

HATÓANYAGKÉNT ARIL-AMINO-KARBONIL-VEGYÜLETEKET TARTALMAZÓ  
HERBICID KÉSZÍTMÉNYEK, ~~HA~~ <sup>AMINO-</sup>ARIL-KARBONIL-VEGYÜLETEK, ~~ES~~ EL-  
JÁRÁS EZEK ELŐÁLLÍTÁSÁRA ÉS A KÉSZÍTMÉNYEK ALKALMAZÁSÁRA

Bejelentő: Sandoz A.G. Bázél, Svájc

A bejelentés napja: 1991. 07. 12.

Elsőbbsége: 1990. 07. 27. (9016476) Nagy-Britannia

### Kivonat

A találmány <sup>szerint</sup> ~~az (I) általános képletű vegyületeket ha-~~  
~~tóanyagként tartalmazó herbicid készítmények és a ható-~~  
~~anyagok előállítására vonatkozik. Az (I) képletben~~  
<sup>(dnak)</sup> <sup>(alkilcsoport)</sup>

R<sub>2</sub> jelentése hidrogén- vagy halogénatom;

R<sub>3</sub> jelentése halogénatom; ciano- vagy alkilcsoport;

R<sub>4</sub> jelentése hidrogén- vagy halogénatom; nitro-, ami-  
no- vagy cianocsoport; adott esetben szubsztituált  
alkilcsoport; alkenil- vagy alkinil-oxi-csoport; kü-  
lönböző kéntartalmú csoportok; vagy

R<sub>3</sub> és R<sub>4</sub> a benzolgyűrűvel együtt adott esetben hetero-  
atomot tartalmazó biciklusos csoportot is képezhet;

R<sub>5</sub> jelentése hidrogén- vagy halogénatom; alkil- vagy  
alkenilcsoport;

R<sub>6</sub> jelentése karboxilcsoport vagy abból leszármaztatha-  
tó különböző csoportok;

A jelentése  $\text{NH}$  csoport; vagy

A és R<sub>6</sub> együtt egy  $\text{N-C(X)}$  csoportot és képezhet, amely-  
ben X oxigén vagy kénatomot jelent.

Az (I) általános képletű vegyületek egyrészt karba-

mid-, illetve tiokarbamid-, másrészt hidantoin származékok lehetnek. A karbamid-, illetve tiokarbamid származékokat a megfelelően szubsztituált fenil-izocianát, illetve -izotiocianát és amin komponens reakciójával állítják elő; a hidantoin származékokat az észter- és amid csoport között végbemelő intramolekuláris kondenzációs reakcióval kapják.

~~Az (I) általános képletű hatóanyagok szelektív herbicidek: károsító hatásuk sokkal erősebb a gyomnövényekkel, mint a haszonnövényekkel szemben.~~



2353-91

**KÖZZÉTÉTELI  
PÉLDÁNY**

A

15704

60107

Képviselő:

DANUBIA Szabadalmi és Védjegy Iroda Kft.

Budapest

NSZO<sup>5</sup>:

A 01 N 47/38

A 01 N 43/40

A 01 N 43/90

C 07 D 211/68

C 07 D 471/04

HATÓANYAGKÉNT ARIL-AMINO-KARBONIL-VEGYÜLETEKET TARTALMAZÓ  
HERBICID KÉSZÍTMÉNYEK, ~~ÉS~~ <sup>(AMINO-)</sup> ARIL-KARBONIL-VEGYÜLETEK, ~~ÉS~~ EL-  
JÁRÁS EZEK ELŐÁLLÍTÁSÁRA ~~ÉS~~ A KÉSZÍTMÉNYEK ALKALMAZÁSÁRA

Bejelentő: Sandoz A.G. Bázel, Svájc

Feltaláló: Dr. Karl SECKINGER, Riegel, Németország

A bejelentés napja: 1991. 07. 12.

Elsőbbsége: 1990. 07. 27. (9016476)<sup>5</sup> Nagy-Britannia

A találmány hatóanyagként új aril-amino-karbonil-vegyületeket tartalmazó herbicid készítményekre, a hatóanyagként alkalmazott aril-amino-karbonil-vegyületekre és ezek

72807-2703-PT-fa

előállítására vonatkozik. A találmány tárgyát képezik továbbá a hatóanyagok szintézisében alkalmazott közbenső termékek és ezek előállítása is.

Közelebbről a találmány az (I) általános képletű vegyületekre és előállításukra vonatkozik, ahol az (I) képletben

- $R_2$  hidrogén- vagy halogénatomot jelent;
- $R_3$  jelentése halogénatom, cianocsoport vagy 1-4 szénatomos alkilcsoport;
- $R_4$  jelentése hidrogén- vagy halogénatom; nitro-, amino- vagy cianocsoport; adott esetben cianocsoporttal szubsztituált 1-8 szénatomos alkilcsoport; adott esetben cianocsoporttal szubsztituált 2-8 szénatomos alkenilcsoport; 2-5 szénatomos alkoxi-karbonil-(1-4 szénatomos alkil)-csoport, amelyben az alkilcsoportnak az alkoxi-karbonil-csoportához képest alfa-helyzetű szénatomja egy további 2-5 szénatomos alkoxi-karbonil-csoporttal vagy cianocsoporttal szubsztituálva lehet; 2-5 szénatomos alkoxi-karbonil-(1-4 szénatomos alkoxi)-(1-4 szénatomos alkil)-csoport; 2-5 szénatomos alkoxi-karbonil-oxi-csoport; 2-5 szénatomos alkoxi-karbonil-(2-5 szénatomos alkenil)-oxi-csoport; 2-5 szénatomos alkinil-oxi-csoport; 3-6 szénatomos cikloalkil-oxi-csoport; adott esetben halogénatommal szubsztituált 2-5 szénatomos alkenil-oxi-csoport; 2-5 szénatomos alkoxi-karbonil-(2-5 szénatomos alkenil)-csoport, amelyben az alkenilcsoport adott esetben halogénatommal szubsztituálva lehet; 1-4 szén-

atomos alkil-tio-(1-4 szénatomos alkil)-csoport; 1-4 szénatomos alkil-szulfonil-(1-4 szénatomos alkil)-csoport; 1-4 szénatomos alkil-szulfonil-csoport; 1-4 szénatomos alkil-szulfonil-oxi-csoport; (1-4 szénatomos alkoxi)-(1-4 szénatomos alkoxi)-csoport; O-(1-4 szénatomos alkilén)<sub>n</sub>R<sub>7</sub> általános képletű csoport; S-(1-4 szénatomos alkilén)<sub>n</sub>R<sub>7</sub> általános képletű csoport; OCH(SR<sub>8</sub>)COOR<sub>9</sub> általános képletű csoport; NR<sub>10</sub>R<sub>11</sub>, COOR<sub>12</sub>, C(O)NR<sub>13</sub>R'<sub>13</sub>, C(O)R<sub>14</sub> általános képletű csoport; vagy R<sub>15</sub>; vagy

R<sub>3</sub> és R<sub>4</sub> a benzolgyűrűvel együtt, amelyhez kapcsolódnak, egy 9-10-tagú biciklusos csoportot is alkothatnak, amelynek 1-3 gyűrűtagja adott esetben oxigén-, nitrogén- vagy kénatom lehet, és amely adott esetben egy vagy több 2-8 szénatomos alkinilcsoporttal, halogénatommal, oxocsoporttal, (1-4 szénatomos alkilén)-R<sub>16</sub> általános képletű csoporttal, 2-8 szénatomos alkenilcsoporttal, és adott esetben önmagában is (2-5 szénatomos alkoxi)-karbonil-csoporttal, 1-4 szénatomos alkoxics csoporttal vagy cianocsoporttal helyettesített 1-8 szénatomos alkilcsoporttal szubsztituálva lehet;

R<sub>5</sub> jelentése hidrogén- vagy halogénatom; 1-4 szénatomos alkilcsoport; vagy 2-4 szénatomos alkenilcsoport;

R<sub>6</sub> jelentése COOH, COOW, COOSW, COON=CWW', CONHSO<sub>2</sub>W, CONHOCH<sub>2</sub>COOW, COOCH<sub>2</sub>OCOW, COOCHWOCOW' vagy CONHOCH<sub>2</sub>COOH általános képletű csoport;

A jelentése NH csoport; vagy

A és  $R_6$  együttesen egy  $N-C(X)$  általános képletű csoportot is alkothatnak, amelynek orientációja olyan, hogy a nitrogénatom az (I) általános képlet  $C=O$  csoportjához kapcsolódik;

$R_7$  jelentése hidrogénatom; 1-4 szénatomos alkil-, 2-5 szénatomos alkenil-, 2-5 szénatomos alkinil- vagy 3-8 szénatomos cikloalkilcsoport, és ezek a szénhidrogén-csoportok szubsztituálatlanok, vagy egy vagy több halogénatommal vagy cianocsoporttal szubsztituáltak lehetnek; ciklopentanoil-csoport; adott esetben 0-(1-4 szénatomos alkilén)- $COOR_8$  általános képletű csoporttal szubsztituált fenilcsoport; 2-5 szénatomos alkanoilcsoport; 2-5 szénatomos alkoxi-karbonil-csoport, amelyben az alkoxics csoport adott esetben 1-4 szénatomos alkiltio-csoporttal szubsztituálva lehet;  $C(O)NR_8R_8$ ,  $C(=NOR_8)COOR_8$ ,  $P(O)(OR_8)OR_8$ , általános képletű csoport;  $R_{15}$ ;  $C(O)R_{15}$  általános képletű csoport; vagy ciklopentoxi-karbonil-csoport;

$R_8$  és  $R_8'$  jelentése egymástól függetlenül 1-4 szénatomos alkilcsoport;

$R_9$  jelentése adott esetben egy vagy több halogénatommal szubsztituált 1-4 szénatomos alkilcsoport;

$R_{10}$  jelentése hidrogénatom vagy 1-4 szénatomos alkilcsoport;

$R_{11}$  jelentése hidrogénatom; adott esetben  $P(O)(OR_8)R_8'$  általános képletű csoporttal szubsztituált 1-4 szénatomos alkilcsoport; 2-5 szénatomos alkanoilcsoport; 2-5 szénatomos alkoxi-karbonil-csoport; vagy 2-5

szénatomos alkoxi-karbonil-(1-4 szénatomos alkil)-csoport;

R<sub>12</sub> jelentése N=(2-8 szénatomos alkilidén)-csoport; vagy adott esetben egy vagy több halogénatommal, 1-4 szénatomos alkoxicssoporttal, tri(1-4 szénatomos alkil)-szilil-oxi-csoporttal, tri(1-4 szénatomos alkil)-szilil-csoporttal, 2-5 szénatomos alkoxi-karbonil-csoporttal, P(O)(OR<sub>g</sub>)OR<sub>g</sub>' általános képletű csoporttal, 2-5 szénatomos alkanoil-oxi-csoporttal vagy di(1-4 szénatomos alkil)-amino-karbonil-oxi-csoporttal szubsztituált 1-4 szénatomos alkilcsoport, és a di(1-4 szénatomos alkil)-amino-karbonil-oxi-csoportban lévő két alkilcsoport a nitrogénnel együtt egy öt- vagy hattagú telített heterociklusos csoportot is alkothat, amely adott esetben egy további heteroatomként oxigén-, kén- vagy nitrogénatomot is tartalmazhat, és ebben a gyűrűs csoportban a gyűrű telítettségi fokától függően bármelyik további nitrogénatom hidrogénatomot vagy 1-4 szénatomos alkilcsoportot hordozhat;

R<sub>13</sub> hidrogénatomot vagy 1-4 szénatomos alkilcsoportot jelent; és

R<sub>13</sub>' jelentése hidrogénatom; 1-4 szénatomos alkilcsoport; 1-4 szénatomos alkoxicssoport; fenilcsoport; formilcsoport; 2-5 szénatomos alkanoilcsoport; 1-4 szénatomos alkil-szulfonil-csoport; 2-5 szénatomos alkoxi-karbonil-(1-4 szénatomos alkil)-csoport; vagy 2-5 szénatomos alkoxi-karbonil-(1-4 szénatomos alko-

xi)-csoport; vagy

$R_{13}$  és  $R_{13}'$  azzal a nitrogénatommal együtt, amelyhez kapcsolódnak, egy öt- vagy hattagú heterociklusos csoportot is alkothat, amely adott esetben egy vagy két további heteroatomként oxigén-, kén- vagy nitrogénatomot tartalmazhat, és ebben a gyűrűs csoportban a gyűrű telítettségi fokától függően bármelyik további nitrogénatom hidrogénatomot vagy 1-4 szénatomos alkilcsoportot hordozhat;

$R_{14}$  hidrogénatomot vagy 1-4 szénatomos alkilcsoportot jelent;

$R_{15}$  jelentése öt- vagy hattagú heterociklusos csoport, amelynek 1-3 gyűrűtagja oxigén-, kén- vagy nitrogénatom, és ez a gyűrűs csoport adott esetben egy vagy több 1-4 szénatomos alkilcsoporttal vagy 2-5 szénatomos alkoxi-karbonil-csoporttal szubsztituálva lehet;

$R_{16}$  jelentése tetrahidropiránil-, 5,6-dihidro-2H-tiínil-, piridil-, pirazinil-, oxazolil- vagy oxadiazolilcsoport, és mindezek a csoportok adott esetben 1-4 szénatomos alkilcsoporttal szubsztituálva lehetnek;

$W$  és  $W'$  jelentése egymástól függetlenül 1-8 szénatomos alkil-, 2-8 szénatomos alkenil-, 2-8 szénatomos alkinilcsoport vagy fenilcsoport, és mindezek a csoportok adott esetben cianocsoporttal, 1-4 szénatomos alkoxicssoporttal vagy egy vagy több halogénatommal szubsztituálva lehetnek;

n értéke 0 vagy 1; és

m értéke 0, 1, 2, 3 vagy 4.

Azokat az (I) általános képletű vegyületeket, ahol A és  $R_6$  N-C(X) csoportot alkotnak, az alábbiakban hidantoinoknak nevezzük. Azokat az (I) általános képletű vegyületeket, amelyekben A és  $R_6$  nem kapcsolódnak egymáshoz, az alábbiakban karbamidoknak nevezzük.

Az (I) általános képletben bármelyik alkilcsoport egyenes vagy elágazó szénláncú lehet, és előnyösen 1-4 szénatomos vázat tartalmaz.

Az alkenil- és alkinilcsoportok egyenes vagy elágazó szénláncúak lehetnek, és 3-5 szénatomból álló vázat tartalmaznak.

A cikloalkenilcsoportok előnyösen 5- vagy 6 gyűrűbeli szénatomot tartalmaznak.

A cikloalkilcsoportok előnyösen 3-5 gyűrűbeli szénatomot tartalmaznak.

Ha az (I) általános képletű vegyület szubsztituensként halogénatomot tartalmaz, akkor ez előnyösen klór- vagy fluoratom, még előnyösebben fluoratom.

Ha  $R_3$  és  $R_4$  a benzolgyűrűvel együtt biciklusos rendszert alkotnak, akkor ez előnyösen indanoncsoport; benzazinon-, különösen kinolincsoport; benzoxazinoncsoport; benzdiazinon-, különösen dihidrokinoxalinon-csoport; benztiazinoncsoport; benzodioxáncsoport; benzopiráncsoport; benzopiron-, különösen kumarincsoport; benzazol-, különösen indol-, indolon-, indazol-, benztriazol-, izatin- vagy benzimidazoloncsoport; benzoxazoloncsoport; benztiazazoloncsoport;

benzofuráncsoport; vagy benzodioxoláncsoport.

Ha  $m$  értéke 2, 3 vagy 4, akkor az  $R_5$  szubsztituensek azonosak vagy különbözők lehetnek.

Ha az (I) általános képletű vegyület hidantoin-típusú, akkor szubsztituenseinek előnyös jelentései az alábbiak:

$A$  jelentése  $N-C(O)$  képletű csoport;

$R_2$  klór- vagy fluoratomot jelent;

$R_3$  klóratomot vagy cianocsoportot jelent;

$R_4$  jelentése hidrogénatom; adott esetben cianocsoporttal szubsztituált 1-5 szénatomos alkoxics csoport; hidroxilcsoport; 1-4 szénatomos alkoxi-karbonil-(1-4 szénatomos alkoxi)-csoport; halogénatom; cianocsoport; 1-4 szénatomos alkil-szulfonil-oxi-csoport; 2-5 szénatomos alkinil-oxi-csoport; 3-6 szénatomos cikloalkil-oxi-csoport; 2-5 szénatomos alkoxi-karbonil-oxi-csoport; adott esetben halogénatommal szubsztituált 2-5 szénatomos alkenil-oxi-csoport; 2-5 szénatomos alkoxi-karbonil-csoport; 2-5 szénatomos alkenil-oxi-csoport; 1-4 szénatomos alkil-szulfonil-csoport; nitrocsoport; 1-4 szénatomos alkil-tio-csoport; 2-5 szénatomos alkoxi-karbonil-csoport; vagy

$R_3$  és  $R_4$  a benzolgyűrűvel együtt 5-fluor-indán-1-on-6-il- vagy 4-( $C_2H_5OCOCH_2$ )-7-fluor-2,4-dihidrobenzo[b]-1,4-oxazin-3-on-6-il-csoportot alkotnak; és

$R_5$  hidrogén- vagy halogénatomot jelent.

Ha az (I) általános képletű vegyület hidantoin-típusú, akkor szubsztituenseinek különösen előnyös jelentései az alábbiak:

A jelentése N-(CO) képletű csoport;

R<sub>2</sub> jelentése fluoratom;

R<sub>3</sub> jelentése klóratom;

R<sub>4</sub> jelentése 1-4 szénatomos alkoxi-, 2-5 szénatomos alkinil-oxi-, 2-5 szénatomos alkenil-oxi- vagy 2-5 szénatomos alkoxi-karbonil-csoport; és

R<sub>5</sub> hidrogén- vagy fluoratomot jelent.

Ha az (I) általános képletű vegyület karbamid-típusú, akkor szubsztituenseinek előnyös jelentései az alábbiak:

R<sub>2</sub> fluoratomot jelent;

R<sub>3</sub> jelentése klóratom;

R<sub>4</sub> jelentése 1-4 szénatomos alkoxi-, 2-5 szénatomos alkoxi-karbonil-, 2-5 szénatomos alkoxi-karbonil-oxi-, 1-4 szénatomos alkil-szulfonil-oxi-csoport; hidrogén- vagy halogénatom; cianocsoport; 2-5 szénatomos alkinil-oxi-, 3-6 szénatomos cikloalkil-oxi-csoport; nitrocsoport; vagy 1-5 szénatomos alkil-tio-csoport; vagy

R<sub>3</sub> és R<sub>4</sub> a benzolgyűrűvel együtt 5-fluor-indán-1-on-6-il- vagy 4-(C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>OCOCH<sub>2</sub>)-7-fluor-2,4-dihidrobenzo[b]-1,4-oxazin-3-on-6-il-csoportot alkotnak;

R<sub>5</sub> hidrogén- vagy halogénatomot jelent; és

R<sub>6</sub> jelentése 2-8 szénatomos alkoxi-karbonil-csoport.

Ha az (I) általános képletű vegyület karbamid-típusú, akkor szubsztituenseinek különösen előnyös jelentései az alábbiak:

R<sub>2</sub> fluoratomot jelent;

R<sub>3</sub> jelentése klóratom;

R<sub>4</sub> jelentése 2-5 szénatomos alkoxi- vagy 2-5 szénato-

mos alkinil-oxi-csoport;

$R_5$  jelentése hidrogén- vagy fluoratom; és

$R_6$  jelentése 2-5 szénatomos alkoxi-karbonil-csoport.

Az (I) általános képletű karbamidszármazékokat a találmány szerint úgy állítjuk elő, hogy egy (II) általános képletű vegyületet, amelyben  $R_2$ ,  $R_3$  és  $R_4$  a fentiekben meghatározott, egy (III) általános képletű vegyülettel - amelyben  $R_5$ ,  $R_6$  és  $m$  jelentése a fentiekben meghatározott - reagáltatunk.

E reakció különböző oldószerekben, változatos körülmények között valósítható meg. Az egyik megvalósítási mód szerint e reakciót vizes oldatban, valamilyen bázis jelenlétében játszadjuk le. Előnyösen alkalmazhatók e célra bázisként az alkálifém-hidroxidok, például a nátrium- vagy kálium-hidroxid. A reagáltatást alacsony hőmérsékleten, azaz szobahőmérséklet alatti hőfokon, előnyösen körülbelül 0 °C és 20 °C közötti hőmérséklettartományban végezzük. A feldolgozást ismert módszerekkel, például savanyítás után szűréssel és extrakcióval végezhetjük a kívánt végtermék elkülönítése céljából.

Egy másik megvalósítási mód szerint a reakciót közömbös oldószerben - például toluolban, dietil-éterben vagy diklór-metánban - 0 °C és 100 °C közötti hőmérsékleten, előnyösen a szobahőmérséklethez közeli hőfokon hajtjuk végre. A feldolgozást ebben az esetben is ismert módszerekkel végezzük, például úgy, hogy az oldószert lepároljuk, majd kromatografálást és extrakciót végzünk a kívánt végtermék elkülönítése céljából.

A (II) és (III) általános képletű vegyületek ismertek, és ismert eljárásokkal állíthatók elő.

Az (I) általános képletű hidantoinvegyületek az (I) általános képletű karbamidszármazékokból kaphatók olyan esetekben, amikor X jelentése oxigénatom. Ez az átalakulás az (I) általános képletű karbamidszármazék amidcsoportja és észtercsoportja között végbemenő kondenzációs reakció, amelyet valamilyen sav vagy nukleofil ágens hozzáadásával elősegíthetünk. Ennek az eljárásnak egyik megvalósítási módja szerint a reakciót valamilyen alkoholban - például etanolban - valamilyen sav, például sósav jelenlétében hajtjuk végre. Ennek során célszerűen szobahőmérséklettől a reakcióelegy forráspontjáig terjedő hőmérsékleten dolgozunk, bár a reakció előnyösen az elegy forráspontján valósítható meg. A kívánt végterméket ismert módon - például bepárlás és átkristályosítás útján - végzett feldolgozás után különítjük el.

Egy másik megvalósítási mód szerint a reagáltatást valamilyen alkoholos közegben, például metanolban valamilyen nukleofil anyag, például kálium-karbonát jelenlétében végzzük. Célszerűen körülbelül szobahőmérséklettől 60 °C hőmérsékletig terjedő hőfokon, előnyösen körülbelül 50 °C hőmérsékleten dolgozunk. A kapott terméket ammónium-kloriddal kezelve jutunk a végtermékhez, amelyet az oldatból ismert módon - például extrakció és átkristályosítás útján - nyerünk ki.

Az (I) általános képletű hidantoin-származékok teljes általánosságban - tehát ha X akár oxigén-, akár nitrogéna-

tomot jelent - előállíthatók úgy, hogy egy (IIa) általános képletű vegyületet - amelyben  $R_2$ ,  $R_3$  és  $R_4$  jelentése a fentiekben meghatározott, és X oxigén- vagy kénatomot jelent - reagáltatunk egy (IIIa) általános képletű vegyülettel, amelyben  $R_5$  és m jelentése a fentiekben meghatározott.

A fenti kondenzációs reakciót előnyösen közömbös oldószerben, például toluolban játszadjuk le. A kondenzáció elősegíthető nukleofil ágens, például valamilyen terciér amin, így trialkil-amin, például trietil-amin hozzáadásával. E reakciót célszerűen szobahőmérséklettől a reakcióelegy forráspontjáig terjedő hőmérsékleten végezzük, előnyösen szobahőmérsékleten vagy a szobahőmérséklethez közeli hőfokon. A kívánt végterméket ez esetben is ismert módszerrel - például az oldószer lepárlásával, szűréssel és kristályosítással - végzett feldolgozás után kapjuk.

A (IIa) és (IIIa) általános képletű vegyületek ismertek, és ismert eljárásokkal állíthatók elő.

Az (I) általános képletű vegyületek hasznosak, mert hatékonyan gátolják növények növekedését. E helyen növényeken csírázó magvakat, kikelő palántákat és kifejlett vegetációt értünk (a növények földalatti részeit is beleértve). A találmány szerinti vegyületek különösen gyomirtószerekként (herbicidekként) alkalmazhatók, mivel mind az egyszikű, mind a kétszikű növényeket károsítják, s ez a herbicid hatások meghatározására alkalmazott standard vizsgálati módszerekkel igazolható. A herbicid hatás a növényeknek mind a kikelése előtt, mind a kikelése után megnyilvánul. E herbicid hatások arra utalnak, hogy az (I) általános képletű vegyületek gyomok

irtása szempontjából különösen érdekesek.

Igazolható, hogy az (I) általános képletű vegyületek erősebben hatnak a kétszikű növényekre, mint az egyszikűekre; másrészt haszonnövényekre ehyébb toxikus hatásokat fejtenek ki, mint gyomnövényekre. Ennek alapján e vegyületek különös figyelmet érdemelnek, mivel szelektív herbicidként alkalmazhatók gyomnövények leküzdésére haszonnövények területén, különösen olyan haszonnövények termőterületén, mint például a cukorrépa, napraforgó, gyapot, szójabab, kukorica és búza.

A találmány révén lehetővé válik módszer kidolgozása gyomok irtására valamely területen. E módszer abban áll, hogy a gyomokra vagy a gyomok (várható) helyére egy (I) általános képletű vegyület herbicid hatású mennyiségét juttatjuk ki. Ha szelektív hatást kívánunk elérni valamilyen haszonnövény termőterületén, akkor a kijuttatott mennyiségnek elegendőnek kell lennie a gyomnövények irtására a haszonnövény lényeges károsítása nélkül.

A találmány szerinti vegyületek herbicidként, valamint szelektív herbicidként történő alkalmazása során az alkalmazásra kerülő mennyiség ismert tényezőktől, így az alkalmazott hatóanyagtól, az adott helyen lévő növényektől, a kijuttatás időzítésétől, módjától és a hatóanyag kiszérésétől, valamint a kezelés különböző körülményeitől, például a talajtól és az időjárástól függ. Általában azonban a gyomirtásban kielégítő eredményeket érhetünk el, ha a találmány szerinti vegyületeket 0,01-5 kg/hektár, közelebbről 0,01-1 kg/hektár, előnyösen 0,01-0,5 kg/hektár mennyiségben

juttatjuk ki, és a kijuttatást szükség szerint megismételjük. Ha a gyomirtást haszonnövények termőterületén végezzük, akkor a kijuttatott mennyiség általában nem haladhatja meg a körülbelül 1 kg/hektár adagot, általában 0,01 és 1 kg/hektár közötti tartományban van.

A gyomirtás gyakorlati kivitelezése céljából az (I) általános képletű vegyületeket célszerűen herbicid készítmények alakjában alkalmazzuk, amelyek az adott vegyület herbicid hatás szempontjából hatásos mennyiségét és mezőgazdasági szempontból elfogadható közömbös vivőanyagot tartalmaznak. A "mezőgazdasági szempontból elfogadható" kifejezés azt jelenti, hogy a vivőanyag jelenléte nem mérgezi sem a mezőgazdasági környezetet - beleértve a közvetlen talajkörnyezetet -, sem az adott területen jelenlévő haszonnövényeket, és kijuttatása egyébként is biztonságos. Az ilyen készítmények 0,01-99 tömeg% hatóanyagot, 0-20 tömeg% mezőgazdasági nedvesítőszer és 1-99,99 tömeg% közömbös vivőanyagot tartalmazhatnak. Egyes esetekben kívánatos a nedvesítőszernek a hatóanyaghoz viszonyított magasabb aránya, ami elérhető a készítmény kialakítása során vagy tankban végzett összekeverés útján. A készítmények kijuttatási formái általában 0,01-25 tömeg% hatóanyagot tartalmaznak, természetesen azonban, hogy a célzott alkalmazástól és az adott vegyület fizikai sajátságaitól függően a hatóanyag ennél nagyobb vagy kisebb koncentrációkban is jelen lehet. A koncentrátum alakjában lévő készítmények - amelyeket használat előtt fel kell hígítani - általában 2-90 tömeg%, előnyösen 10-80 tömeg% hatóanyagot tartalmaznak.

A találmány szerinti vegyületek célszerűen például porokká, szemcsékké, pelletékké, szuszpenziós koncentrátumokká, nedvesíthető porokká, emulziós koncentrátumokká és hasonlóká alakíthatók. E szerformák a szokásos módon állíthatók elő, például úgy, hogy a találmány szerinti vegyületeket közömbös vivőanyaggal keverjük. Konkrétabban: folyékony készítményeket úgy kapunk, hogy a komponenseket összekeverjük; finom eloszlású szilárd készítményeket keveréssel és általában őrléssel kaphatunk; szuszpenziókat nedves őrléssel állítunk elő; és szemcséket, valamint pelleteket úgy kapunk, hogy az előre kialakított szemcsés vivőanyagot a hatóanyaggal impregnáljuk vagy bevonjuk, vagy agglomerációs módszert alkalmazunk.

Úgy például port előállíthatunk úgy, hogy a hatóanyagot a szilárd, közömbös vivőanyaggal, például talkummal, agyaggal, kovafölddel őrljük és összekeverjük. Szemcsézett készítményt úgy állíthatunk elő, hogy az általában megfelelő oldószerben oldott vegyülettel impregnáljuk a szemcsés vivőanyagot, például attapulgitot vagy vermikulitot, amelynek részecskemérete általában körülbelül 0,3-1,5 mm. Nedvesíthető porokat - amelyek vízzel vagy olajjal a hatóanyag kívánt koncentrációjára hígíthatók - úgy készíthetünk, hogy koncentrált porkészítménybe nedvesítőszereket foglalunk.

A találmány szerinti vegyületeket mikrokapszulázott alakban is alkalmazhatjuk.

A herbicid készítményekben a hatóanyag hatásának fokozására, valamint a habzás, összetapadás és korrózió csökkentése céljából mezőgazdasági szempontból elfogadható ada-

lékanyagok alkalmazhatók.

E leírásban felületaktív szeren mezőgazdasági szempontból elfogadható olyan anyagot értünk, amely emulgeálhatóságot, szélesztést, nedvesítést, diszpergálhatóságot fokozó vagy más, a felületet módosító sajátságokkal rendelkezik. Ilyen felületaktív szer a nátrium-lignin-szulfonát és a nátrium-lauril-szulfát.

Vivőanyagon e leírásban olyan folyékony vagy szilárd anyagokat értünk, amelyeket egy koncentrált termék alkalmazható vagy kívánt koncentrációra hígításához felhasználhatunk. Porok és szemcsés készítmények céljára ilyen vivőanyag például a talkum, kaolin és kovaföld; folyékony koncentrátumok esetében e célra valamilyen szénhidrogén, például xilol vagy valamilyen alkohol, például izopropanol alkalmazható; folyékony kijuttatási formák esetén vivőanyagként például víz vagy dízelolaj használható.

A találmány szerinti készítmények más, biológiailag hatásos vegyületeket, például hasonló vagy kiegészítő herbicid hatású anyagokat, vagy antidotum, fungicid vagy inszekticid hatóanyagokat is tartalmazhatnak.

Az alábbi A, B és C példákban nem korlátozó jelleggel részletesebben ismertetjük a találmány szerinti jellegzetes herbicid készítményeket. E példákban a mennyiségeket tömegrészekben adjuk meg.

#### A. példa

Porkészítmény előállítása

Mechanikus őrlő-keverő berendezésben 10 tömegrész (I)

általános képletű vegyületet 90 rész porított talkummal keverünk, és addig őröljük, míg homogén, könnyen gördülő, kívánt részecskeméretű port nem kapunk. Ez a porkészítmény alkalmas közvetlen kijuttatásra a gyomos fertőzés helyén.

#### B. példa

##### Nedvesíthető por előállítása

25 rész (I) általános képletű vegyületet 25 rész szintetikus, finom eloszlású kovafölddel, 2 rész nátrium-lauril-szulfáttal, 3 rész nátrium-lignin-szulfonáttal és 45 rész finom eloszlású kaolinnal keverés közben addig őrölünk, amíg a részecskeméret körülbelül 5 mikront el nem ér. Az így kapott nedvesíthető port felhasználás előtt vízzel a kívánt koncentrációjú permetezhető folyadékká hígítjuk.

#### C. példa

##### Emulziós koncentrátum (EC) előállítása

Hengerpohárban 13 rész (I) általános képletű vegyületet 7 rész Toximul 360A nedvesítőszerrel (anionos és nemionos nedvesítőszer keveréke, amelynek nagy része nemionos jellegű), 24 rész dimetil-formamiddal és 56 rész Tenneco 500-100 termékkel (túlnyomórészt alkil-aromás oldószerek, így xilol és etil-benzol keveréke) addig keverünk, amíg oldatot nem kapunk. Az így kapott koncentrátumot használat előtt vízzel hígítjuk.

##### Példák a hatóanyagok előállítására

Az alábbiakban - ha erre vonatkozó külön megjegyzést nem

teszünk - a hőmérséklet-értékeket Celsius-fokban adjuk meg.

A. példa

1-{[(2-Fluor-5-izopropoxi-4-klór-fenil)-amino]-karbonil}-1,2,3,6-tetrahidro-2-piridin-karbonsav (1.1 számú vegyület) előállítása

4,6 g (0,02 mol) szilárd, finoman porított (2-fluor-5-izopropoxi-4-klór-fenil)-izocianátot keverés közben, több részletben 40 ml 1 n nátrium-hidroxid-oldatban feloldott 3,28 g (0,02 mol) 1,2,3,6-tetrahidro-2-piridin-karbonsav hidrokloridhoz adagolunk, miközben jégghűtéssel a hőmérsékletet 5 °C-on tartjuk. Az adagolás befejezése után a reakcióelegyet szobahőmérsékleten 4,5 órán át keverjük, majd leszívatóval szűrjük. A szűrletet 15 %-os sósavoldattal óvatosan megsavanyítjuk, a csapadékot leszívatóval szűrjük, vízzel mossuk, majd 150 ml diklór-metánban oldjuk, vízmentes nátrium-szulfáton megszáritjuk, és bepároljuk. Az így kapott sűrűnfolyó maradékot 200 ml 5:1 arányú dietil-éter/hexán eleggyel alaposan átdolgozva színtelen kristályok alakjában kapjuk a cím szerinti tiszta vegyületet, op.: 115-116 °C.

B. példa

1-{[(2-Fluor-5-izopropoxi-4-klór-fenil)-amino]-karbonil}-1,2,3,6-tetrahidro-2-piridin-karbonsav-metil-észter (1.2. számú vegyület) előállítása

5,65 g (0,04 mol) 1,2,3,6-tetrahidro-2-piridin-karbonsav-metil-észter és 75 ml száraz toluol oldatához keve-

rés közben, hűtés nélkül 9,2 g (0,04 mol) (2-fluor-5-izopropoxi-4-klór-fenil)-izocianát 200 ml száraz toluollal készült oldatát csepegtetjük. Az exoterm, 29 °C hőmérsékletet eredményező reakció lezajlása után a reakcióelegyet 5 órán át szobahőmérsékleten tovább keverjük, majd szárazra pároljuk. A maradékot szilikagéloszlopon kromatografáljuk, eluálószerként hexán és dietil-éter 3:2 arányú elegyét alkalmazzuk, s így a cím szerinti vegyületet sárga szirup alakjában kapjuk, amely állás közben megszilárdul, op.: 88-89 °C.

Az A. és B. példákban leírt eljárásokhoz hasonlóan állítottuk elő az 1. táblázatban feltüntetett vegyületeket.

#### C. példa

2-(2-Fluor-5-izopropoxi-4-klór-fenil)-8,8a-dihidroimidazo[1,5-a]piridin-1,3(2H,5H)-dion (2.3. számú vegyület) előállítása

1,43 g (0,004 mol) 1-{[(2-fluor-5-izopropoxi-4-klór-fenil)-amino]-karbonil}-1,2,3,6-tetrahidro-2-piridin-karbonsav, 20 ml etanol és 20 ml 2 n sósavoldat elegyét visszafolyatós hűtő alatt 4 órán át forraljuk, majd a reakcióelegyet forgóbepárló készüléken bepároljuk. Így halványságra szirup alakjában jutunk a cím szerinti vegyülethez, amely vékonyréteg-kromatogramja (VRK) alapján egységes;  $R_f$ -értéke szilikagélen 0,35, ha a kifejlesztést etil-acetát és hexán 1:1 arányú elegyével végezzük, és a foltokat 1 %-os káliumpermanganát-oldattal tesszük láthatóvá. E szirup -15 °C hőmérsékleten másnapig hűtve teljes egészében megkristályo-

sodik, és hexánnal alaposan átdolgozva 90-92 °C-on olvad.

D. példa

2-(2,4-Diklór-5-izopropoxi-fenil)-8,8a-dihidroimidazo[1,5-a]piridin-1,3(2H, 5H)-dion (2.1. számú vegyület) előállítás

1,36 g (0,0035 mol) 1-{[(2,4-diklór-5-izopropoxi-fenil)-amino]-karbonil}-1,2,3,6-tetrahidro-2-piridin-karbonsav-metil-észter, 18 ml etanol és 18 ml 2 n sósavoldat elegyét 4 órán át visszafolyatós hűtő alatt forraljuk, majd vákuumban bepároljuk. A maradékot diklór-metánban felvesszük, 75 ml vízzel mossuk, vízmentes nátrium-szulfáton szárítjuk, szűrjük, majd bepároljuk. A szirupszerű maradékot 20 ml dietiléterben oldva másnapig -18 °C-on állni hagyjuk, s így színtelen kristályok alakjában kapjuk a cím szerinti vegyületet, op.: 125-126 °C.

E. példa

2-(2-Fluor-5-hidroxi-4-klór-fenil)-8,8a-dihidroimidazo[1,5-a]piridin-1,3(2H, 5H)-dion (2.2 számú vegyület) előállítás

8,4 g (0,0217 mol) 1-{[(2-fluor-4-klór-5-metoxi-karbonil-oxi-fenil)-amino]-karbonil}-2-piridin-karbonsav-metil-észter, 3 g (0,0217 mol) kálium-karbonát és 175 ml metanol keverékét 50 °C-on 2 órán át keverés közben melegítjük, utána az így kapott sárga oldatot vákuumban bepároljuk, és a maradékhoz 200 ml telített ammónium-klorid-oldatot adunk. A cím szerinti vegyületet háromszor 120 ml die-

til-éterrel extraháljuk, és az egyesített éteres kivonatot vízmentes nátrium-szulfáton szárítjuk, majd bepároljuk. A forgóbepárlón végzett bepárlás után visszamaradó kristálytömeget hexán és dietil-éter 5:1 arányú elegyével alaposan eldörzsölve a cím szerinti vegyületet színtelen kristályok alakjában nyerjük, op.: 195-197 °C.

F. példa

2-(2-Fluor-5-izopropoxi-4-klór-fenil)-8,8a-dihidroidimidazo[1,5-a]piridin-1,3(2H, 5H)-dion (2.3. számú vegyület) előállítása

2,82 g (0,02 mol) 1,2,3,6-tetrahidro-2-piridin-karbonsav-metil-észter 40 ml száraz toluollal készült, 0,8 ml trietil-amint tartalmazó oldatához hűtés nélkül 4,6 g (0,02 mol) (2-fluor-5-izopropoxi-4-klór-fenil)-izocianát és 100 ml száraz toluol elegyét adjuk. Az adagolás befejezése után kapott reakcióelegyet szobahőmérsékleten 18 órán át keverjük, majd vákuumban bepároljuk. A viszkózus, folyékony lepárlási maradékot 50 ml 1:1 arányú hexán/dietil-éter elegyben oldjuk, szűrjük, és a szűrletet másnapig -15 °C hőmérsékleten hűtjük. Így színtelen kristályok formában jutunk a cím szerinti vegyülethez, op.: 90-92 °C.

Az F. példában ismertetett eljárást követve, 1,2,3,6-tetrahidro-2-piridin-karbonsav-metil-észtert a megfelelő aril-izocianátokkal, illetve aril-izotiocianátokkal reagáltatva állítottuk elő a 2. táblázatban feltüntetett vegyületeket.

1. táblázat "A" rész

(I) általános képletű karbamidszármazékok (ahol A jelentése NH csoport)

| A példa<br>sorszáma | R <sub>2</sub> | R <sub>3</sub> | R <sub>4</sub>                    | R <sub>6</sub>     | (R <sub>5</sub> ) <sub>m</sub> | Op. (°C) vagy<br>R <sub>f</sub> -érték szili-<br>kagélen |
|---------------------|----------------|----------------|-----------------------------------|--------------------|--------------------------------|----------------------------------------------------------|
| 1.1.                | F              | Cl             | OC <sub>3</sub> H <sub>7</sub> -i | COOH               | H                              | 115-116                                                  |
| 1.2.                | F              | Cl             | OC <sub>3</sub> H <sub>7</sub> -i | COOCH <sub>3</sub> | H                              | 88-89                                                    |
| 1.3.                | F              | Cl             | OCOCH <sub>3</sub>                | COOCH <sub>3</sub> | H                              | 109-111                                                  |
| 1.4.                | F              | Cl             | OSO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>  | COOCH <sub>3</sub> | H                              | 136-138                                                  |
| 1.5.                | Cl             | Cl             | OC <sub>3</sub> H <sub>7</sub> -i | COOCH <sub>3</sub> | H                              | 86-87                                                    |
| 1.6.                | H              | Cl             | H                                 | COOH               | H                              | 117-118                                                  |
| 1.7.                | F              | Cl             | Br                                | COOCH <sub>3</sub> | H                              | 103-105                                                  |
| 1.8.                | F              | Cl             | I                                 | "                  | H                              | 112                                                      |
| 1.9.                | F              | Cl             | Cl                                | "                  | H                              | 118                                                      |
| 1.10.               | F              | Cl             | CN                                | "                  | H                              | 149-150                                                  |
| 1.11.               | F              | Cl             | OCH <sub>2</sub> C≡CH             | "                  | H                              | 104-106                                                  |
| 1.12.               | F              | Cl             | OC <sub>3</sub> H <sub>7</sub> -n | "                  | H                              | 91                                                       |
| 1.13.               | F              | Cl             | OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>  | "                  | H                              | 63                                                       |

1570

Op. (°C) vagy  
R<sub>f</sub>-érték szili-  
kagélen

(R<sub>5</sub>)<sub>m</sub>

R<sub>6</sub>

R<sub>4</sub>

R<sub>3</sub>

R<sub>2</sub>

A példa  
sorszáma

|       |   |    |                                                      |                                           |   |     |
|-------|---|----|------------------------------------------------------|-------------------------------------------|---|-----|
| 1.14. | F | Cl | OCH <sub>3</sub>                                     | COOCH <sub>3</sub>                        | H | 102 |
| 1.15. | F | Cl | O-ciklopentil                                        | "                                         | H | 105 |
| 1.16. | F | Cl | OCH <sub>2</sub> CH=CHCH <sub>3</sub>                | "                                         | H |     |
| 1.17. | F | Cl | OCH <sub>2</sub> C(CH <sub>3</sub> )=CH <sub>2</sub> | "                                         | H |     |
| 1.18. | F | Cl | OCH(CH <sub>3</sub> )CH=CH <sub>2</sub>              | "                                         | H |     |
| 1.19. | F | Cl | OCH <sub>2</sub> CH=C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> | "                                         | H |     |
| 1.20. | F | Cl | OCH <sub>2</sub> C(Br)=CH <sub>2</sub>               | "                                         | H |     |
| 1.21. | F | Cl | OCH <sub>2</sub> CH=CH-Br                            | "                                         | H |     |
| 1.22. | F | Cl | OCH <sub>2</sub> CH=CH-COOCH <sub>3</sub>            | "                                         | H |     |
| 1.23. | F | Cl | OC <sub>3</sub> H <sub>7</sub> -i                    | COOC <sub>3</sub> H <sub>7</sub> -i       | H |     |
| 1.24. | F | Cl | "                                                    | COOCH <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub>     | H |     |
| 1.25. | F | Cl | "                                                    | COOCH <sub>2</sub> C≡CH                   | H |     |
| 1.26. | F | Cl | "                                                    | COOC(CH <sub>3</sub> )HOCOCH <sub>3</sub> | H |     |
| 1.27. | F | Cl | "                                                    | COOCH <sub>2</sub> OCOCH <sub>3</sub>     | H |     |
| 1.28. | F | Cl | "                                                    | COON=C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>     | H |     |
| 1.29. | F | Cl | "                                                    | CONHOCH <sub>2</sub> COOCH <sub>3</sub>   | H |     |
| 1.30. | F | Cl | "                                                    | CONHSO <sub>2</sub> -fenil                | H |     |

A példa sorszáma      R<sub>2</sub>      R<sub>3</sub>      R<sub>4</sub>      R<sub>6</sub>      (R<sub>5</sub>)m      Op. (°C) vagy R<sub>f</sub>-érték szilikagélén

|       |   |                 |                                                  |                                                                      |                                          |     |
|-------|---|-----------------|--------------------------------------------------|----------------------------------------------------------------------|------------------------------------------|-----|
| 1.31. | F | Cl              | OC <sub>3</sub> H <sub>7</sub> -i                | COSCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>                                   | H                                        |     |
| 1.32. | F | CH <sub>3</sub> | "                                                | COOCH <sub>3</sub>                                                   | H                                        |     |
| 1.33. | F | CN              | "                                                | "                                                                    | H                                        |     |
| 1.34. | F | CN              | COOC <sub>4</sub> H <sub>9</sub> -s              | "                                                                    | H                                        |     |
| 1.35. | F | Cl              | CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>                 | "                                                                    | H                                        |     |
| 1.36. | F | Cl              | CH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>  | "                                                                    | H                                        |     |
| 1.37. | F | Cl              | SO <sub>2</sub> C <sub>3</sub> H <sub>7</sub> -i | "                                                                    | H                                        |     |
| 1.38. | F | Cl              | NO <sub>2</sub>                                  | "                                                                    | H                                        | 101 |
| 1.39. | F | Cl              | OC <sub>3</sub> H <sub>7</sub> -i                | COOCH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub> | H                                        |     |
| 1.40. | F | Cl              | OC <sub>3</sub> H <sub>7</sub> -i                | COOCH <sub>3</sub>                                                   | 2-CH <sub>3</sub>                        |     |
| 1.41. | F | Cl              | "                                                | "                                                                    | 6-CH <sub>3</sub>                        |     |
| 1.42. | F | Cl              | "                                                | "                                                                    | 4(5)-CH <sub>3</sub> (1)                 |     |
| 1.43. | F | Cl              | "                                                | "                                                                    | 4(5)-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> (1) |     |
| 1.44. | F | Cl              | "                                                | "                                                                    | 4(5)-Cl(1)                               |     |
| 1.45. | F | Cl              | "                                                | "                                                                    | 8-F                                      |     |
| 1.46. | F | Cl              | "                                                | "                                                                    | 3,6-(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>      |     |
| 1.47. | F | Cl              | "                                                | "                                                                    | 4,6,6-(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>    |     |

| A példa<br>sorszáma | R <sub>2</sub> | R <sub>3</sub> | R <sub>4</sub>                                                    | R <sub>6</sub>     | (R <sub>5</sub> ) <sup>m</sup> | Op. (°C) vagy<br>R <sub>f</sub> -érték szili-<br>kagélen |
|---------------------|----------------|----------------|-------------------------------------------------------------------|--------------------|--------------------------------|----------------------------------------------------------|
| 1.48.               | F              | Cl             | OC(CH <sub>3</sub> )C≡CH                                          | COOCH <sub>3</sub> | H                              | 103-105                                                  |
| 1.49.               | F              | Cl             | OCH(CH <sub>3</sub> )CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>              | "                  | H                              | 66                                                       |
| 1.50.               | F              | Cl             | OCH <sub>2</sub> -fenil                                           | "                  | H                              |                                                          |
| 1.51.               | F              | Cl             | OCH(CH <sub>3</sub> )-fenil                                       | "                  | H                              |                                                          |
| 1.52.               | F              | Cl             | OCH(CH <sub>3</sub> )CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>             | "                  | H                              |                                                          |
| 1.53.               | F              | Cl             | OCH <sub>2</sub> C(O)CH <sub>3</sub>                              | "                  | H                              |                                                          |
| 1.54.               | F              | Cl             | OCH <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub>                               | "                  | H                              |                                                          |
| 1.55.               | F              | Cl             | OCH <sub>2</sub> CH=CHCl                                          | "                  | H                              |                                                          |
| 1.56.               | F              | Cl             | OCH <sub>2</sub> CH(Cl)=CH <sub>2</sub>                           | "                  | H                              |                                                          |
| 1.57.               | F              | Cl             | OCH <sub>2</sub> -(2,2-di-Cl-<br>ciklopropil)                     | "                  | H                              |                                                          |
| 1.58.               | F              | Cl             | OCH <sub>2</sub> (2-Cl-ciklopropil)                               | "                  | H                              |                                                          |
| 1.59.               | F              | Cl             | OCH <sub>2</sub> -ciklopropil                                     | "                  | H                              |                                                          |
| 1.60.               | F              | Cl             | OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | "                  | H                              |                                                          |
| 1.61.               | F              | Cl             | OCH <sub>2</sub> -(tetrahidrofuran-2-il)                          | "                  | H                              |                                                          |
| 1.62.               | F              | Cl             | OCH <sub>2</sub> -(tetrahidropirán-2-il)                          | "                  | H                              |                                                          |
| 1.63.               | F              | Cl             | OCH <sub>2</sub> -(5,6-dihidro-2-H-tiin-<br>3-il)                 | "                  | H                              |                                                          |

Op. (°C) vagy  
R<sub>f</sub>-érték szili-  
kagélen

(R<sub>5</sub>)<sub>m</sub>

R<sub>6</sub>

R<sub>4</sub>

R<sub>3</sub>

R<sub>2</sub>

A példa  
sorszáma

|       |   |    |                                                                          |                    |   |
|-------|---|----|--------------------------------------------------------------------------|--------------------|---|
| 1.64. | F | Cl | OCH <sub>2</sub> -C(=NOCH <sub>3</sub> )COOC <sub>2</sub> H <sub>5</sub> | COOCH <sub>3</sub> | H |
| 1.65. | F | Cl | OCH <sub>2</sub> (1,3-dioxolán-2-il)                                     | "                  | H |
| 1.66. | F | Cl | OCH <sub>2</sub> -(1,3-ditiolán-2-il)                                    | "                  | H |
| 1.67. | F | Cl | OCH <sub>2</sub> -CO-(1,4-oxazin-4-il)                                   | "                  | H |
| 1.68. | F | Cl | OCH <sub>2</sub> COOC <sub>5</sub> H <sub>11</sub> -n                    | "                  | H |
| 1.69. | F | Cl | O-(2-oxo-ciklopentil-1)                                                  | "                  | H |
| 1.70. | F | Cl | OP(O)(OCH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>                                    | "                  | H |
| 1.71. | F | Cl | OCH(SCH <sub>3</sub> )-COOCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> Cl             | "                  | H |
| 1.72. | F | Cl | OCH <sub>2</sub> P(O)(OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>    | "                  | H |
| 1.73. | F | Cl | OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>                                         | "                  | H |
| 1.74. | F | Cl | OCHF <sub>2</sub>                                                        | "                  | H |
| 1.75. | F | Cl | OCH <sub>2</sub> COO-ciklopentil                                         | "                  | H |
| 1.76. | F | Cl | OCH <sub>2</sub> -(1-pirazolil)                                          | "                  | H |
| 1.77. | F | Cl | 4-[C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> OOC-CH(CH <sub>3</sub> )-O]-<br>fenoxi  | "                  | H |
| 1.78. | F | Cl | OCH <sub>2</sub> -(2-tienil)                                             | "                  | H |
| 1.79. | F | Cl | OCH(CH <sub>3</sub> )-(3-CH <sub>3</sub> -1,2,4-<br>oxadiazol-5-il)      | "                  | H |

| A példa<br>sorszáma | R <sub>2</sub> | R <sub>3</sub> | R <sub>4</sub>                                                                                             | R <sub>6</sub>     | (R <sub>5</sub> ) <sub>m</sub> | Op. (°C) vagy<br>R <sub>f</sub> -érték szili-<br>kagélen |
|---------------------|----------------|----------------|------------------------------------------------------------------------------------------------------------|--------------------|--------------------------------|----------------------------------------------------------|
| 1.80.               | F              | Cl             | SC <sub>3</sub> H <sub>7</sub> -i                                                                          | COOCH <sub>3</sub> | H                              | 80-81                                                    |
| 1.81.               | F              | Cl             | SCH <sub>2</sub> C≡CH                                                                                      | "                  | H                              |                                                          |
| 1.82.               | F              | Cl             | SCH <sub>2</sub> COOC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>                                                          | "                  | H                              |                                                          |
| 1.83.               | F              | Cl             | SCH(CH <sub>3</sub> )-COOC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>                                                     | "                  | H                              |                                                          |
| 1.84.               | F              | Cl             | SCH <sub>2</sub> -fenil                                                                                    | "                  | H                              |                                                          |
| 1.85.               | F              | Cl             | S-(tetrahydro-pirán-2-il)                                                                                  | "                  | H                              |                                                          |
| 1.86.               | F              | Cl             | NCH <sub>2</sub> COOC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>                                                          | "                  | H                              |                                                          |
| 1.87.               | F              | Cl             | N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>                                                                           | "                  | H                              |                                                          |
| 1.88.               | F              | Cl             | N-(CH <sub>3</sub> )-COOCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>                                                    | "                  | H                              |                                                          |
| 1.89.               | F              | Cl             | NHCOCH(CH <sub>3</sub> )-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>                                                   | "                  | H                              |                                                          |
| 1.90.               | F              | Cl             | NHCH(C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> )-P(O)(C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> )(OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub> ) | "                  | H                              |                                                          |
| 1.91.               | F              | Cl             | COOC <sub>3</sub> H <sub>7</sub> -i                                                                        | "                  | H                              | 0,43 (etil-acetát:hexán 1:1)                             |
| 1.92.               | F              | Cl             | COOCH(CH <sub>2</sub> F) <sub>2</sub>                                                                      | "                  | H                              |                                                          |
| 1.93.               | F              | Cl             | COOCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>                                                        | "                  | H                              |                                                          |
| 1.94.               | F              | Cl             | COON=C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>                                                                      | "                  | H                              |                                                          |
| 1.95.               | F              | Cl             | COOCH <sub>2</sub> F                                                                                       | "                  | H                              |                                                          |
| 1.96.               | F              | Cl             | COOCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OSi(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>                                      | "                  | H                              |                                                          |

| A példa<br>sorszáma | R <sub>2</sub> | R <sub>3</sub> | R <sub>4</sub>                                                            | R <sub>6</sub>     | (R <sub>5</sub> ) <sub>m</sub> | Op. (°C) vagy<br>R <sub>f</sub> -érték szili-<br>kagélen |
|---------------------|----------------|----------------|---------------------------------------------------------------------------|--------------------|--------------------------------|----------------------------------------------------------|
| 1.97.               | F              | Cl             | COOCH <sub>2</sub> Si(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>                      | COOCH <sub>3</sub> | H                              |                                                          |
| 1.98.               | F              | Cl             | COOCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> P(O)(OCH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>   | "                  | H                              |                                                          |
| 1.99.               | F              | Cl             | COOCH(CH <sub>3</sub> )CH <sub>2</sub> Si(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>  | "                  | H                              |                                                          |
| 1.100.              | F              | Cl             | COOCH(C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> )P(O)(OCH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> | "                  | H                              |                                                          |
| 1.101.              | F              | Cl             | COOCH <sub>2</sub> COOC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>                       | "                  | H                              |                                                          |
| 1.102.              | F              | Cl             | COOCH <sub>2</sub> OCOCH <sub>3</sub>                                     | "                  | H                              |                                                          |
| 1.103.              | F              | Cl             | COOCH(CH <sub>3</sub> )OCO-1-piperidil                                    | "                  | H                              |                                                          |
| 1.104.              | F              | Cl             | CON(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>                                        | "                  | H                              |                                                          |
| 1.105.              | F              | Cl             | CON(CH <sub>3</sub> )OCH <sub>3</sub>                                     | "                  | H                              |                                                          |
| 1.106.              | F              | Cl             | CONHSO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>                                       | "                  | H                              |                                                          |
| 1.107.              | F              | Cl             | CONHOCH <sub>2</sub> COOC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>                     | "                  | H                              |                                                          |
| 1.108.              | F              | Cl             | CONHCH <sub>2</sub> COOC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>                      | "                  | H                              |                                                          |
| 1.109.              | F              | Cl             | CHO                                                                       | "                  | H                              |                                                          |
| 1.110.              | F              | Cl             | COOCH <sub>3</sub>                                                        | "                  | H                              |                                                          |
| 1.111.              | F              | Cl             | 4-(C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> OOC)-1,3-dioxolán-<br>2-il               | "                  | H                              |                                                          |
| 1.112.              | F              | Cl             | 2-CH <sub>3</sub> -1,3-dioxolán-2-il                                      | "                  | H                              |                                                          |

A példa sorszáma      R<sub>2</sub>      R<sub>3</sub>      R<sub>4</sub>      R<sub>6</sub>      (R<sub>5</sub>)<sub>m</sub>      Op. (°C) vagy R<sub>f</sub>-érték szilikagélén

|        |   |    |                                                                                      |                    |   |                              |
|--------|---|----|--------------------------------------------------------------------------------------|--------------------|---|------------------------------|
| 1.113. | F | Cl | 4,4-di-CH <sub>3</sub> -(4,5-dihidro-oxazol-2-il)                                    | COOCH <sub>3</sub> | H |                              |
| 1.114. | F | Cl | CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>                                    | "                  | H |                              |
| 1.116. | F | Cl | CH <sub>2</sub> COOC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>                                     | "                  | H |                              |
| 1.117. | F | Cl | CH <sub>2</sub> C(CN)(CH <sub>3</sub> )-COOC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>             | "                  | H |                              |
| 1.118. | F | Cl | CH <sub>2</sub> C-(CH <sub>3</sub> )(COOC <sub>2</sub> H <sub>5</sub> ) <sub>2</sub> | "                  | H |                              |
| 1.119. | F | Cl | CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>                                                     | "                  | H |                              |
| 1.120. | F | Cl | CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> COOC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>                    | "                  | H |                              |
| 1.121. | F | Cl | CH <sub>2</sub> NHCH <sub>2</sub> COOC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>                   | "                  | H |                              |
| 1.122. | F | Cl | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CN                                                   | "                  | H |                              |
| 1.123. | F | Cl | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> COOC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>                     | "                  | H |                              |
| 1.124. | F | Cl | CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> )-COOC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>                | "                  | H |                              |
| 1.125. | F | Cl | CH=CH-CN                                                                             | "                  | H |                              |
| 1.126. | F | Cl | CH=CH-COOC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>                                               | "                  | H |                              |
| 1.127. | F | Cl | CH=C(Br)-COOC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>                                            | "                  | H |                              |
| 1.164. | F | Cl | COOCH <sub>3</sub>                                                                   | "                  | H | 0,47 (etil-acetát:hexán 1:1) |

| A példa<br>sorszáma | R <sub>2</sub> | R <sub>3</sub> | R <sub>4</sub>      | R <sub>6</sub>     | (R <sub>5</sub> ) <sub>m</sub> | Op. (°C) vagy<br>R <sub>f</sub> -érték szili-<br>kagélen |
|---------------------|----------------|----------------|---------------------|--------------------|--------------------------------|----------------------------------------------------------|
| 1.165.              | F              | Cl             | CCl=CH <sub>2</sub> | COOCH <sub>3</sub> | H                              | 150-151                                                  |
| 1.166.              | F              | Cl             | C≡CH                | "                  | H                              | 92-94                                                    |

1. táblázat "B" rész

(Ia) általános képletű karbamidszármazékok

| A példa<br>sorszáma | Ar (2)                                                                        | R <sub>6</sub>     | Op. (°C) vagy<br>R <sub>f</sub> -érték szil-<br>likagélen |
|---------------------|-------------------------------------------------------------------------------|--------------------|-----------------------------------------------------------|
| 1.128.              | 5-F-indan-1-on-6-il                                                           | COOCH <sub>3</sub> | 129°; 0,42 (etil-acetát)                                  |
| 1.129.              | 4-(C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> OCOCH <sub>2</sub> )-7-F-Ar <sub>1</sub> (3) | "                  | 123-125°                                                  |
| 1.130.              | (CH <sub>3</sub> OCH <sub>2</sub> )-7-F-Ar <sub>1</sub>                       | "                  |                                                           |
| 1.131.              | 4-(CNCH <sub>2</sub> )-7-F-Ar <sub>1</sub>                                    | "                  |                                                           |
| 1.132.              | 4-(CH <sub>3</sub> )-7-F-Ar <sub>1</sub>                                      | "                  |                                                           |
| 1.133.              | 4-allil-7-F-Ar <sub>1</sub>                                                   | "                  |                                                           |

| A példa<br>sorszáma | Ar(2)                                                                            | R <sub>6</sub>     | Op. (°C) vagy<br>R <sub>f</sub> -érték szil-<br>likagélen |
|---------------------|----------------------------------------------------------------------------------|--------------------|-----------------------------------------------------------|
| 1.134.              | 4-CH <sub>2</sub> -(tetrahidropiran-4-il)-7-F-Ar <sub>1</sub>                    | COOCH <sub>3</sub> |                                                           |
| 1.135.              | 4-CH <sub>2</sub> -(5,6-dihidro-2H-tiin-3-il)-7-F-Ar <sub>1</sub>                | "                  |                                                           |
| 1.137.              | 4-CH <sub>2</sub> -(2-pirazinil)-7-F-Ar <sub>1</sub>                             | "                  |                                                           |
| 1.138.              | 2,2,5-tri-F-benzo[d]dioxol-6-il                                                  | "                  |                                                           |
| 1.139.              | 4-CH <sub>3</sub> -7-F-benzo[e]-1,3-dioxin-6-il                                  | "                  |                                                           |
| 1.140.              | 4-(2-propinil)-7-F-benzo[b]-1,4-tiazin-3-on-6-il                                 | "                  |                                                           |
| 1.141.              | 4-(2-propinil)-7-F-Ar <sub>1</sub>                                               | "                  |                                                           |
| 1.142.              | 1-(2-propinil)-6-F-Ar <sub>2</sub> (4)                                           | "                  |                                                           |
| 1.143.              | 1-allil-6-F-Ar <sub>2</sub>                                                      | "                  |                                                           |
| 1.144.              | 1-(2-propinil)-6-F-Ar <sub>3</sub> (5)                                           | "                  |                                                           |
| 1.145.              | 1-allil-6-F-Ar <sub>3</sub>                                                      | "                  |                                                           |
| 1.146.              | 1-allil-6-F-kinolin-2(1H)-on-7-il                                                | "                  |                                                           |
| 1.147.              | 3-(2-propinil)-6-F-benzo[d]-1,3-oxazol-2(3H)-on-5-il                             | "                  |                                                           |
| 1.148.              | 4-(1,2-oxazol-3-il-CH <sub>2</sub> )-7-F-Ar <sub>1</sub>                         | "                  |                                                           |
| 1.149.              | 4-(5-CH <sub>3</sub> -1,2,4-oxadiazol-3-il-CH <sub>2</sub> )-7-F-Ar <sub>1</sub> | "                  |                                                           |
| 1.150.              | 3-(1,2-oxazol-3-il-CH <sub>2</sub> )-6-F-Ar <sub>4</sub> (6)                     | "                  |                                                           |

| A példa<br>sorszáma | Ar (2)                                              | R <sub>6</sub>     | Op. (°C) vagy<br>R <sub>f</sub> -érték szil-<br>likagélén |
|---------------------|-----------------------------------------------------|--------------------|-----------------------------------------------------------|
| 1.151.              | 3-(2-piridil-CH <sub>2</sub> )-6-F-Ar <sub>4</sub>  | COOCH <sub>3</sub> |                                                           |
| 1.152.              | 5-F-2,3-dihidrobenzo[b]furán-6-il                   | "                  |                                                           |
| 1.153.              | 5-F-1-CH <sub>3</sub> -indol-6-il                   | "                  |                                                           |
| 1.154.              | 1-(2-propinil)-5-F-benzo[d]pirazol-6-il             | "                  |                                                           |
| 1.155.              | 1-(2-propinil)-5-F-benzo[d]-1,2,3-triazol-6-il      | "                  |                                                           |
| 1.156.              | 1-allil-5-F-1,3-dihidro-indol-2-on-6-il             | "                  |                                                           |
| 1.157.              | 5-F-1,3-dimetil-1,3-dihidro-indol-2-on-6-il         | "                  |                                                           |
| 1.158.              | 5-F-benzo[d]imidazol-2(1H,3H)-on-6-il               | "                  |                                                           |
| 1.159.              | 5-F-1-(2-propinil)-1H-indol-2,3-dion-6-il           | "                  |                                                           |
| 1.160.              | 6-F-kromán-7-il                                     | "                  |                                                           |
| 1.161.              | 6-F-2,3-dihidrobenzo[b]-1,4-dioxin-7-il             | "                  |                                                           |
| 1.162.              | 6-F-1-(2-propinil)-3,4-dihidrokinolin-2(1H)-on-7-il | "                  |                                                           |
| 1.163.              | 7-F-4-izopropil-kromén-2-on-6-il                    | "                  |                                                           |

## 2. Táblázat "A" rész

(I) általános képletű hidantoin származékok [ahol A és R<sub>6</sub> együttesen egy N-C(X) általános képletű csoportot alkotnak, amelynek orientációja olyan, hogy a nitrogénatom az (I) képlet C=O csoportjához kapcsolódik]

| A példa<br>sorszáma | R <sub>2</sub> | R <sub>3</sub> | R <sub>4</sub>                          | X | (R <sub>5</sub> ) <sub>m</sub> | Op. (°C) vagy<br>R <sub>f</sub> -érték szil-<br>likagélén |
|---------------------|----------------|----------------|-----------------------------------------|---|--------------------------------|-----------------------------------------------------------|
| 2.1.                | Cl             | Cl             | OC <sub>3</sub> H <sub>7</sub> -i       | O | H                              | 125-126                                                   |
| 2.2.                | F              | Cl             | OH                                      | O | H                              | 195-196                                                   |
| 2.3.                | F              | Cl             | OC <sub>3</sub> H <sub>7</sub> -i       | O | H                              | 90-92                                                     |
| 2.4.                | F              | Cl             | OC <sub>3</sub> H <sub>7</sub> -i       | S | H                              | 0,44 (hexán:etil-acetát 1:1)                              |
| 2.5.                | F              | Cl             | OCH <sub>3</sub>                        | O | H                              | 130-131                                                   |
| 2.6.                | F              | Cl             | OCH <sub>2</sub> CN                     | O | H                              | 0,25 (hexán:etil acetát 1:2)                              |
| 2.7.                | F              | Cl             | OCH(CH <sub>3</sub> )COOCH <sub>3</sub> | O | H                              | 138-139                                                   |
| 2.8.                | F              | Cl             | Br                                      | O | H                              | 115-116                                                   |
| 2.9.                | F              | Cl             | I                                       | O | H                              | 135                                                       |
| 2.10.               | F              | Cl             | Cl                                      | O | H                              | 116                                                       |
| 2.11.               | F              | Cl             | CN                                      | O | H                              | 191                                                       |

| A példa<br>sorszáma | R <sub>2</sub> | R <sub>3</sub>  | R <sub>4</sub>                                       | X | (R <sub>5</sub> ) <sub>m</sub> | Op. (°C) vagy<br>R <sub>f</sub> -érték szil-<br>likagélén |
|---------------------|----------------|-----------------|------------------------------------------------------|---|--------------------------------|-----------------------------------------------------------|
| 2.12.               | F              | Cl              | OSO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>                     | O | H                              | 143-144                                                   |
| 2.13.               | F              | Cl              | OCH <sub>2</sub> C≡CH                                | O | H                              | 129-131                                                   |
| 2.14.               | F              | Cl              | OC <sub>3</sub> H <sub>7</sub> -n                    | O | H                              | 126                                                       |
| 2.15.               | F              | Cl              | OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>                     | S | H                              | 127                                                       |
| 2.16.               | F              | Cl              | O-ciklopentil                                        | O | H                              | 113                                                       |
| 2.17.               | F              | Cl              | OCOCH <sub>3</sub>                                   | O | H                              | 117-118                                                   |
| 2.18.               | F              | Cl              | OCH <sub>2</sub> CH=CHCH <sub>3</sub>                | O | H                              | 90                                                        |
| 2.19.               | F              | Cl              | OCH(CH <sub>3</sub> )CH=CH <sub>2</sub>              | O | H                              | 0,4 (hexán:etil acetát 1:1)                               |
| 2.20.               | F              | Cl              | OCH <sub>2</sub> C(CH <sub>3</sub> )=CH <sub>2</sub> | O | H                              | 127                                                       |
| 2.21.               | F              | Cl              | OCH <sub>2</sub> CH=C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> | O | H                              |                                                           |
| 2.22.               | F              | Cl              | OCH <sub>2</sub> C(Br)=CH <sub>2</sub>               | O | H                              | 109-110                                                   |
| 2.23.               | F              | Cl              | OCH <sub>2</sub> CH=CH-Br                            | O | H                              | 60-62                                                     |
| 2.24.               | F              | Cl              | OCH <sub>2</sub> CH=CH-COOCH <sub>3</sub>            | O | H                              | 135-136                                                   |
| 2.25.               | F              | CN              | OC <sub>3</sub> H <sub>7</sub> -i                    | O | H                              | 144                                                       |
| 2.26.               | F              | CN              | COOC <sub>4</sub> H <sub>9</sub> -sec                | O | H                              |                                                           |
| 2.27.               | F              | CH <sub>3</sub> | OC <sub>3</sub> H <sub>7</sub> -i                    | O | H                              |                                                           |

| A példa<br>sorszáma | R <sub>2</sub> | R <sub>3</sub> | R <sub>4</sub>                                        | X | (R <sub>5</sub> ) <sub>m</sub>        | Op. (°C) vagy<br>R <sub>f</sub> -érték szil-<br>likagélén |
|---------------------|----------------|----------------|-------------------------------------------------------|---|---------------------------------------|-----------------------------------------------------------|
| 2.28.               | F              | Cl             | CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>                      | O | H                                     |                                                           |
| 2.29.               | F              | Cl             | CH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>       | O | H                                     |                                                           |
| 2.30.               | F              | Cl             | SO <sub>2</sub> C <sub>3</sub> H <sub>7</sub> -i      | O | H                                     | 153                                                       |
| 2.31.               | F              | Cl             | NO <sub>2</sub>                                       | O | H                                     | 108                                                       |
| 2.32.               | F              | Cl             | OC <sub>3</sub> H <sub>7</sub> -i                     | O | 8a-CH <sub>3</sub>                    |                                                           |
| 2.33.               | F              | Cl             | OC <sub>3</sub> H <sub>7</sub> -i                     | O | 5-CH <sub>3</sub>                     |                                                           |
| 2.34.               | F              | Cl             | OC <sub>3</sub> H <sub>7</sub> -i                     | O | 6(7)-CH <sub>3</sub>                  |                                                           |
| 2.35.               | F              | Cl             | OC <sub>3</sub> H <sub>7</sub> -i                     | O | 6(7)-C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>    |                                                           |
| 2.36.               | F              | Cl             | OC <sub>3</sub> H <sub>7</sub> -i                     | O | 6(7)-Cl                               |                                                           |
| 2.37.               | F              | Cl             | OC <sub>3</sub> H <sub>7</sub> -i                     | O | 8-F                                   |                                                           |
| 2.38.               | F              | Cl             | OC <sub>3</sub> H <sub>7</sub> -i                     | O | 5,8-(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>   |                                                           |
| 2.39.               | F              | Cl             | OC <sub>3</sub> H <sub>7</sub> -i                     | O | 5,5,7-(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub> |                                                           |
| 2.40.               | F              | Cl             | OCH(CH <sub>3</sub> )-C≡CH                            | O | H                                     | 0,32 (hexán:etil acetát 1:1)                              |
| 2.41.               | F              | Cl             | OCH(CH <sub>3</sub> )-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | O | H                                     | 0,41 (hexán:diethyléter 1:2)                              |
| 2.42.               | F              | Cl             | OCH <sub>2</sub> -fenil                               | O | H                                     |                                                           |
| 2.43.               | F              | Cl             | OCH(CH <sub>3</sub> )-fenil                           | O | H                                     |                                                           |

| A példa<br>sorszáma | R <sub>2</sub> | R <sub>3</sub> | R <sub>4</sub>                                                            | X | (R <sub>5</sub> ) <sub>m</sub> | Op. (°C) vagy<br>R <sub>f</sub> -érték szil-<br>likagélén |
|---------------------|----------------|----------------|---------------------------------------------------------------------------|---|--------------------------------|-----------------------------------------------------------|
| 2.44.               | F              | Cl             | OC(CH <sub>3</sub> )H-CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>                    | O | H                              |                                                           |
| 2.45.               | F              | Cl             | OCH <sub>2</sub> C(O)CH <sub>3</sub>                                      | O | H                              |                                                           |
| 2.46.               | F              | Cl             | OCH <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub>                                       | O | H                              | 127                                                       |
| 2.47.               | F              | Cl             | OCH <sub>2</sub> CH=CHCl                                                  | O | H                              | 49-51                                                     |
| 2.48.               | F              | Cl             | OCH <sub>2</sub> CH(Cl)=CH <sub>2</sub>                                   | O | H                              | 101-102                                                   |
| 2.49.               | F              | Cl             | OCH <sub>2</sub> -(2,2-diCl-ciklopropil)                                  | O | H                              |                                                           |
| 2.50.               | F              | Cl             | OCH <sub>2</sub> -(2-Cl-ciklopropil)                                      | O | H                              |                                                           |
| 2.51.               | F              | Cl             | OCH <sub>2</sub> -ciklopropil                                             | O | H                              |                                                           |
| 2.52.               | F              | Cl             | OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>         | O | H                              |                                                           |
| 2.53.               | F              | Cl             | OCH <sub>2</sub> -(2-tetrahidrofuril)                                     | O | H                              |                                                           |
| 2.54.               | F              | Cl             | OCH <sub>2</sub> -(2-tetrahidropiránil)                                   | O | H                              |                                                           |
| 2.55.               | F              | Cl             | OCH <sub>2</sub> -(2H-5,6-dihidrotiín-3-il)                               | O | H                              |                                                           |
| 2.56.               | F              | Cl             | OCH <sub>2</sub> -C(=NOCH <sub>3</sub> )-COOC <sub>2</sub> H <sub>5</sub> | O | H                              |                                                           |
| 2.57.               | F              | Cl             | OCH <sub>2</sub> -(1,3-dioxolán-2-il)                                     | O | H                              |                                                           |
| 2.58.               | F              | Cl             | OCH <sub>2</sub> -(1,3-ditiolán-2-il)                                     | O | H                              |                                                           |
| 2.59.               | F              | Cl             | OCH <sub>2</sub> -CO-(1,4-oxazin-4-il)                                    | O | H                              |                                                           |

| A példa<br>sorszáma | R <sub>2</sub> | R <sub>3</sub> | R <sub>4</sub>                                                        | X | (R <sub>5</sub> ) <sub>m</sub> | Op. (°C) vagy<br>R <sub>f</sub> -érték szil-<br>likagélen |
|---------------------|----------------|----------------|-----------------------------------------------------------------------|---|--------------------------------|-----------------------------------------------------------|
| 2.60.               | F              | Cl             | OCH <sub>2</sub> COOC <sub>5</sub> H <sub>11</sub> -n                 | O | H                              |                                                           |
| 2.61.               | F              | Cl             | O-(2-oxo-ciklopentil)                                                 | O | H                              |                                                           |
| 2.62.               | F              | Cl             | OP(O)(OCH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>                                 | O | H                              |                                                           |
| 2.63.               | F              | Cl             | OCH(SCH <sub>3</sub> )-COOCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> Cl          | O | H                              |                                                           |
| 2.64.               | F              | Cl             | OCH <sub>2</sub> P(O)(OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> | O | H                              |                                                           |
| 2.65.               | F              | Cl             | OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>                                      | O | H                              |                                                           |
| 2.66.               | F              | Cl             | OCHF <sub>2</sub>                                                     | O | H                              |                                                           |
| 2.67.               | F              | Cl             | OCH <sub>2</sub> COO(ciklopentil)                                     | O | H                              |                                                           |
| 2.68.               | F              | Cl             | OCH <sub>2</sub> -(1-pirazolil)                                       | O | H                              |                                                           |
| 2.69.               | F              | Cl             | 4-[C <sub>2</sub> H <sub>3</sub> OOC-CH(CH <sub>3</sub> )-O]-fenoxi   | O | H                              |                                                           |
| 2.70.               | F              | Cl             | OCH <sub>2</sub> -(2-tienil)                                          | O | H                              |                                                           |
| 2.71.               | F              | Cl             | OCH(CH <sub>3</sub> )-(3-CH <sub>3</sub> -1,2,4-oxadiazol-5-il)       | O | H                              |                                                           |
| 2.72.               | F              | Cl             | SC <sub>3</sub> H <sub>7</sub> -i                                     | O | H                              | 110-111                                                   |
| 2.73.               | F              | Cl             | SCH <sub>2</sub> C≡CH                                                 | O | H                              |                                                           |
| 2.74.               | F              | Cl             | SCH <sub>2</sub> COOC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>                     | O | H                              |                                                           |
| 2.75.               | F              | Cl             | SCH(CH <sub>3</sub> )-COOC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>                | O | H                              |                                                           |

| A példa<br>sorszáma | R <sub>2</sub> | R <sub>3</sub> | R <sub>4</sub>                                                                                             | X | (R <sub>5</sub> ) <sub>m</sub> | Op. (°C) vagy<br>R <sub>f</sub> -érték szil-<br>likagélén |
|---------------------|----------------|----------------|------------------------------------------------------------------------------------------------------------|---|--------------------------------|-----------------------------------------------------------|
| 2.76.               | F              | Cl             | SCH <sub>2</sub> -fenil                                                                                    | O | H                              |                                                           |
| 2.77.               | F              | Cl             | S-(tetrahydro-2-piranil)                                                                                   | O | H                              |                                                           |
| 2.78.               | F              | Cl             | NCH <sub>2</sub> COOC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>                                                          | O | H                              |                                                           |
| 2.79.               | F              | Cl             | N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>                                                                           | O | H                              |                                                           |
| 2.80.               | F              | Cl             | N-(CH <sub>3</sub> )COOCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>                                                     | O | H                              |                                                           |
| 2.81.               | F              | Cl             | NHCOCH(CH <sub>3</sub> )-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>                                                   | O | H                              |                                                           |
| 2.82.               | F              | Cl             | NHCH(C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> )-P(O)(C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> )(OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub> ) | O | H                              |                                                           |
| 2.83.               | F              | Cl             | COOC <sub>3</sub> H <sub>7</sub> -i                                                                        | O | H                              | 0,38 (hexán-etilacetát 1:1)                               |
| 2.84.               | F              | Cl             | COOCH(CH <sub>2</sub> F) <sub>2</sub>                                                                      | O | H                              |                                                           |
| 2.85.               | F              | Cl             | COOCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>                                                        | O | H                              |                                                           |
| 2.86.               | F              | Cl             | COON=C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>                                                                      | O | H                              |                                                           |
| 2.87.               | F              | Cl             | COOCH <sub>2</sub> F                                                                                       | O | H                              |                                                           |
| 2.88.               | F              | Cl             | COOCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OSi(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>                                      | O | H                              |                                                           |
| 2.89.               | F              | Cl             | COOCH <sub>2</sub> Si(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>                                                       | O | H                              |                                                           |
| 2.90.               | F              | Cl             | COOCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> P(O)(OCH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>                                    | O | H                              |                                                           |
| 2.91.               | F              | Cl             | COOCH(CH <sub>3</sub> )CH <sub>2</sub> Si(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>                                   | O | H                              |                                                           |

| A példa<br>sorszáma | R <sub>2</sub> | R <sub>3</sub> | R <sub>4</sub>                                                            | X | (R <sub>5</sub> ) <sub>m</sub> | Op. (°C) vagy<br>R <sub>f</sub> -érték szil-<br>likagélén |
|---------------------|----------------|----------------|---------------------------------------------------------------------------|---|--------------------------------|-----------------------------------------------------------|
| 2.92.               | F              | Cl             | COOCH(C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> )P(O)(OCH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> | O | H                              |                                                           |
| 2.93.               | F              | Cl             | COOCH <sub>2</sub> COOC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>                       | O | H                              |                                                           |
| 2.94.               | F              | Cl             | COOCH <sub>2</sub> OCOCH <sub>3</sub>                                     | O | H                              |                                                           |
| 2.95.               | F              | Cl             | COOCH(CH <sub>3</sub> )OCO-(1-piperidil)                                  | O | H                              |                                                           |
| 2.96.               | F              | Cl             | CON(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>                                        | O | H                              |                                                           |
| 2.97.               | F              | Cl             | CON(CH <sub>3</sub> )(OCH <sub>3</sub> )                                  | O | H                              |                                                           |
| 2.98.               | F              | Cl             | CONHSO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>                                       | O | H                              |                                                           |
| 2.99.               | F              | Cl             | CONHOCH <sub>2</sub> COOC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>                     | O | H                              |                                                           |
| 2.100.              | F              | Cl             | CONHCH <sub>2</sub> COOC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>                      | O | H                              |                                                           |
| 2.101.              | F              | Cl             | CHO                                                                       | O | H                              |                                                           |
| 2.102.              | F              | Cl             | COCH <sub>3</sub>                                                         | O | H                              |                                                           |
| 2.103.              | F              | Cl             | 4-COOC <sub>2</sub> H <sub>5</sub> -1,3-dioxolán-2-il                     | O | H                              |                                                           |
| 2.104.              | F              | Cl             | 2-CH <sub>3</sub> -1,3-dioxolán-2-il                                      | O | H                              |                                                           |
| 2.106.              | F              | Cl             | CH <sub>3</sub>                                                           | O | H                              |                                                           |
| 2.107.              | F              | Cl             | CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>                         | O | H                              |                                                           |
| 2.108.              | F              | Cl             | CH <sub>2</sub> COOC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>                          | O | H                              |                                                           |

| A példa<br>sorszáma | R <sub>2</sub> | R <sub>3</sub> | R <sub>4</sub>                                                                      | X | (R <sub>5</sub> ) <sub>m</sub> | Op. (°C) vagy<br>R <sub>f</sub> -érték szil-<br>likagélien |
|---------------------|----------------|----------------|-------------------------------------------------------------------------------------|---|--------------------------------|------------------------------------------------------------|
| 2.109.              | F              | Cl             | CH <sub>2</sub> C(CN)(CH <sub>3</sub> )COOC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>             | O | H                              |                                                            |
| 2.110.              | F              | Cl             | CH <sub>2</sub> C(CH <sub>3</sub> )(COOC <sub>2</sub> H <sub>5</sub> ) <sub>2</sub> | O | H                              |                                                            |
| 2.111.              | F              | Cl             | CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>                                                    | O | H                              |                                                            |
| 2.112.              | F              | Cl             | CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> COOC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>                   | O | H                              |                                                            |
| 2.113.              | F              | Cl             | CH <sub>2</sub> NHCH <sub>2</sub> COOC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>                  | O | H                              |                                                            |
| 2.114.              | F              | Cl             | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CN                                                  | O | H                              |                                                            |
| 2.115.              | F              | Cl             | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> COOC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>                    | O | H                              |                                                            |
| 2.116.              | F              | Cl             | CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> )-COOC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>               | O | H                              |                                                            |
| 2.117.              | F              | Cl             | CH=CH-CN                                                                            | O | H                              |                                                            |
| 2.118.              | F              | Cl             | CH=CH-COOC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>                                              | O | H                              |                                                            |
| 2.119.              | F              | Cl             | CH=C(Br)-COOC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>                                           | O | H                              |                                                            |
| 2.156.              | F              | Cl             | C≡CH                                                                                | O | H                              | 133                                                        |
| 2.157.              | F              | Cl             | COOCH <sub>3</sub>                                                                  | O | H                              | 158                                                        |
| 2.158.              | F              | Cl             | CCl=CH <sub>2</sub>                                                                 | O | H                              | 0,29 (etil-acetát:hexán 1:1)                               |

2. Táblázat "B" rész

(Ib) általános képletű hidantoin származékok

| A példa<br>sorszáma | Ar (2)                                                                     | X | Op. (°C) vagy<br>R <sub>f</sub> -érték szil-<br>ikagélén |
|---------------------|----------------------------------------------------------------------------|---|----------------------------------------------------------|
| 2.120.              | 5-F-indán-1-on-6-il                                                        | 0 | 198-199                                                  |
| 2.121.              | 4-(C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> OOC-CH <sub>2</sub> )-7-F-Ar <sub>1</sub> | 0 | 138-139                                                  |
| 2.122.              | 4-(CH <sub>3</sub> OCH <sub>2</sub> )-7-F-Ar <sub>1</sub>                  | 0 |                                                          |
| 2.123.              | 4-(CHCH <sub>2</sub> )-7-F-Ar <sub>1</sub>                                 | 0 |                                                          |
| 2.124.              | 4-CH <sub>3</sub> -7-F-Ar <sub>1</sub>                                     | 0 |                                                          |
| 2.125.              | 4-allil-7-F-Ar <sub>1</sub>                                                | 0 |                                                          |
| 2.126.              | 4-CH <sub>2</sub> -(tetrahydropirán-4-il)-7-F-Ar <sub>1</sub>              | 0 |                                                          |
| 2.127.              | 4-CH <sub>2</sub> -(5,6-dihidro-2-H-tiin-3-il)                             | 0 |                                                          |
| 2.128.              | 4-CH <sub>2</sub> -(2-piridil)-7-F-Ar <sub>1</sub>                         | 0 |                                                          |
| 2.129.              | 4-(pirazin-2-il-metil)-7-F-Ar <sub>1</sub>                                 | 0 |                                                          |
| 2.130.              | 2,2,5-tri-F-benzo[d]-dioxol-6-il                                           | 0 |                                                          |
| 2.131.              | 4-CH <sub>3</sub> -7-F-benzo[e]-1,3-dioxin-6-il                            | 0 |                                                          |
| 2.132.              | 4-(2-propinil)-7-F-benzo[b]-1,4-tiazin-3-on-6-il                           | 0 |                                                          |
| 2.133.              | 4-(2-propinil)-7-F-Ar <sub>1</sub>                                         | 0 |                                                          |

| A példa<br>sorszáma | Ar(2)                                                                            | X | Op. (°C) vagy<br>R <sub>f</sub> -érték szilika-<br>gélén |
|---------------------|----------------------------------------------------------------------------------|---|----------------------------------------------------------|
| 2.134.              | 1-(2-propinil)-6-F-Ar <sub>2</sub>                                               | O |                                                          |
| 2.135.              | 1-allil-6-F-Ar <sub>2</sub>                                                      | O |                                                          |
| 2.136.              | 1-(2-propinil)-6-F-Ar <sub>3</sub>                                               | O |                                                          |
| 2.137.              | 1-allil-6-F-Ar <sub>3</sub>                                                      | O |                                                          |
| 2.138.              | 1-allil-6-F-kinolin-2(1H)-on-7-il                                                | O |                                                          |
| 2.139.              | 3-(2-propinil)-6-F-benzo[d]-1,3-oxazol-2(3H)-on-5-il                             | O |                                                          |
| 2.140.              | 4-(1,2-oxazol-3-il-CH <sub>2</sub> )-7-F-Ar <sub>1</sub>                         | O |                                                          |
| 2.141.              | 4-(5-CH <sub>3</sub> -1,2,4-oxadiazol-3-il-CH <sub>2</sub> )-7-F-Ar <sub>1</sub> | O |                                                          |
| 2.142.              | 3-(1,2-oxazol-3-il-CH <sub>2</sub> )-6-F-Ar <sub>4</sub>                         | O |                                                          |
| 2.143.              | 3-(2-piridil-CH <sub>2</sub> )-6-F-Ar <sub>4</sub>                               | O |                                                          |
| 2.144.              | 5-F-2,3-dihidrobenzo[b]furán-6-il                                                | O |                                                          |
| 2.145.              | 5-F-1-CH <sub>3</sub> -indol-6-il                                                | O |                                                          |
| 2.146.              | 1-(2-propinil)-5-F-benzo[d]pirazol-6-il                                          | O |                                                          |
| 2.147.              | 1-(2-propinil)-5-F-benzo[d]-1,2,3-triazol-6-il                                   | O |                                                          |
| 2.148.              | 1-allil-5-F-1,3-dihidro-indol-2-on-6-il                                          | O |                                                          |
| 2.149.              | 5-F-1,3-dimetil-1,3-dihidro-indol-2-on-6-il                                      | O |                                                          |

| A példa<br>sorszáma | Ar(2)                                               | X | Op. (°C) vagy<br>R <sub>f</sub> -érték szil-<br>ikagélien |
|---------------------|-----------------------------------------------------|---|-----------------------------------------------------------|
| 2.150.              | 5-F-benzo[d]imidazol-2(1H,3H)-on-6-il               | 0 |                                                           |
| 2.151.              | 5-F-1-(2-propinil)-1H-indol-2,3-dion-6-il           | 0 |                                                           |
| 2.152.              | 6-F-kromán-7-il                                     | 0 |                                                           |
| 2.153.              | 6-F-2,3-dihidrobzeno[b]-1,4-dioxin-7-il             | 0 |                                                           |
| 2.154.              | 6-F-1-(2-propinil)-3,4-dihidrokinolin-2(1H)-on-7-il | 0 |                                                           |
| 2.155.              | 7-F-izopropil-kromén-2-on-6-il                      | 0 |                                                           |

-43-

A táblázatokban használt rövidítések:

- (1) A 4- és 5-szubsztituált izomer keveréke
- (2) Ar = 2-R<sub>2</sub>-4-R<sub>3</sub>-5-R<sub>4</sub>-fenil
- (3) Ar<sub>1</sub> = 2,4-dihidrobzeno[b]-1,4-oxazin-3-on-6-il
- (4) Ar<sub>2</sub> = 3,4-dihidro-2H-kinoxalin-2-on-7-il
- (5) Ar<sub>3</sub> = 1H-kinoxalin-2-on-7-il
- (6) Ar<sub>4</sub> = benzo[d]-1,3-tiazol-2(3H)-on-5-il
- (7) számozási konvenció az (A) és (B) képlet szerint.

0000

### A biológiai hatás vizsgálata

A találmány szerinti vegyületek herbicid hatását különböző gyomokon, a vegyületek kikelés előtt és kikelés után kifejtett gyomirtó hatásával igazoltuk. E kísérleteink során az *Abutilon theophrasti*, *Amaranthus retroflexus*, *Sinapis alba*, *Solanum nigrum*, *Bromus tectorum*, *Setaria viridis*, *Avena fatua* és *Echinochloa crus-galli* gyomnövényeket alkalmaztuk.

A kikelés előtti hatás vizsgálata során kisméretű melegházi műanyagcserepeket száraz talajjal töltöttünk meg, és abba különböző gyomnövények magvait vetettük. A vetés után 24 órával - vagy ennél hamarabb - a cserepeket addig permeteztük vízzel, amíg a talaj át nem nedvesedett, majd a vizsgálandó vegyületeket - emulgeálószeret tartalmazó acetonos oldatokból készített vizes emulziók formájában - meghatározott koncentrációkban permeteztük a talaj felszínére. Permetezés után a talajt tartalmazó edényeket melegházban helyeztük el, megfelelő hőmérsékletet biztosítottunk, és naponta vagy még gyakrabban öntöztük azokat. A növényeket 14-21 napig tartottuk ilyen körülmények között; ennek befejeződése után kiértékeljük a növények állapotát és károsodásuk mértékét.

A kikelés utáni hatás vizsgálata során a vizsgálandó vegyületeket vizes emulziókká alakítottuk, és különböző gyomnövények előre meghatározott méretet elért levélzetére permeteztük. Permetezés után a növényeket melegházba he-

lyeztük, és naponta vagy még gyakrabban öntöztük. A kezelt növények levélzetére nem juttattunk vizet. A növények károsodásának súlyosságát a kezelés után 21 nappal határoztuk meg és értékeltük.

A találmány szerinti vegyületek általában kedvező hatást mutatnak a fentebb említett legtöbb gyomnövényfajta ellen; különösen hatásosak - mind kikelés előtti, mind kikelés utáni vizsgálat során - az *Abutilon theophrasti*, *Amaranthus retroflexus* és *Solanum nigrum* ellen.

## Szabadalmi igénypontok

1. Herbicid készítmény, azzal j e l l e m e z v e,  
hogy hatóanyagként legalább egy (I) általános képletű ve-  
gyületet tartalmaz - ahol

R<sub>2</sub> hidrogén- vagy halogénatomot jelent;

R<sub>3</sub> jelentése halogénatom, cianocsoport vagy 1-4 széna-  
tomos alkilcsoport;

R<sub>4</sub> jelentése hidrogén- vagy halogénatom; nitro-, amino-  
vagy cianocsoport; adott esetben cianocsoporttal  
szubsztituált 1-8 szénatomos alkilcsoport; adott e-  
setben cianocsoporttal szubsztituált 2-8 szénatomos  
alkenilcsoport; 2-5 szénatomos alkoxi-karbonil-(1-4  
szénatomos alkil)-csoport, amelyben az alkilcsoport-  
nak az alkoxi-karbonil-csoporthoz képest alfa-hely-  
zetű szénatomja egy további 2-5 szénatomos alkoxi-  
karbonil-csoporttal vagy cianocsoporttal szubsztitu-  
álva lehet; 2-5 szénatomos alkoxi-karbonil-(1-4 szén-  
atomos alkoxi)-(1-4 szénatomos alkil)-csoport; 2-5  
szénatomos alkoxi-karbonil-oxi-csoport; 2-5 szénato-  
mos alkoxi-karbonil-(2-5 szénatomos alkenil)-oxi-  
csoport; 2-5 szénatomos alkinil-oxi-csoport; 3-6  
szénatomos cikloalkil-oxi-csoport; adott esetben ha-  
logénatommal szubsztituált 2-5 szénatomos alkenil-oxi-  
csoport; 2-5 szénatomos alkoxi-karbonil-(2-5 szénato-  
mos alkenil)-csoport, amelyben az alkenilcsoport adott  
esetben halogénatommal szubsztituálva lehet; 1-4 szén-

atomos alkil-tio-(1-4 szénatomos alkil)-csoport; 1-4 szénatomos alkil-szulfonil-(1-4 szénatomos alkil)-csoport; 1-4 szénatomos alkil-szulfonil-csoport; 1-4 szénatomos alkil-szulfonil-oxi-csoport; (1-4 szénatomos alkoxi)-(1-4 szénatomos alkoxi)-csoport; O-(1-4 szénatomos alkilén)<sub>n</sub>R<sub>7</sub> általános képletű csoport; S-(1-4 szénatomos alkilén)<sub>n</sub>R<sub>7</sub> általános képletű csoport; OCH(SR<sub>8</sub>)COOR<sub>9</sub> általános képletű csoport; NR<sub>10</sub>R<sub>11</sub>, COOR<sub>12</sub>, C(O)NR<sub>13</sub>R<sub>13'</sub>, C(O)R<sub>14</sub> általános képletű csoport; vagy R<sub>15</sub>; vagy

R<sub>3</sub> és R<sub>4</sub> a benzolgyűrűvel együtt, amelyhez kapcsolódnak, egy 9-10-tagú biciklusos csoportot is alkothatnak, amelynek 1-3 gyűrűtagja adott esetben oxigén-, nitrogén- vagy kénatom lehet, és amely adott esetben egy vagy több 2-8 szénatomos alkinilcsoporttal, halogénatommal, oxocsoporttal, (1-4 szénatomos alkilén)-R<sub>16</sub> általános képletű csoporttal, 2-8 szénatomos alkenilcsoporttal, és adott esetben önmagában is (2-5 szénatomos alkoxi)-karbonil-csoporttal, 1-4 szénatomos alkoxicssoporttal vagy cianocsoporttal helyettesített 1-8 szénatomos alkilcsoporttal szubsztituálva lehet;

R<sub>5</sub> jelentése hidrogén- vagy halogénatom; 1-4 szénatomos alkilcsoport; vagy 2-4 szénatomos alkenilcsoport;

R<sub>6</sub> jelentése COOH, COOW, COOSW, COON=CWW', CONHSO<sub>2</sub>W, CONHOCH<sub>2</sub>COOW, COOCH<sub>2</sub>OCOW, COOCHWOCOW' vagy CONHOCH<sub>2</sub>COOH általános képletű csoport;

A jelentése NH csoport; vagy

- A és  $R_6$  együttesen egy  $N-C(X)$  általános képletű csoportot is alkothatnak, amelynek orientációja olyan, hogy a nitrogénatom az (I) általános képlet  $C=O$  csoportjához kapcsolódik;
- $R_7$  jelentése hidrogénatom; 1-4 szénatomos alkil-, 2-5 szénatomos alkenil-, 2-5 szénatomos alkinil- vagy 3-8 szénatomos cikloalkilcsoport, és ezek a szénhidrogén-csoportok szubsztituálatlanok, vagy egy vagy több halogénatommal vagy cianocsoporttal szubsztituáltak lehetnek; ciklopentanoil-csoport; adott esetben 0-(1-4 szénatomos alkilén)- $COOR_8$  általános képletű csoporttal szubsztituált fenilcsoport; 2-5 szénatomos alkanoilcsoport; 2-5 szénatomos alkoxi-karbonil-csoport, amelyben az alkoxics csoport adott esetben 1-4 szénatomos alkiltio-csoporttal szubsztituálva lehet;  $C(O)NR_8R_8$ ,  $C(=NOR_8)COOR_8$ ,  $P(O)(OR_8)OR_8$ , általános képletű csoport;  $R_{15}$ ;  $C(O)R_{15}$  általános képletű csoport; vagy ciklopentoxi-karbonil-csoport;
- $R_8$  és  $R_8'$  jelentése egymástól függetlenül 1-4 szénatomos alkilcsoport;
- $R_9$  jelentése adott esetben egy vagy több halogénatommal szubsztituált 1-4 szénatomos alkilcsoport;
- $R_{10}$  jelentése hidrogénatom vagy 1-4 szénatomos alkilcsoport;
- $R_{11}$  jelentése hidrogénatom; adott esetben  $P(O)(OR_8)R_8'$  általános képletű csoporttal szubsztituált 1-4 szén-

atomos alkilcsoport; 2-5 szénatomos alkanoilcsoport;  
2-5 szénatomos alkoxi-karbonil-csoport; vagy 2-5  
szénatomos alkoxi-karbonil-(1-4 szénatomos alkil)-  
csoport;

$R_{12}$  jelentése  $N=(2-8 \text{ szénatomos alkilidén})$ -csoport; vagy  
adott esetben egy vagy több halogénatommal, 1-4  
szénatomos alkoxicsoporttal, tri(1-4 szénatomos al-  
kil)-szilil-oxi-csoporttal, tri(1-4 szénatomos al-  
kil)-szilil-csoporttal, 2-5 szénatomos alkoxi-karbo-  
nil-csoporttal,  $P(O)(OR_8)OR_8'$  általános képletű  
csoporttal, 2-5 szénatomos alkanoil-oxi-csoporttal  
vagy di(1-4 szénatomos alkil)-amino-karbonil-oxi-  
csoporttal szubsztituált 1-4 szénatomos alkilcso-  
port, és a di(1-4 szénatomos alkil)-amino-karbonil-  
oxi-csoportban lévő két alkilcsoport a nitrogénnel  
együtt egy öt- vagy hattagú telített heterociklusos  
csoportot is alkothat, amely adott esetben egy to-  
vábbi heteroatomként oxigén-, kén- vagy nitrogénato-  
mot is tartalmazhat, és ebben a gyűrűs csoportban a  
gyűrű telítettségi fokától függően bármelyik további  
nitrogénatom hidrogénatomot vagy 1-4 szénatomos al-  
kilcsoportot hordozhat;

$R_{13}$  hidrogénatomot vagy 1-4 szénatomos alkilcsoportot  
jelent; és

$R_{13}'$  jelentése hidrogénatom; 1-4 szénatomos alkilcso-  
port; 1-4 szénatomos alkoxicsoport; fenilcsoport;  
formilcsoport; 2-5 szénatomos alkanoilcsoport; 1-4  
szénatomos alkil-szulfonil-csoport; 2-5 szénatomos

alkoxi-karbonil-(1-4 szénatomos alkil)-csoport; vagy  
2-5 szénatomos alkoxi-karbonil-(1-4 szénatomos alko-  
xi)-csoport; vagy

R<sub>13</sub> és R<sub>13</sub>' azzal a nitrogénatommal együtt, amelyhez  
kapcsolódnak, egy öt- vagy hattagú heterociklusos  
csoportot is alkothat, amely adott esetben egy vagy  
két további heteroatomként oxigén-, kén- vagy nitro-  
génatomot tartalmazhat, és ebben a gyűrűs csoportban  
a gyűrű telítettségi fokától függően bármelyik to-  
vábbi nitrogénatom hidrogénatomot vagy 1-4 szénato-  
mos alkilcsoportot hordozhat;

R<sub>14</sub> hidrogénatomot vagy 1-4 szénatomos alkilcsoportot  
jelent;

R<sub>15</sub> jelentése öt- vagy hattagú heterociklusos csoport,  
amelynek 1-3 gyűrűtagja oxigén-, kén- vagy nitrogén-  
atom, és ez a gyűrűs csoport adott esetben egy vagy  
több 1-4 szénatomos alkilcsoporttal vagy 2-5 széna-  
tomos alkoxi-karbonil-csoporttal szubsztituálva le-  
het;

R<sub>16</sub> jelentése tetrahidropiránil-, 5,6-dihidro-2H-tii-  
nil-, piridil-, pirazinil-, oxazolil- vagy oxadiazol-  
lilcsoport, és mindezek a csoportok adott esetben 1-  
4 szénatomos alkilcsoporttal szubsztituálva lehet-  
nek;

W és W' jelentése egymástól függetlenül 1-8 szénatomos  
alkil-, 2-8 szénatomos alkenil-, 2-8 szénatomos al-  
kinilcsoport vagy fenilcsoport, és mindezek a csopor-  
tok adott esetben cianocsoporttal, 1-4 szénatomos

alkoxicsoporttal vagy egy vagy több halogénatommal szubsztituálva lehetnek;

n értéke 0 vagy 1; és

m értéke 0, 1, 2, 3 vagy 4 -

adott esetben további herbicid, antidotum, fungicid vagy inszekticid hatású anyaggal (anyagokkal) kombinálva, mezőgazdasági szempontból alkalmas hígítószerrel, segédanyagokkal, adott esetben felületaktív szerrel összekeverve.

2. Eljárás az 1. igénypont szerinti herbicid készítmény olyan (I) általános képletű hatóanyagainak az előállítására, ahol  $R_2$ ,  $R_3$ ,  $R_4$ ,  $R_5$ ,  $R_6$  és m jelentése az 1. igénypontban meghatározott, és A NH csoportot jelent, azzal j e l l e m e z v e, hogy egy (II) általános képletű vegyületet - amelyben  $R_2$ ,  $R_3$  és  $R_4$  jelentése az 1. igénypontban meghatározott - egy (III) általános képletű vegyülettel reagáltatunk, ahol  $R_5$  és  $R_6$  jelentése az 1. igénypontban meghatározott.

3. Eljárás az 1. igénypont szerinti herbicid készítmény olyan (I) általános képletű hatóanyagainak az előállítására, ahol  $R_2$ ,  $R_3$ ,  $R_4$ ,  $R_5$  és m jelentése az 1. igénypontban meghatározott, és A, valamint  $R_6$  együttesen N-C(X) általános képletű csoportot alkotnak, azzal j e l l e m e z v e, hogy

a) olyan (I) általános képletű vegyületek előállítására, ahol X oxigénatomot jelent, egy (O) általános képletű vegyületben - amelyben A jelentése NH csoport, és  $R_6$  jelentése COOH, COOW, COOSW, COON=CWW', CONHSO<sub>2</sub>W, CONHOCH<sub>2</sub>COOW, COOCH<sub>2</sub>OCOW,

COOCHWOCOW' vagy CONHOCH<sub>2</sub>COOH általános képletű csoport, ahol W és W' jelentése az 1. igénypontban meghatározott - az amid- és észtercsoport között kondenzációs reakciót hajtunk végre; vagy

- b) olyan (I) általános képletű vegyületek előállítására, ahol X oxigén- vagy kénatomot jelent, egy (IIa) általános képletű vegyületet - amelyben R<sub>2</sub>, R<sub>3</sub> és R<sub>4</sub> jelentése az 1. igénypontban meghatározott, és X oxigén- vagy kénatomot jelent - egy (IIIa) általános képletű vegyülettel reagáltatunk, ahol R<sub>5</sub> és m jelentése az 1. igénypontban meghatározott.

4. Az (I) általános képletű vegyületek, ahol R<sub>2</sub>, R<sub>3</sub>, R<sub>4</sub>, R<sub>5</sub>, R<sub>6</sub> és m jelentése az 1. igénypontban meghatározott.

5. A 4. igénypont szerinti (I) általános képletű vegyületek, ahol A jelentése N-C(O) képletű csoport.

6. A 4. vagy 5. igénypont szerinti (I) általános képletű vegyületek, ahol R<sub>2</sub> klór- vagy fluoratomot, R<sub>3</sub> klóratomot vagy cianocsoportot, és R<sub>5</sub> hidrogén- vagy halogénatomot jelent.

7. A 4-6. igénypontok bármelyike szerinti (I) általános képletű vegyületek, ahol R<sub>4</sub> jelentése hidrogénatom; adott esetben cianocsoporttal szubsztituált 1-5 szénatomos alkoxics csoport; hidroxilcsoport; (1-4 szénatomos alkoxi)-karbonil-(1-4 szénatomos alkoxi)-csoport; halogénatom; cianocsoport; 1-4 szénatomos alkil-szulfonil-oxi-csoport; 2-5 szénatomos alkinil-oxi-csoport; 3-6 szénatomos cikloalkil-oxi-csoport; 2-5 szénatomos alkoxi-karbonil-oxi-csoport; a-

dott esetben halogénatommal szubsztituált 2-5 szénatomos alkenil-oxi-csoport; 2-5 szénatomos alkenil-oxi-csoport; 1-4 szénatomos alkil-szulfonil-csoport; nitrocsoport; 1-4 szénatomos alkiltio-csoport; 2-5 szénatomos alkoxi-karbonil-csoport; vagy  $R_3$  és  $R_4$  a benzolgyűrűvel együtt 5-fluor-indán-1-on-6-il- vagy 4-( $C_2H_5OCOCH_2$ )-7-fluor-2,4-dihidrobenzo[b]-1,4-oxazin-3-on-6-il-csoportot is alkothat.

8. A 7. igénypont szerinti (I) általános képletű vegyületek, ahol  $R_2$  fluoratomot,  $R_3$  klóratomot és  $R_4$  1-4 szénatomos alkoxi-, 2-5 szénatomos alkinil-oxi-, 2-5 szénatomos alkenil-oxi- vagy 2-5 szénatomos alkoxi-karbonil-csoportot jelent.

9. A 4. igénypont szerinti (I) általános képletű vegyületek, ahol A jelentése NH csoport.

10. A 9. igénypont szerinti (I) általános képletű vegyületek, ahol  $R_2$  fluoratomot,  $R_3$  klóratomot,  $R_5$  hidrogén- vagy halogénatomot és  $R_6$  2-8 szénatomos alkoxi-karbonil-csoportot jelent.

11. A 10. igénypont szerinti (I) általános képletű vegyületek, ahol  $R_4$  jelentése 1-4 szénatomos alkoxics csoport; 2-5 szénatomos alkoxi-karbonil-csoport; 2-5 szénatomos alkoxi-karbonil-oxi-csoport; 1-4 szénatomos alkil-szulfonil-oxi-csoport; hidrogén- vagy halogénatom; cianocsoport; 2-5 szénatomos alkinil-oxi-csoport; 3-6 szénatomos cikloalkil-oxi-csoport; nitrocsoport; 1-5 szénatomos alkil-tio-csoport; vagy  $R_3$  és  $R_4$  benzolgyűrűvel együtt 5-fluor-indán-1-on-6-il- vagy 4-( $C_2H_5OCOCH_2$ )-7-fluor-2,4-dihidrobenzo[b]-1,4-oxazin-3-on-6-il-csoportot is alkothat.

12. A 11. igénypont szerinti (I) általános képletű vegyületek, ahol  $R_2$  fluoratomot,  $R_3$  klóratomot,  $R_4$  2-5 szénatomos alkoxi- vagy 1-4 szénatomos alkinil-oxi-csoportot jelent,  $R_5$  jelentése hidrogén- vagy fluoratom, és  $R_6$  jelentése 2-5 szénatomos alkoxi-karbonil-csoport.

13. Módszer gyomnövények leküzdésére, azzal j e l - l e m e z v e, hogy a gyomnövényekre vagy leendő helyükre a 4-12. igénypontok bármelyike szerinti (I) általános képletű vegyület herbicid hatás szempontjából hatásos mennyiségét juttatjuk ki.

+ 1 rajz



A kérelem lezárta  
a vizsgálati eljárást

DANUBIA  
Szabadalmi és Védjegy Iroda Kft.  
2.

