

1337-93

KÖZZÉTÉTELI
PÉLDÁNY

31095

64760

57.269/BE

K I V O N A T

~~Eljárás~~ Szubsztituált pirido^{uk}[2,3-d]pirimidin-2,4(1H,3H)-dionok, eljárás előállításuk^{uk}ra és alkalmazásukra, valamint csökkentett fitotoxicitású herbicid készítmények
BASF AKTIENGESELLSCHAFT, LUDWIGSHAFEN,

NÉMET SZÖVETSÉGI KÖZTÁRSASÁG

A bejelentés napja: 1991.10.30.

Elsőbbsége: 1990.11.08. (P 40 35 479.2)

NÉMET SZÖVETSÉGI KÖZTÁRSASÁG

A nemzetközi bejelentés száma: PCT/EP91/02055

A nemzetközi közzététel száma: WO 92/08719

(szerinti vegyületek) A találmány ~~tárgyát az~~ (Ia) és (Ib) általános képletű ~~leben~~ ~~pirido~~ ~~[2,3-d]pirimidin-2,4(1H,3H)-dionok~~ ~~ahol~~

R¹ és R² hidrogénatom, alkil-, halogénezett alkil- vagy ciklo-alkilcsoport;

R³ hidrogénatom, alkil-, amino-, hidroxil-, merkaptó-, alkil-tio-csoport, vagy adott esetben szubsztituált arilcsoport;

R⁴ hidrogénatom, alkil-, alkoxi-karbonil-, (alkil-tio)-karbonil-, alkoxi-tiokarbonil-, (alkil-tio)-tiokarbonil-csoport, ciano- vagy karbamoilcsoport;

R⁵ hidrogénatom, alkil-, cianocsoport, -C(O)R⁷ vagy -C(S)R⁷ általános képletű csoport;

R⁶ alkil-, aril-alkenil-csoport, adott esetben szubsztituált arilcsoport, -CH₂R⁸ általános képletű csoport, alkoxi-karbonil-, (alkil-tio)-karbonil-, alkoxi-tiokarbonil-, (alkil-tio)-tiokarbonil-, hidroxil-, merkaptó-, alkoxi-, alkil-tio-

-csoport, amino-, alkil-amino-csoport, -NHCXR^9 vagy $\text{-NHSO}_2\text{R}^{10}$ általános képletű csoport, adott esetben szubsztituált tienil-, piridil-, indolilcsoport;

R^7 hidrogénatom, alkilcsoport, hidroxil-, merkaptol-, alkoxil-, alkil-tiol-, alkoxil-karbonil-, (alkil-tiol)-karbonil-, alkoxil-tiokarbonil-, (alkil-tiol)-tiokarbonil-csoport, amino-, alkil-amino-, dialkil-amino-csoport, vagy adott esetben szubsztituált arilcsoport;

R^8 halogénatom, hidroxil-, merkaptocsoport, alkoxil-, alkil-tiol-, alkoxil-karbonil-, (alkil-tiol)-karbonil-, alkoxil-tiokarbonil-, (alkil-tiol)-tiokarbonil-csoport; egy (a) általános képletű csoport;

R^9 alkil-, halogénezett alkilcsoport, $\text{-NR}^1\text{R}^2$ vagy -OR^1 általános képletű csoport;

R^{10} alkilcsoport, adott esetben szubsztituált arilcsoport;

R^{11} halogénatom, hidroxil-, merkaptocsoport, alkoxil-, alkil-tiol-, alkil-, nitro- vagy aminocsoport;

X oxigénatom vagy kénatom.++

~~valamint ezeknek a mezőgazdaságban felhasználható, egy bázisos~~
nitrogénatomot vagy savas hidroxicsoporthoz tartalmazó sói és az ezek előállítására szolgáló eljárás képezik.

Az (Ia) általános képletű vegyületeket úgy állítják elő, hogy egy (II) általános képletű vegyületet egy (III) vagy egy (IV) általános képletű vegyülettel reagáltatnak, és a kapott in-
termeiért magasabb hőmérsékleten tovább átalakítják.

Az (Ib) általános képletű vegyületeket úgy állítják elő,
~~hogy egy (II) általános képletű vegyületet egy (VI) általános~~

~~Képletű vegyülettel reagáltatnak; vagy~~

~~egy (VIIa) vagy (VIIb) általános képletű vegyületet egy (VIIIa), (VIIIb) vagy (VIIIc) általános képletű vegyülettel reagáltatnak; vagy~~

~~egy (Ib) általános képletű vegyületet R^6 helyén más szubsztituenst tartalmazó (Ib) általános képletű vegyületté alakítanak át.~~

Az (Ia) és (Ib) általános képletű vegyületek ^{és sói} antidótumként fokozzák a (XI) és (XII) általános képletű herbicidek kultúrnövények általi elviselhetőségét.

1337-93

Budapesti Nemzetközi
Szabadalmi Iroda
H-1061 Budapest, Dalszínház u. 10.
Telefon: 153-3733, Fax: 153-3664

KÖZZÉTÉTELI
PÉLDÁNY

A 3 1 0 9 5

64760

57.269/BE

NSZOS:

C 07 D 471/04
A 01 N 25/32
A 01 N 43/90
A 01 N 39/02
A 01 N 43/40
A 01 N 43/72
A 01 N 43/60
A 01 N 35/10

Eljárás Szubsztituált pirido[2,3-d]pirimidin-2,4(1H,3H)-
^{eljárás} ^{uk}
-dionok előállítására és alkalmazására, valamint csökkentett fitotoxicitású
herbicid készítmények
BASF AKTIENGESSELLSCHAFT, LUDWIGSHAFEN,

NÉMET SZÖVETSÉGI KÖZTÁRSASÁG

Feltalálók:

HAGEN Helmut, FRANKENTHAL,
RAATZ Peter, FRANKENTHAL,
WALTER Helmut, OBRIGHEIM,
LANDES Andreas, LIMBURGERHOF,

NÉMET SZÖVETSÉGI KÖZTÁRSASÁG

A bejelentés napja: 1991.10.30.

Elsőbbsége: 1990.11.08. (P 40 35 479.2)

NÉMET SZÖVETSÉGI KÖZTÁRSASÁG

A nemzetközi bejelentés száma: PCT/EP91/02055

A nemzetközi közzététel száma: WO 92/08719

A találmány tárgyát az (Ia) és (Ib) általános képletű —
a képletben

- R^1 és R^2 jelentése hidrogénatom, 1-4 szénatomos alkilcsoport, halogénezett 1-4 szénatomos alkilcsoport, vagy 3-7 szénatomos cikloalkilcsoport;
- R^3 jelentése hidrogénatom, 1-4 szénatomos alkilcsoport, amino-, hidroxil-, merkaptocsoport, 1-4 szénatomos alkil-tio-csoport, 6 vagy 10 szénatomos arilcsoport, amely az R^{11} -nél megadottak közül 1-3 csoporttal lehet szubsztituálva;
- R^4 jelentése hidrogénatom, 1-4 szénatomos alkil-, 1-4 szénatomos alkoxi-karbonil-, 1-4 szénatomos (alkil-tio)-karbonil-, 1-4 szénatomos alkoxi-tiokarbonil-, 1-4 szénatomos (alkil-tio)-tiokarbonil-csoport, ciano- vagy karbamoilcsoport; vagy
- R^3 és R^4 együttesen 3-6 szénatomos alkilén-, 3-6 szénatomos alkenilén- vagy 1,2-feniléncsoportot képez;
- R^5 jelentése hidrogénatom, 1-4 szénatomos alkilcsoport, ciano-csoport, a $-C(O)R^7$ vagy $-C(S)R^7$ általános képletű csoport;
- R^6 jelentése 1-4 szénatomos alkil-, (6 szénatomos aril)-(2-4 szénatomos alkenil)-csoport, 6, 10 vagy 14 szénatomos aril-csoport, ahol az arilcsoportok szubsztituálva lehetnek az R^{11} -nél megadottak közül 1-3 csoporttal, $-CH_2R^8$ általános képletű csoport, 1-4 szénatomos alkoxi-karbonil-, 1-4 szénatomos (alkil-tio)-karbonil-, 1-4 szénatomos alkoxi-tiokarbonil-, 1-4 szénatomos (alkil-tio)-tiokarbonil-csoport-, hidroxil-, merkaptocsoport, 1-4 szénatomos alkoxi-, 1-4 szénatomos alkil-tio-csoport, amino-, 1-4 szénatomos alkil-amino-csoport, $-NHCXR^9$ és $-NH SO_2 R^{10}$ általános képletű csoport, 2-tienil-, 3-tienil-, 2-piridil-, 3-piridil-, 4-piridil-,

2-indolil-, 3-indolilcsoport, ahol a heteroarilcsoportok szubsztituálva lehetnek az R^{11} -nél megadottak közül egy vagy két csoporttal; vagy

R^5 és R^6 együttesen 3-6 szénatomos alkilén-, 3-5 szénatomos alkenilén- vagy 1,2-feniléncsoportot képez, amelyek szubsztituálva lehetnek 1-4 szénatomos alkil-, halogénezett 1-4 szénatomos alkil-, vagy 3-7 szénatomos cikloalkilcsoporttal, vagy karbonil- vagy tiokarbonil-csoportot is tartalmazhatnak;

R^7 jelentése hidrogénatom, 1-4 szénatomos alkil-, hidrox-, merkaptocsoport, 1-4 szénatomos alkoxi-, 1-4 szénatomos alkil-tio-, 1-4 szénatomos alkoxi-karbonil-, 1-4 szénatomos (alkil-tio)-karbonil-, 1-4 szénatomos alkoxi-tiokarbonil-, 1-4 szénatomos (alkil-tio)-tiokarbonil-csoport, amino-, 1-4 szénatomos alkil-amino-csoport, di(1-4 szénatomos alkil)-amino-csoport, 6 vagy 10 szénatomos arilcsoport, vagy (6 vagy 10 szénatomos aril)-amino-csoport, ahol az arilcsoportok még szubsztituálva lehetnek az R^{11} -nél megadott 1-3 csoporttal;

R^8 jelentése halogénatom, hidrox-, merkaptocsoport, 1-4 szénatomos alkoxi-, 1-4 szénatomos alkil-tio-, 1-4 szénatomos alkoxi-karbonil-, 1-4 szénatomos (alkil-tio)-karbonil-, 1-4 szénatomos alkoxi-tiokarbonil-, 1-4 szénatomos (alkil-tio)-tiokarbonil-csoport, vagy (a) általános képletű csoport;

R^9 jelentése 1-5 szénatomos alkil-, halogénezett 1-4 szénatomos alkilcsoport, $-NR^1R^2$ vagy $-OR^1$ általános képletű csoport;

R^{10} jelentése 1-4 szénatomos alkil-, 6 vagy 10 szénatomos aril-csoport, amely szubsztituálva lehet az R^{11} -nél megadottak közül 1-3 csoporttal;

R^{11} jelentése halogénatom, hidroxil-, merkaptó-, 1-4 szénatomos alkoxil-, 1-4 szénatomos alkil-tio-csoport, 1-4 szénatomos alkil-, nitro- vagy aminocsoport;

X jelentése oxigénatom vagy kénatom;

azzal a fenntartással, hogy

- a) R^1 és R^2 hidrogénatomtól, metil- vagy etilcsoporttól eltérő jelentésű,
- b) R^3 és R^4 egyike hidrogénatomtól eltérő jelentésű;
- c) R^5 és R^6 egyike hidrogénatomtól eltérő jelentésű;
- d) ha R^1 metilcsoportot, R^2 izobutilcsoportot és R^3 aminocsoportot jelent, akkor R^4 hidrogénatomtól eltérő jelentésű;
- e) ha R^1 metilcsoportot, R^2 hidrogénatomot és R^5 fenilcsoportot jelent, akkor R^6 hidroxicssoporttól eltérő jelentésű;
- f) ha R^1 metilcsoportot, R^2 hidrogénatomot és R^6 aminocsoportot jelent, akkor R^5 karboxi- vagy etoxi-karbonil-csoporttól eltérő jelentésű;
- g) ha R^1 hidrogénatomot, R^2 metilcsoportot és R^5 hidrogénatomot jelent, akkor R^6 hidroxicssoporttól eltérő jelentésű;
- h) ha R^1 hidrogénatomot, R^2 metilcsoportot és R^4 etoxi-karbonil-csoportot jelent, akkor R^6 metil- vagy aminocsoporttól eltérő jelentésű;
- i) ha R^5 cianocsoportot, R^6 hidroxicssoportot és R^1 butilcsoportot jelent, akkor R^2 hidrogénatomtól eltérő jelentésű; és

j) ha R^5 cianocsoportot, R^6 hidroxicssoportot és R^1 propilcsoportot jelent, akkor R^2 propilcsoporttól eltérő jelentésű —

pirido[2,3-d]pirimidin-2,4(1H,3H)-dionok, valamint ezeknek az (Ia) és (Ib) általános képletű vegyületeknek a mezőgazdaságban felhasználható olyan sói képezik, amelyek egy bázisos nitrogén-szubsztituenst vagy egy savas hidroxiszubsztituenst tartalmaznak.

A találmány tárgyát képezi még ezenkívül eljárás az (Ia) és (Ib) általános képletű vegyületek, valamint az olyan gyomírtó szerek előállítására, amelyek herbicid hatóanyagokként 2-(4-heteroaril-oxi)- vagy 2-(4-aril-oxi)-fenoxi-ecetsav- vagy propionsav-származékokat és/vagy ciklohexenon-származékokat, és antidótumként (Ia) és (Ib) általános képletű vegyületeket tartalmaznak, valamint a nemkívánatos növények növekedése elleni szelektív küzdelmet szolgáló eljárás ezekkel a gyomírtó szerekkel.

Az 1,3-diszubsztituált-2,4-dioxi-pirido[2,3-d]pirimidin-származékok már régóta a vegyületek ismert osztályát képezik. Így az Arch.Pharm., 311, 406 (1978) alatt leírják a 7-helyzetben szubsztituált pirido[2,3-d]pirimidin-2,4-dionokat, a 6- és 7-helyzetben szubsztituált 1-alkil- és 1,3-dimetil-pirido[2,3-d]-pirimidin-2,4-dionokat (lásd az 5. táblázatot is). Egyidejűleg utalnak egyes vegyületek tumorellenes vagy nyugtató hatású szerként való használatára. További 5-, 6-, valamint 6-, 7-diszubsztituált-1,3-dimetil-pirido[2,3-d]pirimidin-2,4-dionokat írnak le a J.Heterocycl. Chem., 22, 345 és 1469 (1985) alatt (lásd a 20. táblázatot is).

A (XI) általános képletű —

a képletben

R^a jelentése fenil-, piridil-, benzoxazolil-, benztiazolil- vagy benzpirazinilcsoport, ahol ezek az aromás gyűrűrendszerek egy vagy kétszeresen szubsztituálva lehetnek a következő csoportok valamelyikével: halogénatom, nitrocsoport, 1-4 szénatomos alkil-, halogénezett 1-4 szénatomos alkil-, halogénezett 1-4 szénatomos alkoxicssoport;

R^b jelentése hidrogénatom, 1-4 szénatomos alkilcsoport, vagy egy, a növények által elviselhető kation-ekvivalens; és

R^c jelentése hidrogénatom vagy metilcsoport —

a 2-(4-heteroaril-oxi)- vagy 2-(4-aril-oxi)-fenoxi-ecetsav-származékok csoportjába tartozó herbicid hatóanyagok a szakirodalomból, így a DE-A 22 23 894, DE-A 24 33 067, DE-A 25 76 251, DE-A 30 04 770 számú német szövetségi köztársaságbeli közzétételi iratokból, a BE-A 868 875 és BE-A 858 618 számú nyilvánosságra hozott belgiumi szabadalmi bejelentésekből ismertek (lásd az 1. táblázatot is).

Ezek a pázsitfűfélék családjába tartozó nemkívánatos növények növekedésének gátlását szolgálják. Ezeknek az anyagoknak a kultúrnövények általi elviselhetősége azonban kívánnivalókat hagy maga után.

Ugyanez vonatkozik a (XII) általános képletű —

a képletben

R^d jelentése 1-6 szénatomos alkilcsoport;

A jelentése 4 szénatomos alkilén- vagy 4 szénatomos alkenilén-lánc, ahol ezek a láncok 1-3-szorosan szubsztituálva lehetnek 1-3 szénatomos alkilcsoporttal és/vagy halogénatommal,

vagy kívánt esetben 1-3 szénatomos alkilcsoporttal szubsztituált olyan 3-6-tagú alkilénlánccal, amely gyűrűtagként tartalmaz egy, az oximéter-résszel nem közvetlenül szomszédos oxigén- vagy kénatomot;

- B jelentése nitro-, cianocsoport, halogénatom, 1-4 szénatomos alkil-, 1-4 szénatomos alkoxi-, 1-4 szénatomos alkil-tio-csoport, halogénezett 1-4 szénatomos alkoxicssoport, karboxi-, 1-4 szénatomos alkoxi-karbonil-, benzil-oxi-karbonil-csoport és/vagy fenilcsoport, ahol az aromás csoportok 1-3-szorosan szubsztituálva lehetnek a következő csoportok valamelyikével: nitro-, cianocsoport, halogénatom, 1-4 szénatomos alkil-, 1-4 szénatomos alkoxi-, 1-4 szénatomos alkil-tio-csoport, halogénezett 1-4 szénatomos alkil-, halogénezett 1-4 szénatomos alkoxicssoport, karboxi-, 1-4 szénatomos alkoxi-karbonil- és/vagy benzil-oxi-karbonil-csoport;
- n értéke 0 és 3 közötti szám, vagy 0 és 5 közötti szám abban az esetben, ha B halogénatomot jelent;
- R^e jelentése (1-4 szénatomos alkoxi)-(1-6 szénatomos alkil)-vagy (1-4 szénatomos alkil-tio)-(1-6 szénatomos alkil)-csoport; 3-7 szénatomos alkil- vagy 5-7 szénatomos cikloalke-
nilcsoport, ahol ezek a csoportok 1-3-szorosan szubsztituálva lehetnek a következő csoportok valamelyikével: 1-4 szénatomos alkil-, 1-4 szénatomos alkoxi-, 1-4 szénatomos alkil-tio-, halogénezett 1-4 szénatomos alkilcsoport, hidroxicssoport és/vagy halogénatom;
- 5-tagú telített heterociklusos, amely heteroatomként egy vagy két oxigén- és/vagy kénatomot tartalmaz, és amely háromig

terjedő számban szubsztituálva lehet a következő csoportok valamelyikével: 1-4 szénatomos alkil-, 1-4 szénatomos alkoxi, 1-4 szénatomos alkil-tio- és/vagy halogénezett 1-4 szénatomos alkilcsoport; egy vagy két oxigén- és/vagy kénatomot, és egy vagy két kettős kötést tartalmazó 6- vagy 7-tagú heterociklus, ahol ez a gyűrű 1-3-szorosan szubsztituálva lehet a következő csoportok valamelyikével: hidroxicsoport, halogénatom, 1-4 szénatomos alkil-, 1-4 szénatomos alkoxi-, 1-4 szénatomos alkil-tio- és/vagy halogénezett 1-4 szénatomos alkilcsoport;

egy vagy két nitrogénatomot és egy oxigén- vagy egy kénatomot tartalmazó 5-tagú heteroaromás rendszer, ahol ez a gyűrű 1-3-szorosan szubsztituálva lehet a következő csoportok valamelyikével: halogénatom, cianocsoport, 1-4 szénatomos alkil-, 1-4 szénatomos alkoxi-, 1-4 szénatomos alkil-tio-, halogénezett 1-4 szénatomos alkilcsoport, 2-6 szénatomos alkenil-, 2-6 szénatomos alkenil-oxi-, halogénezett 2-6 szénatomos alkenilcsoport és/vagy (1-4 szénatomos alkoxi)-(1-4 szénatomos alkil)-csoport;

fenilcsoport vagy piridilcsoport, ahol ezek a csoportok 1-3-szorosan szubsztituálva lehetnek a következő csoportok valamelyikével: halogénatom, nitro-, cianocsoport, 1-4 szénatomos alkil-, 1-4 szénatomos alkoxi-, 1-4 szénatomos alkil-tio-, halogénezett 1-4 szénatomos alkilcsoport, 3-6 szénatomos alkenil-oxi-, 3-6 szénatomos alkinil-oxi-csoport és/vagy $-NR^fR^g$ általános képletű csoport, amelyben

R^f jelentése hidrogénatom, 1-4 szénatomos alkil-, 3-6 szénato-

mos alkenil- vagy 3-6 szénatomos alkinilcsoport; és
R⁹ jelentése hidrogénatom, 1-4 szénatomos alkil-, 3-6 szénatomos alkenil-, 3-6 szénatomos alkinilcsoport, 1-6 szénatomos acilcsoport, vagy benzoilcsoport, ahol az aromás gyűrű 1-3-szorosan szubsztituálva lehet a következő csoportok valamelyikével: nitro-, cianocsoport, halogénatom, 1-4 szénatomos alkil-, 1-4 szénatomos alkoxi-, 1-4 szénatomos alkil-tio-csoport és/vagy halogénezett 1-4 szénatomos alkilcsoport — ciklohexenonszármazékokra.

Ezek a régebbi DE-A 4014985 és DE-A 4014986 számú német szövetségi köztáraságbeli közzétételi iratokban ugyancsak gyomírtó szerként vannak leírva, és túlnyomórészt a kétszikű és nem a pázsitfűfélék családjába tartozó fűfélék kultúráiban a nemkívánatos fűvek növekedésének gátlására szolgálnak. A szubsztitúensek szerkezete és az alkalmazott adagok szerint az e csoportba tartozó vegyületek a pázsitfűfélék, így a búza és a rizs kultúráiban is felhasználhatók a nemkívánatos fűvek növekedésének szelektív gátlására.

A találmány célkitűzése volt olyan vegyületeket előállítani, amelyek a fent említett (XI) és (XII) általános képletű gyomírtószerek alkalmazásánál fellépő hátrányokat legalább annyira csökkentik, hogy a kultúrnövények terméshezama már nem, vagy nem jelentősen csökkenjen.

Kísérleteink eredményeként ennek megfelelően találtuk a bevezetőben meghatározott (Ia) é (Ib) általános képletű vegyületeket.

Ezenkívül eljárásokat dolgoztunk ki az (Ia) é (Ib) általá-

nos képletű vegyületek előállítására, valamint eljárásokat növénykultúráknak egyrészt az (Ia) és/vagy (Ib) általános képletű vegyületekkel, másrészt a (XI) és/vagy (XII) általános képletű vegyületekkel való kombinált kezelésére.

Az (Ia) és (Ib) általános képletű vegyületek bizonyos származékai előfordulhatnak a környezet által elviselhető sók formájában. Előnyösek az alkálifémsók, különösen a kálium- vagy nátriumsók; az alkáliföldfémsók, különösen a kalcium-, magnézium- vagy báriumsók, a mangán-, réz-, cink- vagy vassók, valamint az ammónium-, foszfónium-, szulfónium- vagy szulfoxóniumsók, például az ammónium-, tetraalkil-ammónium-, benzil-trialkil-ammónium-sók, trialkil-szulfónium-sók vagy trialkil-szulfoxónium-sók.

Az (Ia) és (Ib) általános képletű vegyületek növényvédő szerként találmány szerinti felhasználására való tekintettel szubsztituensként előnyösen a következő csoportok jönnek tekintetbe:

R^1, R^2 jelentése hidrogénatom;
1-4 szénatomos alkilcsoport, így metil-, etil-, propil-, izopropil-, butil-, szek-butil-, izobutil-, terc-butil-csoport, különösen metil- és etilcsoport;
halogénezett 1-4 szénatomos alkilcsoport, különösen halogénezett 1-2 szénatomos alkilcsoport, így klór-metil-, diklór-metil-, triklór-metil-, fluor-klór-metil-, fluor-metil-, difluor-metil-, trifluor-metil-, fluor-diklór-metil-, difluor-klór-metil-, 1-fluor-etil-, 2-fluor-etil-, 2,2-difluor-etil-, 2,2,2-trifluor-etil-, 2-fluor-2-klór-etil-, 2,2-difluor-2-klór-

-etil, 2-fluor-2,2-diklór-etil-, 2,2,2-trifluor-etil- és pentafluor-etil-csoport;

3-7 szénatomos cikloalkilcsoport, így ciklopropil-, ciklopentil-, ciklohexil-, cikloheptilcsoport, különösen a ciklopropilcsoport;

- R^3 jelentése hidrogénatom, hidroxil-, merkaptó-, aminocsoport; 1-4 szénatomos alkilcsoport, miként R^1 -nél megemlítve, különösen metil- és etilcsoport; 1-4 szénatomos alkil-tio-csoport, így metil-tio-, etil-tio-, propil-tio-, izopropil-tio-, butil-tio-, szek-butyl-tio-, izobutyl-tio- és terc-butyl-tio-csoport; 6 vagy 10 szénatomos arilcsoport, így fenil-, naftilcsoport, amely 1-3-szorosan szubsztituálva lehet az R^{11} -nél megadott csoportokkal, előnyösen nitrocsoporttal, fluor- vagy klór-atommal;
- R^4 jelentése hidrogénatom, 1-4 szénatomos alkilcsoport, miként R^1 -nél megemlítve, különösen metil- és etilcsoport; 1-4 szénatomos alkoxi-karbonil-csoport, így metoxi-karbonil-, etoxi-karbonil-, propoxi-karbonil-, izopropoxi-karbonil-, butoxi-karbonil-, szek-butoxi-karbonil-, izobutoxi-karbonil-, terc-butoxi-karbonil-csoport; 1-4 szénatomos (alkil-tio)-karbonil-csoport, így (metil-tio)-karbonil-, (etil-tio)-karbonil-, (propil-tio)-karbonil-, (izopropil-tio)-karbonil-, (butil-tio)-karbonil-, (szek-butyl-tio)-karbonil-, (izobutyl-tio)-karbonil-, (terc-butyl-tio)-karbonil-csoport; 1-4 szénatomos alkoxi-tiokarbonil-csoport, így metoxi-tio-

karbonil-, etoxi-tiokarbonil-, propoxi-tiokarbonil-, izo-propoxi-tiokarbonil-, butoxi-tiokarbonil-, szek-butoxi-tiokarbonil-, izobutoxi-tiokarbonil-, terc-butoxi-tiokarbonil-csoport;

1-4 szénatomos (alkil-tio)-tiokarbonil-csoport, így (metil-tio)-tiokarbonil-, (etil-tio)-tiokarbonil-, (propil-tio)-tiokarbonil-, (izopropil-tio)-tiokarbonil-, (butil-tio)-tiokarbonil-, (szek-butyl-tio)-tiokarbonil-, (izobutyl-tio)-tiokarbonil-, (terc-butyl-tio)-tiokarbonil-csoport;

R^3 és R^4 jelentése együttesen 3-6 szénatomos alkiléncsoport, így tri-, tetra-, penta- és hexametiléncsoport, 3-6 szénatomos alkeniléncsoport, különösen 3-4 szénatomos alkeniléncsoport, így propenilén-, 1-butenilén-, 2-buteniléncsoport; 1,2-fenilkéncsoport;

R^5 jelentése hidrogénatom, 1-4 szénatomos alkilcsoport, miként R^1 -nél megadva, előnyösen metil- és etilcsoport;

a $-C(O)R^7$ és $-C(S)R^7$ általános képletű csoport, amelyekben R^7 előnyösen amino-, metoxi-, etoxi-, hidroxil-, metil-, etil-, fenil-, metoxi-karbonil- és etoxi-karbonil-csoportot jelent;

R^6 jelentése 1-4 szénatomos alkilcsoport, miként R^1 -nél megadva, előnyösen metil- és etilcsoport;

sztirilcsoport;

6 vagy 10 szénatomos arilcsoport, így fenil-, naftilcsoport, amely 1-3-szorosan szubsztituálva lehet az R^{11} -nél megadott csoportokkal, előnyösen klóratommal, nitro- és metilcsoporttal;

a $-\text{CH}_2\text{R}^8$ általános képletű csoport, amelyben R^8 előnyösen klóratomot, metoxi-karbonil- és karboxicsoportot jelent;

1-4 szénatomos alkoxi-karbonil-csoport, miként R^4 -nél megadva;

1-4 szénatomos (alkil-tio)-karbonil-csoport, miként R^4 -nél megadva;

1-4 szénatomos alkoxi-tiokarbonil-csoport, miként R^4 -nél megadva;

1-4 szénatomos (alkil-tio)-tiokarbonil-csoport, miként R^4 -nél megadva;

hidroxicsoport; aminocsoport;

1-4 szénatomos alkoxicsoport, így metoxi-, etoxi-, propoxi-, izopropoxi-, butoxi-, szek-butoxi-, izobutoxi- és terc-butoxi-csoport, különösen előnyösen izopropoxicsoport;

1-4 szénatomos alkil-tio-csoport, miként R^3 -nál megadva;

1-4 szénatomos alkil-amino-csoport, így metil-amino-, etil-amino-, propil-amino-, izopropil-amino-, butil-amino-, szek-butil-amino-, izobutil-amino-, terc-butil-amino-csoport;

az $-\text{NHCXR}^9$ általános képletű csoport, ahol X előnyösen oxigénatomot jelent, különösen metil-karbonil-amino- és etil-karbonil-amino-csoport;

az $-\text{NHSO}_2\text{R}^{10}$ általános képletű csoport, különösen a tozil-amino-csoport;

2-tienil-, 3-tienil-, 2-piridil-, 3-piridil-, 4-piridil-, 3-indolilcsoport, különösen előnyösen 2-tienil- és 3-indolilcsoport, ahol ezek a csoportok szubsztituálva lehetnek az R^{11} -nél megadottak közül egy vagy két csoporttal;

- R^5 és R^6 jelentése együttesen 3-6 szénatomos alkiléncsoport, így tri- és tetrametiléncsoport;
- 3-5 szénatomos alkeniléncsoport, így propenilén-, 1-butenilén-, és 2-butenilén-, vagy 1,2-feniléncsoport, amely csoportok egy vagy kétszeresen szubsztituálva lehetnek 1-4 szénatomos alkilcsoporttal, így metil-, és etilcsoporttal, halogénezett 1-4 szénatomos alkilcsoporttal, így trifluor-metil-csoporttal, és 3-7 szénatomos cikloalkilcsoporttal, így ciklopropil-, ciklopentil- és ciklohexil-csoporttal, és még tartalmazhatnak karbonil- vagy tiokarbonilcsoportokat is;
- különösen előnyösek az 1,3-propándiil-karbonil-, 2,2-dimetil-1,3-propándiil-karbonil- és 1,2-fenilén-karbonil-csoportok;
- R^7 jelentése hidrogénatom, hidroxicssoport, aminocsoport;
- 1-4 szénatomos alkilcsoport, miként R^1 -nél megadva, különösen metil- és etilcsoport;
- 1-4 szénatomos alkoxicssoport, miként R^6 -nál megadva, különösen metoxi- és etoxicssoport;
- 1-4 szénatomos alkil-tio-csoport, miként R^3 -nál megadva, különösen metil-tio- és etil-tio-csoport;
- 1-4 szénatomos alkoxi-karbonil-csoport, miként R^4 -nél megadva, különösen metoxi-karbonil- és etoxi-karbonil-csoport;
- 1-4 szénatomos (alkil-tio)-karbonil-csoport, miként R^4 -nél megadva;
- 1-4 szénatomos alkoxi-tiokarbonil-csoport, miként R^4 -nél megadva;

1-4 szénatomos (alkil-tio)-tiokarbonil-csoport, miként R^4 -nél megadva;

1-4 szénatomos alkil-amino-csoport, miként R^6 -nál megadva;
di(1-4 szénatomos alkil)-amino-csoport, így N,N-dimetil-amino-, N,N-dietyl-amino-, N,N-dipropil-amino-, N,N-diizopropil-amino-, N,N-dibutil-amino-, N,N-di(szek-butil)-amino-,

N,N-diizobutil-amino-, N,N-di(terc-butil)-amino-csoport, N-etyl-N-metil-amino-, N-metil-N-propil-amino-, N-izopropil-N-metil-amino-, N-butil-N-metil-amino-csoport, N-metil-N-(szek-butil)-amino-, N-izobutil-N-metil-amino-, N-metil-N-(terc-butil)-amino-csoport, N-etyl-N-izopropil-amino-,

N-butil-N-etyl-amino-, N-etyl-N-(szek-butil)-amino-, N-etyl-N-(terc-butil)-amino-csoport, N-izopropil-N-propil-amino-,

N-butil-N-propil-amino-, N-propil-N-(szek-butil)-amino-, N-izobutil-N-propil-amino-, N-propil-N-(terc-butil)-amino-, N-butil-N-izopropil-amino-, N-izopropil-N-(szek-butil)-amino-,

N-izobutil-N-izopropil-amino-, N-izopropil-N-(terc-butil)-amino-csoport, N-butil-N-(szek-butil)-amino-,

N-butil-N-izobutil-amino-, N-butil-N-(terc-butil)-amino-, N-izobutil-N-(szek-butil)-amino-,

N-(szek-butil)-N-(terc-butil)-amino-, és

N-izobutil-N-(terc-butil)-amino-csoport;

6 vagy 10 szénatomos arilcsoport, és 6 vagy 10 szénatomos

aril-amino-csoport, így fenil-, naftil- és anilinocsoport, ahol az arilcsoportok 1-3-szorosan szubsztituálva lehetnek az R^{11} -nél megadott csoportokkal;

- R^8 jelentése halogénatom, különösen fluor- és klóratom;
hidroxics csoport; merkaptocsoport;
1-4 szénatomos alkoxics csoport, miként R^6 -nál megadva;
1-4 szénatomos alkil-tio-csoport, miként R^3 -nál megadva;
1-4 szénatomos alkoxi-karbonil-csoport, miként R^4 -nél megadva;
1-4 szénatomos (alkil-tio)-karbonil-csoport, miként R^4 -nél megadva;
1-4 szénatomos alkoxi-tiokarbonil-csoport, miként R^4 -nél megadva;
1-4 szénatomos (alkil-tio)-tiokarbonil-csoport, miként R^4 -nél megadva;
(a) általános képletű csoport, amelyben
X jelentése különösen előnyösen oxigénatom, és
 R^9 jelentése oxigénatom, metil- és etilcsoport;
 R^9 jelentése 1-4 szénatomos alkilcsoport, miként R^1 -nél megadva, különösen előnyösen metil- és etilcsoport;
halogénezett 1-4 szénatomos alkilcsoport, miként R^1 -nél megadva;
az $-NR^1R^2$ általános képletű csoport, előnyösen amino-, dimetil-amino-csoport;
az $-OR^1$ általános képletű csoport, előnyösen hidrox-, metoxi- és etoxics csoport;
 R^{10} jelentése 1-4 szénatomos alkilcsoport, miként R^1 -nél

megadva;

6 vagy 10 szénatomos arilcsoport, így fenil- és naftilcsoport, amely 1-3-szorosan szubsztituálva lehet az R^{11} -nél megadottak valamelyikével, különösen 2-metil-fenil-, 3-metil-fenil-, 4-metil-fenil-csoport;

R^{11} jelentése halogénatom, különösen fluor- és klóratom; hidroxil-, merkaptó-, nitro- és aminocsoport;

1-4 szénatomos alkoxics csoport, miként R^6 -nál megadva, különösen metoxi- és etoxics csoport;

1-4 szénatomos alkil-tio-csoport, miként R^3 -nál megadva, különösen metil-tio- és etil-tio-csoport;

1-4 szénatomos alkilcsoport, miként R^1 -nél megadva, előnyösen metil-, etil-, propil-, izopropil- és terc-butil-csoport;

X jelentése oxigénatom és kénatom.

Különösen igen alkalmas (Ia) és (Ib) általános képletű vegyületek találhatók a 16-19. táblázatokban (lásd a példákat).

A találmány szerinti (Ia) és (Ib) általános képletű vegyületek különböző módokon állíthatók elő. Szubsztituált pirido-pirimidinek előállíthatók például 4-amino-pirimidineknek etoxi-metilén-malonsav-származékokkal való kondenzációjával, vagy 4-amino-5-formil-pirimidineknek β -diketonokkal való reagáltatásával (lásd E.Lunt és C.G.Newton tanulmányát a "Comprehensive Heterocyclic Chemistry", 3. kötetének 215-232. oldalán, Pergamon Press, Oxford). Egy további előállítási lehetőséget jelent β -dialkil-amino-ke-tonok 4-amino-pirimidinekkel való reakciója [R.Troschütz és H.J.Roth: Arch.Pharm., 311, 406, 542 (1978)].

Az (Ia) általános képletű pirido-pirimidin-származékokat például úgy állítjuk elő, hogy egy (II) általános képletű 4-amino-pirimidin-2,4-(1H,3H)-diont egy (III) általános képletű β -klór-alkenállal inert oldószerben és védőgázatmoszférában reagáltatunk.

Ennél ajánlatos az előkészített (II) általános képletű vegyülethez a (III) általános képletű alkenál-származékokat folyékony fázisban, szobahőmérsékleten, 5 és 30 perc közötti, előnyösen 10 és 20 perc közötti idő alatt hozzáadni.

A reakcióelegyet ezután általában 20 °C és 150 °C közötti, előnyösen 70 °C és 110 °C közötti hőmérsékletre melegítjük, és ezen állni hagyjuk 3-12, különösen 5-7 órán keresztül, mielőtt szobahőmérsékletre hűtjük. Általában szilárd termékeket kapunk, amelyek a lehűlés folyamán szilárd anyagokként kiválnak, és a szokásos módszerekkel elválaszthatók. A (II) általános képletű vegyület mólarányát a (III) általános képletű alkenál-származékhoz általában 0,7 : 1 és 1,2 : 1 közötti tartományban választjuk meg.

A (II) általános képletű pirimidinszármazékok általánosan ismertek, és könnyen előállíthatók (lásd D.J.Brown tanulmányát: Comprehensive Heterocycl. Chem., 3. kötet, 106-142. old., Pergamon Press, Oxford).

A (III) általános képletű β -klór-alkenálok előállítása például a J.Chem.Soc. (C) 2484 (1970) alatti előírásokhoz hasonló módon történhet.

Az (Ia) általános képletű pirido-pirimidinek előállításának egy további módja abból áll, hogy a (II) általános képletű ve-

gyületet egy (IV) általános képletű β -alkoxi-akrilsav-származékkal egy, a J.Heterocyclic Chem. 22, 1469 (1985) alatt leírt, önmagában ismert módon reagáltatjuk, majd az (V) általános képletű intermediert a szokásos módon izoláljuk, és azt azután magasabb hőmérsékleten tovább átalakítjuk az (Ia) általános képletű vegyületté. Itt olyan (IV) általános képletű β -alkoxi-akrilsav-származékok kerülnek alkalmazásra, amelyekben R^{12} 2-5 szénatomos alkoxi-karbonil-, 2-5 szénatomos alkoxi-tiokarbonil- vagy cianocsoportot jelent, és R^{13} 2-5 szénatomos alkilcsoportot, így etil-, propil-, izopropil-, butil-, terc-butil-, terc-pentikl- vagy pentilcsoportot jelent. A (IV) általános képletű vegyületek általánosan ismertek, és könnyen előállíthatók.

Az (Ib) általános képletű vegyületek előállíthatók például ismert módon úgy, hogy egy (II) általános képletű vegyületet egy (VI) általános képletű β -amino-alkil-ketonnal reagáltatunk [lásd Arch.Pharm., 311, 406 (1978)]. Ennél $R^{5'}$ előnyösen hidrogénatomot és 1-4 szénatomos alkilcsoportot, különösen metil- és etilcsoportot, R^{14} 1-4 szénatomos alkilcsoportot, előnyösen metil- és etilcsoportot jelent.

Az (Ib) általános képletű vegyületek előállításának egy további módja abból áll, hogy egy (VIIa) vagy (VIIb) általános képletű pirimidinszármazékot önmagában ismert módon [lásd J.Heterocycl.Chem., 22, 345 (1985)] egy (VIIIa), (VIIIb) vagy (VIIIc) általános képletű malonsavszármazékkal reagáltatunk. Ennél $R^{5''}$ jelentése cianocsoport, a $-C(O)R^7$ vagy $-C(S)R^7$ általános képletű csoport;

R^{15} jelentése 1-4 szénatomos alkilcsoport, így metil-, etil-, propil-, izopropil-, butil-, izobutil-, szek-butil- és terc-butil-csoport, különösen etilcsoport;

$R^{6'}$ jelentése 1-4 szénatomos alkilcsoport, miként R^{15} -nél megadva, különösen metilcsoport;

6 szénatomos aril-(2-4 szénatomos alkenil)-csoport, így sztirilcsoport;

6, 10 vagy 14 szénatomos arilcsoport, így fenil- és naftilcsoport, különösen fenilcsoport; ahol az arilcsoportok 1-3-szorosan szubsztituálva lehetnek az R^{11} -nél megadott csoportokkal vagy a $-CH_2R^8$ általános képletű csoporttal.

Ezenkívül úgy is előállíthatjuk az (Ib) általános képletű vegyületeket, hogy egy olyan (Ib) általános képletű vegyületet, amelyben R^6 hidroxicsoportot jelent, önmagában ismert módon [lásd P.Mátyus, P.Sohár, H.Wamhoff: Liebigs Ann.Chem. 1653 (1984)] egy (IX) általános képletű vegyülettel reagáltatunk.

Ennél

R^{16} jelentése 1-4 szénatomos alkilcsoport, miként R^1 -nél megadva, előnyösen izopropil- vagy butilcsoport, és

Nu jelentése nukleofug kilépőcsoport, így halogénatom, előnyösen jódatom.

Az (Ib) általános képletű vegyületek előállításának egy további módszere abból áll, hogy egy olyan (Ib) általános képletű vegyületet, amelyben R^6 aminocsoportot jelent, önmagában ismert módon egy (Xa) vagy (Xb) általános képletű vegyülettel reagáltatunk.

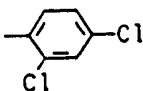
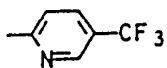
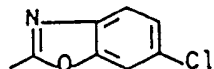
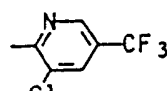
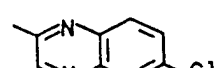
A (XI) általános képletű (heteroaril-oxi)- illetve (aril-

-oxi)-fenoxi-ecetsav-származékokat tartalmazó olyan gyomírtó szerek speciális példái, amelyeknek a kultúrnövények általi elviselhetőségét az (Ia) és (Ib) általános képletű vegyületekkel javíthatjuk, a következő 1. táblázatban találhatók.

A (XII) általános képletű ciklohexenonszármazékokat tartalmazó olyan gyomírtó szerek speciális példái, amelyeknek a kultúrnövények általi elviselhetőségét az (Ia) és (Ib) általános képletű vegyületekkel javíthatjuk, a 2-től 15-ig terjedő számú táblázatokban találhatók (lásd a DE-A 4014985 és DE-A 2822304 számú német szövetségi köztársaságbeli közzétételi iratokat).

1. táblázat

(XI) általános képletű vegyületek

Szám	R ^a	R ^b	R ^c	Irodalom
A.1		CH ₃	CH ₃	DE-A 22 23 894
A.2		n-C ₄ H ₉	CH ₃	BE-A 868 875
A.3		C ₂ H ₅	CH ₃	BE-A 858 618
A.4		CH ₃	CH ₃	BE-A 868 875
A.5		C ₂ H ₅	CH ₃	DE-A 30 04 770

2. táblázat

Olyan (XII) általános képletű vegyületek, amelyek képletében R^e jelentése 2-(etil-tio)-propilcsoport, és az A alkilénlánc végén m szubsztituált fenilcsoport vagy m = 0 esetén hidrogénatom van.

Szám	R ^d	A	B	n	m	fizikai adatok [NMR (δ ppm-ben)]
B.1	propil	2-butenilén	-	0	1	4,5 (d, 2H); 5,6-6,1 (m, 2H)
B.2	propil	2-butenilén	4-terc-butil	1	1	4,5 (d, 2H); 5,6-6,0 (m, 2H); 1,3 (s, 9H)
B.3	propil	2-butenilén	4-(trifluor-metil)	1	1	4,5 (d, 2H); 5,6-6,0 (m, 2H)
B.4	propil	2-butenilén	4-fluor	1	1	4,5 (d, 2H); 5,6-6,0 (m, 2H)
B.5	propil	2-butenilén	4-klór	1	1	4,5 (d, 2H); 5,6-6,0 (m, 2H)
B.6	propil	tetrametilén	-	0	1	1,0 (s); 4,0-4,2 (m); 7,1-7,4 (m)
B.7	etil	2-butenilén	-	0	1	4,5 (d, 2H); 5,6-6,0 (m, 2H)
B.8	propil	2-butenilén	3-klór	1	1	4,5 (d, 2H); 5,6-6,0 (m, 2H)
B.9	propil	3-butenilén	4-klór	1	1	4,1 (t, 2H); 6,0-6,5 (m, 2H)
B.10	propil	3-butenilén	4-metil	1	1	2,3 (s, 3H); 4,1 (t, 2H); 6,0-6,5 (m, 2H)
B.11	propil	3-butenilén	4-fluor	1	1	4,1 (t, 2H); 6,0-6,5 (m, 2H)
B.12	propil	3-butenilén	-	0	1	4,1 (t, 2H); 6,0-6,6 (m, 2H)
B.13	propil	2-butenilén	4-metoxi	1	1	3,8 (s, 3H); 4,4 (d, 2H); 5,5-6,0 (m, 2H)
B.14	propil	2-butenilén	4-metil	1	1	4,5 (d, 2H); 5,6-6,0 (m, 2H)
B.15	propil	etilén	-	0	0	n ² ₀ ,5=1,5229 (DE-A-2822304)

3. táblázat

Olyan (XII) általános képletű vegyületek, amelyek képletében az A alkilénlánc és a hozzá kapcsolódó fenilcsoport a W alatt megadott csoport, R^d pedig V csoporttal szubsztituált 5-izoxazolil-csoport

Szám	R ^d	V	W	fizikai adatok	
				[olvadáspont (°C); NMR	(δ ppm-ben)]
C.1	etil	3-etil	4-fenil-2-butenil	58-59	
C.2	propil	3-etil	4-fenil-2-butenil	4, 5 (d, 2H), 5, 6-6, 1 (m, 2H)	
C.3	etil	3-izopropil	4-fenil-2-butenil	57-58	
C.4	etil	3-(1-metoxi- -etil)	4-fenil-2-butenil	3, 3 (s, 3H), 5, 6-6, 1 (m, 2H)	

4. táblázat

Olyan (XII) általános képletű vegyületek, amelyek képletében A jelentése tetraetilén-csoport

Szám	R ^d	R ^e	B _n	fizikai adatok [NMR (δ ppm-ben)]
D.1	etil	3-tetrahidropirán	4-fluor	2,9 (széles, 2H); 4,1 (széles, 2H)
D.2	propil	3-tetrahidropirán	4-fluor	2,9 (t, 2H); 4,05 (széles, 2H)
D.3	etil	3-tetrahidrotiopirán	4-fluor	2,9 (t, 2H); 4,05 (széles, 2H)
D.4	propil	3-tetrahidrotiopirán	4-fluor	2,9 (t, 2H); 4,05 (széles, 2H)
D.5	etil	4-tetrahidropirán	4-fluor	4,05 (széles, 2H)
D.6	propil	4-tetrahidropirán	4-fluor	4,05 (széles, 2H)
D.7	etil	3-tetrahidropirán	4-Cl	2,9 (t, 2H); 4,05 (széles, 2H)
D.8	propil	3-tetrahidropirán	4-Cl	2,9 (t, 2H); 4,05 (széles, 2H)
D.9	etil	4-tetrahidropirán	4-Cl	2,9 (t, 2H); 4,05 (széles, 2H)
D.10	propil	4-tetrahidropirán	4-Cl	2,9 (széles, 2H); 4,05 (széles, 2H)
D.11	etil	3-tetrahidrotiopirán	4-Cl	4,05 (széles, 2H)
D.12	propil	3-tetrahidrotiopirán	4-Cl	4,05 (széles, 2H)

5. táblázat

Olyan (XII) általános képletű vegyületek, amelyek képletében az A alkilénlánc és a hozzá kapcsolódó adott esetben szubsztituált fenilcsoport a W alatt megadott csoport

Szám	R ^d	R ^e	W	fizikai adatok [olvadáspont (°C); NMR (δ ppm-ben)]
E.1	propil	3-tetrahidrotiopiránil	4-fenil-2-butenil	4,5 (d, 2H); 5,5-6,1 (m, 2H)
E.2	etil	3-tetrahidrotiopiránil	4-fenil-2-butenil	4,5 (d, 2H); 5,6-6,1 (m, 2H)
E.3	propil	3-tetrahidrotiopiránil	4-(4-fluor-fenil)-2-butenil	4,5 (d, 2H); 5,6-6,0 (m, 2H)
E.4	propil	3-tetrahidrotiopiránil	4-(4-klór-fenil)-2-butenil	4,5 (d, 2H); 5,6-6,0 (m, 2H)
E.5	propil	3-tetrahidrotiopiránil	4-[4-(trifluor-metil)- -fenil]-2-butenil	4,5 (d, 2H); 5,6-6,0 (m, 2H)
E.6	propil	3-tetrahidrotiopiránil	4-(4-terc-butil-fenil)- -2-butenil	4,5 (d, 2H); 5,6-6,1 (m, 2H); 1,3 (s, 9H)
E.7	etil	3-tetrahidrotiopiránil	4-(4-fluor-fenil)-2-butenil	4,5 (d, 2H); 5,6-6,0 (m, 2H)
E.8	etil	3-tetrahidrotiopiránil	4-(4-klór-fenil)-2-butenil	4,5 (d, 2H); 5,6-6,0 (m, 2H)
E.9	etil	3-tetrahidrotiopiránil	4-(4-terc-butil-fenil)- -2-butenil	4,5 (d, 2H); 5,6-6,0 (m, 2H); 1,3 (s, 9H)
E.10	etil	3-tetrahidrotiopiránil	4-[4-(trifluor-metil)- -fenil]-2-butenil	4,5 (d, 2H); 5,6-6,0 (m, 2H)
E.11	metil	3-tetrahidrotiopiránil	4-fenil-2-butenil	4,5 (d, 2H); 5,6-6,0 (m, 2H); 2,4 (s, 3H)
E.12	etil	4-tetrahidropiránil	4-fenil-2-butenil	62-64
E.13	etil	4-tetrahidropiránil	4-(4-fluor-fenil)-2-butenil	4,5 (d, 2H); 5,6-6,0 (m, 2H)

5. táblázat (folytatás)

Szám	R ^d	R ^e	W	fizikai adatok [olvadáspont (°C); NMR (δ ppm-ben)]
E.14	etil	4-tetrahidropiránil	4-(4-klór-fenil)-2-butenil	4,5 (d, 2H); 5,6-6,0 (m, 2H)
E.15	etil	4-tetrahidropiránil	4-(4-terc-butil-fenil)-2-butenil	99-101
E.16	etil	4-tetrahidropiránil	4-[4-(trifluor-metil-fenil)-2-butenil	4,5 (d, 2H), 5,6-6,0 (m, 2H)
E.17	propil	4-tetrahidropiránil	4-fenil-2-butenil	4,5 (d, 2H); 5,6-6,1 (m, 2H)
E.18	propil	4-tetrahidropiránil	4-(4-fluor-fenil)-2-butenil	4,5 (d, 2H); 5,6-6,0 (m, 2H)
E.19	propil	4-tetrahidropiránil	4-(4-klór-fenil)-2-butenil	4,5 (d, 2H); 5,6-6,0 (m, 2H)
E.20	propil	4-tetrahidropiránil	4-(4-terc-butil-fenil)-2-butenil	84-86
E.21	propil	4-tetrahidropiránil	4-[4-(trifluor-metil-fenil)-2-butenil	4,5 (d, 2H); 5,6-6,0 (m, 2H)
E.22	etil	3-tetrahidropiránil	4-fenil-2-butenil	4,5 (d, 2H); 5,6-6,0 (m, 2H)
E.23	etil	3-tetrahidropiránil	4-(4-fluor-fenil)-2-butenil	4,5 (d, 2H); 5,6-6,0 (m, 2H)
E.24	etil	3-tetrahidropiránil	4-(4-klór-fenil)-2-butenil	4,5 (d, 2H); 5,6-6,0 (m, 2H)
E.25	etil	3-tetrahidropiránil	4-(4-terc-butil-fenil)-2-butenil	4,5 (d, 2H); 5,6-6,0 (m, 2H); 1,3 (s, 9H)
E.26	etil	3-tetrahidropiránil	4-[4-(trifluor-metil-fenil)-2-butenil	4,5 (d, 2H); 5,6-6,1 (m, 2H)
E.27	propil	3-tetrahidropiránil	4-fenil-2-butenil	4,5 (d, 2H); 5,6-6,0 (m, 2H)
E.28	propil	3-tetrahidropiránil	4-(4-fluor-fenil)-2-butenil	4,5 (d, 2H); 5,6-6,0 (m, 2H)
E.29	propil	3-tetrahidropiránil	4-(4-klór-fenil)-2-butenil	4,5 (d, 2H); 5,6-6,0 (m, 2H)
E.30	propil	3-tetrahidropiránil	4-(4-terc-butil-fenil)-2-butenil	4,5 (d, 2H); 5,6-6,0 (m, 2H); 1,3 (s, 9H)
E.31	propil	3-tetrahidropiránil	4-[4-(trifluor-metil-fenil)-2-butenil	4,5 (d, 2H); 5,6-6,0 (m, 2H)

5. táblázat (folytatás)

Szám	R ^d	R ^e	W	fizikai adatok [olvadáspont (°C); NMR (δ ppm-ben)]
E.32	etil	3-tetrahidrotiopiranil	4-(3-klór-fenil)-2-butenil	4,5 (d, 2H); 5,6-6,0 (m, 2H)
E.33	etil	3-tetrahidrotiopiranil	4-(4-metil-fenil)-2-butenil	2,3 (s, 3H); 4,5 (d, 2H); 5,6-6,0 (m, 2H)
E.34	etil	3-tetrahidrotiopiranil	4-(4-klór-fenil)-3-butenil	4,2 (t, 2H); 6,1-6,5 (m, 2H)
E.35	etil	3-tetrahidrotiopiranil	4-(4-metil-fenil)-3-butenil	2,3 (s, 3H); 4,2 (t, 2H); 6,0-6,5 (m, 2H)
E.36	etil	3-tetrahidrotiopiranil	4-(4-fluor-fenil)-3-butenil	4,2 (t, 2H); 6,0-6,5 (m, 2H)
E.37	etil	3-tetrahidrotiopiranil	4-fenil-3-butenil	4,2 (t, 2H); 6,1-6,6 (m, 2H)
E.38	propil	3-tetrahidrotiopiranil	4-fenil-3-butenil	4,2 (t, 2H); 6,1-6,6 (m, 2H)
E.39	etil	3-tetrahidropiranil	4-(3-klór-fenil)-2-butenil	4,5 (d, 2H); 5,6-6,0 (m, 2H)
E.40	etil	3-tetrahidropiranil	4-fenil-3-butenil	4,2 (t, 2H); 6,1-6,6 (m, 2H)
E.41	propil	3-tetrahidropiranil	4-fenil-3-butenil	4,2 (t, 2H); 6,0-6,6 (m, 2H)
E.42	etil	4-tetrahidropiranil	4-fenil-3-butenil	4,2 (t, 2H); 6,1-6,6 (m, 2H)
E.43	propil	4-tetrahidropiranil	4-fenil-3-butenil	4,2 (t, 2H); 6,1-6,6 (m, 2H)
E.44	propil	3,4-dibróm-3-tetra- hidro-tiopiranil	4-[4-(trifluor-metil)- -fenil]-2-butenil	3,5 (d, 2H); 7,55 (d, 2H)
E.45	propil	3,4-dibróm-3-tetra- hidro-tiopiranil	4-(4-fluor-fenil)- -3-butenil	4,15 (t, 2H); 5,9-6,2 (m, 1H); 6,4 (d, 1H)



5. táblázat (folytatás)

Szám	R ^d	R ^e	W	fizikai adatok	
				[olvadáspont (°C); NMR (δ ppm-ben)]	
E.46	propil	3,4-dibrom-3-tetra- hidropiránil	4-(4-fluor-fenil)-2- -butenil	4,49 (d,2H); 5,5-6,1 (m,2H)	
E.47	propil	3,4-dibrom-3-tetra- hidropiránil	4-(4-terc-butil-fenil)- -2-butenil	4,49 (d,2H); 5,55-6,1 (m,2H)	
E.48	propil	3,4-dibrom-3-tetra- hidropiránil	4-(4-metil-fenil)-2- -butenil	4,49 (d,2H); 5,55-6,1 (m,2H)	
E.49	propil	3,4-dibrom-3-tetra- hidropiránil	4-[4-(trifluor-metil)- -fenil]-2-butenil	4,52 (s,2H); 5,5-6,1 (m,2H)	
E.50	propil	3,4-dibrom-3-tetra- hidropiránil	4-(3-klor-fenil)-2- -butenil	4,5 (d,2H); 5,5-6,1 (m,2H)	
E.51	propil	3,4-dibrom-3-tetra- hidropiránil	4-(4-metil-fenil)-3- -butenil	4,18 (t,2H); 6,0-6,2 (m,1H); 6,45 (d,1H)	
E.52	propil	4-metil-3-ciklohexén- -1-il	4-[4-(trifluor-metil)- -fenil]-2-butenil	4,05 (m,2H); 5,5-6,1 (m,2H)	
E.53	propil	4-metil-3-ciklohexén- -1-il	4-(4-fluor-fenil)-2- -butenil	4,5 (d,2H); 5,5-6,1 (m,2H)	
E.54	propil	3-tetrahidrotiopiránil	4-(4-metoxi-fenil)-2- -butenil	3,8 (s,3H); 4,4 (d,2H); 5,5-6,0 (m,2H)	
E.55	etil	3-tetrahidrotiopiránil	4-(4-metoxi-fenil)-2- -butenil	3,8 (s,3H); 4,5 (d,2H); 5,6-6,0 (m,2H)	
E.56	propil	3-tetrahidropiránil	4-(4-metoxi-fenil)-2-butenil	3,8(s,3H);4,5(d,2H);5,6-6,0(m,2H)	
E.57	etil	3-tetrahidropiránil	4-(4-metoxi-fenil)-2-butenil	3,8(s,3H);4,5(d,2H);5,6-6,0(m,2H)	
E.58	propil	4-tetrahidropiránil	4-(4-metoxi-fenil)-2-butenil	3,8(s,3H);4,4(d,2H);5,5-6,0(m,2H)	



5. táblázat (folytatás)

Szám	R ^d	R ^e	W	fizikai adatok [olvadáspont (°C); NMR (δ ppm-ben)]
E.59	etil	4-tetrahidropiránil	4-(4-metoxi-feni)- -2-butenil	3, 8 (s, 3H); 4, 5 (d, 2H); 5, 5-6, 0 (m, 2H)
E.60	etil	3-tetrahidrotiopiránil	Z-4-fenil-2-butenil	4, 7 (d, 2H); 5, 8-6, 0 (m, 2H)
E.61	propil	3-tetrahidrotiopiránil	Z-4-fenil-2-butenil	4, 7 (d, 2H); 5, 8-6, 0 (m, 2H)
E.62	propil	3-tetrahidropiránil	Z-4-fenil-2-butenil	4, 7 (d, 2H); 5, 8-6, 0 (m, 2H)
E.63	propil	4-tetrahidropiránil	Z-4-fenil-2-butenil	4, 7 (d, 2H); 5, 8-6, 0 (m, 2H)
E.64	etil	4-tetrahidropiránil	Z-4-fenil-2-butenil	4, 7 (d, 2H); 5, 8-6, 0 (m, 2H)
E.65	propil	3-tetrahidrotiopiránil	4-(4-metil-fenil)-2-butenil	2, 3 (s, 3H); 4, 5 (d, 2H); 5, 6-6, 0 (m, 2H)
E.66	propil	3-tetrahidrotiopiránil	4-(3-klór-fenil)-2-butenil	4, 5 (d, 2H); 5, 6-6, 0 (m, 2H)
E.67	propil	3-tetrahidrotiopiránil	4-(3, 4-diklór-fenil)-2- -butenil	4, 5 (d, 2H); 5, 6-6, 0 (m, 2H)
E.68	etil	3-tetrahidrotiopiránil	4-(3, 4-diklór-fenil)-2- -butenil	4, 5 (d, 2H); 5, 6-6, 0 (m, 2H)
E.69	propil	3-tetrahidropiránil	4-(3, 4-diklór-fenil)-2- -butenil	4, 5 (d, 2H); 5, 6-6, 0 (m, 2H)
E.70	propil	4-tetrahidropiránil	4-(3, 4-diklór-fenil)-2- -butenil	4, 5 (d, 2H); 5, 6-6, 0 (m, 2H)
E.71	propil	3-tetrahidrotiopiránil	4-(4-bróm-fenil)-3- -butenil	4, 2 (t, 2H); 6, 2 (dt, 1H); 6, 4 (d, 1H)



5. táblázat (folytatás)

Szám	R ^d	R ^e	W	fizikai adatok	
				[olvadáspont (°C); NMR	(δ ppm-ben)]
E.72	etil	3-tetrahidrotiopiranil	4-(4-bróm-fenil)- -3-butenil	4, 2 (t, 2H); 6, 2 (dt, 1H); 6, 4 (d, 1H)	
E.73	propil	3-tetrahidrotiopiranil	4-(4-fluor-fenil)- -3-butenil	4, 6 (t, 2H); 6, 1 (dt, 1H); 6, 6 (d, 1H)	
E.74	propil	3-tetrahidrotiopiranil	4-(4-klór-fenil)- -3-butenil	4, 2 (t, 2H); 6, 1-6, 5 (2m, 2H)	
E.75	propil	3-tetrahidrotiopiranil	4-(4-metil-fenil)- -3-butenil	4, 2 (t, 2H); 6, 1-6, 2 (m, 2H); 6, 6 (d, 1H)	
E.76	propil	3-tetrahidropiranil	4-(4-bróm-fenil)-3-butenil	4, 2 (t, 2H); 6, 0-6, 4 (2m, 2H)	
E.77	propil	4-tetrahidropiranil	4-(4-bróm-fenil)-3-butenil	4, 2 (t, 2H); 6, 0-6, 5 (2m, 2H)	
E.78	etil	4-tetrahidropiranil	4-(4-bróm-fenil)-3-butenil	4, 2 (t, 2H); 6, 0-6, 5 (2m, 2H)	
E.79	etil	fenil	4-fenil-2-butenil	4, 5 (d, 2H); 5, 6-6, 0 (m, 2H)	
E.80	propil	fenil	4-fenil-2-butenil	4, 5 (d, 2H); 5, 6-6, 0 (m, 2H)	
E.81	etil	4-(trifluor-metil)-fenil	4-fenil-2-butenil	4, 5 (d, 2H); 5, 6-6, 1 (m, 2H)	
E.82	propil	4-(trifluor-metil)-fenil	4-fenil-2-butenil	56-57	
E.83	etil	4-etil-fenil	4-fenil-2-butenil	4, 5 (d, 2H); 5, 6-6, 1 (m, 2H)	
E.84	etil	4-(benzoil-amino)-fenil	4-fenil-2-butenil	103-105	
E.85	propil	4-etoxi-fenil	4-fenil-2-butenil	4, 6 (d, 2H); 5, 6-6, 1 (m, 2H)	
E.86	propil	3-fluor-4-(benzoil- -amino)-fenil	4-fenil-2-butenil	87-90	
E.87	etil	4-piridil	4-fenil-2-butenil	4, 5 (d, 2H); 5, 6-6, 2 (m, 2H)	
E.88	propil	3-piridil	4-fenil-2-butenil	4, 6 (d, 2H); 5, 6-6, 2 (m, 2H)	

5. táblázat (folytatás)

Szám	R ^d	R ^e	W	fizikai adatok	
				[olvadáspont (°C); NMR	(δ ppm-ben)]
E.89	etil	4-(3-propinil-oxi)-fenil	4-fenil-2-butenil	4, 6 (d, 2H); 5, 6-6, 1 (m, 2H)	
E.90	propil	4-etil-fenil	4-fenil-2-butenil	4, 5 (d, 2H); 5, 6-6, 1 (m, 2H)	
E.91	etil	3, 4-dihidroxí-ciklohexil	4-(4-klór-fenil)-2-butenil	4, 4-4, 6 (m, 2H); 5, 5-6, 0 (m, 2H)	
E.92	etil	2-(etil-tio)-2-metil-	4-(4-fluor-fenil)-2-butenil	1, 3 (s, 6H); 4, 5 (d, 2H);	
		-propil		5, 6-6, 0 (m, 2H)	
E.93	etil	2-(etil-tio)-2-metil-	4-fenil-2-butenil	1, 3 (s, 6H); 4, 5 (d, 2H);	
		-propil		5, 5-6, 1 (m, 2H)	
E.94	etil	2-(etil-tio)-2-metil-	4-fenil-3-butenil	1, 3 (s, 6H); 4, 2 (t, 2H);	
		-propil		6, 2 (dt, 1H); 6, 4 (dt, 1H)	
E.95	etil	2-(etil-tio)-2-metil-	4-(4-fluor-fenil)-3-butenil	1, 3 (s, 6H); 4, 2 (t, 2H);	
		-propil		6, 1 (dt, 1H); 6, 4 (dt, 1H)	
E.96	etil	2-(etil-tio)-2-metil-	4-(4-klór-fenil)-3-butenil	1, 3 (s, 6H); 4, 2 (t, 2H);	
		-propil		6, 2 (dt, 1H); 6, 5 (dt, 1H)	
E.97	etil	2, 6, 6-trimetil-1-	4-fenil-2-butenil	1, 0 (s, 6H); 4, 5 (d, 2H);	
		-ciklohexen-1-il		5, 8-6, 2 (m, 2H)	
E.98	propil	2, 6, 6-trimetil-1-	4-fenil-2-butenil	1, 0 (s, 6H); 4, 5 (d, 2H);	
		-ciklohexen-1-il		5, 6-6, 1 (m, 2H)	
E.99	propil	3-tetrahidrotiopiránil	4-(4-fluor-fenil)-3-pentenil	2, 0 (s, 3H); 4, 1 (t, 2H); 5, 7 (t, 1H)	
E.100	etil	3-tetrahidrotiopiránil	4-(4-fluor-fenil)-3-pentenil	2, 0 (s, 3H); 4, 1 (t, 2H); 5, 7 (t, 1H)	
E.101	propil	3-tetrahidropiránil	4-(4-fluor-fenil)-3-pentenil	2, 0 (s, 3H); 4, 1 (t, 2H); 5, 7 (t, 1H)	
E.102	propil	4-tetrahidropiránil	4-(4-fluor-fenil)-3-pentenil	2, 0 (s, 3H); 4, 1 (t, 2H); 5, 7 (t, 1H)	
E.103	etil	4-tetrahidropiránil	4-(4-fluor-fenil)-3-pentenil	2, 0 (s, 3H); 4, 1 (t, 2H); 5, 7 (t, 1H)	

6. táblázat

Olyan (XII) általános képletű vegyületek, amelyek képletében A jelentése $-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{O}-$ képletű csoport.

Szám	R ^d	R ^e	B _n	fizikai adatok/ ¹ H-NMR [δ ppm-ben], op. [°C]
F.01	etil	3-tetrahidropiranyl	-	42- 45
F.02	propil	3-tetrahidropiranyl	-	3,90 (m,2H), 4,20 (t,2H), 4,40 (m, 2H), 6,80-7,00 (m,3H), 7,13-7,37 (m,2H)
F.03	etil	4-tetrahidropiranyl	-	106-107
F.04	propil	4-tetrahidropiranyl	-	72- 73
F.05	etil	3-tetrahidrotiopiranyl	-	52- 55
F.06	propil	3-tetrahidrotiopiranyl	-	92
F.07	etil	3-tetrahidropiranyl	2-F	76- 78
F.08	propil	3-tetrahidropiranyl	2-F	72- 77
F.09	etil	4-tetrahidropiranyl	2-F	121-125
F.10	propil	4-tetrahidropiranyl	2-F	103-107
F.11	etil	3-tetrahidrotiopiranyl	2-F	82- 86
F.12	propil	3-tetrahidrotiopiranyl	2-F	81- 85
F.13	etil	3-tetrahidropiranyl	3-F	62- 68
F.14	propil	3-tetrahidropiranyl	3-F	3,90 (m,2H), 4,20 (t,2H), 4,40 (m,2H) 6,70 (m,3H), 7,25 (m,1H),
F.15	etil	4-tetrahidropiranyl	3-F	103-109
F.16	propil	4-tetrahidropiranyl	3-F	73- 79
F.17	etil	3-tetrahidropiranyl	3-F	4,20(t,2H), 4,40(m,2H) 6,70(m,3H), 7,25(m,1H)

6. táblázat (folytatás)

Szám	R ^d	R ^e	B _n	B _n fizikai adatok/ ¹ H-NMR [δ ppm-ben], op. [°C]
F.18	propil	3-tetrahidrotiopiránil	3-F	
F.19	etil	3-tetrahidropiránil	4-F	64- 67
F.20	propil	3-tetrahidropiránil	4-F	70- 72
F.21	etil	4-tetrahidropiránil	4-F	101-103
F.22	propil	4-tetrahidropiránil	4-F	107-109
F.23	etil	3-tetrahidrotiopiránil	4-F	105-108
F.24	propil	3-tetrahidrotiopiránil	4-F	82- 84
F.25	etil	3-tetrahidropiránil	2-Cl	74- 80
F.26	propil	3-tetrahidropiránil	2-Cl	67- 71
F.27	etil	4-tetrahidropiránil	2-Cl	4,00 (m,2H), 4,27 (t,2H), 4,47 (m,2H), 7,20 (t,1H), 7,37 (d,1H)
F.28	propil	4-tetrahidropiránil	2-Cl	68- 72
F.29	etil	3-tetrahidrotiopiránil	2-Cl	74- 78
F.30	propil	3-tetrahidrotiopiránil	2-Cl	72-78
F.31	etil	3-tetrahidropiránil	3-Cl	
F.32	propil	3-tetrahidropiránil	3-Cl	
F.33	etil	4-tetrahidropiránil	3-Cl	
F.34	propil	4-tetrahidropiránil	3-Cl	
F.35	etil	3-tetrahidrotiopiránil	3-Cl	
F.36	propil	3-tetrahidrotiopiránil	3-Cl	3,93 (m,2H), 4,20 (t,2H), 4,43 (m,2H), 6,90 (m,2H), 7,25 (m,2H)
F.37	etil	3-tetrahidropiránil	4-Cl	3,93 (m,2H), 4,20 (t,2H), 4,43 (m,2H), 6,90 (m,2H), 7,25 (m,2H)
F.38	propil	3-tetrahidropiránil	4-Cl	

6. táblázat (folytatás)

Szám	R ^d	R ^e	B ⁿ	fizikai adatok/ ¹ H-NMR [δ ppm-ben], op. [°C]
F.39	etil	4-tetrahidropiranil	4-Cl	116-118
F.40	propil	4-tetrahidropiranil	4-Cl	104-106
F.41	etil	3-tetrahidrotiopiranil	4-Cl	74- 77
F.42	propil	3-tetrahidrotiopiranil	4-Cl	86- 88
F.43	etil	3-tetrahidropiranil	2-CF ₃	
F.44	propil	3-tetrahidropiranil	2-CF ₃	
F.45	etil	4-tetrahidropiranil	2-CF ₃	
F.46	propil	4-tetrahidropiranil	2-CF ₃	
F.47	etil	3-tetrahidrotiopiranil	2-CF ₃	
F.48	propil	3-tetrahidrotiopiranil	2-CF ₃	
F.49	etil	3-tetrahidropiranil	3-CF ₃	
F.50	propil	3-tetrahidropiranil	3-CF ₃	
F.51	etil	4-tetrahidropiranil	3-CF ₃	
F.52	propil	4-tetrahidropiranil	3-CF ₃	
F.53	etil	3-tetrahidrotiopiranil	3-CF ₃	
F.54	propil	3-tetrahidrotiopiranil	3-CF ₃	
F.55	etil	3-tetrahidropiranil	4-CF ₃	72- 77
F.56	propil	3-tetrahidropiranil	4-CF ₃	3, 90 (m, 2H), 4, 27 (t, 2H), 4, 47 (m, 2H) 7, 00 (d, 2H), 7, 55 (d, 2H)
F.57	etil	4-tetrahidropiranil	4-CF ₃	
F.58	propil	4-tetrahidropiranil	4-CF ₃	90- 94
F.59	etil	3-tetrahidrotiopiranil	4-CF ₃	73- 79
F.60	propil	3-tetrahidrotiopiranil	4-CF ₃	4, 27 (t, 2H), 4, 47 (m, 2H), 7, 00 (d, 2H), 7, 55 (d, 2H)
F.61	etil	3-tetrahidropiranil	2, 4-Cl ₂	73- 75

6. táblázat (folytatás)

Szám	R ^d	R ^e	B _n	fizikai adatok/ ¹ H-NMR [δ ppm-ben], op. [°C]
F.62	propil	3-tetrahidropiránil	2,4-Cl ₂	69-73
F.63	etil	4-tetrahidropiránil	2,4-Cl ₂	4,00 (m,2H), 4,25 (t,2H), 4,45 (t,2H) 6,87 (d,1H), 7,17 (d,1H), 7,37 (d,1H)
F.64	propil	4-tetrahidropiránil	2,4-Cl ₂	4,00 (m,2H), 4,25 (t,2H), 4,45 (t,2H) 6,87 (d,1H), 7,17 (d,1H), 7,37 (d,1H)
F.65	etil	3-tetrahidrotiopiránil	2,4-Cl ₂	4,25 (t,2H), 4,45 (t,2H), 6,87 (d,1H) 7,17 (d,1H), 7,37 (d,1H)
F.66	propil	3-tetrahidrotiopiránil	2,4-Cl ₂	4,25 (t,2H), 4,45 (t,2H), 6,87 (d,1H) 7,17 (d,1H), 7,37 (d,1H)
F.67	etil	3-tetrahidropiránil	2,4,6-Cl ₃	90-93
F.68	propil	3-tetrahidropiránil	2,4,6-Cl ₃	83-87
F.69	etil	4-tetrahidropiránil	2,4,6-Cl ₃	79-82
F.70	propil	4-tetrahidropiránil	2,4,6-Cl ₃	4,00 (m,2H), 4,27 (t,2H), 4,45 (m,2H), 7,32 (s,2H)
F.71	etil	3-tetrahidrotiopiránil	2,4,6-Cl ₃	105-108
F.72	propil	3-tetrahidrotiopiránil	2,4,6-Cl ₃	4,27 (t,2H), 4,45 (m,2H), 7,82 (s,2H)
F.73	etil	3-tetrahidropiránil	4-NO ₂	3,90 (m,2H), 4,32 (m,2H), 4,50 (m,2H), 7,00 (d,2H), 8,20 (d,2H)
F.74	propil	3-tetrahidropiránil	4-NO ₂	3,90 (m,2H), 4,32 (m,2H), 4,50 (m,2H) 7,00 (d,2H), 8,20 (d,2H)
F.75	etil	4-tetrahidropiránil	4-NO ₂	126-129
F.76	propil	4-tetrahidropiránil	4-NO ₂	138-141
F.77	etil	3-tetrahidrotiopiránil	4-NO ₂	4,32 (m,2H), 4,50 (m,2H), 7,00 (d,2H), 8,20 (d,2H)
F.78	propil	3-tetrahidrotiopiránil	4-NO ₂	4,32 (m,2H), 4,50 (m,2H), 7,00 (d,2H), 8,20 (d,2H)

7. táblázat

Olyan (XII) általános képletű vegyületek, amelyek képletében A jelentése $-\text{CH}_2\text{CH}(\text{CH}_3)-\text{O}-$ képletű csoport.

Szám	R ^d	R ^e	B _n	fizikai adatok/ ¹ H-NMR [δ ppm-ben], op. [°C]
G.01	etil	3-tetrahidropiranyl	-	
G.02	propil	3-tetrahidropiranyl	-	
G.03	etil	4-tetrahidropiranyl	-	
G.04	propil	4-tetrahidropiranyl	-	
G.05	etil	3-tetrahidrotiopiranyl	-	
G.06	propil	3-tetrahidrotiopiranyl	-	
G.07	etil	3-tetrahidropiranyl	4-F	
G.08	propil	3-tetrahidropiranyl	4-F	
G.09	etil	4-tetrahidropiranyl	4-F	
G.10	propil	4-tetrahidropiranyl	4-F	
G.11	etil	3-tetrahidrotiopiranyl	4-F	
G.12	propil	3-tetrahidrotiopiranyl	4-F	
G.13	etil	3-tetrahidropiranyl	4-Cl	
G.14	propil	3-tetrahidropiranyl	4-Cl	
G.15	etil	4-tetrahidropiranyl	4-Cl	1,35 (m,3H), 4,05-4,30 (m,2H), 4,60 (m,1H), 6,80-7,40 (m,4H)
G.16	propil	4-tetrahidropiranyl	4-Cl	1,35 (m,3H), 4,05-4,30 (m,2H), 4,60 (m,1H), 6,80-7,40 (m,4H)
G.17	etil	3-tetrahidrotiopiranyl	4-Cl	1,35 (m,3H), 4,05-4,25 (m,2H), 4,60 (m,1H), 6,80-7,40 (m,4H)
G.18	propil	3-tetrahidrotiopiranyl	4-Cl	1,35 (m,3H), 4,05-4,30 (m,2H), 4,60 (m,1H), 6,80-7,40 (m,4H)

8. táblázat

Olyan (XII) általános képletű vegyületek, amelyek képletében A jelentése $-\text{CH}_2\text{CH}_2-\text{S}-$ képletű csoport.

Szám	R ^d	R ^e	B _n	fizikai adatok/ ¹ H-NMR [δ ppm-ben], op. [°C]
H.01	etil	3-tetrahidropiránil	-	3,90 (m,2H), 4,23 (t,2H), 7,17-7,43 (m,5H)
H.02	propil	3-tetrahidropiránil	-	65 3,97 (m,2H), 4,23 (t,2H), 7,17-7,43 (m,5H)
H.03	etil	4-tetrahidropiránil	-	3,97 (m,2H), 4,23 (t,2H), 7,17-7,43 (m,5H)
H.04	propil	4-tetrahidropiránil	-	4,23 (t,2H), 7,17-7,43 (m,5H)
H.05	etil	3-tetrahidrotiopiránil	-	4,23 (t,2H), 7,17-7,43 (m,5H)
H.06	propil	3-tetrahidrotiopiránil	-	3,90 (m,2H), 4,17 (t,2H), 7,00 (m,2H),
H.07	etil	3-tetrahidropiránil	4-F	7,40 (m,2H)
H.08	propil	3-tetrahidropiránil	4-F	3,90 (m,2H), 4,17 (t,2H), 7,00 (m,2H),
H.09	etil	4-tetrahidropiránil	4-F	7,40 (m,2H)
H.10	propil	4-tetrahidropiránil	4-F	4,00 (m,2H), 4,17 (t,2H), 7,00 (m,2H),
H.11	etil	3-tetrahidrotiopiránil	4-F	7,40 (m,2H)
H.12	propil	3-tetrahidrotiopiránil	4-F	4,17 (t,2H), 7,00 (m,2H), 7,40 (m,2H),
H.13	etil	3-tetrahidropiránil	4-Cl	4,17 (t,2H), 7,00 (m,2H), 7,40 (m,2H),
				71-75



8. táblázat (folytatás)

Szám	R ^d	R ^e	B _n	fizikai adatok/ ¹ H-NMR [δ ppm-ben], op. [°C]
				63- 65
H.14	propil	3-tetrahidropiranil	4-Cl	4,00 (m, 2H), 4,20 (t, 2H), 7,30 (m, 4H)
H.15	etil	4-tetrahidropiranil	4-Cl	4,00 (m, 2H), 4,20 (t, 2H), 7,30 (m, 4H)
H.16	propil	4-tetrahidropiranil	4-Cl	4,20 (t, 2H), 7,30 (m, 4H)
H.17	etil	3-tetrahidrotiopiranil	4-Cl	4,20 (t, 2H), 7,30 (m, 4H)
H.18	propil	3-tetrahidrotiopiranil	4-Cl	3,90 (m, 2H), 4,25 (t, 2H), 7,10-7,50 (m, 4H)
H.19	etil	3-tetrahidropiranil	2-Cl	3,90 (m, 2H), 4,25 (t, 2H), 7,10-7,50 (m, 4H)
H.20	propil	3-tetrahidropiranil	2-Cl	4,00 (m, 2H), 4,25 (t, 2H), 7,10-7,50 (m, 4H)
H.21	etil	4-tetrahidropiranil	2-Cl	4,00 (m, 2H), 4,25 (t, 2H), 7,10-7,50 (m, 4H)
H.22	propil	4-tetrahidropiranil	2-Cl	4,25 (t, 2H), 7,10-7,50 (m, 4H)
H.23	etil	3-tetrahidrotiopiranil	2-Cl	4,25 (t, 2H), 7,10-7,50 (m, 4H)
H.24	propil	3-tetrahidrotiopiranil	2,6-Cl ₂	3,90 (m, 2H), 4,20 (t, 2H), 7,20 (t, 1H)
H.25	etil	3-tetrahidropiranil		7,40 (d, 2H)
H.26	propil	3-tetrahidropiranil	2,6-Cl ₂	3,90 (m, 2H), 4,20 (t, 2H), 7,20 (t, 1H)
				7,40 (d, 2H)
H.27	etil	4-tetrahidropiranil	2,6-Cl ₂	61- 64
H.28	propil	4-tetrahidropiranil	2,6-Cl ₂	4,00 (m, 2H), 4,20 (t, 2H), 7,20 (t, 1H)
				7,40 (d, 2H)
H.29	etil	3-tetrahidrotiopiranil	2,6-Cl ₂	4,20 (t, 2H), 7,20 (t, 2H), 7,40 (d, 2H)
H.30	propil	3-tetrahidrotiopiranil	2,6-Cl ₂	4,20 (t, 2H), 7,20 (t, 2H), 7,40 (d, 2H)



9. táblázat

Olyan (XII) általános képletű vegyületek, amelyek képletében A jelentése $-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2-\text{O}-$ képletű csoport.

Szám	R ^d	R ^e	B _n	fizikai adatok/ ¹ H-NMR [δ ppm-ben], op. [°C]
J.01	etil	3-tetrahidropiránil	-	3,90 (m,2H), 4,03 (t,2H), 4,23 (t,2H), 6,90 (m,3H), 7,27 (m,2H)
J.02	propil	3-tetrahidropiránil	-	3,90 (m,2H), 4,03 (t,2H), 4,23 (t,2H), 6,90 (m,3H), 7,27 (m,2H)
J.03	etil	4-tetrahidropiránil	-	3,97 (m,2H), 4,03 (t,2H), 4,23 (t,2H), 6,90 (m,3H), 7,27 (m,2H)
J.04	propil	4-tetrahidropiránil	-	3,97 (m,2H), 4,03 (t,2H), 4,23 (t,2H), 6,90 (m,3H), 7,27 (m,2H)
J.05	etil	3-tetrahidrotiopiránil	-	4,03 (t,2H), 4,23 (t,2H), 6,90 (m,3H), 7,27 (m,2H)
J.06	propil	3-tetrahidrotiopiránil	-	4,03 (t,2H), 4,23 (t,2H), 6,90 (m,3H), 7,27 (m,2H)
J.07	etil	3-tetrahidropiránil	2-F	3,90 (m,2H), 4,10 (t,2H), 4,27 (t,2H), 6,80-7,15 (m,4H)
J.08	propil	3-tetrahidropiránil	2-F	3,90 (m,2H), 4,10 (t,2H), 4,27 (t,2H), 6,80-7,15 (m,4H)
J.09	etil	4-tetrahidropiránil	2-F	4,00 (m,2H), 4,10 (t,2H), 4,27 (t,2H), 6,80-7,15 (m,4H)
J.10	propil	4-tetrahidropiránil	2-F	76- 80

9. táblázat (folytatás)

Szám	R ^d	R ^e	B _n	fizikai adatok/ ¹ H-NMR [δ ppm-ben], op. [°C]
J.11	etil	3-tetrahidrotiopiranil	2-F	4,10 (t,2H), 4,27 (t,2H), 6,80-7,15(m,4H),
J.12	propil	3-tetrahidrotiopiranil	2-F	4,10 (t,2H), 4,27 (t,2H), 6,80-7,15(m,4H),
J.13	etil	3-tetrahidropiranil	3-F	3,90 (m,2H), 4,05 (t,2H), 4,27 (t,2H), 6,67 (m,3H), 7,23 (m,1H)
J.14	propil	3-tetrahidropiranil	3-F	3,90 (m,2H), 4,05 (t,2H), 4,27 (t,2H), 6,67 (m,3H), 7,23 (m,1H)
J.15	etil	4-tetrahidropiranil	3-F	3,90-4,10 (m,4H), 4,27 (t,2H), 6,67 (m,3H), 7,23 (m,1H)
J.16	propil	4-tetrahidropiranil	3-F	3,90-4,10 (m,4H), 4,27 (t,2H), 6,67 (m,3H), 7,23 (m,1H)
J.17	etil	3-tetrahidrotiopiranil	3-F	4,05 (t,2H), 4,27 (t,2H), 6,67 (m,3H) 7,23 (m,1H)
J.18	propil	3-tetrahidrotiopiranil	3-F	4,05 (t,2H), 4,27 (t,2H), 6,67 (m,3H) 7,23 (m,1H)
J.19	etil	3-tetrahidropiranil	4-F	3,90 (m,2H), 4,03 (t,2H), 4,27 (t,2H), 6,90 (m,2H), 7,00 (m,2H)
J.20	propil	3-tetrahidropiranil	4-F	3,90 (m,2H), 4,03 (t,2H), 4,27 (t,2H), 6,90 (m,2H), 7,00 (m,2H)
J.21	etil	4-tetrahidropiranil	4-F	3,90-4,06 (m,4H), 4,23 (t,2H), 6,90 (m,2H), 7,00 (m,2H)
J.22	propil	4-tetrahidropiranil	4-F	3,90-4,06 (m,4H), 4,28 (t,2H), 6,90 (m,2H), 7,00 (m,2H)

9. táblázat (folytatás)

Szám	R ^d	R ^e	B _n	fizikai adatok/ ¹ H-NMR [δ ppm-ben], op. [°C]
J.23	etil	3-tetrahidrotiopiránil	4-F	4,03 (t, 2H), 4,27 (t, 2H), 6,90 (m, 2H), 7,00 (m, 2H)
J.24	propil	3-tetrahidrotiopiránil	4-F	4,03 (t, 2H), 4,27 (t, 2H), 6,90 (m, 2H), 7,00 (m, 2H)
J.25	etil	3-tetrahidropiránil	2-Cl	
J.26	propil	3-tetrahidropiránil	2-Cl	
J.27	etil	4-tetrahidropiránil	2-Cl	
J.28	propil	4-tetrahidropiránil	2-Cl	
J.29	etil	3-tetrahidrotiopiránil	2-Cl	
J.30	propil	3-tetrahidrotiopiránil	2-Cl	
J.31	etil	3-tetrahidropiránil	3-Cl	3,90 (m, 2H), 4,06 (t, 2H), 4,27 (t, 2H), 6,77 (m, 1H), 6,90 (m, 2H), 7,17 (m, 1H)
J.32	propil	3-tetrahidropiránil	3-Cl	3,90 (m, 2H), 4,06 (t, 2H), 4,27 (t, 2H), 6,77 (m, 1H), 6,90 (m, 2H), 7,17 (m, 1H)
J.33	etil	4-tetrahidropiránil	3-Cl	3,90-4,10 (m, 4H), 4,27 (t, 2H), 6,77 (m, 1H), 6,90 (m, 2H), 7,17 (m, 1H)
J.34	propil	4-tetrahidropiránil	3-Cl	3,90-4,10 (m, 4H), 4,27 (t, 2H), 6,77 (m, 1H), 6,90 (m, 2H), 7,17 (m, 1H)
J.35	etil	3-tetrahidrotiopiránil	3-Cl	4,06 (t, 2H), 4,27 (t, 2H), 6,77 (m, 1H), 6,90 (m, 2H), 7,17 (m, 1H)

9. táblázat (folytatás)

Szám	R ^d	R ^e	B _n	fizikai adatok/ ¹ H-NMR [δ ppm-ben], op. [°C]
J.36	propil	3-tetrahidrotiopiránil	3-Cl	4,06 (t, 2H), 4,27 (t, 2H), 6,77 (m, 1H), 6,90 (m, 2H), 7,17 (m, 1H)
J.37	etil	3-tetrahidropiránil	4-Cl	3,90 (m, 2H), 4,03 (t, 2H), 4,23 (t, 2H), 6,80 (m, 2H), 7,20 (m, 2H)
J.38	propil	3-tetrahidropiránil	4-Cl	3,90 (m, 2H), 4,03 (t, 2H), 4,23 (t, 2H), 6,80 (m, 2H), 7,20 (m, 2H)
J.39	etil	4-tetrahidropiránil	4-Cl	3,90-4,09 (m, 4H), 4,23 (t, 2H), 6,80 (m, 2H), 7,20 (m, 2H)
J.40	propil	4-tetrahidropiránil	4-Cl	3,90-4,09 (m, 4H), 4,23 (t, 2H), 6,80 (m, 2H), 7,20 (m, 2H)
J.41	etil	3-tetrahidrotiopiránil	4-Cl	4,03 (t, 2H), 4,23 (t, 2H), 6,80 (m, 2H), 7,20 (m, 2H)
J.42	propil	3-tetrahidrotiopiránil	4-Cl	4,03 (t, 2H), 4,23 (t, 2H), 6,80 (m, 2H), 7,20 (m, 2H)
J.43	etil	3-tetrahidropiránil	4-NO ₂	3,90 (m, 2H), 4,20 (t, 2H), 4,28 (t, 2H), 6,93 (d, 2H), 8,20 (d, H)
J.44	propil	3-tetrahidropiránil	4-NO ₂	3,90 (m, 2H), 4,20 (t, 2H), 4,28 (t, 2H), 6,93 (d, 2H), 8,20 (d, 2H)
J.45	etil	4-tetrahidropiránil	4-NO ₂	4,00 (m, 2H), 4,20 (t, 2H), 4,28 (t, 2H), 6,93 (d, 2H), 8,20 (d, 2H)

9. táblázat (folytatás)

Szám	R ^d	R ^e	B _n	fizikai adatok/ ¹ H-NMR [δ ppm-ben], op. [°C]
J.46	propil	4-tetrahidropiránil	4-NO ₂	4,00 (m, 2H), 4,20 (t, 2H), 4,28 (t, 2H), 6,93 (d, 2H), 8,20 (d, 2H)
J.47	etil	3-tetrahidrotiopiránil	4-NO ₂	4,20 (t, 2H), 4,28 (t, 2H), 6,93 (d, 2H), 8,20 (d, 2H)
J.48	propil	3-tetrahidrotiopiránil	4-NO ₂	4,20 (t, 2H), 4,28 (t, 2H), 6,93 (d, 2H), 8,20 (d, 2H)
J.49	etil	3-tetrahidropiránil	4-Br	3,90 (m, 2H), 4,00 (t, 2H), 4,27 (t, 2H), 6,80 (d, 2H), 7,37 (d, 2H)
J.50	propil	3-tetrahidropiránil	4-Br	3,90 (m, 2H), 4,00 (t, 2H), 4,27 (t, 2H), 6,80 (d, 2H), 7,37 (d, 2H)
J.51	etil	4-tetrahidropiránil	4-Br	3,90-4,10 (m, 4H), 4,27 (t, 2H), 6,80 (d, 2H), 7,37 (d, 2H)
J.52	propil	4-tetrahidropiránil	4-Br	3,90-4,10 (m, 4H), 4,27 (t, 2H), 6,80 (d, 2H), 7,37 (d, 2H)
J.53	etil	4-tetrahidrotiopiránil	4-Br	4,00 (t, 2H), 4,27 (t, 2H), 6,80 (d, 2H), 7,37 (d, 2H)
J.54	propil	4-tetrahidrotiopiránil	4-Br	4,00 (t, 2H), 4,27 (t, 2H), 6,80 (d, 2H), 7,37 (d, 2H)

10. táblázat

Olyan (XII) általános képletű vegyületek, amelyek képletében A jelentése $-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2-\text{S}-$ képletű csoport.

Szám	R ^d	R ^e	B _n	fizikai adatok/ ¹ H-NMR [δ ppm-ben], op. [°C]
K.01	etil	3-tetrahidropiránil	-	3,90 (m, 2H), 4,17 (t, 2H), 7,10-7,40 (m, 5H)
K.02	propil	3-tetrahidropiránil	-	3,90 (m, 2H), 4,17 (t, 2H), 7,10-7,40 (m, 5H)
K.03	etil	4-tetrahidropiránil	-	4,00 (m, 2H), 4,17 (t, 2H), 7,10-7,40 (m, 5H)
K.04	propil	4-tetrahidropiránil	-	4,00 (m, 2H), 4,17 (t, 2H), 7,10-7,40 (m, 5H)
K.05	etil	3-tetrahidrotiopiránil	-	4,17 (t, 2H), 7,10-7,40 (m, 5H)
K.06	propil	3-tetrahidrotiopiránil	-	4,17 (t, 2H), 7,10-7,40 (m, 5H)
K.07	etil	3-tetrahidropiránil	4-F	3,90 (m, 2H), 4,17 (t, 2H), 7,00 (t, 2H), 7,33 (m, 2H)
K.08	propil	3-tetrahidropiránil	4-F	3,90 (m, 2H), 4,17 (t, 2H), 7,00 (t, 2H), 7,33 (m, 2H)
K.09	etil	4-tetrahidropiránil	4-F	4,00 (m, 2H), 4,17 (t, 2H), 7,00 (t, 2H), 7,33 (m, 2H)
K.10	propil	4-tetrahidropiránil	4-F	4,00 (m, 2H), 4,17 (t, 2H), 7,00 (t, 2H), 7,33 (m, 2H)
K.11	etil	3-tetrahidrotiopiránil	4-F	4,17 (t, 2H), 7,00 (t, 2H), 7,33 (m, 2H)
K.12	propil	3-tetrahidrotiopiránil	4-F	4,17 (t, 2H), 7,00 (t, 2H), 7,33 (m, 2H)
K.13	etil	3-tetrahidropiránil	4-Cl	3,90 (m, 2H), 4,17 (t, 2H), 7,27 (s, 4H)
K.14	propil	3-tetrahidropiránil	4-Cl	3,90 (m, 2H), 4,17 (t, 2H), 7,27 (s, 4H)

10. táblázat (folytatás)

Szám	R ^d	R ^e	B _n	fizikai adatok/ ¹ H-NMR [δ ppm-ben], op. [°C]
K.15	etil	4-tetrahidropirán	4-Cl	4,00 (m, 2H), 4,17 (t, 2H), 7,27 (s, 4H)
K.16	propil	4-tetrahidropirán	4-Cl	4,00 (m, 2H), 4,17 (t, 2H), 7,27 (s, 4H)
K.17	etil	3-tetrahidrotiopirán	4-Cl	4,17 (t, 2H), 7,27 (s, 4H)
K.18	propil	3-tetrahidrotiopirán	4-Cl	4,17 (t, 2H), 7,27 (s, 4H)
K.19	etil	3-tetrahidropirán	2-Cl	3,90 (m, 2H), 4,20 (t, 2H), 7,07-7,40 (m, 4H)
K.20	propil	3-tetrahidropirán	2-Cl	3,90 (m, 2H), 4,20 (t, 2H), 7,07-7,40 (m, 4H)
K.21	etil	4-tetrahidropirán	2-Cl	4,00 (m, 2H), 4,20 (t, 2H), 7,07-7,40 (m, 4H)
K.22	propil	4-tetrahidropirán	2-Cl	4,00 (m, 2H), 4,20 (t, 2H), 7,07-7,40 (m, 4H)
K.23	etil	3-tetrahidrotiopirán	2-Cl	4,20 (t, 2H), 7,07-7,40 (m, 4H)
K.24	propil	3-tetrahidrotiopirán	2-Cl	4,20 (t, 2H), 7,07-7,40 (m, 4H)
K.25	etil	3-tetrahidropirán	3-Cl	3,90 (m, 2H), 4,20 (t, 2H), 7,17 (m, 3H) 7,30 (m, 1H)
K.26	propil	3-tetrahidropirán	3-Cl	3,90 (m, 2H), 4,20 (t, 2H), 7,17 (m, 3H) 7,30 (m, 1H)
K.27	etil	4-tetrahidropirán	3-Cl	4,00 (m, 2H), 4,20 (t, 2H), 7,17 (m, 3H) 7,30 (m, 1H)
K.28	propil	4-tetrahidropirán	3-Cl	4,00 (m, 2H), 4,20 (t, 2H), 7,17 (m, 3H) 7,30 (m, 1H)

10. táblázat (folytatás)

Szám	R ^d	R ^e	B _n	fizikai adatok/ ¹ H-NMR [δ ppm-ben], op. [°C]
K.29	etil	3-tetrahidrotiopiránil	3-Cl	4,20 (t,2H), 7,17 (m,3H), 7,30 (m,1H)
K.30	propil	3-tetrahidrotiopiránil	3-Cl	4,20 (t,2H), 7,17 (m,3H), 7,30 (m,1H)
K.31	etil	3-tetrahidropiránil	2,5-Cl ₂	3,90 (m,2H), 4,20 (t,2H), 7,07 (dd,1H), 7,20 (d,1H) 7,30 (d,1H)
K.32	propil	3-tetrahidropiránil	2,5-Cl ₂	3,90 (m,2H), 4,20 (t,2H), 7,07 (dd,1H), 7,20 (d,1H) 7,30 (d,1H)
K.33	etil	4-tetrahidropiránil	2,5-Cl ₂	4,00 (m,2H), 4,20 (t,2H), 7,07 (dd,1H), 7,20 (d,1H) 7,30 (d,1H)
K.34	propil	4-tetrahidropiránil	2,5-Cl ₂	4,00 (m,2H), 4,20 (t,2H), 7,07 (dd,1H), 7,20 (d,1H) 7,30 (d,1H)
K.35	etil	3-tetrahidrotiopiránil	2,5-Cl ₂	4,20 (t,2H), 7,07 (dd,1H), 7,20 (d,1H), 7,30 (d,1H)
K.36	propil	3-tetrahidrotiopiránil	2,5-Cl ₂	4,20 (t,2H), 7,07 (dd,1H), 7,20 (d,1H), 7,30 (d,1H)
K.37	etil	3-tetrahidropiránil	2,6-Cl ₂	3,90 (m,2H), 4,20 (t,2H), 7,20 (t,1H), 7,40 (d,2H)
K.38	propil	3-tetrahidropiránil	2,6-Cl ₂	3,90 (m,2H), 4,20 (t,2H), 7,20 (t,1H), 7,40 (d,2H)
K.39	etil	4-tetrahidropiránil	2,6-Cl ₂	4,00 (m,2H), 4,20 (t,2H), 7,20 (t,1H), 7,40 (d,2H)
K.40	propil	4-tetrahidropiránil	2,6-Cl ₂	4,00 (m,2H), 4,20 (t,2H), 7,20 (t,1H), 7,40 (d,2H)
K.41	etil	3-tetrahidrotiopiránil	2,6-Cl ₂	4,20 (t,2H), 7,20 (t,1H), 7,40 (d,2H)
K.42	propil	3-tetrahidrotiopiránil	2,6-Cl ₂	4,20 (t,2H), 7,20 (t,1H), 7,40 (d,2H)

11. táblázat

Olyan (XII) általános képletű vegyületek, amelyek képletében A jelentése $-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{O}-\text{CH}_2-$ képletű csoport.

Szám	R ^d	R ^e	B _n	fizikai adatok/ ¹ H-NMR [δ ppm-ben], op. [°C]
L.01	etil	3-tetrahidropiranyl	-	3,90 (m, 2H), 4,25 (t, 2H), 4,58 (s, 2H), 7,38 (s, 5H)
L.02	propil	3-tetrahidropiranyl	-	3,90 (m, 2H), 4,25 (t, 2H), 4,58 (s, 2H), 7,38 (s, 5H)
L.03	etil	4-tetrahidropiranyl	-	4,03 (m, 2H), 4,33 (m, 2H), 4,60 (s, 2H), 7,40 (s, 5H)
L.04	propil	4-tetrahidropiranyl	-	4,03 (m, 2H), 4,33 (m, 2H), 4,60 (s, 2H), 7,40 (s, 5H)
L.05	etil	3-tetrahidrotiopiranyl	-	4,27 (m, 2H), 4,57 (s, 2H), 7,35 (s, 5H)
L.06	propil	3-tetrahidrotiopiranyl	-	4,27 (m, 2H), 4,57 (s, 2H), 7,35 (s, 5H)
L.07	etil	3-tetrahidropiranyl	2-F	3,93 (m, 2H), 4,27 (m, 2H), 4,67 (s, 2H), 6,93-7,50 (m, 4H)
L.08	propil	3-tetrahidropiranyl	2-F	3,93 (m, 2H), 4,27 (m, 2H), 4,67 (s, 2H), 6,93-7,50 (m, 4H)
L.09	etil	4-tetrahidropiranyl	2-F	4,03 (m, 2H), 4,27 (m, 2H), 4,63 (s, 2H), 6,97-7,50 (m, 4H)
L.10	propil	4-tetrahidropiranyl	2-F	4,03 (m, 2H), 4,27 (m, 2H), 4,63 (s, 2H), 6,97-7,50 (m, 4H)

11. táblázat (folytatás)

Szám	R ^d	R ^e	B _n	fizikai adatok/ ¹ H-NMR [δ ppm-ben], op. [°C]
L.11	etil	3-tetrahidrotiopiránil	2-F	4, 27 (m, 2H), 4, 67 (s, 2H), 6, 97-7, 50 (m, 4H)
L.12	propil	3-tetrahidrotiopiránil	2-F	4, 27 (m, 2H), 4, 67 (s, 2H), 6, 97-7, 50 (m, 4H)
L.13	etil	3-tetrahidropiránil	3-F	3, 93 (m, 2H), 4, 27 (m, 2H), 4, 57 (s, 2H), 6, 90-7, 15 (m, 3H), 7, 23-7, 40 (m, 1H)
L.14	propil	3-tetrahidropiránil	3-F	3, 93 (m, 2H), 4, 27 (m, 2H), 4, 57 (s, 2H), 6, 90-7, 15 (m, 3H), 7, 23-7, 40 (m, 1H)
L.15	etil	4-tetrahidropiránil	3-F	4, 03 (m, 2H), 4, 25 (m, 2H), 4, 60 (s, 2H), 6, 90-7, 18 (m, 3H), 7, 26-7, 40 (m, 1H)
L.16	propil	4-tetrahidropiránil	3-F	4, 03 (m, 2H), 4, 25 (m, 2H), 4, 60 (s, 2H), 6, 90-7, 18 (m, 3H), 7, 26-7, 40 (m, 1H)
L.17	etil	3-tetrahidrotiopiránil	3-F	4, 27 (m, 2H), 4, 60 (s, 2H), 6, 90-7, 15 (m, 3H), 7, 23-7, 40 (m, 1H)
L.18	propil	3-tetrahidrotiopiránil	3-F	4, 27 (m, 2H), 4, 60 (s, 2H), 6, 90-7, 15 (m, 3H), 7, 23-7, 40 (m, 1H)
L.19	etil	3-tetrahidropiránil	4-F	3, 93 (m, 2H), 4, 23 (m, 2H), 4, 53 (s, 2H), 7, 00 (m, 2H), 7, 30 (m, 2H)
L.20	propil	3-tetrahidropiránil	4-F	3, 93 (m, 2H), 4, 23 (m, 2H), 4, 53 (s, 2H), 7, 00 (m, 2H), 7, 30 (m, 2H)
L.21	etil	4-tetrahidropiránil	4-F	92 4, 00 (m, 2H), 4, 23 (m, 2H), 4, 53 (s, 2H), 7, 03 (m, 2H), 7, 30 (m, 2H)
L.22	propil	4-tetrahidropiránil	4-F	



11. táblázat (folytatás)

Szám	R ^d	R ^e	B _n	fizikai adatok/ ¹ H-NMR [δ ppm-ben], op. [°C]
L.23	etil	3-tetrahidrotiopiranil	4-F	4,27 (m, 2H), 4,53 (s, 2H), 7,03 (m, 2H), 7,30 (m, 2H)
L.24	propil	3-tetrahidrotiopiranil	4-F	4,27 (m, 2H), 4,53 (s, 2H), 7,03 (m, 2H), 7,30 (m, 2H)
L.25	etil	3-tetrahidropiranil	2-Cl	
L.26	propil	3-tetrahidropiranil	2-Cl	
L.27	etil	4-tetrahidropiranil	2-Cl	
L.28	propil	4-tetrahidropiranil	2-Cl	
L.29	etil	3-tetrahidrotiopiranil	2-Cl	
L.30	propil	3-tetrahidrotiopiranil	2-Cl	
L.31	etil	3-tetrahidropiranil	3-Cl	
L.32	propil	3-tetrahidropiranil	3-Cl	
L.33	etil	4-tetrahidropiranil	3-Cl	
L.34	propil	4-tetrahidropiranil	3-Cl	
L.35	etil	3-tetrahidrotiopiranil	3-Cl	
L.36	propil	3-tetrahidrotiopiranil	3-Cl	
L.37	etil	3-tetrahidropiranil	4-Cl	3,93 (m, 2H), 4,27 (m, 2H), 4,53 (s, 2H), 7,28 (m, 4H)
L.38	propil	3-tetrahidropiranil	4-Cl	3,93 (m, 2H), 4,27 (m, 2H), 4,53 (s, 2H), 7,28 (m, 4H)
L.39	etil	4-tetrahidropiranil	4-Cl	67- 72
L.40	propil	4-tetrahidropiranil	4-Cl	4,00 (m, 2H), 4,23 (m, 2H), 4,53 (s, 2H), 7,28 (m, 4H)



11. táblázat (folytatás)

Szám	R ^d	R ^e	B _n	fizikai adatok/ ¹ H-NMR [δ ppm-ben], op. [°C]
L.41	etil	3-tetrahidrotiopiranil	4-Cl	4,27 (m,2H), 4,53 (s,2H), 7,28 (m,4H)
L.42	propil	3-tetrahidrotiopiranil	4-Cl	4,27 (m,2H), 4,53 (s,2H), 7,28 (m,4H)
L.43	etil	3-tetrahidropiranil	2-CH ₃	3,93 (m,2H), 4,23 (m,2H), 4,57 (s,2H), 7,09-7,33 (m,4H)
L.44	propil	3-tetrahidropiranil	2-CH ₃	3,93 (m,2H), 4,23 (m,2H), 4,57 (s,2H), 7,09-7,33 (m,4H)
L.45	etil	4-tetrahidropiranil	2-CH ₃	4,00 (m,2H), 4,23 (m,2H), 4,57 (s,2H), 7,09-7,33 (m,4H)
L.46	propil	4-tetrahidropiranil	2-CH ₃	4,00 (m,2H), 4,23 (m,2H), 4,57 (s,2H), 7,09-7,33 (m,4H)
L.47	etil	3-tetrahidrotiopiranil	2-CH ₃	4,23 (m,2H), 4,57 (s,2H), 7,09-7,33 (m,4H)
L.48	propil	3-tetrahidrotiopiranil	2-CH ₃	4,23 (m,2H), 4,57 (s,2H), 7,09-7,33 (m,4H)
L.49	etil	3-tetrahidropiranil	3-CH ₃	3,93 (m,2H), 4,25 (m,2H), 4,57 (s,2H), 7,00-7,32 (m,4H)
L.50	propil	3-tetrahidropiranil	3-CH ₃	3,93 (m,2H), 4,25 (m,2H), 4,57 (s,2H), 7,00-7,32 (m,4H)
L.51	etil	4-tetrahidropiranil	3-CH ₃	4,00 (m,2H), 4,27 (m,2H), 4,57 (s,2H), 7,00-7,32 (m,4H)
L.52	propil	4-tetrahidropiranil	3-CH ₃	4,00 (m,2H), 4,27 (m,2H), 4,57 (s,2H), 7,00-7,32 (m,4H)



11. táblázat (folytatás)

Szám	R ^d	R ^e	B _n	fizikai adatok/ ¹ H-NMR [δ ppm-ben], op. [°C]
L.53	etil	3-tetrahidrotiopiránil	3-CH ₃	4,27 (m,2H), 4,60 (s,2H), 7,00-7,32 (m,4H)
L.54	propil	3-tetrahidrotiopiránil	3-CH ₃	4,27 (m,2H), 4,60 (s,2H), 7,00-7,32 (m,4H)
L.55	etil	3-tetrahidropiránil	4-CH ₃	3,93 (m,2H), 4,20 (m,2H), 4,53 (s,2H), 7,07-7,30 (m,4H)
L.56	propil	3-tetrahidropiránil	4-CH ₃	3,93 (m,2H), 4,20 (m,2H), 4,53 (s,2H), 7,07-7,30 (m,4H)
L.57	etil	4-tetrahidropiránil	4-CH ₃	4,00 (m,2H), 4,23 (m,2H), 4,57 (s,2H), 7,03-7,27 (m,4H)
L.58	propil	4-tetrahidropiránil	4-CH ₃	4,00 (m,2H), 4,23 (m,2H), 4,57 (s,2H), 7,03-7,27 (m,4H)
L.59	etil	3-tetrahidrotiopiránil	4-CH ₃	4,23 (m,2H), 4,57 (s,2H), 7,07-7,30 (m,4H)
L.60	propil	3-tetrahidrotiopiránil	4-CH ₃	4,28 (m,2H), 4,57 (s,2H), 7,07-7,30 (m,4H)
L.61	etil	3-tetrahidropiránil	4-terc-butil	3,93 (m,2H), 4,23 (m,2H), 4,53 (s,2H), 7,20-7,40 (m,4H)
L.62	propil	3-tetrahidropiránil	4-terc-butil	3,93 (m,2H), 4,23 (m,2H), 4,53 (s,2H), 7,20-7,40 (m,4H)
L.63	etil	4-tetrahidropiránil	4-terc-butil	4,00 (m,2H), 4,23 (m,2H), 4,53 (s,2H), 7,20-7,40 (m,4H)



11. táblázat (folytatás)

Szám	R ^d	R ^e	B _n	fizikai adatok/ ¹ H-NMR [δ ppm-ben], op. [°C]
L.64	propil	4-tetrahidropiránil	4-terc-butil	4,00 (m, 2H), 4,23 (m, 2H), 4,53 (s, 2H), 7,20-7,40 (m, 4H)
L.65	etil	3-tetrahidrotiopiránil	4-terc-butil	4,23 (m, 2H), 4,53 (s, 2H), 7,20-7,40 (m, 4H)
L.66	propil	3-tetrahidrotiopiránil	4-terc-butil	4,23 (m, 2H), 4,53 (s, 2H), 7,20-7,40 (m, 4H)

12. táblázat

Olyan (XII) általános képletű vegyületek, amelyek képletében A jelentése $-\text{CH}_2\text{CH}_2-\text{S}-\text{CH}_2-$ képletű csoport.

Szám	R ^d	R ^e	B _n	fizikai adatok/ ¹ H-NMR [δ ppm-ben], op. [°C]
M.01	etil	3-tetrahidropiránil	-	3,73 (s, 2H), 3,90 (m, 2H), 4,17 (t, 2H), 7,28 (s, 5H)
M.02	propil	3-tetrahidropiránil	-	3,73 (s, 2H), 3,90 (m, 2H), 4,17 (t, 2H), 7,28 (s, 5H)
M.03	etil	4-tetrahidropiránil	-	3,77 (s, 2H), 4,00 (m, 2H), 4,13 (t, 2H), 7,28 (s, 5H)
M.04	propil	4-tetrahidropiránil	-	3,77 (s, 2H), 4,00 (m, 2H), 4,13 (t, 2H), 7,28 (s, 5H)
M.05	etil	3-tetrahidrotiopiránil	-	3,80 (s, 2H), 4,13 (t, 2H), 7,28 (s, 5H)
M.06	propil	3-tetrahidrotiopiránil	-	3,80 (s, 2H), 4,13 (t, 2H), 7,28 (s, 5H)
M.07	etil	3-tetrahidropiránil	4-F	3,72 (s, 2H), 3,90 (m, 2H), 4,13 (t, 2H), 7,00 (m, 2H), 7,30 (m, 2H)
M.08	propil	3-tetrahidropiránil	4-F	3,72 (s, 2H), 3,90 (m, 2H), 4,13 (t, 2H), 7,00 (m, 2H), 7,30 (m, 2H)
M.09	etil	4-tetrahidropiránil	4-F	63- 65
M.10	propil	4-tetrahidropiránil	4-F	



12. táblázat (folytatás)

Szám	R ^d	R ^e	B _n	fizikai adatok/ ¹ H-NMR [δ ppm-ben], op. [°C]	
M.11	etil	3-tetrahidrotiopiranil	4-F	3,75 (s,2H), 7,30 (m,2H)	4,13 (t,2H), 7,00 (m,2H),
M.12	propil	3-tetrahidrotiopiranil	4-F	3,75 (s,2H), 7,30 (m,2H)	4,13 (t,2H), 7,00 (m,2H),
M.13	etil	3-tetrahidropiranil	4-Cl	3,77 (s,2H), 7,30 (s,4H)	3,93 (m,2H), 4,13 (t,2H),
M.14	propil	3-tetrahidropiranil	4-Cl	3,77 (s,2H), 7,30 (s,4H)	3,93 (m,2H), 4,13 (t,2H),
M.15	etil	4-tetrahidropiranil	4-Cl	3,73 (s,2H), 7,30 (s,4H)	4,00 (m,2H), 4,17 (t,2H),
M.16	propil	4-tetrahidropiranil	4-Cl	3,73 (s,2H), 7,30 (s,4H)	4,00 (m,2H), 4,17 (t,2H),
M.17	etil	3-tetrahidrotiopiranil	4-Cl	3,73 (s,2H), 7,30 (s,4H)	4,13 (m,2H), 7,30 (s,4H)
M.18	propil	3-tetrahidrotiopiranil	4-Cl	3,73 (s,2H), 7,30 (s,4H)	4,13 (m,2H), 7,30 (s,4H)

13. táblázat

olyan (XII) általános képletű vegyületek, amelyek képletében A jelentése $-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2-$ 0- képletű csoport.

Szám	R ^d	R ^e	B _n	fizikai adatok/ ¹ H-NMR [δ ppm-ben], op. [°C]
N.01	etil	3-tetrahidropiranil	-	3, 70-4, 20 (m, 6H), 6, 90 (m, 3H), 7, 30 (m, 2H)
N.02	propil	3-tetrahidropiranil	-	3, 70-4, 20 (m, 6H), 6, 90 (m, 3H), 7, 30 (m, 2H)
N.03	etil	4-tetrahidropiranil	-	3, 83-4, 23 (m, 6H), 6, 90 (m, 3H), 7, 30 (m, 2H)
N.04	propil	4-tetrahidropiranil	-	3, 83-4, 23 (m, 6H), 6, 90 (m, 3H), 7, 30 (m, 2H)
N.05	etil	3-tetrahidrotiopiranil	-	4, 00 (bs, 2H), 4, 13 (bs, 2H), 6, 90 (m, 3H) 7, 30 (m, 2H)
N.06	propil	3-tetrahidrotiopiranil	-	4, 00 (bs, 2H), 4, 13 (bs, 2H), 6, 90 (m, 3H) 7, 30 (m, 2H)
N.07	etil	3-tetrahidropiranil	2-F	3, 93 (m, 2H), 4, 00-4, 20 (m, 4H), 6, 80-7, 15 (m, 4H)
N.08	propil	3-tetrahidropiranil	2-F	3, 93 (m, 2H), 4, 00-4, 20 (m, 4H), 6, 80-7, 15 (m, 4H)
N.09	etil	4-tetrahidropiranil	2-F	68- 72
N.10	propil	4-tetrahidropiranil	2-F	3, 90-4, 20 (m, 6H), 6, 80-7, 15 (m, 4H)

13. táblázat (folytatás)

Szám	R ^d	R ^e	B _n	fizikai adatok/ ¹ H-NMR [δ ppm-ben], op. [°C]
N.11	etil	3-tetrahidrotiopiranil	2-F	4,00-4,20 (m,4H), 6,80-7,15 (m,4H)
N.12	propil	3-tetrahidrotiopiranil	2-F	4,00-4,20 (m,4H), 6,80-7,15 (m,4H)
N.13	etil	3-tetrahidropiranil	3-F	
N.14	propil	3-tetrahidropiranil	3-F	
N.15	etil	4-tetrahidropiranil	3-F	
N.16	propil	4-tetrahidropiranil	3-F	
N.17	etil	3-tetrahidrotiopiranil	3-F	
N.18	propil	3-tetrahidrotiopiranil	4-F	3,80-4,20 (m,6H), 6,75-7,05 (m,4H)
N.19	etil	3-tetrahidropiranil	4-F	3,80-4,20 (m,6H), 6,75-7,05 (m,4H)
N.20	propil	3-tetrahidropiranil	4-F	3,90-4,20 (m,6H), 6,75-7,05 (m,4H)
N.21	etil	4-tetrahidropiranil	4-F	3,90-4,20 (m,6H), 6,75-7,05 (m,4H)
N.22	propil	4-tetrahidropiranil	4-F	3,90-4,20 (m,6H), 6,75-7,05 (m,4H)
N.23	etil	3-tetrahidrotiopiranil	4-F	3,90-4,20 (m,6H), 6,75-7,05 (m,4H)
N.24	propil	3-tetrahidrotiopiranil	4-Cl	3,80-4,20 (m,6H), 6,80 (m,2H), 7,20 (m,2H)
N.25	etil	3-tetrahidropiranil	4-Cl	3,80-4,20 (m,6H), 6,80 (m,2H), 7,20 (m,2H)
N.26	propil	3-tetrahidropiranil	4-Cl	3,90-4,20 (m,6H), 6,80 (m,2H), 7,20 (m,2H)
N.27	etil	4-tetrahidropiranil	4-Cl	3,90-4,20 (m,6H), 6,80 (m,2H), 7,20 (m,2H)
N.28	propil	4-tetrahidropiranil	4-Cl	3,90-4,20 (m,6H), 6,80 (m,2H), 7,20 (m,2H)

13. táblázat (folytatás)

Szám	R ^d	R ^e	B _n	fizikai adatok/ ¹ H-NMR [δ ppm-ben], op. [°C]
N.29	etil	3-tetrahidrotiopiranil	4-Cl	3,90-4,20 (m,4H), 6,80 (m,2H), 7,20 (m,2H)
N.30	propil	3-tetrahidrotiopiranil	4-Cl	3,90-4,20 (m,4H), 6,80 (m,2H), 7,20 (m,2H)
N.31	etil	3-tetrahidropiranil	2,6-Cl ₂	3,93 (m,2H), 4,00-4,25 (m,4H), 7,00 (t,1H), 7,30 (d,2H)
N.32	propil	3-tetrahidropiranil	2,6-Cl ₂	3,93 (m,2H), 4,00-4,25 (m,4H), 7,00 (t,1H), 7,30 (d,2H)
N.33	etil	4-tetrahidropiranil	2,6-Cl ₂	3,90-4,25 (m,6H), 7,00 (t,1H), 7,30 (d,2H)
N.34	propil	4-tetrahidropiranil	2,6-Cl ₂	3,90-4,25 (m,6H), 7,00 (t,1H), 7,30 (d,2H)
N.35	etil	3-tetrahidrotiopiranil	2,6-Cl ₂	4,00-4,20 (m,4H), 7,00 (t,1H), 7,30 (d,2H)
N.36	propil	3-tetrahidrotiopiranil	2,6-Cl ₂	4,00-4,20 (m,4H), 7,00 (t,1H), 7,30 (d,2H)

14. táblázat

Olyan (XII) általános képletű vegyületek, amelyek képletében A jelentése $-\text{CH}_2\text{CH}_2-\text{O}-\text{CH}_2\text{CH}_2-$ képletű csoport

Szám	R ^d	R ^e	B _n	fizikai adatok/ ¹ H-NMR	
				[δ ppm-ben], op.	[°C]
P.01	etil	3-tetrahidropiránil	-	3,90 (m,2H), 4,20 (m,2H), 7,25 (m,5H)	
P.02	propil	3-tetrahidropiránil	-	3,90 (m,2H), 4,20 (m,2H), 7,25 (m,5H)	
P.03	etil	4-tetrahidropiránil	-		
P.04	propil	4-tetrahidropiránil	-		
P.05	etil	3-tetrahidrotiopiránil	-	4,20 (m,2H), 7,25 (m,5H)	
P.06	propil	3-tetrahidrotiopiránil	-	4,20 (m,2H), 7,25 (m,5H)	
P.07	etil	3-tetrahidropiránil	4-F	3,90(m,2H), 4,17(m,2H), 6,93(m,2H), 7,13(m,2H)	
P.08	propil	3-tetrahidropiránil	4-F	3,90(m,2H), 4,17(m,2H), 6,93(m,2H), 7,13(m,2H)	
P.09	etil	4-tetrahidropiránil	4-F		
P.10	propil	4-tetrahidropiránil	4-F		
P.11	etil	3-tetrahidrotiopiránil	4-F	4,17 (m,2H), 6,93 (m,2H), 7,13 (m,2H)	
P.12	propil	3-tetrahidrotiopiránil	4-F	4,17 (m,2H), 6,93 (m,2H), 7,13 (m,2H)	
P.13	etil	3-tetrahidropiránil	4-Cl	3,90 (m,2H), 4,17 (m,2H), 7,13 (m,4H)	
P.14	propil	3-tetrahidropiránil	4-Cl	3,90 (m,2H), 4,17 (m,2H), 7,13 (m,4H)	
P.15	etil	4-tetrahidropiránil	4-Cl		
P.16	propil	4-tetrahidropiránil	4-Cl		
P.17	etil	3-tetrahidrotiopiránil	4-Cl	4,17 (m,2H), 7,13 (m,4H)	
P.18	propil	3-tetrahidrotiopiránil	4-Cl	4,17 (m,2H), 7,13 (m,4H)	





15. táblázat

Olyan (XII) általános képletű vegyületek, amelyek képletében A jelentése $-\text{CH}_2(\text{CH}_2)_3\text{CH}_2-\text{O}-$ képletű csoport.

Szám	R ^d	R ^e	B _n	fizikai adatok/ ¹ H-NMR	
				[δ ppm-ben], op.	[°C]
R.01	etil	3-tetrahidropiránil	-	3,80-4,17 (m,6H), 6,90 (m,3H), 7,27 (m,2H)	
R.02	propil	3-tetrahidropiránil	-	3,80-4,17 (m,6H), 6,90 (m,3H), 7,27 (m,2H)	
R.03	etil	4-tetrahidropiránil	-	3,90-4,17 (m,6H), 6,90 (m,3H), 7,27 (m,2H)	
R.04	propil	4-tetrahidropiránil	-	3,90-4,17 (m,6H), 6,90 (m,3H), 7,27 (m,2H)	
R.05	etil	3-tetrahidrotiopiránil	-	3,97 (t,2H), 4,07 (t,2H), 6,90 (m,3H), 7,27 (m,2H)	
R.06	propil	3-tetrahidrotiopiránil	-	3,97 (t,2H), 4,07 (t,2H), 6,90 (m,3H), 7,27 (m,2H)	
R.07	etil	3-tetrahidropiránil	4-F	3,90 (m,4H), 4,03 (t,2H), 6,70-7,03 (m,4H)	
R.08	propil	3-tetrahidropiránil	4-F	3,90 (m,4H), 4,03 (t,2H), 6,70-7,03 (m,4H)	
R.09	etil	4-tetrahidropiránil	4-F	3,83-4,13 (m,6H), 6,70-7,03 (m,4H)	
R.10	propil	4-tetrahidropiránil	4-F	3,83-4,13 (m,6H), 6,70-7,03 (m,4H)	
R.11	etil	3-tetrahidrotiopiránil	4-F	3,90 (t,2H), 4,03 (t,2H), 6,70-7,03 (m,4H)	
R.12	propil	3-tetrahidrotiopiránil	4-F	3,90 (t,2H), 4,03 (t,2H), 6,70-7,03 (m,4H)	
R.13	etil	3-tetrahidropiránil	4-Cl	3,80-4,10 (m,6H), 6,80 (d,2H), 7,20 (d,2H)	
R.14	propil	3-tetrahidropiránil	4-Cl	3,80-4,10 (m,6H), 6,80 (d,2H), 7,20 (d,2H)	
R.15	etil	4-tetrahidropiránil	4-Cl	3,87-4,10 (m,6H), 6,80 (d,2H), 7,20 (d,2H)	
R.16	propil	4-tetrahidropiránil	4-Cl	3,87-4,10 (m,6H), 6,80 (d,2H), 7,20 (d,2H)	
R.17	etil	3-tetrahidrotiopiránil	4-Cl	3,90 (t,2H), 4,07 (t,2H), 6,80 (d,2H), 7,20 (d,2H)	54- 61
R.18	propil	3-tetrahidrotiopiránil	4-Cl	3,90 (t,2H), 4,07 (t,2H), 6,80 (d,2H), 7,20 (d,2H)	

Gyomírtó hatóanyagokat és antidótumként ható vegyületeket együtt vagy egymástól elválasztva vihetünk fel kisarjadás után a kultúrnövények leveleire és hajtásaira. Az antidótumként ható szert előnyösen a herbicid hatóanyaggal egyidejűleg alkalmazzuk. Az elválasztott alkalmazás is lehetséges, amikor is először az antidótumot visszük fel, és a gyomírtó szert csak azután juttatjuk a talajra. A herbicid hatóanyag és az antidótum permetezőszerként szuszpendálható, emulgeálható vagy oldható alakban együtt vagy egymástól elválasztva formázható.

A gyakorlatban jelentőséggel bír még a kultúrnövények magvainak antidótummal való kezelése a vetés előtt. Ekkor a herbicid hatóanyagot a szokásos módon önmagában alkalmazzuk.

A (XI) általános képletű (heteroaril-oxi)- illetve (aril-oxi)-fenoxi-ecetsav-származékokhoz különböző mennyiségű antidótumként ható vegyület szükséges, ha a herbicidet különböző kultúráknál alkalmazzuk. A mennyiségi viszonyok széles határok között variálhatók. A mennyiségek függnek a (heteroaril-oxi)- illetve (aril-oxi)-fenoxi-ecetsav-származékok szerkezetétől és a mindenkori célkultúrától. Az antidótumként ható vegyület : herbicid hatóanyag alkalmas tömeg-részarányai 0,01 : 1 és 10 : 1 között, előnyösen 0,1 : 1 és 4 : 1 között vannak.

A (XII) általános képletű ciklohexenonszármazékokhoz különböző mennyiségű antidótumként ható vegyület szükséges, ha a (XII) általános képletű vegyületet különböző kultúráknál alkalmazzuk. A mennyiségi viszonyok, amelyek között egy (XII) általános képletű ciklohexenonszármazékot és egy (Ia) és (Ib) általános képletű vegyületet alkalmazunk, széles tartományon belül változhat-

nak. Ezek a mennyiségi viszonyok függnnek a (XII) általános képletű ciklohexenonszármazék, valamint az (Ia) és (Ib) általános képletű vegyületek szerkezetétől és a mindenkori kultúrától. Az antidótumként ható vegyület : herbicid hatóanyag megfelelő tömegarányai 0,01 : 1 és 10 : 1 között, előnyösen 0,25 : 1 és 4 : 1 között vannak, mind a közös, mind az egymástól elválasztott alkalmazás esetén.

Az új gyomirtó készítmények az antidótumként használt (Ia) illetve (Ib) általános képletű vegyület és a (XI) illetve (XII) általános képletű (heteroaril-oxi)- illetve (aril-oxi)-fenoxi-ecetsav-származékok csoportjába tartozó herbicid mellett tartalmazhatnak még olyan más kémiai szerkezetű további herbicideket vagy növekedésszabályozó hatóanyagokat is, amelyeknél az antagonisztikus hatás megmarad.

A találmány szerinti készítmények, illetve elválasztott alkalmazás esetén a herbicid hatóanyagok vagy az antidótum közvetlenül permetezhető oldatok, porok, szuszpenziók, nagy százalékarányú vizes, olajos vagy egyéb szuszpenziók, diszperziók, emulziók, olajos diszperziók, kenőcsök, porozószerkek, szórószerkek vagy granulátumok formájában alkalmazhatók permetezéssel, ködképzéssel, porlasztással, beszórással vagy öntözéssel. Az alkalmazási formák teljesen a felhasználás céljához igazodnak.

Közvetlenül permetezhető oldatok, emulziók, kenőcsök és olajdiszperziók előállításához a közepestől a magas forráspontig terjedő ásványolaj-frakciók jönnek számításba, így a kerozin vagy a Diesel-olaj, továbbá szénkátrányolajok, valamint növényi vagy állati eredetű olajok, alifás, ciklusos vagy aromás szénhidrogé-

nek, például benzol, toluol, xilolok, paraffin, tetrahidronaftalin, alkilezett naftalinok vagy azok származékai, így a metanol, etanol, propanol, butanol, kloroform, szén-tetraklorid, ciklohexanol, ciklohexanon, klór-benzol, izoforon, erősen poláros oldószerek, így például az N,N-dimetil-formamid, dimetil-szulfoxid, N-metil-pirrolidon és a víz.

A vizes alkalmazási formák emulziókoncentrátumokból, kenőcsökből vagy nedvesítő porokból (fecskendezhető porokból), olajdiszperziókból víz hozzáadásával készíthetők. Emulziók, kenőcsök vagy olajdiszperziók előállításához a gyomírtó hatóanyagot és/vagy az antidótumot önmagában vagy egy olajban vagy oldószerben oldva, nedvesítő-, tapadást elősegítő-, diszpergáló- vagy emulgeálószer segítségével vízben homogenizálhatjuk. Készíthetünk azonban olyan gyomírtó hatóanyagból és/vagy antidótumból, nedvesítő-, tapadást elősegítő-, diszpergáló- vagy emulgeálószerből és esetleg oldószerből vagy valamilyen olajból álló koncentrátumokat, amelyek alkalmasak a vízzel történő hígításra.

Felületaktív anyagokként a ligninszulfonsav, naftalinszulfonsav, hidroxibenzolszulfonsav, alkil-aril-szulfonátok, alkil-szulfátok, alkil-szulfonátok alkálifém-, alkáliföldfém és ammóniumsói, a dibutil-naftalin-szulfonsav, laurilalkohol-szulfát, zsíralkohol-szulfátok alkálifém- és alkáliföldfém-sói, zsírsavas alkálifém- és alkáliföldfém-sók, szulfatált hexadekanolok, heptadekanolok, oktadekanolok sói, szulfatált zsíralkohol-glikoléterek sói, szulfonált naftalin és naftanil-származékoknak formaldehiddel képezett kondenzációs termékei, a naftalin illetve naftalinszulfonsavak fenollal és formaldehiddel képezett kon-

denzációs termékei, polioxi-etilén-oktil-fenol-éter, etoxilezett izooktil-fenol, oktil-fenol, nonil-fenol, alkil-fenol-poliglikol-éter, tributil-fenil-pokliglikol-éter, alkil-aril-poliéter-alkoholok, izotridecil-alkohol, zsíralkohol-etilén-oxid-kondenzátumok, etoxilezett ricinusolaj, polioxi-etilén-alkil-éter, etoxilezett polioxi-propilén, dodecil-alkohol-poliglikol-éter-acetál, szorbit-észter, lignin-szulfít-szennylúg és metil-cellulóz jönnek számításba.

Porok, beszórószeres és porozószeres gyomirtó hatóanyagok és/vagy antidótumnak szilárd hordozóanyaggal való keverésével vagy együttes őrlésével állíthatók elő.

Granulátumok, például burkolattal ellátott, impregnált vagy homogén granulátumok a hatóanyagoknak szilárd hordozóanyagokhoz való kötésével állíthatók elő. Szilárd hordozóanyagok lehetnek például ásványi földek, így szilikagél, kovasavak, kovagélek, szilikátok, talkum, kaolin, attapulgit, mészkő, kréta, bolusz, lösz, agyag, dolomit, diatomaföld, kalcium- és magnézium-szulfát, magnézium-oxid, őrölt műanyagok, műtrágyák, így például ammónium-szulfát, ammónium-foszfát, ammónium-nitrát, karbamid-származékok és növényi termékek, így gabonaliszt-féleségek, fakéregliszt, faliszt, dióhéjliszt, cellulózpor és más szilárd hordozóanyagok.

A készítmények 0,01 tömeg % és 95 tömeg % közötti, előnyösen 0,5 tömeg % és 90 tömeg % közötti mennyiségben tartalmazznak herbicid hatóanyagot és antidótumot. Általában 0,2 kg/hektár és 5 kg/hektár mennyiségű herbicid hatóanyagot alkalmazunk.

A találmány szerinti vegyületek előállítását a következőkben leírt példák világítják meg közelebbről.

1. példa:

5-Etil-1,3,6-trimetil-pirido[2,3-d]pirimidin-2,4(1H,3H)-dion
 11,6 g (75 mmol) 6-amino-1,3-dimetil-pirimidin-2,4(1H,3H)-
 -diont szobahőmérsékleten, nitrogénatmoszférában oldunk 100 ml
 vízmentes N,N-dimetil-formamidban. Ezután 15 perc alatt 13,2 g
 (100 mmol) 3-klór-2-pentén-2-karbaldehidet csepegtetünk hozzá,
 majd a reakcióelegyet 30 perc alatt 95°C-ra felmelegítjük, és 6
 órán keresztül ezen a hőmérsékleten tartjuk. Ezután az elegyet
 lehűtjük szobahőmérsékletre, és a terméket szűréssel elválaszt-
 juk a reakcióelegyből. Szárítás után 15,6 g sárga kristályos ter-
 méket kapunk (1.006 számú hatóanyag-példa a 16. táblázatban).

Kitermelés 67 %.

Hasonló módon állítjuk elő a 16. táblázatban feltüntetett
 termékeket.

16. táblázat

Olyan (Ia) általános képletű vegyületek, amelyek képletében R^1 és R^2
 jelentése metilcsoport.

Példa száma	R^3	R^4	Olvadáspont
1.001	fenil	H	145°C
1.002	3-NO ₂ -C ₆ H ₄	H	244-248°C
1.003	4-Cl-C ₆ H ₄	H	165°C
1.004	metil	metil	154-156°C
1.005	metil	etil	90°C
1.006	etil	metil	120-123°C
1.007	fenil	metil	172°C
1.008		-(CH ₂) ₃ -	134°C
1.009		-(CH ₂) ₄ -	148-150°C
1.010		-(CH ₂) ₅ -	145°C
1.011		-(CH ₂) ₆ -	165°C

2. példa:

1,3-Dimetil-7-(3-nitro-fenil)-pirido[2,3-d]pirimidin-2,4-(1H,3H)-dion

6,2 g (40 mmol) 6-amino-1,3-dimetil-piridin-2,4(1H,3H)-dion és 11,6 g (45 mmol) 3-nitro- β -(dimetil-amino)-propiofenon-hidroklorid elegyét 100 ml tömény ecetsavban visszafolyatós hűtő alkalmazásával 3 órán keresztül forraljuk. 2 ml tömény sósavoldat hozzáadása után ugyanezen a hőmérsékleten tovább keverjük a szuszpenziót, amíg az színtelenné nem válik. A reakcióelegy lehűtése és szűrése után 8,9 g kristályos terméket kapunk (2.001 számú hatóanyag-példa a 17. táblázatban).

Kitermelés 78 %.

Hasonló módon állítjuk elő a 17. táblázatban feltüntetett vegyületeket.

17. táblázat

(Ib) általános képletű vegyületek

Példa száma	R ¹	R ²	R ⁵	R ⁶	Olvadáspont
2.001	metil	metil	H	3-nitro-fenil	261°C
2.002	metil	metil	H	sztiril	100-110°C
2.003	metil	metil	H	2-tienil	186-188°C
2.004	metil	metil	H	3-indolil	210-215°C
2.005	metil	metil	Metil	4-klór-fenil	235-244°C
2.006	etil	H	H	4-nitro-fenil	> 250°C

3. példa:

1,3-Dimetil-6-(metoxi-karbonil)-7-[(metoxi-karbonil)-metil]-
-pirido[2,3-d]pirimidin-2,4(1H,3H)-dion

4,85 g (20 mmol) 5-[(dimetil-amino)-metilén]-piridin és 3,48 g (20 mmol) acetondikarbonsav-dimetil-észter 100 ml vízmentes etanollal készített szuszpenziójához 0°C-on 20 perc alatt 2,4 g (24 mmol) trietil-amint csepegtetünk, és azután szobahőmérsékleten 2 órán keresztül keverjük. Ezután lehűtjük az elegyet -15°C-ra, a csapadékot leszűrjük és vákuumban megszárítjuk. Így 3,81 g terméket kapunk (3.008 számú hatóanyag-példa a 18. táblázatban).

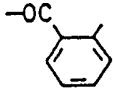
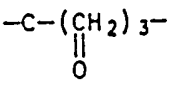
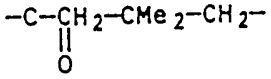
Kitermelés 59 %.

Hasonló módon állítjuk elő a 18. táblázatban feltüntetett vegyületeket.

*A táblázatban Me = metil, Et = etil, Ph = fenil.

18. táblázat

(Ib) általános képletű vegyületek

Példaszám	R1	R2	R5	R6	Olvadáspont
3.001	Me	Me	CONH ₂	NH ₂	>250°C
3.002	Me	Me	CONH ₂	Me	>250°C
3.003	Me	Me	CONHPh	Ph	>250°C
3.004	Me	Me	CO ₂ Et	CH ₂ Cl	89- 90°C
3.005	Me	Me	CO ₂ Et	Ph	155-157°C
3.006	Me	Me	CO ₂ Et	CO ₂ Et	>250°C
3.007	Me	Me	CO ₂ Me	NH ₂	>250°C
3.008	Me	Me	CO ₂ Me	CH ₂ CO ₂ Me	164-166°C
3.009	Me	Me	CO ₂ H	Me	>250°C
3.010	Me	Me	CO ₂ H	OH	263-266°C
3.011	Me	Me	CO ₂ H	CH ₂ CO ₂ H	>250°C
3.012	Me	Me	CO ₂ H	Ph	217-219°C
3.013	Me	Me	COMe	Me	153°C
3.014	Me	Me	COPh	Ph	>250°C
3.015	Me	Me	COCO ₂ Et	Me	>250°C
3.016	Me	Me	COCO ₂ Et	Ph	>250°C
3.017	Me	Me			>250°C
3.018	Me	Me			>250°C
3.019	Me	Me			181-192°C
3.020	Et	H	COMe	Me	>250°C
3.021	Et	H	CO ₂ Et	Me	250°C
3.022	Et	H	CO ₂ Et	NH ₂	>250°C
3.023	Et	H	CO ₂ Et	OH	>250°C
3.024	Et	H	CO ₂ NH ₂	Me	215°C
3.025	Et	H	CO ₂ H	NH ₂	>250°C
3.026	ciklopropil	Et	COMe	Me	>250°C
3.027	ciklopropil	Et	CO ₂ Et	Me	240°C
3.028	ciklopropil	Et	CN	NH ₂	>250°C
3.029	ciklopropil	Et	CONH ₂	Me	83°C
3.030	ciklopropil	Et	CO ₂ Et	NH ₂	>250°C
3.031	ciklopropil	Et	CONH ₂	NH ₂	>250°C
3.032	ciklopropil	Et	CO ₂ Me	OH	148-150°C

4. példa

1,3-Dimetil-6-(etoxi-karbonil)-7-(propionil-amino)-pirido-
-[2,3-d]pirimidin-2,4(1H,3H)-dion

5,60 g (20 mmol) 7-amino-1,3-dimetil-2,4(1H,3H)-dioxo-piri-
do[2,3-d]pirimidin-6-karbonsav-etil-észter, 2,86 g (22 mmol)
propionsavanhidrid és 30 ml propionsav elegyét visszafolyató hű-
tő alkalmazásával 24 órán át forraljuk. Lehűtés és szűrés után
5,47 g terméket kapunk (4.002 számú hatóanyag a 19. táblázatban).

Kitermelés 82 %.

Hasonló módon állítjuk elő a 19. táblázatban feltüntetett
vegyületeket.

19. táblázat

Olyan (Ib) általános képletű vegyületek, amelyek képletében R^1
és R^2 jelentése metilcsoport, R^5 jelentése etoxi-karbonilcsoport.

Példa száma	R^6	Olvadáspont
4.001	-NHCOMe	148°C
4.002	-NHCOEt	131-134°C
4.003	tozil-amino	<250°C
4.004	-OCHMe ₂	112°C

A 20. táblázatban a szakirodalomból ismert vagy az irodalomból ismert eljárásokhoz hasonló módon előállított (Ia) és (Ib) általános képletű vegyületek láthatók, amelyek szintén képesek a (XI) és (XII) általános képletű herbicid hatóanyagoknak a kultúrnövények általi elviselhetőségét növelni. Az (Ia) és (Ib) általános képletekben R^1 és R^2 metilcsoportokat jelentenek a 20. táblázatban felsorolt vegyületekben.

20. táblázat

Példa száma	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	Irodalom
5.001	OH	CO ₂ Et	-	-	1
5.002	NH ₂	CN	-	-	*
5.003	OH	H	-	-	*
5.004	-	-	H	Ph	2
5.005	-	-	H	4-Me-C ₆ H ₄	2
5.006	-	-	Me	Ph	2
5.007	-	-		-CH ₂ -(o-C ₆ H ₄)	2
5.008	-	-		-(CH ₂) ₂ -(o-C ₆ H ₄)	2
5.009	-	-		-(CH ₂) ₃ -(o-C ₆ H ₄)	2
5.010	-	-	CN	NH ₂	3
5.011	-	-	CO ₂ Et	NH ₂	3
5.012	-	-	CO ₂ Et	OH	3
5.013	-	-	CO ₂ Et	Me	3
5.014	-	-	CO ₂ H	NH ₂	3
5.015	-	-	$\begin{array}{ccccccc} - & \text{C} & - & \text{N} & - & \text{C} & - & \text{N} & - \\ & & & & & & & & \\ & \text{O} & & \text{Me} & & \text{O} & & \text{Me} & \end{array}$		3
5.016	-	-	$\begin{array}{ccccccc} - & \text{C} & - & \text{NH} & - & \text{C} & - & \text{NH} & - \\ & & & & & & & & \\ & \text{O} & & & & \text{S} & & & \end{array}$		3

1) G.L. Anderson, J. Heterocycl. Chem., 22, 1469 (1985).

2) R. Troschütz, H.J. Roth, Arch. Pharm., 311, 406 (1978).

3) K. Hirota, Y. Kitade, S. Senda, J. Heterocycl. Chem., 22, 345 (1985).

*) Az 1)-hez hasonló módon előállítva.

A herbicidből és antidótumként ható vegyületből álló, találmány szerinti gyomirtó szerek, illetve kombinációk különböző képviselőinek befolyását a kívánatos és nemkívánatos növények növekedésére, összehasonlítva a herbicid hatóanyag önmagában kifejtett hatásával, üvegházi kísérletek segítségével a következő biológiai példák kapcsán bizonyíthatjuk:

A kísérleti növények termesztésére 300 m³ űrtartalmú, agyagos homokkal és szubsztrátumként körülbelül 3,0 % humusszal töltött műanyag virágcserepek szolgálnak. A kísérleti növények magjait fejták szerint szétválasztva sekély mélységben vetjük és megöntözzük. Ezután átlátszó műanyag fedéllel fedjük az edényeket, amíg a magvak egyenletesen kicsíráznak és a növények kifejlődnek.

A kikelés utáni kezelés céljából a kísérleti növényeket a növekedési forma szerint először 3-20 cm növekedési magasságig termesztjük és csak azután kezeljük. A gyomirtó szert diszperziós közegként vízben szuszpendáljuk vagy emulgeáljuk, és finoman elosztó szórófejekkel permetezzük.

Herbicid példaként a 2.15 és az 5.34 számú (XII) általános képletű ciklohexenonszármazékokat használjuk.

Ezeket a herbicid hatóanyagokat mindenkor kereskedelmi formázott termékek (100 g/ 1 liter koncentrált emulzió) alakjában adjuk a mindenkori antidótum-vegyülethez, így ezzel együtt alkalmazzuk.

Összehasonlító kísérletek céljaira a 2.15 és 5.34 számú hatóanyagot mindenkor 80 térfogat % ciklohexanonból és 20 % etoxilezett ricinusolajból (Castor olajból) álló keverékkel alkalmaz-

zuk (antidótum nélküli üres formázás).

A kikelés utáni kezelés céljára valamennyi antidótumként ható vegyületet 80 térfogat % ciklohexanonból és 20 térfogat % etoxilezett ricinusolajból álló keverékkel, 10 tömeg % hatóanyagot tartalmazó mennyiségben alkalmazzuk.

A következő kísérleti növényeket használjuk:

Rövidítés	Latin név	Magyar név
LOLMU	<i>Lolium multiflorum</i>	szálkás perje
SETVI	<i>Setaria viridis</i>	zöldmuhar
TRZAW	<i>Triticum aestivum</i>	őszai búza
ZEAMX	<i>Zea mays</i>	kukorica

A kísérleti edényeket üvegházban helyezzük el, ahol a hőkedvelő fajtákat 18°C és 30°C közötti, a mérsékeltebb klímát kedvelőket 10°C és 25°C közötti hőmérsékleten tartjuk.

A gyomírtó szereket hordozó és diszperziós közegként vízben szuszpendáljuk, és finoman elosztó porlasztókkal felszerelt mozgó öntözőkabin segítségével visszük bőségesen a növényekre.

A kísérleti időszak 3-5 hétig tart. Ezen idő alatt a növényeket gondozzuk, és regisztráljuk reakcióikat az egyes kezelésekre.

0-tól 100 %-ig terjedő skálán értékeljük a vegyszerek hatására bekövetkező károsodásokat összehasonlítva a kezeletlen kontrollnövényekkel. Ennél 0 azt jelenti, hogy semmi károsodás nem

következett be, és 100 a növények teljes pusztulását jelenti.

A 21-26. táblázatok adatai dokumentálják a találmány szerinti (Ia) és (Ib) általános képletű pirido[2,3-d]pirimidin-2,4-(1H,3H)-dion-származékok antidótum-hatását.

Ennél az antidótum példavegyületek egyértelműen javítják a 2.15 és 5.34 számú herbicidnek a pázsitfűfélék családjába tartozó kultúrnövények általi elviselhetőségét.

21. táblázat

A 2.15 számú herbicid (szetoxidim; Sethoxidim) kukorica és búza általi elviselhetőségének javítása egy antidótum példavegyületnek hozzákeverésével, kikelés utáni alkalmazás esetén üvegházi kísérletben.

Az antidótum száma	Felhasznált mennyiség [kg hatóanyag/hektár]			Kísérleti növények és károsodásuk [%]	
	Herbicide	Antidótum	Kukorica őszi búza	Kultúr- növény	Nemkívánatos növény
					Lolium multiflorum
-	0,015		80	-	98
3.001	0,015	0,06	15	-	98
-	0,06		-	40	100
1.004	0,06	0,25	-	0	100

22. táblázat

Az 5.34 számú herbicid kukorica és búza általi elviselhetőségének javítása egy antidótum példavegyületnek hozzákeverésével kikelés utáni alkalmazás esetén üvegházi kísérletben.

Az antidótum száma	Felhasznált mennyiség [kg hatóanyag/hektár]		Kísérleti növények és károsodásuk [%]		
	Herbicid	Antidótum	Kultúr- növény	Nemkívánatos növény	
			Kukorica Őszi búza	Lolium multiflorum	
-	0,25	-	85	80	100
1.006	0,25	0,75	15	20	90

23. táblázat

Az 5.34 számú herbicid kukorica általi elviselhetőségének javítása egy antidótum példavegyületnek hozzákeverésével kikelés utáni alkalmazás esetén üvegházi kísérletben.

Az antidótum száma	Felhasznált mennyiség [kg hatóanyag/hektár]		Kísérleti növények és károsodásuk [%]	
	Herbicid	Antidótum	Kultúr- növény	Nemkívánatos növény
			Kukorica	Setaria viridis
-	0,125	-	75	100
0,001	0,125	0,375	30	100

24. táblázat

Az 5.34 számú herbicid kukorica általi elviselhetőségének javítása egy antidótumként hatásos pirido[2,3-d]pirimidin-származék hozzákeverésével; kikelés utáni alkalmazás üvegházi kísérletben.

Az antidótum száma	Felhasznált mennyiség [kg hatóanyag/hektár]		Kísérleti növények és károsodásuk [%]	
	Herbicide	Antidótum	Kultúr- növény	Nemkívánatos növény
			Kukorica "Lixis" fajta	Setaria viridis
-	0,25	-	100	100
3.008	0,25	0,25	30	100
3.005	0,25	0,25	20	100
3.004	0,25	0,25	30	100
3.006	0,25	0,25	0	100
1.007	0,25	0,25	20	95
1.006	0,25	0,25	30	100
1.010	0,25	0,25	10	95
-	0,125	-	85	100
5.011	0,125	0,125	50	100
5.013	0,125	0,125	30	100
3.001	0,125	0,125	15	100
3.008	0,125	0,125	20	98
3.005	0,125	0,125	10	100
3.004	0,125	0,125	20	95
3.006	0,125	0,125	0	98
1.007	0,125	0,125	10	90
1.006	0,125	0,125	15	85
1.008	0,125	0,125	10	90
3.016	0,125	0,125	30	90
1.010	0,125	0,125	0	90

25. táblázat

Az 5.34 számú herbicid kukorica és búza általi elviselhetőségének javítása egy antidótumként hatásos pirido[2,3-d]pirimidin-származék hozzákeverésével; kikelés utáni alkalmazás üvegházi kísérletben.

Az antidótum száma	Felhasznált mennyiség [kg hatóanyag/hektár]		Kísérleti növények és károsodásuk [%]		
	Herbicide	Antidótum	Kultúr- növény		Nemkívánatos növény
			Tavaszi		Setaria viridis
			Kukorica "Lexis" fajta	búza "Sztár" fajta	
-	0,06	-	60	90	100
5.011	0,06	0,06	20	-	100
3.013	0,06	0,06	0	-	75
3.001	0,06	0,06	0	-	90
3.009	0,06	0,06	20	-	85
3.008	0,06	0,06	20	-	80
3.005	0,06	0,06	0	-	80
3.004	0,06	0,06	0	65	85
3.006	0,06	0,06	0	10	90
1.007	0,06	0,06	10	20	80
1.009	0,06	0,06	10	65	90
3.016	0,06	0,06	10	50	95

26. táblázat

Az 5.34 számú herbicid búza általi elviselhetőségének javítása egy antidótumként hatásos pirido[2,3-d]pirimidin-származék hozzákeverésével; kikelés utáni alkalmazás üvegházi kísérletben.

Az antidótum száma	Felhasznált mennyiség [kg hatóanyag/hektár]		Kísérleti növények és károsodásuk [%]	
	Herbicid	Antidótum	Kultúr- növény	Nemkívánatos növény
			Tavaszi búza "Sztár fajta"	Setaria viridis
-	0,03	-	85	75
0.008	0,03	0,03	10	60
3.005	0,03	0,03	10	45
3.004	0,03	0,03	40	75
3.006	0,03	0,03	0	40

S Z A B A D A L M I I G É N Y P O N T O K

1. Az (Ia) és (Ib) általános képletű —

a képletben

R^1 és R^2 jelentése hidrogénatom, 1-4 szénatomos alkilcsoport, halogénezett 1-4 szénatomos alkilcsoport, vagy 3-7 szénatomos cikloalkilcsoport;

R^3 jelentése hidrogénatom, 1-4 szénatomos alkilcsoport, amino-, hidrox-, merkaptocsoport, 1-4 szénatomos alkil-tio-csoport, 6 vagy 10 szénatomos arilcsoport, amely az R^{11} -nél megadottak közül 1-3 csoporttal lehet szubsztituálva;

R^4 jelentése hidrogénatom, 1-4 szénatomos alkil-, 1-4 szénatomos alkoxi-karbonil-, 1-4 szénatomos (alkil-tio)-karbonil-, 1-4 szénatomos alkoxi-tiokarbonil-, 1-4 szénatomos (alkil-tio)-tiokarbonil-csoport, ciano- vagy karbamoilcsoport; vagy

R^3 és R^4 együttesen 3-6 szénatomos alkilén-, 3-6 szénatomos alkenilén- vagy 1,2-feniléncsoportot képez;

R^5 jelentése hidrogénatom, 1-4 szénatomos alkilcsoport, ciano-csoport, a $-C(O)R^7$ vagy $-C(S)R^7$ általános képletű csoport;

R^6 jelentése 1-4 szénatomos alkil-, (6 szénatomos aril)-(2-4 szénatomos alkenil)-csoport, 6, 10 vagy 14 szénatomos aril-csoport, ahol az arilcsoportok szubsztituálva lehetnek az R^{11} -nél megadottak közül 1-3 csoporttal, $-CH_2R^8$ általános képletű csoport, 1-4 szénatomos alkoxi-karbonil-, 1-4 szénatomos (alkil-tio)-karbonil-, 1-4 szénatomos alkoxi-tiokarbonil-, 1-4 szénatomos (alkil-tio)-tiokarbonil-csoport-,

hidroxi-, merkaptocsoport, 1-4 szénatomos alkoxi-, 1-4 szénatomos alkil-tio-csoport, amino-, 1-4 szénatomos alkil-amino-csoport, egy -NHCXR^9 és $\text{-NHSO}_2\text{R}^{10}$ általános képletű csoport, 2-tienil-, 3-tienil-, 2-piridil-, 3-piridil-, 4-piridil-, 2-indolil-, 3-indolilcsoport, ahol a heteroarilcsoportok szubsztituálva lehetnek az R^{11} -nél megadottak közül egy vagy két csoporttal; vagy

R^5 és R^6 együttesen 3-6 szénatomos alkilén-, 3-5 szénatomos alkenilén- vagy 1,2-feniléncsoportot képez, amelyek szubsztituálva lehetnek 1-4 szénatomos alkil-, halogénezett 1-4 szénatomos alkil- vagy 3-7 szénatomos cikloalkilcsoporttal, vagy karbonil- vagy tiokarbonil-csoportot is tartalmazhatnak;

R^7 jelentése hidrogénatom, 1-4 szénatomos alkil-, hidroxi-, merkaptocsoport, 1-4 szénatomos alkoxi-, 1-4 szénatomos alkil-tio-, 1-4 szénatomos alkoxi-karbonil-, 1-4 szénatomos (alkil-tio)-karbonil-, 1-4 szénatomos alkoxi-tiokarbonil-, 1-4 szénatomos (alkil-tio)-tiokarbonil-csoport, amino-, 1-4 szénatomos alkil-amino-csoport, di(1-4 szénatomos alkil)-amino-csoport, 6 vagy 10 szénatomos arilcsoport, vagy (6 vagy 10 szénatomos aril)-amino-csoport, ahol az arilcsoportok még szubsztituálva lehetnek az R^{11} -nél megadott 1-3 csoporttal;

R^8 jelentése halogénatom, hidroxi-, merkaptocsoport, 1-4 szénatomos alkoxi-, 1-4 szénatomos alkil-tio-, 1-4 szénatomos alkoxi-karbonil-, 1-4 szénatomos (alkil-tio)-karbonil-, 1-4 szénatomos alkoxi-tiokarbonil-, 1-4 szénatomos (alkil-tio)-

- tiokarbonil-csoport, vagy (a) általános képletű csoport;
- R^9 jelentése 1-5 szénatomos alkil-, halogénezett 1-4 szénatomos alkilcsoport, egy $-NR^1R^2$ vagy $-OR^1$ általános képletű csoport;
- R^{10} jelentése 1-4 szénatomos alkil-, 6 vagy 10 szénatomos arilcsoport, amely szubsztituálva lehet az R^{11} -nél megadottak közül 1-3 csoporttal;
- R^{11} jelentése halogénatom, hidroxil-, merkaptó-, 1-4 szénatomos alkoxi-, 1-4 szénatomos alkil-tio-csoport, 1-4 szénatomos alkil-, nitro- vagy aminocsoport;
- X jelentése oxigénatom vagy kénatom;
- azzal a feltétellel, hogy
- R^1 és R^2 hidrogénatomtól, metil- vagy etilcsoporttól eltérő jelentésű,
 - R^3 és R^4 jelentése nem lehet egyidejűleg hidrogénatom;
 - R^5 és R^6 ha R^1 butilcsoportot jelent, akkor R^2 , R^5 és R^6 nem jelenthet mind egyidejűleg metilcsoportot,
 - ha R^1 metilcsoportot, R^2 izobutilcsoportot és R^3 aminocsoportot jelent, akkor R^4 hidrogénatomtól eltérő jelentésű;
 - ha R^1 metilcsoportot, R^2 hidrogénatomot és R^5 fenilcsoportot jelent, akkor R^6 hidroxicsoporthoz eltérő jelentésű;
 - ha R^1 metilcsoportot, R^2 hidrogénatomot és R^6 aminocsoportot jelent, akkor R^5 karboxi- vagy etoxi-karbonil-csoporttól eltérő jelentésű;
 - ha R^1 hidrogénatomot, R^2 metilcsoportot és R^5 hidrogénatomot jelent, akkor R^6 hidroxicsoporthoz eltérő jelentésű;

- h) ha R^1 hidrogénatomot, R^2 metilcsoportot és R^4 etoxi-karbonil-csoportot jelent, akkor R^6 metil- vagy aminocsoporttól eltérő jelentésű;
- i) ha R^5 cianocsoportot, R^6 hidroxicssoportot és R^1 butilcsoportot jelent, akkor R^2 hidrogénatomtól eltérő jelentésű,
- j) ha R^5 cianocsoportot, R^6 hidroxicssoportot és R^1 propilcsoportot jelent, akkor R^2 propilcsoporttól eltérő jelentésű —

pirido[2,3-d]pirimidin-2,4(1H,3H)-dion-származékok, valamint ezeknek az (Ia) és (Ib) általános képletű vegyületeknek a mezőgazdaságban felhasználható olyan sói, amelyek egy bázisos nitrogén-szubsztituenst vagy egy savas hidroxiszubsztituenst tartalmaznak.

2. Eljárás az 1. igénypont szerinti (Ia) általános képletű vegyületek előállítására, azzal jellemezve, hogy egy (II) általános képletű 6-amino-pirimidin-2,4(1H,3H)-dion-származékot egy (III) általános képletű —

a képletben

$R^{3'}$ jelentése hidrogénatom, 1-4 szénatomos alkilcsoport, 6 vagy 10 szénatomos arilcsoport, amely szubsztituálva lehet az R^{11} -nél megadottak közül 1-3 csoporttal —

β -klór-alkenál-származékkal reagáltatunk; vagy

egy (II) általános képletű vegyületet egy (IV) általános képletű —

a képletben

R^{12} jelentése 2-5 szénatomos alkoxi-karbonil-, 2-5 szénatomos

alkoxi-tiokarbonil-csoport vagy cianocsoport, és R^{13} jelentése 2-5 szénatomos alkilcsoport —
 β -alkoxi-akrilsav-származékkal önmagában ismert módon reagáltatva egy (V) általános képletű intermedierré alakítunk át, és ezt magasabb hőmérsékleten tovább átalakítjuk egy (Ia) általános képletű vegyületté.

3. Eljárás az 1. igénypont szerinti (Ib) általános képletű vegyületek előállítására, azzal jellemezve, hogy egy (II) általános képletű vegyületet önmagában ismert módon egy (VI) általános képletű —

a képletben

$R^{5'}$ jelentése hidrogénatom vagy 1-4 szénatomos alkilcsoport,

R^{14} jelentése 1-4 szénatomos alkilcsoport —

β -dialkil-amino-ke-ton-származékkal reagáltatunk; vagy egy (VIIa) vagy (VIIb) általános képletű pirimidinszármazékot önmagában ismert módon egy (VIIIa), (VIIIb) vagy (VIIIc) általános képletű —

a képletben

$R^{5''}$ jelentése cianocsoport, egy $-C(O)R^7$ vagy $-C(S)R^7$ általános képletű csoport;

R^{15} jelentése 1-4 szénatomos alkilcsoport;

$R^{6'}$ jelentése 1-4 szénatomos alkilcsoport; (6 szénatomos aril)-(2-4 szénatomos alkenil)-csoport; 6, 10 vagy 14 szénatomos arilcsoport, ahol az arilcsoportok 1-3 -szorosan szubsztituálva lehetnek az R^{11} -nél megadott csoportokkal vagy egy $-CH_2R^8$ általános képletű csoporttal —

malonsavszármazékkal reagáltatunk; vagy

egy olyan (Ib) általános képletű vegyületet, amelyben R^6 jelentése hidroxicsoport, önmagában ismert módon egy (IX) általános képletű vegyülettel, amelyben

R^{16} jelentése 1-4 szénatomos alkilcsoport, és

Nu jelentése nukleofug kilépőcsoport,

reagáltatunk; vagy

egy olyan (Ib) általános képletű vegyületet, amelyben R^6 jelentése aminocsoport, önmagában ismert módon egy (Xa) vagy (Xb) általános képletű vegyülettel reagáltatunk.

4. Gyomirtó szer, azzal jellemezve, hogy tartalmaz legalább egy (Ia) vagy (Ib) általános képletű pirido[2,3-d]-pirimidin-2,4(1H,3H)-dion-származékot, amelyben az R^1 , R^2 , R^3 , R^4 , R^5 és R^6 szubsztituensek jelentése azonos az 1. igénypontban megadottakkal, és nem esnek az a)-tól j)-ig felsorolt megszorítások alá: és legalább egy, az alábbiakban felsorolt herbicid hatóanyagot:
a) (XI) általános képletű 2-(4-heteroaril-oxi)- vagy 2-(4-aril-oxi)-fenoxi-ecetsav-származékok, amelyekben a szubsztituensek jelentése a következő:

R^a jelentése fenil-, piridil-, benzoxazolil-, benztiazolil- vagy benzpirazinilcsoport, ahol ezek az aromás gyűrűrendszerek egy vagy kétszeresen szubsztituálva lehetnek a következő csoportok valamelyikével: halogénatom, nitrocsoport, 1-4 szénatomos alkil-, halogénezett 1-4 szénatomos alkil-, halogénezett 1-4 szénatomos alkoxicsoport; és/vagy nitrocsoport; és

R^b jelentése hidrogénatom, 1-4 szénatomos alkilcsoport, vagy

egy, a növények által elviselhető kation-ekvivalens; és

R^C jelentése hidrogénatom vagy metilcsoport; vagy

b) (XII) általános képletű ciklohexenonszármazékok, amelyekben a szubsztituensek jelentése a következő:

R^d jelentése 1-6 szénatomos alkilcsoport;

A jelentése 4 szénatomos alkilén- vagy 4 szénatomos alkenilén-lánc, ahol ezek a láncok 1-3 -szorosan szubsztituálva lehetnek 1-3 szénatomos alkilcsoporttal és/vagy halogénatommal, vagy kívánt esetben 1-3 szénatomos alkilcsoporttal szubsztituált olyan 3-6 -tagú alkilénláncal, amely gyűrűtagként tartalmaz egy, az oximéter-résszel nem közvetlenül szomszédos oxigén- vagy kénatomot;

B jelentése nitro-, cianocsoport, halogénatom, 1-4 szénatomos alkil-, 1-4 szénatomos alkoxi-, 1-4 szénatomos alkil-tio-csoport, halogénezett 1-4 szénatomos alkil-, halogénezett 1-4 szénatomos alkoxicssoport, karboxi-, 1-4 szénatomos alkoxi-karbonil-, benzil-oxi-karbonil-csoport és/vagy fenil-csoport, ahol az aromás csoportok 1-3 -szorosan szubsztituálva lehetnek a következő csoportok valamelyikével: nitro-, cianocsoport, halogénatom, 1-4 szénatomos alkil-, 1-4 szénatomos alkoxi-, 1-4 szénatomos alkil-tio-csoport, halogénezett 1-4 szénatomos alkil-, halogénezett 1-4 szénatomos alkoxicssoport, karboxi-, 1-4 szénatomos alkoxi-karbonil- és/vagy benzil-oxi-karbonil-csoport;

n értéke 0 és 3 közötti szám, vagy 0 és 5 közötti szám abban az esetben, ha B halogénatomot jelent;

R^e jelentése (1-4 szénatomos alkoxi)-(1-6 szénatomos alkil)-

vagy (1-4 szénatomos alkil-tio)-(1-6 szénatomos alkil)-csoport; 3-7 szénatomos cikloalkil- vagy 5-7 szénatomos cikloalkenilcsoport, ahol ezek a csoportok 1-3-szorosan szubsztituálva lehetnek a következő csoportok valamelyikével: 1-4 szénatomos alkil-, 1-4 szénatomos alkoxi-, 1-4 szénatomos alkil-tio-, halogénezett 1-4 szénatomos alkilcsoport, hidroxicsoport és/vagy halogénatom;

5-tagú telített heterociklusos, amely heteroatomként egy vagy két oxigén- és/vagy kénatomot tartalmaz, és amely háromig terjedő számban szubsztituálva lehet a következő csoportok valamelyikével: 1-4 szénatomos alkil-, 1-4 szénatomos alkoxi, 1-4 szénatomos alkil-tio- és/vagy halogénezett 1-4 szénatomos alkilcsoport; egy vagy két oxigén- és/vagy kénatomot, és egy vagy két kettős kötést tartalmazó 6- vagy 7-tagú heterociklus, ahol ez a gyűrű 1-3-szorosan szubsztituálva lehet a következő csoportok valamelyikével: hidroxicsoport, halogénatom, 1-4 szénatomos alkil-, 1-4 szénatomos alkoxi-, 1-4 szénatomos alkil-tio- és/vagy halogénezett 1-4 szénatomos alkilcsoport;

egy vagy két nitrogénatomot és egy oxigén- vagy kénatomot tartalmazó 5-tagú heteroaromás rendszer, ahol ez a gyűrű 1-3 -szorosan szubsztituálva lehet a következő csoportok valamelyikével: halogénatom, cianocsoport, 1-4 szénatomos alkil-, 1-4 szénatomos alkoxi-, 1-4 szénatomos alkil-tio-, halogénezett 1-4 szénatomos alkilcsoport, 2-6 szénatomos alkenil-, 2-6 szénatomos alkenil-oxi-, halogénezett 2-6 szénatomos alkenilcsoport és/vagy (1-4 szénatomos alkoxi)-

-(1-4 szénatomos alkil)-csoport;
 fenilcsoport vagy piridilcsoport, ahol ezek a csoportok 1-3
 -szorosan szubsztituálva lehetnek a következő csoportok va-
 lamelyikével: halogénatom, nitro-, cianocsoport, 1-4 széna-
 tomomos alkil-, 1-4 szénatomos alkoxi-, 1-4 szénatomos al-
 kil-tio-, halogénezett 1-4 szénatomos alkilcsoport, 3-6
 szénatomos alkenil-oxi-, 3-6 szénatomos alkinil-oxi-csoport
 és/vagy egy $-NR^fR^g$ általános képletű csoport, amelyben
 R^f jelentése hidrogénatom, 1-4 szénatomos alkil-, 3-6 szénato-
 mos alkenil- vagy 3-6 szénatomos alkinilcsoport; és
 R^g jelentése hidrogénatom, 1-4 szénatomos alkil-, 3-6 szénato-
 mos alkenil-, 3-6 szénatomos alkinilcsoport, 1-6 szénatomos
 acilcsoport, vagy benzoilcsoport, ahol az aromás gyűrű 1-3-
 szorosan szubsztituálva lehet a következő csoportok valame-
 lyikével: nitro-, cianocsoport, halogénatom, 1-4 szénatomos
 alkil-, 1-4 szénatomos alkoxi-, 1-4 szénatomos alkil-tio-
 -csoport és/vagy halogénezett 1-4 szénatomos alkilcsoport.

5. A 4. igénypont szerinti gyomírtó szer, azzal jellemezve,
 hogy benne az (Ia) vagy (Ib) általános képletű vegyület tömega-
 ránya az a) vagy b) herbicid hatóanyaghoz 0,01 : 1 és 10 : 1 kö-
 zött van.

6. Eljárás a nemkívánatos növények növekedésének szelektív
 gátlására, azzal jellemezve, hogy egy 4. igénypont szerinti (Ia)
 vagy (Ib) általános képletű vegyületet és egy 4. igénypont sze-
 rintí (XI) általános képletű 2-(4-heteroaril-oxi)- vagy 2-(4-

-aril-oxi)-fenoxi-ecetsav-származékot, vagy egy (XII) általános képletű ciklohexenonszármazékot a kultúrnövények vetése előtt, a vetés alkalmával vagy az után, a kultúrnövények kikéltése előtt vagy folyamán, egyidejűleg vagy egymás után alkalmazunk.

7. Eljárás kultúrnövényeknek a 4. igénypont szerinti (XI) általános képletű 2-(4-heteroaril-oxi)- vagy 2-(4-aril-oxi)-fenoxi-ecetsav-származék herbicidek vagy a (XII) általános képletű ciklohexenonszármazék herbicidek általi károsodásának megátltására, azzal jellemezve, hogy a kultúrnövények vetőmagvait egy 4. igénypont szerinti (Ia) vagy (Ib) általános képletű vegyület antagonisztikus hatásos mennyiségével kezeljük.

8. Eljárás a nemkívánatos növények növekedésének szelektív gátltására, azzal jellemezve, hogy a kultúrnövények és a nemkívánatos növények leveleit a kikéltés utáni kezelés során egy 4. igénypont szerinti (Ia) vagy (Ib) általános képletű vegyülettel és egy (XI) általános képletű 2-(4-heteroaril-oxi)- vagy 2-(4-aril-oxi)-fenoxi-ecetsav-származékkal vagy egy (XII) általános képletű ciklohexenonszármazékkal egyidejűleg vagy egymás után kezeljük.

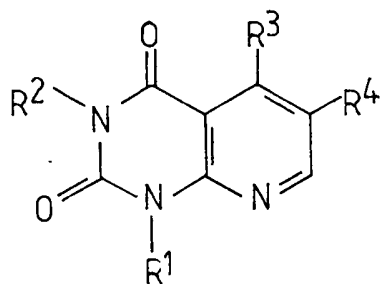
+ 3 rajzlap



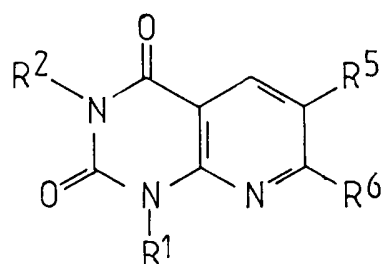
A meghatalmazott:

Beliczay László
szabadalmi ügyvivő
az S.B.G. & K. Budapesti Nemzetközi
Szabadalmi Iroda tagja
H-1061 Budapest, Dózsa u. 10.
Telefon 153 4783, Fax 153 3664

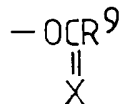
64760



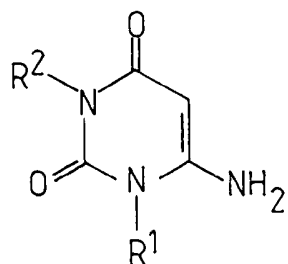
(1a)



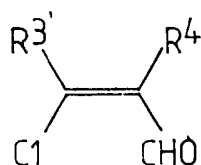
(1b)



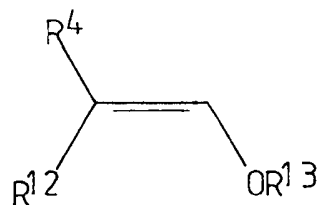
(a)



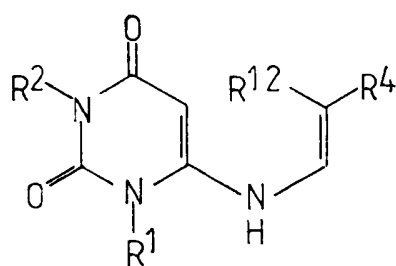
(11)



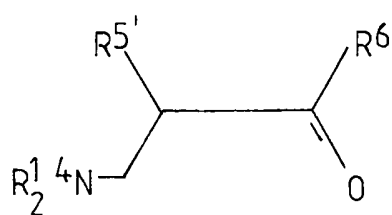
(III)



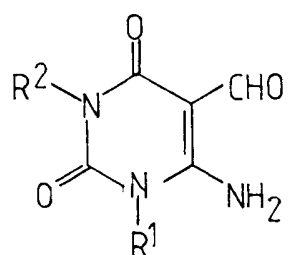
(IV)



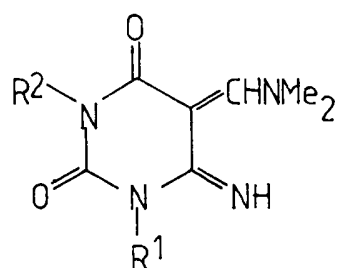
(V)



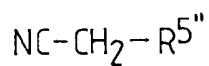
(VI)



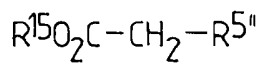
(VIIa)



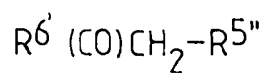
(VIIb)



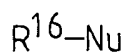
(VIIIa)



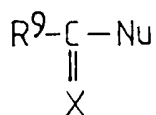
(VIIIb)



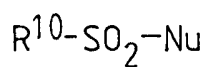
(VIIIc)



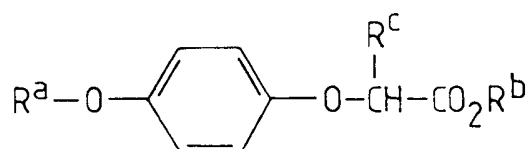
(IX)



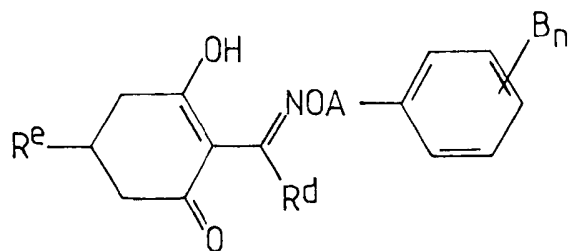
(Xa)



(Xb)



(XI)



(XII)