

(12) NACH DEM VERTRAG ÜBER DIE INTERNATIONALE ZUSAMMENARBEIT AUF DEM GEBIET DES PATENTWESENS (PCT) VERÖFFENTLICHTE INTERNATIONALE ANMELDUNG

(19) Weltorganisation für geistiges Eigentum  
Internationales Büro



(43) Internationales Veröffentlichungsdatum  
6. November 2003 (06.11.2003)

PCT

(10) Internationale Veröffentlichungsnummer  
WO 03/090539 A1

- (51) Internationale Patentklassifikation<sup>7</sup>: A01N 43/80, C07D 413/04, 417/04 (74) Gemeinsamer Vertreter: BASF AKTIENGESELLSCHAFT; 67056 Ludwigshafen (DE).
- (21) Internationales Aktenzeichen: PCT/EP03/04136 (81) Bestimmungsstaaten (national): AE, AG, AL, AM, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BR, BY, BZ, CA, CH, CN, CO, CR, CU, CZ, DE, DK, DM, DZ, EC, EE, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, HR, HU, ID, IL, IN, IS, JP, KE, KG, KP, KR, KZ, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LV, MA, MD, MG, MK, MN, MW, MX, MZ, NI, NO, NZ, OM, PH, PL, PT, RO, RU, SC, SD, SE, SG, SK, SL, TJ, TM, TN, TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ, VC, VN, YU, ZA, ZM, ZW.
- (22) Internationales Anmeldedatum: 22. April 2003 (22.04.2003) (84) Bestimmungsstaaten (regional): ARIPO-Patent (GH, GM, KE, LS, MW, MZ, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), eurasisches Patent (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), europäisches Patent (AT, BE, BG, CH, CY, CZ, DE, DK, EE, ES, FI, FR, GB, GR, HU, IE, IT, LU, MC, NL, PT, RO, SE, SI, SK, TR), OAPI-Patent (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GQ, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG).
- (25) Einreichungssprache: Deutsch
- (26) Veröffentlichungssprache: Deutsch
- (30) Angaben zur Priorität: 102 18 620 25. April 2002 (25.04.2002) DE

(71) Anmelder (für alle Bestimmungsstaaten mit Ausnahme von US): BASF AKTIENGESELLSCHAFT [DE/DE]; 67056 Ludwigshafen (DE).

(72) Erfinder; und

(75) Erfinder/Anmelder (nur für US): WAGNER, Oliver [DE/DE]; Im Meisental 50, 67433 Neustadt (DE). RACK, Michael [DE/DE]; Sandwingert 67, 69123 Heidelberg (DE). WITSCHEL, Matthias [DE/DE]; Höhenweg 12b, 67098 Bad Dürkheim (DE). ZAGAR, Cyrill [DE/DE]; Untere Clignetstr. 8, 68167 Mannheim (DE). LANDES, Andreas [DE/DE]; Grünewaldstr.15, 67354 Römerberg-Heiligenstein (DE).

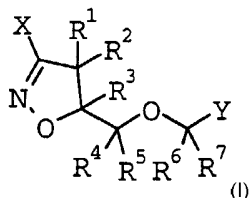
Veröffentlicht:

- mit internationalem Recherchenbericht
- vor Ablauf der für Änderungen der Ansprüche geltenden Frist; Veröffentlichung wird wiederholt, falls Änderungen eintreffen

Zur Erklärung der Zweibuchstaben-Codes und der anderen Abkürzungen wird auf die Erklärungen ("Guidance Notes on Codes and Abbreviations") am Anfang jeder regulären Ausgabe der PCT-Gazette verwiesen.

(54) Title: 3-HETEROARYL SUBSTITUTED 5-METHYLOXYMETHYL ISOXAZOLINES USED AS HERBICIDES

(54) Bezeichnung: 3-HETEROARYLSUBSTITUIERTE 5 METHYLOXYMETHYL-ISOXAZOLINE ALS HERBIZIDE



(57) Abstract: The invention relates to 3-heteroaryl substituted isoxazolines of formula (I), or to their salts that can be used for agricultural purposes. In said formula, the variables are defined as follows: X represents a substituted 5-membered heteroaryl comprising between one and four nitrogen atoms, or between one and three nitrogen atoms and one oxygen or sulphur atom, or one oxygen or sulphur atom, or represents a substituted 6-membered heteroaryl comprising between one and four nitrogen atoms, whereby the aforementioned 5-membered heteroaryl is not pyrazolyl or thienyl; R<sup>1</sup> - R<sup>7</sup> represent hydrogen, alkyl or haloalkyl; Y represents an optionally substituted aryl, or benzo[1,4]dioxonyl, benzo[1,3]dioxolanyl, 2,3-dihydrobenzofuranyl or benzimidazole, or an optionally substituted 5- to 6-membered heteroaryl. The invention also relates to methods and intermediate products for the production of said compounds, in addition to the use thereof or of agents containing the compounds for controlling undesired plants.

(57) Zusammenfassung: Die vorliegende Erfindung betrifft 3-heteroarylsubstituierte Isoxazoline der Formel (I): in der die Variablen die folgenden Bedeutungen haben: X substituiertes 5-gliedriges Heteroaryl mit ein bis vier Stickstoffatomen, oder mit ein bis drei Stickstoffatomen und einem Sauerstoff- oder Schwefelatom, oder mit einem Sauerstoff- oder Schwefelatom; oder substituiertes 6-gliedriges Heteroaryl mit ein bis vier Stickstoffatomen; wobei das oben genannte 5-gliedrige Heteroaryl nicht Pyrazolyl oder Thienyl ist; R<sup>1</sup> - R<sup>7</sup> Wasserstoff, Alkyl oder Halogenalkyl; Y gegebenenfalls substituiertes Aryl, oder Benzo[1,4]dioxonyl, Benzo[1,3]dioxolanyl, 2,3-Dihydrobenzofuranyl oder Benzimidazol; oder gegebenenfalls substituiertes 5- bis 6-gliedriges Heteroaryl; sowie deren landwirtschaftlich brauchbaren Salze, Verfahren und Zwischenprodukte zu ihrer Herstellung; sowie die Verwendung dieser Verbindungen oder diese Verbindungen enthaltende Mittel zur Bekämpfung unerwünschter Pflanzen.

WO 03/090539 A1



## 2

nocarbonyl-C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-alkyl, Carboxyl, Carboxy-C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-alkyl, Phenyl, Phenoxy, Phenylthio, Phenylamino, Phenyl-C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-alkyl, Phenyl-C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-alkoxy, 3- bis 6-gliedriges Heterocyclyl und 5- oder 6-gliedriges Heteroaryl, wobei die acht letztgenannten Reste ihrerseits partiell oder vollständig halogeniert sein können und/oder ein bis drei Substituenten aus der Gruppe Nitro, Cyano, 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>-Halogenalkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-Halogenalkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-Alkylthio, C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-Halogenalkylthio, C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-Alkylsulfinyl, C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-Halogenalkylsulfinyl, C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-Alkylsulfonyl und C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-Halogenalkylsulfonyl tragen können;

wobei das oben genannte 5-gliedrige Heteroaryl nicht Pyrazolyl oder Thienyl ist;

15

R<sup>1</sup> - R<sup>7</sup> Wasserstoff, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkyl oder C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkyl;

Y

Aryl, das partiell oder vollständig halogeniert sein kann und/oder ein bis drei Substituenten aus der Gruppe Cyano, Nitro, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkyl, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-Alkenyl, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-Alkynyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkylthio, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkylthio, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkoxy-carbonyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkoxy-carbonyl-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkylsulfonyl, Phenyl, Phenoxy und Phenylcarbonyl, Benzo[1,4]dioxonyl, Benzo[1,3]dioxolanyl, 2,3-Dihydrobenzofuranyl oder Benzimidazol; oder 5-gliedriges Heteroaryl mit ein bis vier Stickstoffatomen, oder mit ein bis drei Stickstoffatomen und einem Sauerstoff- oder Schwefelatom, oder mit einem Sauerstoff- oder Schwefelatom; oder 6-gliedriges Heteroaryl mit ein bis vier Stickstoffatomen; wobei die Heterocyclen partiell oder vollständig halogeniert sein können und/oder ein bis drei Substituenten aus der Gruppe Cyano, 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-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkoxy-carbonyl und C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkylsulfonyl tragen können;

sowie deren landwirtschaftlich brauchbaren Salze.

40

Außerdem betrifft die Erfindung Verfahren und Zwischenprodukte zur Herstellung von Verbindungen der Formel I, Mittel welche diese enthalten sowie die Verwendung dieser Derivate oder diese enthaltende Mittel zur Schädnpflanzenbekämpfung.

45

## 3

- Aus der Literatur, beispielsweise aus EP 514 987 sind 3-phenyl-substituierte Isoxazoline bekannt. In EP 334 120 werden Isoxazoline, welche in 3-Position durch einen unsubstituierten Heterocyclus substituiert sind, offenbart. Weiterhin werden in JP
- 5** 2001/158787 3-Pyrazolylylsubstituierte Isoxazoline beschrieben. Aus WO 02/19825 und KR 2002/19751 sind thienylsubstituierte Isoxazoline bekannt. In JP 09/143171 werden Isoxazoline, welche in 3-Position durch eine Carbonyl- oder Oximgruppe substituiert sind, genannt.
- 10** Die herbiziden Eigenschaften der bisher bekannten Verbindungen bzw. die Verträglichkeiten gegenüber Kulturpflanzen können jedoch nur bedingt befriedigen. Es lag daher dieser Erfindung die Aufgabe zugrunde, neue, insbesondere herbizid wirksame, Verbindungen
- 15** mit verbesserten Eigenschaften zu finden.
- Demgemäß wurden die 3-heteroarylylsubstituierten Isoxazoline der Formel I sowie deren herbizide Wirkung gefunden.
- 20** Ferner wurden herbizide Mittel gefunden, welche die Verbindungen I enthalten und eine sehr gute herbizide Wirkung besitzen. Außerdem wurden Verfahren zur Herstellung dieser Mittel und Verfahren zur Bekämpfung von unerwünschtem Pflanzenwuchs mit den Verbindungen I gefunden.
- 25** Die Verbindungen der Formel I können je nach Substitutionsmuster ein oder mehrere Chiralitätszentren enthalten und liegen dann als Enantiomeren oder Diastereomeregemische vor. Gegenstand der Erfindung sind sowohl die reinen Enantiomeren oder Diastereomeren
- 30** als auch deren Gemische.
- Die Verbindungen der Formel I können auch in Form ihrer landwirtschaftlich brauchbaren Salze vorliegen, wobei es auf die Art des Salzes in der Regel nicht ankommt. Im allgemeinen kommen die
- 35** Salze derjenigen Kationen oder die Säureadditionssalze derjenigen Säuren in Betracht, deren Kationen, beziehungsweise Anionen, die herbizide Wirkung der Verbindungen I nicht negativ beeinträchtigen.
- 40** Es kommen als Kationen insbesondere Ionen der Alkalimetalle, vorzugsweise Lithium, Natrium und Kalium, der Erdalkalimetalle, vorzugsweise Calcium und Magnesium, und der Übergangsmetalle, vorzugsweise Mangan, Kupfer, Zink und Eisen, sowie Ammonium, wobei hier gewünschtenfalls ein bis vier Wasserstoffatome durch
- 45** C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl, Hydroxy-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>-alkyl, Hydroxy-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alkoxy-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alkyl, Phenyl oder Benzyl ersetzt sein können, vorzugsweise Ammonium, Dimethylammonium, Diisopropyl-

## 4

ammonium, Tetramethylammonium, Tetrabutylammonium, 2-(2-Hydroxyeth-1-oxy)eth-1-ylammonium, Di(2-hydroxyeth-1-yl)ammonium, Trimethylbenzylammonium, des weiteren Phosphoniumionen, Sulfoniumionen, vorzugsweise Tri(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alkyl)sulfonium und Sulfoxonium-  
 5 ionen, vorzugsweise Tri(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alkyl)sulfoxonium, in Betracht.

Anionen von brauchbaren Säureadditionsalzen sind in erster Linie Chlorid, Bromid, Fluorid, Hydrogensulfat, Sulfat, Dihydrogenphosphat, Hydrogenphosphat, Nitrat, Hydrogencarbonat, Carbonat,  
 10 Hexafluorosilikat, Hexafluorophosphat, Benzoat sowie die Anionen von C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkansäuren, vorzugsweise Formiat, Acetat, Propionat und Butyrat.

Die für die Substituenten R<sup>1</sup>-R<sup>7</sup> oder als Reste an Aryl- bzw. Heteroarylringen genannten organischen Molekülteile stellen Sammelbegriffe für individuelle Aufzählungen der einzelnen Gruppenmitglieder dar. Sämtliche Kohlenwasserstoffketten, also alle Alkyl-, Halogenalkyl-, Cyanoalkyl-, Alkoxy-, Halogenalkoxy-, Alkylcarbonyloxy, Alkylthio-, Halogenalkylthio-, Alkylsulfinyl-, Halogen-  
 20 alkylsulfinyl-, Alkylsulfonyl-, Halogenalkylsulfonyl-, Alkylcarbonyl, Alkoxycarbonyl-, Halogenalkoxycarbonyl, Alkylamino, Dialkylamino-, Alkylcarbonylamino-, N-Alkylcarbonyl-N-alkylamino, Alkoxyalkyl-, Alkoxyalkoxy, Alkylthioalkyl-, Dialkylaminoalkyl- und Alkoxycarbonylalkyl-Teile können geradkettig oder verzweigt  
 25 sein. Sofern nicht anders angegeben tragen halogenierte Substituenten vorzugsweise ein bis fünf gleiche oder verschiedene Halogenatome. Die Bedeutung Halogen steht jeweils für Fluor, Chlor, Brom oder Iod.

30 Ferner bedeuten beispielsweise:

- C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl sowie die Alkylteile von 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>-C<sub>4</sub>-alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkylsulfonyl-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkylcarbonyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkylcarbonylamino, N-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkylcarbonyl-N-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alkylamino, N-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxycarbonyl-N-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alkylamino, Amino-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkylamino-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alkyl, Di(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alkyl)amino-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alkyl, Carboxy-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxycarbonyl-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alkyl, Aminocarbonyl-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkylaminocarbonyl-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alkyl, Di(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alkyl)aminocarbonyl-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alkyl und Phenyl-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alkyl: z.B. Methyl, Ethyl, Propyl, 1-Methylethyl, Butyl, 1-Methylpropyl, 2-Methylpropyl und 1,1-Dimethylethyl;
- C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkyl: C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl, wie voranstehend genannt, sowie die Alkylteile von 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, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkylsulfonyl-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkylcarbonyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkylcarbonylamino, N-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkylcarbonyl-

## 5

- N-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkylamino, N-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkoxy-carbonyl-N-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkylamino, Amino-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkylamino-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkyl, Di(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkyl)amino-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkyl, Carboxy-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkoxy-carbonyl-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkyl, Aminocarbonyl-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkylaminocarbonyl-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkyl, Di(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkyl)aminocarbonyl-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkyl und Phenyl-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkyl, sowie z.B. Pentyl, 1-Methylbutyl, 2-Methylbutyl, 3-Methylbutyl, 2,2-Dimethylpropyl, 1-Ethylpropyl, Hexyl, 1,1-Dimethylpropyl, 1,2-Dimethylpropyl, 1-Methylpentyl, 2-Methylpentyl, 3-Methylpentyl, 4-Methylpentyl, 1,1-Dimethylbutyl, 1,2-Dimethylbutyl, 1,3-Dimethylbutyl, 2,2-Dimethylbutyl, 2,3-Dimethylbutyl, 3,3-Dimethylbutyl, 1-Ethylbutyl, 2-Ethylbutyl, 1,1,2-Trimethylpropyl, 1-Ethyl-1-methylpropyl und 1-Ethyl-3-methylpropyl;
- 15 - C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-Alkyl: C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkyl, wie voranstehend genannt, sowie die Alkylteile von 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, C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-Alkylsulfonyl-C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-Alkyl-carbonyl, C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-Alkylcarbonylamino, N-C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-Alkylcarbonyl-N-C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-alkylamino, N-C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-Alkoxy-carbonyl-N-C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-alkylamino, Amino-C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-Alkylamino-C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-alkyl, Di(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-alkyl)amino-C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-alkyl, Carboxy-C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-Alkoxy-carbonyl-C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-alkyl, Aminocarbonyl-C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-Alkylaminocarbonyl-C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-alkyl, Di(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-alkyl)aminocarbonyl-C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-alkyl und Phenyl-C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-alkyl, sowie z.B. Heptyl, 2-Methylhexyl, 3-Methylhexyl, 2,2-Dimethylpentyl, 2,3-Dimethylpentyl, 2,4-Dimethylpentyl, 3,3-Dimethylpentyl, 2,2,3-Trimethylbutyl, Octyl, 2-Methylheptyl, 3-Methylheptyl, 4-Methylheptyl, 2,2-Dimethylhexyl, 2,3-Dimethylhexyl, 2,4-Dimethylhexyl, 3,3-Dimethylhexyl, 2,2,3-Trimethylpentyl, 2,3,3-Trimethylpentyl, 2,3,4-Trimethylpentyl und 2,2,3,3-Tetramethylbutyl;
- 35 - C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-Cycloalkyl: Cyclopropyl, Cyclobutyl, Cyclopentyl und Cyclohexyl;
- C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenycycloalkyl: C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-Cycloalkyl, wie voranstehend genannt, der partiell oder vollständig durch Fluor, Chlor, Brom und/oder Jod substituiert ist, also z. B. 2,2-Difluor-cyclopropyl, 2,2-Dichlorcyclopropyl, 3-Fluorcyclopentyl, 3-Chlorcyclopentyl, 3,3-Difluorcyclopentyl, 3,3-Dichlorcyclopentyl, 4-Fluorcyclohexyl, 4-Chlorcyclohexyl, 4,4-Difluorcyclohexyl und 4,4-Dichlorcyclohexyl;
- 45 - drei- bis sechsgliedriges Heterocycl: monocyclischer, gesättigter oder partiell ungesättigter Kohlenwasserstoff mit drei bis sechs Ringgliedern wie voranstehend genannt, welche

## 6

neben Kohlenstoffatomen ein bis vier Stickstoffatome, oder ein bis drei Stickstoffatome und ein Sauerstoff- oder Schwefelatom, oder ein Sauerstoff- und/oder ein Schwefelatom oder 2 Sauerstoff- oder 2 Schwefelatome enthalten können und welche über ein C-Atom oder ein N-Atom verknüpft sein können, z.B.

3- bis 4-gliedriges Heterocyclyl:

2-Oxrianyl, 2-Oxetanyl, 3-Oxetanyl, 2-Aziridinyl, 3-Thiethanyl, 1-Azetinyl, 2-Azetinyl;

10

5-gliedriges gesättigtes Hererocyclyl, verknüpft über ein C-Atom:

2-Tetrahydrofuran-2-yl, 3-Tetrahydrofuran-2-yl, 1,3-Dioxolan-2-yl, 1,3-Dioxolan-5-yl, 2-Tetrahydrothienyl, 3-Tetrahydrothienyl, 1,3-Dithiolan-2-yl, 1,3-Dithiolan-5-yl, 1,2-Dithiolan-3-yl, 1,2-Dithiolan-4-yl, 2-Pyrrolidinyl, 3-Pyrrolidinyl, 3-Isoxazolidinyl, 4-Isoxazolidinyl, 5-Isoxazolidinyl, 3-Isothiazolidinyl, 4-Isothiazolidinyl, 5-Isothiazolidinyl,

15

3-Pyrazolidinyl, 4-Pyrazolidinyl, 5-Pyrazolidinyl, 2-Oxazolidinyl, 4-Oxazolidinyl, 5-Oxazolidinyl, 2-Thiazolidinyl, 4-Thiazolidinyl, 5-Thiazolidinyl, 2-Imidazolidinyl, 4-Imidazolidinyl, 1,2,4-Oxadiazolidin-3-yl, 1,2,4-Oxadiazolidin-5-yl, 1,2,4-Thiadiazolidin-3-yl, 1,2,4-Thiadiazolidin-5-yl, 1,2,4-Triazololidin-3-yl, 1,3,4-Oxadiazolidin-2-yl, 1,3,4-Thiadiazolidin-2-yl, 1,3,4-Triazololidin-2-yl;

20

25

5-gliedriges gesättigtes Hererocyclyl, verknüpft über ein N-Atom:

1-Pyrrolidinyl, 2-Isothiazolidinyl, 2-Isothiazolidinyl, 1-Pyrazolidinyl, 3-Oxazolidinyl, 3-Thiazolidinyl, 1-Imidazolidinyl, 1,2,4-Triazololidin-1-yl, 1,2,4-Oxadiazolidin-2-yl, 1,2,4-Oxadiazolidin-4-yl, 1,2,4-Thiadiazolidin-2-yl, 1,2,4-Thiadiazolidin-4-yl;

35

5-gliedriges partiell ungesättigtes Hererocyclyl; verknüpft über ein C-Atom:

2,3-Dihydrofuran-2-yl, 2,3-Dihydrofuran-3-yl, 2,3-Dihydrofuran-4-yl, 2,4-Dihydrofuran-2-yl, 2,4-Dihydrofuran-3-yl,

40

2,3-Dihydrothien-2-yl, 2,3-Dihydrothien-3-yl, 2,4-Dihydrothien-2-yl, 2,4-Dihydrothien-3-yl, 4,5-Dihidropyrrol-2-yl, 4,5-Dihidropyrrol-3-yl, 2,5-Dihidropyrrol-2-yl, 2,5-Dihidropyrrol-3-yl, 4,5-Dihydroisoxazol-3-yl, 2,5-Dihydroisoxazol-3-yl, 2,3-Dihydroisoxazol-3-yl, 4,5-Dihydroisoxazol-4-yl,

45

2,5-Dihydroisoxazol-4-yl, 2,3-Dihydroisoxazol-4-yl, 4,5-Dihydroisoxazol-5-yl, 2,5-Dihydroisoxazol-5-yl, 2,3-Dihydroisoxazol-5-yl, 4,5-Dihydroisothiazol-3-yl, 2,5-Dihydroisothia-

## 7

- zol-3-yl, 2,3-Dihydroisothiazol-3-yl, 4,5-Dihydroisothiazol-4-yl, 2,5-Dihydroisothiazol-4-yl, 2,3-Dihydroisothiazol-4-yl, 4,5-Dihydroisothiazol-5-yl, 2,5-Dihydroisothiazol-5-yl, 2,3-Dihydroisothiazol-5-yl, 2,3-Dihydro-  
5 pyrazol-3-yl, 2,3-Dihydropyrazol-4-yl, 2,3-Dihydropyrazol-5-yl, 3,4-Dihydropyrazol-3-yl, 3,4-Dihydropyrazol-4-yl, 3,4-Dihydropyrazol-5-yl, 4,5-Dihydropyrazol-3-yl, 4,5-Dihydropyrazol-4-yl, 4,5-Dihydropyrazol-5-yl, 2,3-Dihydroimidazol-2-yl, 2,3-Dihydroimida-  
10 zol-4-yl, 2,3-Dihydroimidazol-5-yl, 4,5-Dihydroimidazol-2-yl, 4,5-Dihydroimidazol-4-yl, 4,5-Dihydroimidazol-5-yl, 2,5-Dihydroimidazol-2-yl, 2,5-Dihydroimidazol-4-yl, 2,5-Dihydroimida-  
zol-5-yl, 2,3-Dihydrooxazol-2-yl, 2,3-Dihydrooxazol-4-yl, 2,3-Dihydrooxazol-5-yl, 3,4-Dihydrooxazol-2-yl, 3,4-Dihydro-  
15 oxazol-4-yl, 3,4-Dihydrooxazol-5-yl, 2,3-Dihydrothiazol-2-yl, 2,3-Dihydrothiazol-4-yl, 2,3-Dihydrothiazol-5-yl, 3,4-Dihydrothiazol-2-yl, 3,4-Dihydrothiazol-4-yl, 3,4-Dihydrothia-  
zol-5-yl;
- 20 5-gliedriges partiell ungesättigtes Heterocyclyl verknüpft über ein N-Atom:  
4,5-Dihydropyrrol-1-yl, 2,5-Dihydropyrrol-1-yl, 4,5-Dihydroisoxazol-2-yl, 2,3-Dihydroisoxazol-1-yl, 4,5-Dihydroisothiazol-1-yl, 2,3-Dihydroisothiazol-1-yl, 2,3-Dihydro-  
25 pyrazol-1-yl, 2,3-Dihydropyrazol-2-yl, 4,5-Dihydropyrazol-1-yl, 3,4-Dihydropyrazol-1-yl, 2,3-Dihydroimidazol-1-yl, 2,3-Dihydroimidazol-3-yl, 4,5-Dihydroimidazol-1-yl, 2,5-Dihydroimidazol-1-yl, 2,3-Dihydrooxazol-3-yl, 3,4-Dihydrooxazol-3-yl, 2,3-Dihydrothiazol-3-yl, 3,4-Dihydrothiazol-3-yl;  
30 thiazol-3-yl;
- 6-gliedriges gesättigtes Heterocyclyl verknüpft über ein C-Atom:  
2-Piperidinyl, 3-Piperidinyl, 4-Piperidinyl, 1,3-Dioxan-5-yl, 1,3-Dithian-5-yl, 2-Tetrahydropyranyl, 4-Tetrahydropyranyl, 2-Tetrahydrothiopyranyl, 4-Tetrahydrothiopyranyl, 3-Hexahydropyridazinyl, 4-Hexahydropyridazinyl, 2-Hexahydropyrimidinyl, 4-Hexahydropyrimidinyl, 5-Hexahydropyrimidinyl, 2-Piperazinyl, 1,3,5-Hexahydrotriazin-2-yl, 1,2,4-Hexahydrotriazin-3-yl, Tetrahydro-1,3-oxazin-2-yl, Tetrahydro-1,3-oxazin-6-yl, 2-Morpholinyl, 3-Morpholinyl;  
40 zol-3-yl;
- 6-gliedriges gesättigtes Heterocyclyl verknüpft über ein N-Atom:  
45



## 8

1-Piperidinyl, 1-Hexahydropyridazinyl, 1-Hexahydropyrimidinyl, 1-Piperazinyl, 1,3,5-Hexahydrotriazin-1-yl, 1,2,4-Hexahydrotriazin-1-yl, Tetrahydro-1,3-oxazin-1-yl, 1-Morpholinyl;

- 5 6-gliedriges partiell ungesättigtes Heterocyclylverknüpft über ein C-Atom:  
 2H-Pyran-2-yl, 2H-Pyran-3-yl, 2H-Pyran-4-yl, 2H-Pyran-5-yl, 2H-Pyran-6-yl, 2H-Thiopyran-2-yl, 2H-Thiopyran-3-yl, 2H-Thiopyran-4-yl, 2H-Thiopyran-5-yl, 2H-Thiopyran-6-yl, 5,6-Di-
- 10 hydro-4H-1,3-Oxazin-2-yl;
- C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-Alkenyl: z.B. Ethenyl, 1-Propenyl, 2-Propenyl, 1-Methylethenyl, 1-Butenyl, 2-Butenyl, 3-Butenyl, 1-Methyl-1-propenyl, 2-Methyl-1-propenyl,
- 15 1-Methyl-2-propenyl, 2-Methyl-2-propenyl, 1-Pentenyl, 2-Pentenyl, 3-Pentenyl, 4-Pentenyl, 1-Methyl-1-butenyl, 2-Methyl-1-butenyl, 3-Methyl-1-butenyl, 1-Methyl-2-butenyl, 2-Methyl-2-butenyl, 3-Methyl-2-butenyl, 1-Methyl-3-butenyl, 2-Methyl-3-butenyl, 3-Methyl-3-butenyl,
- 20 1,1-Dimethyl-2-propenyl, 1,2-Dimethyl-1-propenyl, 1,2-Dimethyl-2-propenyl, 1-Ethyl-1propenyl, 1-Ethyl-2-propenyl, 1-Hexenyl, 2-Hexenyl, 3-Hexenyl, 4-Hexenyl, 5-Hexenyl, 1-Methyl-1-pentenyl, 2-Methyl-1-pentenyl, 3-Methyl-1-pentenyl,
- 25 4-Methyl-1-pentenyl, 1-Methyl-2-pentenyl, 2-Methyl-2-pentenyl, 3-Methyl-2-pentenyl, 4-Methyl-2-pentenyl, 1-Methyl-3-pentenyl, 2-Methyl-3-pentenyl, 3-Methyl-3-pentenyl, 4-Methyl-3-pentenyl, 1-Methyl-4-pentenyl, 2-Methyl-4-pentenyl,
- 30 3-Methyl-4-pentenyl, 4-Methyl-4-pentenyl, 1,1-Dimethyl-2-butenyl, 1,1-Dimethyl-3-butenyl, 1,2-Dimethyl-1-butenyl, 1,2-Dimethyl-2-butenyl, 1,2-Dimethyl-3-butenyl, 1,3-Dimethyl-1-butenyl, 1,3-Dimethyl-2-butenyl, 1,3-Dimethyl-3-butenyl,
- 35 2,2-Dimethyl-3-butenyl, 2,3-Dimethyl-1-butenyl, 2,3-Dimethyl-2-butenyl, 2,3-Dimethyl-3-butenyl, 3,3-Dimethyl-1-butenyl, 3,3-Dimethyl-2-butenyl, 1-Ethyl-1-butenyl, 1-Ethyl-2-butenyl, 1-Ethyl-3-butenyl, 2-Ethyl-1-butenyl, 2-Ethyl-2-butenyl, 2-Ethyl-3-butenyl,
- 40 1,1,2-Trimethyl-2-propenyl, 1-Ethyl-1-methyl-2-propenyl, 1-Ethyl-2-methyl-1-propenyl und 1-Ethyl-2-methyl-2-propenyl;
- C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>-Alkenyl: C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-Alkenyl wie voranstehend genannt, sowie z.B. 1-Heptenyl, 2-Heptenyl, 3-Heptenyl, 2-Methyl-1-hexenyl,
- 45 2-Methyl-2-hexenyl, 2-Methyl-3-hexenyl, 2-Methyl-4-hexenyl, 2-Methyl-5-hexenyl, 3-Methyl-1-hexenyl, 3-Methyl-2-hexenyl, 3-Methyl-3-hexenyl, 3-Methyl-4-hexenyl, 3-Methyl-5-hexenyl,

## 9

- 2,2-Dimethyl-3-pentenyl, 2,2-Dimethyl-4-pentenyl,  
 2,3-Dimethyl-1-pentenyl, 2,3-Dimethyl-2-pentenyl,  
 2,3-Dimethyl-3-pentenyl, 2,3-Dimethyl-4-pentenyl,  
 2,4-Dimethyl-1-pentenyl, 2,4-Dimethyl-2-pentenyl,  
 5 3,3-Dimethyl-1-pentenyl, 2,2-Dimethyl-3-methyl-3-butentyl,  
 1-Octenyl, 2-Octenyl, 3-Octenyl, 4-Octenyl,  
 2-Methyl-1-heptenyl, 2-Methyl-2-heptenyl,  
 2-Methyl-3-heptenyl, 2-Methyl-4-heptenyl,  
 2-Methyl-5-heptenyl, 2-Methyl-6-heptenyl,  
 10 3-Methyl-1-heptenyl, 3-Methyl-2-heptenyl,  
 3-Methyl-3-heptenyl, 3-Methyl-4-heptenyl,  
 3-Methyl-5-heptenyl, 3-Methyl-6-heptenyl,  
 4-Methyl-1-heptenyl, 4-Methyl-2-heptenyl,  
 4-Methyl-3-heptenyl, 2,2-Dimethyl-3-hexenyl,  
 15 2,2-Dimethyl-4-hexenyl, 2,2-Dimethyl-5-hexenyl,  
 2,3-Dimethyl-1-hexenyl, 2,3-Dimethyl-2-hexenyl,  
 2,3-Dimethyl-3-hexenyl, 2,3-Dimethyl-4-hexenyl,  
 2,3-Dimethyl-5-hexenyl, 2,4-Dimethyl-1-hexenyl,  
 2,4-Dimethyl-2-hexenyl, 2,4-Dimethyl-3-hexenyl,  
 20 2,4-Dimethyl-4-hexenyl, 2,4-Dimethyl-5-hexenyl,  
 3,3-Dimethyl-1-hexenyl, 3,3-Dimethyl-4-hexenyl,  
 3,3-Dimethyl-5-hexenyl, 2,2-Trimethyl-3-pentenyl, 2,2,3-Tri-  
 methyl-4-pentenyl, 2,3,3-Trimethyl-1-pentenyl, 2,3,3-Trime-  
 thyl-4-pentenyl, 2,3,4-Trimethyl-1-pentenyl und 2,3,4-Tri-  
 25 methyl-2-pentenyl;
- C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-Alkynyl: z.B. Ethinyl, 1-Propinyl, 2-Propinyl,  
 1-Butinyl, 2-Butinyl, 3-Butinyl, 1-Methyl-2-propinyl,  
 1-Pentinyl, 2-Pentinyl, 3-Pentinyl, 4-Pentinyl,  
 30 1-Methyl-2-butinyl, 1-Methyl-3-butinyl, 2-Methyl-3-butinyl,  
 3-Methyl-1-butinyl, 1,1-Dimethyl-2-propinyl,  
 1-Ethyl-2-propinyl, 1-Hexinyl, 2-Hexinyl, 3-Hexinyl,  
 4-Hexinyl, 5-Hexinyl, 1-Methyl-2-pentinyl,  
 1-Methyl-3-pentinyl, 1-Methyl-4-pentinyl,  
 35 2-Methyl-3-pentinyl, 2-Methyl-4-pentinyl,  
 3-Methyl-1-pentinyl, 3-Methyl-4-pentinyl,  
 4-Methyl-1-pentinyl, 4-Methyl-2-pentinyl,  
 1,1-Dimethyl-2-butinyl, 1,1-Dimethyl-3-butinyl,  
 1,2-Dimethyl-3-butinyl, 2,2-Dimethyl-3-butinyl,  
 40 3,3-Dimethyl-1-butinyl, 1-Ethyl-2-butinyl, 1-Ethyl-3-butinyl,  
 2-Ethyl-3-butinyl und 1-Ethyl-1-methyl-2-propinyl;
- C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>-Alkynyl: C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-Alkynyl wie voranstehend genannt, sowie  
 z.B. 1-Heptinyl, 2-Heptinyl, 3-Heptinyl, 2-Methyl-3-hexinyl,  
 45 2-Methyl-4-hexinyl, 2-Methyl-5-hexinyl, 3-Methyl-1-hexinyl,  
 3-Methyl-4-hexinyl, 3-Methyl-5-hexinyl,  
 2,2-Dimethyl-3-pentinyl, 2,2-Dimethyl-4-pentinyl,

## 10

- 2,3-Dimethyl-4-pentynyl, 3,3-Dimethyl-1-pentynyl, 1-Octynyl, 2-Octynyl, 3-Octynyl, 4-Octynyl, 2-Methyl-3-heptynyl, 2-Methyl-4-heptynyl, 2-Methyl-5-heptynyl, 2-Methyl-6-heptynyl, 3-Methyl-1-heptynyl, 3-Methyl-4-heptynyl, 5 3-Methyl-5-heptynyl, 3-Methyl-6-heptynyl, 4-Methyl-1-heptynyl, 4-Methyl-2-heptynyl, 2,2-Dimethyl-3-hexynyl, 2,2-Dimethyl-4-hexynyl, 2,2-Dimethyl-5-hexynyl, 2,3-Dimethyl-4-hexynyl, 2,3-Dimethyl-5-hexynyl, 2,4-Dimethyl-5-hexynyl, 3,3-Dimethyl-1-hexynyl, 10 3,3-Dimethyl-4-hexynyl, 3,3-Dimethyl-5-hexynyl, 2,2,3-Trimethyl-4-pentynyl und 2,3,3-Trimethyl-4-pentynyl;
- C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkyl: einen C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkylrest wie vorstehend genannt, der partiell oder vollständig durch Fluor, Chlor, Brom und/oder Iod substituiert ist, also z.B. Chlormethyl, 15 Dichlormethyl, Trichlormethyl, Fluormethyl, Difluormethyl, Trifluormethyl, Chlorfluormethyl, Dichlorfluormethyl, Chlor-difluormethyl, 2-Fluorethyl, 2-Chlorethyl, 2-Bromethyl, 2-Iodethyl, 2,2-Difluorethyl, 2,2,2-Trifluorethyl, 2-Chlor-20 2-fluorethyl, 2-Chlor-2,2-difluorethyl, 2,2-Dichlor-2-fluorethyl, 2,2,2-Trichlorethyl, Pentafluorethyl, 2-Fluorpropyl, 3-Fluorpropyl, 2,2-Difluorpropyl, 2,3-Difluorpropyl, 2-Chlorpropyl, 3-Chlorpropyl, 2,3-Dichlorpropyl, 2-Brompropyl, 3-Brompropyl, 3,3,3-Trifluorpropyl, 3,3,3-Trichlorpropyl, 25 2,2,3,3,3-Pentafluorpropyl, Heptafluorpropyl, 1-(Fluormethyl)-2-fluorethyl, 1-(Chlormethyl)-2-chlorethyl, 1-(Brommethyl)-2-bromethyl, 4-Fluorbutyl, 4-Chlorbutyl, 4-Brombutyl und Nonafluorbutyl;
- 30 - C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkyl: C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkyl wie voranstehend genannt, sowie z.B. 5-Fluorpentyl, 5-Chlorpentyl, 5-Brompentyl, 5-Iodpentyl, Undecafluorpentyl, 6-Fluorhexyl, 6-Chlorhexyl, 6-Bromhexyl, 6-Iodhexyl und Dodecafluorhexyl;
- 35 - C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-Halogenalkyl: C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkyl wie voranstehend genannt, sowie z.B. 7-Fluorheptyl, 7-Chlorheptyl, 7-Bromheptyl, 7-Iodheptyl, Perfluorheptyl, 8-Fluoroctyl, 8-Chloroctyl, 8-Bromoctyl, 8-Iodoctyl und Octadecafluoroctyl;
- 40 - C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkenyl: ein C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-Alkenylrest wie voranstehend genannt, der partiell oder vollständig durch Fluor, Chlor, Brom und/oder Iod substituiert ist, z.B. 2-Chlorvinyl, 2-Chlorallyl, 3-Chlorallyl, 2,3-Dichlorallyl, 3,3-Dichlorallyl, 2,3,3-Trichlorallyl, 2,3-Dichlor-2-butenyl, 2-Bromvinyl, 2-Bromallyl, 3-Bromallyl, 2,3-Dibromallyl, 3,3-Dibromallyl, 45 2,3,3-Tribromallyl und 2,3-Dibrom-2-butenyl;

## 11

- C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>-Halogenalkenyl: ein C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkenylrest wie voranstehend genannt, sowie z.B. 2-Chlor-1-heptenyl, 3-Chlor-1-heptenyl, 2,3-Dichlor-1-heptenyl, 3,3-Dichlor-1-heptenyl, 2,3,3-Trichlor-1-heptenyl,  
5 2-Brom-1-heptenyl, 3-Brom-1-heptenyl, 2,3-Dibrom-1-heptenyl, 3,3-Dibrom-1-heptenyl, 2,3,3-Tribrom-1-heptenyl, 2-Chlor-1-octenyl, 3-Chlor-1-octenyl, 2,3-Dichlor-1-octenyl, 3,3-Dichlor-1-octenyl, 2,3,3-Trichlor-1-octenyl, 2-Brom-1-octenyl, 3-Brom-1-octenyl, 2,3-Dibrom-1-octenyl,  
10 3,3-Dibrom-1-octenyl und 2,3,3-Tribrom-1-octenyl;
  
- C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkinyl: ein C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-Alkinylrest, wie voranstehend genannt, der partiell oder vollständig durch Fluor, Chlor, Brom und/oder Iod substituiert ist, z.B. 1,1-Difluorprop-2-in-1-yl, 3-Iod-prop-2-in-1-yl, 4-Fluorbut-2-in-1-yl, 4-Chlorbut-2-in-1-yl, 1,1-Difluorbut-2-in-1-yl, 4-Iodbut-3-in-1-yl, 5-Fluorpent-3-in-1-yl, 5-Iodpent-4-in-1-yl, 6-Fluorhex-4-in-1-yl und 6-Iodhex-5-in-1-yl;
  
- 20 - C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>-Halogenalkinyl: ein C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkinylrest wie voranstehend genannt, sowie z.B. 7-Fluorhept-5-in-1-yl, 7-Iodhept-6-in-1-yl, 8-Fluoroct-6-in-1-yl und 8-Iodoct-7-in-1-yl;
  
- C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Cyanoalkyl: z.B. Cyanomethyl, 1-Cyanoethyl, 1-Cyanopropyl, 2-Cyanopropyl, 3-Cyanopropyl, 1-Cyanoprop-2-yl, 2-Cyanoprop-2-yl, 1-Cyanobutyl, 2-Cyanobutyl, 3-Cyanobutyl, 4-Cyanobutyl, 1-Cyanobutyl-2-yl, 2-Cyanobut-2-yl, 1-Cyanobut-3-yl, 2-Cyanobut-3-yl, 1-Cyano-2-methyl-prop-3-yl, 2-Cyano-2-methyl-prop-3-yl, 3-Cyano-2-methyl-prop-3-yl oder  
25 2-Cyanomethyl-prop-2-yl;  
30
  
- C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Cyanoalkyl: C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Cyanoalkyl wie voranstehend genannt sowie z.B. 5-Cyanopentyl oder 6-Cyanohexyl;
  
- 35 - C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-Cyanoalkyl: C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Cyanoalkyl wie voranstehend genannt sowie z.B. 7-Cyanoheptyl oder 8-Cyanooctyl;
  
- C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-Cyanoalkenyl: ein C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-Alkenylrest, wie vorstehend genannt, der durch Cyano substituiert ist, z.B. 2-Cyanovinyl, 2-Cyanoallyl, 3-Cyanoallyl, 2-Cyanobut-2-enyl oder 3-Cyanobut-2-enyl;  
40
  
- C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>-Cyanoalkenyl: ein C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-Cyanoalkenylrest wie vorstehend genannt, sowie z.B. 2-Cyano-1-heptenyl, 3-Cyano-1-heptenyl, 2-Cyano-1-octenyl oder 3-Cyano-1-octenyl;  
45

## 12

- C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy: sowie die Alkoxyteile von 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>-Alkoxy-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy-carbonyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy-carbonyl-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy-carbonylamino, N-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy-carbonyl-N-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alkylamino, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy-carbonyl(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alkoxy und Phenyl-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alkoxy, z.B. Methoxy, Ethoxy, Propoxy, 1-Methylethoxy, Butoxy, 1-Methylpropoxy, 2-Methylpropoxy und 1,1-Dimethylethoxy;  
5
  
- C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkoxy: C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy wie voranstehend genannt, sowie die Alkoxyteile von 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>-Alkoxy-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkoxy-carbonyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkoxy-carbonyl-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkyl C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkoxy-carbonylamino, N-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkoxy-carbonyl-N-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkylamino, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkoxy-carbonyl(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)alkoxy und Phenyl-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkoxy, z.B. Pentoxy, 1-Methylbutoxy, 2-Methylbutoxy, 3-Methoxylbutoxy, 1,1-Dimethylpropoxy, 1,2-Dimethylpropoxy, 2,2-Dimethylpropoxy, 1-Ethylpropoxy, Hexoxy, 1-Methylpentoxy, 2-Methylpentoxy, 3-Methylpentoxy, 4-Methylpentoxy, 1,1-Dimethylbutoxy, 1,2-Dimethylbutoxy, 1,3-Dimethylbutoxy, 2,2-Dimethylbutoxy, 2,3-Dimethylbutoxy, 3,3-Dimethylbutoxy, 1-Ethylbutoxy, 2-Ethylbutoxy, 1,1,2-Trimethylpropoxy, 1,2,2-Trimethylpropoxy, 1-Ethyl-1-methylpropoxy und 1-Ethyl-2-methylpropoxy;  
10  
15  
20
  
- C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-Alkoxy: C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkoxy wie voranstehend genannt, sowie die Alkoxyteile von 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>-Alkoxy-C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-alkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-Alkoxy-carbonyl, C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-Alkoxy-carbonyl-C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-Alkoxy-carbonylamino, N-C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-Alkoxy-carbonyl-N-C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-alkylamino und Phenyl-C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-alkoxy, z.B. Heptoxy, 2-Methylhexoxy, 3-Methylhexoxy, 2,2-Dimethylpentoxy, 2,3-Dimethylpentoxy, 2,4-Dimethylpentoxy, 3,3-Dimethylpentoxy, 2,2-Dimethyl-3-methylbutoxy, Octoxy, 2-Methylheptoxy, 3-Methylheptoxy, 4-Methylheptoxy, 2,2-Dimethylhexoxy, 2,3-Dimethylhexoxy, 2,4-Dimethylhexoxy, 3,3-Dimethylhexoxy, 2,2-Dimethyl-3-methylpentoxy, 2-Methyl-3,3-dimethylpentoxy, 2,3,4-Trimethylpentoxy und 2,2,3,3-Tetramethylbutoxy;  
25  
30  
35
  
- C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkoxy: einen C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxyrest wie voranstehend genannt, der partiell oder vollständig durch Fluor, Chlor, Brom und/oder Iod substituiert ist, also z.B. Fluormethoxy, Difluormethoxy, Trifluormethoxy, Chlordifluormethoxy, Bromdifluormethoxy, 2-Fluorethoxy, 2-Chlorethoxy, 2-Brommethoxy, 2-Iodethoxy, 2,2-Difluorethoxy, 2,2,2-Trifluorethoxy, 2-Chlor-2-fluorethoxy, 2-Chlor-2,2-difluorethoxy, 2,2-Dichlor-2-fluorethoxy, 2,2,2-Trichlorethoxy, Pentafluorethoxy, 2-Fluorpropoxy, 3-Fluorpropoxy, 2-Chlorpropoxy, 3-Chlorpropoxy, 2-Brompropoxy, 3-Brompropoxy, 2,2-Difluorpropoxy, 2,3-Difluorpropoxy, 2,3-Dichlorpropoxy, 3,3,3-Tri-
  
- 40  
45

## 13

- fluorpropoxy, 3,3,3-Trichlorpropoxy, 2,2,3,3,3-Pentafluorpropoxy, Heptafluorpropoxy, 1-(Fluormethyl)-2-fluorethoxy, 1-(Chlormethyl)-2-chlorethoxy, 1-(Brommethyl)-2-bromethoxy, 4-Fluorbutoxy, 4-Chlorbutoxy, 4-Brombutoxy und Nonafluorbutoxy;
- 5
- C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkoxy: C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkoxy wie voranstehend genannt, sowie z.B. 5-Fluorpentoxy, 5-Chlorpentoxy, 5-Brompentoxy, 5-Iodpentoxy, Undecafluorpentoxy, 6-Fluorhexoxy, 6-Chlorhexoxy, 6-Bromhexoxy, 6-Iodhexoxy und Dodecafluorhexoxy;

10

  - C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-Halogenalkoxy: C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkoxy wie voranstehend genannt, sowie z.B. 7-Fluorheptoxy, 7-Chlorheptoxy, 7-Bromheptoxy, 7-Iodheptoxy, Perfluorheptoxy, 8-Fluoroctoxy, 8-Chloroctoxy, 8-Bromoctoxy, 8-Iodoctoxy und Octadecafluoroctoxy;

15

  - C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkylamino sowie die Alkylamino-Teile von C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkylamino-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkyl, N-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkylcarbonyl-N-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkylamino, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkylaminocarbonyl und C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkylaminocarbonyl-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkyl, z.B. Methylamino, Ethylamino, Propylamino, 1-Methylethylamino, Butylamino, 1-Methylpropylamino, 2-Methylpropylamino, 1,1-Dimethylethylamino, Pentylamino, 1-Methylbutylamino, 2-Methylbutylamino, 3-Methylbutylamino, 2,2-Dimethylpropylamino, 1-Ethylpropylamino, Hexylamino, 1,1-Dimethylpropylamino, 1,2-Dimethylpropylamino, 1-Methylpentylamino, 2-Methylpentylamino, 3-Methylpentylamino, 4-Methylpentylamino, 1,1-Dimethylbutylamino, 1,2-Dimethylbutylamino, 1,3-Dimethylbutylamino, 2,2-Dimethylbutylamino, 2,3-Dimethylbutylamino, 3,3-Dimethylbutylamino, 1-Ethylbutylamino, 2-Ethylbutylamino, 1,1,2-Trimethylpropylamino, 1,2,2-Trimethylpropylamino, 1-Ethyl-1-methylpropylamino oder 1-Ethyl-2-methylpropylamino;

20

25

30

  - C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-Alkylamino: C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkylamino wie voranstehend genannt, sowie die Alkylamino-Teile von C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-Alkylamino-C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-alkyl, N-C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-Alkylcarbonyl-N-C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-alkylamino, N-C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-Alkoxy-carbonyl-N-C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-alkylamino, C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-Alkylaminocarbonyl und C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-Alkylaminocarbonyl-C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-alkyl: z.B. Heptylamino, 2-Methylhexylamino, 3-Methylhexylamino, 2,2-Dimethylpentylamino, 2,3-Dimethylpentylamino, 2,4-Dimethylpentylamino, 3,3-Dimethylpentylamino, 2,2-Dimethyl-3-methylbutylamino, Octylamino, 2-Methylheptylamino, 3-Methylheptylamino, 4-Methylheptylamino, 2,2-Dimethylhexylamino, 2,3-Dimethylhexylamino, 2,4-Dimethylhexylamino, 3,3-Dimethylhexylamino, 2,2-Dimethyl-3-methyl-

35

40

45

## 14

pentylamino, 2-Methyl-3,3-dimethylpentylamino, 2,3,4-Trimethylpentylamino und 2,2,3,3-Tetramethylbutylamino;

- Di(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alkyl)amino sowie die Dialkylamino-Teile von
- 5 Di(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alkyl)amino-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alkyl, Di(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alkyl)aminocarbonyl und Di(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alkyl)aminocarbonyl-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alkyl, z.B. N,N-Dimethylamino, N,N-Diethylamino, N,N-Dipropylamino, N,N-Di(1-methylethyl)amino, N,N-Dibutylamino, N,N-Di(1-methylpropyl)amino, N,N-Di(2-methylpropyl)amino,
- 10 N,N-Di(1,1-dimethylethyl)amino, N-Ethyl-N-methylamino, N-Methyl-N-propylamino, N-Methyl-N-(1-methylethyl)amino, N-Butyl-N-methylamino, N-Methyl-N-(1-methylpropyl)amino, N-Methyl-N-(2-methylpropyl)amino, N-(1,1-Dimethylethyl)-N-methylamino, N-Ethyl-N-propylamino,
- 15 N-Ethyl-N-(1-methylethyl)amino, N-Butyl-N-ethylamino, N-Ethyl-N-(1-methylpropyl)amino, N-Ethyl-N-(2-methylpropyl)amino, N-Ethyl-N-(1,1-dimethylethyl)amino, N-(1-Methylethyl)-N-propylamino, N-Butyl-N-propylamino, N-(1-Methylpropyl)-N-propylamino, N-(2-Methylpropyl)-N-propylamino, N-(1,1-Dimethylethyl)-N-propylamino, N-Butyl-N-(1-methylethyl)amino, N-(1-Methylethyl)-N-(1-methylpropyl)amino, N-(1-Methylethyl)-N-(2-methylpropyl)amino, N-(1,1-Dimethylethyl)-N-(1-methylethyl)amino, N-Butyl-N-(1-methylpropyl)amino, N-Butyl-N-(2-methylpropyl)amino,
- 20 N-Butyl-N-(1,1-dimethylethyl)amino, N-(1-Methylpropyl)-N-(2-methylpropyl)amino, N-(1,1-Dimethylethyl)-N-(1-methylpropyl)amino und N-(1,1-Dimethylethyl)-N-(2-methylpropyl)amino;
- 30 - Di(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkyl)amino: Di(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alkyl)amino wie voranstehend genannt, sowie die Dialkylamino-Teile von Di(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkyl)amino-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkyl, Di(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkyl)aminocarbonyl und Di(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkyl)aminocarbonyl-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkyl: z.B. N,N-Dipentylamino, N,N-Dihexylamino, N-Methyl-N-pentylamino, N-Ethyl-N-pentylamino, N-Methyl-N-hexylamino und N-Ethyl-N-hexylamino;
- 35 - Di(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-alkyl)amino: Di(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkyl)amino wie voranstehend genannt, sowie die Dialkylamino-Teile von Di(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-alkyl)amino-C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-alkyl, Di(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-alkyl)aminocarbonyl und
- 40 Di(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-alkyl)aminocarbonyl-C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-alkyl: z.B. N,N-Diheptylamino, N,N-Dioctylamino, N-Methyl-N-heptylamino, N-Ethyl-N-heptylamino, N-Methyl-N-octylamino und N-Ethyl-N-octylamino;

## 15

- C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkylthio sowie die Alkylthio-Teile von C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkylthio-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alkyl, z.B. Methylthio, Ethylthio, Propylthio, 1-Methylethylthio, Butylthio, 1-Methylpropylthio, 2-Methylpropylthio und 1,1-Dimethylethylthio;  
5
- C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkylthio: C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkylthio wie voranstehend genannt, sowie die Alkylthio-Teile von C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkylthio-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkyl, sowie z.B. Pentylthio, 1-Methylbutylthio, 2-Methylbutylthio, 3-Methylbutylthio, 2,2-Dimethylpropylthio, 1-Ethylpropylthio,  
10 Hexylthio, 1,1-Dimethylpropylthio, 1,2-Dimethylpropylthio, 1-Methylpentylthio, 2-Methylpentylthio, 3-Methylpentylthio, 4-Methylpentylthio, 1,1-Dimethylbutylthio, 1,2-Dimethylbutylthio, 1,3-Dimethylbutylthio, 2,2-Dimethylbutylthio, 2,3-Dimethylbutylthio, 3,3-Dimethylbutylthio, 1-Ethylbutylthio, 2-Ethylbutylthio, 1,1,2-Trimethylpropylthio, 1,2,2-Trimethylpropylthio, 1-Ethyl-1-methylpropylthio und 1-Ethyl-2-methylpropylthio;  
15
- C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-Alkylthio: C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkylthio wie voranstehend genannt, sowie die Alkylthio-Teile von C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-Alkylthio-C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-alkyl, sowie z.B. Heptylthio, 2-Methylhexylthio, 3-Methylhexylthio, 2,2-Dimethylpentylthio, 2,3-Dimethylpentylthio, 2,4-Dimethylpentylthio, 3,3-Dimethylpentylthio, 2,2-Dimethyl-3-methylbutylthio, Octylthio, 2-Methylheptylthio, 3-Methylheptylthio  
25 4-Methylheptylthio, 2,2-Dimethylhexylthio, 2,3-Dimethylhexylthio, 2,4-Dimethylhexylthio, 3,3-Dimethylhexylthio, 2,2,3-Trimethylpentylthio, 2,3,3-Trimethylpentylthio, 2,3,4-Trimethylpentylthio und 2,2,3,3-Tetramethylbutylthio;
- 30 - C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkylthio: einen C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkylthioest wie voranstehend genannt, der partiell oder vollständig durch Fluor, Chlor, Brom und/oder Iod substituiert ist, also z.B. Fluormethylthio, Difluormethylthio, Trifluormethylthio, Chlor-difluormethylthio, Bromdifluormethylthio, 2-Fluorethylthio, 2-Chlorethylthio, 2-Bromethylthio, 2-Iodethylthio,  
35 2,2-Difluorethylthio, 2,2,2-Trifluorethylthio, 2,2,2-Trichlorethylthio, 2-Chlor-2-fluorethylthio, 2-Chlor-2,2-difluorethylthio, 2,2-Dichlor-2-fluorethylthio, Pentafluorethylthio, 2-Fluorpropylthio, 3-Fluorpropylthio, 2-Chlorpropylthio, 3-Chlorpropylthio, 2-Brompropylthio,  
40 3-Brompropylthio, 2,2-Difluorpropylthio, 2,3-Difluorpropylthio, 2,3-Dichlorpropylthio, 3,3,3-Trifluorpropylthio, 3,3,3-Trichlorpropylthio, 2,2,3,3,3-Pentafluorpropylthio, Heptafluorpropylthio, 1-(Fluormethyl)-2-fluorethylthio,  
45 1-(Chlormethyl)-2-chlorethylthio, 1-(Brommethyl)-2-brom-



## 16

ethylthio, 4-Fluorbutylthio, 4-Chlorbutylthio, 4-Brombutylthio und Nonafluorbutylthio;

- 5 - C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkylthio: C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkylthio wie voranstehend genannt, sowie z.B. 5-Fluorpentylthio, 5-Chlorpentylthio, 5-Brompentylthio, 5-Iodpentylthio, Undecafluorpentylthio, 6-Fluorhexylthio, 6-Chlorhexylthio, 6-Bromhexylthio, 6-Iodhexylthio und Dodecafluorhexylthio;
- 10 - C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-Halogenalkylthio: C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkylthio wie voranstehend genannt, sowie z.B. 7-Fluorheptylthio, 7-Chlorheptylthio, 7-Bromheptylthio, 7-Iodheptylthio, Perfluorheptylthio, 8-Fluoroctylthio, 8-Chloroctylthio, 8-Bromoctylthio, 8-Iodoctylthio und Octadecafluoroctylthio;
- 15 - C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkylsulfinyl (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkyl-S(=O)-): z.B. Methylsulfinyl, Ethylsulfinyl, Propylsulfinyl, 1-Methylethylsulfinyl, Butylsulfinyl, 1-Methylpropylsulfinyl, 2-Methylpropylsulfinyl, 1,1-Dimethylethylsulfinyl, Pentylsulfinyl, 1-Methylbutylsulfinyl, 2-Methylbutylsulfinyl, 3-Methylbutylsulfinyl, 2,2-Dimethylpropylsulfinyl, 1-Ethylpropylsulfinyl, 1,1-Dimethylpropylsulfinyl, 1,2-Dimethylpropylsulfinyl, Hexylsulfinyl, 1-Methylpentylsulfinyl, 2-Methylpentylsulfinyl, 3-Methylpentylsulfinyl, 4-Methylpentylsulfinyl, 1,1-Dimethylbutylsulfinyl, 1,2-Dimethylbutylsulfinyl, 1,3-Dimethylbutylsulfinyl, 2,2-Dimethylbutylsulfinyl, 2,3-Dimethylbutylsulfinyl, 3,3-Dimethylbutylsulfinyl, 1-Ethylbutylsulfinyl, 2-Ethylbutylsulfinyl, 1,1,2-Trimethylpropylsulfinyl, 1,2,2-Trimethylpropylsulfinyl, 1-Ethyl-1-methylpropylsulfinyl und 1-Ethyl-2-methylpropylsulfinyl;
- 20 - C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-Alkylsulfinyl (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-Alkyl-S(=O)-): C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkylsulfinyl wie voranstehend genannt sowie z.B. Heptylsulfinyl, 2-Methylhexylsulfinyl, 3-Methylhexylsulfinyl, 2,2-Dimethylpentylsulfinyl, 2,3-Dimethylpentylsulfinyl, 2,4-Dimethylpentylsulfinyl, 3,3-Dimethylpentylsulfinyl, 2,2-Dimethyl-3-methylbutylsulfinyl, Octylsulfinyl, 2-Methylheptylsulfinyl, 3-Methylheptylsulfinyl, 4-Methylheptylsulfinyl, 2,2-Dimethylhexylsulfinyl, 2,3-Dimethylhexylsulfinyl, 2,4-Dimethylhexylsulfinyl, 3,3-Dimethylhexylsulfinyl, 2,2,3-Trimethylpentylsulfinyl, 2,3,3-Trimethylpentylsulfinyl, 2,3,4-Trimethylpentylsulfinyl und 2,2,3,3-Tetramethylbutylsulfinyl;
- 25 - C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkylsulfinyl: C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkylsulfinylrest wie voranstehend genannt, der partiell oder vollständig durch Fluor, Chlor, Brom und/oder Iod substituiert ist, also z.B. Fluormethylsulfinyl, Difluormethylsulfinyl, Trifluormethylsulfinyl,
- 30
- 35
- 40
- 45

## 17

- Chlordifluormethylsulfinyl, Bromdifluormethylsulfinyl, 2-Fluorethylsulfinyl, 2-Chlorethylsulfinyl, 2-Bromethylsulfinyl, 2-Iodethylsulfinyl, 2,2-Difluorethylsulfinyl, 2,2,2-Trifluorethylsulfinyl, 2,2,2-Trichlorethylsulfinyl,
- 5 2-Chlor-2-fluorethylsulfinyl, 2-Chlor-2,2-difluorethylsulfinyl, 2,2-Dichlor-2-fluorethylsulfinyl, Pentafluorethylsulfinyl, 2-Fluorpropylsulfinyl, 3-Fluorpropylsulfinyl, 2-Chlorpropylsulfinyl, 3-Chlorpropylsulfinyl, 2-Brompropylsulfinyl, 3-Brompropylsulfinyl, 2,2-Difluorpropylsulfinyl, 2,3-Difluorpropylsulfinyl, 2,3-Dichlorpropylsulfinyl, 3,3,3-Trifluorpropylsulfinyl, 3,3,3-Trichlorpropylsulfinyl, 2,2,3,3,3-Pentafluorpropylsulfinyl, Heptafluorpropylsulfinyl, 1-(Fluormethyl)-2-fluorethylsulfinyl, 1-(Chlormethyl)-2-chlorethylsulfinyl, 1-(Brommethyl)-2-bromethylsulfinyl, 4-Fluorbutylsulfinyl, 4-Chlorbutylsulfinyl, 4-Brombutylsulfinyl, Nonafluorbutylsulfinyl, 5-Fluorpentylsulfinyl, 5-Chlorpentylsulfinyl, 5-Brompentylsulfinyl, 5-Iodpentylsulfinyl, Undecafluorpentylsulfinyl, 6-Fluorhexylsulfinyl, 6-Chlorhexylsulfinyl, 6-Bromhexylsulfinyl, 6-Iodhexylsulfinyl und Dodecafluorhexylsulfinyl;
- 20
- C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-Halogenalkylsulfinyl: C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkylsulfinyl wie voranstehend genannt, sowie z.B. 7-Fluorheptylsulfinyl, 7-Chlorheptylsulfinyl, 7-Bromheptylsulfinyl, 7-Iodheptylsulfinyl, Perfluorheptylsulfinyl, 8-Fluoroctylsulfinyl, 8-Chloroctylsulfinyl, 8-Bromoctylsulfinyl, 8-Iodoctylsulfinyl und Perfluoroctylsulfinyl;
- 25
- C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkylsulfonyl (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkyl-S(=O)<sub>2</sub>-) sowie die Alkylsulfonyl-Teile von C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkylsulfonyl-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkyl: z.B. Methylsulfonyl, Ethylsulfonyl, Propylsulfonyl, 1-Methylethylsulfonyl, Butylsulfonyl, 1-Methylpropylsulfonyl, 2-Methylpropylsulfonyl, 1,1-Dimethylethylsulfonyl, Pentylsulfonyl, 1-Methylbutylsulfonyl, 2-Methylbutylsulfonyl, 3-Methylbutylsulfonyl, 1,1-Dimethylpropylsulfonyl, 1,2-Dimethylpropylsulfonyl, 2,2-Dimethylpropylsulfonyl, 1-Ethylpropylsulfonyl, Hexylsulfonyl, 1-Methylpentylsulfonyl, 2-Methylpentylsulfonyl, 3-Methylpentylsulfonyl, 4-Methylpentylsulfonyl, 1,1-Dimethylbutylsulfonyl, 1,2-Dimethylbutylsulfonyl, 1,3-Dimethylbutylsulfonyl, 2,2-Dimethylbutylsulfonyl, 2,3-Dimethylbutylsulfonyl, 3,3-Dimethylbutylsulfonyl, 1-Ethylbutylsulfonyl, 2-Ethylbutylsulfonyl, 1,1,2-Trimethylpropylsulfonyl, 1,2,2-Trimethylpropylsulfonyl, 1-Ethyl-1-methylpropylsulfonyl und 1-Ethyl-2-methylpropylsulfonyl;
- 30
- 35
- 40
- 45

## 18

- C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-Alkylsulfonyl (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-Alkyl-S(=O)<sub>2</sub>-): C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkylsulfonyl wie voranstehend genannt, sowie die Alkylsulfonyl-Teile von C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-Alkylsulfonyl-C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-alkyl: z.B. Heptylsulfonyl, 2-Methylhexylsulfonyl, 3-Methylhexylsulfonyl, 2,2-Dimethylpentylsulfonyl, 2,3-Dimethylpentylsulfonyl, 2,4-Dimethylpentylsulfonyl, 3,3-Dimethylpentylsulfonyl, 2,2-Dimethyl-3-methylbutylsulfonyl, Octylsulfonyl, 2-Methylheptylsulfonyl, 3-Methylheptylsulfonyl, 4-Methylheptylsulfonyl, 2,2-Dimethylhexylsulfonyl, 2,3-Dimethylhexylsulfonyl, 2,4-Dimethylhexylsulfonyl, 3,3-Dimethylhexylsulfonyl, 2,2,3-Trimethylpentylsulfonyl, 2,3,3-Trimethylpentylsulfonyl, 2,3,4-Trimethylpentylsulfonyl und 2,2,3,3-Tetramethylbutylsulfonyl;
- C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkylsulfonyl: einen C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkylsulfonylrest wie voranstehend genannt, der partiell oder vollständig durch Fluor, Chlor, Brom und/oder Iod substituiert ist, also z.B. Fluormethylsulfonyl, Difluormethylsulfonyl, Trifluormethylsulfonyl, Chlordifluormethylsulfonyl, Bromdifluormethylsulfonyl, 2-Fluorethylsulfonyl, 2-Chlorethylsulfonyl, 2-Bromethylsulfonyl, 2-Iodethylsulfonyl, 2,2-Difluorethylsulfonyl, 2,2,2-Trifluorethylsulfonyl, 2-Chlor-2-fluorethylsulfonyl, 2-Chlor-2,2-difluorethylsulfonyl, 2,2-Dichlor-2-fluorethylsulfonyl, 2,2,2-Trichlorethylsulfonyl, Pentafluorethylsulfonyl, 2-Fluorpropylsulfonyl, 3-Fluorpropylsulfonyl, 2-Chlorpropylsulfonyl, 3-Chlorpropylsulfonyl, 2-Brompropylsulfonyl, 3-Brompropylsulfonyl, 2,2-Difluorpropylsulfonyl, 2,3-Difluorpropylsulfonyl, 2,3-Dichlorpropylsulfonyl, 3,3,3-Trifluorpropylsulfonyl, 3,3,3-Trichlorpropylsulfonyl, 2,2,3,3,3-Pentafluorpropylsulfonyl, Heptafluorpropylsulfonyl, 1-(Fluormethyl)-2-fluorethylsulfonyl, 1-(Chlormethyl)-2-chlorethylsulfonyl, 1-(Brommethyl)-2-bromethylsulfonyl, 4-Fluorbutylsulfonyl, 4-Chlorbutylsulfonyl, 4-Brombutylsulfonyl, Nonfluorbutylsulfonyl, 5-Fluorpentylsulfonyl, 5-Chlorpentylsulfonyl, 5-Brompentylsulfonyl, 5-Iodpentylsulfonyl, 6-Fluorhexylsulfonyl, 6-Bromhexylsulfonyl, 6-Iodhexylsulfonyl und Dodecafluorhexylsulfonyl;
- C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-Halogenalkylsulfonyl: C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkylsulfonyl wie voranstehend genannt, sowie z.B. 7-Fluorheptylsulfonyl, 7-Chlorheptylsulfonyl, 7-Bromheptylsulfonyl, 7-Iodheptylsulfonyl, Perfluorheptylsulfonyl, 8-Fluoroctylsulfonyl, 8-Chloroctylsulfonyl, 8-Bromoctylsulfonyl, 8-Iodoctylsulfonyl und Octadecafluoroctylsulfonyl;

## 19

- Aryl: ein- bis dreikerniger aromatischer Carbocyclus mit 6 bis 14 Ringgliedern, wie z.B. Phenyl, Naphthyl, Anthracenyl und Phenanthrenyl;
  
- 5 - 5-gliedriges Heteroaryl mit ein bis vier Stickstoffatomen, oder mit ein bis drei Stickstoffatomen und einem Sauerstoff- oder Schwefelatom, oder mit einem Sauerstoff- oder Schwefelatom, steht für C-Atom verknüpfte aromatische 5-Ring Heterocyclen, welche neben Kohlenstoffatomen ein bis vier Stickstoffatome, oder ein bis drei Stickstoffatome und ein Schwefel- oder Sauerstoffatom, oder ein Sauerstoff- oder ein Schwefelatom als Ringglieder enthalten können,
  
- 10 z.B. über ein C-Atom verknüpfte aromatische 5-Ring Heterocyclen mit einem Heteroatom, wie z.B. 2-Furyl, 3-Furyl, 2-Thienyl, 3-Thienyl, 2-Pyrrolyl, 3-Pyrrolyl;
  
- 15 z.B. über ein C-Atom verknüpfte aromatische 5-Ring Heterocyclen mit zwei Heteroatomen, wie z.B. 3-Isoxazolyl, 4-Isoxazolyl, 5-Isoxazolyl, 3-Isothiazolyl, 4-Isothiazolyl, 5-Isothiazolyl, 2-Oxazolyl, 4-Oxazolyl, 5-Oxazolyl, 2-Thiazolyl, 4-Thiazolyl, 5-Thiazolyl, 2-Imidazolyl, 4-Imidazolyl, 3-Pyrazolyl, 4-Pyrazolyl, 5-Pyrazolyl;
  
- 20 z.B. über ein C-Atom verknüpfte aromatische 5-Ring Heterocyclen mit drei Heteroatomen, wie z.B. 1,2,4-Oxadiazol-3-yl, 1,2,4-Oxadiazol-5-yl, 1,2,4-Thiadiazol-3-yl, 1,2,4-Thiadiazol-5-yl, 1,2,4-Triazol-3-yl, 1,3,4-Oxadiazol-2-yl, Tetrazol-2-yl;
  
- 25 z.B. über ein C-Atom verknüpfte aromatische 5-Ring Heterocyclen mit vier Heteroatomen wie z.B. Tetrazol-2-yl;
  
- 30 - 6-gliedriges Heteroaryl mit einem bis vier N-Atomen:
  
- 35 z.B. über ein C-Atom verknüpfte aromatische 6-Ring Heterocyclen, welche neben Kohlenstoffatomen ein bis vier, vorzugsweise ein bis drei Stickstoffatome als Ringglieder enthalten können, z.B. 2-Pyridinyl, 3-Pyridinyl, 4-Pyridinyl, 3-Pyridazinyl, 4-Pyridazinyl, 2-Pyrimidinyl, 4-Pyrimidinyl,
  
- 40 5-Pyrimidinyl, 2-Pyrazinyl, 1,3,5-Triazin-2-yl, 1,2,4-Triazin-3-yl, 1,2,4-Triazin-5-yl, 1,2,4-Triazin-6-yl und 1,2,4,5-Tetrazinyl;

45 In einer besonderen Ausführungsform haben die Variablen der Verbindungen der Formel I folgende Bedeutungen, wobei diese für sich allein betrachtet als auch in Kombination miteinander besondere Ausgestaltungen der Verbindungen der Formel I darstellen:

## 20

Bevorzugt sind die 3-heteroarylsubstituierten Isoxazoline der Formel I, in der

- X 6-gliedriges Heteroaryl mit ein bis vier Stickstoffatomen,  
5 das partiell oder vollständig halogeniert ist und/oder ein bis drei Substituenten aus folgender Gruppe trägt:  
Cyano, Nitro, Hydroxy, C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-Alkyl, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-Cycloalkyl, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenycycloalkyl, C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>-Alkenyl, C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>-Alkinyl, C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-Halogenalkyl, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkenyl, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkinyl, C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-Alkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-Halogenalkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-Alkoxy-C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-alkyl, Amino, C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-Alkylamino, Di(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-alkyl)amino, Amino-C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-Alkylamino-C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-alkyl, Di(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-alkyl)amino-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>-Halogenalkylthio, C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-Alkylthio-C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-Alkylsulfinyl, C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-Halogenalkylsulfinyl, C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-Alkylsulfonyl, C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-Halogenalkylsulfonyl, C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-Alkylsulfonyl-C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-Alkoxy-carbonyl, C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-Alkoxy-carbonyl-C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-alkyl, Aminocarbonyl, C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-Alkylaminocarbonyl, Di(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-alkyl)aminocarbonyl, Aminocarbonyl-C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-Alkylaminocarbonyl-C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-alkyl, Di(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-alkyl)aminocarbonyl-C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-alkyl, Carboxyl, Carboxy-C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-alkyl, Phenyl, Phenoxy, Phenylthio, Phenylamino, Phenyl-C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-alkyl, Phenyl-C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-alkoxy, 3- bis 6-gliedriges Heterocyclyl und 5- oder 6-gliedriges Heteroaryl, wobei die acht letztgenannten Reste ihrerseits partiell oder vollständig halogeniert sein können und/oder ein bis drei Substituenten aus der Gruppe Nitro, Cyano, 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>-Halogenalkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-Halogenalkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-Alkylthio, C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-Halogenalkylthio, C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-Alkylsulfinyl, C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-Halogenalkylsulfinyl, C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-Alkylsulfonyl und C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-Halogenalkylsulfonyl tragen können;

- besonders bevorzugt 6-gliedriges Heteroaryl mit ein bis vier Stickstoffatomen, das partiell oder vollständig halogeniert ist und/oder ein bis drei Substituenten aus folgender Gruppe trägt:  
35 Cyano, Nitro, Hydroxy, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkyl, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-Cycloalkyl, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenycycloalkyl, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-Alkenyl, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-Alkinyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkyl, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkenyl, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkinyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkoxy-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkyl, Amino, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkylamino, Di(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkyl)amino, Amino-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkylamino-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkyl, Di(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkyl)amino-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>-Halogenalkylthio, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkylthio-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkylsulfinyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkylsulfonyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkylsulfonyl-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkoxy-carbonyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkoxy-carbonyl-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkyl, Aminocarbonyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkylaminocarbonyl, Di(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkyl)aminocarbonyl, Aminocarbonyl-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkyl,

## 21

C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkylaminocarbonyl-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkyl, Di(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkyl)aminocarbonyl-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkyl, Carboxyl und Carboxy-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkyl;

insbesondere bevorzugt 6-gliedriges Heteroaryl mit ein bis vier Stickstoffatomen, das partiell oder vollständig halogeniert ist und/oder ein bis drei Substituenten aus folgender Gruppe trägt:

5  
10  
15  
Cyano, Nitro, Hydroxy, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkyl, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-Cycloalkyl, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenycycloalkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkoxy-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkyl, Amino, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkylamino, Di(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkyl)amino, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkylthio, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkylthio, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkylsulfinyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkylsulfonyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkoxy-carbonyl, Aminocarbonyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkylaminocarbonyl, Di(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkyl)aminocarbonyl, Carboxyl und Carboxy-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkyl;

außerordentlich bevorzugt 6-gliedriges Heteroaryl mit ein bis vier Stickstoffatomen, das partiell halogeniert ist und/oder ein bis zwei Substituenten aus folgender Gruppe trägt:

20  
25  
Cyano, Nitro, Hydroxy, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkyl, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-Cycloalkyl, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenycycloalkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkoxy-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkyl, Amino, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkylamino, Di(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkyl)amino, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkylthio, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkylthio, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkylsulfinyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkylsulfonyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkoxy-carbonyl, Aminocarbonyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkylaminocarbonyl, Di(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkyl)aminocarbonyl, Carboxyl und Carboxy-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkyl;

sehr außerordentlich bevorzugt 6-gliedriges Heteroaryl mit ein bis vier Stickstoffatomen, das partiell halogeniert ist und/oder einen Substituenten aus folgender Gruppe trägt:

30  
35  
40  
Cyano, Nitro, Hydroxy, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkyl, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-Cycloalkyl, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenycycloalkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkoxy-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkyl, Amino, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkylamino, Di(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkyl)amino, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkylthio, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkylthio, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkylsulfinyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkylsulfonyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkoxy-carbonyl, Aminocarbonyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkylaminocarbonyl, Di(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkyl)aminocarbonyl, Carboxyl und Carboxy-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkyl;

bedeutet.

Ebenso bevorzugt sind die 3-heteroarylsubstituierten Isoxazoline der Formel I, in der

45  
X 6-gliedriges Heteroaryl mit ein bis drei Stickstoffatomen, bevorzugt 6-gliedriges Heteroaryl mit ein bis zwei N-Atomen,

## 22

insbesondere Pyridyl, Pyrimidyl oder Pyrazinyl,  
sehr bevorzugt Pyridyl oder Pyrimidyl;

- 5 ebenso sehr bevorzugt Pyridyl oder Pyrazinyl,  
sehr bevorzugt Pyridyl; und

das 6-gliedrige Heteroaryl wie oben beschrieben substituiert  
ist;

- 10 außerordentlich bevorzugt 6-gliedriges Heteroaryl mit ein bis  
zwei Stickstoffatomen,  
insbesondere Pyridyl oder Pyrazinyl,  
sehr bevorzugt Pyridyl; und  
das 6-gliedrige Heteroaryl wie oben beschrieben substituiert  
15 ist; und  
das 6-gliedrige Heteroaryl ortho- oder meta zu einem Stick-  
stoff mit dem Isoxazolingerüst verknüpft ist,

bedeutet.

- 20 Ebenso bevorzugt sind die 3-heteroarylsubstituierten Isoxazoline  
der Formel I, in der

- X 6-gliedriges Heteroaryl mit ein bis zwei Stickstoffatomen,  
25 welches partiell oder vollständig halogeniert ist und/oder  
ein bis zwei Substituenten aus folgender Gruppe trägt:  
Cyano, Nitro, Hydroxy, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkyl,  
C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-Alkenyl, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-Alkinyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Halogen-  
alkoxy, Amino, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkylamino, Di(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkyl)amino,  
30 C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkylthio, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkylsulfinyl und C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkylsulfonyl;  
bevorzugt Cyano, Nitro, Hydroxy, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Halogen-  
alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkoxy, Amino, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkyl-  
amino, Di(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkyl)amino, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkylthio, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkyl-  
sulfinyl und C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkylsulfonyl; und  
35 in ortho- oder meta-Position zu einem Stickstoff des  
6-gliedrigen Heteroaryls mit dem Isoxazolingerüst verknüpft  
ist;

- bevorzugt 6-gliedriges Heteroaryl mit ein bis zwei Stick-  
40 stoffatomen, welches partiell halogeniert ist und/oder ein  
bis zwei Substituenten in ortho-Position zu einem Stickstoff-  
atom aus folgender Gruppe trägt:  
Cyano, Nitro, Hydroxy, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkyl,  
C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-Alkenyl, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-Alkinyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Halogen-  
45 alkoxy, Amino, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkylamino, Di(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkyl)amino,  
C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkylthio und C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkylsulfinyl;

## 23

bevorzugt Cyano, Nitro, Hydroxy, 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, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkoxy, Amino, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkylamino, Di(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkyl)amino, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkylthio und C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkylsulfinyl; und

5 in ortho- oder meta-Position zu einem Stickstoff des 6-gliedrigen Heteroaryls mit dem Isoxazolingerüst verknüpft ist;

insbesondere bevorzugt 6-gliedriges Heteroaryl mit ein bis  
10 zwei Stickstoffatomen, welches partiell halogeniert ist und/oder einen Substituenten in ortho-Position zu einem Stickstoffatom aus folgender Gruppe trägt:

Cyano, Nitro, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkyl, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-Alkenyl, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-Alkinyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkoxy oder C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkoxy und  
15 C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkylthio;

bevorzugt 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 und C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkoxy; und

in ortho- oder meta-Position zu einem Stickstoff des 6-gliedrigen Heteroaryls mit dem Isoxazolingerüst verknüpft  
20 ist;

bedeutet.

Ebenso bevorzugt sind die 3-heteroarylsubstituierten Isoxazoline  
25 der Formel I, in der

X 6-gliedriges Heteroaryl mit ein bis zwei Stickstoffatomen, welches partiell oder vollständig halogeniert ist und/oder ein bis zwei Substituenten aus folgender Gruppe trägt:  
30 Cyano, Nitro, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkyl, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-Alkenyl und C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-Alkinyl; und in ortho- oder meta-Position zu einem Stickstoff des 6-gliedrigen Heteroaryls mit dem Isoxazolingerüst verknüpft ist;

35 bevorzugt 6-gliedriges Heteroaryl mit ein bis zwei Stickstoffatomen, welches partiell halogeniert ist und/oder ein bis zwei Substituenten in ortho-Position zu einem Stickstoffatom aus folgender Gruppe trägt:

40 Cyano, Nitro, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkyl, C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>-Alkenyl und C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>-Alkinyl; und

in ortho- oder meta-Position zu einem Stickstoff des 6-gliedrigen Heteroaryls mit dem Isoxazolingerüst verknüpft  
45 ist;



## 24

insbesondere bevorzugt 6-gliedriges Heteroaryl mit ein bis zwei Stickstoffatomen, einen Substituenten in ortho-Position zu einem Stickstoffatom aus folgender Gruppe trägt: CN, NO<sub>2</sub>, Halogen wie z.B. Fluor, Chlor, Brom, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl wie z.B. Methyl, Ethyl, iso-Propyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkyl wie z.B. Trifluormethyl, C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>-Alkenyl wie z.B. Ethenyl, und C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>-Alkinyl wie z.B. Ethinyl; und in ortho- oder meta-Position zu einem Stickstoff des 6-gliedrigen Heteroaryls mit dem Isoxazolingerüst verknüpft ist;

außerordentlich bevorzugt 6-gliedriges Heteroaryl mit ein bis zwei Stickstoffatomen, welches einen Substituenten in ortho-Position zu einem Stickstoff aus folgender Gruppe trägt: F, Cl, Br, CN, CH<sub>3</sub>, C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>, iC<sub>3</sub>H<sub>7</sub>, CF<sub>3</sub>, Ethenyl und Ethinyl; und in ortho- oder meta-Position zu einem Stickstoff des 6-gliedrigen Heteroaryls mit dem Isoxazolingerüst verknüpft ist;

20 bedeutet.

Ebenso bevorzugt sind die 3-heteroarylsubstituierten Isoxazoline der Formel I, in der

25 X 5-gliedriges Heteroaryl mit ein bis vier Stickstoffatomen, oder ein bis drei Stickstoffatomen und einem Sauerstoff- oder Schwefelatom, oder einem Sauerstoff- oder Schwefelatom aus folgender Gruppe: Pyrrolyl, Furanyl, Imidazolyl, Oxazolyl, 30 Isoxazolyl, Thiazolyl, Isothiazolyl, 1,2,3-Triazolyl, 1H-1,2,4-Triazolyl, 4H-1,2,4-Triazolyl, 1,2,3-Oxadiazolyl, 1,2,4-Oxadiazolyl, 1,3,4-Oxadiazolyl, 1,2,3-Thiadiazolyl, 1,2,4-Thiadiazolyl, 1,3,4-Thiadiazolyl und 1H-Tetrazolyl; wobei das 5-gliedrige Heteroaryl partiell oder vollständig 35 halogeniert ist und/oder ein bis drei Substituenten aus folgender Gruppe trägt: Cyano, Nitro, Hydroxy, C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-Alkyl, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-Cycloalkyl, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenycycloalkyl, C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>-Alkenyl, C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>-Alkinyl, C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-Halogenalkyl, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkenyl, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkinyl, C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-Alkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-Halogenalkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-Alkoxy-C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-alkyl, Amino, C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-Alkylamino, 40 Di(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-alkyl)amino, Amino-C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-Alkylamino-C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-alkyl, Di(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-alkyl)amino-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>-Halogenalkylthio, C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-Alkylthio-C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-alkyl, 45 C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-Alkylsulfinyl, C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-Halogenalkylsulfinyl, C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-Alkylsulfonyl, C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-Halogenalkylsulfonyl, C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-Alkylsulfonyl-C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-Alkoxy-carbonyl, C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-Alkoxy-carbo-

## 25

- nyl-C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-alkyl, Aminocarbonyl, C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-Alkylaminocarbonyl, Di(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-alkyl)aminocarbonyl, Aminocarbonyl-C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-Alkylaminocarbonyl-C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-alkyl, Di(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-alkyl)aminocarbonyl-C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-alkyl, Carboxyl, Carboxy-C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-alkyl,
- 5** Phenyl, Phenoxy, Phenylthio, Phenylamino, Phenyl-C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-alkyl, Phenyl-C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-alkoxy, 3- bis 6-gliedriges Heterocyclyl oder 5- oder 6-gliedriges Heteroaryl, wobei die acht letztgenannten Reste ihrerseits partiell oder vollständig halogeniert sein können und/oder ein bis drei Substituenten aus der Gruppe
- 10** Nitro, Cyano, 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>-Halogenalkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-Halogenalkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-Alkylthio, C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-Halogenalkylthio, C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-Alkylsulfinyl, C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-Halogenalkylsulfinyl, C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-Alkylsulfonyl, und C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-Halogenalkylsulfonyl tragen können;
- 15** besonders bevorzugt 5-gliedriges Heteroaryl mit ein bis vier Stickstoffatomen, oder ein bis drei Stickstoffatomen und einem Sauerstoff- oder Schwefelatom, oder einem Sauerstoff- oder Schwefelatom aus folgender Gruppe: Pyrroyl, Furanyl, Imidazolyl, Oxazolyl, Isoxazolyl, Thiazolyl, Isothiazolyl,
- 20** 1,2,3-Triazolyl, 1H-1,2,4-Triazolyl, 4H-1,2,4-Triazolyl, 1,2,3-Oxadiazolyl, 1,2,4-Oxadiazolyl, 1,3,4-Oxadiazolyl, 1,2,3-Thiadiazolyl, 1,2,4-Thiadiazolyl, 1,3,4-Thiadiazolyl und 1H-Tetrazolyl;
- wobei das 5-gliedrige Heteroaryl partiell oder vollständig halogeniert ist und/oder ein bis drei Substituenten aus folgender Gruppe trägt:
- 25** Cyano, Nitro, Hydroxy, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkyl, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-Cycloalkyl, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenycycloalkyl, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-Alkenyl, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-Alkynyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkyl, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkenyl, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkynyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkoxy-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkyl, Amino, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkylamino, Di(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkyl)amino, Amino-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkylamino-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkyl, Di(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkyl)amino-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>-Halogenalkylthio, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkylthio-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkyl,
- 30** C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkylsulfinyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkylsulfonyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkylsulfonyl-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkoxy-carbonyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkoxy-carbonyl-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkyl, Aminocarbonyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkylaminocarbonyl, Di(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkyl)aminocarbonyl, Aminocarbonyl-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkylaminocarbonyl-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkyl, Di(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkyl)aminocarbonyl-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkyl, Carboxyl und Carboxy-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkyl;
- 40**
- insbesondere bevorzugt 5-gliedriges Heteroaryl mit ein bis vier Stickstoffatomen, oder ein bis drei Stickstoffatomen und einem Sauerstoff- oder Schwefelatom, oder einem Sauerstoff- oder Schwefelatom aus folgender Gruppe: Pyrroyl, Furanyl, Imidazolyl, Oxazolyl, Isoxazolyl, Thiazolyl, Isothiazolyl, 1,2,3-Triazolyl, 1H-1,2,4-Triazolyl, 4H-1,2,4-Triazolyl,
- 45**

## 26

1,2,3-Oxadiazolyl, 1,2,4-Oxadiazolyl, 1,3,4-Oxadiazolyl,  
1,2,3-Thiadiazolyl, 1,2,4-Thiadiazolyl, 1,3,4-Thiadiazolyl  
und 1H-Tetrazolyl,

wobei das 5-gliedrige Heteroaryl partiell oder vollständig  
5 halogeniert ist und/oder ein bis drei Substituenten aus fol-  
gender Gruppe trägt:

Cyano, Nitro, Hydroxy, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkyl, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-Cycloalkyl,  
C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-Halogencycloalkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkoxy,  
C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkoxy-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkyl, Amino,  
10 C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkylamino, Di(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkyl)amino, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkylthio,  
C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkylthio, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkylsulfinyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkyl-  
sulfonyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkoxycarbonyl, Aminocarbonyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkyl-  
aminocarbonyl, Di(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkyl)aminocarbonyl, Carboxyl und Car-  
boxy-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkyl;

15 außerordentlich bevorzugt 5-gliedriges Heteroaryl mit ein bis  
vier Stickstoffatomen, oder ein bis drei Stickstoffatomen und  
einem Sauerstoff- oder Schwefelatom, oder einem Sauerstoff-  
oder Schwefelatom aus folgender Gruppe: Pyrrolyl, Furanyl,  
20 Imidazolyl, Oxazolyl, Isoxazolyl, Thiazolyl, Isothiazolyl,  
1,2,3-Triazolyl, 1H-1,2,4-Triazolyl, 4H-1,2,4-Triazolyl,  
1,2,3-Oxadiazolyl, 1,2,4-Oxadiazolyl, 1,3,4-Oxadiazolyl,  
1,2,3-Thiadiazolyl, 1,2,4-Thiadiazolyl, 1,3,4-Thiadiazolyl  
und 1H-Tetrazolyl;

25 wobei das 5-gliedrige Heteroaryl partiell halogeniert ist  
und/oder ein bis zwei Substituenten aus folgender Gruppe  
trägt:

Cyano, Nitro, Hydroxy, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkyl, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-Cycloalkyl,  
C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-Halogencycloalkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkoxy,  
30 C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkoxy-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkyl, Amino,  
C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkylamino, Di(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkyl)amino, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkylthio,  
C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkylthio, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkylsulfinyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkyl-  
sulfonyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkoxycarbonyl, Aminocarbonyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkyl-  
aminocarbonyl, Di(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkyl)aminocarbonyl, Carboxyl und Car-  
35 boxy-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkyl;

sehr außerordentlich bevorzugt 5-gliedriges Heteroaryl mit  
ein bis vier Stickstoffatomen, oder ein bis drei Stickstoff-  
atomen und einem Sauerstoff- oder Schwefelatom, oder einem  
40 Sauerstoff- oder Schwefelatom aus folgender Gruppe:

Pyrrolyl, Furanyl, Imidazolyl, Oxazolyl, Isoxazolyl,  
Thiazolyl, Isothiazolyl, 1,2,3-Triazolyl, 1H-1,2,4-Triazolyl,  
4H-1,2,4-Triazolyl, 1,2,3-Oxadiazolyl, 1,2,4-Oxadiazolyl,  
1,3,4-Oxadiazolyl, 1,2,3-Thiadiazolyl, 1,2,4-Thiadiazolyl,  
45 1,3,4-Thiadiazolyl und 1H-Tetrazolyl,

wobei das 5-gliedrige Heteroaryl partiell halogeniert ist  
und/oder einen Substituenten aus folgender Gruppe trägt:

## 27

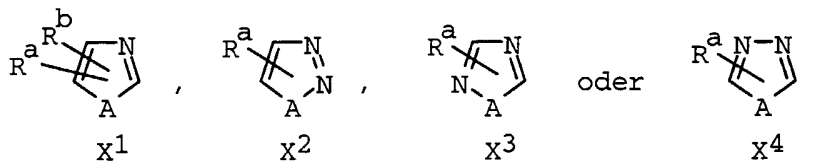
- Cyano, Nitro, Hydroxy, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkyl, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-Cycloalkyl, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenycycloalkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkoxy-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkyl, Amino, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkylamino, Di(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkyl)amino, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkylthio, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkylthio, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkylsulfinyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkylsulfonyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkoxy-carbonyl, Aminocarbonyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkylaminocarbonyl, Di(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkyl)aminocarbonyl, Carboxyl und Carboxy-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkyl;

10 bedeutet.

Ebenso bevorzugt sind die 3-heteroarylsubstituierten Isoxazoline der Formel I, in der

- 15 X 5-gliedriges Heteroaryl mit ein bis drei Stickstoffatomen, oder ein bis zwei Stickstoffatomen und einem Sauerstoff- oder Schwefelatom, oder einem Sauerstoff oder Schwefelatom ausgewählt aus der Gruppe X<sup>1</sup> bis X<sup>6</sup> mit

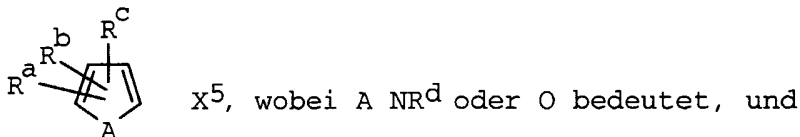
20



25

wobei A in X<sup>1</sup> bis X<sup>4</sup> NR<sup>d</sup>, O oder S bedeutet,

30



35

R<sup>a</sup> Halogen, Cyano, Nitro, Hydroxy, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkyl, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-Cycloalkyl, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenycycloalkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkoxy-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkyl, Amino, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkylamino,

40

Di(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkyl)amino, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkylthio, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkylthio, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkylsulfinyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkylsulfonyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkoxy-carbonyl, Aminocarbonyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkylaminocarbonyl, Di(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkyl)aminocarbonyl, Carboxyl oder Carboxy-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkyl;

45

R<sup>b</sup>, R<sup>c</sup> Wasserstoff, sowie ein unter R<sup>a</sup> genannter Substituent; und

## 28

R<sup>d</sup> Wasserstoff oder C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkyl;

bedeutet.

5 Besonders bevorzugt sind die 3-heteroarylsubstituierten Isoxazoline der Formel I, in der

x für X<sup>1</sup> steht, wobei

10 R<sup>a</sup> Halogen, Cyano, Nitro, Hydroxy, 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, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkoxy, Amino, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkylamino, Di(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkyl)amino, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkylthio, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkylsulfinyl oder C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkylsulfonyl,

15 R<sup>b</sup> Wasserstoff, sowie ein wie voranstehend unter R<sup>a</sup> genannter Substituent; und

R<sup>d</sup> Wasserstoff oder C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkyl;  
bevorzugt Wasserstoff oder C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl;

insbesondere bevorzugt

20 X für X<sup>1</sup> steht, wobei

R<sup>a</sup> 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 oder C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkoxy;

R<sup>b</sup> Wasserstoff, 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 oder C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkoxy; und

25 R<sup>d</sup> Wasserstoff oder C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl;

bedeutet.

30 Ebenso besonders bevorzugt sind die 3-heteroarylsubstituierten Isoxazoline der Formel I, in der

X für X<sup>5</sup> steht, wobei

35 R<sup>a</sup> Halogen, Cyano, Nitro, Hydroxy, 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, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkoxy, Amino, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkylamino, Di(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkyl)amino, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkylthio, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkylsulfinyl oder C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkylsulfonyl;

R<sup>b</sup>, R<sup>c</sup> Wasserstoff, sowie ein wie voranstehend unter R<sup>a</sup> genannter Substituent; und

40 R<sup>d</sup> Wasserstoff oder C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkyl,  
bevorzugt Wasserstoff oder C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl;

bevorzugt

X für X<sup>5</sup> steht, wobei

45

## 29

- R<sup>a</sup> Halogen, Cyano, Nitro, Hydroxy, 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, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkoxy, Amino, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkylamino, Di(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkyl)amino, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkylthio, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkylsulfinyl oder C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkylsulfonyl;
- 5 R<sup>b</sup>, R<sup>c</sup> Wasserstoff, sowie ein wie voranstehend unter R<sup>a</sup> genannter Substituent; und
- R<sup>d</sup> Wasserstoff oder C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl;

10 wobei der 5-gliedrige Heterocyclus in ortho-Position zum Heteroatom mit dem Isoxazolingerüst verknüpft ist;

insbesondere bevorzugt

- X für X<sup>5</sup> steht, wobei
- 15 R<sup>a</sup> 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 oder C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkoxy;
- R<sup>b</sup>, R<sup>c</sup> Wasserstoff, sowie ein wie voranstehend unter R<sup>a</sup> genannter Substituent; und
- R<sup>d</sup> Wasserstoff oder C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl;

20

wobei der 5-gliedrige Heterocyclus in ortho-Position zum Heteroatom mit dem Isoxazolingerüst verknüpft ist; bedeutet.

25 Ebenso besonders bevorzugt sind die 3-heteroarylsubstituierten Isoxazoline der Formel I, in der

- X für X<sup>6</sup> steht, wobei
- R<sup>a</sup> Halogen, Cyano, Nitro, Hydroxy, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkyl,
- 30 C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkoxy, Amino, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkylamino, Di(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkyl)amino, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkylthio, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkylsulfinyl oder C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkylsulfonyl;
- 35 R<sup>b</sup> Wasserstoff, sowie ein wie voranstehend unter R<sup>a</sup> genannter Substituent;

bevorzugt

- X für X<sup>6</sup> steht, wobei
- 40 R<sup>a</sup> Halogen, Cyano, Nitro, Hydroxy, 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, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkoxy, Amino, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkylamino, Di(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkyl)amino, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkylthio, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkylsulfinyl oder C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkylsulfonyl;
- 45 R<sup>b</sup> Wasserstoff, sowie ein wie voranstehend unter R<sup>a</sup> genannter Substituent;

## 30

wobei der 5-gliedrige Heterocyclus in ortho-Position zu einem Heteroatom mit dem Isoxazolingerüst verknüpft ist;

insbesondere bevorzugt

- 5 X für X<sup>6</sup> steht, wobei
- R<sup>a</sup> 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 oder C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkoxy;
- R<sup>b</sup> Wasserstoff, sowie ein wie voranstehend unter R<sup>a</sup> genannter Substituent;

## 10

wobei der 5-gliedrige Heterocyclus in ortho-Position zu einem Heteroatom mit dem Isoxazolingerüst verknüpft ist;

bedeutet.

## 15

Ebenso bevorzugt sind die 3-heteroarylsubstituierten Isoxazoline der Formel I, in der

- R<sup>1</sup> - R<sup>7</sup> Wasserstoff, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl, wie z.B. Methyl oder Ethyl, oder C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkyl, wie z.B. Difluormethyl, Trifluormethyl oder Trichlormethyl;
- 20 besonders bevorzugt Wasserstoff, Methyl oder Trifluormethyl;
- sehr bevorzugt Wasserstoff;

## 25

insbesondere bevorzugt stehen R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup>, R<sup>4</sup>-R<sup>7</sup> für Wasserstoff, Methyl oder Trifluormethyl und R<sup>3</sup> für Wasserstoff, Methyl, Ethyl oder Trifluormethyl;

- insbesondere sehr bevorzugt stehen R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup>, R<sup>4</sup>-R<sup>7</sup> für Wasserstoff und R<sup>3</sup> für Methyl.
- 30

Ebenso bevorzugt sind die 3-heteroarylsubstituierten Isoxazoline der Formel I, in der

- 35 Y Aryl, das partiell oder vollständig halogeniert sein kann und/oder ein bis drei Substituenten aus der Gruppe Cyano, Nitro, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkyl, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-Alkenyl, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-Alkinyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkoxy-carbonyl-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkylsulfonyl,
- 40 Phenyl, Phenoxy und Phenylcarbonyl tragen kann; oder Benzo[1,4]dioxanyl, Benzo[1,3]dioxolanyl, 2,3-Dihydrobenzofuranyl oder Benzinidazolyl; oder
- 5- bis 6-gliedriges Heteroaryl mit einem bis vier Stickstoff-, Sauerstoff- und/oder Schwefelatomen, das partiell
- 45 oder vollständig halogeniert sein kann und/oder ein bis drei Substituenten aus der Gruppe 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, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkoxy-

## 31

- C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkoxy-carbonyl tragen kann;  
besonders bevorzugt Aryl, das partiell halogeniert sein  
kann und/oder ein bis zwei Substituenten aus der Gruppe  
Cyano, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkyl und C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkyl-  
5 sulfonyl tragen kann; oder  
Benzo[1,4]dioxanyl, Benzo[1,3]dioxolanyl, 2,3-Dihydroben-  
zofuranyl oder Benzinidazolyl; oder  
5- bis 6-gliedriges Heteroaryl mit einem bis vier Stick-  
stoff-, Sauerstoff- und/oder Schwefelatomen, das partiell  
10 halogeniert sein kann und/oder ein bis zwei Substituenten  
aus der Gruppe C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkoxy-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alkyl und  
C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkoxy-carbonyl tragen kann;
- insbesondere bevorzugt Aryl, das partiell halogeniert  
sein kann und/oder ein bis zwei Substituenten aus der  
15 Gruppe Cyano, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkyl und  
C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkylsulfonyl tragen kann; oder  
Benzo[1,4]dioxanyl, Benzo[1,3]dioxolanyl, 2,3-Dihydroben-  
zofuranyl oder Benzimidazolyl; oder  
20 5- bis 6-gliedriges Heteroaryl aus der Gruppe Pyrazolyl,  
Thiazolyl, Isoxazolyl, Thiadiazolyl und Pyridyl, das par-  
tiell halogeniert sein kann und/oder ein bis zwei  
Substituenten aus der Gruppe C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alko-  
xy-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alkyl und C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkoxy-carbonyl tragen kann;  
25 bedeutet.
- Ebenso bevorzugt sind die 3-heteroarylsubstituierten Isoxazoline  
der Formel I, in der
- 30 Y Aryl, das partiell oder vollständig halogeniert sein kann  
und/oder ein bis drei Substituenten aus der Gruppe  
Cyano, Nitro, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkyl oder C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-Alkenyl,  
C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-Alkynyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkoxy,  
35 C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkoxy-carbonyl-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alkoxy,  
C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkylsulfonyl, Phenyl, Phenoxy und Phenylcarbonyl;  
bevorzugt Cyano, Nitro, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkyl, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-Alkenyl,  
C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-Alkynyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkyl oder C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkoxy tragen  
kann;
- 40 besonders bevorzugt Aryl, das partiell halogeniert sein  
kann und/oder ein bis zwei Substituenten aus der Gruppe  
Cyano, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkyl und C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkyl-  
sulfonyl;
- 45 bevorzugt Cyano, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkyl oder C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkyl tra-  
gen kann;



## 32

insbesondere bevorzugt Aryl, das partiell halogeniert sein kann und/oder ein bis zwei Substituenten aus der Gruppe Cyano, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkyl und C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkylsulfonyl;

5 bevorzugt Cyano tragen kann;

bedeutet.

Ebenso bevorzugt sind die 3-heteroarylsubstituierten Isoxazoline  
10 der Formel I, in der

Y Aryl, das partiell oder vollständig halogeniert sein kann  
und/oder ein bis zwei Substituenten aus der Gruppe  
Cyano, 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 und  
15 C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkylsulfonyl;  
bevorzugt Cyano, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl und C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkyl tragen  
kann;

20 besonders bevorzugt Aryl, das in einer oder beiden ortho-  
Positionen zur Verknüpfungsstelle halogeniert ist und/  
oder einen Substituenten aus der Gruppe Cyano,  
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 und  
C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy-sulfonyl;  
bevorzugt Cyano, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl und C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkyl tragen  
25 kann;

insbesondere besonders bevorzugt Aryl, das in einer oder  
beiden ortho-Positionen zur Verknüpfungsstelle haloge-  
niert ist;

30 bedeutet.

Ebenso bevorzugt sind die 3-heteroarylsubstituierten Isoxazoline  
der Formel I, in der

35 Y Phenyl, das partiell oder vollständig halogeniert sein  
kann und/oder ein bis drei Substituenten aus der Gruppe  
Cyano, Nitro, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkyl, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-Alkenyl, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-Alkynyl,  
C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkoxy,  
40 C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkylthio, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkylthio, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkoxy-  
carbonyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkoxy-carbonyl-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkyl-  
sulfonyl, Phenyl Phenoxy und Phenylcarbonyl;  
bevorzugt Cyano, Nitro, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkyl, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-Alkenyl,  
C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-Alkynyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkoxy,  
45 C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkylthio und C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Halogen-  
alkylthio tragen kann;

- 5 besonders bevorzugt Phenyl, das partiell oder vollständig halogeniert sein kann und/oder ein bis drei Substituenten aus der Gruppe Cyano, Nitro, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkyl, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-Alkenyl, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-Alkynyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkoxy-carbonyl; bevorzugt Cyano, Nitro, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkyl, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-Alkenyl, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-Alkynyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkyl und C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkoxy tragen kann;
- 10 insbesondere besonders bevorzugt Phenyl, das partiell halogeniert sein kann und/oder ein bis zwei Substituenten aus der Gruppe Cyano, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkyl und C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkylsulfonyl;
- 15 bevorzugt Cyano, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkyl und C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkyl tragen kann;

bedeutet.

- 20 Ebenso bevorzugt sind die 3-heteroarylsubstituierten Isoxazoline der Formel I, in der

- Y Phenyl, das partiell oder vollständig halogeniert sein kann und/oder ein bis zwei Substituenten aus der Gruppe
- 25 Cyano, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl und C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkyl tragen kann; besonders bevorzugt Phenyl, das in 2- und/oder 6-Position zur Verknüpfungsstelle halogeniert ist und/oder einen Substituenten aus der Gruppe Cyano, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl und C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkyl tragen kann;
- 30 insbesondere besonders bevorzugt Phenyl, das in 2- und/oder 6-Position zur Verknüpfungsstelle halogeniert ist;

bedeutet.

- 35 Ebenso bevorzugt sind die 3-heteroarylsubstituierten Isoxazoline der Formel I, in der

- Y Naphtyl, das partiell oder vollständig halogeniert sein kann und/oder ein bis drei Substituenten aus der Gruppe
- 40 Cyano, Nitro, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkyl, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-Alkenyl, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-Alkynyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkylthio und C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkylthio tragen kann; besonders bevorzugt Naphthyl, das partiell oder vollständig halogeniert sein kann und/oder ein bis drei
- 45 Substituenten aus der Gruppe Cyano, Nitro, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkyl, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-Alkenyl, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-Alkynyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkyl und C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkoxy tragen kann;

## 34

insbesondere besonders bevorzugt Naphthyl, das partiell halogeniert sein kann und/oder ein bis zwei Substituenten aus der Gruppe Cyano, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkyl und C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkyl tragen kann;

5

bedeutet.

Ebenso bevorzugt sind die 3-heteroarylsubstituierten Isoxazoline der Formel I, in der

10

Y Naphthyl, das partiell oder vollständig halogeniert sein kann und/oder ein bis zwei Substituenten aus der Gruppe Cyano, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl und C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkyl tragen kann;

15

besonders bevorzugt Naphthyl, das in einer oder beiden ortho-Positionen zur Verknüpfungsstelle halogeniert ist und/oder einen Substituenten aus der Gruppe Cyano, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl und C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkyl tragen kann; insbesondere besonders bevorzugt Naphthyl, das in einer oder beiden ortho-Positionen zur Verknüpfungsstelle halogeniert ist;

20

bedeutet.

Ebenso bevorzugt sind die 3-heteroarylsubstituierten Isoxazoline der Formel I, in der

25

Y 5-gliedriges Heteroaryl mit ein bis vier Stickstoffatomen, oder mit ein bis 3 Stickstoffatomen und einen Sauerstoff- oder Schwefelatom, oder einem Sauerstoff oder Schwefelatom; oder

30

6-gliedriges Heteroaryl mit ein bis 4 Stickstoffatomen; wobei die Heterocyclen partiell oder vollständig halogeniert sein können und/oder ein bis drei Substituenten aus der Gruppe Cyano, 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, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkoxy-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkoxy-carbonyl und C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkylsulfonyl tragen können;

35

besonders bevorzugt 5-gliedriges Heteroaryl mit ein bis vier Stickstoffatomen, oder mit ein bis 3 Stickstoffatomen und einen Sauerstoff- oder Schwefelatom, oder einem Sauerstoff- oder Schwefelatom; oder

40

6-gliedriges Heteroaryl mit ein bis 4 Stickstoffatomen; wobei die Heterocyclen partiell oder vollständig halogeniert sein können und/oder ein bis drei Substituenten aus der Gruppe Cyano, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkyl,

45

## 35

C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkoxy- C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alkyl und C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkoxy-carbonyl tragen können;

insbesondere besonders bevorzugt 5- oder 6-gliedriges  
5 Heteroaryl aus der Gruppe Pyrozolyl, Thiozolyl,  
Isoxazolyl, Thiadiazolyl und Pyridyl, wobei das 5- oder  
6-gliedrige Heteroaryl partiell halogeniert sein kann  
und/oder ein bis zwei Substituenten aus der Gruppe Cyano,  
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-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alkyl  
10 und C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy-carbonyl tragen kann;

bedeutet.

Ebenso bevorzugt sind die 3-heteroarylsubstituierten Isoxazoline  
15 der Formel I, in der

X 6-gliedriges Heteroaryl mit ein bis drei Stickstoff-  
atomen,  
bevorzugt 6-gliedriges Heteroaryl mit einem bis zwei  
20 Stickstoffatomen,  
insbesondere Pyridyl, Pyrimidyl und Pyrazinyl,  
sehr bevorzugt Pyridyl und Pyrimidyl;  
wobei das 6-gliedrige Heteroaryl wie oben beschrieben  
substituiert ist;

25 R<sup>1</sup>-R<sup>7</sup> Wasserstoff, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl, wie z. B. Methyl oder Ethyl,  
oder C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkyl, wie z. B. Difluormethyl, Tri-  
fluormethyl oder Trichlormethyl;  
besonders bevorzugt Wasserstoff, Methyl oder Trifluor-  
30 methyl;  
sehr bevorzugt Wasserstoff;

insbesondere bevorzugt stehen R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup>, R<sup>4</sup>-R<sup>7</sup>-für Wasser-  
stoff, Methyl oder Trifluormethyl und R<sup>3</sup> für Wasserstoff,  
35 Methyl, Ethyl oder Trifluormethyl; insbesondere sehr  
bevorzugt stehen R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup>, R<sup>4</sup>-R<sup>7</sup> für Wasserstoff und R<sup>3</sup> für  
Methyl; und

Y Aryl, das partiell oder vollständig halogeniert sein kann  
und/oder ein bis zwei Substituenten aus der Gruppe Cyano,  
40 C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl und C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkyl tragen kann;  
besonders bevorzugt Aryl, das in einer oder beiden ortho-  
Positionen zur Verknüpfungsstelle halogeniert ist und/  
oder einen Substituenten aus der Gruppe Cyano,  
45 C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl und C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkyl tragen kann;

## 36

insbesondere besonders bevorzugt Aryl, das in einer oder beiden ortho-Positionen zur Verknüpfungsstelle halogeniert ist;

bedeutet.

5

Ebenso bevorzugt sind die 3-heteroarylsubstituierten Isoxazoline der Formel I, in der

- X für X<sup>1</sup> steht, wobei
- 10 R<sup>a</sup> Halogen, Cyano, Nitro, Hydroxy, 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, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkoxy, Amino, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkylamino, Di(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkyl)amino, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkylthio, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkylsulfinyl oder C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkylsulfonyl;
- 15 R<sup>b</sup> Wasserstoff, sowie ein wie voranstehend unter R<sup>a</sup> genannter Substituent; und  
R<sup>d</sup> Wasserstoff oder C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkyl, bevorzugt Wasserstoff oder C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl;
- 20 insbesondere bevorzugt  
X für X<sup>1</sup> steht, wobei  
R<sup>a</sup> 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 oder C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkoxy;  
R<sup>b</sup> Wasserstoff, Halogen, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkyl,  
25 C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkoxy oder C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkoxy; und  
R<sup>d</sup> Wasserstoff oder C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl;  
R<sup>1</sup>-R<sup>7</sup> Wasserstoff, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl, wie z. B. Methyl oder Ethyl, oder C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkyl, wie z. B. Difluormethyl, Trifluormethyl oder Trichlormethyl;
- 30 besonders bevorzugt Wasserstoff, Methyl oder Trifluormethyl;  
sehr bevorzugt Wasserstoff;
- insbesondere bevorzugt stehen R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup>, R<sup>4</sup>-R<sup>7</sup>-für Wasserstoff, Methyl oder Trifluormethyl und R<sup>3</sup> für Wasserstoff, Methyl, Ethyl oder Trifluormethyl; insbesondere sehr bevorzugt stehen R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup>, R<sup>4</sup>-R<sup>7</sup> für Wasserstoff und R<sup>3</sup> für Methyl; und
- 40 Y Aryl, das partiell oder vollständig halogeniert sein kann und/oder ein bis zwei Substituenten aus der Gruppe Cyano, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl und C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkyl tragen kann; besonders bevorzugt Aryl, das in einer oder beiden ortho-Positionen zur Verknüpfungsstelle halogeniert ist und/
- 45 oder einen Substituenten aus der Gruppe Cyano, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl und C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkyl tragen kann; insbesondere besonders bevorzugt Aryl, das in einer oder

## 37

beiden ortho-Positionen zur Verknüpfungsstelle halogeniert ist; bedeutet.

Ebenso besonders bevorzugt sind die 3-heteroarylsubstituierten  
5 Isoxazoline der Formel I, in der

- X für X<sup>5</sup> steht, wobei
- 10 R<sup>a</sup> Halogen, Cyano, Nitro, Hydroxy, 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, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkoxy, Amino, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkylamino, Di(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkyl)amino, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkylthio, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkylsulfinyl oder C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkylsulfonyl;
- R<sup>b</sup>, R<sup>c</sup> Wasserstoff, sowie ein wie voranstehend unter R<sup>a</sup> genannter Substituent; und
- 15 R<sup>d</sup> Wasserstoff oder C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkyl, bevorzugt Wasserstoff oder C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl;

bevorzugt

- X für X<sup>5</sup> steht, wobei
- 20 R<sup>a</sup> Halogen, Cyano, Nitro, Hydroxy, 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, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkoxy, Amino, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkylamino, Di(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkyl)amino, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkylthio, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkylsulfinyl oder C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkylsulfonyl;
- 25 R<sup>b</sup>, R<sup>c</sup> Wasserstoff, sowie ein wie voranstehend unter R<sup>a</sup> genannter Substituent; und
- R<sup>d</sup> Wasserstoff oder C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl;

wobei der 5-gliedrige Heterocyclus in ortho- Position zum Hetero-  
30 atom mit dem Isoxazolingerüst verknüpft ist;

insbesondere bevorzugt

- X für X<sup>5</sup> steht, wobei
- 35 R<sup>a</sup> 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 oder C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkoxy;
- R<sup>b</sup>, R<sup>c</sup> Wasserstoff, soqwie ein wie voranstehend unter R<sup>a</sup> genannter Substituent; und
- R<sup>d</sup> Wasserstoff oder C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl;

40 wobei der 5-gliedrige Heterocyclus in ortho- Position zum Hetero-atom mit dem Isoxazolingerüst verknüpft ist,

- R<sup>1</sup>-R<sup>7</sup> Wasserstoff, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl, wie z. B. Methyl oder Ethyl, oder C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkyl, wie z. B. Difluormethyl, Tri-  
45 fluormethyl oder Trichlormethyl;  
besonders bevorzugt Wasserstoff, Methyl oder Trifluormethyl;

## 38

- sehr bevorzugt Wasserstoff;  
insbesondere bevorzugt stehen  $R^1$ ,  $R^2$ ,  $R^4$ - $R^7$ -für Wasserstoff, Methyl oder Trifluormethyl und  $R^3$  für Wasserstoff, Methyl, Ethyl oder Trifluormethyl; insbesondere sehr
- 5 bevorzugt stehen  $R^1$ ,  $R^2$ ,  $R^4$ - $R^7$  für Wasserstoff und  $R^3$  für Methyl; und
- Y Aryl, das partiell oder vollständig halogeniert sein kann und/oder ein bis zwei Substituenten aus der Gruppe Cyano,  $C_1$ - $C_4$ -Alkyl und  $C_1$ - $C_4$ -Halogenalkyl tragen kann;
- 10 besonders bevorzugt Aryl, das in einer oder beiden ortho-Positionen zur Verknüpfungsstelle halogeniert ist und/oder einen Substituenten aus der Gruppe Cyano,  $C_1$ - $C_4$ -Alkyl und  $C_1$ - $C_4$ -Halogenalkyl tragen kann;
- 15 insbesondere besonders bevorzugt Aryl, das in einer oder beiden ortho-Positionen zur Verknüpfungsstelle halogeniert ist; bedeutet.

Ebenso besonders bevorzugt sind die 3-heteroarylsubstituierten

20 Isoxazoline der Formel I, in der

- X für  $X^6$  steht, wobei
- $R^a$  Halogen, Cyano, Nitro, Hydroxy,  $C_1$ - $C_6$ -Alkyl,  $C_1$ - $C_6$ -Halogenalkyl,  $C_1$ - $C_6$ -Alkoxy,  $C_1$ - $C_6$ -Halogenalkoxy,
- 25 Amino,  $C_1$ - $C_6$ -Alkylamino, Di( $C_1$ - $C_6$ -alkyl)amino,  $C_1$ - $C_6$ -Alkylthio,  $C_1$ - $C_6$ -Alkylsulfinyl oder  $C_1$ - $C_6$ -Alkylsulfonyl,
- $R^b$  Wasserstoff, sowie ein wie voranstehend unter  $R^a$  genannter Substituent;
- 30 bevorzugt
- X für  $X^6$  steht, wobei
- $R^a$  Halogen, Cyano, Nitro, Hydroxy,  $C_1$ - $C_6$ -Alkyl,  $C_1$ - $C_6$ -Halogenalkyl,  $C_1$ - $C_6$ -Alkoxy,  $C_1$ - $C_6$ -Halogenalkoxy,
- 35 Amino,  $C_1$ - $C_6$ -Alkylamino, Di( $C_1$ - $C_6$ -alkyl)amino,  $C_1$ - $C_6$ -Alkylthio,  $C_1$ - $C_6$ -Alkylsulfinyl oder  $C_1$ - $C_6$ -Alkylsulfonyl;
- $R^b$  Wasserstoff, sowie ein wie voranstehend unter  $R^a$  genannter Substituent;

40 wobei der 5-gliedrige Heterocyclus in ortho- Position zu einem Heteroatom mit dem Isoxazolingerüst verknüpft ist;

- insbesondere bevorzugt
- 45 X für  $X^6$  steht, wobei
- $R^a$  Halogen,  $C_1$ - $C_6$ -Alkyl,  $C_1$ - $C_6$ -Halogenalkyl,  $C_1$ - $C_6$ -Alkoxy oder  $C_1$ - $C_6$ -Halogenalkoxy,

## 39

R<sup>b</sup> Wasserstoff, sowie ein wie voranstehend unter R<sup>a</sup> genannter Substituent;

wobei der 5-gliedrige Heterocyclus in ortho- Position zu einem Heteroatom mit dem Isoxazolingerüst verknüpft ist;

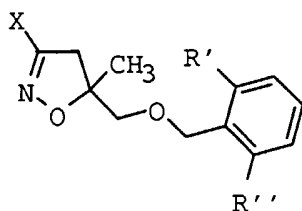
R<sup>1</sup>-R<sup>7</sup> Wasserstoff, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl, wie z. B. Methyl oder Ethyl, oder C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkyl, wie z. B. Difluormethyl, Trifluormethyl oder Trichlormethyl;  
 10 besonders bevorzugt Wasserstoff, Methyl oder Trifluormethyl;  
 sehr bevorzugt Wasserstoff;  
 insbesondere bevorzugt stehen R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup>, R<sup>4</sup>-R<sup>7</sup> für Wasserstoff, Methyl oder Trifluormethyl und R<sup>3</sup> für Wasserstoff,  
 15 Methyl, Ethyl oder Trifluormethyl; insbesondere sehr bevorzugt stehen R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup>, R<sup>4</sup>-R<sup>7</sup> für Wasserstoff und R<sup>3</sup> für Methyl, und

Y Aryl, das partiell oder vollständig halogeniert sein kann und/oder ein bis zwei Substituenten aus der Gruppe Cyano, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl und C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkyl tragen kann;  
 20 besonders bevorzugt Aryl, das in einer oder beiden ortho-Positionen zur Verknüpfungsstelle halogeniert ist und/oder einen Substituenten aus der Gruppe Cyano, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl und C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkyl tragen kann;  
 25 insbesondere besonders bevorzugt Aryl, das in einer oder beiden ortho-Positionen zur Verknüpfungsstelle halogeniert ist;

30 bedeutet.

Außerordentlich bevorzugt sind die Verbindungen der Formel I.a (entspricht Formel I mit R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup>, R<sup>4</sup> - R<sup>7</sup> = Wasserstoff, R<sup>3</sup> = Methyl), insbesondere die Verbindungen der Formel I.a.1 bis  
 35 I.a.234 der Tabelle 1, wobei die Definitionen der Variablen R<sup>1</sup> bis R<sup>7</sup>, X und Y nicht nur in Kombination miteinander sondern auch jeweils für sich allein betrachtet für die erfindungsgemäßen Verbindungen eine besondere Rolle spielen.

40



I.a

45



Tabelle 1

5

	Nr.	X	R'	R''
	I.a.1	4-Fluorpyrid-3-yl	H	H
	I.a.2	4-Fluorpyrid-3-yl	F	H
	I.a.3	4-Fluorpyrid-3-yl	F	F
10	I.a.4	3-Chlorpyrid-2-yl	H	H
	I.a.5	3-Chlorpyrid-2-yl	F	H
	I.a.6	3-Chlorpyrid-2-yl	F	F
	I.a.7	4-Chlorpyrid-3-yl	H	H
	I.a.8	4-Chlorpyrid-3-yl	F	H
	I.a.9	4-Chlorpyrid-3-yl	F	F
15	I.a.10	4-Brompyrid-3-yl	H	H
	I.a.11	4-Brompyrid-3-yl	F	H
	I.a.12	4-Brompyrid-3-yl	F	F
	I.a.13	2-Methylpyrid-3-yl	H	H
	I.a.14	2-Methylpyrid-3-yl	F	H
20	I.a.15	2-Methylpyrid-3-yl	F	F
	I.a.16	4-Methylpyrid-3-yl	H	H
	I.a.17	4-Methylpyrid-3-yl	F	H
	I.a.18	4-Methylpyrid-3-yl	F	F
	I.a.19	2-Trifluormethylpyrid-3-yl	H	H
	I.a.20	2-Trifluormethylpyrid-3-yl	F	H
25	I.a.21	2-Trifluormethylpyrid-3-yl	F	F
	I.a.22	2-Methoxy-pyrid-3-yl	H	H
	I.a.23	2-Methoxy-pyrid-3-yl	F	H
	I.a.24	2-Methoxy-pyrid-3-yl	F	F
	I.a.25	2,6-Difluorpyrid-3-yl	H	H
30	I.a.26	2,6-Difluorpyrid-3-yl	F	H
	I.a.27	2,6-Difluorpyrid-3-yl	F	F
	I.a.28	2,3-Dichlorpyrid-4-yl	H	H
	I.a.29	2,3-Dichlorpyrid-4-yl	F	H
	I.a.30	2,3-Dichlorpyrid-4-yl	F	F
	I.a.31	2,4-Dichlorpyrid-3-yl	H	H
35	I.a.32	2,4-Dichlorpyrid-3-yl	F	H
	I.a.33	2,4-Dichlorpyrid-3-yl	F	F
	I.a.34	2,6-Dichlorpyrid-3-yl	H	H
	I.a.35	2,6-Dichlorpyrid-3-yl	F	H
	I.a.36	2,6-Dichlorpyrid-3-yl	F	F
40	I.a.37	2,6-Dibrompyrid-3-yl	H	H
	I.a.38	2,6-Dibrompyrid-3-yl	F	H
	I.a.39	2,6-Dibrompyrid-3-yl	F	F
	I.a.40	2,4-Dimethylpyrid-3-yl	H	H
	I.a.41	2,4-Dimethylpyrid-3-yl	F	H
	I.a.42	2,4-Dimethylpyrid-3-yl	F	F
45	I.a.43	2,6-Dimethylpyrid-3-yl	H	H
	I.a.44	2,6-Dimethylpyrid-3-yl	F	H
	I.a.45	2,6-Dimethylpyrid-3-yl	F	F

## 41

	Nr.	X	R'	R''
	I.a.46	2-Fluor-6-methylpyrid-3-yl	H	H
	I.a.47	2-Fluor-6-methylpyrid-3-yl	F	H
	I.a.48	2-Fluor-6-methylpyrid-3-yl	F	F
5	I.a.49	2-Chlor-6-methylpyrid-3-yl	H	H
	I.a.50	2-Chlor-6-methylpyrid-3-yl	F	H
	I.a.51	2-Chlor-6-methylpyrid-3-yl	F	F
	I.a.52	3-Chlor-6-methylpyrid-2-yl	H	H
	I.a.53	3-Chlor-6-methylpyrid-2-yl	F	H
	I.a.54	3-Chlor-6-methylpyrid-2-yl	F	F
10	I.a.55	3-Chlor-5-methylpyrid-4-yl	H	H
	I.a.56	3-Chlor-5-methylpyrid-4-yl	F	H
	I.a.57	3-Chlor-5-methylpyrid-4-yl	F	F
	I.a.58	2-Brom-6-methylpyrid-3-yl	H	H
	I.a.59	2-Brom-6-methylpyrid-3-yl	F	H
15	I.a.60	2-Brom-6-methylpyrid-3-yl	F	F
	I.a.61	2-Methyl-3-chlorpyrid-4-yl	H	H
	I.a.62	2-Methyl-3-chlorpyrid-4-yl	F	H
	I.a.63	2-Methyl-3-chlorpyrid-4-yl	F	F
	I.a.64	2-Methyl-6-chlorpyrid-3-yl	H	H
	I.a.65	2-Methyl-6-chlorpyrid-3-yl	F	H
20	I.a.66	2-Methyl-6-chlorpyrid-3-yl	F	F
	I.a.67	2,4,6-Trichlorpyrid-3-yl	H	H
	I.a.68	2,4,6-Trichlorpyrid-3-yl	F	H
	I.a.69	2,4,6-Trichlorpyrid-3-yl	F	F
	I.a.70	2,4,6-Trimethylpyrid-3yl	H	H
25	I.a.71	2,4,6-Trimethylpyrid-3yl	F	H
	I.a.72	2,4,6-Trimethylpyrid-3yl	F	F
	I.a.73	2-Fluor-4,6-dimethylpyrid-3-yl	H	H
	I.a.74	2-Fluor-4,6-dimethylpyrid-3-yl	F	H
	I.a.75	2-Fluor-4,6-dimethylpyrid-3-yl	F	F
	I.a.76	2-Chlor-4,6-dimethylpyrid-3-yl	H	H
30	I.a.77	2-Chlor-4,6-dimethylpyrid-3-yl	F	H
	I.a.78	2-Chlor-4,6-dimethylpyrid-3-yl	F	F
	I.a.79	5-Chlor-2,3-dimethylpyrid-4-yl	H	H
	I.a.80	5-Chlor-2,3-dimethylpyrid-4-yl	F	H
	I.a.81	5-Chlor-2,3-dimethylpyrid-4-yl	F	F
35	I.a.82	3,5-Dichlor-2-methylpyrid-4-yl	H	H
	I.a.83	3,5-Dichlor-2-methylpyrid-4-yl	F	H
	I.a.84	3,5-Dichlor-2-methylpyrid-4-yl	F	F
	I.a.85	2-Brom-4,6-dimethylpyrid-3-yl	H	H
	I.a.86	2-Brom-4,6-dimethylpyrid-3-yl	F	H
	I.a.87	2-Brom-4,6-dimethylpyrid-3-yl	F	F
40	I.a.88	4-Chlorpyrimidin-5-yl	H	H
	I.a.89	4-Chlorpyrimidin-5-yl	F	H
	I.a.90	4-Chlorpyrimidin-5-yl	F	F
	I.a.91	4,6-Dichlorpyrimidin-5-yl	H	H
	I.a.92	4,6-Dichlorpyrimidin-5-yl	F	H
45	I.a.93	4,6-Dichlorpyrimidin-5-yl	F	F
	I.a.94	4-Methylpyrimidin-5-yl	H	H
	I.a.95	4-Methylpyrimidin-5-yl	F	H
	I.a.96	4-Methylpyrimidin-5-yl	F	F

## 42

Nr.	X	R'	R''	
	I.a.97	4,6-Dimethylpyrimidin-5-yl	H	H
	I.a.98	4,6-Dimethylpyrimidin-5-yl	F	H
	I.a.99	4,6-Dimethylpyrimidin-5-yl	F	F
5	I.a.100	2-Chlorpyrazin-3-yl	H	H
	I.a.101	2-Chlorpyrazin-3-yl	F	H
	I.a.102	2-Chlorpyrazin-3-yl	F	F
	I.a.103	2-Methylpyrazin-3-yl	H	H
	I.a.104	2-Methylpyrazin-3-yl	F	H
	I.a.105	2-Methylpyrazin-3-yl	F	F
10	I.a.106	3-Chlorpyridazin-4-yl	H	H
	I.a.107	3-Chlorpyridazin-4-yl	F	H
	I.a.108	3-Chlorpyridazin-4-yl	F	F
	I.a.109	3-Methylpyridazin-4-yl	H	H
	I.a.110	3-Methylpyridazin-4-yl	F	H
	I.a.111	3-Methylpyridazin-4-yl	F	F
15	I.a.112	2-Chlorfuryl-3-yl	H	H
	I.a.113	2-Chlorfuryl-3-yl	F	H
	I.a.114	2-Chlorfuryl-3-yl	F	F
	I.a.115	2-Methylfuryl-3-yl	H	H
	I.a.116	2-Methylfuryl-3-yl	F	H
20	I.a.117	2-Methylfuryl-3-yl	F	F
	I.a.118	2,5-Dichlorfuryl-3-yl	H	H
	I.a.119	2,5-Dichlorfuryl-3-yl	F	H
	I.a.120	2,5-Dichlorfuryl-3-yl	F	F
	I.a.121	2-Chlor-4-methylfuryl-3-yl	H	H
	I.a.122	2-Chlor-4-methylfuryl-3-yl	F	H
25	I.a.123	2-Chlor-4-methylfuryl-3-yl	F	F
	I.a.124	2-Chlor-4,5-dimethylfuryl-3-yl	H	H
	I.a.125	2-Chlor-4,5-dimethylfuryl-3-yl	F	H
	I.a.126	2-Chlor-4,5-dimethylfuryl-3-yl	F	F
	I.a.127	1,5-Dimethylimidazol-4-yl	H	H
30	I.a.128	1,5-Dimethylimidazol-4-yl	F	H
	I.a.129	1,5-Dimethylimidazol-4-yl	F	F
	I.a.130	1-Methyl-5-Chlorimidazol-4-yl	H	H
	I.a.131	1-Methyl-5-Chlorimidazol-4-yl	F	H
	I.a.132	1-Methyl-5-Chlorimidazol-4-yl	F	F
35	I.a.133	1,2,5-Trimethylimidazol-4-yl	H	H
	I.a.134	1,2,5-Trimethylimidazol-4-yl	F	H
	I.a.135	1,2,5-Trimethylimidazol-4-yl	F	F
	I.a.136	1-Methyl-2,5-dichlorimidazol-4-yl	H	H
	I.a.137	1-Methyl-2,5-dichlorimidazol-4-yl	F	H
	I.a.138	1-Methyl-2,5-dichlorimidazol-4-yl	F	F
40	I.a.139	5-Chloroxazol-4-yl	H	H
	I.a.140	5-Chloroxazol-4-yl	F	H
	I.a.141	5-Chloroxazol-4-yl	F	F
	I.a.142	5-Methyloxazol-4-yl	H	H
	I.a.143	5-Methyloxazol-4-yl	F	H
	I.a.144	5-Methyloxazol-4-yl	F	F
45	I.a.145	5-Chlorisoxazol-4-yl	H	H
	I.a.146	5-Chlorisoxazol-4-yl	F	H
	I.a.147	5-Chlorisoxazol-4-yl	F	F

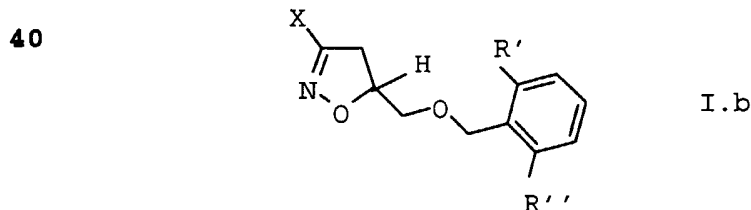
## 43

	Nr.	X	R'	R''
	I.a.148	5-Methylisoxazol-4-yl	H	H
	I.a.149	5-Methylisoxazol-4-yl	F	H
	I.a.150	5-Methylisoxazol-4-yl	F	F
5	I.a.151	5-Chlorthiazol-4-yl	H	H
	I.a.152	5-Chlorthiazol-4-yl	F	H
	I.a.153	5-Chlorthiazol-4-yl	F	F
	I.a.154	5-Methylthiazol-4-yl	H	H
	I.a.155	5-Methylthiazol-4-yl	F	H
	I.a.156	5-Methylthiazol-4-yl	F	F
10	I.a.157	5-Chlorisothiazol-4-yl	H	H
	I.a.158	5-Chlorisothiazol-4-yl	F	H
	I.a.159	5-Chlorisothiazol-4-yl	F	F
	I.a.160	5-Methylisothiazol-4-yl	H	H
	I.a.161	5-Methylisothiazol-4-yl	F	H
15	I.a.162	5-Methylisothiazol-4-yl	F	F
	I.a.163	1,5-Dimethyl-1,2,3-triazol-4-yl	H	H
	I.a.164	1,5-Dimethyl-1,2,3-triazol-4-yl	F	H
	I.a.165	1,5-Dimethyl-1,2,3-triazol-4-yl	F	F
	I.a.166	1-Methyl-4-chlor-1,2,3-triazol-5-yl	H	H
	I.a.167	1-Methyl-4-chlor-1,2,3-triazol-5-yl	F	H
20	I.a.168	1-Methyl-4-chlor-1,2,3-triazol-5-yl	F	F
	I.a.169	1-Methyl-5-chlor-1,2,3-triazol-4-yl	H	H
	I.a.170	1-Methyl-5-chlor-1,2,3-triazol-4-yl	F	H
	I.a.171	1-Methyl-5-chlor-1,2,3-triazol-4-yl	F	F
	I.a.172	3-Chlor-1,2,5-oxadiazol-4-yl	H	H
25	I.a.173	3-Chlor-1,2,5-oxadiazol-4-yl	F	H
	I.a.174	3-Chlor-1,2,5-oxadiazol-4-yl	F	F
	I.a.175	3-Methyl-1,2,5-oxadiazol-4-yl	H	H
	I.a.176	3-Methyl-1,2,5-oxadiazol-4-yl	F	H
	I.a.177	3-Methyl-1,2,5-oxadiazol-4-yl	F	F
	I.a.178	3-Chlor-1,2,4-oxadiazol-5-yl	H	H
30	I.a.179	3-Chlor-1,2,4-oxadiazol-5-yl	F	H
	I.a.180	3-Chlor-1,2,4-oxadiazol-5-yl	F	F
	I.a.181	5-Chlor-1,2,4-oxadiazol-3-yl	H	H
	I.a.182	5-Chlor-1,2,4-oxadiazol-3-yl	F	H
	I.a.183	5-Chlor-1,2,4-oxadiazol-3-yl	F	F
35	I.a.184	3-Methyl-1,2,4-oxadiazol-5-yl	H	H
	I.a.185	3-Methyl-1,2,4-oxadiazol-5-yl	F	H
	I.a.186	3-Methyl-1,2,4-oxadiazol-5-yl	F	F
	I.a.187	5-Methyl-1,2,4-oxadiazol-3-yl	H	H
	I.a.188	5-Methyl-1,2,4-oxadiazol-3-yl	F	H
	I.a.189	5-Methyl-1,2,4-oxadiazol-3-yl	F	F
40	I.a.190	5-Chlor-1,3,4-oxadiazol-2-yl	H	H
	I.a.191	5-Chlor-1,3,4-oxadiazol-2-yl	F	H
	I.a.192	5-Chlor-1,3,4-oxadiazol-2-yl	F	F
	I.a.193	5-Chlor-1,2,3-thiadiazol-4-yl	H	H
	I.a.194	5-Chlor-1,2,3-thiadiazol-4-yl	F	H
45	I.a.195	5-Chlor-1,2,3-thiadiazol-4-yl	F	F
	I.a.196	5-Methyl-1,2,3-thiadiazol-4-yl	H	H
	I.a.197	5-Methyl-1,2,3-thiadiazol-4-yl	F	H
	I.a.198	5-Methyl-1,2,3-thiadiazol-4-yl	F	F

## 44

Nr.	X	R'	R''
I.a.199	4-Cyanopyrid-3-yl	F	F
I.a.200	4-Cyanopyrid-3-yl	H	H
I.a.201	4-Cyanopyrid-3-yl	F	F
5 I.a.202	4-Trifluormethylpyrid-3-yl	F	F
I.a.203	4-Trifluormethylpyrid-3-yl	H	H
I.a.204	4-Trifluormethylpyrid-3-yl	F	H
I.a.205	4-Methoxy-pyrid-3-yl	F	F
I.a.206	4-Methoxy-pyrid-3-yl	H	H
I.a.207	4-Methoxy-pyrid-3-yl	F	H
10 I.a.208	2-Fluoridpyrid-3-yl	F	F
I.a.209	2-Fluoridpyrid-3-yl	H	H
I.a.210	2-Fluoridpyrid-3-yl	F	H
I.a.211	2-Chlorpyrid-3-yl	F	F
I.a.212	2-Chlorpyrid-3-yl	H	H
15 I.a.213	2-Chlorpyrid-3-yl	F	H
I.a.214	2-Brompyrid-3-yl	F	F
I.a.215	2-Brompyrid-3-yl	H	H
I.a.216	2-Brompyrid-3-yl	F	H
I.a.217	2-Cyanopyrid-3-yl	F	F
I.a.218	2-Cyanopyrid-3-yl	H	H
20 I.a.219	2-Cyanopyrid-3-yl	F	H
I.a.220	2-Fluorpyrazin-3-yl	F	F
I.a.221	2-Fluorpyrazin-3-yl	H	H
I.a.222	2-Fluorpyrazin-3-yl	F	H
I.a.223	2-Brompyrazin-3-yl	F	F
25 I.a.224	2-Brompyrazin-3-yl	H	H
I.a.225	2-Brompyrazin-3-yl	F	H
I.a.226	2-Cyanopyrazin-3-yl	F	F
I.a.227	2-Cyanopyrazin-3-yl	H	H
I.a.228	2-Cyanopyrazin-3-yl	F	H
I.a.229	2-Trifluormethylpyrazin-3-yl	F	F
30 I.a.230	2-Trifluormethylpyrazin-3-yl	H	H
I.a.231	2-Trifluormethylpyrazin-3-yl	F	H
I.a.232	2-Methoxy-pyrazin-3-yl	F	F
I.a.233	2-Methoxy-pyrazin-3-yl	H	H
I.a.234	2-Methoxy-pyrazin-3-yl	F	H

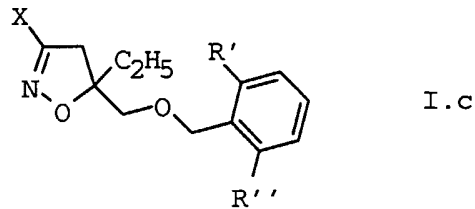
35 Ebenso außerordentlich bevorzugt sind die Verbindungen der Formel I.b, insbesondere die Verbindungen der Formel I.b.1 bis I.b.234, die sich von den entsprechenden Verbindungen der Formel I.a.1 bis I.a.234 dadurch unterscheiden, daß R<sup>3</sup> für Wasserstoff steht.



## 45

Ebenso außerordentlich bevorzugt sind die Verbindungen der Formel I.c, insbesondere die Verbindungen der Formel I.c.1 bis I.c.234, die sich von den entsprechenden Verbindungen der Formel I.a.1 bis I.a.234 dadurch unterscheiden, daß R<sup>3</sup> für Ethyl steht.

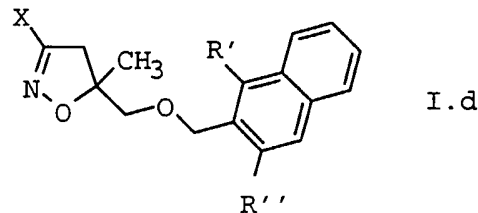
5



10

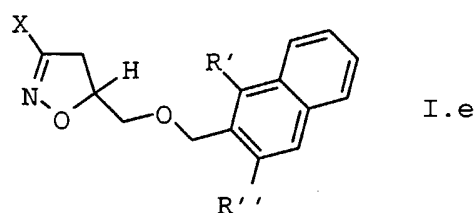
Ebenso außerordentlich bevorzugt sind die Verbindungen der Formel I.d, insbesondere die Verbindungen der Formel I.d.1 bis I.d.234, die sich von den entsprechenden Verbindungen der Formel I.a.1 bis I.a.234 dadurch unterscheiden, daß Y für entsprechend substituiert Naphth-2-yl steht.

20



Ebenso außerordentlich bevorzugt sind die Verbindungen der Formel I.e, insbesondere die Verbindungen der Formel I.e.1 bis I.e.234, die sich von den entsprechenden Verbindungen der Formel I.a.1 bis I.a.234 dadurch unterscheiden, daß R<sup>3</sup> für Wasserstoff und Y für entsprechend substituiert Naphth-2-yl steht.

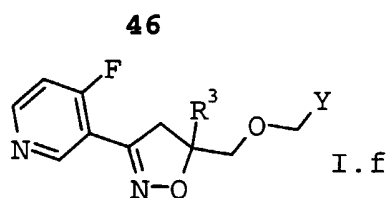
30



35

Ebenfalls außerordentlich bevorzugt sind die Verbindungen der Formel I.f (entspricht Formel I mit X = 4-Fluorpyrid-3-yl und R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup>, R<sup>4</sup> - R<sup>7</sup> = Wasserstoff), insbesondere die Verbindungen der Formel I.f.1 bis I.f.228 der Tabelle 1A, wobei die Definitionen der Variablen R<sup>1</sup> bis R<sup>7</sup>, X und Y nicht nur in Kombination miteinander sondern auch jeweils für sich allein betrachtet für die erfindungsgemäßen Verbindungen eine besondere Rolle spielen.

45



5  
Tabelle 1A

Nr.	R <sup>3</sup>	Y
I. f. 1	H	3-Fluorphenyl
I. f. 2	CH <sub>3</sub>	3-Fluorphenyl
10 I. f. 3	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	3-Fluorphenyl
I. f. 4	H	4-Fluorphenyl
I. f. 5	CH <sub>3</sub>	4-Fluorphenyl
I. f. 6	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	4-Fluorphenyl
I. f. 7	H	2-Chlorphenyl
I. f. 8	CH <sub>3</sub>	2-Chlorphenyl
15 I. f. 9	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	2-Chlorphenyl
I. f. 10	H	3-Chlorphenyl
I. f. 11	CH <sub>3</sub>	3-Chlorphenyl
I. f. 12	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	3-Chlorphenyl
I. f. 13	H	4-Chlorphenyl
20 I. f. 14	CH <sub>3</sub>	4-Chlorphenyl
I. f. 15	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	4-Chlorphenyl
I. f. 16	H	2-Bromphenyl
I. f. 17	CH <sub>3</sub>	2-Bromphenyl
I. f. 18	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	2-Bromphenyl
I. f. 19	H	3-Bromphenyl
25 I. f. 20	CH <sub>3</sub>	3-Bromphenyl
I. f. 21	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	3-Bromphenyl
I. f. 22	H	4-Bromphenyl
I. f. 23	CH <sub>3</sub>	4-Bromphenyl
I. f. 24	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	4-Bromphenyl
30 I. f. 25	H	2-Iodphenyl
I. f. 26	CH <sub>3</sub>	2-Iodphenyl
I. f. 27	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	2-Iodphenyl
I. f. 28	H	2,4-Difluorphenyl
I. f. 29	CH <sub>3</sub>	2,4-Difluorphenyl
I. f. 30	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	2,4-Difluorphenyl
35 I. f. 31	H	3,5-Difluorphenyl
I. f. 32	CH <sub>3</sub>	3,5-Difluorphenyl
I. f. 33	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	3,5-Difluorphenyl
I. f. 34	H	2,6-Dichlorphenyl
I. f. 35	CH <sub>3</sub>	2,6-Dichlorphenyl
40 I. f. 36	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	2,6-Dichlorphenyl
I. f. 37	H	2,4-Dichlorphenyl
I. f. 38	CH <sub>3</sub>	2,4-Dichlorphenyl
I. f. 39	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	2,4-Dichlorphenyl
I. f. 40	H	3,4-Dichlorphenyl
I. f. 41	CH <sub>3</sub>	3,4-Dichlorphenyl
45 I. f. 42	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	3,4-Dichlorphenyl
I. f. 43	H	2,4,6-Trichlorphenyl
I. f. 44	CH <sub>3</sub>	2,4,6-Trichlorphenyl

	I. f. 45	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	2,4,6-Trichlorophenyl
	I. f. 46	H	2,3,5-Trichlorophenyl
	I. f. 47	CH <sub>3</sub>	2,3,5-Trichlorophenyl
	I. f. 48	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	2,3,5-Trichlorophenyl
5	I. f. 49	H	2,3,4,5,6-Pentafluorophenyl
	I. f. 50	CH <sub>3</sub>	2,3,4,5,6-Pentafluorophenyl
	I. f. 51	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	2,3,4,5,6-Pentafluorophenyl
	I. f. 52	H	2-Nitrophenyl
	I. f. 53	CH <sub>3</sub>	2-Nitrophenyl
10	I. f. 54	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	2-Nitrophenyl
	I. f. 55	H	3-Nitrophenyl
	I. f. 56	CH <sub>3</sub>	3-Nitrophenyl
	I. f. 57	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	3-Nitrophenyl
	I. f. 58	H	4-Nitrophenyl
	I. f. 59	CH <sub>3</sub>	4-Nitrophenyl
15	I. f. 60	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	4-Nitrophenyl
	I. f. 61	H	2-Cyanophenyl
	I. f. 62	CH <sub>3</sub>	2-Cyanophenyl
	I. f. 63	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	2-Cyanophenyl
	I. f. 64	H	3-Cyanophenyl
	I. f. 65	CH <sub>3</sub>	3-Cyanophenyl
20	I. f. 66	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	3-Cyanophenyl
	I. f. 67	H	4-Cyanophenyl
	I. f. 68	CH <sub>3</sub>	4-Cyanophenyl
	I. f. 69	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	4-Cyanophenyl
	I. f. 70	H	2-Methylphenyl
25	I. f. 71	CH <sub>3</sub>	2-Methylphenyl
	I. f. 72	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	2-Methylphenyl
	I. f. 73	H	3-Methylphenyl
	I. f. 74	CH <sub>3</sub>	3-Methylphenyl
	I. f. 75	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	3-Methylphenyl
	I. f. 76	H	4-Methylphenyl
30	I. f. 77	CH <sub>3</sub>	4-Methylphenyl
	I. f. 78	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	4-Methylphenyl
	I. f. 79	H	4-Ethylphenyl
	I. f. 80	CH <sub>3</sub>	4-Ethylphenyl
	I. f. 81	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	4-Ethylphenyl
35	I. f. 82	H	2,5-Dimethylphenyl
	I. f. 83	CH <sub>3</sub>	2,5-Dimethylphenyl
	I. f. 84	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	2,5-Dimethylphenyl
	I. f. 85	H	3,4-Dimethylphenyl
	I. f. 86	CH <sub>3</sub>	3,4-Dimethylphenyl
	I. f. 87	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	3,4-Dimethylphenyl
40	I. f. 88	H	2,4-Dimethylphenyl
	I. f. 89	CH <sub>3</sub>	2,4-Dimethylphenyl
	I. f. 90	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	2,4-Dimethylphenyl
	I. f. 91	H	2,4,6-Trimethylphenyl
	I. f. 92	CH <sub>3</sub>	2,4,6-Trimethylphenyl
45	I. f. 93	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	2,4,6-Trimethylphenyl
	I. f. 94	H	2-Trifluormethylphenyl
	I. f. 95	CH <sub>3</sub>	2-Trifluormethylphenyl
	I. f. 96	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	2-Trifluormethylphenyl



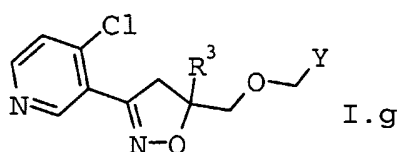
	I. f. 97	H	3-Trifluormethylphenyl
	I. f. 98	CH <sub>3</sub>	3-Trifluormethylphenyl
	I. f. 99	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	3-Trifluormethylphenyl
	I. f. 100	H	4-Trifluormethylphenyl
5	I. f. 101	CH <sub>3</sub>	4-Trifluormethylphenyl
	I. f. 102	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	4-Trifluormethylphenyl
	I. f. 103	H	2-Methoxyphenyl
	I. f. 104	CH <sub>3</sub>	2-Methoxyphenyl
	I. f. 105	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	2-Methoxyphenyl
10	I. f. 106	H	3-Methoxyphenyl
	I. f. 107	CH <sub>3</sub>	3-Methoxyphenyl
	I. f. 108	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	3-Methoxyphenyl
	I. f. 109	H	4-Methoxyphenyl
	I. f. 110	CH <sub>3</sub>	4-Methoxyphenyl
	I. f. 111	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	4-Methoxyphenyl
15	I. f. 112	H	3,4,5-Trimethoxyphenyl
	I. f. 113	CH <sub>3</sub>	3,4,5-Trimethoxyphenyl
	I. f. 114	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	3,4,5-Trimethoxyphenyl
	I. f. 115	H	3-Trifluormethoxyphenyl
	I. f. 116	CH <sub>3</sub>	3-Trifluormethoxyphenyl
	I. f. 117	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	3-Trifluormethoxyphenyl
20	I. f. 118	H	2-Difluormethoxyphenyl
	I. f. 119	CH <sub>3</sub>	2-Difluormethoxyphenyl
	I. f. 120	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	2-Difluormethoxyphenyl
	I. f. 121	H	2-(Ethoxycarbonylmethoxy)phenyl
	I. f. 122	CH <sub>3</sub>	2-(Ethoxycarbonylmethoxy)phenyl
25	I. f. 123	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	2-(Ethoxycarbonylmethoxy)phenyl
	I. f. 124	H	4-(Phenyl)phenyl
	I. f. 125	CH <sub>3</sub>	4-(Phenyl)phenyl
	I. f. 126	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	4-(Phenyl)phenyl
	I. f. 127	H	3-Phenoxyphenyl
	I. f. 128	CH <sub>3</sub>	3-Phenoxyphenyl
30	I. f. 129	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	3-Phenoxyphenyl
	I. f. 130	H	2-Methyl-3-(phenyl)phenyl
	I. f. 131	CH <sub>3</sub>	2-Methyl-3-(phenyl)phenyl
	I. f. 132	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	2-Methyl-3-(phenyl)phenyl
	I. f. 133	H	3-Phenoxyphenyl
35	I. f. 134	CH <sub>3</sub>	3-Phenoxyphenyl
	I. f. 135	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	3-Phenoxyphenyl
	I. f. 136	H	3-(Phenylcarbonyl)phenyl
	I. f. 137	CH <sub>3</sub>	3-(Phenylcarbonyl)phenyl
	I. f. 138	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	3-(Phenylcarbonyl)phenyl
	I. f. 139	H	4-(Methoxycarbonyl)phenyl
40	I. f. 140	CH <sub>3</sub>	4-(Methoxycarbonyl)phenyl
	I. f. 141	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	4-(Methoxycarbonyl)phenyl
	I. f. 142	H	4-(Isopropoxycarbonyl)phenyl
	I. f. 143	CH <sub>3</sub>	4-(Isopropoxycarbonyl)phenyl
	I. f. 144	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	4-(Isopropoxycarbonyl)phenyl
45	I. f. 145	H	2-Chlor-6-nitrophenyl
	I. f. 146	CH <sub>3</sub>	2-Chlor-6-nitrophenyl
	I. f. 147	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	2-Chlor-6-nitrophenyl
	I. f. 148	H	3-Chlor-4-methoxyphenyl

	I.f.149	CH <sub>3</sub>	3-Chlor-4-methoxyphenyl
	I.f.150	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	3-Chlor-4-methoxyphenyl
	I.f.151	H	3-Chlor-4-ethoxyphenyl
	I.f.152	CH <sub>3</sub>	3-Chlor-4-ethoxyphenyl
5	I.f.153	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	3-Chlor-4-ethoxyphenyl
	I.f.154	H	2-Ethyl-5-nitrophenyl
	I.f.155	CH <sub>3</sub>	2-Ethyl-5-nitrophenyl
	I.f.156	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	2-Ethyl-5-nitrophenyl
	I.f.157	H	2,3-Dichlor-4-methoxyphenyl
	I.f.158	CH <sub>3</sub>	2,3-Dichlor-4-methoxyphenyl
10	I.f.159	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	2,3-Dichlor-4-methoxyphenyl
	I.f.160	H	2,3-Dichlor-4-isopropoxyphenyl
	I.f.161	CH <sub>3</sub>	2,3-Dichlor-4-isopropoxyphenyl
	I.f.162	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	2,3-Dichlor-4-isopropoxyphenyl
	I.f.163	H	2,4-Dichlor-6-nitrophenyl
15	I.f.164	CH <sub>3</sub>	2,4-Dichlor-6-nitrophenyl
	I.f.165	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	2,4-Dichlor-6-nitrophenyl
	I.f.166	H	2-Chlor-3-methyl-4-(methylsulfonyl)phenyl
	I.f.167	CH <sub>3</sub>	2-Chlor-3-methyl-4-(methylsulfonyl)phenyl
20	I.f.168	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	2-Chlor-3-methyl-4-(methylsulfonyl)phenyl
	I.f.169	H	Benzo[1,4]dioxan-6-yl
	I.f.170	CH <sub>3</sub>	Benzo[1,4]dioxan-6-yl
	I.f.171	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	Benzo[1,4]dioxan-6-yl
	I.f.172	H	Benzo[1,3]dioxolan-5-yl
25	I.f.173	CH <sub>3</sub>	Benzo[1,3]dioxolan-5-yl
	I.f.174	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	Benzo[1,3]dioxolan-5-yl
	I.f.175	H	2,3-Dihydrobenzofuran-2-yl
	I.f.176	CH <sub>3</sub>	2,3-Dihydrobenzofuran-2-yl
	I.f.177	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	2,3-Dihydrobenzofuran-2-yl
30	I.f.178	H	Benzimidazol-2-yl
	I.f.179	CH <sub>3</sub>	Benzimidazol-2-yl
	I.f.180	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	Benzimidazol-2-yl
	I.f.181	H	Naphth-1-yl
	I.f.182	CH <sub>3</sub>	Naphth-1-yl
	I.f.183	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	Naphth-1-yl
35	I.f.184	H	2-Methylnapht-1-yl
	I.f.185	CH <sub>3</sub>	2-Methylnapht-1-yl
	I.f.186	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	2-Methylnapht-1-yl
	I.f.187	H	Anthracen-9-yl
	I.f.188	CH <sub>3</sub>	Anthracen-9-yl
40	I.f.189	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	Anthracen-9-yl
	I.f.190	H	5-Chlor-1-methylpyrazol-4-yl
	I.f.191	CH <sub>3</sub>	5-Chlor-1-methylpyrazol-4-yl
	I.f.192	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	5-Chlor-1-methylpyrazol-4-yl
	I.f.193	H	5-Chlor-1-methyl-3-trifluoromethylpyrazol-4-yl
45	I.f.194	CH <sub>3</sub>	5-Chlor-1-methyl-3-trifluoromethylpyrazol-4-yl

	I.f.195	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	5-Chlor-1-methyl-3-trifluormethylpyrazol-4-yl
	I.f.196	H	Thiazol-4-yl
	I.f.197	CH <sub>3</sub>	Thiazol-4-yl
5	I.f.198	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	Thiazol-4-yl
	I.f.199	H	2-Chlorthiazol-5-yl
	I.f.200	CH <sub>3</sub>	2-Chlorthiazol-5-yl
	I.f.201	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	2-Chlorthiazol-5-yl
	I.f.202	H	3-Ethylisoxazol-5-yl
	I.f.203	CH <sub>3</sub>	3-Ethylisoxazol-5-yl
10	I.f.204	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	3-Ethylisoxazol-5-yl
	I.f.205	H	3-nPropylisoxazol-5-yl
	I.f.206	CH <sub>3</sub>	3-nPropylisoxazol-5-yl
	I.f.207	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	3-nPropylisoxazol-5-yl
	I.f.208	H	3-(Methoxymethyl)isoxazol-5-yl
	I.f.209	CH <sub>3</sub>	3-(Methoxymethyl)isoxazol-5-yl
15	I.f.210	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	3-(Methoxymethyl)isoxazol-5-yl
	I.f.211	H	5-Methoxymethyl-1,3,4-thiadiazol-2-yl
	I.f.212	CH <sub>3</sub>	5-Methoxymethyl-1,3,4-thiadiazol-2-yl
20	I.f.213	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	5-Methoxymethyl-1,3,4-thiadiazol-2-yl
	I.f.214	H	Pyrid-2-yl
	I.f.215	CH <sub>3</sub>	Pyrid-2-yl
	I.f.216	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	Pyrid-2-yl
	I.f.217	H	Pyrid-3-yl
25	I.f.218	CH <sub>3</sub>	Pyrid-3-yl
	I.f.219	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	Pyrid-3-yl
	I.f.220	H	Pyrid-4-yl
	I.f.221	CH <sub>3</sub>	Pyrid-4-yl
	I.f.222	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	Pyrid-4-yl
30	I.f.223	H	2-Chlorpyrid-5-yl
	I.f.224	CH <sub>3</sub>	2-Chlorpyrid-5-yl
	I.f.225	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	2-Chlorpyrid-5-yl
	I.f.226	H	5-Ethyl-3-(ethoxycarbonyl)pyrid-2-yl
	I.f.227	CH <sub>3</sub>	5-Ethyl-3-(ethoxycarbonyl)pyrid-2-yl
35	I.f.228	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	5-Ethyl-3-(ethoxycarbonyl)pyrid-2-yl

Ebenso außerordentlich bevorzugt sind die Verbindungen der Formel I.g, insbesondere die Verbindungen der Formel I.g.1 bis I.g.228, die sich von den entsprechenden Verbindungen der Formel I.f.1 bis I.f.228 dadurch unterscheiden, daß X für 4-Chlorpyrid-3-yl steht.

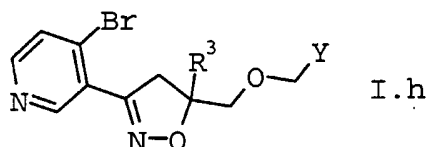
45



## 51

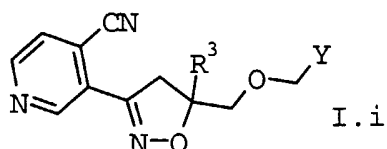
Ebenso außerordentlich bevorzugt sind die Verbindungen der Formel I.h, insbesondere die Verbindungen der Formel I.h.1 bis I.h.228, die sich von den entsprechenden Verbindungen der Formel I.f.1 bis 5 I.f.228 dadurch unterscheiden, daß X für 4-Brompyrid-3-yl steht.

10



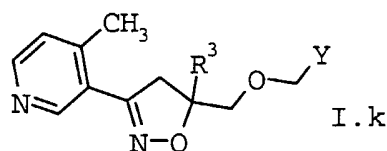
Ebenso außerordentlich bevorzugt sind die Verbindungen der Formel I.i, insbesondere die Verbindungen der Formel I.i.1 bis I.i.228, die sich von den entsprechenden Verbindungen der Formel I.f.1 bis 15 I.f.228 dadurch unterscheiden, daß X für 4-Cyanopyrid-3-yl steht.

20



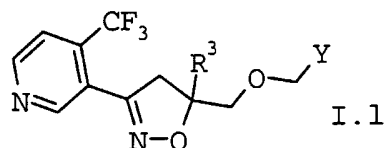
Ebenso außerordentlich bevorzugt sind die Verbindungen der Formel I.k, insbesondere die Verbindungen der Formel I.k.1 bis I.k.228, die sich von den entsprechenden Verbindungen der Formel I.f.1 bis 25 I.f.228 dadurch unterscheiden, daß X für 4-Methylpyrid-3-yl steht.

30



Ebenso außerordentlich bevorzugt sind die Verbindungen der Formel I.l, insbesondere die Verbindungen der Formel I.l.1 bis I.l.228, die sich von den entsprechenden Verbindungen der Formel I.f.1 bis 35 I.f.228 dadurch unterscheiden, daß X für 4-Trifluormethylpyrid-3-yl steht.

40

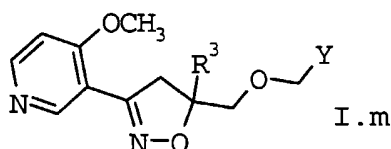


45

## 52

Ebenso außerordentlich bevorzugt sind die Verbindungen der Formel I.m, insbesondere die Verbindungen der Formel I.m.1 bis I.m.228, die sich von den entsprechenden Verbindungen der Formel I.f.1 bis I.f.228 dadurch unterscheiden, daß X für 4-Methoxy-pyrid-3-yl 5 steht.

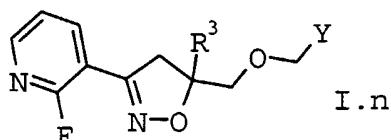
10



15

Ebenso außerordentlich bevorzugt sind die Verbindungen der Formel I.n, insbesondere die Verbindungen der Formel I.n.1 bis I.n.228, die sich von den entsprechenden Verbindungen der Formel I.f.1 bis I.f.228 dadurch unterscheiden, daß X für 2-Fluor-pyrid-3-yl steht.

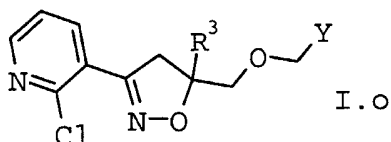
20



25

Ebenso außerordentlich bevorzugt sind die Verbindungen der Formel I.o, insbesondere die Verbindungen der Formel I.o.1 bis I.o.228, die sich von den entsprechenden Verbindungen der Formel I.f.1 bis I.f.228 dadurch unterscheiden, daß X für 2-Chlor-pyrid-3-yl steht.

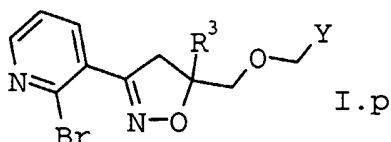
30



35

Ebenso außerordentlich bevorzugt sind die Verbindungen der Formel I.p, insbesondere die Verbindungen der Formel I.p.1 bis I.p.228, die sich von den entsprechenden Verbindungen der Formel I.f.1 bis I.f.228 dadurch unterscheiden, daß X für 2-Brom-pyrid-3-yl steht.

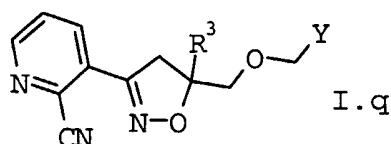
40



45

Ebenso außerordentlich bevorzugt sind die Verbindungen der Formel I.q, insbesondere die Verbindungen der Formel I.q.1 bis I.q.228, die sich von den entsprechenden Verbindungen der Formel I.f.1 bis I.f.228 dadurch unterscheiden, daß X für 2-Cyanopyrid-3-yl steht.

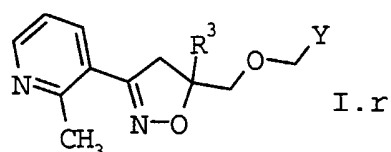
53



5

Ebenso außerordentlich bevorzugt sind die Verbindungen der Formel I.r, insbesondere die Verbindungen der Formel I.r.1 bis I.r.228, die sich von den entsprechenden Verbindungen der Formel I.f.1 bis I.f.228 dadurch unterscheiden, daß X für 2-Methylpyrid-3-yl steht.

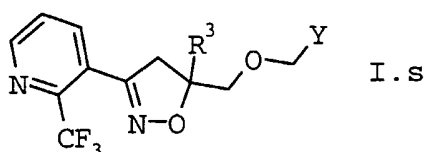
10



15

Ebenso außerordentlich bevorzugt sind die Verbindungen der Formel I.s, insbesondere die Verbindungen der Formel I.s.1 bis I.s.228, die sich von den entsprechenden Verbindungen der Formel I.f.1 bis I.f.228 dadurch unterscheiden, daß X für 2-Trifluormethylpyrid-3-yl steht.

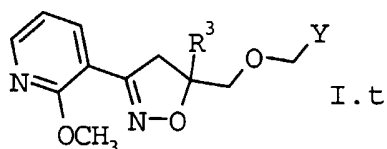
20



25

Ebenso außerordentlich bevorzugt sind die Verbindungen der Formel I.t, insbesondere die Verbindungen der Formel I.t.1 bis I.t.228, die sich von den entsprechenden Verbindungen der Formel I.f.1 bis I.f.228 dadurch unterscheiden, daß X für 2-Methoxypyrid-3-yl steht.

30



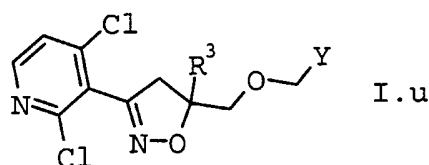
35

Ebenso außerordentlich bevorzugt sind die Verbindungen der Formel I.u, insbesondere die Verbindungen der Formel I.u.1 bis I.u.228, die sich von den entsprechenden Verbindungen der Formel I.f.1 bis I.f.228 dadurch unterscheiden, daß X für 2,4-Dichlorpyrid-3-yl steht.

40

45

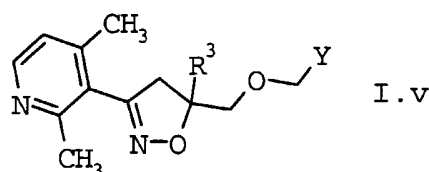
54



5

Ebenso außerordentlich bevorzugt sind die Verbindungen der Formel I.v, insbesondere die Verbindungen der Formel I.v.1 bis I.v.228, die sich von den entsprechenden Verbindungen der Formel I.f.1 bis I.f.228 dadurch unterscheiden, daß X für 2,4-Dimethylpyrid-3-yl

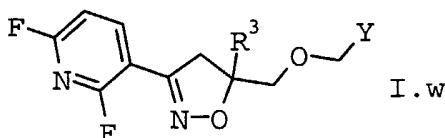
10 steht.



15

Ebenso außerordentlich bevorzugt sind die Verbindungen der Formel I.w, insbesondere die Verbindungen der Formel I.w.1 bis I.w.228, die sich von den entsprechenden Verbindungen der Formel I.f.1 bis I.f.228 dadurch unterscheiden, daß X für 2,6-Difluorpyrid-3-yl

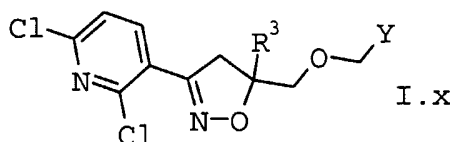
20 steht.



25

Ebenso außerordentlich bevorzugt sind die Verbindungen der Formel I.x, insbesondere die Verbindungen der Formel I.x.1 bis I.x.228, die sich von den entsprechenden Verbindungen der Formel I.f.1 bis I.f.228 dadurch unterscheiden, daß X für 2,6-Dichlorpyrid-3-yl

30 steht.



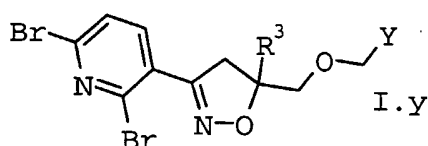
35

Ebenso außerordentlich bevorzugt sind die Verbindungen der Formel I.y, insbesondere die Verbindungen der Formel I.y.1 bis I.y.228, die sich von den entsprechenden Verbindungen der Formel I.f.1 bis I.f.228 dadurch unterscheiden, daß X für 2,6-Dibrompyrid-3-yl

40 steht.

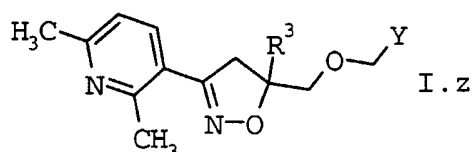
45

55



5 Ebenso außerordentlich bevorzugt sind die Verbindungen der Formel I.z, insbesondere die Verbindungen der Formel I.z.1 bis I.z.228, die sich von den entsprechenden Verbindungen der Formel I.f.1 bis I.f.228 dadurch unterscheiden, daß X für 2,6-Dimethylpyrid-3-yl steht.

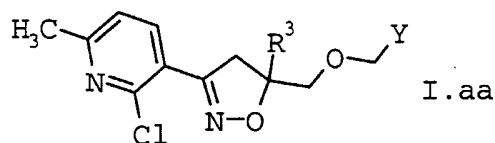
10



15

Ebenso außerordentlich bevorzugt sind die Verbindungen der Formel I.aa, insbesondere die Verbindungen der Formel I.aa.1 bis I.aa.228, die sich von den entsprechenden Verbindungen der Formel I.f.1 bis I.f.228 dadurch unterscheiden, daß X für 2-Chlor-6-Methylpyrid-3-yl steht.

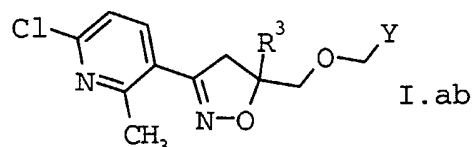
20



25

Ebenso außerordentlich bevorzugt sind die Verbindungen der Formel I.ab, insbesondere die Verbindungen der Formel I.ab.1 bis I.ab.228, die sich von den entsprechenden Verbindungen der Formel I.f.1 bis I.f.228 dadurch unterscheiden, daß X für 6-Chlor-2-Methylpyrid-3-yl steht.

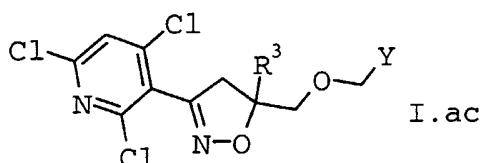
30



35

Ebenso außerordentlich bevorzugt sind die Verbindungen der Formel I.ac, insbesondere die Verbindungen der Formel I.ac.1 bis I.ac.228, die sich von den entsprechenden Verbindungen der Formel I.f.1 bis I.f.228 dadurch unterscheiden, daß X für 2,4,6-Trichlorpyrid-3-yl steht.

40



45

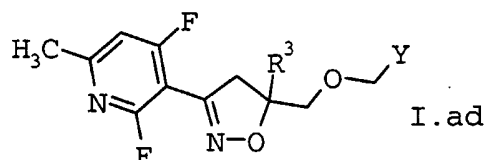


## 56

Ebenso außerordentlich bevorzugt sind die Verbindungen der Formel I.ad, insbesondere die Verbindungen der Formel I.ad.1 bis I.ad.228, die sich von den entsprechenden Verbindungen der Formel I.f.1 bis I.f.228 dadurch unterscheiden, daß X für

5 2,4-Difluor-6-methylpyrid-3-yl steht.

10

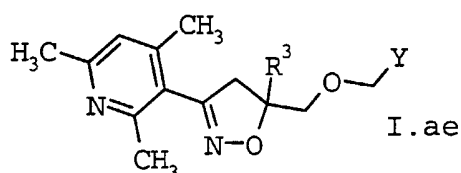


15

Ebenso außerordentlich bevorzugt sind die Verbindungen der Formel I.ae, insbesondere die Verbindungen der Formel I.ae.1 bis I.ae.228, die sich von den entsprechenden Verbindungen der Formel I.f.1 bis I.f.228 dadurch unterscheiden, daß X für

15 2,4,6-Trime-thylpyrid-3-yl steht.

20

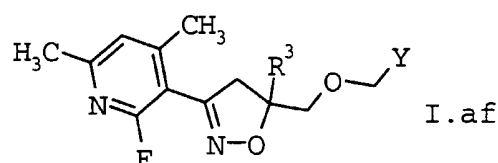


25

Ebenso außerordentlich bevorzugt sind die Verbindungen der Formel I.af, insbesondere die Verbindungen der Formel I.af.1 bis I.af.228, die sich von den entsprechenden Verbindungen der Formel I.f.1 bis I.f.228 dadurch unterscheiden, daß X für

25 4,6-Dimethyl-2-fluor-pyrid-3-yl steht.

30

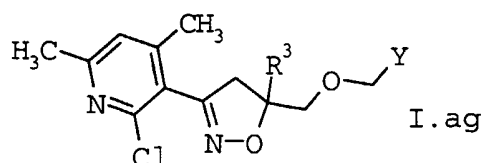


35

Ebenso außerordentlich bevorzugt sind die Verbindungen der Formel I.ag, insbesondere die Verbindungen der Formel I.ag.1 bis I.ag.228, die sich von den entsprechenden Verbindungen der Formel I.f.1 bis I.f.228 dadurch unterscheiden, daß X für

35 2-Chlor-4,6-dimethylpyrid-3-yl steht.

40

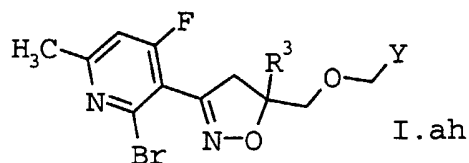


45

## 57

Ebenso außerordentlich bevorzugt sind die Verbindungen der Formel I.ah, insbesondere die Verbindungen der Formel I.ah.1 bis I.ah.228, die sich von den entsprechenden Verbindungen der Formel I.f.1 bis I.f.228 dadurch unterscheiden, daß X für 2-Brom-4-Fluor-6-methylpyrid-3-yl steht.

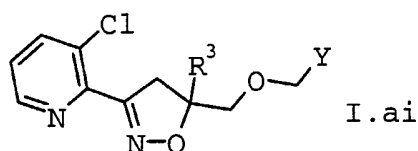
10



15

Ebenso außerordentlich bevorzugt sind die Verbindungen der Formel I.ai, insbesondere die Verbindungen der Formel I.ai.1 bis I.ai.228, die sich von den entsprechenden Verbindungen der Formel I.f.1 bis I.f.228 dadurch unterscheiden, daß X für 3-Chlorpyrid-2-yl steht.

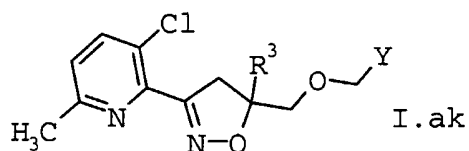
20



25

Ebenso außerordentlich bevorzugt sind die Verbindungen der Formel I.ak, insbesondere die Verbindungen der Formel I.ak.1 bis I.ak.228, die sich von den entsprechenden Verbindungen der Formel I.f.1 bis I.f.228 dadurch unterscheiden, daß X für 3-Chlor-6-methylpyrid-2-yl steht.

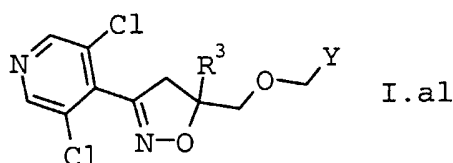
30



35

Ebenso außerordentlich bevorzugt sind die Verbindungen der Formel I.al, insbesondere die Verbindungen der Formel I.al.1 bis I.al.228, die sich von den entsprechenden Verbindungen der Formel I.f.1 bis I.f.228 dadurch unterscheiden, daß X für 3,5-Dichlorpyrid-4-yl steht.

40

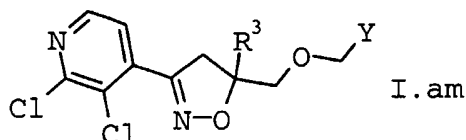


45

## 58

Ebenso außerordentlich bevorzugt sind die Verbindungen der Formel I.am, insbesondere die Verbindungen der Formel I.am.1 bis I.am.228, die sich von den entsprechenden Verbindungen der Formel I.f.1 bis I.f.228 dadurch unterscheiden, daß X für 2,3-Dichlorpyrid-4-yl steht.

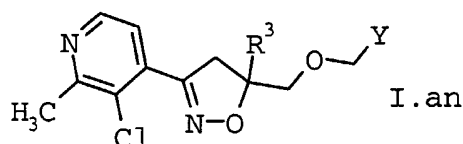
10



15

Ebenso außerordentlich bevorzugt sind die Verbindungen der Formel I.an, insbesondere die Verbindungen der Formel I.an.1 bis I.an.228, die sich von den entsprechenden Verbindungen der Formel I.f.1 bis I.f.228 dadurch unterscheiden, daß X für 3-Chlor-2-methylpyrid-4-yl steht.

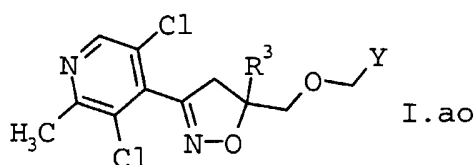
20



25

Ebenso außerordentlich bevorzugt sind die Verbindungen der Formel I.ao, insbesondere die Verbindungen der Formel I.ao.1 bis I.ao.228, die sich von den entsprechenden Verbindungen der Formel I.f.1 bis I.f.228 dadurch unterscheiden, daß X für 3,5-Dichlor-2-methylpyrid-4-yl steht.

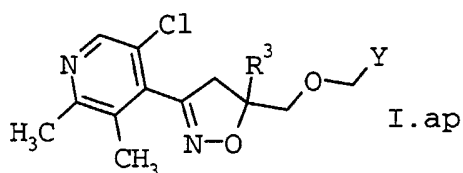
30



35

Ebenso außerordentlich bevorzugt sind die Verbindungen der Formel I.ap, insbesondere die Verbindungen der Formel I.ap.1 bis I.ap.228, die sich von den entsprechenden Verbindungen der Formel I.f.1 bis I.f.228 dadurch unterscheiden, daß X für 5-Chlor-2,3-dimethylpyrid-4-yl steht.

40

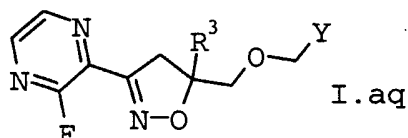


45

## 59

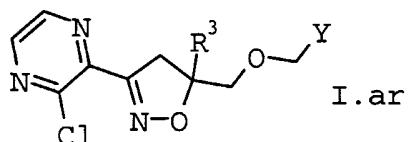
Ebenso außerordentlich bevorzugt sind die Verbindungen der Formel I.aq, insbesondere die Verbindungen der Formel I.aq.1 bis I.aq.228, die sich von den entsprechenden Verbindungen der Formel I.f.1 bis I.f.228 dadurch unterscheiden, daß X für 2-Fluorpyrazin-3-yl steht.

10



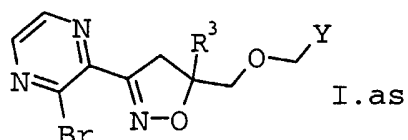
Ebenso außerordentlich bevorzugt sind die Verbindungen der Formel I.ar, insbesondere die Verbindungen der Formel I.ar.1 bis I.ar.228, die sich von den entsprechenden Verbindungen der Formel I.f.1 bis I.f.228 dadurch unterscheiden, daß X für 2-Chlorpyrazin-3-yl steht.

20



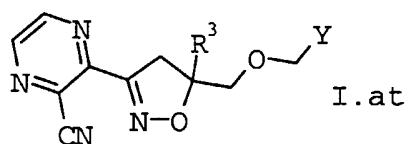
Ebenso außerordentlich bevorzugt sind die Verbindungen der Formel I.as, insbesondere die Verbindungen der Formel I.as.1 bis I.as.228, die sich von den entsprechenden Verbindungen der Formel I.f.1 bis I.f.228 dadurch unterscheiden, daß X für 2-Brompyrazin-3-yl steht.

30



Ebenso außerordentlich bevorzugt sind die Verbindungen der Formel I.at, insbesondere die Verbindungen der Formel I.at.1 bis I.at.228, die sich von den entsprechenden Verbindungen der Formel I.f.1 bis I.f.228 dadurch unterscheiden, daß X für 2-Cyanopyrazin-3-yl steht.

40

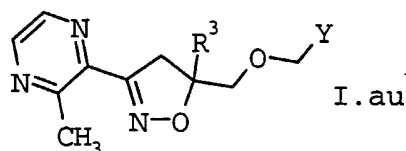


45

## 60

Ebenso außerordentlich bevorzugt sind die Verbindungen der Formel I.au, insbesondere die Verbindungen der Formel I.au.1 bis I.au.228, die sich von den entsprechenden Verbindungen der Formel I.f.1 bis I.f.228 dadurch unterscheiden, daß X für 2-Methylpyrazin-3-yl steht.

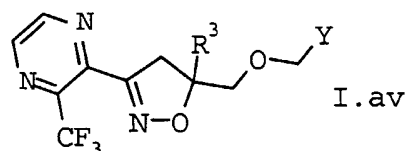
10



15

Ebenso außerordentlich bevorzugt sind die Verbindungen der Formel I.av, insbesondere die Verbindungen der Formel I.av.1 bis I.av.228, die sich von den entsprechenden Verbindungen der Formel I.f.1 bis I.f.228 dadurch unterscheiden, daß X für 2-Trifluormethylpyrazin-3-yl steht.

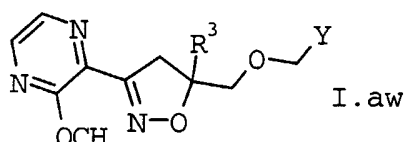
20



25

Ebenso außerordentlich bevorzugt sind die Verbindungen der Formel I.aw, insbesondere die Verbindungen der Formel I.aw.1 bis I.aw.228, die sich von den entsprechenden Verbindungen der Formel I.f.1 bis I.f.228 dadurch unterscheiden, daß X für 2-Methoxy-pyrazin-3-yl steht.

30



35

Die 3-heteroarylsubstituierten Isoxazoline der Formel I sind auf verschiedene Art und Weise erhältlich, beispielsweise nach folgenden Verfahren:

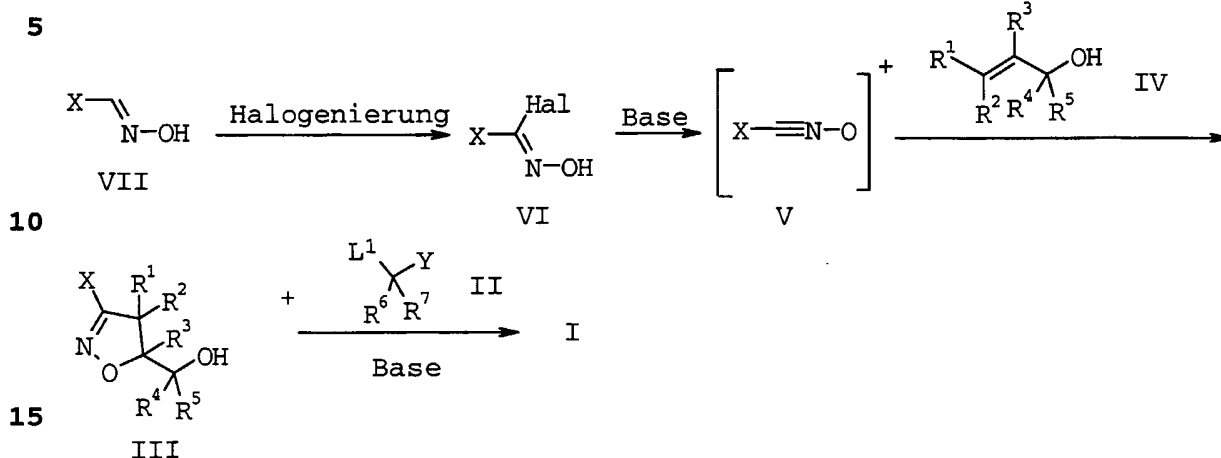
## 40 Verfahren A

Ein Aldoxim der Formel VII wird über das entsprechende Hydroxamsäurehalogenid der Formel VI zu einem Nitriloxid der Formel V umgesetzt. Das Nitriloxid der Formel V reagiert mit einem Allylalkohol der Formel IV zu einem 5-Hydroxymethylisoxazolin der Formel III. Dieses wird anschließend mit einem Arylmethyl-derivat der

45

## 61

Formel II zum 3-heteroarylsubstituierten Isoxazolin der Formel I verethert:



L<sup>1</sup> in Formel II steht für eine nucleophil verdrängbare Abgangsgruppe wie Halogen (z.B. Chlor, Brom oder Iod), Aryl-,

**20** C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkylsulfonyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkylsulfonyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkylsulfonyloxy oder C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkylsulfonyloxy, wie z.B. Toluoylsulfonyl oder Trifluormethylsulfonyloxy, oder eine andere äquivalente Abgangsgruppe.

**25** Hal in Formel VI steht für Halogen, bevorzugt Chlor oder Brom, sehr bevorzugt Brom.

Die Umsetzung des 5-Hydroxymethylisoxazolins der Formel III mit einem Arylmethylderivat der Formel II in Gegenwart einer Base zum

**30** 3-heteroarylsubstituierten Isoxazolin der Formel I erfolgt üblicherweise bei Temperaturen von 0°C bis 120°C, vorzugsweise 10°C bis 80°C, in einem inerten organischen Lösungsmittel in Gegenwart einer Base [vgl. EP-0 334 120].

**35** Geeignete aprotische Lösungsmittel sind Ether wie Diethylether, Diisopropylether, tert.-Butylmethylether, Dioxan, Anisol und Tetrahydrofuran, sowie Dimethylsulfoxid, Dimethylformamid und Dimethylacetamid, besonders bevorzugt Diethylether, tert.-Butylmethylether, Dioxan, und Tetrahydrofuran.

**40** Es können auch Gemische der genannten Lösungsmittel verwendet werden.

Als Basen kommen allgemein anorganische Verbindungen wie Alkali-

**45** metall- und Erdalkalimetallhydroxide wie Lithiumhydroxid, Natriumhydroxid, Kaliumhydroxid und Calciumhydroxid, Alkalimetall- und Erdalkalimetallhydride wie Lithiumhydrid, Natrium-

## 62

hydrid, Kaliumhydrid und Calciumhydrid, Alkalimetallamide wie Lithiumamid, Natriumamid und Kaliumamid, Alkalimetall- und Erdalkalimetallcarbonate wie Lithiumcarbonat, Natrimcarbonat, Kaliumcarbonat und Calciumcarbonat außerdem organische Basen, z.B. tertiäre Amine wie Trimethylamin, Triethylamin, Diisopropylethylamin und N-Methylpiperidin, Pyridin, substituierte Pyridine wie Colloidin, Lutidin und 4-Dimethylaminopyridin sowie bicyclische Amine in Betracht.

- 10 Die Basen werden im allgemeinen in katalytischen Mengen eingesetzt, sie können aber auch äquimolar, im Überschuß oder gegebenenfalls als Lösungsmittel verwendet werden.

Die Edukte werden im allgemeinen in äquimolaren Mengen miteinander umgesetzt. Es kann vorteilhaft sein, II in einem Überschuß bezogen auf III einzusetzen.

Die Aufarbeitung und Isolierung der Produkte kann in an sich bekannter Weise erfolgen.

20

Die für die Herstellung der 3-heteroarylsubstituierten Isoxazoline der Formel I benötigten Arylmethyl-derivate der Formel II sind in der Literatur bekannt [vgl. Organikum, 1979, S 213.f., 413f.] oder können gemäß der zitierten Literatur hergestellt werden.

Die für die Herstellung der 5-Hydroxymethylisoxozoline der Formel III benötigten Nitriloxide der Formel V können gemäß der Literatur in situ aus den entsprechenden Aldoximen der Formel VII über die Stufe des Hydroxamsäurehalogenids der Formel VI hergestellt werden [vgl. Houben-Weyl, Methoden der organischen Chemie, Bd. E 5, 1985, S. 1591 ff. und dort zitierte Literatur] oder sind gemäß der zitierten Literatur bekannt.

35 In der Regel wird das Aldoxim der Formel VII zusammen mit dem Allylalkohol der Formel IV vorgelegt, mit einem Halogenierungsmittel ggf. unter Basenzugabe entsteht das entsprechende Hydroxomsäurechlorid der Formel VI, welches durch weitere Basenzugabe zum Nitriloxid der Formel V umgesetzt wird. Das so generierte Nitriloxid der Formel V reagiert dann mit dem am Anfang mit der Reaktionsmischung vorgelegten Allylalkohol der Formel IV zu dem 5-Hydroxymethylisoxozolin der Formel III.

45 Des weiteren kann auch das Aldoxim der Formel VIII zunächst zum Hydroxomsäurechlorid der Formel VI halogeniert werden, anschließend werden der Allylalkohol der Formel IV und Base zugegeben. Das so generierte Nitriloxid der Formel V reagiert dann mit dem

## 63

Allylkohol der Formel IV zu dem 5-Hydroxymethylisoxozolin der Formel III.

Die Umsetzung des Nitriloxids der Formel V mit einem Allylkohol  
5 der Formel IV erfolgt üblicherweise bei Temperaturen von -30°C bis 80°C, vorzugsweise -10°C bis 20°C, in einem inerten organischen Lösungsmittel [vgl. Houben-Weyl, Methoden der organischen Chemie, Bd. E 5, 1985, 1607 ff. und dort zitierte Literatur].

- 10 Geeignete Lösungsmittel sind aliphatische Kohlenwasserstoffe wie Pentan, Hexan, Cyclohexan und Gemische von C<sub>5</sub>-C<sub>8</sub>-Alkanen, aromatische Kohlenwasserstoffe wie Toluol, o-, m- und p-Xylol, halogenierte Kohlenwasserstoffe wie Methylenchlorid, Chloroform und Chlorbenzol, Ether wie Diethylether, Diisopropylether, tert.-  
15 Butylmethylether, Dioxan, Anisol und Tetrahydrofuran, Nitrile wie Acetonitril und Propionitril, Ketone wie Aceton, Methyl-ethylketon, Diethylketon und tert.-Butylmethylketon, Dimethylsulfoxid, Dimethylformamid und Dimethylacetamid.
- 20 Es können auch Gemische der genannten Lösungsmittel verwendet werden.

Die Edukte werden im allgemeinen in äquimolaren Mengen miteinander umgesetzt. Es kann vorteilhaft sein, IV in einem Überschuß  
25 bezogen auf V einzusetzen.

Die Reaktionsgemische werden in üblicher Weise aufgearbeitet, z.B. durch Mischen mit Wasser, Trennung der Phasen und gegebenenfalls chromatographische Reinigung der Rohprodukte. Die Zwischen-  
30 und Endprodukte fallen z.T. in Form zäher Öle an, die unter vermindertem Druck und bei mäßig erhöhter Temperatur von flüchtigen Anteilen befreit oder gereinigt werden. Sofern die Zwischen- und Endprodukte als Feststoffe erhalten werden, kann die Reinigung auch durch Umkristallisieren oder Digerieren erfolgen.

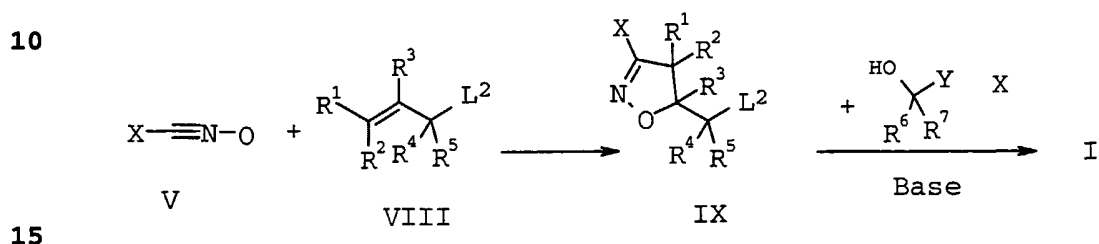
35 Die entsprechenden Aldoxime der Formel VII sind in der Literatur bekannt [vgl. Houben-Weyl, Methoden der organischen Chemie, Bd. 10/4, 1968, S. 55 ff.] oder können gemäß der zitierten Literatur aus den entsprechenden Aldehyden hergestellt werden.

40 Die für die Herstellung der 5-Hydroxymethylisoxazoline III benötigten Allylkohole der Formel IV sind in der Literatur bekannt [vgl. EP-514 987; Houben-Weyl, Methoden der organischen Chemie, Bd. 6/1a, 1979, S. 55 ff. und darin zitierte Literatur] oder kön-  
45 nen gemäß der zitierten Literatur hergestellt werden.



## Verfahren B

Ein Nitriloxid der Formel V reagiert mit einem Allylderivat der Formel VIII zu einem Methylisoxazolinderivat der Formel IX. Dieses wird anschließend mit einem Arylmethylalkohol der Formel X zum 3-heteroarylsubstituierten Isoxazolin der Formel I verethert:



L<sup>2</sup> in den Formeln VIII und IX steht für eine nucleophil verdrängbare Abgangsgruppe wie Halogen (z.B. Chlor, Brom oder Iod), C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkylsulfonyloxy oder C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkylsulfonyloxy, wie z.B. Trifluormethylsulfonyloxy, oder eine andere äquivalente Abgangsgruppe.

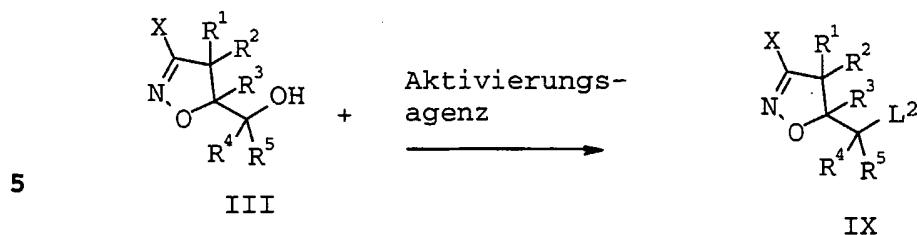
Die Umsetzung des Methylisoxazolinderivats der Formel IX mit einem Arylmethylalkohol der Formel X erfolgt analog der Umsetzung des 5-hydroxymethylisoxazolins der Formel III mit einem Arylmethylderivat der Formel II in Verfahren A.

Die für die Herstellung der 3-heteroarylsubstituierten Isoxazoline der Formel I benötigten Arylmethylalkohole der Formel X sind dem Fachmann bekannt oder können durch literaturbekannte Reaktionen hergestellt werden.

Die Herstellung der Methylisoxazolinderivate der Formel IX aus Nitriloxiden der Formel V und Allylderivaten der Formel VIII erfolgt analog zur Herstellung der 5-Hydroxymethylisoxazoline der Formel III in Verfahren A.

Des Weiteren besteht die Möglichkeit, die Methylisoxazolinderivate der Formel IX aus den 5-Hydroxymethylisoxazolinen der Formel III herzustellen:

65



Die Umsetzung der 5-Hydroxymethylisoxazoline zu Methylisoxazolin-  
 10 von  $-20^{\circ}\text{C}$  bis zur Rückflußtemperatur des entsprechenden Reaktions-  
 gemischen in einem inerten Lösungsmittel.

Geeignete Lösungsmittel sind aliphatische Kohlenwasserstoffe wie  
 Penton, Hexon, Cyclohexon und Gemische von  $\text{C}_5$ - $\text{C}_8$ -Alkanen, aromati-  
 15 sche Kohlenwasserstoffe wie Toluol, o-, m- und p-Xylol,  
 halogenierte Kohlenwasserstoffe wie Methylenchlorid, Chloroform  
 und Chlorbenzol, Ether wie Diethylether, Diisopropylether, tert.-  
 Butylmethylether, Dioxon, Anisol und Tetrahydrofuran. Es können  
 auch Gemische der genannten Lösungsmittel verwendet werden.

20 Als Aktivierungsagentien eignen sich z. B. Halogenierungsmittel  
 wie Thionylchlorid, Phosgen, Diphosgen, Triphosgen, Oxalylchlorid,  
 Thionylbromid, Oxalylbromid, oder z. B. Alkylsulfonsäurechloride,  
 wie z. B. Methylsulfonsäurechlorid, oder Halogenalkylsulfonsäu-  
 25 rechloride, wie z.B. Trifluormethylsulfonsäurechlorid.

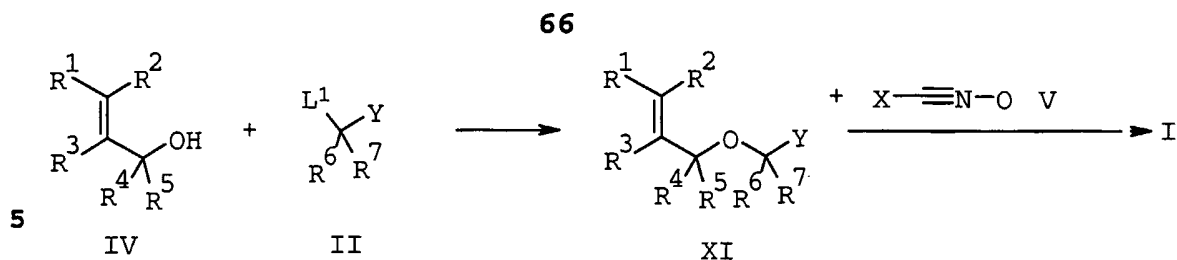
Die Edukte werden im allgemeinen in äquimolaren Mengen miteinan-  
 der umgesetzt. Es kann vorteilhaft sein, das Aktivierungsagenz im  
 Überschuß einzusetzen.

30 Die Allylderivate der Formel VIII sind dem Fachmann bekannt oder  
 können z. B. aus den Allylalkoholen der Formel IV analog der Syn-  
 these von III zu IX hergestellt werden.

### 35 Verfahren C

Ein Allylalkohol der Formel IV wird mit einem Arylmethylderivat  
 der Formel II zu einem Arylmethylallylether der Formel XI umge-  
 setzt. Dieser reagiert anschließend mit einem Nitriloxid der For-  
 40 mel V zu den 3-heteroarylsubstituierten Isoxazolininen der Formel  
 I:

45



L<sup>1</sup> in Formel II steht für eine nucleophil verdrängbare Abgangsgruppe wie Halogen (z.B. Chlor, Brom oder Iod), Aryl-,

- 10** C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkylsulfonyl, Arylsulfonyl (z.B. Toluylsulfonyl), C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkylsulfonyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkylsulfonyloxy oder C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkylsulfonyloxy wie (z.B. Trifluormethylsulfonyloxy), oder eine andere äquivalente Abgangsgruppe.
- 15** Die Umsetzung der Arylmethylallylether der Formel XI mit einem Nitriloxid der Formel V zu den 3-heteroarylsubstituierten Isoxazolininen der Formel I erfolgt analog zur Umsetzung des Nitriloxids der Formel V mit einem Allylalkohol der Formel IV in Verfahren A.
- 20** Die Edukte werden im allgemeinen in äquimolaren Mengen miteinander umgesetzt. Es kann vorteilhaft sein, XI in einem Überschuß bezogen auf V einzusetzen.
- Die Aufarbeitung und Isolierung der Produkte kann in an sich bekannter Weise erfolgen.
- 25**
- Die für die Herstellung der 3-heteroarylsubstituierten Isoxazoline der Formel I benötigten Nitriloxide der Formel V sind analog Verfahren A erhältlich.
- 30**
- Die Umsetzung des Allylalkohols der Formel IV mit einem Arylmethylderivat der Formel II erfolgt analog zur Umsetzung des 5-Hydroxymethylisoxazolins der Formel III mit einem Arylmethylderivat der Formel II in Verfahren A.
- 35**
- Die Edukte werden im allgemeinen in äquimolaren Mengen miteinander umgesetzt. Es kann vorteilhaft sein, II in einem Überschuß bezogen auf V einzusetzen.
- 40** Die Aufarbeitung und Isolierung der Produkte kann in an sich bekannter Weise erfolgen.
- Die für die Herstellung der Arylmethylallylether der Formel XI benötigten Arylmethylderivate der Formel II und Allylalkohole der
- 45** Formel IV sind gemäß Verfahren A erhältlich.

## 67

Des Weiteren besteht die Möglichkeit, den Arylmethylallylether der Formel XI durch Umsetzung des entsprechenden Allylderivats der Formel VIII mit einem Arylmethylalkohol der Formel X (vgl. Verfahren B) herzustellen.

5

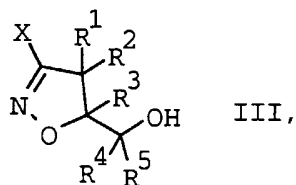
Die Umsetzung erfolgt analog zur Umsetzung des Allylalkohols der Formel IV mit einem Arylmethylalkohol der Formel II bzw. analog zur Umsetzung des 5-Hydroxymethylisoxazolins der Formel III mit einem Arylmethylalkohol der Formel II in Verfahren A.

10

Die benötigten Allylderivate der Formel VIII und Arylmethylalkohole der Formel X sind gemäß Verfahren B erhältlich.

5-Hydroxymethylisoxazoline der Formel III

15



20

wobei X, R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup>, R<sup>3</sup>, R<sup>4</sup> und R<sup>5</sup> die unter Anspruch 1 genannten Bedeutungen haben, sind ebenfalls ein Gegenstand der vorliegenden

25 Erfindung.

Die besonders bevorzugten Ausführungsformen der Zwischenprodukte in Bezug auf die Variablen entsprechen denen der Reste X, R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup>, R<sup>3</sup>, R<sup>4</sup> und R<sup>5</sup> der Formel I.

30

Besonders bevorzugt werden 5-Hydroxymethylisoxazoline der Formel III, in der

X 6-gliedriges Heteroaryl mit ein bis drei Stickstoff-

35

atomen;  
bevorzugt 6-gliedriges Heteroaryl mit einem bis zwei

Stickstoffatomen;

insbesondere Pyridyl, Pyrimidyl und Pyrazinyl;

sehr bevorzugt Pyridyl und Pyrimidyl;

40

ebenso bevorzugt Pyridyl und Pyrazinyl;

wobei das 6-gliedrige Heteroaryl jeweils wie oben be-

schrieben substituiert ist; und

R<sup>1</sup>-R<sup>5</sup>

Wasserstoff, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl, wie z. B. Methyl oder Ethyl,

45

oder C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Haloenalkyl, wie z. B. Difluormethyl, Tri-  
fluormethyl oder Trichlormethyl;

## 68

besonders bevorzugt Wasserstoff, Methyl oder Trifluor-  
methyl;

sehr bevorzugt Wasserstoff;

- 5 insbesondere bevorzugt stehen  $R^1$ ,  $R^2$ ,  $R^4$ - $R^5$  für Wasserstoff, Methyl oder Trifluormethyl und  $R^3$  für Wasserstoff, Methyl, Ethyl oder Trifluormethyl;
- insbesondere sehr bevorzugt stehen  $R^1$ ,  $R^2$ ,  $R^4$ - $R^5$  für Wasserstoff und  $R^3$  für Methyl;

10 bedeuten.

Ebenso besonders bevorzugt werden 5-Hydroxymethylisoxazoline der Formel III, in der

- 15 X für  $X^1$  steht, wobei

- $R^a$  Halogen, Cyano, Nitro, Hydroxy,  $C_1$ - $C_6$ -Alkyl,  
 $C_1$ - $C_6$ -Halogenalkyl,  $C_1$ - $C_6$ -Alkoxy,  $C_1$ - $C_6$ -Halogenalkoxy,  
Amino,  $C_1$ - $C_6$ -Alkylamino, Di( $C_1$ - $C_6$ -alkyl)amino,  
20  $C_1$ - $C_6$ -Alkylthio,  $C_1$ - $C_6$ -Alkylsulfinyl oder  $C_1$ - $C_6$ -Alkyl-  
sulfonyl,  
 $R^b$  Wasserstoff, sowie ein wie voranstehend unter  $R^a$  genannter Substituent; und  
 $R^d$  Wasserstoff oder  $C_1$ - $C_6$ -Alkyl, bevorzugt Wasserstoff oder  
25  $C_1$ - $C_4$ -Alkyl;

insbesondere bevorzugt

- $R^a$  Halogen,  $C_1$ - $C_6$ -Alkyl,  $C_1$ - $C_6$ -Halogenalkyl,  $C_1$ - $C_6$ -Alkoxy  
oder  $C_1$ - $C_6$ -Halogenalkoxy;  
30  $R^b$  Wasserstoff, Halogen,  $C_1$ - $C_6$ -Alkyl,  $C_1$ - $C_6$ -Halogenalkyl,  
 $C_1$ - $C_6$ -Alkoxy oder  $C_1$ - $C_6$ -Halogenalkoxy;  
 $R^d$  Wasserstoff oder  $C_1$ - $C_4$ -Alkyl; und

- $R^1$ - $R^7$  Wasserstoff,  $C_1$ - $C_4$ -Alkyl, wie z. B. Methyl oder Ethyl,  
35 oder  $C_1$ - $C_4$ -Halogenalkyl, wie z. B. Difluormethyl, Tri-  
fluormethyl oder Trichlormethyl;  
besonders bevorzugt Wasserstoff, Methyl oder Trifluor-  
methyl;  
sehr bevorzugt Wasserstoff;  
40 insbesondere bevorzugt stehen  $R^1$ ,  $R^2$ ,  $R^4$ - $R^7$  für Wasserstoff, Methyl oder Trifluormethyl und  $R^3$  für Wasserstoff, Methyl, Ethyl oder Trifluormethyl;  
insbesondere sehr bevorzugt stehen  $R^1$ ,  $R^2$ ,  $R^4$ - $R^7$  für Wasserstoff und  $R^3$  für Methyl;

- 45 bedeuten.

Ebenso besonders bevorzugt werden 5-Hydroxymethylisoxazoline der Formel III, in denen

- X für X<sup>5</sup> steht, wobei
- 5**
- R<sup>a</sup> Halogen, Cyano, Nitro, Hydroxy, 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, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkoxy, Amino, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkylamino, Di(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkyl)amino, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkylthio, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkylsulfinyl oder C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkylsulfonyl,
- 10**
- R<sup>b</sup>, R<sup>c</sup> Wasserstoff, sowie ein wie voranstehend unter R<sup>a</sup> genannter Substituent;
- R<sup>d</sup> Wasserstoff oder C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkyl; bevorzugt Wasserstoff oder C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl;
- 15**
- bevorzugt
- R<sup>a</sup> Halogen, Cyano, Nitro, Hydroxy, 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, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkoxy, Amino, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkylamino, Di(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkyl)amino, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkylthio, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkylsulfinyl oder C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkylsulfonyl;
- 20**
- R<sup>b</sup>, R<sup>c</sup> Wasserstoff, sowie ein wie voranstehend unter R<sup>a</sup> genannter Substituent; und
- 25**
- R<sup>d</sup> Wasserstoff oder C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl;
- wobei der 5-gliedrige Heterocyclus in ortho-Position zum Heteroatom mit dem Isoxazolingerüst verknüpft ist;
- 30**
- insbesondere bevorzugt
- R<sup>a</sup> 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 oder C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkoxy;
- R<sup>b</sup>, R<sup>c</sup> Wasserstoff, sowie ein wie voranstehend unter R<sup>a</sup> genannter Substituent; und
- 35**
- R<sup>d</sup> Wasserstoff oder C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl;
- wobei der 5-gliedrige Heterocyclus in ortho-Position zum Heteroatom mit dem Isoxazolingerüst verknüpft ist; und
- 40**
- R<sup>1</sup>-R<sup>5</sup> Wasserstoff, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl, wie z. B. Methyl oder Ethyl, oder C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkyl, wie z. B. Difluormethyl, Trifluormethyl oder Trichlormethyl; besonders bevorzugt Wasserstoff, Methyl oder Trifluormethyl;
- 45**
- sehr bevorzugt Wasserstoff;

## 70

insbesondere bevorzugt stehen  $R^1$ ,  $R^2$ ,  $R^4$ - $R^5$ -für Wasserstoff, Methyl oder Trifluormethyl und  $R^3$  für Wasserstoff, Methyl, Ethyl oder Trifluormethyl;

insbesondere sehr bevorzugt stehen  $R^1$ ,  $R^2$ ,  $R^4$ - $R^5$  für Wasserstoff und  $R^3$  für Methyl;

5

bedeuten.

Ebenso besonders bevorzugt werden 5-Hydroxymethylisoxazoline der Formel III, in denen

10

X für  $X^6$  steht, wobei

$R^a$  Halogen, Cyano, Nitro, Hydroxy,  $C_1$ - $C_6$ -Alkyl,  $C_1$ - $C_6$ -Halogenalkyl,  $C_1$ - $C_6$ -Alkoxy,  $C_1$ - $C_6$ -Halogenalkoxy, Amino,  $C_1$ - $C_6$ -Alkylamino, Di( $C_1$ - $C_6$ -alkyl)amino,  $C_1$ - $C_6$ -Alkylthio,  $C_1$ - $C_6$ -Alkylsulfinyl oder  $C_1$ - $C_6$ -Alkylsulfonyl;

15

$R^b$  Wasserstoff, sowie ein wie voranstehend unter  $R^a$  genannter Substituent;

20

bevorzugt

$R^a$  Halogen, Cyano, Nitro, Hydroxy,  $C_1$ - $C_6$ -Alkyl,  $C_1$ - $C_6$ -Halogenalkyl,  $C_1$ - $C_6$ -Alkoxy,  $C_1$ - $C_6$ -Halogenalkoxy, Amino,  $C_1$ - $C_6$ -Alkylamino, Di( $C_1$ - $C_6$ -alkyl)amino,  $C_1$ - $C_6$ -Alkylthio,  $C_1$ - $C_6$ -Alkylsulfinyl oder  $C_1$ - $C_6$ -Alkylsulfonyl,

25

$R^b$  Wasserstoff, sowie ein wie voranstehend unter  $R^a$  genannter Substituent;

30

wobei der 5-gliedrige Heterocyclus in ortho-Position zu einem Heteroatom mit dem Isoxazolingerüst verknüpft ist;

insbesondere bevorzugt

35

$R^a$  Halogen,  $C_1$ - $C_6$ -Alkyl,  $C_1$ - $C_6$ -Halogenalkyl,  $C_1$ - $C_6$ -Alkoxy oder  $C_1$ - $C_6$ -Halogenalkoxy,

$R^b$  Wasserstoff, sowie ein wie voranstehend unter  $R^a$  genannter Substituent;

40

wobei der 5-gliedrige Heterocyclus in ortho-Position zu einem Heteroatom mit dem Isoxazolingerüst verknüpft ist; und

$R^1$ - $R^5$  Wasserstoff,  $C_1$ - $C_4$ -Alkyl, wie z. B. Methyl oder Ethyl, oder  $C_1$ - $C_4$ -Halogenalkyl, wie z. B. Difluormethyl, Trifluormethyl oder Trichlormethyl;

45

## 71

besonders bevorzugt Wasserstoff, Methyl oder Trifluor-  
methyl;

sehr bevorzugt Wasserstoff;

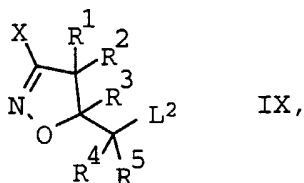
- 5 insbesondere bevorzugt stehen  $R^1$ ,  $R^2$ ,  $R^4$ - $R^5$ -für Wasser-  
stoff, Methyl oder Trifluormethyl und  $R^3$  für Wasserstoff,  
Methyl, Ethyl oder Trifluormethyl;

insbesondere sehr bevorzugt stehen  $R^1$ ,  $R^2$ ,  $R^4$ - $R^5$  für Was-  
serstoff und  $R^3$  für Methyl;

10 bedeuten.

Methylisoxazoline der Formel IX

15



20

wobei X und  $R^1$ - $R^5$  die unter Anspruch 1 genannten Bedeutungen haben  
und  $L^2$  für eine nucleophil verdrängbare Abgangsgruppe wie Halogen  
(z.B. Chlor, Brom und Iod),  $C_1$ - $C_6$ -Alkylsulfonyloxy oder  
 $C_1$ - $C_6$ -Halogenalkylsulfonyloxy (z.B. Trifluormethylsulfonyloxy),

- 25 oder eine andere äquivalente Abgangsgruppe steht, sind ebenfalls  
Gegenstand der vorliegenden Erfindung.

Die besonders bevorzugten Ausführungsformen der Zwischenprodukte  
in Bezug auf die Variablen entsprechen denen der Reste X und  $R^1$ - $R^5$

30 der Formel I.

Besonders bevorzugt werden Methylisoxazoline der Formel IX, in  
der

- 35 X 6-gliedriges Heteroaryl mit ein bis drei Stickstoff-  
atomen;  
insbesondere 6-gliedriges Heteroaryl mit einem bis zwei  
Stickstoffatomen;

sehr bevorzugt Pyridyl;

- 40 wobei das 6-gliedrige Heteroaryl wie oben beschrieben  
substituiert ist; und

$R^1$ - $R^5$  Wasserstoff,  $C_1$ - $C_4$ -Alkyl, wie z. B. Methyl oder Ethyl,  
oder  $C_1$ - $C_4$ -Halogenalkyl, wie z. B. Difluormethyl, Tri-  
fluormethyl oder Trichlormethyl;

45



## 72

besonders bevorzugt Wasserstoff, Methyl oder Trifluormethyl;

sehr bevorzugt Wasserstoff;

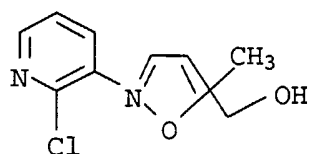
- 5 insbesondere bevorzugt stehen  $R^1$ ,  $R^2$ ,  $R^4$ - $R^5$  für Wasserstoff, Methyl oder Trifluormethyl und  $R^3$  für Wasserstoff, Methyl, Ethyl oder Trifluormethyl;
- insbesondere sehr bevorzugt stehen  $R^1$ ,  $R^2$ ,  $R^4$ - $R^5$  für Wasserstoff und  $R^3$  für Methyl; und

- 10  $L^2$  eine nucleophil verdrängbare Abgangsgruppe;  
bevorzugt Halogen,  $C_1$ - $C_6$ -Alkylsulfonyloxy oder  $C_1$ - $C_6$ -Halogenalkylsulfonyloxy;  
besonders bevorzugt Chlor, Brom, Iod oder Trifluormethylsulfonyloxy;

- 15 bedeuten.

3-(2-Chlorpyrid-3-yl)-4,5-dihydro-5-hydroxymethyl-5-methylisoxazol

20



2.1

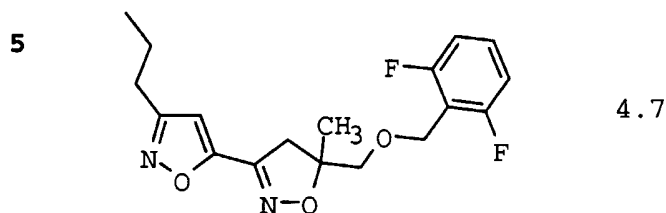
25

- 5.0 g (0.03 mol) 2-Chlorpyrid-3-yl-carboxaldehydoxim wurden in Dimethylformamid vorgelegt, mit einer Spatelspitze N-Chlorsuccinimid versetzt und auf 40-45°C erwärmt. Anschließend wurden 4.26 g (0.03 mol) N-Chlorsuccinimid portionsweise zugegeben, so dass die Reaktionstemperatur 50°C nicht überstieg. Nach 1 h Rühren bei 45-50°C wurde der Ansatz hydrolysiert, mit Diethylether extrahiert und die organische Phase getrocknet. Zu der erhaltenen Lösung wurden 2.07 g (0.03 mol) 2-Methyl-2-propenol gegeben und unter Eiskühlung 5.37 g (0.04 mol) Triethylamin zugetropft. Nach 1 h ließ man die Reaktionslösung auf Raumtemperatur erwärmen, filtrierte den Niederschlag ab und entfernte das Lösungsmittel. Man erhielt 2.8 g (38.7 % der Theorie) der Teitelverbindung
- 40 (Schmp. 71°C).

45

## 73

5-(2,6-Difluor-benzyloxymethyl)-5-methyl-3-(3-propyl-isoxazol-5-yl)-4,5-dihydroisoxazol



10

3 g (0.02 mol) 3-Propylisoxazol-5-yl-carbaldehydoxim wurde in 20 ml Dimethylformamid gelöst, man gab 0.29 g (0.002 mol) N-Chlor-succinimid zu und erwärmte das Reaktionsgemisch auf 45-50°C. In-  
 15 nerhalb einer Stunde wurden weitere 2.31 g (0.02 mol) N-Chlorsuc-  
 cinimid zugegeben. Anschließend ließ man das Reaktionsgemisch ab-  
 kühlen und goß es anschließend auf Wasser. Die Phasen wurden ge-  
 trennt und die wässrige mit Diethylether extrahiert. Die verein-  
 20 igten organischen Phasen wurden gewaschen, getrocknet und an-  
 schließend mit 3.48 g (0.02 mol) (2-Methyl-prop-2-en)-oxy-  
 methyl-2,6-difluorbenzol versetzt. Dann wurden bei 0°C 3 g (0.03  
 mol) Triethylamin langsam zugetropft und eine Stunde bei 0°C ge-  
 rührt. Der entstandene Niederschlag wurde abfiltriert und das  
 Filtrat vom Lösungsmittel befreit. Nach üblichen Reinigungsmetho-  
 25 den erhielt man 0.8 g (11.7 % der Theorie) der Titelverbindung.

In den Tabellen 2 bis 5 sind neben den voranstehenden  
 Verbindungen noch weitere 5-Hydroxymethylisoxazoline der Formel  
 III und 3-heteroarylsubstituierte Isoxazoline der Formel I aufge-  
 30 führt, die in analoger Weise nach den voranstehend beschrieben  
 Verfahren hergestellt wurden oder herstellbar sind.

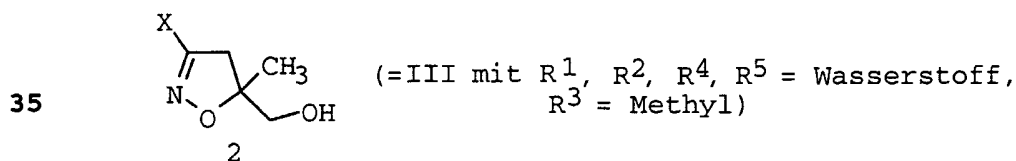
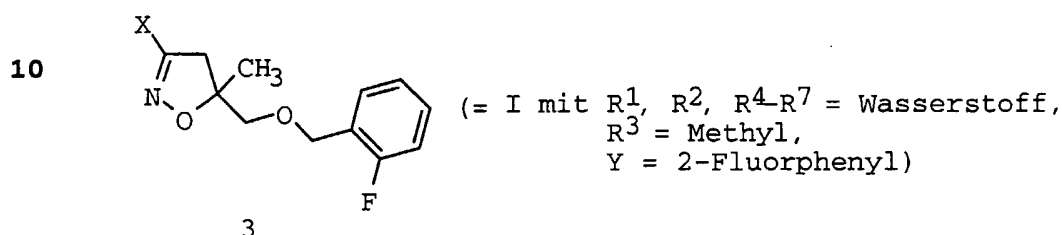


Tabelle 2

Nr.	X	ausgewählte <sup>1</sup> H-NMR-Daten [DMSO] bzw. Schmp.	
40	2.1	2-Chlorpyrid-3-yl	71°C
	2.2	6-Methylpyrid-2-yl	
	2.3	2-Chlor-5-methylimidazol-4-yl	
	2.4	3-Methylisoxazol-5-yl	
45	2.5	3-Propylisoxazol-5-yl	
	2.6	4-(But-2-yl)isoxazol-5-yl	
	2.7	3-(2-Methyl- propyl)isoxazol-5-yl	

Nr.	X	ausgewählte <sup>1</sup> H-NMR-Daten [DMSO] bzw. Schmp.
2.8	3-Phenylisoxazol-5-yl	
2.9	2-Methylthiazol-4-yl	
5 2.10	2-Methyl-5-chlorthiazol-4-yl	3.22 (dd, 2H), 3.40 (dd, 2H)



15

Tabelle 3

Nr.	X	ausgewählte <sup>1</sup> H-NMR-Daten [cm <sup>-1</sup> ]DMSO] bzw. Schmp.bzw. MS [m/e] bzw. ausgewählte IR-Daten [cm <sup>-1</sup> ]
20 3.1	2-Chlorpyrid-3-yl	3.31 (dd, 2H), 3.59 (dd, 2H)
3.2	6-Methylpyrid-2-yl	3.27 (dd, 2H), 3.53 (dd, 2H)
25 3.3	2-Chlor-5-methylimidazol-4-yl	3.30 (dd, 2H), 3.58 (dd, 2H)
3.4	3-Methylisoxazol-5-yl	3.23 (dd, 2H), 3.57 (dd, 2H)
3.5	3-Propylisoxazol-5-yl	3.25 (dd, 2H), 3.55 (dd, 2H)
30 3.6	4-(But-2-yl)isoxazol-5-yl	3.25 (dd, 2H), 3.56 (dd, 2H)
3.7	3-(2-Methyl-propyl)isoxazol-5-yl	[M+H] <sup>+</sup> 346
3.8	3-Phenylisoxazol-5-yl	90°C
35 3.9	2-Methylthiazol-4-yl	3.32 (dd, 2H), 3.52 (dd, 2H)
3.10	2-Methyl-5-chlorthiazol-4-yl	3.22 (dd, 2H), 3.50 (dd, 2H)
3.11	4-Chlorpyrid-3-yl	3.35 (dd, 2H), 3.59 (dd, 2H)
40 3.12	2-Chlorid-3-yl-N-oxid	IR [cm <sup>-1</sup> ] 1259 N-Oxid
3.13	2,4-Dichlorpyrid-3-yl	3.15 (dd, 2H), 3.60 (dd, 2H)
3.14	2,6-Dichlorpyrid-3-yl	3.32 (dd, 2H), 3.56 (dd, 2H)
45 3.15	2-Brompyrid-3-yl	3.28 (dd, 2H), 3.58 (dd, 2H)
3.16	2-Methylpyrid-3-yl	3.28 (dd, 2H), 3.56 (dd, 2H)

## 75

Nr.	X	ausgewählte <sup>1</sup> H-NMR-Daten [cm <sup>-1</sup> ]DMSO] bzw. Schmp.bzw. MS [m/e] bzw. ausgewählte IR-Daten [cm <sup>-1</sup> ]	
5	3.17	2-Trifluormethylpyrid-3-yl	3.26 (dd, 2H), 3.58 (dd, 2H)
	3.18	4-Trifluormethylpyrid-3-yl	3.3 (dd, 2H), 3.55 (dd, 2H)
	3.19	2-Methoxypyridin-3-yl	3.27 (dd, 2H), 3.54 (dd, 2H)
10	3.20	6-Methoxypyridin-3-yl	3.25 (dd, 2H), 3.53 (dd, 2H)
	3.21	2-Chlor-4-Isopropylpyrid-3-yl	3.3 (dd, 2H), 3.55 (dd, 2H)
	3.22	2-Chlor-6-methylpyrid-3-yl	3.35 (dd, 2H), 3.54 (dd, 2H)
15	3.23	2-Chlor-4,6-dimethylpyrid-3-yl	3.12 (dd, 2H), 3.57 (dd, 2H)
	3.24	2,6-Dichlor-4-methylpyridin-3-yl	3.18 (dd, 2H), 3.59 (dd, 2H)
	3.25	3-Chlorpyrid-4-yl	3.32 (dd, 2H), 3.62 (dd, 2H)
20	3.26	3-Brompyrid-4-yl	3.38 (dd, 2H), 3.58 (dd, 2H)
	3.27	2-Methylpyrid-4-yl	3.24 (dd, 2H), 3.58 (dd, 2H)
	3.28	3-Trifluormethylpyrid-4-yl	3.25 (dd, 2H), 3.57 (dd, 2H)
25	3.29	2-Trifluormethyl-5-chlorpyrid-4-yl	3.43 (dd, 2H), 3.59 (dd, 2H)
	3.30	2-Cyclopropylpyrimidin-4-yl	3.25 (dd, 2H), 3.58 (dd, 2H)
30	3.31	2-Phenyl-4-methylpyrimidin-6-yl	3.35 (dd, 2H), 3.60 (dd, 2H)
	3.32	3-Chlorpyrazin-2-yl	3.4 (dd, 2H), 3.68 (dd, 2H)
	3.33	1-Methyl-4,5-dichlorimidazol-2-yl	3.24 (dd, 2H), 3.57 (dd, 2H)
	3.34	1,4-Dimethyl-2-Chlor-imidazol-2-yl	3.31 (dd, 2H), 3.57 (dd, 2H)
35	3.35	3-Methyl-4-chlorisoxazol-5-yl	3.28 (dd, 2H), 3.57 (dd, 2H)
	3.36	"2-Chlorpyrid-3-yl" Methylsulfonsäuresalz	1492, 1456, 1351, 1194, 1058, 785, 772, 761, 536

40

45

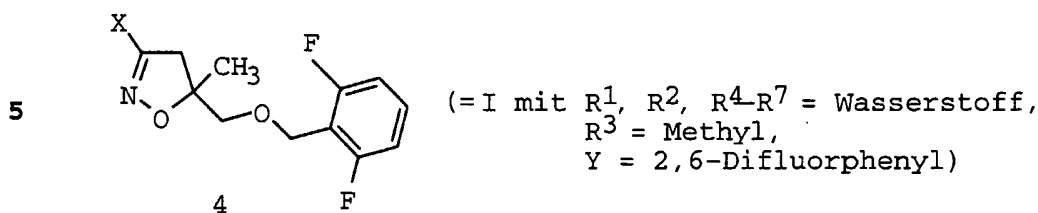
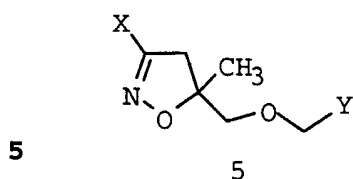


Tabelle 4

Nr.	X	ausgewählte $^1\text{H-NMR}$ -Daten [DMSO] bzw. Schmp. bzw. MS [m/e]
4.1	2-Chlorpyrid-3-yl	3.33 (dd, 2H), 3.53 (dd, 2H)
4.2	6-Methylpyrid-2-yl	70°C
4.3	2-Chlor-5-methylimidazol-4-yl	[M+H] <sup>+</sup> 356
4.4	3-Methylisoxazol-5-yl	3.20 (dd, 2H), 3.54 (dd, 2H)
4.5	3-Propylisoxazol-5-yl	3.22 (dd, 2H), 3.52 (dd, 2H)
4.6	4-(But-2-yl)isoxazol-5-yl	3.18 (dd, 2H), 3.53 (dd, 2H)
4.7	3-(2-Methyl-propyl)isoxazol-5-yl	3.19 (dd, 2H), 3.53 (dd, 2H)
4.8	3-Phenylisoxazol-5-yl	79-81°C
4.9	2-Methylthiazol-4-yl	3.18 (dd, 2H), 3.51 (dd, 2H)
4.10	2-Methyl-5-chlorthiazol-4-yl	3.22 (dd, 2H), 3.50 (dd, 2H)
4.11	3-Chlorpyrid-2-yl	Schmp. 102°C
4.12	3-Methylpyrid-2-yl	3.34 (dd, 2H), 3.55 (dd, 2H)
4.13	Trifluormethylpyrid-2-yl	Schmp. 95-96°C
4.14	2-Fluorpyrid-3-yl	3.26 (dd, 2H), 3.53 (dd, 2H)
4.15	2-Fluorpyrid-3-yl	3.32 (dd, 2H), 3.56 (dd, 2H)
4.16	2-Brompyrid-3-yl	3.22 (dd, 2H), 3.55 (dd, 2H)
4.17	2,4-Dichlorpyrid-3-yl	3.09 (dd, 2H), 3.59 (dd, 2H)
4.18	2,4-Dichlorpyrid-3-yl	3.28 (dd, 2H), 3.56 (dd, 2H)
4.19	2-Chlorpyrid-3-yl-N-oxid	[M] <sup>+</sup> 368
4.20	2-Cyanopyrid-3-yl	3.48 (dd, 2H), 3.61 (dd, 2H)
4.21	2-Hydroxypyrid-3-yl	3.38 (dd, 2H), 3.52 (dd, 2H)
4.22	2-Nitropyrid-3-yl	3.08 (dd, 2H), 3.60 (dd, 2H)
4.23	2-Methylpyrid-3-yl	Schmp. 85°C

Nr.	X	ausgewählte <sup>1</sup> H-NMR-Daten [DMSO] bzw. Schmp. bzw. MS [m/e]	
5	4.24	4-Methylpyrid-3-yl	3.30 (dd, 2H), 3.57 (dd, 2H)
	4.25	2-Ethylpyrid-3-yl	3.20 (dd, 2H), 3.58 (dd, 2H)
	4.26	2-Trifluormethylpyrid-3-yl	3.20 (dd, 2H), 3.51 (dd, 2H)
10	4.27	4-Trifluormethylpyrid-3-yl	3.23 (dd, 2H), 3.53 (dd, 2H)
	4.28	2-Methoxypyrid-3-yl	3.24 (dd, 2H), 3.52 (dd, 2H)
	4.29	2(Methylthio)pyrid-3-yl	Schmp. 97-98°C
15	4.30	2(Methylsulfonyl)pyrid-3-yl	IR: 1312 cm <sup>-1</sup> (SO <sub>2</sub> )
	4.31	2(Methylsulfonox)pyrid-3-yl	<sup>13</sup> C-NMR: 87.27, 87.20
	4.32	2(Dimethylamino)pyrid-3-yl	[M+H] <sup>+</sup> 362
	4.33	2(Phenylthio)pyrid-3-yl	3.31 (dd, 2H), 3.58 (dd, 2H)
	4.34	2-Chlor-6-methylpyrid-3-yl	3.3 (dd, 2H), 3.55 (dd, 2H)
20	4.35	2-Chlor-4-isopropylpyrid-3-yl	3.26 (dd, 2H), 3.54 (dd, 2H)
	4.36	2-Chlor-4,6-dimethylpyrid-3-yl	3.11 (dd, 2H), 3.58 (dd, 2H)
	4.37	2-Methyl-4-chlorpyrid	3.1 (dd, 2H), 3.54 (dd, 2H)
	4.38	3-Chlorpyrid-4-yl	3.34 (dd, 2H), 3.56 (dd, 2H)
25	4.39	3-Brompyrid-4-yl	3.3 (dd, 2H), 3.55 (dd, 2H)
	4.40	3-Trifluormethylpyrid-4-yl	3.25 (dd, 2H), 3.55 (dd, 2H)
	4.41	2-Trifluormethyl-5-chlorpyrid-4-yl	Schmp. 60°C
30	4.42	2-Methylpyrimidin-4-yl	Schmp. 89°C
	4.43	2-Cyclopropylpyrimidin-4-yl	3.26 (dd, 2H), 3.58 (dd, 2H)
	4.44	3-Chlorpyrazin-2-yl	3.3 (dd, 2H), 3.58 (dd, 2H)
35	4.45	5-Methylfuran-2-yl	3.03 (dd, 2H), 3.46 (dd, 2H)
	4.46	3-Chlor-5-chlormethylfuran-2-yl	3.24 (dd, 2H), 3.58 (dd, 2H)
	4.47	3-Methoxycarbonylfuran-2-yl	3.3 (dd, 2H), 3.54 (dd, 2H)
	4.48	1-Methyl-4,5-dichlorimidazol-2-yl	Schmp. 86°C
	4.49	3-Methyl-4-chlorisoxazol-5-yl	3.3 (dd, 2H), 3.54 (dd, 2H)
40	4.50	1-Methyl-3,5-dichlorpyrrol-2-yl	[M+H] <sup>+</sup> 389
	4.51	2-Ethenylpyrid-3-yl	3.3 (dd, 2H), 3.54 (dd, 2H)
	4.52	2-Acetylpyrid-3-yl	[M+H] <sup>+</sup> 361



(I mit  $R^1, R^2, R^4-R^7$  = Wasserstoff,  
 $R^3$  = Methyl)

Tabelle 5

Nr.	X	Y	ausgewählte $^1\text{H-NMR}$ -Daten bzw. MS
5.1	2-Chlorpyrid-3-yl	Phenyl	3.4 (dd, 2H), 3.56 (dd, 2H)
5.2	2-Chlorpyrid-3-yl	3-Fluorphenyl	335 [M+H] <sup>+</sup>
5.3	2-Chlorpyrid-3-yl	2-Chlorphenyl	351 [M+H] <sup>+</sup>
5.4	2-Chlorpyrid-3-yl	2,6-Dichlorphenyl	385 [M+H] <sup>+</sup>
5.5	2-Chlorpyrid-3-yl	2,3,6-Trichlorphenyl	419 [M+H] <sup>+</sup>
5.6	2-Chlorpyrid-3-yl	2-Chlor-6-fluorphenyl	3.28 (dd, 2H), 3.56 (dd, 2H)
5.7	2-Chlorpyrid-3-yl	4-Methylphenyl	331 [M+H] <sup>+</sup>
5.8	2-Chlorpyrid-3-yl	2-Methylnophthyl-1-yl	381 [M+H] <sup>+</sup>
5.9	2-Chlorpyrid-3-yl	5-Chlor-1-methyl-3-trifluormethylpyrazol-4-yl	423 [M+H] <sup>+</sup>

## Anwendung

Die 3-heteroarylsubstituierten Isoxazoline der Formel I und deren landwirtschaftlich brauchbaren Salze eignen sich - sowohl als Isomergemische als auch in Form der reinen Isomeren - als Herbizide. Die Verbindungen der Formel I enthaltenden herbiziden Mittel bekämpfen Pflanzenwuchs auf Nichtkulturflächen sehr gut, besonders bei hohen Aufwandmengen. In Kulturen wie Weizen, Reis, Mais, Soja und Baumwolle wirken sie gegen Unkräuter und Schädgräser, ohne die Kulturpflanzen nennenswert zu schädigen. Dieser Effekt tritt vor allem bei niedrigen Aufwandmengen auf.

In Abhängigkeit von der jeweiligen Applikationsmethode können die Verbindungen der Formel I bzw. sie enthaltenden herbiziden Mittel noch in einer weiteren Zahl von Kulturpflanzen zur Beseitigung unerwünschter Pflanzen eingesetzt werden. In Betracht kommen beispielsweise folgende Kulturen:

Allium cepa, Ananas comosus, Arachis hypogaea, Asparagus officinalis, Beta vulgaris spec. altissima, Beta vulgaris spec. rapa, Brassica napus var. napus, Brassica napus var.

## 79

- napobrassica, Brassica rapa var. silvestris, Camellia sinensis, Carthamus tinctorius, Carya illinoensis, Citrus limon, Citrus sinensis, Coffea arabica (Coffea canephora, Coffea liberica), Cucumis sativus, Cynodon dactylon, Daucus carota, Elaeis
- 5 guineensis, Fragaria vesca, Glycine max, Gossypium hirsutum, (Gossypium arboreum, Gossypium herbaceum, Gossypium vitifolium), Helianthus annuus, Hevea brasiliensis, Hordeum vulgare, Humulus lupulus, Ipomoea batatas, Juglans regia, Lens culinaris, Linum usitatissimum, Lycopersicon lycopersicum, Malus spec., Manihot
- 10 esculenta, Medicago sativa, Musa spec., Nicotiana tabacum (N.rustica), Olea europaea, Oryza sativa, Phaseolus lunatus, Phaseolus vulgaris, Picea abies, Pinus spec., Pisum sativum, Prunus avium, Prunus persica, Pyrus communis, Ribes sylvestre, Ricinus communis, Saccharum officinarum, Secale cereale, Solanum
- 15 tuberosum, Sorghum bicolor (s. vulgare), Theobroma cacao, Trifolium pratense, Triticum aestivum, Triticum durum, Vicia faba, Vitis vinifera und Zea mays.

- Darüber hinaus können die Verbindungen der Formel I auch in Kul-
- 20 turen, die durch Züchtung einschließlich gentechnischer Methoden gegen die Wirkung von Herbiziden tolerant sind, verwandt werden.

- Die Verbindungen der Formel I bzw. die sie enthaltenden herbiziden Mittel können beispielsweise in Form von direkt
- 25 versprühbaren wäßrigen Lösungen, Pulvern, Suspensionen, auch hochprozentigen wäßrigen, öligen oder sonstigen Suspensionen oder Dispersionen, Emulsionen, Öldispersionen, Pasten, Stäubemitteln, Streumitteln oder Granulaten durch Versprühen, Vernebeln, Verstäuben, Verstreuen oder Gießen angewendet werden. Die
- 30 Anwendungsformen richten sich nach den Verwendungszwecken; sie sollten in jedem Fall möglichst die feinste Verteilung der erfindungsgemäßen Wirkstoffe gewährleisten.

- Die herbiziden Mittel enthalten eine herbizid wirksame Menge mindestens einer Verbindung der Formel I oder eines landwirtschaftlich brauchbaren Salzes von I und für die Formulierung von Pflanzenschutzmitteln übliche Hilfsmittel.
- 35

- Als inerte Hilfsstoffe kommen im Wesentlichen in Betracht:
- 40 Mineralölfraktionen von mittlerem bis hohem Siedepunkt wie Kerosin und Dieselöl, ferner Kohlenteeröle sowie Öle pflanzlichen oder tierischen Ursprungs, aliphatische, cyclische und aromatische Kohlenwasserstoffe, z.B. Paraffine, Tetrahydronaphthalin, alkylierte Naphthaline und deren Derivate, alkylierte Benzole und
- 45 deren Derivate, Alkohole wie Methanol, Ethanol, Propanol, Butanol



und Cyclohexanol, Ketone wie Cyclohexanon, stark polare Lösungsmittel, z.B. Amine wie N-Methylpyrrolidon und Wasser.

Wäßrige Anwendungsformen können aus Emulsionskonzentraten, Suspensionen, Pasten, netzbaren Pulvern oder wasserdispergierbaren Granulaten durch Zusatz von Wasser bereitete werden. Zur Herstellung von Emulsionen, Pasten oder Öldispersionen können die Substrate als solche oder in einem Öl oder Lösungsmittel gelöst, mittels Netz-, Haft-, Dispergier- oder Emulgiermittel in Wasser homogenisiert werden. Es können aber auch aus wirksamer Substanz, Netz-, Haft-, Dispergier- oder Emulgiermittel und eventuell Lösungsmittel oder Öl bestehende Konzentrate hergestellt werden, die zur Verdünnung mit Wasser geeignet sind.

Als oberflächenaktive Stoffe (Adjuvantien) kommen die Alkali-, Erdalkali-, Ammoniumsalze von aromatischen Sulfonsäuren, z.B. Lignin-, Phenol-, Naphthalin- und Dibutyl-naphthalinsulfonsäure, sowie von Fettsäuren, Alkyl- und Alkylarylsulfonaten, Alkyl-, Laurylether- und Fettalkoholsulfaten, sowie Salze sulfatierter Hexa-, Hepta- und Octadecanolen sowie von Fettalkoholglykolether, Kondensationsprodukte von sulfoniertem Naphthalin und seiner Derivate mit Formaldehyd, Kondensationsprodukte des Naphthalins bzw. der Naphthalinsulfonsäuren mit Phenol und Formaldehyd, Polyoxyethylenoctylphenolether, ethoxyliertes Isooctyl-, Octyl- oder Nonylphenol, Alkylphenyl-, Tributylphenylpolyglykolether, Alkylarylpolyetheralkohole, Isotridecylalkohol, Fettalkoholethylenoxid-Kondensate, ethoxyliertes Rizinusöl, Polyoxyethylen- oder Polyoxypropylenalkylether, Laurylalkoholpolyglykoletheracetat, Sorbitester, Lignin-Sulfitablaugen oder Methylcellulose in Betracht.

Pulver-, Streu- und Stäubemittel können durch Mischen oder gemeinsames Vermahlen der wirksamen Substanzen mit einem festen Trägerstoff hergestellt werden.

Granulate, z.B. Umhüllungs-, Imprägnierungs- und Homogengranulate können durch Bindung der Wirkstoffe an feste Trägerstoffe hergestellt werden. Feste Trägerstoffe sind Mineralerden wie Kieselsäuren, Kieselgele, Silikate, Talkum, Kaolin, Kalkstein, Kalk, Kreide, Bolus, Löß, Ton, Dolomit, Diatomeenerde, Calcium- und Magnesiumsulfat, Magnesiumoxid, gemahlene Kunststoffe, Düngemittel, wie Ammoniumsulfat, Ammoniumphosphat, Ammoniumnitrat, Harnstoffe und pflanzliche Produkte wie Getreidemehl, Baumrinden-, Holz- und Nußschalenmehl, Cellulosepulver oder andere feste Trägerstoffe.

## 81

Die Konzentrationen der Verbindungen der Formel I in den anwendungsfertigen Zubereitungen können in weiten Bereichen variiert werden. Im allgemeinen enthalten die Formulierungen etwa von 0,001 bis 98 Gew.-%, vorzugsweise 0,01 bis 95 Gew.-%, 5 mindestens eines Wirkstoffs. Die Wirkstoffe werden dabei in einer Reinheit von 90% bis 100%, vorzugsweise 95% bis 100% (nach NMR-Spektrum) eingesetzt.

Die folgenden Formulierungsbeispiele verdeutlichen die Herstellung solcher Zubereitungen:

- I. 20 Gewichtsteile eines Wirkstoffs der Formel I werden in einer Mischung gelöst, die aus 80 Gewichtsteilen alkyliertem Benzol, 10 Gewichtsteilen des Anlagerungsproduktes von 8 bis 10 Mol Ethylenoxid an 1 Mol Ölsäure-N-monoethanolamid, 5 Gewichtsteilen Calciumsalz der Dodecylbenzolsulfonsäure und 5 Gewichtsteilen des Anlagerungsproduktes von 40 Mol Ethylenoxid an 1 Mol Rizinusöl besteht. Durch Ausgießen und feines Verteilen der Lösung in 100000 Gewichtsteilen Wasser erhält man eine wäßrige Dispersion, die 0,02 Gew.-% des Wirkstoffs der Formel I enthält.
- II. 20 Gewichtsteile eines Wirkstoffs der Formel I werden in einer Mischung gelöst, die aus 40 Gewichtsteilen Cyclohexanon, 30 Gewichtsteilen Isobutanol, 20 Gewichtsteilen des Anlagerungsproduktes von 7 Mol Ethylenoxid an 1 Mol Isooctylphenol und 10 Gewichtsteilen des Anlagerungsproduktes von 40 Mol Ethylenoxid an 1 Mol Rizinusöl besteht. Durch Eingießen und feines Verteilen der Lösung in 100000 Gewichtsteilen Wasser erhält man eine wäßrige Dispersion, die 0,02 Gew.-% des Wirkstoffs der Formel I enthält.
- III. 20 Gewichtsteile eines Wirkstoffs der Formel I werden in einer Mischung gelöst, die aus 25 Gewichtsteilen Cyclohexanon, 65 Gewichtsteilen einer Mineralölfraction vom Siedepunkt 210 bis 280°C und 10 Gewichtsteilen des Anlagerungsproduktes von 40 Mol Ethylenoxid an 1 Mol Ricinusöl besteht. Durch Eingießen und feines Verteilen der Lösung in 100000 Gewichtsteilen Wasser erhält man eine wäßrige Dispersion, die 0,02 Gew.-% des Wirkstoffs der Formel I enthält.
- IV. 20 Gewichtsteile eines Wirkstoffs der Formel I werden mit 3 Gewichtsteilen des Natriumsalzes der Diisobutyl-naphthalinsulfonsäure, 17 Gewichtsteilen des Natriumsalzes einer Ligninsulfonsäure aus einer Sulfit-Ablauge und 60

## 82

Gewichtsteilen pulverförmigem Kieselsäuregel gut vermischt und in einer Hammermühle vermahlen. Durch feines Verteilen der Mischung in 20000 Gewichtsteilen Wasser erhält man eine Spritzbrühe, die 0,1 Gew.-% des Wirkstoffs der Formel I enthält.

5  
V. 3 Gewichtsteile eines Wirkstoffs der Formel I werden mit 97 Gewichtsteilen feinteiligem Kaolin vermischt. Man erhält auf diese Weise ein Stäubemittel, das 3 Gew.-% des Wirkstoffs der Formel I enthält.

10  
VI. 20 Gewichtsteile eines Wirkstoffs der Formel I werden mit 2 Gewichtsteilen Calciumsalz der Dodecylbenzolsulfonsäure, 8 Gewichtsteilen Fettalkoholpolyglykolether, 2 Gewichtsteilen Natriumsalz eines Phenol-Harnstoff-Formaldehyd-Kondensates und 68 Gewichtsteilen eines paraffinischen Mineralöls innig vermischt. Man erhält eine stabile ölige Dispersion.

15  
20  
VII. 1 Gewichtsteil eines Wirkstoffs der Formel I wird in einer Mischung gelöst, die aus 70 Gewichtsteilen Cyclohexanon, 20 Gewichtsteilen ethoxyliertem Isooctylphenol und 10 Gewichtsteilen ethoxyliertem Rizinusöl besteht. Man erhält ein stabiles Emulsionskonzentrat.

25  
30  
VIII. 1 Gewichtsteil eines Wirkstoffs der Formel I wird in einer Mischung gelöst, die aus 80 Gewichtsteilen Cyclohexanon und 20 Gewichtsteilen Wettol<sup>R</sup> EM 31 (= nichtionischer Emulgator auf der Basis von ethoxyliertem Rizinusöl) besteht. Man erhält ein stabiles Emulsionskonzentrat.

Die Applikation der Verbindungen der Formel I bzw. der herbiziden Mittel kann im Vorauf- oder im Nachaufverfahren erfolgen.

35 Sind die Wirkstoffe für gewisse Kulturpflanzen weniger verträglich, so können Ausbringungstechniken angewandt werden, bei welchen die herbiziden Mittel mit Hilfe der Spritzgeräte so gespritzt werden, daß die Blätter der empfindlichen Kulturpflanzen nach Möglichkeit nicht getroffen werden, während die Wirkstoffe

40 auf die Blätter darunter wachsender unerwünschter Pflanzen oder die unbedeckte Bodenfläche gelangen (post-directed, lay-by).

Die Aufwandmengen an Verbindung der Formel I betragen je nach Bekämpfungsziel, Jahreszeit, Zielpflanzen und Wachstumsstadium

45 0,001 bis 3,0, vorzugsweise 0,01 bis 1,0 kg/ha aktive Substanz (a.S.).

- Zur Verbreiterung des Wirkungsspektrums und zur Erzielung synergistischer Effekte können die 3 heteroarylsubstituierten Isoxazoline der Formel I mit zahlreichen Vertretern anderer herbizider oder wachstumsregulierender Wirkstoffgruppen gemischt und gemeinsam ausgebracht werden. Beispielsweise kommen als Mischungspartner 1,2,4-Thiadiazole, 1,3,4-Thiadiazole, Amide, Aminophosphorsäure und deren Derivate, Aminotriazole, Anilide, Aryloxy-/Heteroaryloxyalkansäuren und deren Derivate, Benzoesäure und deren Derivate, Benzothiadiazinone, 2-(Heteroaryl/Aroyl)-1,3-cyclohexandione, Heteroaryl-Aryl-Ketone, Benzylisoxazolidinone, meta-CF<sub>3</sub>-Phenyl-derivate, Carbamate, Chinolincarbonsäure und deren Derivate, Chloracetanilide, Cyclohexenonoximether-derivate, Diazine, Dichlorpropionsäure und deren Derivate, Dihydrobenzofurane, Dihydrofuran-3-one, Dinitroaniline, Dinitrophenole, Diphenylether, Dipyridyle, Halogencarbonsäuren und deren Derivate, Harnstoffe, 3-Phenyluracile, Imidazole, Imidazolinone, N-Phenyl-3,4,5,6-tetrahydrophthalimide, Oxadiazole, Oxirane, Phenole, Aryloxy- und Heteroaryloxyphenoxypropionsäureester, Phenyl-essigsäure und deren Derivate, 2-Phenylpropionsäure und deren Derivate, Pyrazole, Phenylpyrazole, Pyridazine, Pyridincarbonsäure und deren Derivate, Pyrimidylether, Sulfonamide, Sulfonylharnstoffe, Triazine, Triazinone, Triazolinone, Triazolcarboxamide und Uracile in Betracht.
- Außerdem kann es von Nutzen sein, die Verbindungen der Formel I allein oder in Kombination mit anderen Herbiziden auch noch mit weiteren Pflanzenschutzmitteln gemischt, gemeinsam auszubringen, beispielsweise mit Mitteln zur Bekämpfung von Schädlingen oder phytopathogenen Pilzen bzw. Bakterien. Von Interesse ist ferner die Mischbarkeit mit Mineralsalzlösungen, welche zur Behebung von Ernährungs- und Spurenelementmängeln eingesetzt werden. Es können auch nichtphytotoxische Öle und Ölkonzentrate zugesetzt werden.

#### Anwendungsbeispiele

- Die herbizide Wirkung der 3-heteroarylsubstituierten Isoxazoline der Formel I ließ sich durch die folgenden Gewächshausversuche zeigen:
- Als Kulturgefäße dienten Plastikblumentöpfe mit lehmigem Sand mit etwa 3,0 % Humus als Substrat. Die Samen der Testpflanzen wurden nach Arten getrennt eingesät.

- Bei Vorauflaufbehandlung wurden die in Wasser suspendierten oder emulgierten Wirkstoffe direkt nach Einsaat mittels fein verteilter Düsen aufgebracht. Die Gefäße wurden leicht beregnet, um Keimung und Wachstum zu fördern, und anschließend mit durchsich-

## 84

tigen Plastikhauben abgedeckt, bis die Pflanzen angewachsen waren. Diese Abdeckung bewirkt ein gleichmäßiges Keimen der Testpflanzen, sofern dies nicht durch die Wirkstoffe beeinträchtigt wurde. Die Aufwandmenge für die Verenglaufbehandlung betrug 3,0 5 kg/ha a.S. (aktive Substanz).

Zum Zweck der Nachauflaufbehandlung wurden die Testpflanzen je nach Wuchsform erst bis zu einer Wuchshöhe von 3 bis 15 cm angezogen und erst dann mit den in Wasser suspendierten oder emulgierten Wirkstoffen behandelt. Die Testpflanzen wurden dafür entweder direkt gesät und in den gleichen Gefäßen aufgezogen oder sie wurden erst als Keimpflanzen getrennt angezogen und einige Tage vor der Behandlung in die Versuchsgefäße verpflanzt. Die Aufwandmenge für die Nachauflaufbehandlung betrug 3,0 kg/ha 15 a.S. (aktive Substanz).

Die Pflanzen wurden artenspezifisch bei Temperaturen von 10 bis 25°C bzw. 20 bis 35°C gehalten. Die Versuchsperiode erstreckte sich über 2 bis 4 Wochen. Während dieser Zeit wurden die Pflanzen 20 gepflegt, und ihre Reaktion auf die einzelnen Behandlungen wurde ausgewertet.

Bewertet wurde nach einer Skala von 0 bis 100. Dabei bedeutet 100 kein Aufgang der Pflanzen bzw. völlige Zerstörung zumindest der oberirdischen Teile und 0 keine Schädigung oder normaler Wachstumsverlauf. 25

Die in den Gewächshausversuchen verwendeten Pflanzen setzten sich aus folgenden Arten zusammen:

30

Lateinischer Name	Deutscher Name	Englischer Name
<i>Abutilon theophrasti</i>	Chinesischer Hanf	velvet leaf
<i>Avena fatua</i>	Flughafer	wild oat
35 <i>Lolium multiflorum</i>	Italienisches Raygras	italian ryegrass
<i>Setaria italica</i>	Italienische Borstenhirse	foxtail millet

40 Bei Aufwandmengen von 3,0 kg/ha zeigten die Verbindungen 3.16, 3.17, 3.27, 3.36, 4.29 und 4.38 im Voraufbau eine sehr gute Wirkung gegen die Schadpflanzen *Solium multiflorum* und *Setaria italica*.

45

**85**

Die Wirkung von Verbindung 4.1 im Voraufbau bei Aufwandmengen von 3.0 Kg/ha auf die Schadpflanzen *Lolium multiflorum* und *Setaria italica* ist sehr gut.

- 5 Bei Aufwandmengen von 3,0 kg/ha zeigte die Verbindung 4.1 im Nachaufbau eine sehr gute Wirkung gegen die unerwünschten Pflanzen *Abutilon theophrasti*, *Avena fatua* und *Setaria italica*.

10

15

20

25

30

35

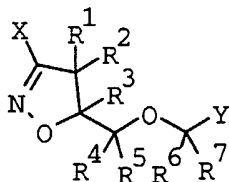
40

45

Patentansprüche:

1. 3-Heteroarylsubstituierte Isoxazoline der Formel I

5



I

10

in der die Variablen die folgenden Bedeutungen haben:

15 X 5-gliedriges Heteroaryl mit ein bis vier Stickstoff-  
atomen, oder mit ein bis drei Stickstoffatomen und einem  
Sauerstoff- oder Schwefelatom, oder mit einem Sauerstoff-  
oder Schwefelatom; oder

20 6-gliedriges Heteroaryl mit ein bis vier Stickstoff-  
atomen;

wobei die Heterocyclen partiell oder vollständig haloge-  
niert sind und/oder ein bis drei Substituenten aus fol-  
gender Gruppe tragen:

25

Cyano, Nitro, Hydroxy, C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-Alkyl, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-Cycloalkyl,  
C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-Halogencycloalkyl, C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>-Alkenyl, C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>-Alkinyl,  
C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-Halogenalkyl, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkenyl, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-Halogen-  
alkinyl, C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-Cyanoalkyl, C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>-Cyanoalkenyl,

30

C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-Alkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-Halogenalkoxy, 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>-Alkoxy-C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-alkoxy, Amino,  
C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-Alkylamino, Di(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-alkyl)amino, C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-Alkyl-  
carbonylamino, N-C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-Alkylcarbonyl-N-C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-alkylamino,  
C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-Alkoxy-carbonylamino, N-C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-Alkoxy-carbonyl-

35

N-C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-alkylamino, Amino-C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-Alkylami-  
no-C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-alkyl, Di(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-alkyl)amino-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>-Halogenalkylthio, C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-Alkyl-  
thio-C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-Alkylsulfinyl, C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-Halogenalkyl-  
sulfinyl, C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-Alkylsulfonyl, C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-Halogenalkylsulfonyl,  
C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-Alkylsulfonyl-C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-Alkylcarbonyl,  
C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-Alkoxy-carbonyl, C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-Alkoxy-carbonyl-C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-alkyl,  
Aminocarbonyl, C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-Alkylaminocarbonyl,

40

Di(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-alkyl)aminocarbonyl, Aminocarbonyl-C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-alkyl,  
C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-Alkylaminocarbonyl-C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-alkyl, Di(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-alkyl)ami-  
nocarbonyl-C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-alkyl, Carboxyl, Carboxy-C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-alkyl,

45

## 87

Phenyl, Phenoxy, Phenylthio, Phenylamino, Phenyl-C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-alkyl, Phenyl-C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-alkoxy, 3- bis 6-gliedriges Heterocyclyl und 5- oder 6-gliedriges Heteroaryl, wobei die acht letztgenannten Reste ihrerseits partiell oder

5 vollständig halogeniert sein können und/oder ein bis drei Substituenten aus der Gruppe Nitro, Cyano, 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>-Halogenalkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-Halogenalkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-Alkylthio, C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-Halogenalkylthio, C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-Alkylsulfinyl, C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-Halogenalkylsulfinyl, C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-Alkylsulfonyl und C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-Halogenalkylsulfonyl tragen können;

10

wobei das oben genannte 5-gliedrige Heteroaryl nicht Pyrazolyl oder Thien-yl ist;

15 R<sup>1</sup> - R<sup>7</sup> Wasserstoff, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkyl oder C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkyl;

Y Aryl, das partiell oder vollständig halogeniert sein kann und/oder ein bis drei Substituenten aus der Gruppe Cyano, Nitro, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkyl, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-Alkenyl, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-Alkynyl,

20 C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkylthio, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkylthio, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkoxy-carbonyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkoxy-carbonyl-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkylsulfonyl, Phenyl, Phenoxy und Phenylcarbonyl, Benzo[1,4]dioxonyl, Benzo[1,3]dioxolanyl, 2,3-Dihydrobenzofuranyl oder Benzimidazol; oder

25 5 gliedriges Heteroaryl mit ein bis vier Stickstoffatomen, oder mit ein bis drei Stickstoffatomen und einem Sauerstoff- oder Schwefelatom, oder mit einem Sauerstoff- oder Schwefelatom; oder

30 6-gliedriges Heteroaryl mit ein bis vier Stickstoffatomen;

wobei die Heterocyclen partiell oder vollständig halogeniert sein können und/oder ein bis drei Substituenten aus der Gruppe Cyano, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkyl,

35 C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkoxy-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkoxy-carbonyl und C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkylsulfonyl tragen können;

sowie deren landwirtschaftlich brauchbaren Salze.

40 2. 3-Heteroarylsubstituierte Isoxazoline der Formel I gemäß Anspruch 1, wobei X ein 6-gliedriges Heteroaryl mit ein bis vier Stickstoffatomen darstellt, das partiell oder vollständig halogeniert ist und/oder ein bis drei Substituenten aus folgender Gruppe trägt:

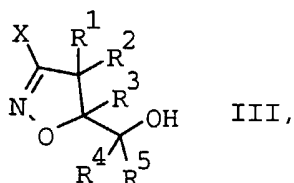
45 Cyano, Nitro, Hydroxy, C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-Alkyl, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-Cycloalkyl, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-Halogen-cycloalkyl, C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>-Alkenyl, C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>-Alkynyl, C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-Halogenalkyl, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkenyl, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-Halogen-



- alkinyl, C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-Cyanoalkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-Cyanoalkenyl, C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-Alkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-Halogenalkoxy, 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>-Alkoxy-C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-alkoxy, Amino, C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-Alkylamino, Di(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-alkyl)amino, C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-Alkylcarbonylamino, N-C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-Alkylcarbonyl-N-C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-alkylamino, C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-Alkoxy-carbonylamino, N-C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-Alkoxy-carbonyl-N-C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-alkylamino, Amino-C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-Alkylamino-C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-alkyl, Di(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-alkyl)amino-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>-Halogenalkylthio, C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-Alkylthio-C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-Alkylsulfinyl, C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-Halogenalkylsulfinyl, C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-Alkylsulfonyl, C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-Halogenalkylsulfonyl, C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-Alkylsulfonyl-C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-Alkylcarbonyl, C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-Alkoxy-carbonyl, C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-Alkoxy-carbonyl-C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-alkyl, Aminocarbonyl, C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-Alkylaminocarbonyl, Di(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-alkyl)aminocarbonyl, Aminocarbonyl-C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-Alkylaminocarbonyl-C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-alkyl, Di(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-alkyl)aminocarbonyl-C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-alkyl, Carboxyl, Carboxy-C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-alkyl, Phenyl, Phenoxy, Phenylthio, Phenylamino, Phenyl-C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-alkyl, Phenyl-C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-alkoxy, 3- bis 6-gliedriges Heterocyclyl und 5- oder 6-gliedriges Heteroaryl, wobei die acht letztgenannten Reste ihrerseits oder vollständig halogeniert sein können und/oder ein bis drei Substituenten aus der Gruppe Nitro, Cyano, 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>-Halogenalkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-Halogenalkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-Alkylthio, C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-Halogenalkylthio, C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-Alkylsulfinyl, C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-Halogenalkylsulfinyl, C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-Alkylsulfonyl und C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-Halogenalkylsulfonyl tragen können.
3. 3-Heteroarylsubstituierte Isoxazoline der Formel I gemäß Anspruch 1, wobei X ein 5-gliedriges Heteroaryl mit ein bis vier Stickstoffatomen, oder mit ein bis drei Stickstoffatomen und einem Schwefel- oder Sauerstoffatom, oder mit einem Sauerstoff- oder Schwefelatom aus folgender Gruppe: Pyrrolyl, Furanyl, Imidazolyl, Oxazolyl, Isoxazolyl, Thiazolyl, Isothiazolyl, 1,2,3-Triazolyl, 1-H-1,2,4-Triazolyl, 4-H-1,2,4-Triazolyl, 1,2,3-Oxadiazolyl, 1,2,4-Oxadiazolyl, 1,3,4-Oxadiazolyl, 1,2,3-Thiadiazolyl, 1,2,4-Thiadiazolyl, 1,3,4-Thiadiazolyl und 1-H-Tetrazolyl darstellt; und partiell oder vollständig halogeniert ist und/oder ein bis drei Substituenten aus folgender Gruppe trägt:
- Cyano, Nitro, Hydroxy, C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-Alkyl, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-Cycloalkyl, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-Halogen-cycloalkyl, C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>-Alkenyl, C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>-Alkinyl, C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-Halogenalkyl, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkenyl, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkinyl, C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-Cyanoalkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-Cyanoalkenyl, C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-Alkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-Halogenalkoxy, 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>-Alkoxy-C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-alkoxy, Amino, C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-Alkylamino, Di(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-alkyl)amino, C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-Alkylcarbonylamino, N-C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-Alkylcarbonyl-N-C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-alkylamino, C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-Alkoxy-carbonylamino, N-C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-Alkoxy-carbonyl-N-C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-alkylamino, Amino-C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-Alkylami-

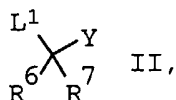
- no-C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-alkyl, Di(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-alkyl)amino-C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-Alkylthio, C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-Halogenalkylthio, C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-Alkylthio-C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-Alkylsulfinyl, C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-Halogenalkylsulfinyl, C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-Alkylsulfonyl, C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-Halogenalkylsulfonyl, C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-Alkylsulfonyl-C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-Alkylcarbonyl, C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-Alkoxy-carbonyl, C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-Alkoxy-carbonyl-C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-alkyl, Aminocarbonyl, C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-Alkylaminocarbonyl, Di(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-alkyl)aminocarbonyl, Aminocarbonyl-C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-Alkylaminocarbonyl-C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-alkyl, Di(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-alkyl)aminocarbonyl-C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-alkyl, Carboxyl, Carboxy-C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-alkyl, Phenyl, Phenoxy, Phenylthio, Phenylamino, Phenyl-C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-alkyl, Phenyl-C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-alkoxy, 3- bis 6-gliedriges Heterocyclyl und 5- oder 6-gliedriges Heteroaryl, wobei die acht letztgenannten Reste ihrerseits oder vollständig halogeniert sein können und/oder ein bis drei Substituenten aus der Gruppe Nitro, Cyano, 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>-Halogenalkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-Halogenalkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-Alkylthio, C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-Halogenalkylthio, C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-Alkylsulfinyl, C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-Halogenalkylsulfinyl, C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-Alkylsulfonyl, C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-Halogenalkylsulfonyl tragen können.
4. Verfahren zur Herstellung von 3-heteroarylsubstituierten Isoxazolinen der Formel I gemäß Anspruch 1, dadurch gekennzeichnet, daß man

- a) 5-Hydroxymethyloxazoline der Formel III



wobei X, R<sup>1</sup>-R<sup>5</sup> die unter Anspruch 1 genannten Bedeutungen haben,

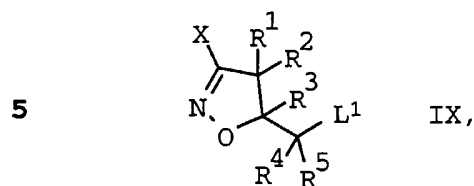
mit Arylmethylderivaten der Formel II



wobei R<sup>6</sup> und R<sup>7</sup> die unter Anspruch 1 genannten Bedeutungen haben und L<sup>1</sup> für eine nucleophil verdrängbare Abgangsgruppe steht, oder

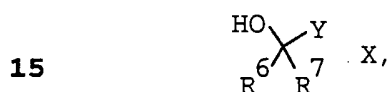
## 90

b) Methylisoxazolinderivate der Formel IX



10 wobei X, R<sup>1</sup>-R<sup>5</sup> die unter Anspruch 1 genannten Bedeutung haben und L<sup>2</sup> für eine nucleophil verdrängbare Abgangsgruppe steht,

mit Arylmethylalkoholen der Formel X

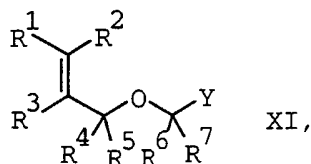


wobei R<sup>6</sup> und R<sup>7</sup> die unter Anspruch 1 genannten Bedeutung haben,

20 umsetzt.

5. Verfahren zur Herstellung von 3-heteroarylsubstituierten Isoxazolinen der Formel I gemäß Anspruch 1, dadurch gekennzeichnet, daß man Arylmethylallylether der Formel XI

25



30

wobei Y, R<sup>1</sup>-R<sup>7</sup> die unter Anspruch 1 genannten Bedeutungen haben,

35 mit einem Nitriloxid der Formel V

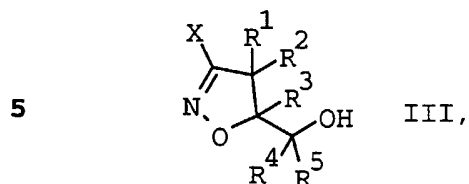


40 wobei X die unter Anspruch 1 genannten Bedeutungen hat, umsetzt.

45

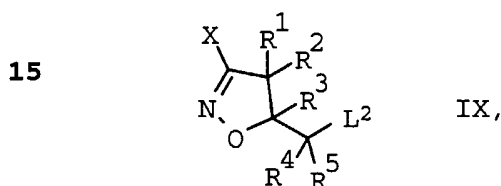
## 91

6. 5-Hydroxymethyloxazoline der Formel III .



- 10 wobei X, R<sup>1</sup>-R<sup>5</sup> die unter Anspruch 1 genannten Bedeutungen haben.

7. Methylisoxazolinderivate der Formel IX



- 20 wobei X, R<sup>1</sup>-R<sup>5</sup> die unter Anspruch 1 genannten Bedeutungen haben und L<sup>2</sup> für eine nucleophil verdrängbare Abgangsgruppe steht.

- 25 8. Mittel, enthaltend eine herbizid wirksame Menge mindestens eines 3-heteroarylsubstituierten Isoxazolins der Formel I oder eines landwirtschaftlich brauchbaren Salzes von I gemäß den Ansprüchen 1 bis 3 und für die Formulierung von Pflanzenschutzmitteln übliche Hilfsmittel.

- 30 9. Verfahren zur Herstellung von Mitteln gemäß Anspruch 8, dadurch gekennzeichnet, daß man eine herbizid wirksame Menge mindestens eines 3-heteroarylsubstituierten Isoxazolins der Formel I gemäß den Ansprüchen 1 bis 3 oder eines landwirtschaftlich brauchbaren Salzes von I und für die Formulierung von Pflanzenschutzmitteln übliche Hilfsmittel mischt.
- 35

- 40 10. Verfahren zur Bekämpfung von unerwünschtem Pflanzenwuchs, dadurch gekennzeichnet, daß man eine herbizid wirksame Menge mindestens eines 3-heteroarylsubstituierten Isoxazolins der Formel I gemäß den Ansprüchen 1 bis 3 oder eines landwirtschaftlich brauchbaren Salzes von I auf Pflanzen, deren Lebensraum und/oder auf Samen einwirken läßt.

- 45 11. Verwendung der 3-heteroarylsubstituierten Isoxazoline der Formel I gemäß den Ansprüchen 1 bis 3 und deren landwirtschaftlich brauchbaren Salze als Herbizide.

**INTERNATIONAL SEARCH REPORT**

International Application No

PCT/EP 03/04136

**A. CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER**  
 IPC 7 A01N43/80 C07D413/04 C07D417/04

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)  
 IPC 7 A01N 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 practical, search terms used)

EPO-Internal, PAJ, WPI Data, CHEM ABS Data

**C. DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT**

Category °	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
X	JP 2001 158787 A (NIPPON NOHYAKU CO LTD (JP)) 12 June 2001 (2001-06-12) cited in the application Verbindungen Nr. 85-197 & PAJ Zusammenfassung ---	1-11
X	WO 02 19825 A (KOREA RESEARCH INSTITUTE OF CHEMICAL TECHNOLOGY (KR)) 14 March 2002 (2002-03-14) cited in the application the whole document ---	1-11
X	EP 0 334 120 A (BASF AG (DE)) 27 September 1989 (1989-09-27) cited in the application the whole document -----	1-11

Further documents are listed in the continuation of box C.

Patent family members are listed in 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.
- \* & \* document member of the same patent family

Date of the actual completion of the international search

18 August 2003

Date of mailing of the international search report

25/08/2003

Name and mailing address of the ISA

European Patent Office, P.B. 5818 Patentlaan 2  
 NL - 2280 HV Rijswijk  
 Tel. (+31-70) 340-2040, Tx. 31 651 epo nl,  
 Fax: (+31-70) 340-3016

Authorized officer

Cortés, J

## INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No.

PCT/EP 03/04136

**Box I Observations where certain claims were found unsearchable (Continuation of item 1 of first sheet)**

This international search report has not been established in respect of certain claims under Article 17(2)(a) for the following reasons:

1.  Claims Nos.:  
because they relate to subject matter not required to be searched by this Authority, namely:
  
2.  Claims Nos.: **7 ( in part )**  
because they relate to parts of the international application that do not comply with the prescribed requirements to such an extent that no meaningful international search can be carried out, specifically:  
  
**See the supplementary sheet, further document PCT/ISA/ 210**
  
3.  Claims Nos.:  
because they are dependent claims and are not drafted in accordance with the second and third sentences of Rule 6.4(a).

**Box II Observations where unity of invention is lacking (Continuation of item 2 of first sheet)**

This International Searching Authority found multiple inventions in this international application, as follows:

**See the supplementary sheet**

1.  As all required additional search fees were timely paid by the applicant, this international search report covers all searchable claims.
2.  As all searchable claims could be searched without effort justifying an additional fee, this Authority did not invite payment of any additional fee.
3.  As only some of the required additional search fees were timely paid by the applicant, this international search report covers only those claims for which fees were paid, specifically claims Nos.:
  
4.  No required additional search fees were timely paid by the applicant. Consequently, this international search report is restricted to the invention first mentioned in the claims; it is covered by claims Nos.:

**Remark on Protest**

- The additional search fees were accompanied by the applicant's protest.  
 No protest accompanied the payment of additional search fees.

The International Searching Authority found multiple (groups of) inventions in this international application, as follows:

1. Claims: 1-11 (in part)  
X is pyrrolyl
2. Claims: 1-11 (in part)  
X is furanyl
3. Claims: 1-11 (in part)  
X is imidazolyl
4. Claims: 1-11 (in part)  
X is oxazolyl
5. Claims: 1-11 (in part)  
X is isoxazolyl
6. Claims: 1-11 (in part)  
X is thiazolyl
7. Claims: 1-11 (in part)  
X is isothiazolyl
8. Claims: 1-11 (in part)  
X is 1,2,3-, 1-H-1,2,4- or 4-H-1,2,4-triazolyl
9. Claims: 1-11 (in part)  
X is an 1,2,3-, 1,2,4- or 1,3,4-oxadiazolyl
10. Claims: 1-11 (in part)  
X is an 1,2,3-, 1,2,4- or 1,3,4-thiadiazolyl
11. Claims: 1-11 (in part)  
X is an 1-H tetrazolyl

12. Claims: 1-11 (in part)

X is a 6-membered heteroaryl with 1-4 nitrogen atoms



## BOX I.2

## Claim: 7 (in part)

The functional definition of substituent L2 as a "nucleophile displaceable leaving group" makes the scope of Claim 7 unclear (PCT Article 6) and encompasses so many possibilities that a meaningful search over the entire claimed scope is not possible. Consequently, the search was directed to the parts of the claims that can be considered clear, namely the compounds of Formula IX as per Claim 7 in which L2 is a halogen, C1-C6-alkylsulfonyl or C1-C6-halogen alkylsulfonyloxy (see the description, page 72, lines 1-12).

The applicant is advised that claims or parts of claims relating to inventions in respect of which no international search report has been established normally cannot be the subject of an international preliminary examination (PCT Rule 66.1(e)). In its capacity as International Preliminary Examining Authority the EPO generally will not carry out a preliminary examination for subjects that have not been searched. This also applies to cases where the claims were amended after receipt of the international search report (PCT Article 19) or where the applicant submits new claims in the course of the procedure under PCT Chapter II.

## INTERNATIONAL SEARCH REPORT

Information on patent family members

International Application No

PCT/EP 03/04136

Patent document cited in search report		Publication date	Patent family member(s)	Publication date
JP 2001158787	A	12-06-2001	NONE	
WO 0219825	A	14-03-2002	KR 2002019750 A AU 8629401 A WO 0219825 A1	13-03-2002 22-03-2002 14-03-2002
EP 0334120	A	27-09-1989	DE 3809765 A1 DE 58901518 D1 EP 0334120 A1 HU 50141 A2 US 4983210 A	05-10-1989 02-07-1992 27-09-1989 28-12-1989 08-01-1991

INTERNATIONALER RECHERCHENBERICHT

Internationales Aktenzeichen

PCT/EP 03/04136

<b>A. KLASSIFIZIERUNG DES ANMELDUNGSGEGENSTANDES</b> IPK 7 A01N43/80 C07D413/04 C07D417/04		
Nach der Internationalen Patentklassifikation (IPK) oder nach der nationalen Klassifikation und der IPK		
<b>B. RECHERCHIERTE GEBIETE</b> Recherchierter Mindestprüfstoff (Klassifikationssystem und Klassifikationssymbole ) IPK 7 A01N C07D		
Recherchierte aber nicht zum Mindestprüfstoff gehörende Veröffentlichungen, soweit diese unter die recherchierten Gebiete fallen		
Während der internationalen Recherche konsultierte elektronische Datenbank (Name der Datenbank und evtl. verwendete Suchbegriffe) EPO-Internal, PAJ, WPI Data, CHEM ABS Data		
<b>C. ALS WESENTLICH ANGESEHENE UNTERLAGEN</b>		
Kategorie*	Bezeichnung der Veröffentlichung, soweit erforderlich unter Angabe der in Betracht kommenden Teile	Betr. Anspruch Nr.
X	JP 2001 158787 A (NIPPON NOHYAKU CO LTD (JP)) 12. Juni 2001 (2001-06-12) in der Anmeldung erwähnt Verbindungen Nr. 85-197 & PAJ Zusammenfassung ---	1-11
X	WO 02 19825 A (KOREA RESEARCH INSTITUTE OF CHEMICAL TECHNOLOGY (KR)) 14. März 2002 (2002-03-14) in der Anmeldung erwähnt das ganze Dokument ---	1-11
X	EP 0 334 120 A (BASF AG (DE)) 27. September 1989 (1989-09-27) in der Anmeldung erwähnt das ganze Dokument -----	1-11
<input type="checkbox"/> Weitere Veröffentlichungen sind der Fortsetzung von Feld C zu entnehmen		
<input checked="" type="checkbox"/> Siehe Anhang Patentfamilie		
* Besondere Kategorien von angegebenen Veröffentlichungen : *A* Veröffentlichung, die den allgemeinen Stand der Technik definiert, aber nicht als besonders bedeutsam anzusehen ist *E* älteres Dokument, das jedoch erst am oder nach dem internationalen Anmeldedatum veröffentlicht worden ist *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) *O* Veröffentlichung, die sich auf eine mündliche Offenbarung, eine Benutzung, eine Ausstellung oder andere Maßnahmen bezieht *P* Veröffentlichung, die vor dem internationalen Anmeldedatum, aber nach dem beanspruchten Prioritätsdatum veröffentlicht worden ist *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 *X* Veröffentlichung von besonderer Bedeutung; die beanspruchte Erfindung kann allein aufgrund dieser Veröffentlichung nicht als neu oder auf erfinderischer Tätigkeit beruhend betrachtet werden *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 *&* Veröffentlichung, die Mitglied derselben Patentfamilie ist		
Datum des Abschlusses der internationalen Recherche 18. August 2003		Absendedatum des internationalen Recherchenberichts 25/08/2003
Name und Postanschrift der Internationalen Recherchenbehörde Europäisches Patentamt, P.B. 5818 Patentlaan 2 NL - 2280 HV Rijswijk Tel. (+31-70) 340-2040, Tx. 31 651 epo nl, Fax: (+31-70) 340-3016		Bevollmächtigter Bediensteter Cortés, J

# INTERNATIONALER RECHERCHENBERICHT

Internationales Aktenzeichen  
PCT/EP 03/04136

## Feld I Bemerkungen zu den Ansprüchen, die sich als nicht recherchierbar erwiesen haben (Fortsetzung von Punkt 2 auf Blatt 1)

Gemäß Artikel 17(2)a) wurde aus folgenden Gründen für bestimmte Ansprüche kein Recherchenbericht erstellt:

1.  Ansprüche Nr.  
weil sie sich auf Gegenstände beziehen, zu deren Recherche die Behörde nicht verpflichtet ist, nämlich
  
2.  Ansprüche Nr. 7 (teilweise)  
weil sie sich auf Teile der internationalen Anmeldung beziehen, die den vorgeschriebenen Anforderungen so wenig entsprechen, daß eine sinnvolle internationale Recherche nicht durchgeführt werden kann, nämlich  
siehe Zusatzblatt WEITERE ANGABEN PCT/ISA/210
  
3.  Ansprüche Nr.  
weil es sich dabei um abhängige Ansprüche handelt, die nicht entsprechend Satz 2 und 3 der Regel 6.4 a) abgefaßt sind.

## Feld II Bemerkungen bei mangelnder Einheitlichkeit der Erfindung (Fortsetzung von Punkt 3 auf Blatt 1)

Die internationale Recherchenbehörde hat festgestellt, daß diese internationale Anmeldung mehrere Erfindungen enthält:

siehe Zusatzblatt

1.  Da der Anmelder alle erforderlichen zusätzlichen Recherchegebühren rechtzeitig entrichtet hat, erstreckt sich dieser internationale Recherchenbericht auf alle recherchierbaren Ansprüche.
  
2.  Da für alle recherchierbaren Ansprüche die Recherche ohne einen Arbeitsaufwand durchgeführt werden konnte, der eine zusätzliche Recherchegebühr gerechtfertigt hätte, hat die Behörde nicht zur Zahlung einer solchen Gebühr aufgefordert.
  
3.  Da der Anmelder nur einige der erforderlichen zusätzlichen Recherchegebühren rechtzeitig entrichtet hat, erstreckt sich dieser internationale Recherchenbericht nur auf die Ansprüche, für die Gebühren entrichtet worden sind, nämlich auf die Ansprüche Nr.
  
4.  Der Anmelder hat die erforderlichen zusätzlichen Recherchegebühren nicht rechtzeitig entrichtet. Der internationale Recherchenbericht beschränkt sich daher auf die in den Ansprüchen zuerst erwähnte Erfindung; diese ist in folgenden Ansprüchen erfaßt:

Bemerkungen hinsichtlich eines Widerspruchs  Die zusätzlichen Gebühren wurden vom Anmelder unter Widerspruch gezahlt.

Die Zahlung zusätzlicher Recherchegebühren erfolgte ohne Widerspruch.

## WEITERE ANGABEN

PCT/ISA/ 210

Die internationale Recherchenbehörde hat festgestellt, daß diese internationale Anmeldung mehrere (Gruppen von) Erfindungen enthält, nämlich:

1. Ansprüche: 1-11 (teilweise)

X ist Pyrrolyl

2. Ansprüche: 1-11 (teilweise)

X ist Furanyl

3. Ansprüche: 1-11 (teilweise)

X ist Imidazolyl

4. Ansprüche: 1-11 (teilweise)

X ist Oxazolyl

5. Ansprüche: 1-11 (teilweise)

X ist Isoxazolyl

6. Ansprüche: 1-11 (teilweise)

X ist Thiazolyl

7. Ansprüche: 1-11 (teilweise)

X ist Isothiazolyl

8. Ansprüche: 1-11 (teilweise)

X ist 1,2,3-, 1-H-1,2,4- oder 4-H-1,2,4-Triazolyl

9. Ansprüche: 1-11 (teilweise)

X ist ein 1,2,3-, 1,2,4- oder 1,3,4-Oxadiazolyl

10. Ansprüche: 1-11 (teilweise)

X ist ein 1,2,3-, 1,2,4- oder 1,3,4-Thiadiazolyl

11. Ansprüche: 1-11 (teilweise)

WEITERE ANGABEN

PCT/ISA/ 210

X ist ein 1-H Tetrazolyl

12. Ansprüche: 1-11 (teilweise)

X ist ein 6-gliedriges Heteroaryl mit ein bis vier  
Stickstoffatomen

WEITERE ANGABEN

PCT/ISA/ 210

Fortsetzung von Feld I.2

Ansprüche Nr.: 7 (teilweise)

Aufgrund der funktionellen Definition des Substituenten L2 als "nucleophil verdrängbare Abgangsgruppe" ist der Umfang des Patentanspruchs 7 unklar im Sinne des Artikels 6 PCT und umfasst so viele Möglichkeiten, dass eine sinnvolle Recherche über den gesamten beanspruchten Umfang nicht möglich ist. Daher wurde die Recherche auf die Teile der Patentansprüche gerichtet, die als klar gelten können, nämlich Verbindungen der Formel IX nach Anspruch 7 in denen L2 Halogen, C1-C6-Alkylsulfonyl oder C1-C6-Halogenalkylsulfonyloxy ist (siehe Beschreibung, Seite 72, Zeilen 1-12).

Der Anmelder wird darauf hingewiesen, daß Patentansprüche, oder Teile von Patentansprüchen, auf Erfindungen, für die kein internationaler Recherchenbericht erstellt wurde, normalerweise nicht Gegenstand einer internationalen vorläufigen Prüfung sein können (Regel 66.1(e) PCT). In seiner Eigenschaft als mit der internationalen vorläufigen Prüfung beauftragte Behörde wird das EPA also in der Regel keine vorläufige Prüfung für Gegenstände durchführen, zu denen keine Recherche vorliegt. Dies gilt auch für den Fall, daß die Patentansprüche nach Erhalt des internationalen Recherchenberichtes geändert wurden (Art. 19 PCT), oder für den Fall, daß der Anmelder im Zuge des Verfahrens gemäß Kapitel II PCT neue Patentansprüche vorlegt.

**INTERNATIONALER RECHERCHENBERICHT**

Angaben zu Veröffentlichungen, die zur selben Patentfamilie gehören

Internationales Aktenzeichen

PCT/EP 03/04136

Im Recherchenbericht angeführtes Patentdokument	Datum der Veröffentlichung	Mitglied(er) der Patentfamilie	Datum der Veröffentlichung
JP 2001158787 A	12-06-2001	KEINE	
WO 0219825 A	14-03-2002	KR 2002019750 A AU 8629401 A WO 0219825 A1	13-03-2002 22-03-2002 14-03-2002
EP 0334120 A	27-09-1989	DE 3809765 A1 DE 58901518 D1 EP 0334120 A1 HU 50141 A2 US 4983210 A	05-10-1989 02-07-1992 27-09-1989 28-12-1989 08-01-1991