herangezogen wird.

30  
Man erhält bei beiden Verfahrensvarianten, d.h. mit oder  
ohne Isolierung der Enolester, vergleichbare Ausbeuten.

35

5 Das acylierte Pyrrolidindion erhält man durch dieses  
Herstellungsverfahren (B) in Form seines Salzes, woraus  
es durch Ansäuern und Extraktion mit einem geeigneten  
Lösungsmittel freigesetzt werden kann. In einigen Fällen  
10 kann das Produkt durch geringe Mengen Carbonsäure, ent-  
standen aus dem Carbonsäurechlorid, verunreinigt sein.  
Diese Verunreinigungen entfernt man durch Versetzen des  
sauren Produkts mit wäßriger Natriumhydroxyd-Lösung oder  
anderer geeigneter Basen, um die Säure als Salz abzu-  
trennen. In der zweiten Verfahrensvariante des Herstel-  
15 lungsverfahrens erhält man das acylierte Pyrrolidindion  
direkt in reiner Form.

Das Verfahren (C) ist dadurch gekennzeichnet, daß man  
Verbindungen der Formel (Ia) mit Alkylierungsreagenzien  
20 der Formel (V) gegebenenfalls in Gegenwart eines Ver-  
dünnungsmittels und gegebenenfalls in Gegenwart eines  
Säurebindemittels umsetzt. Die Verbindungen der Formel  
(I) sind erfindungsgemäße Verbindungen und nach dem oben  
beschriebenen Verfahren erhältlich.

25 Die weiterhin als Ausgangsstoffe zur Herstellung der er-  
findungsgemäßen Verbindungen (Ib) als Ausgangsstoffe be-  
nötigten Alkylierungsmittel sind durch die Formel (V)  
allgemein definiert.

30 In der Formel (V) steht E<sup>2</sup> vorzugsweise für die in den  
Vorzugsbereichen angegebenen Bedeutungen, ganz besonders  
bevorzugt für Methyl, Ethyl, Propyl oder iso-Propyl,

35

5 Allyl, Propinyl und durch Fluor, Chlor, Methyl, Methoxy  
oder Trifluormethyl substituiertes Benzyl. In der Formel  
(V) steht L bevorzugt für Chlor, Brom oder Iod, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-  
Alkylsulfonyloxy, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxysulfonyloxy oder p-Toluol-  
10 sulfonyloxy, wie beispielsweise Methansulfonyloxy, Meth-  
oxysulfonyloxy oder Ethoxysulfonyloxy.

Die Alkylierungsreagenzien der Formel (V) sind bekannte  
Verbindungen der organischen Chemie.

15 Zur Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (C)  
zur Herstellung der erfindungsgemäßen Verbindungen (Ib)  
kommen als Verdünnungsmittel inerte organische Lösungs-  
mittel in Frage. Vorzugsweise verwendet man alipha-  
tische, alicyclische oder aromatische, gegebenenfalls  
20 halogenierte Kohlenwasserstoffe, wie beispielsweise  
Benzin, Benzol, Toluol, Xylol, Pentan, Hexan, Heptan  
Cyclohexan, Petrolether, Ligroin, Methylenchlorid,  
Chloroform, Tetrachlorkohlenstoff, Chlorbenzol oder  
Dichlorbenzol, Ether, wie Diethylether, Diisopropyl-  
25 ether, Dioxan, Tetrahydrofuran oder Ethylenglykoldi-  
ethylether oder -dimethylether, Ketone wie Aceton,  
Butanon, Methylisopropylketon oder Methylisobutylketon,  
Ester, wie Essigsäureethylester, Säuren, wie Essigsäure,  
Nitrile, wie Acetonitril oder Propionitril, Amide, wie  
30 Dimethylformamid, Dimethylacetamid, N-Methyl-pyrrolidon  
oder Hexamethylphosphorsäuretriamid. Verwendet man als  
Reaktionspartner Verbindungen der Formel (V) in flüssi-

35

5 ger Form, so ist es auch möglich, diese in entsprechendem Überschuß gleichzeitig als Verdünnungsmittel einzusetzen.

10 Als Säurebindemittel kommen alle üblicherweise verwendbaren anorganischen und organischen Basen in Frage. Vorzugsweise verwendet man Alkalimetallhydride, -hydroxide, -amide, -carbonate oder -hydrogencarbonate, wie beispielsweise Natriumhydrid, Natriumamid, Natriumhydroxid, Natriumcarbonat oder Natriumhydrogencarbonat, oder auch  
15 tertiäre Amine, wie beispielsweise Triethylamin, N,N-Dimethylanilin, Pyridin, 4-(N,N-Dimethylamino)-pyridin, Diazoabicyclooctan (DABCO), Diazabicyclononen (DBN) oder Diazabicycloundecen (DBU).

20 Die Reaktionstemperaturen können bei der Durchführung in einem größeren Bereich variiert werden. Im allgemeinen arbeitet man zwischen  $-20^{\circ}\text{C}$  und  $+150^{\circ}\text{C}$ , vorzugsweise zwischen  $0^{\circ}\text{C}$  und  $+100^{\circ}\text{C}$ .

25 Zur Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (C) zur Herstellung der erfindungsgemäßen Verbindungen (Ib) setzt man pro Mol an Verbindungen der Formel (Ia) im allgemeinen jeweils 1 bis 20 Mol, vorzugsweise jeweils  
30 1 bis 15 Mol, Alkylierungsmittel der Formel (V) und gegebenenfalls 1 bis 3 Mol, vorzugsweise 1 bis 2 Mol Säurebindemittel ein. Die Reaktionsdurchführung, Aufarbeitung und Isolierung der Reaktionsprodukte der Formel (Ib) erfolgt nach den in der organischen Chemie üblichen  
35 Methoden.

5 Das erfindungsgemäße Verfahren (D) ist dadurch gekennzeichnet, daß man Verbindungen der Formel (Ia) mit Acylierungsreagenzien der Formel (VI) umsetzt.

Als Verdünnungsmittel können bei dem erfindungsgemäßen  
10 Verfahren (D) alle inerten Solventien eingesetzt werden. Vorzugsweise verwendbar sind Kohlenwasserstoffe, wie Benzin, Benzol, Toluol, Xylol und Tetralin, ferner Halogenkohlenwasserstoffe, wie Methylenchlorid, Chloroform, Tetrachlorkohlenstoff, Chlorbenzol und o-Dichlorbenzol, außerdem Ketone, wie Aceton und Methylisopropylketon, weiterhin Ether, wie Diethylether, Tetrahydrofuran und Dioxan, darüber hinaus Carbonsäureester wie Essigsäureethylester oder Solventien, wie Dimethylsulfoxid und Sulfolan. Wenn die Hydrolysestabilität des  
15 Acylierungsreagens es zuläßt, kann die Umsetzung auch in Gegenwart von Wasser durchgeführt werden.  
20

Als Säurebindemittel kommen bei der Umsetzung nach dem erfindungsgemäßen Verfahren (D) alle üblichen Säureakzeptoren in Betracht. Vorzugsweise verwendbar sind  
25 tertiäre Amine, wie Triethylamin, Pyridin, Diazabicyclooctan (DABCO), Diazabicycloundecen (DBU), Diazabicyclononen (DBN), Hünig-Base und N,N-Dimethylanilin, ferner Erdalkalimetalloxide, wie Magnesium- und Calciumoxid, außerdem Alkali- und Erdalkali-metall-carbonate, wie  
30 Natriumcarbonat, Kaliumcarbonat und Calciumcarbonat.

Die Reaktionstemperaturen können auch bei dem erfindungsgemäßen Verfahren (D) innerhalb eines größeren  
35

5 Bereiches variiert werden. Im allgemeinen arbeitet man bei Temperaturen zwischen  $-20^{\circ}\text{C}$  und  $+150^{\circ}\text{C}$ , vorzugsweise zwischen  $0^{\circ}\text{C}$  und  $100^{\circ}\text{C}$ .

Bei der Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens  
10 (D) werden die Ausgangsstoffe der Formel (Ia) und das Acylierungsreagens der Formel (VI) im allgemeinen in angenähert äquivalenten Mengen verwendet. Es ist jedoch auch möglich, das Acylierungsreagens in einem größeren  
Überschuß (bis zu 5 Mol) einzusetzen. Die Aufarbeitung  
15 erfolgt nach üblichen Methoden.

Das erfindungsgemäße Verfahren (E) ist dadurch gekennzeichnet, daß man Verbindungen der Formel (Ia) mit  
20 Metallhydroxiden (VII) oder Aminen (VIII) umsetzt.

Als Verdünnungsmittel können bei dem erfindungsgemäßen  
Verfahren (E) vorzugsweise Ether wie Tetrahydrofuran,  
Dioxan, Diethylether, Nitrile oder Acetonitril oder aber  
Alkohole wie Methanol, Ethanol, Isopropanol, aber auch  
25 Wasser eingesetzt werden. Das erfindungsgemäße Verfahren (E) wird im allgemeinen unter Normaldruck durchgeführt. Die Reaktionstemperaturen liegen im allgemeinen zwischen  
 $-20^{\circ}\text{C}$  und  $100^{\circ}\text{C}$ , vorzugsweise zwischen  $0^{\circ}\text{C}$  und  $50^{\circ}\text{C}$ .

30 Bei der Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (E) werden die Ausgangsstoffe der Formel (Ia) bzw. (VII) oder (VIII) im allgemeinen in angenähert äquimolaren  
Mengen verwendet. Es ist jedoch auch möglich, die eine  
oder andere Komponente in einem größeren Überschuß (bis  
35 zu 2 Mol) einzusetzen. Im allgemeinen geht man so vor, daß man das Reaktionsgemisch durch Entfernen des Verdünnungsmittels im Vakuum einengt.

5 Die Aufarbeitung erfolgt wiederum nach üblichen Methoden.

Die Wirkstoffe eignen sich zur Bekämpfung von tierischen Schädlingen, vorzugsweise Arthropoden und Nematoden,  
10 insbesondere Insekten und Spinnentieren, die in der Landwirtschaft, in Forsten, im Vorrats- und Materialschutz sowie auf dem Hygienesektor vorkommen. Sie sind gegen normal sensible und resistente Arten sowie gegen alle oder einzelne Entwicklungsstadien wirksam. Zu den  
15 oben erwähnten Schädlingen gehören:

Aus der Ordnung der Isopoda z.B. *Oniscus asellus*, *Armadillidium vulgare*, *Porcellio scaber*.

20 Aus der Ordnung der Diplopoda z.B. *Blaniulus guttulatus*.

Aus der Ordnung der Chilopoda z.B. *Geophilus carpophagus*, *Scutigera spec.*

Aus der Ordnung der Symphyla z.B. *Scutigera immaculata*.

25 Aus der Ordnung der Thysanura z.B. *Lepisma saccharina*.  
Aus der Ordnung der Collembola z.B. *Onychiurus armatus*.  
Aus der Ordnung der Orthoptera z.B. *Blatta orientalis*,  
*Periplaneta americana*, *Leucophaea maderae*, *Blattella germanica*, *Acheta domesticus*, *Gryllotalpa spp.*, *Locusta migratoria migratorioides*, *Melanoplus differentialis*,  
30 *Schistocerca gregaria*.

Aus der Ordnung der Dermaptera z.B. *Forficula auricularia*.

35

- 5 Aus der Ordnung der Isoptera z.B. *Reticulitermes* spp.,  
Aus der Ordnung der Anoplura z.B. *Phylloxera vastatrix*,  
*Pemphigus* spp., *Pediculus humanus corporis*, *Haematopinus*  
spp., *Linognathus* spp.
- 10 Aus der Ordnung der Mallophaga z.B. *Trichodectes* spp.,  
*Damalinea* spp.  
Aus der Ordnung der Thysanoptera z.B. *Hercinothrips*  
*femoralis*, *Thrips tabaci*.  
Aus der Ordnung der Heteroptera z.B. *Eurygaster* spp.,
- 15 *Dysdercus intermedius*, *Piesma quadrata*, *Cimex lectulari-*  
*rius*, *Rhodnius prolixus*, *Triatoma* spp.
- Aus der Ordnung der Homoptera z.B. *Aleurodes brassicae*,  
*Bemisia tabaci*, *Trialeurodes vaporariorum*, *Aphis gossy-*  
20 *pii*, *Brevicoryne brassicae*, *Cryptomyzus ribis*, *Aphis*  
*fabae*, *Doralis pomi*, *Eriosoma lanigerum*, *Hyalopterus*  
*arundinis*, *Macrosiphum avenae*, *Myzus* spp., *Phorodon*  
*humuli*, *Rhopalosiphum padi*, *Empoasca* spp., *Euscelis*  
*bilobatus*, *Nephotettix cincticeps*, *Lecanium corni*, *Sais-*  
25 *setia oleae*, *Laodelphax striatellus*, *Nilaparvata lugens*,  
*Aonidiella aurantii*, *Aspidiotus hederæ*, *Pseudococcus*  
spp. *Psylla* spp.
- Aus der Ordnung der Lepidoptera z.B. *Pectinophora gossy-*  
*piella*, *Bupalus piniarius*, *Cheimatobia brumata*, *Litho-*  
30 *colletis blancardella*, *Hyponomeuta padella*, *Plutella*  
*maculipennis*, *Malacosoma neustria*, *Euproctis chrysorr-*  
*hoea*, *Lymantria* spp. *Bucculatrix thurberiella*, *Phylloc-*  
*nistis citrella*, *Agrotis* spp., *Euxoa* spp., *Feltia* spp.,  
*Earias insulana*, *Heliothis* spp., *Spodoptera exigua*,
- 35 *Mamestra brassicae*, *Panolis flammea*, *Prodenia litura*,

5 Spodoptera spp., Trichoplusia ni, Carpocapsa pomonella,  
 Pieris spp., Chilo spp., Pyrausta nubilalis, Ephestia  
 kuehniella, Galleria mellonella, Tineola bisselliella,  
 Tinea pellionella, Hofmannophila pseudospretella, Ca-  
 coecia podana, Capua reticulana, Choristoneura fumi-  
 10 ferana, Clysia ambiguella, Homona magnanima, Tortrix  
 viridana.

Aus der Ordnung der Coleoptera z.B. Anobium punctatum,  
 Rhizophorthera dominica, Acanthoscelides obtectus, Acan-  
 15 thoscelides obtectus, Hylotrupes bajulus, Agelastica  
 alni, Leptinotarsa decemlineata, Phaedon cochleariae,  
 Diabrotica spp., Psylliodes chrysocephala, Epilachna  
 varive stis, Atomaria spp., Oryzaephilus surinamensis,  
 Anthonomus spp., Sitophilus spp., Otiorrhynchus sul-  
 20 catus, Cosmopolites sordidus, Ceuthorrhynchus assimilis,  
 Hypera postica, Dermestes spp., Trogoderma spp., Anthre-  
 nus spp., Attagenus spp., Lyctus spp., Meligethes aene-  
 us, Ptinus spp., Niptus hololeucus, Gibbium psylloides,  
 Tribolium spp., Tenebrio molitor, Agriotes spp., Cono-  
 25 derus spp., Melolontha melolontha, Amphimallon solsti-  
 tialis, Costelytra zealandica.

Aus der Ordnung der Hymenoptera z.B. Diprion spp., Hop-  
 locampa spp., Lasius spp., Monomorium pharaonis, Vespa  
 spp.

30 Aus der Ordnung der Diptera z.B. Aedes spp., Anopheles  
 spp., Culex spp., Drosophila melanogaster, Musca spp.,  
 Fannia spp., Calliphora erythrocephala, Lucilia spp.,  
 Chrysomyia spp., Cuterebra spp., Gastrophilus spp., Hyp-  
 pobosca spp., Stomoxys spp., Oestrus spp., Hypoderma  
 35

- 5 spp., *Tabanus* spp., *Tannia* spp., *Bibio hortulanus*, *Oscinella frit*, *Phorbia* spp., *Pegomyia hyoscyami*, *Ceratitis capitata*, *Dacus oleae*, *Tipula paludosa*.
- 10 Aus der Ordnung der Siphonaptera z.B. *Xenopsylla cheopis*, *Ceratophyllus* spp..  
Aus der Ordnung der Arachnida z.B. *Scorpio maurus*, *Latrodectus mactans*.
- 15 Aus der Ordnung der Acarina z.B. *Acarus siro*, *Argas* spp., *Ornithodoros* spp., *Dermanyssus gallinae*, *Eriophyes ribis*, *Phyllocoptura oleivora*, *Boophilus* spp., *Rhipicephalus* spp., *Amblyomma* spp., *Hyalomma* spp., *Ixodes* spp., *Psoroptes* spp., *Chorioptes* spp., *Sarcoptes* spp., *Tarsonemus* spp., *Bryobia praetiosa*, *Panonychus* spp., *Tetranychus* spp..
- 20 Die erfindungsgemäßen Wirkstoffe zeichnen sich durch eine hohe insektizide Wirksamkeit aus.
- 25 Sie lassen sich mit besonders gutem Erfolg zur Bekämpfung von pflanzenschädigenden Insekten, wie beispielsweise gegen die Larven des Meerrettichblattkäfers (*Phaedon cochleariae*) oder gegen die Larven der Kohlschabe (*Plutella maculipennis*) einsetzen.
- 30 Darüber hinaus zeigen die erfindungsgemäßen Wirkstoffe auch akarizide Wirksamkeit.
- 35

5 Die erfindungsgemäßen Wirkstoffe können weiterhin als  
Defoliant, Desiccant, Krautabtötungsmittel und insbe-  
sondere als Unkrautvernichtungsmittel verwendet werden.  
Unter Unkraut im weitesten Sinne sind alle Pflanzen zu  
10 verstehen, die an Orten aufwachsen, wo sie unerwünscht  
sind. Ob die erfindungsgemäßen Stoffe als totale oder  
selektive Herbizide wirken, hängt im wesentlichen von  
der angewendeten Menge ab.

Die erfindungsgemäßen Wirkstoffe können z.B. bei den  
15 folgenden Pflanzen verwendet werden:

20 Dikotyle Unkräuter der Gattungen: Sinapis, Lepidium, Ga-  
lium, Stellaria, Matricaria, Anthemis, Galinsoga, Chenopodium,  
Urtica, Senecio, Amaranthus, Portulaca, Xanthium,  
Convolvulus, Ipomoea, Polygonum, Sesbania, Ambrosia,  
Cirsium, Carduus, Sonchus, Solanum, Rorippa, Rotala,  
Lindernia, Lamium, Veronica, Abutilon, Emex, Datura,  
Viola, Galeopsis, Papaver, Centaurea, Trifolium, Ranunculus,  
Taraxacum.

25 Dikotyle Kulturen der Gattungen: Gossypium, Glycine,  
Beta, Daucus, Phaseolus, Pisum, Solanum, Linum, Ipomoea,  
Vicia, Nicotiana, Lycopersicon, Arachis, Brassica, Lactuca,  
Cucumis, Cucurbita.

30 Monokotyle Unkräuter der Gattungen: Echinochloa, Setaria,  
Panicum, Digitaria, Phleum, Poa, Festuca, Eleusine,  
Brachiaria, Lolium, Bromus, Avena, Cyperus, Sorghum,  
Agropyron, Cynodon, Monochoria, Fimbristylis, Sagitta-

35

5 ria, Eleocharis, Scirpus, Paspalum, Ischaemum, Spheno-  
clea, Dactyloctenium, Agrostis, Alopecurus, Apera.

Monokotyle Kulturen der Gattungen: Oryza, Zea, Triticum,  
Hordeum, Avena, Secale, Sorghum, Panicum, Saccharum,  
10 Ananas, Asparagus, Allium.

Die Verwendung der erfindungsgemäßen Wirkstoffe ist je-  
doch keineswegs auf diese Gattungen beschränkt, sondern  
erstreckt sich in gleicher Weise auch auf andere Pflan-  
15 zen.

Die Verbindungen eignen sich in Abhängigkeit von der  
Konzentration zur Totalunkrautbekämpfung z.B. auf In-  
dustrie- und Gleisanlagen und auf Wegen und Plätzen mit  
20 und ohne Baumbewuchs. Ebenso können die Verbindungen zur  
Unkrautbekämpfung in Dauerkulturen, z.B. Forst, Zierge-  
hölz-, Obst-, Wein-, Citrus-, Nuß-, Bananen-, Kaffee-,  
Tee-, Gummi-, Ölpalm-, Kakao-, Beerenfrucht- und Hopfen-  
anlagen, auf Zier- und Sportrasen und Weideflächen und  
25 zur selektiven Unkrautbekämpfung in einjährigen Kulturen  
eingesetzt werden.

Die erfindungsgemäßen Verbindungen eignen sich zur se-  
lektiven Bekämpfung von mono- und dikotylen Unkräutern  
30 in monokotylen Kulturen im Vor- und Nachauflaufverfahren.

Die Wirkstoffe können in die üblichen Formulierungen  
überführt werden, wie Lösungen, Emulsionen, Spritzpul-  
ver, Suspensionen, Pulver, Stäubemittel, Pasten, lös-  
35 liche Pulver, Granulate, Suspensions-Emulsions-Konzen-  
trate, Wirkstoff-imprägnierte Natur- und synthetische  
Stoffe sowie Feinstverkapselungen in polymeren Stoffen.

5 Diese Formulierungen werden in bekannter Weise hergestellt, z.B. durch Vermischen der Wirkstoffe mit Streckmitteln, also flüssigen Lösungsmitteln und/oder festen Trägerstoffen, gegebenenfalls unter Verwendung von oberflächenaktiven Mitteln, also Emulgiermitteln  
10 und/oder Dispergiermitteln und/oder schaum erzeugenden Mitteln.

Im Falle der Benutzung von Wasser als Streckmittel können z.B. auch organische Lösungsmittel als Hilfslösungsmittel verwendet werden. Als flüssige Lösungsmittel kommen im wesentlichen in Frage: Aromaten, wie Xylol, Toluol, oder Alkylnaphthaline, chlorierte Aromaten und chlorierte aliphatische Kohlenwasserstoffe, wie Chlorbenzole, Chlorethylene oder Methylenchlorid, aliphatische  
15 Kohlenwasserstoffe, wie Cyclohexan oder Paraffine, z.B. Erdölfraktionen, mineralische und pflanzliche Öle, Alkohole, wie Butanol oder Glykol sowie deren Ether und Ester, Ketone wie Aceton, Methylethylketon, Methylisobutylketon oder Cyclohexanon, stark polare Lösungsmittel,  
20 wie Dimethylformamid und Dimethylsulfoxid, sowie Wasser.

Als feste Trägerstoffe kommen in Frage:  
z.B. Ammoniumsalze und natürliche Gesteinsmehle, wie Kaoline, Tonerden, Talkum, Kreide, Quarz, Attapulgit,  
30 Montmorillonit oder Diatomeenerde und synthetische Gesteinsmehle, wie hochdisperse Kieselsäure, Aluminiumoxid und Silikate, als feste Trägerstoffe für Granulate kommen in Frage: z.B. gebrochene und fraktionierte natürliche Gesteine wie Calcit, Marmor, Bims, Sepiolith, Dolomit sowie synthetische Granulate aus anorganischen und  
35 organischen Mehlen sowie Granulate aus organischem Mate-

5 rial wie Sägemehl, Kokosnußschalen, Maiskolben und Ta-  
bakstengeln; als Emulgier- und/oder schäumerzeugende  
Mittel kommen in Frage: z.B. nichtionogene und anioni-  
sche Emulgatoren, wie Polyoxyethylen-Fettsäure-Ester,  
10 Polyoxyethylen-Fettalkohol-Ether, z.B. Alkylaryl-poly-  
glykolether, Alkylsulfonate, Alkylsulfate, Arylsulfonate  
sowie Einweißhydrolysate; als Dispergiermittel kommen in  
Frage: z.B. Lignin-Sulfitablaugen und Methylcellulose.

Es können in den Formulierungen Haftmittel wie Carboxy-  
15 methylcellulose, natürliche und synthetische pulvrige,  
körnige oder latexförmige Polymere verwendet werden, wie  
Gummiarabicum, Polyvinylalkohol, Polyvinylacetat, sowie  
natürliche Phospholipide, wie Kepheline und Lecithine  
und synthetische Phospholipide. Weitere Additive können  
20 mineralische und vegetabile Öle sein.

Es können Farbstoffe wie anorganische Pigmente, z.B.  
Eisenoxid, Titanoxid, Ferrocyanblau und organische Farb-  
stoffe, wie Alizarin-, Azo- und Metallphthalocyaninfarb-  
25 stoffe und Spurennährstoffe wie Salze von Eisen, Mangan,  
Bor, Kupfer, Kobalt, Molybdän und Zink verwendet werden.

Die Formulierungen enthalten im allgemeinen zwischen 0,1  
und 95 Gew.-% Wirkstoff, vorzugsweise zwischen 0,5 und  
30 90 %.

Die erfindungsgemäßen Wirkstoffe können als solche oder  
in ihren Formulierungen auch in Mischung mit bekannten  
Herbiziden zur Unkrautbekämpfung Verwendung finden, wo-  
35 bei Fertigformulierungen oder Tankmischungen möglich  
sind.

- 5 Auch eine Mischung mit anderen bekannten Wirkstoffen, wie Fungiziden, Insektiziden, Akariziden, Nematiziden, Schutzstoffen gegen Vogelfraß, Pflanzennährstoffen und Bodenstrukturverbesserungsmitteln ist möglich.
- 10 Die Wirkstoffe können als solche, in Form ihrer Formulierungen oder den daraus durch weiteres Verdünnen bereiteten Anwendungsformen, wie gebrauchsfertige Lösungen, Suspensionen, Emulsionen, Pulver, Pasten und Granulate angewandt werden. Die Anwendung geschieht in üb-
- 15 licher Weise, z.B. durch Gießen, Spritzen, Sprühen, Streuen.

Die erfindungsgemäßen Wirkstoffe können sowohl vor als auch nach dem Auflaufen der Pflanzen appliziert werden.

20 Sie können auch vor der Saat in den Boden eingearbeitet werden.

Die angewandte Wirkstoffmenge kann in einem größeren Bereich schwanken. Sie hängt im wesentlichen von der Art

25 des gewünschten Effektes ab. Im allgemeinen liegen die Aufwandmengen zwischen 0,01 und 10 kg Wirkstoff pro Hektar Bodenfläche, vorzugsweise zwischen 0,05 und 5 kg pro ha.

30 Die Herstellung und Verwendung der erfindungsgemäßen Wirkstoffe geht aus den nachfolgenden Beispielen hervor.

35

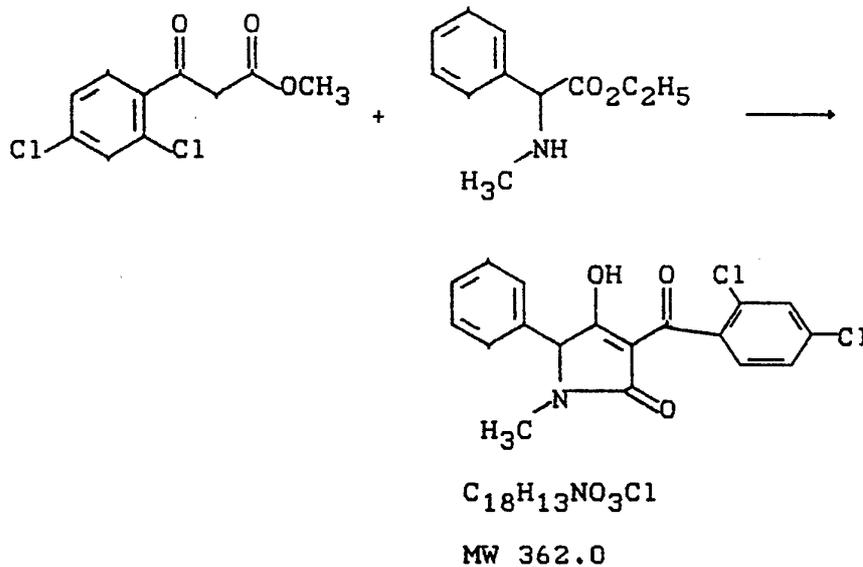
5 HerstellungsbeispieleBeispiel 1

## Verfahren A

10

15

20



25 12,36 g (50 mmol) Methoxycarbonyl-2,4-dichloroaceto-  
 phenon und 9,6 g (50 mmol) N-Methylamino-phenylessig-  
 säureethylester werden in 50 ml absolutem Xylol 12 Stun-  
 30 den bei 120-125° C gerührt. Das Reaktionsgemisch wird  
 dann in eine Lösung von 3,75 g Natriumethylat (55 mmol)  
 in 40 ml absolutem Ethanol eingetropt und 4 Stunden bei  
 70° C gerührt.

35

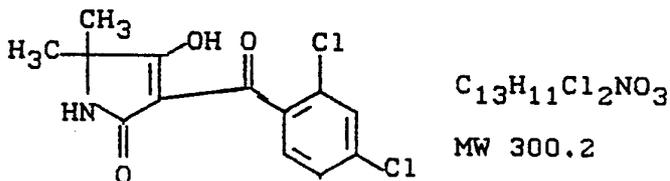
5     Danach nimmt man die Lösung in einen Gemisch aus  
Methylenchlorid und 1 normaler Salzsäure auf, extra-  
10    hiert, trennt die wäßrige Phase ab und wiederholt den  
Vorgang mit Natriumhydrogencarbonat-Lösung. Nach Trennen  
der beiden Phasen voneinander säuert man die wäßrige  
15    Phase an, wobei ein klebriger Niederschlag ausfällt, der  
mit Methylenchlorid aufgenommen wird. Das Lösungsmittel  
wird im Vakuum entfernt und man erhält 9,98 g (55 % der  
Theorie). 3-(2,4-Dichlorbenzoyl)-1-methyl-5-phenyl-  
pyrrolidin-2,4-dion mit Schmelzpunkt 137-138°C.

15

Beispiel 2

nach Verfahren B

20



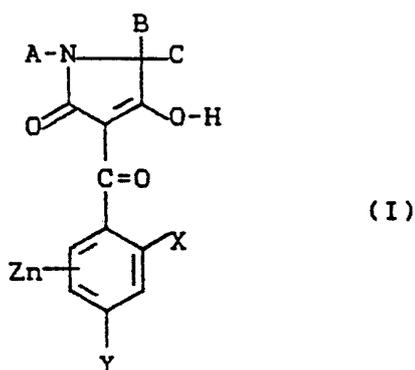
25    2,4 g (8 mmol) 4-(2,4-Dichlor-benzoyloxy)-5,5-dimethyl-  
1H-pyrrolin-2-on werden in 40 ml absolutem Acetonitril  
vorgelegt und mit 2,24 ml (16 mmol) Triethylamin und  
0,18 ml (2 mmol) Hydroxyisobuttersäurenitril bei Raum-  
30    temperatur zur Reaktion gebracht. Nach Beendigung der  
Reaktion, was durch Dünnschichtchromatographie festge-  
stellt wird, rührt man das Reaktionsgemisch in 100 ml

35

5 1 normaler HCl ein, filtriert den dabei anfallenden Niederschlag ab, trocknet und erhält 1,9 g (79 % der Theorie) 3-(2,4-Dichlorbenzoyl)-5,5-dimethyl-1H-pyrrolidin-2,4-dion vom Schmelzpunkt 144-146° C.

10 In analoger Weise zu Beispiel 1 und unter Berücksichtigung der Angaben in der Beschreibung zu den erfindungsgemäßen Verfahren, werden die nachfolgend in Tabelle 2 aufgeführten Endprodukte der Formel (I) erhalten.

15



25

Tabelle 2

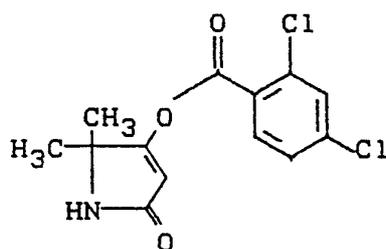
Präparat- Nummer	A	B	C	X	Y	Zn	Fp. [° C]
3	H	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	NO <sub>2</sub>	H	H	182
4	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	Cl	Cl	H	99-100
30 5	CH <sub>3</sub>	C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> -CH <sub>2</sub> -	H	Cl	Cl	H	Öl
6	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	H	H	Cl	Cl	H	99-100
7	cyclo-C <sub>5</sub> H <sub>9</sub>	H	H	Cl	Cl	H	96-97
8	cyclo-C <sub>5</sub> H <sub>9</sub>	CH <sub>3</sub>	H	Cl	Cl	H	98-99
9	C <sub>6</sub> H <sub>7</sub>	CH <sub>3</sub>	H	Cl	Cl	H	158-159
10	C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> -CH <sub>2</sub> -	H	H	Cl	Cl	H	82-84
11	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub>	-	H	Cl	Cl	H	107-108
35 12	H	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	Cl	SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	O-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -OCH <sub>3</sub>	Harz
13	CH <sub>3</sub>	H	H	Cl	Cl	H	125 (Zers.)
14	CH <sub>3</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	Cl	Cl	H	Öl

5 Tabelle 2

	Präparat- Nummer	A	B	C	X	Y	Zn	Fp. [°C]
10	15	H	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -		Cl	Cl	H	211
	16	H	CH <sub>3</sub>	cyclo-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	Cl	Cl	H	158
	17	H	CH <sub>3</sub>	H	Cl	Cl	H	150
	18	H	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	Cl	NO <sub>2</sub>	H	173
	19	H	CH <sub>3</sub>	i-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	Cl	Cl	H	117
15	20	H	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	F	CF <sub>3</sub>	H	>200
	21	H	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	Cl	OCF <sub>3</sub>	H	116
	22	H	CH <sub>3</sub>	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	Cl	Cl	H	153
	23	H	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	F	F	H	136
	24	H	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	Cl	F	H	132
20	25	H	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	Br	H	
	26	H	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	Cl	Br	H	148
	27	H	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	F	Cl	H	>230

## Vorprodukte für Verfahren B

25



30

(IV-1)

Zu 1,9 g (15 mmol) 2,2-Dimethyl-1H-pyrrolidin-3,5-dion,  
gelöst in 50 ml absolutem Methylenchlorid, gibt man bei  
35 0-10°C, 2,1 ml Triethylamin und 3,14 g (15 mmol) 2,4-Di-  
chlor-benzoylchlorid, die ihrerseits in 5 ml absolutem  
Methylenchlorid gelöst sind. Dann läßt man bei Raumtem-

5 peratur nachreagieren und kontrolliert den Reaktions-  
ablauf durch Dünnschichtchromatographie.

Nach Beendigung der Reaktion entfernt man das Lösungsmittel im Vakuum, wäscht mit 200 ml 0,1 normaler Natriumhydroxid-Lösung nach, trocknet die organische Phase  
10 mit Magnesiumsulfat und engt wiederum im Vakuum ein. Der Rückstand wird aus Essigester/n-Hexan umkristallisiert. Man erhält 3,2 g (71 % der Theorie) 4-(2,4-Dichlorbenzoyloxy)-5,5-dimethylpyrrolin-1H-2-on der Formel (IV-  
15 1) mit Schmelzpunkt 167° C.

Tabelle 3

20	Präparat- Nummer	A	B	C	X	Y	Zn	Fp. [° C]
	IV-2	H	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	NO <sub>2</sub>	H	H	144
	IV-3	H	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	Cl	NO <sub>2</sub>	H	226
	IV-4	H	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	F	CF <sub>3</sub>	H	178
25	IV-5	H	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	Cl	SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	O(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	181
	IV-6	H	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -		Cl	Cl	H	238
	IV-7	H	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -		Cl	SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	O(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	193
	IV-8	H	CH <sub>3</sub>	cyclo- C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	Cl	Cl	H	175
30	IV-9	H	CH <sub>3</sub>	H	Cl	Cl	H	137
	IV-10	H	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	Cl	OCF <sub>3</sub>	H	136
	IV-11	H	CH <sub>3</sub>	i-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	Cl	Cl	H	128
	IV-12	H	CH <sub>3</sub>	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	Cl	Cl	H	204
	IV-13	H	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	Cl	F	H	177
35	IV-14	H	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	F	F	H	184

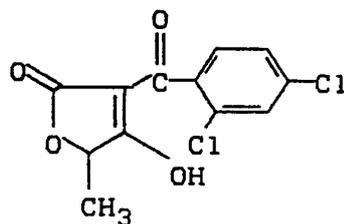
5 Tabelle 3

Präparat- Nummer	A	B	C	X	Y	Zn	Fp. [° C]
10 IV-15	H	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	Cl	Br	H	186
IV-16	H	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	Br	H	176
IV-17	H	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	F	Cl	H	>220
IV-18	H	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	Cl	SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	H	171

15 Anwendungsbeispiele

In den folgenden Anwendungsbeispielen wurde die nachstehend aufgeführte Verbindung als Vergleichssubstanz eingesetzt:

20



25

3-(2,4-Dichlorbenzoyl)-2,5-dihydro-4-hydroxy-5-methylfuran-2-on

30

35

5 Beispiel A

Pre-emergence-Test

Lösungsmittel: 5 Gewichtsteile Aceton

10 Emulgator: 1 Gewichtsteil Alkylarylpolyglykoether

Zur Herstellung einer zweckmäßigen Wirkstoffzubereitung  
vermischt man 1 Gewichtsteil Wirkstoff mit der angegebene-  
nen Menge Lösungsmittel, gibt die angegebene Menge Emul-  
15 gator zu und verdünnt das Konzentrat mit Wasser auf die  
gewünschte Konzentration.

Samen der Testpflanzen werden in normalen Boden ausgesät  
und nach 24 Stunden mit der Wirkstoffzubereitung besos-  
20 sen. Dabei hält man die Wassermenge pro Flächeneinheit  
zweckmäßigerweise konstant. Die Wirkstoffkonzentration  
in der Zubereitung spielt keine Rolle, entscheidend ist  
nur die Aufwandmenge des Wirkstoffs pro Flächeneinheit.  
Nach drei Wochen wird der Schädigungsgrad der Pflanzen  
25 bonitiert in % Schädigung im Vergleich zur Entwicklung  
der unbehandelten Kontrolle. Es bedeuten:

0 % = keine Wirkung (wie unbehandelte Kontrolle)

100 % = totale Vernichtung

30

Eine deutliche Überlegenheit in der Wirksamkeit ebenso  
wie in der Nutzpflanzenselektivität gegenüber dem Stand  
der Technik zeigen in diesem Test z.B. die Verbindungen  
gemäß folgender Herstellungsbeispiele: 2 und 6.

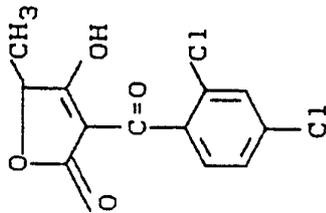
35

Tabelle A

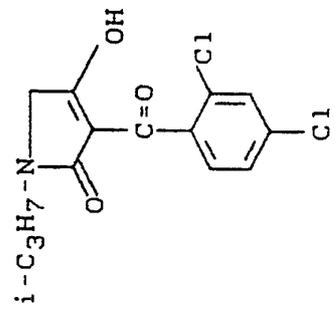
Pre-emergence-Test (Gewächshaus)

Wirkstoff	Aufwandmenge in g/ha	Weizen	Mais	Cyperus	Digitaria	Amaranthus	Galin-soga	Stellaria
-----------	-------------------------	--------	------	---------	-----------	------------	------------	-----------

Stand der Technik:



Erfindung:



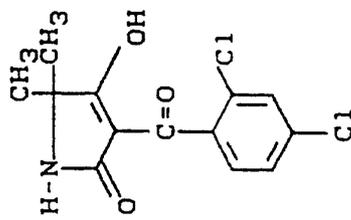
1000	0	0	0	0	0	50	0	0
------	---	---	---	---	---	----	---	---

(6) 1000	20	0	90	95	80	70	70
----------	----	---	----	----	----	----	----

Tabelle A (Fortsetzung)

Pre-emergence-Test (Gewächshaus)

Wirkstoff	Aufwandmenge in g/ha	Weizen	Mais	Cyperus	Digitaria	Amaranthus	Gallium	Stellaria
	(2) 1000	0	10	90	90	95	90	90



5 Beispiel B

Post-emergence-Test

Lösungsmittel: 5 Gewichtsteile Aceton

10 Emulgator: 1 Gewichtsteil Alkylarylpolyglykoether

Zur Herstellung einer zweckmäßigen Wirkstoffzubereitung vermischt man 1 Gewichtsteil Wirkstoff mit der angegebenen Menge Lösungsmittel, gibt die angegebene Menge Emul-  
15 gator zu und verdünnt das Konzentrat mit Wasser auf die gewünschte Konzentration.

Mit der Wirkstoffzubereitung spritzt man Testpflanzen, welche eine Höhe von 5 - 15 cm haben, so, daß die je-  
20 weils gewünschten Wirkstoffmengen pro Flächeneinheit ausgebracht werden. Nach drei Wochen wird der Schädigungsgrad der Pflanzen bonitiert in % Schädigung im Vergleich zur Entwicklung der unbehandelten Kontrolle. Es bedeuten:

25

0 % = keine Wirkung (wie unbehandelte Kontrolle)  
100 % = totale Vernichtung

30 Eine deutliche Überlegenheit in der Wirksamkeit ebenso wie in der Nutzpflanzenselektivität gegenüber dem Stand der Technik zeigen in diesem Test z.B. die Verbindung gemäß Herstellungsbeispiel 2.

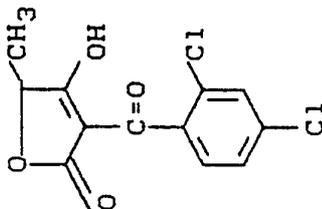
35

Tabelle B

Post-emergence-Test (Gewächshaus)

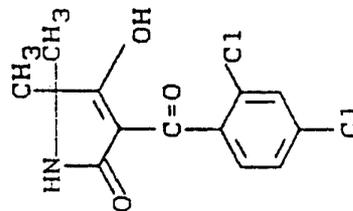
Wirkstoff	Aufwandmenge in g/ha	Weizen	Abutilon	Datura	Portulak	Solanum
-----------	-------------------------	--------	----------	--------	----------	---------

Stand der Technik:



40

Erfindung:



100

95

100

90

0

(2) 1000

5

Beispiel C

## Plutella-Test

10 Lösungsmittel: 7 Gewichtsteile Dimethylformamid  
Emulgator: 1 Gewichtsteil Alkylarylpolglykoether

Zur Herstellung einer zweckmäßigen Wirkstoffzubereitung vermischt man 1 Gewichtsteil Wirkstoff mit der angegebenen  
15 Menge Lösungsmittel und der angegebenen Menge Emulgator und verdünnt das Konzentrat mit Wasser auf die gewünschte Konzentration.

Kohlblätter (*Brassica oleracea*) werden durch Tauchen in die  
20 Wirkstoffzubereitung der gewünschten Konzentration behandelt und mit Raupen der Kohlschabe (*Plutella maculipennis*) besetzt, solange die Blätter noch feucht sind.

Nach der gewünschten Zeit wird die Abtötung in % bestimmt.  
25 Dabei bedeutet 100 %, daß alle Raupen abgetötet wurden; 0 % bedeutet, daß keine Raupen abgetötet wurden.

Bei diesem Test zeigt z.B. die Verbindung 4 der Her-  
stellungsbeispiele überlegene Wirksamkeit gegenüber dem  
30 Stand der Technik.

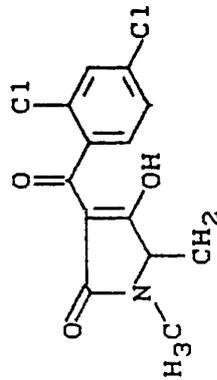
35

Tabelle C

Plutella-Test (pflanzen-schädigende Insekten)

Wirkstoffe	Wirkstoffkonzentration in %	Abtötungsgrad in % nach 7 Tagen
------------	-----------------------------	---------------------------------

Bsp. 4



0,1

100

5

Beispiel D

## Phaedon-Larven-Test

10

Lösungsmittel: 7 Gewichtsteile Dimethylformamid

Emulgator: 1 Gewichtsteil Alkylarylpolyglykoether

15

Zur Herstellung einer zweckmäßigen Wirkstoffzubereitung vermischt man 1 Gewichtsteil Wirkstoff mit der angegebenen Menge Lösungsmittel und der angegebenen Menge Emulgator und verdünnt das Konzentrat mit Wasser auf die gewünschte Konzentration.

20

Kohlblätter (*Brassica oleracea*) werden durch Tauchen in die Wirkstoffzubereitung der gewünschten Konzentration behandelt und mit Meerrettichblattkäfer-Larven (*Phaedon cochleariae*) besetzt, solange die Blätter noch feucht sind.

25

Nach der gewünschten Zeit wird die Abtötung in % bestimmt. Dabei bedeutet 100 %, daß alle Käferlarven abgetötet wurden; 0 % bedeutet, daß keine Käfer-Larven abgetötet wurden.

30

Bei diesem Test zeigt z.B. die Verbindung 8 der Herstellungsbeispiele überlegene Wirksamkeit gegenüber dem Stand der Technik.

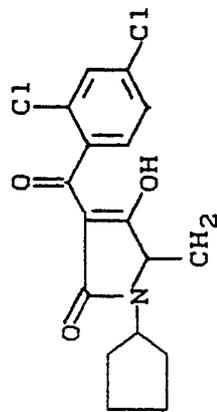
35

Tabelle D

Phaedon-Larven-Test (pflanzen-schädigende Insekten)

Wirkstoffe	Wirkstoffkonzentration in %	Abtötungsgrad in % nach 7 Tagen
------------	-----------------------------	---------------------------------

Bsp. 8



0,1

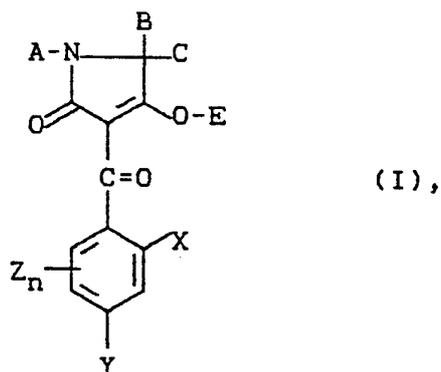
100

5

Patentansprüche

1. Substituierte 3-Benzoyl-pyrrolidin-2,4-dion-  
Derivate der allgemeinen Formel (I)

10



15

20

in welcher

- X für Wasserstoff, Alkyl, Halogen, Alkoxy, Halogenalkyl, Halogenalkoxy, Nitro, Alkoxy-carbonyl, Carboxy, Cyano oder  $-S(O)_m-R^1$  steht,
- 25 Y für Wasserstoff, Alkyl, Halogen, Alkoxy, Halogenalkyl, Halogenalkoxy, Nitro, Alkoxy-carbonyl, Carboxy, Cyano oder  $-S(O)_m-R^1$  steht,
- 30 Z für Alkyl, Halogen, Alkoxy, Halogenalkyl, gegebenenfalls durch Halogen substituiertes Alkoxy, Alkoxyalkyl oder Alkoxy-carbonyl steht,
- n für eine Zahl von 0-3 steht,
- 35 m für eine Zahl von 0-2 steht,

5 A für Wasserstoff, gegebenenfalls durch Halogen substituier-  
tes Alkyl, Alkoxyalkyl, Polyalkoxyalkyl,  
Alkylthioalkyl, Alkenyl, Alkinyl, gegebenenfalls  
durch Heteroatome unterbrochenes Cycloalkyl oder  
10 gegebenenfalls durch Halogen-, Alkyl-, Halogen-  
alkyl-, Alkoxy-, Nitro substituiertes Phenyl oder  
Arylalkyl steht,

B für Wasserstoff, gegebenenfalls durch Halogen substituier-  
tes Alkyl, Cycloalkyl, Alkoxyalkyl, Al-  
15 kylthioalkyl oder gegebenenfalls durch Alkyl, Alkoxy,  
Halogen, Nitro, Halogenalkyl, substituiertes  
Phenyl oder Aralkyl steht,

20 C für Wasserstoff, oder gegebenenfalls durch  
Halogen substituiertes Alkyl steht,

oder worin

25 A und B gemeinsam mit den Atomen, an die sie gebunden  
sind, einen gegebenenfalls durch Halogen oder  
gegebenenfalls halogeniertes Alkyl oder Alkoxy  
substituierten gesättigten oder ungesättigten  
Cyclus bilden, der durch Sauerstoff und/oder  
30 Schwefel unterbrochen sein kann,

oder worin

35 B und C gemeinsam mit dem Kohlenstoffatom, an das sie  
gebunden sind, einen gesättigten oder ungesättigten  
Cyclus bilden, der durch Halogen  
oder gegebenenfalls durch halogeniertes Alkyl

- 5 oder Alkoxy substituiert sein kann und durch Sauerstoff und/oder Schwefel unterbrochen sein kann.
- 10 E für Wasserstoff (= E<sup>1</sup>), oder für gegebenenfalls durch Halogen substituiertes Alkyl, Alkenyl, Alkynyl, Alkoxyalkyl, Aralkyl (= E<sup>2</sup>), für eine Gruppe CO-R<sup>2</sup> (= E<sup>3</sup>) oder für ein Metallion oder Metallequivalent (= E<sup>4</sup>) steht,
- 15 R<sup>1</sup> für gegebenenfalls durch Halogen substituiertes Alkyl oder für einen gegebenenfalls substituierten Phenylrest steht und
- 20 R<sup>2</sup> für gegebenenfalls durch Halogen substituiertes Alkyl, Alkenyl, Alkoxy, Alkoxyalkyl, Alkylthio oder gegebenenfalls substituiertes Phenyl oder Aralkyl steht.
- 25 2. Substituierte 3-Benzoyl-pyrrolidin-2,4-dion-Derivate der Formel (I) gemäß Anspruch 1, dadurch gekennzeichnet, daß
- 30 X für Wasserstoff, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkyl, Halogen, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkoxy, Nitro, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkoxy-carbonyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Carboxy, Cyano oder S(O)<sub>m</sub>-R<sup>1</sup> steht,
- 35

- 5 Y für Wasserstoff, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkyl, Halogen, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkoxy, Nitro, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkoxycarbonyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Carboxy, Cyano oder S(O)<sub>m</sub>-R<sup>1</sup> steht,
- 10 Z für C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkyl, Halogen, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkoxy-C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkoxy-C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkoxy-C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-halogenalkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkoxycarbonyl oder C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkoxycarbonyl steht,
- 15 n für eine Zahl von 0-3 steht,
- m für eine Zahl von 0-2 steht,
- 20 A für Wasserstoff oder gegebenenfalls durch Halogen substituiertes geradkettiges oder verzweigtes C<sub>1</sub>-C<sub>12</sub>-Alkyl, C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>-Alkenyl, C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>-Alkinyl, C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub>-Alkoxy-C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>-alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-Polyalkoxy-C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>-alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub>-Alkylthio-C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>-alkyl, Cycloalkyl mit 3-8
- 25 Ringatomen, das durch Sauerstoff und/oder Schwefel unterbrochen sein kann oder gegebenenfalls durch Halogen, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkyl-, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Haloalkyl-, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkoxy-, Nitro substituiertes Phenyl oder Aryl-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkyl steht,
- 30 B für Wasserstoff, geradkettiges oder verzweigtes und gegebenenfalls durch Halogen substituiertes C<sub>1</sub>-C<sub>12</sub>-Alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-Alkoxy-C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-Alkylthio-C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-alkyl, Cycloalkyl mit 3-8 Ringatomen, das
- 35 durch Sauerstoff und/oder Schwefel unterbrochen sein kann oder gegebenenfalls durch Halogen,

- 75 -

- 5 C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkoxy,  
Nitro substituiertes Phenyl oder Aryl-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkyl  
steht,
- 10 C für Wasserstoff oder gegebenenfalls durch Halogen  
substituiertes C<sub>1</sub>-C<sub>12</sub>-Alkyl steht, oder worin
- A und B gemeinsam mit den Atomen, an die sie gebunden  
sind, einen 5 bis 8-gliedrigen gesättigten oder  
ungesättigten Cyclus bilden, der durch Sauerstoff  
15 und/oder Schwefel unterbrochen und durch ge-  
gebenenfalls halogeniertes C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-  
Alkoxy oder Halogen substituiert sein kann,
- oder worin
- 20 B und C gemeinsam mit dem Kohlenstoffatom, an das sie  
gebunden sind einen 3 bis 8-gliedrigen gesättigten  
oder ungesättigten Cyclus bilden, der durch Sauer-  
stoff und/oder Schwefel unterbrochen und durch  
25 Halogen oder gegebenenfalls halogeniertes C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-  
Alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkoxy substituiert sein kann,
- E für E<sup>1</sup> = Wasserstoff,  
für E<sup>2</sup> = C<sub>1</sub>-C<sub>12</sub>-Alkyl, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkyl, C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>-  
30 Alkenyl, C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>-Alkynyl, C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>-Halogenalkenyl, C<sub>3</sub>-  
C<sub>8</sub>-Halogenalkynyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkoxy-C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-  
Halogenalkoxy-C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkoxy-, Aryl-C<sub>1</sub>-  
C<sub>6</sub>-alkyl,

35

- 5 für E<sup>3</sup> = eine Gruppe CO-R<sup>2</sup> oder  
für E<sup>4</sup> = ein Metallion oder ein Metallequivalent  
steht,
- 10 R<sup>1</sup> für gegebenenfalls durch Halogen substituiertes  
C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-Alkyl, oder für gegebenenfalls durch Halogen,  
Nitro, Cyano, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkoxy, C<sub>1</sub>-  
C<sub>4</sub>-Alkylthio, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkylthio, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl,  
C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkyl substituiertes Phenyl steht und
- 15 R<sup>2</sup> für gegebenenfalls durch Halogen substituiertes  
C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-Alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-Alkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-Alkylthio, C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>-  
Alkenyl, C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-Alkoxy-C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>-alkyl oder für gege-  
benenfalls durch Halogen, C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-Halogenalkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-  
Alkyl oder C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-Alkoxy substituiertes Phenyl, für  
20 gegebenenfalls durch Halogen, C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-Alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-  
Halogenalkyl oder C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-Alkoxy substituiertes Aryl-  
C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkyl steht.
- 25 3. Substituierte 3-Benzoyl-pyrrolidin-2,4-dion-Deriva-  
vate der Formel (I) gemäß Anspruch 1, dadurch  
gekennzeichnet, daß
- 30 X für Wasserstoff, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl, Halogen, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Al-  
koxy, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkoxy,  
Nitro, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy-carbonyl, Carboxy, Cyano oder  
S(O)<sub>m</sub>-R<sup>1</sup> steht,
- 35 Y für Wasserstoff, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkyl, Halogen, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-  
Alkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>-Halogenalkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkoxy,

- 5 Nitro, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy-carbonyl, Carboxy, Cyano oder S(O)<sub>m</sub>-R<sup>1</sup> steht,
- 10 Z für C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl, Halogen, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy-C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>-alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkoxy-C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>-alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy-C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>-halogenalkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy-carbonyl oder C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkoxy-carbonyl steht,
- 15 n für eine Zahl von 0-3 steht,
- m für eine Zahl von 0-2 steht,
- 20 A für Wasserstoff oder gegebenenfalls durch Halogen substituiertes geradkettiges oder verzweigtes C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub>-Alkyl, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-Alkenyl, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-Alkynyl, C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-Alkoxy-C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Polyalkoxy-C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-Alkylthio-C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-alkyl, Cycloalkyl mit 3-7 Ringatomen, das durch 1-2 Sauerstoff- und/oder Schwefelatome unterbrochen sein kann oder gegebenenfalls durch Halogen, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl-, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Haloalkyl-, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy oder Nitro substituiertes Phenyl oder Aryl-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alkyl steht,
- 25
- 30 B für Wasserstoff, geradkettiges oder verzweigtes und gegebenenfalls durch Halogen substituiertes C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub>-Alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkoxy-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkylthio-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkyl, Cycloalkyl mit 3-7 Ringatomen das durch 1-2 Sauerstoff und/oder Schwefelatome unterbrochen sein kann, oder gegebenenfalls durch Halo-
- 35

- 5 gen, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy  
oder Nitro substituiertes Phenyl oder Aryl-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-  
alkyl steht,
- 10 C für Wasserstoff oder gegebenenfalls durch Halogen  
substituiertes C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-Alkyl steht, oder worin
- A und B gemeinsam mit den Atomen, an die sie gebunden  
sind, einen 5 bis 7-gliedrigen gesättigten oder  
15 ungesättigten Cyclus bilden, der durch C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl,  
C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy, Fluor oder Chlor substituiert und der  
durch Sauerstoff und/oder Schwefel unterbrochen  
sein kann,
- oder worin
- 20 B und C gemeinsam mit dem Kohlenstoffatom, an das sie  
gebunden sind, einen 3 bis 7-gliedrigen gesättigten  
oder ungesättigten Cyclus bilden, der durch Sauer-  
stoff und/oder Schwefel unterbrochen und durch  
25 Fluor, Chlor, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-  
Halogenalkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkoxy substituiert sein  
kann,
- E für E<sup>1</sup> = Wasserstoff
- 30 für E<sup>2</sup> = C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-Alkyl, C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkyl, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-  
Alkenyl, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-Alkinyl, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-Halogen-  
alkenyl, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkinyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Al-  
koxy-C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>-alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkoxy-C<sub>2</sub>-  
C<sub>4</sub>-alkyl, Aryl-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alkyl,
- 35

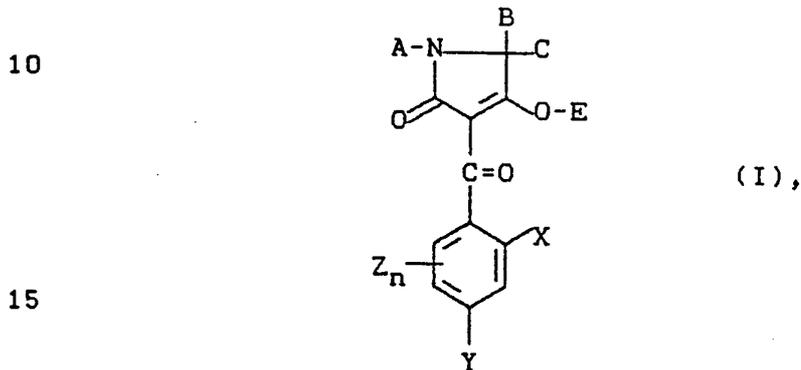
- 5 für E<sup>3</sup> = eine Gruppe CO-R<sup>2</sup> oder  
für E<sup>4</sup> = ein Metallion oder ein Metallequivalent  
steht,
- 10 R<sup>1</sup> für gegebenenfalls durch Halogen substituiertes C<sub>1</sub>-  
C<sub>6</sub>-Alkyl oder für gegebenenfalls durch Fluor, Chlor,  
Brom, Nitro, Cyano, C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>-Alkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>-Halogen-  
alkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>-Alkylthio, C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>-Halogenalkylthio, C<sub>1</sub>-  
C<sub>3</sub>-Alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>-Halogenalkyl substituiertes Phenyl,  
steht und
- 15 R<sup>2</sup> für gegebenenfalls durch Halogen substituiertes C<sub>1</sub>-  
C<sub>6</sub>-Alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkylthio, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-Al-  
kenyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkoxy-C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-alkyl oder für gegeben-  
falls durch Halogen, C<sub>1</sub>-C<sub>5</sub>-Halogenalkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>5</sub>-Alkyl  
20 oder C<sub>1</sub>-C<sub>5</sub>-Alkoxy substituiertes Phenyl, für gege-  
benenfalls durch Halogen, C<sub>1</sub>-C<sub>5</sub>-Alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>5</sub>-Halo-  
genalkyl oder C<sub>1</sub>-C<sub>5</sub>-Alkoxy substituiertes Aryl-C<sub>1</sub>-  
C<sub>4</sub>-alkyl steht.
- 25 4. Substituierte 3-Benzoyl-pyrrolidin-2,4-dion-  
Derivate der allgemeinen Formel (I) gemäß Anspruch  
1, dadurch gekennzeichnet, daß
- 30 X für Wasserstoff, Methyl, Ethyl, Propyl, i-Propyl,  
Fluor, Chlor, Brom, Methoxy, Ethoxy, Trifluormethyl,  
Difluormethyl, Trifluormethoxy, Nitro, Methoxy-  
carbonyl Ethoxycarbonyl, Cyano oder S(O)<sub>m</sub>R<sup>1</sup> steht,
- 35

- 5 Y für Wasserstoff, Methyl, Ethyl, Propyl, i-Propyl,  
Butyl, i-Butyl, tert.-Butyl, Fluor, Chlor, Brom,  
Methoxy, Ethoxy, Trifluormethyl, Trifluormethoxy,  
Difluormethyl, Nitro, Methoxycarbonyl, Ethoxy-  
10 carbonyl, Cyano oder  $S(O)_m R^1$  steht,
- Z für Methyl, Ethyl, i-Propyl, Butyl, i-Butyl, tert.-  
Butyl, Fluor, Chlor, Brom, Methoxy, Ethoxy, Tri-  
15 fluormethyl, Difluormethyl, Trifluormethoxy,  
Methoxyethyl, Ethoxyethyl, Propoxyethyl, iso-Pro-  
poxyethyl, Methoxycarbonyl, Ethoxycarbonyl, Tri-  
fluormethoxycarbonyl, Trichlormethoxycarbonyl,  
Difluormethoxycarbonyl steht,
- n für eine Zahl von 0-3 steht,  
20
- m für eine Zahl von 0-2 steht,
- A für Wasserstoff, gegebenenfalls durch Halogen sub-  
stituiertes geradkettiges oder verzweigtes  $C_1-C_8$ -  
25 Alkyl,  $C_3-C_4$ -Alkenyl,  $C_3-C_4$ -Alkynyl,  $C_1-C_6$ -Alkoxy-  
 $C_2-C_4$ -alkyl,  $C_1-C_4$ -Polyalkoxy- $C_2-C_4$ -alkyl,  $C_1-C_6$ -  
Alkylthio- $C_2-C_4$ -alkyl, Cycloalkyl mit 3-6 Ring-  
atomen, das durch 1-2 Sauerstoff- und/oder Schwe-  
felatome unterbrochen sein kann oder gegebenen-  
30 falls durch Fluor-, Chlor-, Brom-, Methyl-, Ethyl-,

- 5 Propyl-, iso-Propyl-, Methoxy-, Ethoxy-, Trifluor-  
methyl-, Nitro substituiertes Phenyl oder Aryl-C<sub>1</sub>-  
C<sub>3</sub>-alkyl steht,
- 10 B für Wasserstoff, geradkettiges oder verzweigtes und  
gegebenenfalls durch Halogen substituiertes C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-  
Alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-AlkoxyC<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkylthio-C<sub>1</sub>-  
C<sub>3</sub>-alkyl, Cycloalkyl mit 3-6 Ringatomen, das durch  
1-2 Sauerstoff und/oder Schwefelatome unterbrochen  
15 sein kann oder gegebenenfalls durch Halogen, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-  
Alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy oder Nitro  
substituiertes Phenyl oder Aryl-C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>-alkyl steht,
- 20 C für Wasserstoff, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkyl oder C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Halogen-  
alkyl steht,
- oder worin
- 25 A und B gemeinsam mit den Atomen, an die sie gebunden  
sind, einen 5 bis 6-gliedrigen gesättigten oder  
ungesättigten Cyclus bilden, der durch C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>-Alkyl,  
C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>-Alkoxy, Fluor oder Chlor substituiert und der  
durch Sauerstoff und/oder Schwefel unterbrochen  
sein kann,
- 30 oder worin
- 35 B und C gemeinsam mit dem Kohlenstoff, an das sie ge-  
bunden sind, einen 3 bis 6-gliedrigen gesättigten  
oder ungesättigten Cyclus bilden, der durch Sauer-

- 5 stoff und/oder Schwefel unterbrochen und durch Fluor, Chlor, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy, Trifluormethyl, Trifluormethoxy substituiert sein kann,
- E für E<sup>1</sup> = Wasserstoff steht,
- 10 für E<sup>2</sup> = C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkyl, C<sub>2</sub>-C<sub>3</sub>-Halogenalkyl, C<sub>3</sub>-C<sub>4</sub>-Alkenyl, C<sub>3</sub>-C<sub>4</sub>-Alkinyl, C<sub>3</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkenyl, C<sub>3</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkinyl, C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>-Alkoxy-C<sub>2</sub>-C<sub>3</sub>-alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>-Halogenalkoxy-C<sub>2</sub>-C<sub>3</sub>-alkyl, Aryl-C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>-alkyl steht,
- 15 für E<sup>3</sup> = eine Gruppe CO-R<sup>2</sup> oder  
für E<sup>4</sup> = Li<sup>⊕</sup>, Na<sup>⊕</sup>, K<sup>⊕</sup>, NH<sub>4</sub><sup>⊕</sup> steht,
- R<sup>1</sup> für gegebenenfalls durch Fluor substituiertes C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl oder für gegebenenfalls durch Fluor, Chlor, Brom, Nitro, Cyano, C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>-Alkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>-Fluoralkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>-Chloralkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>-Alkylthio, C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>-Fluoralkylthio, C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>-Chloralkylthio, C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>-Alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>-Fluoralkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>-Difluoralkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>-Trifluoralkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>-Chloralkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>-Dichloralkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>-Trichloralkyl substituiertes Phenyl steht
- 25 und
- R<sup>2</sup> für gegebenenfalls durch Fluor, Chlor, Brom substituiertes C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkylthio, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy-(C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>)alkyl oder für gegebenenfalls durch Fluor, Chlor, Brom, Trifluormethyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl oder C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy substituiertes Phenyl, für gegebenenfalls durch Fluor, Chlor, Brom, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl, Trifluormethyl oder C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy substituiertes Aryl-C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>-alkyl steht.
- 35

- 5 5. Verfahren zur Herstellung substituierter 3-Benzoyl-  
pyrrolidin-2,4-dion-Derivate der allgemeinen Formel  
(I)



in welcher

- 20 X für Wasserstoff, Alkyl, Halogen, Alkoxy, Halogen-  
alkyl, Halogenalkoxy, Nitro, Alkoxy-carbonyl, Carb-  
oxy, Cyano oder  $-S(O)_m-R^1$  steht,
- 25 Y für Wasserstoff, Alkyl, Halogen, Alkoxy, Halogenal-  
kyl, Halogenalkoxy, Nitro, Alkoxy-carbonyl, Carboxy,  
Cyano oder  $-S(O)_m-R^1$  steht,
- 30 Z für Alkyl, Halogen, Alkoxy, Halogenalkyl, gegeb-  
enfalls durch Halogen substituiertes Alkoxy, Al-  
koxyalkyl oder Alkoxy-carbonyl steht,
- n für eine Zahl von 0-3 steht,
- 35 m für eine Zahl von 0-2 steht,

5 A für Wasserstoff, gegebenenfalls durch Halogen substituier-  
tes Alkyl, Alkoxyalkyl, Polyalkoxyalkyl,  
Alkylthioalkyl, Alkenyl, Alkinyl, gegebenenfalls  
10 durch Heteroatome unterbrochenes Cycloalkyl oder  
gegebenenfalls durch Halogen-, Alkyl-, Halogen-  
alkyl-, Alkoxy-, Nitro substituiertes Phenyl oder  
Arylalkyl steht,

15 B für Wasserstoff, gegebenenfalls durch Halogen substituier-  
tes Alkyl, Cycloalkyl, Alkoxyalkyl, Al-  
kylthioalkyl oder gegebenenfalls durch Alkyl,  
Alkoxy, Halogen, Nitro, Halogenalkyl, substitu-  
iertes Phenyl oder Aralkyl steht,

20 C für Wasserstoff, oder gegebenenfalls durch  
Halogen substituiertes Alkyl steht,

oder worin

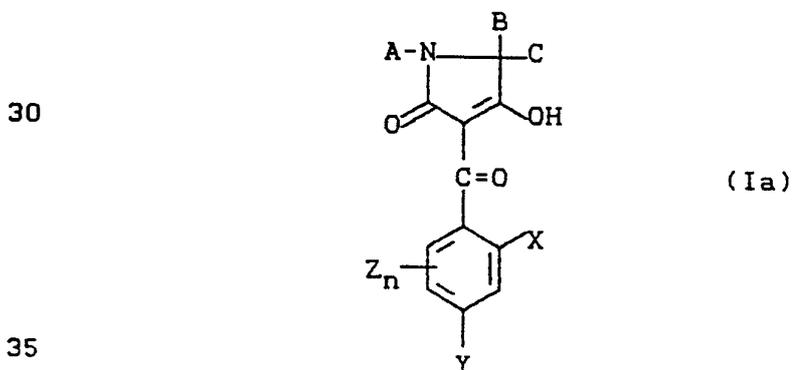
25 A und B gemeinsam mit den Atomen, an die sie gebunden  
sind, einen gegebenenfalls durch Halogen oder  
gegebenenfalls halogeniertes Alkyl oder Alkoxy  
substituierten gesättigten oder ungesättigten  
Cyclus bilden, der durch Sauerstoff und/oder  
30 Schwefel unterbrochen sein kann,

oder worin

35 B und C gemeinsam mit dem Kohlenstoffatom, an das sie  
gebunden sind, einen gesättigten oder unge-  
sättigten Cyclus bilden, der durch Halogen,

- 5 gegebeneneffalls durch halogeniertes Alkyl oder Alkoxy substituiert sein kann und durch Sauerstoff oder Schwefel unterbrochen sein kann,
- 10 E für Wasserstoff (= E<sup>1</sup>), oder für gegebeneneffalls durch Halogen substituiertes Alkyl, Alkenyl, Alkynyl, Alkoxyalkyl, Aralkyl (= E<sup>2</sup>), für eine Gruppe CO-R<sup>2</sup> (= E<sup>3</sup>) oder für ein Metallion oder Metallequivalent (= E<sup>4</sup>) steht,
- 15 R<sup>1</sup> für gegebeneneffalls durch Halogen substituiertes Alkyl oder für einen gegebeneneffalls substituierten Phenylrest steht und
- 20 R<sup>2</sup> für gegebeneneffalls durch Halogen substituiertes Alkyl, Alkenyl, Alkoxy, Alkoxyalkyl, Alkylthio oder gegebeneneffalls substituiertes Phenyl oder Aralkyl steht,

25 dadurch gekennzeichnet, daß man 3-Benzoyl-pyrrolidin-2,4-dion-Derivate der Formel (I) bzw. deren Enole der Formel (Ia)

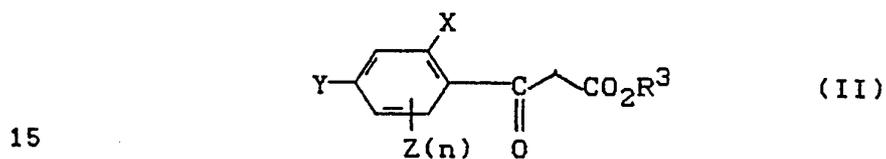


in welcher

5 A, B, C, X, Y, Z und n die oben angegebenen Bedeutungen  
haben,

erhält, wenn man

10 A) Benzoylessigester der Formel (II)

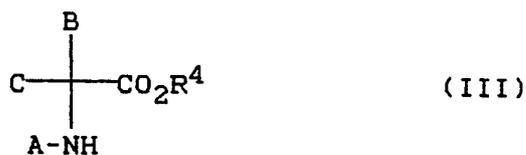


in welcher

20 X, Y, Z und n die oben angegebenen Bedeutungen  
haben und

$R^3$  für Alkyl steht

25 mit Aminosäureestern der allgemeinen Formel (III)



30

in welcher

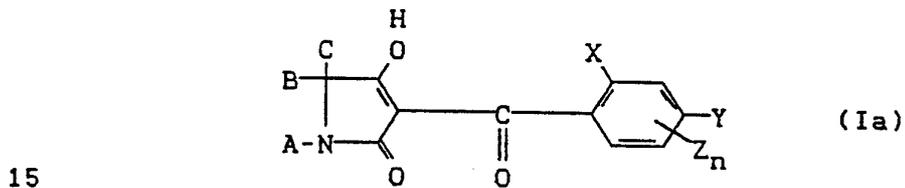
A, B und C die oben angegebenen Bedeutungen haben  
und

35

$R^4$  für Alkyl steht,

5  
 gegebenenfalls in Gegenwart eines Lösungsmittels  
 und in Gegenwart einer Base kondensiert, oder daß  
 man

10 B) Verbindungen der Formel (Ia)

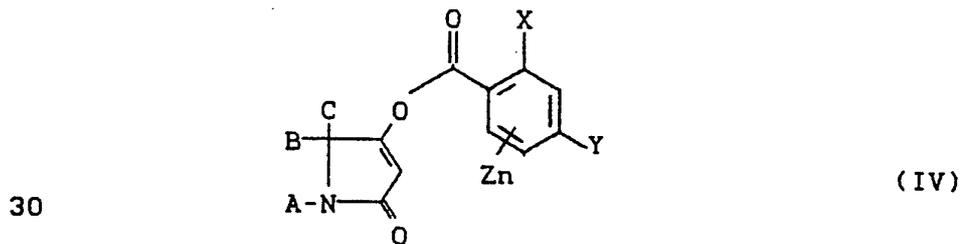


in welcher

20 A, B, C, X, Y, Z, und n die oben angegebenen  
 Bedeutungen haben,

erhält, wenn man 4-Benzoyloxy-pyrrolin-2-one der  
 Formel (IV)

25



35

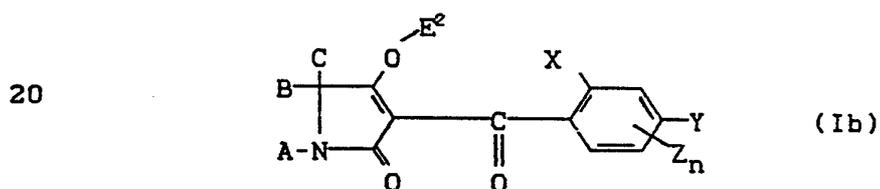
5 in welcher

A, B, C, X, Y, Z und n die oben angegebenen Bedeutungen haben,

10 gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels, gegebenenfalls in Gegenwart einer Base und gegebenenfalls in Gegenwart eines geeigneten Katalysators umlagert, oder daß man

15

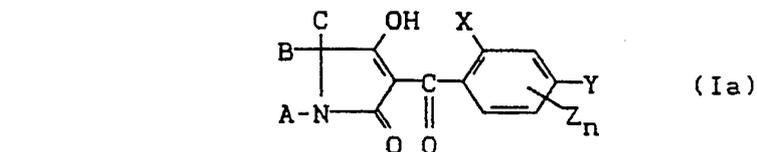
C) Verbindungen der Formel (Ib)



25 in welcher

A, B, C, E<sup>2</sup>, X, Y, Z und n die oben angegebenen Bedeutungen haben,

30 erhält, wenn man Verbindungen der Formel (Ia),



5 in welcher

A, B, C, X, Y, Z und n die oben angegebenen  
Bedeutungen haben,

10 mit Alkylierungsmitteln der allgemeinen Formel (V)



15 in welcher

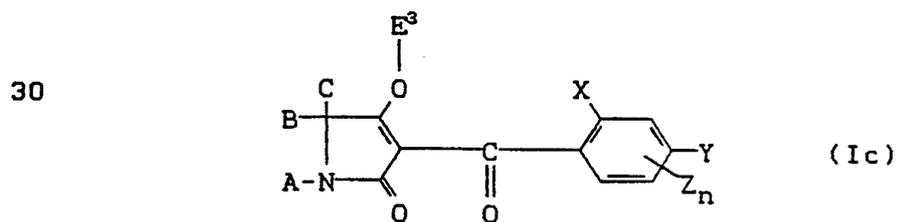
$E^2$  die oben angegebene Bedeutung hat und

L für Halogen,  $-OSO_2$ -Alkyl,  $-OSO_2O$ -Alkyl oder  
20  $-OSO_2$ -Aryl steht,

gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungs-  
mittels und gegebenenfalls in Gegenwart einer  
Base umgesetzt, oder daß man

25

D) Verbindungen der Formel (Ic)



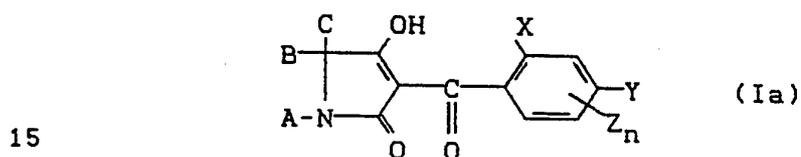
35

- 90 -

5 in welcher

A, B, C, E<sup>3</sup>, X, Y, Z und n die oben angegebenen  
Bedeutungen haben,

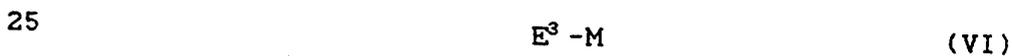
10 erhält, wenn man Verbindungen der Formel (Ia)



in welcher

20 A, B, C, X, Y, Z und n die oben angegebenen Bedeu-  
tungen haben,

mit Acylierungsreagenzien der Formel (VI)

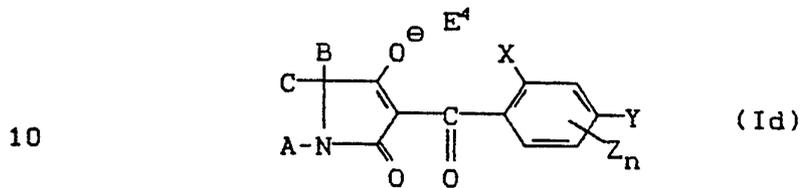


in welcher

30 E<sup>3</sup> die oben angegebene Bedeutung hat und  
M für Halogen, -OE<sup>3</sup>, CN, O-SO<sub>2</sub>-Alkyl, O-  
SO<sub>2</sub>-Aryl und Imidazolyl steht,

35 gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungs-  
mittels und gegebenenfalls in Gegenwart einer  
Base umgesetzt, oder daß man

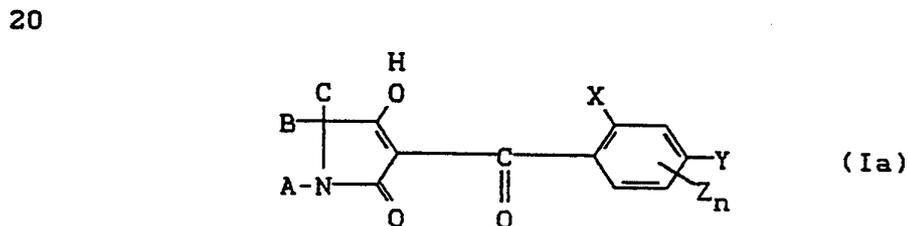
5 E) Verbindungen der allgemeinen Formel (Id)



in welcher

15 X, Y, Z, A, B, C, E<sup>4</sup> und n die oben angegebenen Bedeutungen haben,

erhält, wenn man Verbindungen der Formel (Ia)



25

in welcher

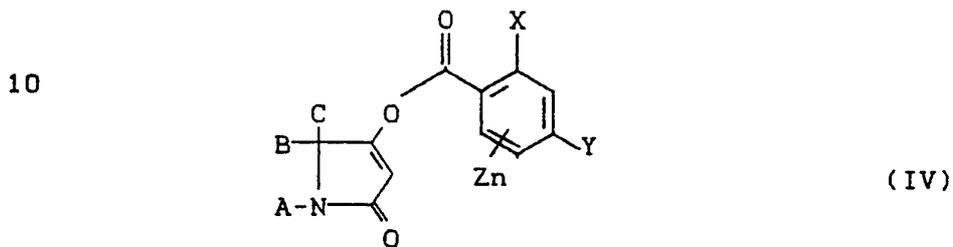
30 X, Y, Z, A, B, C und n die oben angegebenen Bedeutungen haben,

mit Metallhydroxiden oder Aminen der allgemeinen Formel (VII) und (VIII)



- 5 in welchen
- Me für ein- oder zweiwertige Metallionen,
- 10 s und t für die Zahlen 1 und 2 stehen
- R<sup>4</sup>, R<sup>5</sup> und R<sup>6</sup> unabhängig voneinander für  
Wasserstoff und Alkyl stehen,
- 15 gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungs-  
mittels, umgesetzt.
6. Verfahren zur Bekämpfung von unerwünschten Pflanz-  
zen, dadurch gekennzeichnet, daß man 3-Benzoyl-  
pyrrolidin-2,4-dion-Derivate der Formel (I) gemäß  
20 den Ansprüchen 1 bis 5 auf unerwünschte Pflanzen  
und/oder ihren Lebensraum einwirken läßt.
7. Verwendung von 3-Benzoyl-pyrrolidin-2,4-dion-Deri-  
vate der Formel (I) gemäß den Ansprüchen 1 bis 5  
25 zur Bekämpfung von unerwünschten Pflanzen.
8. Verfahren zur Herstellung von herbiziden, insekti-  
ziden Mitteln, dadurch gekennzeichnet, daß man  
3-Benzoyl-pyrrolidin-2,4-dion-Derivate der Formel  
30 (I) gemäß den Ansprüchen 1 bis 5 mit Streckmitteln  
und/oder oberflächenaktiven Substanzen vermischt.
- 35

- 5 9. 4-Benzoyloxy-pyrrolin-2-one der allgemeinen Formel  
(IV)



15 dadurch gekennzeichnet, daß

- 20 X für Wasserstoff, Alkyl, Halogen, Alkoxy, Halogenalkyl, Halogenalkoxy, Nitro, Alkoxy-carbonyl, Carboxy, Cyano oder  $-S(O)_m-R^1$  steht,
- 25 Y für Wasserstoff, Alkyl, Halogen, Alkoxy, Halogenalkyl, Halogenalkoxy, Nitro, Alkoxy-carbonyl, Carboxy, Cyano oder  $-S(O)_m-R^1$  steht,
- 30 Z für Alkyl, Halogen, Alkoxy, Halogenalkyl, gegebenenfalls durch Halogen substituiertes Alkoxy, Alkoxyalkyl oder Alkoxy-carbonyl steht,
- n für eine Zahl von 0-3 steht,

35

- 5 m für eine Zahl von 0-2 steht,
- A für Wasserstoff, gegebenenfalls durch Halogen  
substituiertes Alkyl, Alkoxyalkyl, Polyalkoxy-  
alkyl, Alkylthioalkyl, Alkenyl, Alkynyl, ge-  
10 gegebenenfalls durch Heteroatome unterbrochenes  
Cycloalkyl oder gegebenenfalls durch Halogen-,  
Alkyl-, Halogenalkyl-, Alkoxy-, Nitro substi-  
tuiertes Phenyl oder Arylalkyl steht,
- 15 B für Wasserstoff, gegebenenfalls durch Halogen  
substituiertes Alkyl, Cycloalkyl, Alkoxyalkyl,  
Alkylthioalkyl oder gegebenenfalls durch  
Alkyl, Alkoxy, Halogen, Nitro, Halogenalkyl,  
substituiertes Phenyl oder Aralkyl steht,
- 20 C für Wasserstoff, oder gegebenenfalls durch  
Halogen substituiertes Alkyl steht,
- oder worin
- 25 A und B gemeinsam mit den Atomen, an die sie ge-  
bunden sind, einen gesättigten oder ungesät-  
tigten Cyclus bilden, der gegebenenfalls  
durch Halogen oder gegebenenfalls durch halo-  
30 geniertes Alkyl oder Alkoxy substituiert sein  
kann und durch Sauerstoff und/oder Schwefel  
unterbrochen sein kann,

oder worin

35

5           B und C gemeinsam mit dem Kohlenstoffatom, an das  
sie gebunden sind, einen gesättigten oder  
          ungesättigten Cyclus bilden, der durch  
          Halogen oder gegebenenfalls durch haloge-  
10           niertes Alkyl oder Alkoxy substituiert  
sein kann und durch Sauerstoff und/oder  
          Schwefel unterbrochen sein kann und

          R<sup>1</sup> für gegebenenfalls durch Halogen substituier-  
          tes Alkyl oder für einen gegebenenfalls sub-  
15           stituierten Phenylrest steht.

10.       Verfahren zur Bekämpfung von Insekten, dadurch ge-  
          kennzeichnet, daß man 3-Benzoyl-pyrrolidin-2,4-  
          dion-Derivate der allgemeinen Formel (I) gemäß den  
20           Ansprüchen 1 bis 5 auf Insekten und/oder ihren  
Lebensraum einwirken läßt.

11.       Verwendung von 3-Benzoyl-pyrrolidin-2,4-dion-Deri-  
          vaten der allgemeinen Formel (I) gemäß den Ansprü-  
25           chen 1 bis 5 zur Bekämpfung von Insekten.

30

35

## INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No.  
PCT/EP93/01690

## A. CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER

Int.Cl.5 C07D 207/38; C07D 209/54; C07D 471/04 A01N 43/36  
A01N 43/38; A01N 43/90; //(C07D 471/04, 221:00, 209:00)

According to International Patent Classification (IPC) or to both national classification and IPC

## B. FIELDS SEARCHED

Minimum documentation searched (classification system followed by classification symbols)

Int.Cl.5 C07D

Documentation searched other than minimum documentation to the extent that such documents are included in the fields searched

Electronic data base consulted during the international search (name of data base and, where practicable, search terms used)

## C. DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

Category*	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
X,Y	WO, A,8 804 652 (NIPPON SODA CO., LTD) 30 June 1988 cited in the application see the whole document	1-11
Y	EP, A,0 377 893 (BAYER AG) 18 July 1990 see the whole document	1-11
X	TETRAHEDRON LETTERS; Vol. 24, No. 43, 1983, OXFORD GB pages 4751-4754; R.C.F. JONES ET AL. 'Direct Metallation of Tetramic acids: A New Synthesis of 3-Acyl Tetramic Acids' see the whole document; in particular page 4753, formula 11a and 12a	1-4
X	JOURNAL OF INORGANIC BIOCHEMISTRY; Vol. 39, No. 4, 1990 NEW YORK US; pages 307-316; O. MARKOPOULOU ET AL. 'Synthesis of 3-Butanoyl-and -3-Benzoyl-4-hydroxy-3- pyrrolin-2-ones and their Complexes with Metal Ions' see the whole document, in particular page 308, formula 5	1-5

 Further documents are listed in the continuation of Box C. See patent family annex.

## \* Special categories of cited documents:

"A" document defining the general state of the art which is not considered to be of particular relevance

"E" earlier document but published on or after the international filing date

"L" document which may throw doubts on priority claim(s) or which is cited to establish the publication date of another citation or other special reason (as specified)

"O" document referring to an oral disclosure, use, exhibition or other means

"P" document published prior to the international filing date but later than the priority date claimed

"T" later document published after the international filing date or priority date and not in conflict with the application but cited to understand the principle or theory underlying the invention

"X" document of particular relevance: the claimed invention cannot be considered novel or cannot be considered to involve an inventive step when the document is taken alone

"Y" document of particular relevance: the claimed invention cannot be considered to involve an inventive step when the document is combined with one or more other such documents, such combination being obvious to a person skilled in the art

"&amp;" document member of the same patent family

Date of the actual completion of the international search  
11 October 1993 (11.10.93)Date of mailing of the international search report  
3 November 1993 (03.11.93)Name and mailing address of the ISA  
European Patent Office

Authorized officer:

Facsimile No

Telephone No

## INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No.

PCT/EP93/01690

## C (Continuation). DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

Category*	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
P,X	IL FARMACO; Vol. 47, No. 10, 1092, PAVIA IT pages 1323-1333; M. E. TRANQUILLINI 'Synthesis of 3-Aroyltetramic acids' see the whole document in particular page 1326, formula 6a-d and 11a-d  -----	1-5

**ANNEX TO THE INTERNATIONAL SEARCH REPORT  
ON INTERNATIONAL PATENT APPLICATION NO.**

EP 9301690  
SA 76121

This annex lists the patent family members relating to the patent documents cited in the above-mentioned international search report. The members are as contained in the European Patent Office EDP file on  
The European Patent Office is in no way liable for these particulars which are merely given for the purpose of information. 11/10/93

Patent document cited in search report	Publication date	Patent family member(s)	Publication date
WO-A-8804652	30-06-88	None	
EP-A-0377893	18-07-90	AU-B- 620193	13-02-92
		AU-A- 4764990	19-07-90
		CA-A- 2007239	07-07-90
		JP-A- 2225459	07-09-90
		US-A- 5045560	03-09-91
		US-A- 5186737	16-02-93

# INTERNATIONALER RECHERCHENBERICHT

PCT/EP 93/01690

Internationales Aktenzeichen

<b>I. KLASSIFIKATION DES ANMELDUNGSGEGENSTANDS</b> (bei mehreren Klassifikationssymbolen sind alle anzugeben) <sup>6</sup>		
Nach der Internationalen Patentklassifikation (IPC) oder nach der nationalen Klassifikation und der IPC		
Int.Kl. 5 C07D207/38; A01N43/38;	C07D209/54; A01N43/90;	C07D471/04; A01N43/36 //(C07D471/04, 221:00, 209:00)
<b>II. RECHERCHIERTE SACHGEBIETE</b>		
Recherchierter Mindestprüfstoff <sup>7</sup>		
Klassifikationssystem	Klassifikationssymbole	
Int.Kl. 5	C07D	
Recherchierte nicht zum Mindestprüfstoff gehörende Veröffentlichungen, soweit diese unter die recherchierten Sachgebiete fallen <sup>8</sup>		
<b>III. EINSCHLAGIGE VERÖFFENTLICHUNGEN</b> <sup>9</sup>		
Art. <sup>o</sup>	Kennzeichnung der Veröffentlichung <sup>11</sup> , soweit erforderlich unter Angabe der maßgeblichen Teile <sup>12</sup>	Betr. Anspruch Nr. <sup>13</sup>
X, Y	WO, A, 8 804 652 (NIPPON SODA CO., LTD.) 30. Juni 1988 in der Anmeldung erwähnt siehe das ganze Dokument ---	1-11
Y	EP, A, 0 377 893 (BAYER AG) 18. Juli 1990 siehe das ganze Dokument ---	1-11
X	TETRAHEDRON LETTERS Bd. 24, Nr. 43, 1983, OXFORD GB Seiten 4751 - 4754 R.C.F. JONES ET AL. 'Direct Metallation of Tetramic acids: A New Synthesis of 3-Acyl Tetramic Acids' siehe das ganze Dokument, insbesondere Seite 4753, Formel 11a und 12a ---	1-4
-/--		
<p><sup>o</sup> Besondere Kategorien von angegebenen Veröffentlichungen <sup>10</sup> :</p> <p>"A" Veröffentlichung, die den allgemeinen Stand der Technik definiert, aber nicht als besonders bedeutsam anzusehen ist</p> <p>"E" älteres Dokument, das jedoch erst am oder nach dem internationalen Anmeldedatum veröffentlicht worden ist</p> <p>"L" Veröffentlichung, die geeignet ist, einen Prioritätsanspruch zweifelhaft erscheinen zu lassen, oder durch die das Veröffentlichungsdatum einer anderen im Recherchenbericht genannten Veröffentlichung belegt werden soll oder die aus einem anderen besonderen Grund angegeben ist (wie ausgeführt)</p> <p>"O" Veröffentlichung, die sich auf eine mündliche Offenbarung, eine Benutzung, eine Ausstellung oder andere Maßnahmen bezieht</p> <p>"P" Veröffentlichung, die vor dem internationalen Anmeldedatum, aber nach dem beanspruchten Prioritätsdatum veröffentlicht worden ist</p> <p>"T" Spätere Veröffentlichung, die nach dem internationalen Anmeldedatum oder dem Prioritätsdatum veröffentlicht worden ist und mit der Anmeldung nicht kollidiert, sondern nur zum Verständnis des der Erfindung zugrundeliegenden Prinzips oder der ihr zugrundeliegenden Theorie angegeben ist</p> <p>"X" Veröffentlichung von besonderer Bedeutung; die beanspruchte Erfindung kann nicht als neu oder auf erfinderischer Tätigkeit beruhend betrachtet werden</p> <p>"Y" Veröffentlichung von besonderer Bedeutung; die beanspruchte Erfindung kann nicht als auf erfinderischer Tätigkeit beruhend betrachtet werden, wenn die Veröffentlichung mit einer oder mehreren anderen Veröffentlichungen dieser Kategorie in Verbindung gebracht wird und diese Verbindung für einen Fachmann naheliegend ist</p> <p>"&amp;" Veröffentlichung, die Mitglied derselben Patentfamilie ist</p>		
<b>IV. BESCHEINIGUNG</b>		
Datum des Abschlusses der internationalen Recherche	Absenddatum des internationalen Recherchenberichts	
11. OKTOBER 1993	- 3. 11. 93	
Internationale Recherchenbehörde	Unterschrift des bevollmächtigten Bediensteten	
EUROPAISCHES PATENTAMT	ALLARD M. S.	

III. EINSCHLAGIGE VERÖFFENTLICHUNGEN (Fortsetzung von Blatt 2)		
Art °	Kennzeichnung der Veröffentlichung, soweit erforderlich unter Angabe der maßgeblichen Teile	Betr. Anspruch Nr.
X	<p>JOURNAL OF INORGANIC BIOCHEMISTRY            Bd. 39, Nr. 4, 1990, NEW YORK US            Seiten 307 - 316            O. MARKOPOULOU ET AL. 'Synthesis of            3-Butanoyl- and            3-Benzoyl-4-hydroxy-3-pyrrolin-2-ones and            their Complexes with Metal Ions'            siehe das ganze Dokument, insbesondere            Seite 308, Formel 5</p> <p style="text-align: center;">---</p>	1-5
P,X	<p>IL FARMACO            Bd. 47, Nr. 10, 1092, PAVIA IT            Seiten 1323 - 1333            M.E. TRANQUILLINI 'Synthesis of            3-Aroyltetramic acids'            siehe das ganze Dokument, insbesondere            Seite 1326, Formel 6a-d und 11a-d</p> <p style="text-align: center;">-----</p>	1-5

**ANHANG ZUM INTERNATIONALEN RECHERCHENBERICHT  
 ÜBER DIE INTERNATIONALE PATENTANMELDUNG NR.**

EP 9301690  
 SA 76121

In diesem Anhang sind die Mitglieder der Patentfamilien der im obengenannten internationalen Recherchenbericht angeführten Patentdokumente angegeben.  
 Die Angaben über die Familienmitglieder entsprechen dem Stand der Datei des Europäischen Patentamts am  
 Diese Angaben dienen nur zur Unterrichtung und erfolgen ohne Gewähr.

11/10/93

Im Recherchenbericht angeführtes Patentdokument	Datum der Veröffentlichung	Mitglied(er) der Patentfamilie	Datum der Veröffentlichung
WO-A-8804652	30-06-88	Keine	
EP-A-0377893	18-07-90	AU-B- 620193	13-02-92
		AU-A- 4764990	19-07-90
		CA-A- 2007239	07-07-90
		JP-A- 2225459	07-09-90
		US-A- 5045560	03-09-91
		US-A- 5186737	16-02-93

EPO FORM P0473

Für nähere Einzelheiten zu diesem Anhang : siehe Amtsblatt des Europäischen Patentamts, Nr.12/82