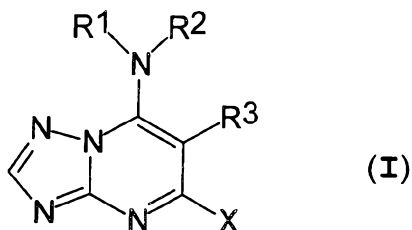


KIVONAT

7-Amino-triazolopirimidinek káros gombák leküzdésére

A találmány tárgyát az



általános képletű 7-amino-triazolopirimidinek — ahol

R^1 és R^2 hidrogénatom, alkil-, alkenil-, alkinil-, cikloalkil-, fenil-, naftil- vagy 5- vagy 6-tagú heterociklil- vagy heteroaril-csoport, amelyek részben vagy teljesen halogénezettek és/vagy egyszer-háromszor szubsztituáltak lehetnek; vagy R^1 és R^2 a közöttük levő nitrogénatommal együtt egy 5- vagy 6-tagú, adott esetben egy-háromszor szubsztituált gyűrűt képeznek; R^3 alkil-, alkenil-, alkinil-, cikloalkil- vagy fenil-alkilcsoport, amelyek részben vagy teljesen halogénezettek és/vagy egy-háromszor szubsztituáltak lehetnek; X halogénatom, ciano-, alkoxi-, halogén-alkil-, adott esetben szubsztituált fenilcsoport —

és sóik, az előállításukra szolgáló eljárás, valamint ezeket hatóanyagként tartalmazó készítmények és káros gombák leküzdésére való alkalmazásuk képezik.

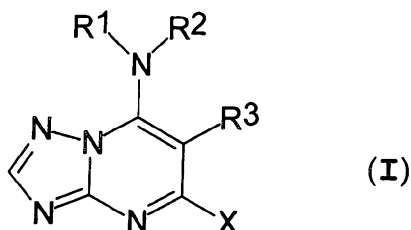
S. B. G. & K.
Szabadalmi Ügyvivői Iroda
H-1062 Budapest, Andrassy út 113.
Telefon: 461-1000, Fax: 461-1099

12

7-Amino-triazolopirimidinek (káros gombák leküzdésére)

előállítás, alkalmazás és a káros gombák leküzdésére

A találmány tárgyát az



általános képletű 7-amino-triazolopirimidinek — amely képletben

R^1 és R^2 jelentése hidrogénatom, 1-10 szénatomos alkil-, 2-10 szénatomos alkenil-, 2-10 szénatomos alkinil-, 3-8 szénatomos cikloalkil-, fenil-, naftilcsoport; vagy

heteroatomként egy-négy nitrogénatomot vagy egy-három nitrogénatomot és egy kén- vagy oxigénatomot tartalmazó 5 vagy 6 tagú heterociklilcsoport; vagy

heteroatomként egy-négy nitrogénatomot vagy egy-három nitrogénatomot és egy kén- vagy oxigénatomot tartalmazó 5 vagy 6 tagú heteroarilcsoport,

ahol ha R^1 és R^2 jelentése a hidrogénatomtól eltérő, úgy ezek egymástól függetlenül részben vagy teljesen halogénezettek és/vagy egy-három R^a csoporttal szubsztituáltak lehetnek, ahol

R^a jelentése ciano-, nitro-, hidroxil-, 1-6 szénatomos alkil-, 1-6 szénatomos halogén-alkil-, 3-6 szénatomos cikloalkil-, 1-6 szénatomos alkoxi-, 1-6 szénatomos halogén-alkoxi-, 1-6 szénatomos alkil-tio-, 1-6 szénatomos alkil-amino-, alkil-részenként 1-6 szénatomos dialkil-amino-, 2-6 szénatomos alkenil-, 2-6 szénatomos alkenil-oxi-, 2-6 szénatomos alkinil-, 3-6 szénatomos alkinil-oxi- és adott esetben halogén-



nezett 1-4 szénatomos oxi-alkilén-oxicsoport; vagy

R^1 és R^2 a közöttük levő nitrogénatommal együtt egy olyan 5 vagy 6 tagú gyűrűt képez, amely heteroatomként egy-négy nitrogénatomot vagy egy-három nitrogénatomot és egy kén- vagy oxigénatomot tartalmaz, és amelyet egy-három R^a csoport szubsztituálhat;

R^3 jelentése 1-10 szénatomos alkil-, 2-10 szénatomos alkenil-, 2-10 szénatomos alkinil-, 3-8 szénatomos cikloalkil- vagy az alkilrészben 1-10 szénatomos fenil-alkilcsoport, amelyek szubsztituálatlanok vagy részben vagy teljesen halogénezettek és/vagy egy-három R^a csoporttal szubsztituáltak lehetnek; vagy 1-10 szénatomos halogén-alkilcsoport, amelyet egy-három R^a csoport szubsztituálhat;

X jelentése halogénatom, ciano-, 1-4 szénatomos alkoxi-, 1-4 szénatomos halogén-alkil-, fenil- vagy R^a csoporttal szubsztituált fenilcsoport —

és sóik képezik.

A találmány tárgyát képezi még eljárás és köztitermékek az (I) általános képletű vegyületek előállítására, valamint az (I) általános képletű vegyületeket hatóanyagként tartalmazó készítmények és alkalmazásuk káros gombák leküzdésére.

A 6-aril-triazolopirimidineket a WO 98/46608 és az EP-A 550 113 számú szabadalmi iratok ismertetik. Gyógyászatiilag hatásos, speciális aromás csoportokkal szubsztituált 6-benzil-triazolopirimidinek az US 5,231,094 és az US 5,387,747 számú szabadalmi iratokból ismertek. Az EP-A 141 317 számú szabadalmi irat olyan 7-amino-triazolopirimidineket közöl, amelyeket 5-helyzetben egy alkil-

csoport szubsztituálhat. Az 5-helyzetben másfajta szubsztituenst hordozó 6-cikloalkil-triazolopirimidinekről pedig az EP-A 613 900 számú szabadalmi irat tudósít.

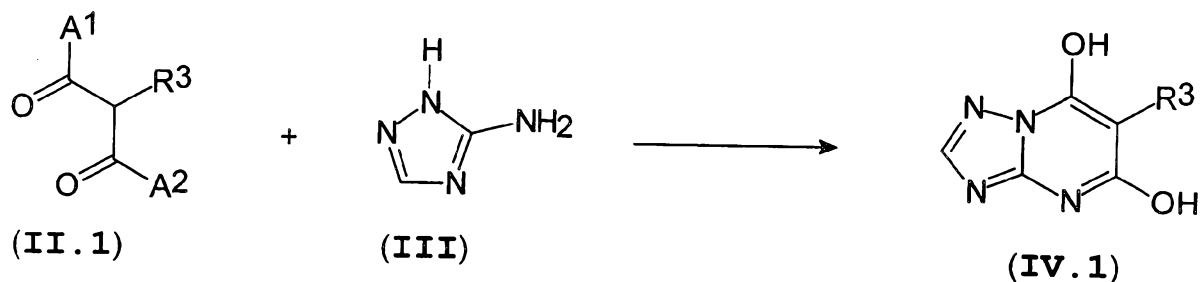
A WO 98/46608, EP-A 550 113, EP-A 141 317 és az EP-A 613 900 számú szabadalmi iratokban leírt vegyületek növényvédőszerekként alkalmasak a káros gombák leküzdésére.

Ezek hatása azonban sok esetben nem kielégítő. Ezért a találmány célja az volt, hogy jobb hatású vegyületeket találjunk.

Ennek megfelelően találtuk az (I) általános képletű 7-amino-triazolopirimidineket. Továbbá eljárást és köztitermékeket találtunk az (I) általános képletű vegyületek előállítására, valamint az (I) általános képletű vegyületek alkalmazását és az ezeket a vegyületeket hatóanyagként tartalmazó készítményeket a káros gombák leküzdésére.

Az (I) általános képletű vegyületek a fentiekben megnevezett szakirodalmi forrásokból ismert vegyületektől a triazolopirimidin-vázon az X és az R³ szubsztituensek kombinációjában különböznek.

Az olyan (I) általános képletű vegyületeket, amelyek képletében X halogénatomot jelent, például a (II.1) általános képletű dikarbonil-vegyületekből nyerjük, amelyeket a (III) képletű 3-amino-1,2,4-triazollal reagáltatva gyűrűzárási reakcióban nyerjük a megfelelő (IV.1) általános képletű hidrox-triazolopirimidineket, az alábbi reakcióvázlatnak megfelelően:



Ezt a reakciót szokásosan 25 °C-tól 210 °C-ig, előnyösen 120 °C-tól 180 °C-ig terjedő hőmérsékleten, bázis jelenlétében hajtjuk végre (lásd az EP-A 770 615 számú szabadalmi iratot).

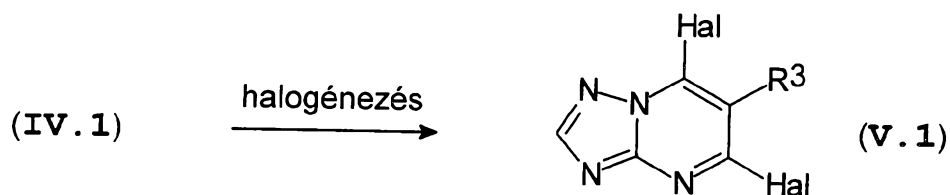
Bázisként szerepelhetnek általában a szerves bázisok, például a tercier aminok, így a trimetil-amin, trietil-amin, N-etil-diizopropil-amin, tributil-amin, N-metil-piperidin és a piri-din. Különösen előnyös a trietil-amin és a tributil-amin.

A bázisokat általában katalitikus mennyiségben alkalmazzuk, ezeket azonban ekvimoláris mennyiségben, feleslegben vagy adott esetben akár oldószerként is alkalmazhatjuk.

A kiindulási vegyületeket általában ekvimoláris mennyiségben reagáltatjuk egymással, azonban a kitermelés szempontjából elő-nyös lehet a (II.1) általános képletű vegyületet, a (III) képle-tű vegyületre vonatkoztatva feleslegben alkalmazni.

Az (I) általános képletű vegyületek előállításához szükséges kiindulási vegyületek a szakirodalomból ismertek vagy ezeket az idézett szakirodalmi források szerint állíthatjuk elő [lásd Heterocycl. 1996, 1031-1047; Tetrahedron Letters 24, 2661-2668 (1966)] vagy pedig ezek a kereskedelmi forgalomban kaphatók.

Végül a (IV.1) általános képletű hidroxitriazolopirimidineket egy halogénezőszerezrel a megfelelő (V.1) általános képletű halogén-triazolopirimidinekké alakítjuk át, az alábbi reakció-vázlatnak megfelelően:



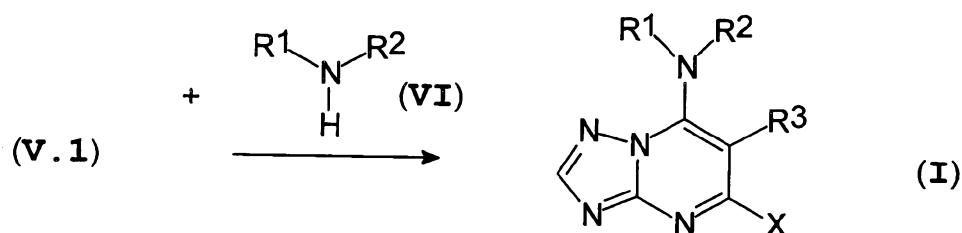
Ezt a reakciót szokásosan 0 °C-tól 150 °C-ig, előnyösen 80 °C-tól 125 °C-ig terjedő hőmérsékleten, egy közömbös szerves oldószerben vagy akár oldószer nélkül hajtjuk végre (lásd az EP-A 770 615 számú szabadalmi iratot).

Alkalmas halogénezőszerek előnyösen a brómozó- vagy a klórozószerek, így például a foszforil-tribromid vagy a foszforil-triklorid, egy oldószer jelen- vagy távollétében.

Alkalmas oldószer az alifás szénhidrogének, így a pentán, hexán, ciklohexán és a petroléter, az aromás szénhidrogének, így a toluol, az o-, m- és a p-xilol, különösen előnyösen a toluol, az o-, m- és a p-xilol.

A fentiekben megnevezett oldószer elegyeit is alkalmazhatjuk.

Végül az (V.1) általános képletű halogén-triazolopirimidin-eket egy (VI) általános képletű aminnal reagáltatva nyerjük az olyan (I) általános képletű 7-amino-triazolopirimidineket, amelyek képletében X halogénatomot jelent, az alábbi reakcióvázlatnak megfelelően:



Ezt a reakciót szokásosan 0 °C-tól 70 °C-ig, előnyösen 10 °C-tól 35 °C-ig terjedő hőmérsékleten, közömbös szerves oldószerben és bázis jelenlétében hajtjuk végre (lásd az EP-A 550 113 számú szabadalmi iratot).

Alkalmas oldószer az aromás szénhidrogének, így a toluol, az o-, m- és a p-xilol, a halogénezett szénhidrogének, így a me-



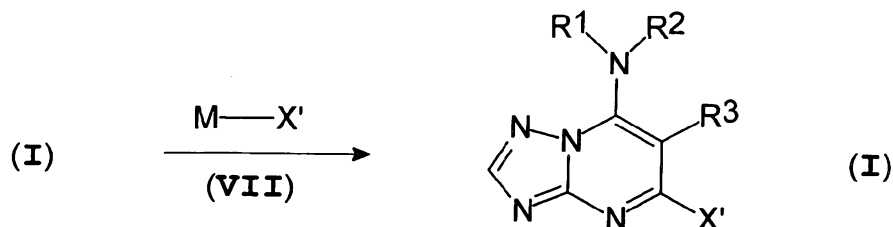
tilén-diklorid, kloroform és a klór-benzol, az éterek, így a dietil-éter, diizopropil-éter, terc-butil-metil-éter, dioxán, anizol és a tetrahidrofurán.

Bázisként szerepelhetnek általában a szervetlen vegyületek, így az alkálifém- és az alkáliföldfém-hidroxidok, így a lítium-, nátrium-, kálium- és a kalcium-hidroxid, az alkálifém- és az alkáliföldfém-oxidok, így a lítium-, nátrium-, kalcium- és a magnézium-oxid, az alkálifém- és az alkáliföldfém-hidridek, így a lítium-, nátrium-, kálium- és a kalcium-hidrid, az alkálifém-amidok, így a lítium-, nátrium- és a kálium-amid, az alkálifém- és az alkáliföldfém-karbonátok, így a lítium-, kálium- és a kalcium-karbonát valamint az alkálifém-hidrogén-karbonátok, így a nátrium-hidrogén-karbonát, a fémorganikus vegyületek, főleg az alkálifém-alkilek, így a metil-, butil- és a fenil-lítium, az alkil-magnézium-halogenidek, így a metil-magnézium-klorid valamint az alkálifém- és az alkáliföldfém-alkoholátok, így a nátrium-metanolát, nátrium-etanolát, kálium-etanolát, kálium-terc-butanolát és a dimetoxi-magnézium, ezenkívül a szerves bázisok, például a terciér aminok, így a trimetil-amin, trietil-amin, N-etil-diizopropil-amin, N-metil-piperidin, piridin, szubsztituált piridinek, így a kollidin, lutidin és a 4-(dimetil-amino)-piridin valamint a biciklusos aminok. Különösen előnyös bázis a trietil-amin, a kálium-karbonát és a nátrium-karbonát.

A bázisokat általában katalitikus mennyiségben alkalmazzuk, ezeket azonban ekvimoláris mennyiségben, feleslegben vagy adott esetben akár oldószerként is alkalmazhatjuk. Alternatív módon azonban bázisként a (VI) általános képletű vegyület feleslege is szolgálhat.

A kiindulási vegyületeket általában ekvimoláris mennyiségben reagáltatjuk egymással, azonban a kitermelés szempontjából előnyös lehet a (VI) általános képletű vegyületet, az (V.1) általános képletű vegyületre vonatkoztatva feleslegben alkalmazni.

Ahhoz, hogy olyan (I) általános képletű 7-amino-triazolopirimidineket nyerjünk, amelyek képletében X ciano- vagy 1-4 szénatomos alkoxicsoportot jelent, a megfelelő (I) általános képletű 7-amino-triazolopirimidint egy (VII) általános képletű vegyülettel reagáltatjuk, az alábbi reakcióvázlat szerint:



A (VII) általános képletben M egy ammónium-, tetraalkilammónium, alkálifém- vagy alkáliföldfém-kationt és X' ciano- vagy alkoxicsoportot jelent.

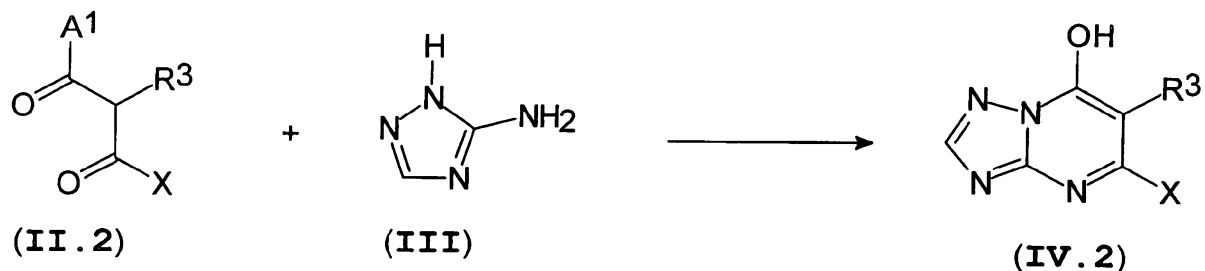
Ezt a reakciót szokásosan 0 °C-tól 150 °C-ig, előnyösen 20 °C-tól 75 °C-ig terjedő hőmérsékleten, egy közömbös szerves oldószerben hajtjuk végre (lásd a WO 99/41255 számú nemzetközi nyilvánosságra hozatali iratot).

Alkalmas oldószerek az éterek, így a dietil-éter, diizopropil-éter, terc-butyl-metil-éter, dioxán, anizol és a tetrahydrofurán, az alkoholok, így a metanol, etanol, propil-alkohol, izopropil-alkohol, butyl-alkohol és a terc-butyl-alkohol, valamint a dimetil-szulfoxid, dimetil-formamid és a dimetil-acetamid. Különösen előnyös oldószer a dietil-éter, tetrahydrofurán, metanol és a dimetil-formamid.

A fentiekben megnevezett oldószerek elegyeit is alkalmazhatjuk.

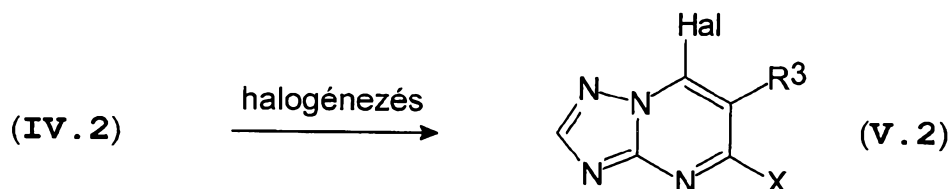
A kiindulási vegyületeket általában ekvimoláris mennyiségben reagáltatjuk egymással, azonban a kitermelés szempontjából előnyös lehet a (VII) általános képletű vegyületet, az (I) általános képletű vegyületre vonatkoztatva feleslegben alkalmazni.

Az olyan (I) általános képletű 7-amino-triazolopirimidineket, amelyek képletében X 1-4 szénatomos halogén-alkil- vagy adott esetben R^a csoporttal szubsztituált fenilcsoportot jelent, a (II.2) általános képletű dikarbonil-vegyületekből nyerjük, amelyeket a (III) képletű 3-amino-1,2,4-triazollal reagáltatva gyűrűzárási reakcióban nyerjük a megfelelő (IV.2) általános képletű 7-hidroxi-triazolopirimidineket, az alábbi reakcióvázlatnak megfelelően:



Ez a reakció ugyanolyan körülmények között megy végbe mint a (II.1) általános képletű vegyületeknek a megfelelő (IV.1) általános képletű vegyületekké való, a fentiekben leírt átalakítása.

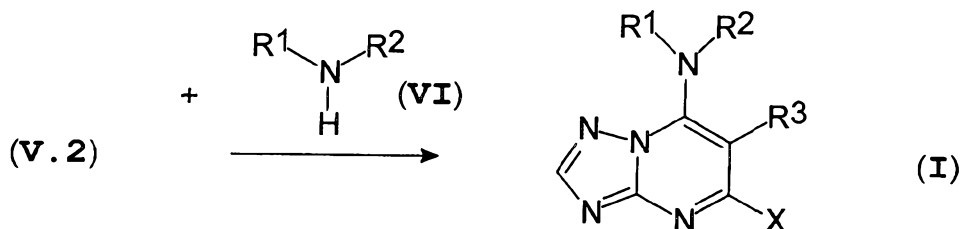
Majd a (IV.2) általános képletű 7-hidroxi-triazolopirimidineket halogénezőszerszerrel a megfelelő (V.2) általános képletű 7-halogén-triazolopirimidinekké alakítjuk át, az alábbi reakcióvázlatnak megfelelően:



Ez a reakció ugyanolyan körülmények között megy végbe mint a (IV.1) általános képletű vegyületeknek a megfelelő (V.1) általános képletű vegyületekké való, a fentiekben leírt átalakítása.

nos képletű vegyületekké való, a fentiekben leírt átalakítása.

Végül az (V.2) általános képletű vegyületeket egy (VI) általános képletű aminnal reagáltatva nyerjük a megfelelő (I) általános képletű vegyületeket, az alábbi reakcióvázlatnak megfelelően:

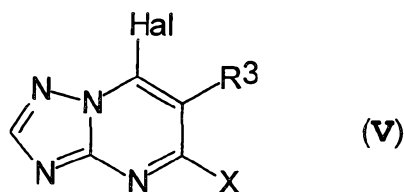
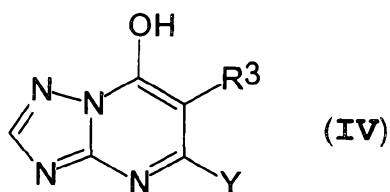


Ez a reakció ugyanolyan körülmények között megy végbe, mint az (V.1) általános képletű vegyületeknek a megfelelő (I) általános képletű vegyületekké való, a fentiekben leírt átalakítása.

A reakcióelegyet a szokásos módon dolgozzuk fel, például vízzel kikeverjük, a fázisokat szétválasztjuk és adott esetben a nyersterméket kromatográfiásan megtisztítjuk. A közti- és a végtermékek részben színtelen vagy enyhén barnás viszkózus olajok formájában válnak ki, amelyeket vákuumban és mérsékelt emelt hőmérsékleten az illékony összetevőktől megszabadítunk vagy megtisztítunk. Amennyiben a közti- és a végtermékeket szilárdanyagokként nyerjük, úgy ezek tisztítása átkristályosítással vagy digerálással történhet.

Amennyiben egyes (I) általános képletű vegyületek a fentiekben leírt módon nem állíthatók elő, úgy ezeket más (I) általános képletű vegyületekből származékképzéssel nyerhetjük.

A



általános képletű 7-hidroxi- és 7-halogén-triazolopirimidinek újak, a képletekben Y hidroxicsoportot vagy az 1. igénypontban meghatározott X csoportok egyikét jelenti, Hal halogénatomot jelent, és R^3 valamint X az 1. igénypontban megadott jelentésűek.

Különösen előnyös (IV) és (V) általános képletű köztitermékek azok, amelyek képletében R^3 jelentése 1-10 szénatomos alkilcsoport, főleg metil-, etil-, butil-, izobutil-, 1-metil-butil-, *terc*-butil-, oktil- vagy izopropilcsoport, 2-10 szénatomos alkenilcsoport, főleg allilcsoport, 3-8 szénatomos cikloalkilcsoport, főleg ciklopropil-metil-, ciklopentil- és ciklohexilcsoport, az alkilrészben 1-10 szénatomos fenil-alkilcsoport, főleg benzil- és o-klór-benzilcsoport, 1-10 szénatomos halogén-alkilcsoport, főleg 2,2,2-trifluor-etil-, 1-metil-2,2,2-trifluor-etil- és 1-(trifluor-metil)-2,2,2-trifluor-etilcsoport és X jelentése halogénatom, főleg klóratom, cianocsoport, 1-4 szénatomos alkoxicsoport, főleg metoxicsoport, 1-4 szénatomos halogén-alkilcsoport, főleg trifluor-metilcsoport, fenilcsoport vagy R^a csoporttal szubsztituált fenilcsoport, főleg fenilcsoport.

A fenti képletekben a szimbólumok megadott definíciójánál gyűjtőfogalmakat használunk, amelyek általában az alábbi szubsztituenseket reprezentálják:

halogénatom: fluor-, klór-, bróm- és jódatom;

alkilcsoport: telített, egyenes vagy elágazó szénláncú és 1-4, 6, 8 vagy 10 szénatomos szénhidrogéncsoportok, például 1-6 szénatomos alkilcsoportok, így a metil-, etil-, propil-, izopropil-, butil-, *szek*-butil-, izobutil-, *terc*-butil-, pentil-, 1-, 2- és 3-metil-butil-, 1-etil-propil-, hexil-, 1,1-, 1,2- és 2,2-dime-

til-propil-, 1-, 2-, 3- és 4-metil-pentil-, 1,1-, 1,2-, 1,3-, 2,2-, 2,3- és 3,3-dimetil-butil-, 1- és 2-etil-butil-, 1,1,2- és 1,2,2-trimetil-propil-, 1-etil-1-metil-propil- és az 1-etil-2-metil-propilcsoport;

halogén-alkilcsoport: egyenes vagy elágazó szénláncú 1-10 szénatomos alkilcsoportok, így a fentiekben megnevezett csoportok, amelyekben a hidrogénatomokat részben, például egyszer-háromszor vagy teljesen halogénatomok, így a fentiekben megnevezett atomok helyettesítik, például az 1-2 szénatomos halogén-alkilcsoportok, így a klór-metil-, bróm-metil-, diklór-metil-, triklór-metil-, fluor-metil-, difluor-metil-, trifluor-metil-, diklór-fluor-metil-, klór-fluor-metil-, klór-difluor-metil-, 1-klór-etil-, 1-bróm-etil-, 1- és 2-fluor-etil-, 2,2-difluor-etil-, 2,2,2-trifluor-etil-, 2-klór-2-fluor-etil-, 2-klór-2,2-difluor-etil-, 2-fluor-2,2-diklór-etil-, 2,2,2-triklór-etil- és a pentafluor-etilcsoport;

alkoxicssoport: egyenes vagy elágazó szénláncú 1-6 szénatomos alkilcsoportok, így a fentiekben megnevezett csoportok, amelyek egy oxigénatomon át (-O-) kapcsolódnak a vázhoz;

halogén-alkoxicssoport: egyenes vagy elágazó szénláncú 1-6 szénatomos halogén-alkilcsoportok, így a fentiekben megnevezett csoportok, amelyek egy oxigénatomon át (-O-) kapcsolódnak a vázhoz;

alkil-tiocsoport: egyenes vagy elágazó szénláncú 1-6 szénatomos alkilcsoportok, így a fentiekben megnevezett csoportok, amelyek egy kénatomon át (-S-) kapcsolódnak a vázhoz;

alkil-aminocsoport: egyenes vagy elágazó szénláncú 1-6 szénatomos alkilcsoportok, így a fentiekben megnevezett csoportok, ame-

lyek egy aminocsoporton át (-NH-) kapcsolódnak a vázhoz;

dialkil-aminocsoport: két, egymástól független egyenes vagy elágazó szénláncú, egyenként 1-6 szénatomos alkilcsoportok, így a fentiekben megnevezett csoportok, amelyek egy nitrogénatomon át kapcsolódnak a vázhoz;

alkenilcsoport: telítetlen, egyenes vagy elágazó szénláncú, 2-6 vagy 10 szénatomos és az egy kettőskötést tetszőleges helyzetben tartalmazó szénhidrogéncsoport, például 2-6 szénatomos alkenilcsoportok, így a vinil-, 1-propenil-, allil-, 1-metil-vinil-, 1-, 2- és 3-butenil-, 1- és 2-metil-1-propenil-, 1- és 2-metil-allil-, 1-, 2-, 3- és 4-pentenil-, 1-, 2- és 3-metil-1-butenil-, 1-, 2- és 3-metil-2-butenil-, 1-, 2- és 3-metil-3-butenil-, 1,1- és 1,2-dimetil-allil-, 1,2-dimetil-1-propenil-, 1-etil-1-propenil-, 1-etil-allil-, 1-, 2-, 3-, 4- és 5-hexenil-, 1-, 2-, 3- és 4-metil-1-pentenil-, 1-, 2-, 3- és 4-metil-2-pentenil-, 1-, 2-, 3- és 4-metil-3-pentenil-, 1-, 2-, 3- és 4-metil-4-pentenil-, 1,2-, 1,3-, 2,3- és 3,3-dimetil-1-butenil-, 1,2-, 1,3-, 2,3- és 3,3-dimetil-2-butenil-, 1,1-, 1,2-, 1,3-, 2,2- és 2,3-dimetil-3-butenil-, 1- és 2-etil-1-butenil-, 1- és 2-etil-2-butenil-, 1- és 2-etil-3-butenil-, 1,1,2-trimetil-allil-, 1-etil-1-metil-allil-, 1-etil-2-metil-1-propenil- és az 1-etil-2-metil-allilcsoport;

alkenil-oxi-csoport: telítetlen, egyenes vagy elágazó szénláncú, 3-6 szénatomos és az egy kettőskötést tetszőleges, de egy heteroatommal nem szomszédos helyzetben tartalmazó szénhidrogéncsoportok, így a fentiekben megnevezett csoportok, amelyek egy oxigénatomon át (-O-) kapcsolódnak a vázhoz;

alkinilcsoport: egyenes vagy elágazó szénláncú, 2-6 vagy 10 szénatomos és az egy hármaskötést tetszőleges helyzetben tartalmazó szénhidrogéncsoportok, például 2-6 szénatomos alkinilcsoportok, így az etinil-, 1-propinil-, propargil-, 1-, 2- és 3-butinil-, 1-metil-propargil-, 1-, 2-, 3- és 4-pentinil-, 3-metil-1-butinil-, 1-metil-2-butinil-, 1- és 2-metil-3-butinil-, 1,1-dimetil-propargil-, 1-etil-propargil-, 1-, 2-, 3-, 4- és 5-hexinil-, 3- és 4-metil-1-pentinil-, 1- és 4-metil-2-pentinil-, 1- és 2-metil-3-pentinil-, 1-, 2- és 3-metil-4-pentinil-, 3,3-dimetil-1-butinil-, 1,1-dimetil-2-butinil-, 1,1-, 1,2- és 2,2-dimetil-3-butinil-, 1-etil-2-butinil-, 1- és 2-etil-3-butinil- és az 1-etil-1-metil-propargilcsoport;

alkinil-oxi-csoport: telítetlen, egyenes vagy elágazó szénláncú, 3-6 szénatomos és az egy hármaskötést tetszőleges, de egy heteroatommal nem szomszédos helyzetben tartalmazó szénhidrogéncsoportok, így a fentiekben megnevezett csoportok, amelyek egy oxigénatomon át (-O-) kapcsolódnak a vázhoz;

cikloalkilcsoport: monociklusos, telített, 3-5, 6 vagy 8 szénatom-gyűrűtagú szénhidrogéncsoportok, például 3-8 szénatomos cikloalkilcsoportok, így a ciklopropil-, ciklobutil-, ciklopentil-, ciklohexil-, cikloheptil- és a ciklooktilcsoport;

5- vagy 6-tagú heterociklil-csoport: a szénatom-gyűrűtagokon kívül egy-négy nitrogénatomot és/vagy egy oxigén- vagy kénatomot vagy egy oxigén- és/vagy kénatomot tartalmazó csoportok, például a 2- és 3-tetrahidrofuranil-, 2- és 3-tetrahidrotienil-, 2- és 3-pirrolidinil-, 3-, 4- és 5-izoxazolidinil-, 3-, 4- és 5-izotiazolidinil-, 3-, 4- és 5-pirazolidinil-, 2-, 4- és 5-

-oxazolidinil-, 2-, 4- és 5-tiazolidinil-, 2- és 4-imidazolidinil-, 1,2,4-oxadiazolidin-3-il-, 1,2,4-oxadiazolidin-5-il-, 1,2,4-tiadiazolidin-3-il-, 1,2,4-tiadiazolidin-5-il-, 1,2,4-triazolidin-3-il-, 1,3,4-oxadiazolidin-2-il-, 1,3,4-tiadiazolidin-2-il-, 1,3,4-triazolidin-2-il-, 2,3-dihidro-2-furil-, 2,3-dihidro-3-furil-, 2,4-dihidro-2-furil-, 2,4-dihidro-3-furil-, 2,3-dihidro-2-tienil-, 2,3-dihidro-3-tienil-, 2,4-dihidro-2-tienil-, 2,4-dihidro-3-tienil-, 2-pirrolin-2-il-, 2-pirrolin-3-il-, 3-pirrolin-2-il-, 3-pirrolin-3-il-, 2-izoxazolin-3-il-, 3-izoxazolin-3-il-, 4-izoxazolin-3-il-, 2-izoxazolin-4-il-, 3-izoxazolin-4-il-, 4-izoxazolin-4-il-, 2-izoxazolin-5-il-, 3-izoxazolin-5-il-, 4-izoxazolin-5-il-, 2-izotiazolin-3-il-, 3-izotiazolin-3-il-, 4-izotiazolin-3-il-, 2-izotiazolin-4-il-, 3-izotiazolin-4-il-, 4-izotiazolin-4-il-, 2-izotiazolin-5-il-, 3-izotiazolin-5-il-, 4-izotiazolin-5-il-, 2,3-dihidropirazol-1-il-, 2,3-dihidropirazol-2-il-, 2,3-dihidropirazol-3-il-, 2,3-dihidropirazol-4-il-, 2,3-dihidropirazol-5-il-, 3,4-dihidropirazol-1-il-, 3,4-dihidropirazol-3-il-, 3,4-dihidropirazol-4-il-, 3,4-dihidropirazol-5-il-, 4,5-dihidropirazol-1-il-, 4,5-dihidropirazol-3-il-, 4,5-dihidropirazol-4-il-, 4,5-dihidropirazol-5-il-, 2,3-dihidrooxazol-2-il-, 2,3-dihidrooxazol-3-il-, 2,3-dihidrooxazol-4-il-, 2,3-dihidrooxazol-5-il-, 3,4-dihidrooxazol-2-il-, 3,4-dihidrooxazol-3-il-, 3,4-dihidrooxazol-4-il-, 3,4-dihidrooxazol-5-il-, 2-, 3- és 4-piperidil-, 1,3-dioxán-5-il-, 2- és 4-tetrahidropiránil-, 2-tetrahidrotienil-, 3- és 4-hexahidropiridazinil-, 2-, 4- és 5-hexahidropirimidinil-, 2-piperazinil-, 1,3,5-hexahidrotriazin-2-il- és az 1,2,4-hexahidrotriazin-3-il-csoport;

5-tagú heteroaril-csoport: gyűrűtagként egy-négy nitrogénatomot vagy egy-három nitrogénatomot és egy kén- vagy oxigénatomot tartalmazó csoportok: 5 tagú heteroarilcsoportok, amelyek a szénatom-gyűrűtagokon kívül gyűrűtagként egy-négy nitrogénatomot vagy egy-három nitrogénatomot és egy kén- vagy oxigénatomot tartalmaznak, például a 2- és 3-furil-, 2- és 3-tienil-, 2- és 3-pirrolil-, 3-, 4- és 5-izoxazolil-, 3-, 4- és 5-izotiazolil-, 3-, 4- és 5-pirazolil-, 2-, 4- és 5-oxazolil-, 2-, 4- és 5-tiazolil-, 2- és 4-imidazolil-, 1,2,4-oxadiazol-3-il-, 1,2,4-oxadiazol-5-il-, 1,2,4-tiadiazol-3-il-, 1,2,4-tiadiazol-5-il-, 1,2,4-triazol-3-il-, 1,3,4-oxadiazol-2-il-, 1,3,4-tiadiazol-2-il- és az 1,3,4-triazol-2-il-csoport;

6-tagú heteroaril-csoport: gyűrűtagként egy-három illetve egy-négy nitrogénatomot tartalmazó csoportok: 6 tagú heteroarilcsoportok, amelyek a szénatom-gyűrűtagokon kívül gyűrűtagként egy-három illetve egy-négy nitrogénatomot tartalmaznak, például a 2-, 3- és 4-piridil-, 3- és 4-piridazinil-, 2-, 4- és 5-pirimidinil-, 2-pirazinil-, 1,3,5-triazin-2-il- és az 1,2,4-triazin-2-il-csoport;

oxi-alkilén-oxi-csoport: el nem ágazó szénláncú, egy-három metilénecsoporthból álló olyan kétértékű csoport, amelynek a két vegyértéke egy-egy oxigénatomon át kapcsolódik a vázhoz, például az oxi-metilén-oxi- (metiléndioxi-), oxi-etilén-oxi- (etiléndioxi-) és az oxi-trimetilén-oxi- (trimetiléndioxi-) csoport.

Az (I) általános képletű vegyületek mezőgazdaságilag használható sóik formájában is létezhetnek, ahol a só fajtája általában nem érdekes. Általában a sók kationjaiként vagy a savaddí-

ciós sók anionjaiként olyan kationok illetve anionok szerepelhetnek, amelyek az (I) általános képletű vegyületek fungicid hatását negatívan nem befolyásolják.

Kationokként szerepelhetnek főleg az alkálifémek, előnyösen a lítium, nátrium és a kálium, az alkáliföldfémek, előnyösen a kalcium és a magnézium és az átmenetifémek, előnyösen a mangán, réz, cink és a vas ionjai, valamint az ammóniumion, ahol kívánt esetben egy-négy hidrogénatomot 1-4 szénatomos alkil-, 1-4 szénatomos hidroxi-alkil-, az alkoxi- és az alkilrészben 1-4 szénatomos alkoxi-alkil-, az alkoxi- és az alkilrészben 1-4 szénatomos hidroxi-alkoxi-alkil-, fenil- vagy benzilcsoportok helyettesíthetnek, előnyösen az ammónium-, dimetil-ammónium-, diizopropil-ammónium-, tetrametil-ammónium-, tetrabutyl-ammónium-, 2-(2-hidroxi-etoxi)-etil-ammónium-, bisz(2-hidroxi-etil)-ammónium- és a trimetil-benzil-ammóniumion, továbbá a foszfóniumionok, a szulfóniumionok, előnyösen az alkilrészenként 1-4 szénatomos trialalkil-szulfóniumionok és a szulfoxóniumionok, előnyösen az alkilrészenként 1-4 szénatomos trialalkil-szulfoxóniumionok.

A használható savaddíciós sók anionjaiként szerepelhetnek elsősorban a következők: a klorid-, bromid-, fluorid-, hidrogén-szulfát-, szulfát-, dihidrogén-foszfát-, hidrogén-foszfát-, nitrát-, hidrogén-karbonát-, karbonát-, benzoát-, [hexafluoro-szilikát(IV)]- és a [hexafluoro-foszfát(V)]-ion valamint az 1-4 szénatomos alkánsavak anionjai, előnyösen a formiát-, acetát-, propionát- és a butirátion.

Az (I) általános képletű 7-amino-triazolopirimidinek találmány szerinti alkalmazását tekintve különösen előnyösek a szub-

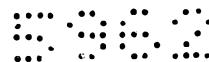
sztituensek alábbi jelentései, akár magukban, akár pedig kombinációkban is:

Előnyösek azok az (I) általános képletű vegyületek, amelyek képletében R^1 és R^2 jelentése hidrogénatom, 1-10 szénatomos alkil- vagy 1-6 szénatomos halogén-alkilcsoport, főleg hidrogénatom, 1-6 szénatomos alkil- vagy 1-4 szénatomos halogén-alkilcsoport, különösen előnyösen hidrogénatom, 1-metil-propil-, izopropil- vagy 2,2,2-trifluor-1-metil-etilcsoport; vagy R^1 és R^2 a közöttük levő nitrogénatommal együtt egy olyan 5 vagy 6 tagú gyűrűt képez, amely gyűrűtagként egy oxigénatomot tartalmazhat és/vagy amelyet egy 1-4 szénatomos alkilcsoport szubsztituálhat, például az 1-pirrolidinil-, 1-pirrolil-, 1-pirazolil-, 1-imidazolil-, piperidino- és a morfolinocsoport, ahol a fentiekben megnevezett csoportokat egy-három R^a csoport, főleg 1-4 szénatomos alkilcsoport, így például metil- vagy etilcsoport szubsztituálhatja.

Emellett különösen előnyösek azok az (I) általános képletű vegyületek is, amelyek képletében R^1 hidrogénatomot, 1-6 szénatomos alkil- és 1-4 szénatomos halogén-alkilcsoportot és R^2 hidrogénatomot jelent.

Egészen különösen előnyösek azok az (I) általános képletű vegyületek is, amelyek képletében R^1 és R^2 hidrogénatomot és R^3 3-8 szénatomos cikloalkilcsoportot, főleg ciklopropil-, ciklopentil- vagy ciklohexilcsoportot jelent.

Ezenkívül különösen előnyösek azok az (I) általános képletű vegyületek, amelyek képletében R^3 1-8 szénatomos alkilcsoportot, főleg izopropil- vagy oktilcsoportot, 3-6 szénatomos cikloalkil-



csoportot, főleg ciklopropil-, ciklopentil- vagy ciklohexilcsoportot vagy benzilcsoportot jelent.

Főleg azok az (I) általános képletű vegyületek az előnyösek, amelyek képletében R^3 3-8 szénatomos cikloalkilcsoportot, főleg 3-6 szénatomos cikloalkilcsoportot, különösen előnyösen ciklopropil-, ciklopropil-metil-, ciklopentil- vagy ciklohexilcsoportot és X ciano-, 1-4 szénatomos alkoxi-, például metoxi-, 1-4 szénatomos halogén-alkil-, például trifluor-metilcsoportot vagy adott esetben R^a csoporttal szubsztituált fenil-alkilcsoportot, például benzil- vagy o-klór-benzilcsoportot jelent.

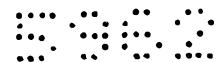
Ezenkívül különösen előnyösek azok az (I) általános képletű vegyületek, amelyek képletében R^3 3-8 szénatomos cikloalkilcsoportot, főleg 3-6 szénatomos cikloalkilcsoportot, különösen előnyösen ciklopropil-, ciklopentil- vagy ciklohexilcsoportot és X halogénatomot, főleg klóratomot jelent.

Ugyanígy különösen előnyösek azok az (I) általános képletű vegyületek, amelyek képletében X halogénatomot, így klór- vagy brómatomot, főleg klóratomot jelent.

Felhasználásukat tekintve különösen előnyösek az alábbi táblázatokban felsorolt (I) általános képletű vegyületek. A táblázatokban az egyes szubsztituenseknél megnevezett csoportok az illető szubsztituens egy-egy különösen előnyös alakját képezik, függetlenül attól a kombinációtól, amelyben ezek meg vannak nevezve.

1. táblázat

Olyan (I) általános képletű vegyületek, amelyek képletében R^3 metilcsoportot és X klóratomot jelent és az R^1 és R^2 csoportok kombinációja mindig az A táblázat egy-egy sorának felel meg.



2. táblázat

Olyan (I) általános képletű vegyületek, amelyek képletében R^3 etilcsoportot és X klóratomot jelent és az R^1 és R^2 csoportok kombinációja mindig az A táblázat egy-egy sorának felel meg.

3. táblázat

Olyan (I) általános képletű vegyületek, amelyek képletében R^3 butilcsoportot és X klóratomot jelent és az R^1 és R^2 csoportok kombinációja mindig az A táblázat egy-egy sorának felel meg.

4. táblázat

Olyan (I) általános képletű vegyületek, amelyek képletében R^3 izobutilcsoportot és X klóratomot jelent és az R^1 és R^2 csoportok kombinációja mindig az A táblázat egy-egy sorának felel meg.

5. táblázat

Olyan (I) általános képletű vegyületek, amelyek képletében R^3 1-metil-butilcsoportot és X klóratomot jelent és az R^1 és R^2 csoportok kombinációja mindig az A táblázat egy-egy sorának felel meg.

6. táblázat

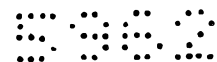
Olyan (I) általános képletű vegyületek, amelyek képletében R^3 terc-butilcsoportot és X klóratomot jelent és az R^1 és R^2 csoportok kombinációja mindig az A táblázat egy-egy sorának felel meg.

7. táblázat

Olyan (I) általános képletű vegyületek, amelyek képletében R^3 oktilcsoportot és X klóratomot jelent és az R^1 és R^2 csoportok kombinációja mindig az A táblázat egy-egy sorának felel meg.

8. táblázat

Olyan (I) általános képletű vegyületek, amelyek képletében R^3 izopropilcsoportot és X klóratomot jelent és az R^1 és R^2 csoportok kombinációja mindig az A táblázat egy-egy sorának felel meg.



tok kombinációja mindig az A táblázat egy-egy sorának felel meg.

9. táblázat

Olyan (I) általános képletű vegyületek, amelyek képletében R^3 ciklopentilcsoportot és X klóratomot jelent és az R^1 és R^2 csoportok kombinációja mindig az A táblázat egy-egy sorának felel meg.

10. táblázat

Olyan (I) általános képletű vegyületek, amelyek képletében R^3 ciklohexilcsoportot és X klóratomot jelent és az R^1 és R^2 csoportok kombinációja mindig az A táblázat egy-egy sorának felel meg.

11. táblázat

Olyan (I) általános képletű vegyületek, amelyek képletében R^3 benzilcsoportot és X klóratomot jelent és az R^1 és R^2 csoportok kombinációja mindig az A táblázat egy-egy sorának felel meg.

12. táblázat

Olyan (I) általános képletű vegyületek, amelyek képletében R^3 o-klór-benzilcsoportot és X klóratomot jelent és az R^1 és R^2 csoportok kombinációja mindig az A táblázat egy-egy sorának felel meg.

13. táblázat

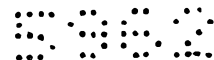
Olyan (I) általános képletű vegyületek, amelyek képletében R^3 propilcsoportot és X klóratomot jelent és az R^1 és R^2 csoportok kombinációja mindig az A táblázat egy-egy sorának felel meg.

14. táblázat

Olyan (I) általános képletű vegyületek, amelyek képletében R^3 allilcsoportot és X klóratomot jelent és az R^1 és R^2 csoportok kombinációja mindig az A táblázat egy-egy sorának felel meg.

15. táblázat

Olyan (I) általános képletű vegyületek, amelyek képletében R^3



ciklopropil-metilcsoportot és X klóratomot jelent és az R^1 és R^2 csoportok kombinációja mindig az A táblázat egy-egy sorának felel meg.

16. táblázat

Olyan (I) általános képletű vegyületek, amelyek képletében R^3 2-ciano-etilcsoportot és X klóratomot jelent és az R^1 és R^2 csoportok kombinációja mindig az A táblázat egy-egy sorának felel meg.

17. táblázat

Olyan (I) általános képletű vegyületek, amelyek képletében R^3 2,2,2-trifluor-etilcsoportot és X klóratomot jelent és az R^1 és R^2 csoportok kombinációja mindig az A táblázat egy-egy sorának felel meg.

18. táblázat

Olyan (I) általános képletű vegyületek, amelyek képletében R^3 1-metil-2,2,2-trifluor-etilcsoportot és X klóratomot jelent és az R^1 és R^2 csoportok kombinációja mindig az A táblázat egy-egy sorának felel meg.

19. táblázat

Olyan (I) általános képletű vegyületek, amelyek képletében R^3 1-(trifluor-metil)-2,2,2-trifluor-etilcsoportot és X klóratomot jelent és az R^1 és R^2 csoportok kombinációja mindig az A táblázat egy-egy sorának felel meg.

20. táblázat

Olyan (I) általános képletű vegyületek, amelyek képletében R^3 metilcsoportot és X trifluor-metilcsoportot jelent és az R^1 és R^2 csoportok kombinációja mindig az A táblázat egy-egy sorának felel meg.

21. táblázat



Olyan (I) általános képletű vegyületek, amelyek képletében R^3 etilcsoportot és X trifluor-metilcsoportot jelent és az R^1 és R^2 csoportok kombinációja mindig az A táblázat egy-egy sorának felel meg.

22. táblázat

Olyan (I) általános képletű vegyületek, amelyek képletében R^3 butilcsoportot és X trifluor-metilcsoportot jelent és az R^1 és R^2 csoportok kombinációja mindig az A táblázat egy-egy sorának felel meg.

23. táblázat

Olyan (I) általános képletű vegyületek, amelyek képletében R^3 izobutilcsoportot és X trifluor-metilcsoportot jelent és az R^1 és R^2 csoportok kombinációja mindig az A táblázat egy-egy sorának felel meg.

24. táblázat

Olyan (I) általános képletű vegyületek, amelyek képletében R^3 1-metil-butilcsoportot és X trifluor-metilcsoportot jelent és az R^1 és R^2 csoportok kombinációja mindig az A táblázat egy-egy sorának felel meg.

25. táblázat

Olyan (I) általános képletű vegyületek, amelyek képletében R^3 *terc*-butilcsoportot és X trifluor-metilcsoportot jelent és az R^1 és R^2 csoportok kombinációja mindig az A táblázat egy-egy sorának felel meg.

26. táblázat

Olyan (I) általános képletű vegyületek, amelyek képletében R^3 oktilcsoportot és X trifluor-metilcsoportot jelent és az R^1 és



R^2 csoportok kombinációja mindig az A táblázat egy-egy sorának felel meg.

27. táblázat

Olyan (I) általános képletű vegyületek, amelyek képletében R^3 izopropilcsoportot és X trifluor-metilcsoportot jelent és az R^1 és R^2 csoportok kombinációja mindig az A táblázat egy-egy sorának felel meg.

28. táblázat

Olyan (I) általános képletű vegyületek, amelyek képletében R^3 ciklopentilcsoportot és X trifluor-metilcsoportot jelent és az R^1 és R^2 csoportok kombinációja mindig az A táblázat egy-egy sorának felel meg.

29. táblázat

Olyan (I) általános képletű vegyületek, amelyek képletében R^3 ciklohexilcsoportot és X trifluor-metilcsoportot jelent és az R^1 és R^2 csoportok kombinációja mindig az A táblázat egy-egy sorának felel meg.

30. táblázat

Olyan (I) általános képletű vegyületek, amelyek képletében R^3 benzilcsoportot és X trifluor-metilcsoportot jelent és az R^1 és R^2 csoportok kombinációja mindig az A táblázat egy-egy sorának felel meg.

31. táblázat

Olyan (I) általános képletű vegyületek, amelyek képletében R^3 p-klór-benzilcsoportot és X trifluor-metilcsoportot jelent és az R^1 és R^2 csoportok kombinációja mindig az A táblázat egy-egy sorának felel meg.

32. táblázat

Olyan (I) általános képletű vegyületek, amelyek képletében R^3 propilcsoportot és X trifluor-metilcsoportot jelent és az R^1 és R^2 csoportok kombinációja mindig az A táblázat egy-egy sorának felel meg.

33. táblázat

Olyan (I) általános képletű vegyületek, amelyek képletében R^3 allilcsoportot és X trifluor-metilcsoportot jelent és az R^1 és R^2 csoportok kombinációja mindig az A táblázat egy-egy sorának felel meg.

34. táblázat

Olyan (I) általános képletű vegyületek, amelyek képletében R^3 ciklopropil-metilcsoportot és X trifluor-metilcsoportot jelent és az R^1 és R^2 csoportok kombinációja mindig az A táblázat egy-egy sorának felel meg.

35. táblázat

Olyan (I) általános képletű vegyületek, amelyek képletében R^3 2-ciano-etilcsoportot és X trifluor-metilcsoportot jelent és az R^1 és R^2 csoportok kombinációja mindig az A táblázat egy-egy sorának felel meg.

36. táblázat

Olyan (I) általános képletű vegyületek, amelyek képletében R^3 2,2,2-trifluor-etilcsoportot és X trifluor-metilcsoportot jelent és az R^1 és R^2 csoportok kombinációja mindig az A táblázat egy-egy sorának felel meg.

37. táblázat

Olyan (I) általános képletű vegyületek, amelyek képletében

R^3 1-metil-2,2,2-trifluor-etilcsoportot és X trifluor-metil-csoportot jelent és az R^1 és R^2 csoportok kombinációja mindig az A táblázat egy-egy sorának felel meg.

38. táblázat

Olyan (I) általános képletű vegyületek, amelyek képletében R^3 1-(trifluor-metil)-2,2,2-trifluor-etilcsoportot és X trifluor-metilcsoportot jelent és az R^1 és R^2 csoportok kombinációja mindig az A táblázat egy-egy sorának felel meg.

39. táblázat

Olyan (I) általános képletű vegyületek, amelyek képletében R^3 metilcsoportot és X fenilcsoportot jelent és az R^1 és R^2 csoportok kombinációja mindig az A táblázat egy-egy sorának felel meg.

40. táblázat

Olyan (I) általános képletű vegyületek, amelyek képletében R^3 etilcsoportot és X fenilcsoportot jelent és az R^1 és R^2 csoportok kombinációja mindig az A táblázat egy-egy sorának felel meg.

41. táblázat

Olyan (I) általános képletű vegyületek, amelyek képletében R^3 butilcsoportot és X fenilcsoportot jelent és az R^1 és R^2 csoportok kombinációja mindig az A táblázat egy-egy sorának felel meg.

42. táblázat

Olyan (I) általános képletű vegyületek, amelyek képletében R^3 izobutilcsoportot és X fenilcsoportot jelent és az R^1 és R^2 csoportok kombinációja mindig az A táblázat egy-egy sorának felel meg.

43. táblázat

Olyan (I) általános képletű vegyületek, amelyek képletében R^3 1-metil-butilcsoportot és X fenilcsoportot jelent és az R^1 és

R^2 csoportok kombinációja mindig az A táblázat egy-egy sorának felel meg.

44. táblázat

Olyan (I) általános képletű vegyületek, amelyek képletében R^3 terc-butilcsoportot és X fenilcsoportot jelent és az R^1 és R^2 csoportok kombinációja mindig az A táblázat egy-egy sorának felel meg.

45. táblázat

Olyan (I) általános képletű vegyületek, amelyek képletében R^3 oktilcsoportot és X fenilcsoportot jelent és az R^1 és R^2 csoportok kombinációja mindig az A táblázat egy-egy sorának felel meg.

46. táblázat

Olyan (I) általános képletű vegyületek, amelyek képletében R^3 izopropilcsoportot és X fenilcsoportot jelent és az R^1 és R^2 csoportok kombinációja mindig az A táblázat egy-egy sorának felel meg.

47. táblázat

Olyan (I) általános képletű vegyületek, amelyek képletében R^3 ciklopentilcsoportot és X fenilcsoportot jelent és az R^1 és R^2 csoportok kombinációja mindig az A táblázat egy-egy sorának felel meg.

48. táblázat

Olyan (I) általános képletű vegyületek, amelyek képletében R^3 ciklohexilcsoportot és X fenilcsoportot jelent és az R^1 és R^2 csoportok kombinációja mindig az A táblázat egy-egy sorának felel meg.

49. táblázat

Olyan (I) általános képletű vegyületek, amelyek képletében R^3 benzilcsoportot és X fenilcsoportot jelent és az R^1 és R^2 csoportok kombinációja mindig az A táblázat egy-egy sorának felel meg.

50. táblázat

Olyan (I) általános képletű vegyületek, amelyek képletében R^3 p-klór-benzilcsoportot és X fenilcsoportot jelent és az R^1 és R^2 csoportok kombinációja mindig az A táblázat egy-egy sorának felel meg.

51. táblázat

Olyan (I) általános képletű vegyületek, amelyek képletében R^3 propilcsoportot és X fenilcsoportot jelent és az R^1 és R^2 csoportok kombinációja mindig az A táblázat egy-egy sorának felel meg.

52. táblázat

Olyan (I) általános képletű vegyületek, amelyek képletében R^3 allilcsoportot és X fenilcsoportot jelent és az R^1 és R^2 csoportok kombinációja mindig az A táblázat egy-egy sorának felel meg.

53. táblázat

Olyan (I) általános képletű vegyületek, amelyek képletében R^3 ciklopropil-metilcsoportot és X fenilcsoportot jelent és az R^1 és R^2 csoportok kombinációja mindig az A táblázat egy-egy sorának felel meg.

54. táblázat

Olyan (I) általános képletű vegyületek, amelyek képletében R^3 2-ciano-etilcsoportot és X fenilcsoportot jelent és az R^1 és R^2 csoportok kombinációja mindig az A táblázat egy-egy sorának felel meg.

55. táblázat

Olyan (I) általános képletű vegyületek, amelyek képletében R^3 2,2,2-trifluor-etilcsoportot és X fenilcsoportot jelent és az R^1 és R^2 csoportok kombinációja mindig az A táblázat egy-egy sorának felel meg.

56. táblázat

Olyan (I) általános képletű vegyületek, amelyek képletében

R^3 1-metil-2,2,2-trifluor-etilcsoportot és X fenilcsoportot jelent és az R^1 és R^2 csoportok kombinációja mindig az A táblázat egy-egy sorának felel meg.

57. táblázat

Olyan (I) általános képletű vegyületek, amelyek képletében R^3 1-(trifluor-metil)-2,2,2-trifluor-etilcsoportot és X fenilcsoportot jelent és az R^1 és R^2 csoportok kombinációja mindig az A táblázat egy-egy sorának felel meg.

58. táblázat

Olyan (I) általános képletű vegyületek, amelyek képletében R^3 metilcsoportot és X cianocsoportot jelent és az R^1 és R^2 csoportok kombinációja mindig az A táblázat egy-egy sorának felel meg.

59. táblázat

Olyan (I) általános képletű vegyületek, amelyek képletében R^3 etilcsoportot és X cianocsoportot jelent és az R^1 és R^2 csoportok kombinációja mindig az A táblázat egy-egy sorának felel meg.

60. táblázat

Olyan (I) általános képletű vegyületek, amelyek képletében R^3 butilcsoportot és X cianocsoportot jelent és az R^1 és R^2 csoportok kombinációja mindig az A táblázat egy-egy sorának felel meg.

61. táblázat

Olyan (I) általános képletű vegyületek, amelyek képletében R^3 izobutilcsoportot és X cianocsoportot jelent és az R^1 és R^2 csoportok kombinációja mindig az A táblázat egy-egy sorának felel meg.

62. táblázat

Olyan (I) általános képletű vegyületek, amelyek képletében R^3 1-metil-butilcsoportot és X cianocsoportot jelent és az R^1 és

R^2 csoportok kombinációja mindig az A táblázat egy-egy sorának felel meg.

63. táblázat

Olyan (I) általános képletű vegyületek, amelyek képletében R^3 terc-butilcsoportot és X cianocsoportot jelent és az R^1 és R^2 csoportok kombinációja mindig az A táblázat egy-egy sorának felel meg.

64. táblázat

Olyan (I) általános képletű vegyületek, amelyek képletében R^3 oktilcsoportot és X cianocsoportot jelent és az R^1 és R^2 csoportok kombinációja mindig az A táblázat egy-egy sorának felel meg.

65. táblázat

Olyan (I) általános képletű vegyületek, amelyek képletében R^3 izopropilcsoportot és X cianocsoportot jelent és az R^1 és R^2 csoportok kombinációja mindig az A táblázat egy-egy sorának felel meg.

66. táblázat

Olyan (I) általános képletű vegyületek, amelyek képletében R^3 ciklopentilcsoportot és X cianocsoportot jelent és az R^1 és R^2 csoportok kombinációja mindig az A táblázat egy-egy sorának felel meg.

67. táblázat

Olyan (I) általános képletű vegyületek, amelyek képletében R^3 ciklohexilcsoportot és X cianocsoportot jelent és az R^1 és R^2 csoportok kombinációja mindig az A táblázat egy-egy sorának felel meg.

68. táblázat

Olyan (I) általános képletű vegyületek, amelyek képletében R^3 benzilcsoportot és X cianocsoportot jelent és az R^1 és R^2 csoportok kombinációja mindig az A táblázat egy-egy sorának felel meg.

69. táblázat

Olyan (I) általános képletű vegyületek, amelyek képletében R^3 p-klór-benzilcsoportot és X cianocsoportot jelent és az R^1 és R^2 csoportok kombinációja mindig az A táblázat egy-egy sorának felel meg.

70. táblázat

Olyan (I) általános képletű vegyületek, amelyek képletében R^3 propilcsoportot és X cianocsoportot jelent és az R^1 és R^2 csoportok kombinációja mindig az A táblázat egy-egy sorának felel meg.

71. táblázat

Olyan (I) általános képletű vegyületek, amelyek képletében R^3 allilcsoportot és X cianocsoportot jelent és az R^1 és R^2 csoportok kombinációja mindig az A táblázat egy-egy sorának felel meg.

72. táblázat

Olyan (I) általános képletű vegyületek, amelyek képletében R^3 ciklopropil-metilcsoportot és X cianocsoportot jelent és az R^1 és R^2 csoportok kombinációja mindig az A táblázat egy-egy sorának felel meg.

73. táblázat

Olyan (I) általános képletű vegyületek, amelyek képletében R^3 2-ciano-etilcsoportot és X cianocsoportot jelent és az R^1 és R^2 csoportok kombinációja mindig az A táblázat egy-egy sorának felel meg.

74. táblázat

Olyan (I) általános képletű vegyületek, amelyek képletében R^3 2,2,2-trifluor-etilcsoportot és X cianocsoportot jelent és az R^1 és R^2 csoportok kombinációja mindig az A táblázat egy-egy sorának felel meg.

75. táblázat

Olyan (I) általános képletű vegyületek, amelyek képletében R^3 1-metil-2,2,2-trifluor-etilcsoportot és X cianocsoportot jelent és az R^1 és R^2 csoportok kombinációja mindig az A táblázat egy-egy sorának felel meg.

76. táblázat

Olyan (I) általános képletű vegyületek, amelyek képletében R^3 1-(trifluor-metil)-2,2,2-trifluor-etilcsoportot és X cianocsoportot jelent és az R^1 és R^2 csoportok kombinációja mindig az A táblázat egy-egy sorának felel meg.

77. táblázat

Olyan (I) általános képletű vegyületek, amelyek képletében R^3 metilcsoportot és X metoxicssoportot jelent és az R^1 és R^2 csoportok kombinációja mindig az A táblázat egy-egy sorának felel meg.

78. táblázat

Olyan (I) általános képletű vegyületek, amelyek képletében R^3 etilcsoportot és X metoxicssoportot jelent és az R^1 és R^2 csoportok kombinációja mindig az A táblázat egy-egy sorának felel meg.

79. táblázat

Olyan (I) általános képletű vegyületek, amelyek képletében R^3 butilcsoportot és X metoxicssoportot jelent és az R^1 és R^2 csoportok kombinációja mindig az A táblázat egy-egy sorának felel meg.

80. táblázat

Olyan (I) általános képletű vegyületek, amelyek képletében R^3 izobutilcsoportot és X metoxicssoportot jelent és az R^1 és R^2 csoportok kombinációja mindig az A táblázat egy-egy sorának felel meg.

81. táblázat

Olyan (I) általános képletű vegyületek, amelyek képletében R^3 1-metil-butilcsoportot és X metoxicsoportot jelent és az R^1 és R^2 csoportok kombinációja mindig az A táblázat egy-egy sorának felel meg.

82. táblázat

Olyan (I) általános képletű vegyületek, amelyek képletében R^3 terc-butilcsoportot és X metoxicsoportot jelent és az R^1 és R^2 csoportok kombinációja mindig az A táblázat egy-egy sorának felel meg.

83. táblázat

Olyan (I) általános képletű vegyületek, amelyek képletében R^3 oktilcsoportot és X metoxicsoportot jelent és az R^1 és R^2 csoportok kombinációja mindig az A táblázat egy-egy sorának felel meg.

84. táblázat

Olyan (I) általános képletű vegyületek, amelyek képletében R^3 izopropilcsoportot és X metoxicsoportot jelent és az R^1 és R^2 csoportok kombinációja mindig az A táblázat egy-egy sorának felel meg.

85. táblázat

Olyan (I) általános képletű vegyületek, amelyek képletében R^3 ciklopentilcsoportot és X metoxicsoportot jelent és az R^1 és R^2 csoportok kombinációja mindig az A táblázat egy-egy sorának felel meg.

86. táblázat

Olyan (I) általános képletű vegyületek, amelyek képletében R^3 ciklohexilcsoportot és X metoxicsoportot jelent és az R^1 és R^2 csoportok kombinációja mindig az A táblázat egy-egy sorának felel meg.

87. táblázat

Olyan (I) általános képletű vegyületek, amelyek képletében R^3 benzilcsoportot és X metoxicsoportot jelent és az R^1 és R^2 csoportok kombinációja mindig az A táblázat egy-egy sorának felel meg.

88. táblázat

Olyan (I) általános képletű vegyületek, amelyek képletében R^3 p-klór-benzilcsoportot és X metoxicsoportot jelent és az R^1 és R^2 csoportok kombinációja mindig az A táblázat egy-egy sorának felel meg.

89. táblázat

Olyan (I) általános képletű vegyületek, amelyek képletében R^3 propilcsoportot és X metoxicsoportot jelent és az R^1 és R^2 csoportok kombinációja mindig az A táblázat egy-egy sorának felel meg.

90. táblázat

Olyan (I) általános képletű vegyületek, amelyek képletében R^3 allilcsoportot és X metoxicsoportot jelent és az R^1 és R^2 csoportok kombinációja mindig az A táblázat egy-egy sorának felel meg.

91. táblázat

Olyan (I) általános képletű vegyületek, amelyek képletében R^3 ciklopropil-metilcsoportot és X metoxicsoportot jelent és az R^1 és R^2 csoportok kombinációja mindig az A táblázat egy-egy sorának felel meg.

92. táblázat

Olyan (I) általános képletű vegyületek, amelyek képletében R^3 2-ciano-etilcsoportot és X metoxicsoportot jelent és az R^1 és R^2 csoportok kombinációja mindig az A táblázat egy-egy sorának felel meg.



93. táblázat

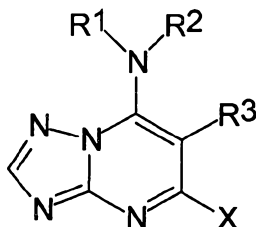
Olyan (I) általános képletű vegyületek, amelyek képletében R^3 2,2,2-trifluor-etilcsoportot és X metoxicsoportot jelent és az R^1 és R^2 csoportok kombinációja mindig az A táblázat egy-egy sorának felel meg.

94. táblázat

Olyan (I) általános képletű vegyületek, amelyek képletében R^3 1-metil-2,2,2-trifluor-etilcsoportot és X metoxicsoportot jelent és az R^1 és R^2 csoportok kombinációja mindig az A táblázat egy-egy sorának felel meg.

95. táblázat

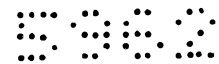
Olyan (I) általános képletű vegyületek, amelyek képletében R^3 1-(trifluor-metil)-2,2,2-trifluor-etilcsoportot és X metoxicsoportot jelent és az R^1 és R^2 csoportok kombinációja mindig az A táblázat egy-egy sorának felel meg.



A táblázat

A szubsztituensek vonatkozásában a különösen előnyös közti-termékekben ezek megfelelnek az (I) általános képletben az R^1 , R^2 , R^a , R^3 és az X szubsztituensek jelentéseinek.

Az (I) általános képletű vegyületek fungicidként alkalmazhatók. Ezek kitűnnek a fitopatogén gombák, főleg az *Ascomycetes*, *Deuteromycetes*, *Phycomycetes* és a *Basidiomycetes* osztályba tar-

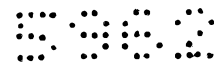


tozó fitopatogén gombák széles spektrumával szembeni kiváló hatásukkal. Ezek részben szisztémikus hatásúak, és ezeket a növényvédelemben levél- és talajfungicidekként alkalmazhatjuk.

Különös jelentőségük van az alábbi különböző haszonnövényeket és magvaikat károsító számos gombafaj leküzdésében: búza, rozs, árpa, zab, rizs, kukorica, gyp, banán, gyapot, szója, kávé, cukornád, szőlő, gyümölcsfák és dísznövények, zöldségek, így az uborka, bab, paradicsom, burgonya és a tök-félék.

Ezek speciál alkalmasak az alábbi gombafajok leküzdésére:

- *Alternaria*-fajok, *Podosphaera*-fajok, *Sclerotinia*-fajok, *Physalospora* canker, a zöldségeken és a gyümölcsökön,
- *Botrytis cinerea*, a szamócán, zöldségeken, dísznövényeken és a szőlőn,
- *Corynespora cassiicola*, az uborkán,
- *Colletotrichum*-fajok, a gyümölcsökön és a zöldségeken,
- *Diplocarpon rosae*, a rózsákon,
- *Elsinoe fawcetti* és *Diaporthe citri*, a citrus-félék gyümölcsein,
- *Sphaerotheca*-fajok, a tök-féléken, szamócán és a rózsákon,
- *Cercospora*-fajok, a földimogyorón, cukorrépán és a padlizsánon,
- *Erysiphe cichoracearum*, a tök-féléken,
- *Leveillula taurica*, a paprikán, paradicsomon és a padlizsánon,
- *Mycosphaerella*-fajok, az almán és a japán barackon,
- *Phyllactinia kakicola*, *Gloesporium kaki*, a japán barackon,
- *Gymnosporangium yamadae*, *Leptothyrium pomi*, *Podosphaera leucotricha* és *Gloedes pomigena*, az almán,
- *Cladosporium carpophilum*, a körtén és a japán barackon,
- *Phomopsis*-fajok, a körtén,



- Phytophthora-fajok, a citrus-félék gyümölcsein, a burgonyán és a hagymán, főleg a Phytophthora infestans, a burgonyán és a paradicsomon,
- Blumeria graminis, a gabonán,
- Fusarium- és Verticillium-fajok, különböző növényeken,
- Glomerella cingulata, a teán,
- Drechslera- és Bipolaris-fajok, a gabonán és a rizsen,
- Mycosphaerella-fajok, a banánon és a földimogyorón,
- Plasmopara viticola, a szőlőn,
- Peronospora-fajok, a hagymán, spenóton és a krizantémon,
- Phaeoisariopsis vitis és Sphaceloma ampelina, a grapefruiton,
- Pseudocercospora herpotrichoides, a búzán és az árpán,
- Pseudoperonospora-fajok, a kohlón és az uborkán,
- Puccinia-fajok és Typhula-fajok, a gabonán és a gyepen,
- Pyricularia oryzae, a rizsen,
- Rhizoctonia-fajok, a gyapoton, rizsen és a gyepen,
- Stagonospora nodorum és Septoria tritici, a búzán,
- Uncinula necator, a szőlőn,
- Ustilago-fajok, a gabonán és a cukornádon, valamint
- Venturia-fajok, az almán és a körtén.

Az (I) általános képletű vegyületek ezenkívül alkalmasak még a *Paecilomyces variotii* kártevő gomba leküzdésére is, az anyagvédelemben (például a fa, papír, diszperziós festékek, rostok és szövetek védelmében) és a készletek megóvásának a területén is.

Az (I) általános képletű vegyületeket úgy alkalmazzuk, hogy a gombákat vagy a gombafertőzéstől megvédeni kívánt növényeket, vetőmagot, anyagokat vagy magát a talajt a hatóanyagok fungicid-



ként hatásos mennyiségével kezeljük. Az alkalmazás történhet az anyagok, a növények vagy magvaik gombafertőzöttsége előtt vagy utána is.

A fungicid készítmények általában 0,1-95 tömeg%, előnyösen 0,5-90 tömeg% hatóanyagot tartalmaznak.

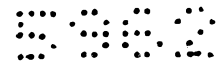
A növényvédelemben való alkalmazásnál a felhasznált mennyiség a kívánt hatás fajtajától függően 0,01-2 kg hatóanyag/ha.

A vetőmagkezelésnél 1 kg vetőmaghoz általában 0,001-0,1 g, előnyösen 0,01-0,05 g hatóanyag szükséges.

Az anyagvédelemben való alkalmazásnál illetve a készletek megóvásának a területén a hatóanyag felhasznált mennyisége a kívánt hatás és a felhasználási terület fajtajához igazodik. Az anyagvédelemben a szokásos felhasználási mennyiség például 0,001-2000, előnyösen 0,005-1000 g hatóanyag/m³ kezelt anyag.

Az (I) általános képletű vegyületeket a szokásos készítményekké, például oldatokká, emulziókká, szuszpenziókká, porokká, pasztákká vagy granulátumokká dolgozhatjuk fel. Az alkalmazási formák a felhasználás céljához igazodnak; ezeknek minden esetben a találmány szerinti vegyület finom és egyenletes eloszlását kell biztosítaniuk.

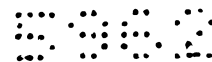
A készítményeket ismert módon állítjuk elő, például a hatóanyagnak oldószerekkel és/vagy hordozóanyagokkal való meghígításával, kívánt esetben emulgeáló- vagy diszpergálószerrel is alkalmazva, és ha hígítószerként víz szerepel, úgy segédoldószerként más szerves oldószereket is alkalmazhatunk. Segédanyagokként lényegében a következők szerepelhetnek: oldószerek, így aromás vegyületek (például a xilol), klórozott aromás vegyületek (például



a klór-benzol), paraffinok (például az ásványolajfrakciók), alkoholok (például a metanol vagy a butanol), ketonok (például a ciklohexanon), aminok (például a 2-hidroxi-etil-amin), a dimetil-formamid és a víz; hordozóanyagok, így a természetes kőzetlisztek (például a kaolin, agyag, talkum és kréta) és a szintetikus kőporok (például a nagyon diszperz kovasav, szilikátok); emulgeálószeresek, így a nem ionos és az anionos emulgeátorok (például a polioxi-etilén-zsíralkohol-éterek, alkil-szulfonátok és aril-szulfonátok) és diszpergálószeresek, így a lignin-szulfitszennylúgok és a metil-cellulóz.

Felületaktív anyagokként szerepelhetnek a ligninszulfonsav, naftalinszulfonsav, fenolszulfonsav, dibutil-naftalinszulfonsav, az alkil-aril-szulfonátok, alkil-szulfátok, alkil-szulfonátok és zsíralkohol-szulfátok alkálifém-, alkáliföldfém- és ammóniumsói, a zsírsavak és alkálifém- vagy alkáliföldfém-sóik, a szulfatált zsíralkohol-glikoléterek sói, a szulfonált naftalinnak és naftalinszármazékoknak a formaldehiddel képzett reakciótermékei, a naftalinnak illetve a naftalinszulfonsavnak a fenollal és a formaldehiddel képzett reakciótermékei, polioxi-etilén-oktil-fenol-éterek, etoxilezett izooktil-, oktil- vagy nonil-fenol, alkil-fenil-poliglikol-éterek, tributil-fenil-poliglikol-éterek, alkil-aril-poliéter-alkoholok, izotridecil-alkohol, a zsíralkoholok és az etilén-oxid kondenzációs termékei, etoxilezett ricinusolaj, polioxi-etilén-alkil-éterek, etoxilezett polioxi-propilén, lauril-alkohol-poliglikol-éter-acetál, szorbit-észter, lignin-szulfitszennylúgok és a metil-cellulóz.

A közvetlenül permetezhető oldatok, emulziók, paszták vagy



olajdiszperziók előállítására közepes-magas forráspontú ásványolajfrakciókat, így kerozint vagy dízelolajat, szénkátrányolajokat valamint állati vagy növényi eredetű olajokat, alifás, gyűrűs és aromás szénhidrogéneket, például benzolt, toluolt, xilolt, paraffint, tetrahidronaftalint, alkilezett naftalinokat vagy származékaikat, metanolt, etanolt, propanolt, butanolt, kloroformot, szén-tetrakloridot, ciklohexanolt, ciklohexanont, klór-benzolt, izoforont, erősen poláros oldószereket, például dimetil-formamidot, dimetil-szulfoxidot, N-metil-pirrolidont és vizet használhatunk.

Porokat, szóró- és porozószereket a hatóanyagoknak egy szilárd hordozóanyaggal való összekeverésével vagy összeörlésével állíthatunk elő.

Granulátumokat, például bevont, impregnált vagy homogéngranulátumokat a hatóanyagoknak szilárd hordozóanyagokon való megkötésével állíthatunk elő. Szilárd hordozóanyagok például az ásványi termékek, így a szilikagél, kovasavak, kovasavgélek, szilikátok, talkum, kaolin, attapulgit, mészkő, mész, kréta, bólusz, lösz, agyag, dolomit, diatomaföld, kalcium- és magnézium-szulfát, magnézium-oxid, őrölt műanyagok, műtrágyák, így például az ammónium-szulfát, -foszfát és -nitrát, karbamid és a növényi termékek, így a gabonaliszt, fahéj-, fa- és csonthéjörlemények, cellulózpor és más szilárd hordozóanyagok.

A készítmények általában 0,01-95, előnyösen 0,1-90 tömegszázalék hatóanyagot tartalmaznak. Ezekben a hatóanyagok tisztasága 90-100%-os, előnyösen 95-100%-os (NMR-spektrumuk alapján).

Példák a fungicid készítményekre:



- I. 5 tömegrész találmány szerinti vegyületet 95 tömegrész finomszemcsés kaolinnal alaposan összekeverve 5 tömeg% hatóanyagtartalmú porozószeret nyerünk.
- II. 30 tömegrész találmány szerinti vegyületet 92 tömegrész porformájú kovasavgél és 8 tömegrész paraffinolaj — amit ennek a kovasavgélnek a felületére porlasztottunk rá — keverékével alaposan összekeverve jó tapadóképeségű készítményt nyerünk (hatóanyagtartalom: 23 tömeg%).
- III. 10 tömegrész találmány szerinti vegyületet feloldunk 90 tömegrész xilolból, 8-10 mól etilén-oxid és 1 mól olajsav-N-monoetanolamid 6 tömegrésznyi reakciótermékéből, 2 tömegrész dodecil-benzolszulfonsav kalciumsóból és 40 mól etilén-oxid és 1 mól ricinusolaj 2 tömegrésznyi reakciótermékéből álló elegyben (hatóanyagtartalom: 9 tömeg%).
- IV. 20 tömegrész találmány szerinti vegyületet feloldunk 60 tömegrész ciklohexanonból, 30 tömegrész izobutanolból, 7 mól etilén-oxid és 1 mól izooktil-fenol 5 tömegrésznyi reakciótermékéből és 40 mól etilén-oxid és 1 mól ricinusolaj 5 tömegrésznyi reakciótermékéből álló elegyben (hatóanyagtartalom: 16 tömeg%).
- V. 80 tömegrész találmány szerinti vegyületet, 3 tömegrész diizobutil-naftalin- α -szulfonsav nátriumsót, szulfitszennylúgból származó 10 tömegrésznyi ligninszulfonsav nátriumsót és 7 tömegrész porformájú kovasavgélt jól összekeverünk és kalapácsos malomban összeörlünk (hatóanyagtartalom: 80 tömeg%).
- VI. 90 tömegrész találmány szerinti vegyületet és 10 tömegrész



N-metil- α -pirrolidont elegyítve olyan oldatot kapunk, ami a legfinomabb cseppekre eloszlatva alkalmazható (hatóanyag-tartalom: 90 tömeg%).

VII. 20 tömegrész találmány szerinti vegyületet feloldunk 40 tömegrész ciklohexanonból, 30 tömegrész izobutanolból, 7 mól etilén-oxid és 1 mól izooktil-fenol 20 tömegrésznyi reakciótermékéből és 40 mól etilén-oxid és 1 mól ricinusolaj 10 tömegrésznyi reakciótermékéből álló elegyben. A kapott oldatot 100.000 tömegrész vízbe öntve és benne finoman eloszlatva 0,02 tömeg% hatóanyagtartalmú vizes diszperziót nyerünk.

VIII. 20 tömegrész találmány szerinti vegyületet 3 tömegrész diizobutil-naftalin- α -szulfonsav nátriumsót, szulfitszennylúgból származó 17 tömegrésznyi ligninszulfonsav nátriumsót és 60 tömegrész porformájú kovasavgélt jól összekeverünk és kalapácsos malomban összeörlünk. A kapott keveréket 20.000 tömegrész vízben finoman eloszlatva 0,1 tömeg% hatóanyag-tartalmú permetlét nyerünk.

A hatóanyagokat magukban vagy készítményeik formájában vagy a belőlük készített közvetlen felhasználásra alkalmas készítményeik formájában, például közvetlenül permetezhető oldatok, porok, szuszpenziók, diszperziók, emulziók, olajdiszperziók, paszták, porozószerke, szórószerke vagy granulátumok alakjában permetezéssel, füstöléssel, porozással, szórással vagy locsolással alkalmazhatjuk. Az alkalmazási formák teljes mértékben a felhasználás céljához igazodnak; ezeknek minden esetben a találmány szerinti hatóanyagok lehető legfinomabb eloszlását kell biztosítaniuk.



Vizes készítményeket emulziókoncentrátumokból, pasztákból vagy nedvesíthető porokból (permetporok, olajdiszperziók) víz hozzáadásával készíthetünk. Emulziók, paszták vagy olajdiszperziók előállítására a hatóanyagokat magukban vagy olajban vagy oldószerben oldva nedvesítő-, tapadást elősegítő, diszpergáló- vagy emulgeálószerrel a vízben homogenizálhatjuk. Készíthetünk azonban a hatóanyagból, nedvesítő-, tapadást elősegítő, diszpergáló- vagy emulgeálószerből és adott esetben oldószerből vagy olajból álló és vízzel hígítható koncentrátumokat is.

A közvetlen felhasználásra alkalmas készítményekben a hatóanyagok koncentrációja széles határok között változhat. Ennek értéke általában 0,0001-10%, előnyösen 0,01-1%.

A hatóanyagokat sikerrel alkalmazhatjuk az ultra kis térfogatú (ultra low volume = ULV) eljárásban is, ahol lehetséges több mint 95 tömeg%-os hatóanyagtartalmú készítményt vagy akár adalékanyagok nélkül magát a hatóanyagot kijuttatni.

A hatóanyagokhoz, adott esetben csak közvetlenül a felhasználásuk előtt (tankmix) különböző típusú olajokat, herbicideket, más fungicideket, kártevőirtószereket, baktericideket adhatunk. Ezeket a szereket a találmány szerinti készítményekhez 1:10-től 10:1-ig terjedő tömegarányban keverhetjük hozzá.

A találmány szerinti készítmények mint fungicidek más hatóanyagokkal, például herbicidekkel, rovarölőkkel, növekedést szabályzókkal, más fungicidekkel vagy akár műtrágyákkal is lehetnek együtt kikészítve. Az (I) általános képletű vegyületeket illetve az ezeket hatóanyagként tartalmazó készítményeket más fungicidekkel összekeverve sok esetben kiszélesedik a fungicid hatás-



spektrum.

A találmány szerinti vegyületekkel együtt alkalmazható fungicidek alábbi felsorolása a kombinációs lehetőségeket szemlélteti csupán, anélkül azonban, hogy a kombinációs lehetőségeket a felsorolás eseteire korlátoznánk:

- kén, ditiokarbamátok és származékaik, így a ferri-dimetil-ditiokarbamát, cink-dimetil-ditiokarbamát, cink-etilén-biszditiokarbamát, mangán-etilén-biszditiokarbamát, mangán-cink-etilén-diamin-biszditiokarbamát, tetrametil-tiurám-diszulfid, cink-(N,N-etilén-biszditiokarbamát) ammóniakomplexe, cink-(N,N'-propilén-biszditiokarbamát) ammóniakomplexe, cink-(N,N'-propilén-biszditiokarbamát), N,N'-polipropilén-bisziokarbamoil-diszulfid;
- nitroszármazékok, így a dinitro-(1-metil-heptil)-fenil-krotonát, 2-szek-butyl-4,6-dinitro-fenil-3,3-dimetil-akrilát, 2-szek-butyl-4,6-dinitro-fenil-izopropil-karbonát, 5-nitro-izoftálsav-diizopropil-észter;
- heterociklusos vegyületek, így a 2-heptadecil-2-imidazolin-acetát, 2-klór-N-(4'-klór-bifenil-2-il)-nikotinamid, 2,4-diklór-6-(o-klór-anilino)-s-triazin, O,O-dietil-ftálimido-foszfotioát, 5-amino-1-[bisz(dimetil-amino)-foszfinil]-3-fenil-1,2,4-triazol, 2,3-diciano-1,4-ditio-antrakinon, 2-tio-1,3-ditiolo-[4,5-b]kinoxalin, 1-(butyl-karbamoil)-2-benzimidazol-karbaminsav-metil-észter, 2-(metoxi-karbonil-amino)-benzimidazol, 2-(2-furil)-benzimidazol, 2-(4-tiazolil)-benzimidazol, N-(1,1,2,2-tetraklór-etil-tio)-tetrahydroftálimid, N-(triklór-metil-tio)-tetrahydroftálimid, N-(triklór-metil-tio)-ftálimid,

- N-(diklór-fluor-metil-tio)-N',N'-dimetil-N-fenil-kénsav-diamid, 5-etoxi-3-(triklór-metil)-1,2,3-tiadiazol, 2-(rodán-metil-tio)-benztiazol, 1,4-diklór-2,5-dimetoxi-benzol, 4-(2-klór-fenil-hidrazono)-3-metil-5-izoxazolon, piridin-2-tio-1-oxid, 8-hidroxiki-kinolin illetve rézsója, 2,3-dihidro-5-karboxanilido-6-metil-1,4-oxatiin, 2,3-dihidro-5-karboxanilido-6-metil-1,4-oxatiin-4,4-dioxid, 2-metil-5,6-dihidro-4H-pirán-3-karbonsav-anilid, 2-metil-furán-3-karbonsav-anilid, 2,5-dimetil-furán-3-karbonsav-anilid, 2,4,5-trimetil-furán-3-karbonsav-anilid, 2,5-dimetil-furán-3-karbonsav-ciklohexil-amid, N-ciklohexil-N-metoxi-2,5-dimetil-furán-3-karbonsavamid, 2-metil-benzoészav-anilid, 2-jód-benzoészav-anilid, N-formil-N-morfolino-2,2,2-triklór-etil-acetál, 1-(3,4-diklór-anilino)-1-(formil-amino)-2,2,2-triklór-etán, 2,6-dimetil-N-tridecyl-morfolin illetve sói, piperazin-1,4-diil-bisz-1-(2,2,2-triklór-etil)-formamid, 2,6-dimetil-N-ciklododecyl-morfolin illetve sói, N-[3-(p-terc-butyl-fenil)-2-metil-propil]-cisz-2,6-dimetil-morfolin, N-[3-(p-terc-butyl-fenil)-2-metil-propil]-piperidin, 1-[2-(2,4-diklór-fenil)-4-etyl-1,3-dioxolán-2-il-etyl]-1H-1,2,4-triazol, 1-[2-(2,4-diklór-fenil)-4-propil-1,3-dioxolán-2-il-etyl]-1H-1,2,4-triazol, N'-imidazolil-N-propil-N-(2,4,6-triklór-fenoxi-etyl)-karbamid, 1-(4-klór-fenoxi)-3,3-dimetil-1-(1H-1,2,4-triazol-1-il)-butanon, 1-(4-klór-fenoxi)-3,3-dimetil-1-(1H-1,2,4-triazol-1-il)-butanol, (2RS,3RS)-1-[3-(2-klór-fenil)-2-(4-fluor-fenil)-oxirán-2-il-metil]-1H-1,2,4-triazol, α -(2-klór-fenil)- α -(4-klór-fenil)-5-pirimidin-metanol, 5-butyl-2-(dimetil-amino)-4-hidrox-6-metil-pirimidin, bisz(p-klór-fenil)-3-piridin-metanol, 1,2-bisz(3-etoxi-karbonil)-2-tioureido-benzol,



1,2-bisz(3-metoxi-karbonil)-2-tioureido-benzol;

- strobilurinok, így a metil-E-(metoxi-imino)-[α -(o-tolil-oxi)-o-tolil]-acetát, metil-E-2-{2-[6-(2-ciano-fenoxi)-pirimidin-4-il-oxi]-fenil}-3-metoxi-akrilát, metil-E-(metoxi-imino)-[α -(2-fenoxi-fenil)-acetamid, metil-E-(metoxi-imino)-[α -(2,5-dimetil-fenoxi)-o-tolil]-acetamid, metil-E-2-{2-[2-(trifluor-metil)-6-piridil-oxi-metil]-fenil}-3-metoxi-akrilát, (E,E)-metoxi-imino-(2-{1-[3-(trifluor-metil)-fenil]-etilidén-amino-oxi-metil}-fenil)-ecetsav-metil-észter, metil-N-{2-[1-(4-klór-fenil)-1H-pirazol-3-il-oxi-metil]-fenil}-N-metoxi-karbamát;
- anilino-pirimidinek, így az N-(4,6-dimetil-2-pirimidinil)-anilin, N-[4-metil-6-(1-propinil)-2-pirimidinil]-anilin és az N-(4-metil-6-ciklopropil-2-pirimidinil)-anilin;
- fenil-pirrolok, így a 4-(2,2-difluor-1,3-benzodioxol-4-il)-pirrol-3-karbonitril;
- fahéjsavamidok, így a 3-(4-klór-fenil)-3-(3,4-dimetoxi-fenil)-akrilsav-morfolid és a 3-(4-fluor-fenil)-3-(3,4-dimetoxi-fenil)-akrilsav-morfolid;
- valamint különféle fungicidek, így a dodecil-guanidin-acetát, 1-(3-bróm-6-metoxi-2-metil-fenil)-1-(2,3,4-trimetoxi-6-metil-fenil)-metanon, 3-[3-(3,5-dimetil-2-oxi-ciklohexil)-2-(hidroxi-etil)]-glutárimid, hexaklór-benzol, D,L-metil-N-(2,6-dimetil-fenil)-N-(2-furoil)-alaninát, D,L-N-(2,6-dimetil-fenil)-N-(2-metoxi-acetil)-alanin-metil-észter, N-(2,6-dimetil-fenil)-N-(klór-acetil)-D,L-2-amino-butirolakton, D,L-N-(2,6-dimetil-fenil)-N-(fenil-acetil)-alanin-metil-észter, 5-metil-5-vinil-3-(3,5-diklór-fenil)-2,4-dioxo-1,3-oxazolidin, 3-[3,5-diklór-fenil-5-metil-5-(metoxi-metil)]-1,3-oxazolidin-2,4-dion, 3-

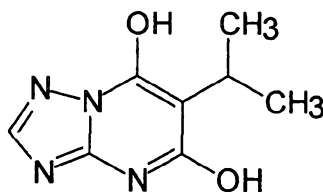
-(3,5-diklór-fenil)-1-(izopropil-karbamoil)-hidantoin, N-(3,5-diklór-fenil)-1,2-dimetil-ciklopropán-1,2-dikarbonsavimid, 2-ciano-[N-(etil-karbamoil)-2-(metoxi-imino)]-acetamid, 1-[2-(2,4-diklór-fenil)-pentil]-1H-1,2,4-triazol, 2,4-difluor- α -(1H-1,2,4-triazol-1-il-metil)-benzhidril-alkohol, N-[3-klór-2,6-dinitro-4-(trifluor-metil)-fenil]-5-(trifluor-metil)-3-klór-2-amino-piridin, 1-{[bis(4-fluor-fenil)-metil-szilil]-metil}-1H-1,2,4-triazol, 5-klór-2-ciano-4-p-tolil-imidazol-1-szulfonsav-dimetil-amid és a 3,5-diklór-N-(3-klór-1-etil-1-metil-2-oxo-propil)-4-metil-benzamid.

Szintézispéldák

Az alábbi szintézispéldákban megadott előiratokat a kiindulási vegyületek megfelelő átalakítása közben további (I) általános képletű vegyületek előállítására használtuk. Az alábbi táblázatban az így kapott vegyületeket fizikai jellemzőikkel együtt soroltuk fel.

1. példa:

5,7-Dihidrox-6-izopropil-1,2,4-triazolo[1,5- α]pirimidin előállítása

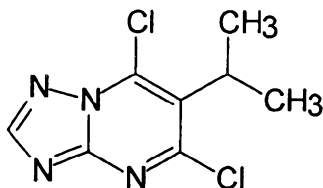


14 g (0,17 mol) 3-amino-1,2,4-triazol, 34,3 g (0,17 mol) dietil-2-izopropil-malonát és 50 ml tributil-amin elegyét 180 °C-on 6 órán át keverjük. Ezután a reakcióelegyet 70 °C-ra lehűtjük, ehhez vizes nátrium-hidroxid-oldatot (21 g NaOH/200 ml víz) adunk, és a reakcióelegyet 30 percig keverjük. A szerves fázist leválasztjuk, és a vizes fázist dietil-éterrel extraháljuk. Végül a

vizes fázist tömény sósavval megsavanyítjuk, és a képződött csapadékot kiszűrjük. Szárítás után 27 g (0,14 mol) cím szerinti vegyületet nyerünk.

2. példa:

5,7-Diklór-6-izopropil-1,2,4-triazolo[1,5- α]pirimidin előállítás

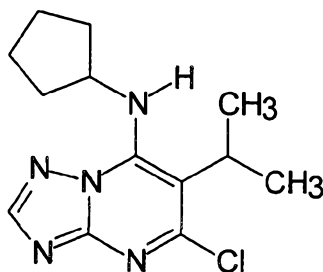


Az 1. példa cím szerinti vegyületének 25 grammját (0,13 mol) 50 ml foszforil-trikloridban 8 órán át visszafolyató hűtő alatt forraljuk. Ezután a foszforil-trikloridot részben ledesztilláljuk, és a bepárlási maradékot metilén-diklorid és víz kétfázisú elegyébe öntjük. A szerves fázist leválasztjuk, megszáritjuk és szűrjük. A szűrletből az oldószert lehajtva 16 g (0,07 mol) cím szerinti vegyületet nyerünk.

Olvadáspontja: 119 °C.

3. példa:

5-Klór-6-izopropil-7-(ciklopentil-amino)-1,2,4-triazolo[1,5- α]pirimidin előállítás



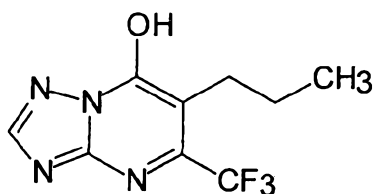
0,13 g (1,5 mmol) ciklopentil-amin, 0,15 g (1,5 mmol) trietil-amin és 10 ml metilén-diklorid elegyét keverés közben 20 ml metilén-dikloridban a 2. példa cím szerinti vegyületének 0,34

grammjához (1,5 mmol) adjuk. A reakcióelegyet szobahőmérsékleten 16 órán át keverjük majd 5%-os sósavval mossuk. A szerves fázist leválasztjuk, nátrium-szulfáttal megszáritjuk és szűrjük. A szűrletből az oldószert lehajtjuk, és a bepárlási maradékot kromatográfiásan megtisztítva 0,32 g (1,14 mmol) cím szerinti vegyületet nyerünk.

Olvadáspontja: 139 °C

4. példa:

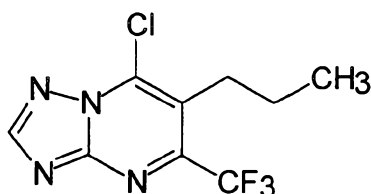
7-Hidroxi-6-propil-5-(trifluor-metil)-1,2,4-triazolo[1,5- α]-pirimidin előállítása



14 g (0,17 mol) 3-amino-1,2,4-triazol, 38,4 g (0,17 mol) 3-oxo-2-propil-4,4,4-trifluor-butanoát és 50 ml tributil-amin elegyét 180 °C-on 6 órán át keverjük. A reakcióelegy feldolgozása az 1. példával analóg módon történik. Szárítás után 33 g (0,13 mol) cím szerinti vegyületet nyerünk.

5. példa:

7-Klór-6-propil-5-(trifluor-metil)-1,2,4-triazolo[1,5- α]-pirimidin előállítása



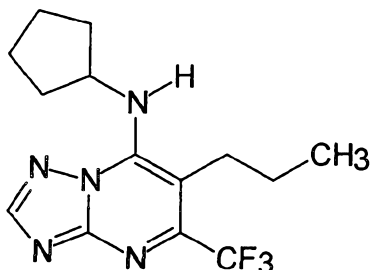
A 4. példa cím szerinti vegyületének 25 grammját (0,10 mol) 50 ml foszforil-trikloridban 8 órán át visszafolyató hűtő alatt forraljuk. A reakcióelegy feldolgozása a 2. példával analóg módon

történik. Így 23 g (0,086 mol) cím szerinti vegyületet nyerünk.

Olvadáspontja: 63 °C

6. példa:

7-(Ciklopentil-amino)-6-propil-5-(trifluor-metil)-1,2,4-triazolo[1,5- α]pirimidin előállítás

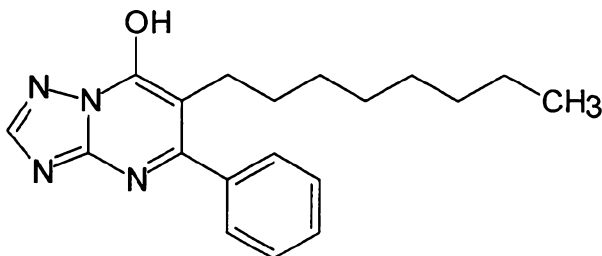


0,13 g (1,5 mmol) ciklopentil-amin, 0,15 g (1,5 mmol) trietil-amin és 10 ml metilén-diklorid elegyét keverés közben 20 ml metilén-dikloridban az 5. példa cím szerinti vegyületének 0,40 grammjához (1,5 mmol) adjuk. A reakcióelegyet szobahőmérsékleten 16 órán át keverjük, majd ennek a feldolgozása a 3. példával analóg módon történik. Így 0,39 g (1,24 mmol) cím szerinti vegyületet nyerünk.

Olvadáspontja: 179 °C

7. példa:

7-Hidroxi-6-oktil-5-fenil-1,2,4-triazolo[1,5- α]pirimidin előállítás

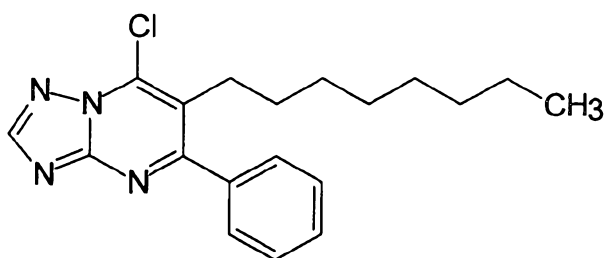


14,0 g (0,17 mol) 3-amino-1,2,4-triazol, 51,7 g (0,17 mol) 3-oxo-2-oktil-4-fenil-butanoát és 3 g p-toluolszulfonsav elegyét

6 órán át visszafolyató hűtő alatt forraljuk. A reakcióelegy feldolgozása az 1. példával analóg módon történik. Szárítás után 37 g (0,11 mol) cím szerinti vegyületet nyerünk.

8. példa:

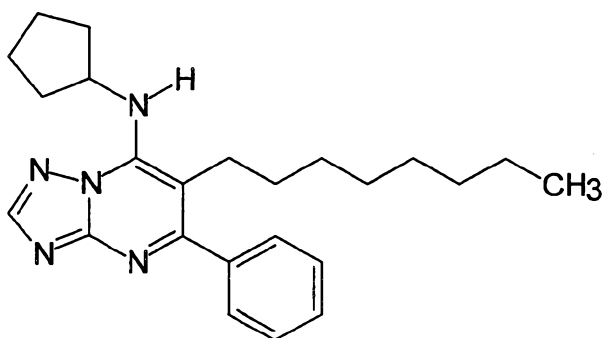
7-Klór-6-oktil-5-fenil-1,2,4-triazolo[1,5- α]pirimidin előállítás



50 ml foszforil-trikloridban a 7. példa cím szerinti vegyületének 17 grammját (0,05 mol) 8 órán át visszafolyató hűtő alatt forraljuk. A reakcióelegy feldolgozása a 2. példával analóg módon történik. Így 16 g (0,046 mol) cím szerinti vegyületet nyerünk.

9. példa:

7-(Ciklopentil-amino)-6-oktil-5-fenil-1,2,4-triazolo[1,5- α]pirimidin előállítás



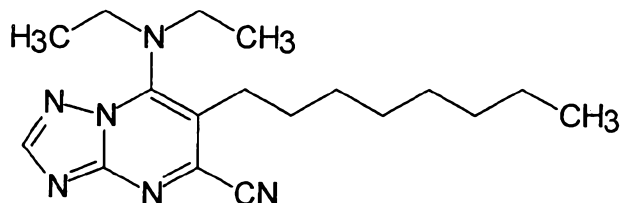
0,13 g (1,5 mmol) ciklopentil-amin, 0,15 g (1,5 mmol) trietil-amin és 10 ml metilén-diklorid elegyét keverés közben 20 ml metilén-dikloridban a 8. példa cím szerinti vegyületének 0,52 grammjához (1,5 mmol) adjuk. A reakcióelegyet szobahőmérsékleten 16 órán át keverjük, majd ennek a feldolgozása a 3. példával

analóg módon történik. Így 0,52 g (1,3 mmol) cím szerinti vegyületet nyerünk.

Olvadáspontja: 81 °C

10. példa:

5-Ciano-6-oktil-7-(diethyl-amino)-1,2,4-triazolo[1,5- α]pirimidin (I-167 számú vegyület) előállítása

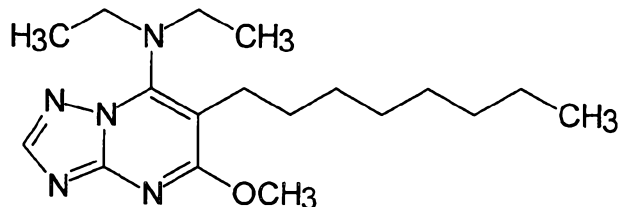


0,1 mol I-48 számú vegyület, 0,25 mol tetraetil-ammónium-cianid és 750 ml dimetil-formamid elegyét 20-25 °C-on mintegy 16 órán át keverjük. A reakcióelegyhez vizet és metil-terc-butyl-étert adva a fázisokat szétválasztjuk. A szerves fázist vízzel mossuk, megszárítjuk és oldószermentesítjük. A bepárlási maradékból Kieselgel tölteten végzett kromatográfiás tisztítás után 8,33 g cím szerinti vegyületet nyerünk.

$^1\text{H-NMR}$ spektruma: δ = 8,5 (s); 3,65 (q); 2,9 (m); 1,7 (m); 1,3 (m); 1,2 (t); 0,9 (t) ppm.

11. példa:

5-Metoxi-6-oktil-7-(diethyl-amino)-1,2,4-triazolo[1,5- α]pirimidin (I-168 számú vegyület) előállítása



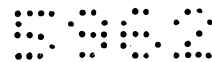
65 mmol I-48 számú vegyületnek 400 ml vízmentes metanollal készült oldatához 20-25 °C-on 71,5 mmol 30%-os nátrium-metanolát-

-oldatot adunk, majd ezt 20-25 °C-on mintegy 16 órán át keverjük. Az oldószert ledesztilláljuk, és a bepárlási maradékot metilén-dikloriddal felvesszük. Ezt az oldatot vízzel mossuk, megszá-
rítjuk és oldószermentesítjük. A bepárlási maradékból Kieselgel tölteten végzett kromatográfiás tisztítás után 7,5 g cím szerin-
ti vegyületet nyerünk.

^1H -NMR spektruma: $\delta = 8,18$ (s); 4,09 (s); 3,41 (q); 2,65 (m);
1,55 (m); 1,3 (m); 1,1 (t); 0,9 (t) ppm.

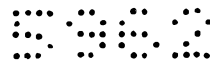
1. táblázat

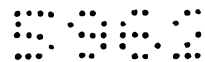
Szám	R ¹	R ²	R ³	X	fizikai adatok (o.p. [°C]; IR [cm ⁻¹]; ¹ H-NMR δ [ppm])
I-1	CH (CH ₃) ₂	H	CH ₃	Cl	169
I-2	-(CH ₂) ₂ CH (CH ₃) (CH ₂) ₂ -		CH ₃	Cl	125
I-3	ciklopentil	H	CH ₃	Cl	172
I-4	CH ₂ -CH ₃	CH ₂ -CH ₃	CH ₃	Cl	96
I-5	CH (CH ₃) -CF ₃	H	CH ₃	Cl	209
I-6	CH ₂ -CF ₃	H	CH ₃	Cl	133
I-7	CH ₂ -C (CH ₃) =CH ₂	CH ₂ -CH ₃	CH ₂ -CH ₃	Cl	55
I-8	CH (CH ₃) ₂		CH ₂ -CH ₃	Cl	152
I-9	-(CH ₂) ₂ CH (CH ₃) (CH ₂) ₂ -		CH ₂ -CH ₃	Cl	1543, 1521, 1451
I-10	ciklopentil	H	CH ₂ -CH ₃	Cl	136
I-11	CH ₂ -CH ₃	CH ₂ -CH ₃	CH ₂ -CH ₃	Cl	1596, 1511, 1464
I-12	(CH ₂) ₂ -CH ₃	(CH ₂) ₂ -CH ₃	CH ₂ -CH ₃	Cl	1595, 1511, 1456
I-13	CH- (CH ₃) ₂	CH ₃	CH ₂ -CH ₃	Cl	1593, 1513, 1097
I-14	(R/S) CH (CH ₃) -CH ₂ -CH ₃	H	CH ₂ -CH ₃	Cl	145
I-15	(R) CH (CH ₃) -CH ₂ -CH ₃	H	CH ₂ -CH ₃	Cl	140
I-16	(S) CH (CH ₃) -CH ₂ -CH ₃	H	CH ₂ -CH ₃	Cl	140
I-17	(R/S) CH (CH ₃) -CH (CH ₃) ₂	H	CH ₂ -CH ₃	Cl	119
I-18	(R) CH (CH ₃) -CH (CH ₃) ₂	H	CH ₂ -CH ₃	Cl	102
I-19	(S) CH (CH ₃) -CH (CH ₃) ₂	H	CH ₂ -CH ₃	Cl	102
I-20	(R/S) CH (CH ₃) -C (CH ₃) ₃	H	CH ₂ -CH ₃	Cl	116



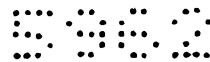
I-21	(R) CH(CH ₃)-C(CH ₃) ₃	H	CH ₂ -CH ₃	Cl	1613, 1555, 1464
I-22	(S) CH(CH ₃)-C(CH ₃) ₃	H	CH ₂ -CH ₃	Cl	1612, 1554, 1464
I-23	(R/S) CH(CH ₃)-CF ₃	H	CH ₂ -CH ₃	Cl	169
I-24	(R) CH(CH ₃)-CF ₃	H	CH ₂ -CH ₃	Cl	140
I-25	(S) CH(CH ₃)-CF ₃	H	CH ₂ -CH ₃	Cl	140
I-26	H	H	CH ₂ -CH ₃	Cl	263
I-27	-(CH ₂) ₂ CH(CH ₃)(CH ₂) ₂ -		(CH ₂) ₃ -CH ₃	Cl	91
I-28	(R/S) CH(CH ₃)-CF ₃	H	(CH ₂) ₃ -CH ₃	Cl	125
I-29	(R) CH(CH ₃)-CF ₃	H	(CH ₂) ₃ -CH ₃	Cl	121
I-30	(S) CH(CH ₃)-CF ₃	H	(CH ₂) ₃ -CH ₃	Cl	121
I-31	CH ₂ -CF ₃	H	(CH ₂) ₃ -CH ₃	Cl	156
I-32	CH ₂ -C(CH ₃)=CH ₂	H	CH ₂ -CH(CH ₃) ₂	Cl	180
I-33	CH(CH ₃) ₂	H	CH ₂ -CH(CH ₃) ₂	Cl	127
I-34	ciklopentil	H	CH ₂ -CH(CH ₃) ₂	Cl	56
I-35	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	CH ₂ -CH(CH ₃) ₂	Cl	163
I-36	CH(CH ₃)-CH ₂ -CH ₃	H	CH ₂ -CH(CH ₃) ₂	Cl	159
I-37	CH(CH ₃) ₂	H	CH(CH ₃)-CH ₂ -CH ₂ -CH ₃	Cl	180
I-38	ciklopentil	H	CH(CH ₃)-CH ₂ -CH ₂ -CH ₃	Cl	127
I-39	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	CH(CH ₃)-CH ₂ -CH ₂ -CH ₃	Cl	56
I-40	(R/S) CH(CH ₃)-CF ₃	H	CH(CH ₃)-CH ₂ -CH ₂ -CH ₃	Cl	163
I-41	CH ₂ -CF ₃	H	CH(CH ₃)-CH ₂ -CH ₂ -CH ₃	Cl	159
I-42	CH(CH ₃) ₂	H	C(CH ₃) ₃	Cl	136
I-43	-(CH ₂) ₂ CH(CH ₃)(CH ₂) ₂ -		C(CH ₃) ₃	Cl	140

I-44	$\text{CH}_2-\text{C}(\text{CH}_3)=\text{CH}_2$	CH_2-CH_3	$(\text{CH}_2)_7-\text{CH}_3$	Cl	2927, 1597, 1508, 1462
I-45	$\text{CH}(\text{CH}_3)_2$	H	$(\text{CH}_2)_7-\text{CH}_3$	Cl	2926, 1613, 1553, 1464
I-46	$-(\text{CH}_2)_2\text{CH}(\text{CH}_3)(\text{CH}_2)_2-$		$(\text{CH}_2)_7-\text{CH}_3$	Cl	2925, 1594, 1520, 1192
I-47	ciklopentil	H	$(\text{CH}_2)_7-\text{CH}_3$	Cl	2927, 1612, 1554, 1059
I-48	CH_2-CH_3	CH_2-CH_3	$(\text{CH}_2)_7-\text{CH}_3$	Cl	2927, 1598, 1511, 1466
I-49	$(\text{CH}_2)_2-\text{CH}_3$	$(\text{CH}_2)_2-\text{CH}_3$	$(\text{CH}_2)_7-\text{CH}_3$	Cl	2927, 1597, 1561, 1457
I-50	$\text{CH}-(\text{CH}_3)_2$	CH_3	$(\text{CH}_2)_7-\text{CH}_3$	Cl	2926, 1595, 1514, 1467
I-51	$(R/S) \text{CH}(\text{CH}_3)-\text{CH}(\text{CH}_3)_2$	H	$(\text{CH}_2)_7-\text{CH}_3$	Cl	2926, 1613, 1553, 1464
I-52	$(R) \text{CH}(\text{CH}_3)-\text{CH}(\text{CH}_3)_2$	H	$(\text{CH}_2)_7-\text{CH}_3$	Cl	2926, 1612, 1553, 1464
I-53	$(S) \text{CH}(\text{CH}_3)-\text{CH}(\text{CH}_3)_2$	H	$(\text{CH}_2)_7-\text{CH}_3$	Cl	2926, 1612, 1552, 1463
I-54	$(R/S) \text{CH}(\text{CH}_3)-\text{C}(\text{CH}_3)_3$	H	$(\text{CH}_2)_7-\text{CH}_3$	Cl	2926, 1613, 1555, 1464
I-55	$(R) \text{CH}(\text{CH}_3)-\text{C}(\text{CH}_3)_3$	H	$(\text{CH}_2)_7-\text{CH}_3$	Cl	2926, 1613, 1556, 1467
I-56	$(S) \text{CH}(\text{CH}_3)-\text{C}(\text{CH}_3)_3$	H	$(\text{CH}_2)_7-\text{CH}_3$	Cl	2925, 1612, 1556, 1466
I-57	$(R/S) \text{CH}(\text{CH}_3)-\text{CF}_3$	H	$(\text{CH}_2)_7-\text{CH}_3$	Cl	1619, 1533, 1146
I-58	$(R) \text{CH}(\text{CH}_3)-\text{CF}_3$	H	$(\text{CH}_2)_7-\text{CH}_3$	Cl	1620, 1542, 1146
I-59	$(S) \text{CH}(\text{CH}_3)-\text{CF}_3$	H	$(\text{CH}_2)_7-\text{CH}_3$	Cl	1619, 1541, 1146
I-60	$\text{CH}_2-\text{C}(\text{CH}_3)=\text{CH}_2$	CH_2-CH_3	$\text{CH}(\text{CH}_3)_2$	Cl	71
I-61	$\text{CH}(\text{CH}_3)_2$	H	$\text{CH}(\text{CH}_3)_2$	Cl	180
I-62	CH_2-CH_3	CH_2-CH_3	$\text{CH}(\text{CH}_3)_2$	Cl	91
I-63	$(\text{CH}_2)_2-\text{CH}_3$	$(\text{CH}_2)_2-\text{CH}_3$	$\text{CH}(\text{CH}_3)_2$	Cl	1592, 1506, 1454
I-64	$\text{CH}-(\text{CH}_3)_2$	CH_3	$\text{CH}(\text{CH}_3)_2$	Cl	85
I-65	$(R/S) \text{CH}(\text{CH}_3)-\text{CH}_2-\text{CH}_3$	H	$\text{CH}(\text{CH}_3)_2$	Cl	1616, 1544, 1463
I-66	$(R) \text{CH}(\text{CH}_3)-\text{CH}_2-\text{CH}_3$	H	$\text{CH}(\text{CH}_3)_2$	Cl	160

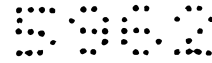




I-67	(S) CH(CH ₃)-CH ₂ -CH ₃	H	CH(CH ₃) ₂	Cl	160
I-68	(R/S) CH(CH ₃)-CH(CH ₃) ₂	H	CH(CH ₃) ₂	Cl	134
I-69	(R) CH(CH ₃)-CH(CH ₃) ₂	H	CH(CH ₃) ₂	Cl	120
I-70	(S) CH(CH ₃)-CH(CH ₃) ₂	H	CH(CH ₃) ₂	Cl	120
I-71	(R/S) CH(CH ₃)-C(CH ₃) ₃	H	CH(CH ₃) ₂	Cl	2964, 1611, 1551
I-72	(R) CH(CH ₃)-C(CH ₃) ₃	H	CH(CH ₃) ₂	Cl	64
I-73	(S) CH(CH ₃)-C(CH ₃) ₃	H	CH(CH ₃) ₂	Cl	64
I-74	(R/S) CH(CH ₃)-CF ₃	H	CH(CH ₃) ₂	Cl	1616, 1527, 1147
I-75	(R) CH(CH ₃)-CF ₃	H	CH(CH ₃) ₂	Cl	70
I-76	(S) CH(CH ₃)-CF ₃	H	CH(CH ₃) ₂	Cl	70
I-77	H	H	CH(CH ₃) ₂	Cl	271
I-78	CH ₂ -C(CH ₃)=CH ₂	CH ₂ -CH ₃	ciklopentil	Cl	66
I-79	CH(CH ₃) ₂	H	ciklopentil	Cl	136
I-80	CH ₂ -CH ₃	CH ₂ -CH ₃	ciklopentil	Cl	78
I-81	(CH ₂) ₂ -CH ₃	(CH ₂) ₂ -CH ₃	ciklopentil	Cl	87
I-82	CH ₂ -C(CH ₃)=CH ₂	CH ₂ -CH ₃	ciklohexil	Cl	136
I-83	CH(CH ₃) ₂	H	ciklohexil	Cl	156
I-84	-(CH ₂) ₂ CH(CH ₃)(CH ₂) ₂ -		ciklohexil	Cl	151
I-85	ciklopentil	H	ciklohexil	Cl	158
I-86	CH ₂ -CH ₃	CH ₂ -CH ₃	ciklohexil	Cl	103
I-87	(CH ₂) ₂ -CH ₃	(CH ₂) ₂ -CH ₃	ciklohexil	Cl	139
I-88	CH-(CH ₃) ₂	CH ₃	ciklohexil	Cl	134
I-89	(R/S) CH(CH ₃)-CH ₂ -CH ₃	H	ciklohexil	Cl	155

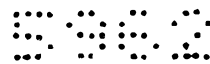


I-90	(R)	CH(CH ₃)-CH ₂ -CH ₃	H	ciklohexil	Cl	155
I-91	(S)	CH(CH ₃)-CH ₂ -CH ₃	H	ciklohexil	Cl	155
I-92	(R/S)	CH(CH ₃)-CH(CH ₃) ₂	H	ciklohexil	Cl	114
I-93	(R)	CH(CH ₃)-CH(CH ₃) ₂	H	ciklohexil	Cl	110
I-94	(S)	CH(CH ₃)-CH(CH ₃) ₂	H	ciklohexil	Cl	110
I-95	(R/S)	CH(CH ₃)-C(CH ₃) ₃	H	ciklohexil	Cl	134
I-96	(R)	CH(CH ₃)-C(CH ₃) ₃	H	ciklohexil	Cl	116
I-97	(S)	CH(CH ₃)-C(CH ₃) ₃	H	ciklohexil	Cl	116
I-98	(R/S)	CH(CH ₃)-CF ₃	H	ciklohexil	Cl	160
I-99	(R)	CH(CH ₃)-CF ₃	H	ciklohexil	Cl	130
I-100	(S)	CH(CH ₃)-CF ₃	H	ciklohexil	Cl	130
I-101		CH ₂ -CF ₃	H	ciklohexil	Cl	167
I-102		-(CH ₂) ₂ CH(CH ₃)(CH ₂) ₂ -		CH ₂ -C ₆ H ₅	Cl	144
I-103		CH ₂ -C(CH ₃)=CH ₂	CH ₂ -CH ₃	CH ₂ -(2-Cl-C ₆ H ₄)	Cl	114
I-104		-(CH ₂) ₂ CH(CH ₃)(CH ₂) ₂ -		CH ₂ -(2-Cl-C ₆ H ₄)	Cl	164
I-105		CH ₂ -C(CH ₃)=CH ₂	CH ₂ -CH ₃	CH ₂ -CH=CH ₂	Cl	55
I-106		-(CH ₂) ₂ CH(CH ₃)(CH ₂) ₂ -		CH ₂ -CH=CH ₂	Cl	37
I-107		ciklopentil	H	CH ₂ -CH=CH ₂	Cl	43
I-108	(R/S)	CH(CH ₃)-CF ₃	H	ciklopropil-metil	Cl	150
I-109		CH ₂ -CF ₃	H	ciklopropil-metil	Cl	144
I-110		CH(CH ₃) ₂	H	CH ₂ -CH ₂ -CN	Cl	211
I-111		CH ₂ -C(CH ₃)=CH ₂	CH ₂ -CH ₃	CH ₂ -CF ₃	Cl	84
I-112		CH(CH ₃) ₂	H	CH ₂ -CF ₃	Cl	151

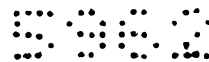


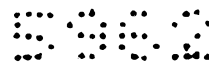
I-113	ciklopentil	H	CH ₂ -CF ₃	Cl	163
I-114	CH ₂ -CH ₃	CH ₂ -CH ₃	CH ₂ -CF ₃	Cl	103
I-115	(CH ₂) ₂ -CH ₃	(CH ₂) ₂ -CH ₃	CH ₂ -CF ₃	Cl	107
I-116	CH-(CH ₃) ₂	CH ₃	CH ₂ -CF ₃	Cl	88
I-117	(R/S) CH(CH ₃)-CH ₂ -CH ₃	H	CH ₂ -CF ₃	Cl	131
I-118	(R) CH(CH ₃)-CH ₂ -CH ₃	H	CH ₂ -CF ₃	Cl	126
I-119	(S) CH(CH ₃)-CH ₂ -CH ₃	H	CH ₂ -CF ₃	Cl	126
I-120	(R/S) CH(CH ₃)-CH(CH ₃) ₂	H	CH ₂ -CF ₃	Cl	114
I-121	(R) CH(CH ₃)-CH(CH ₃) ₂	H	CH ₂ -CF ₃	Cl	112
I-122	(S) CH(CH ₃)-CH(CH ₃) ₂	H	CH ₂ -CF ₃	Cl	112
I-123	(R/S) CH(CH ₃)-C(CH ₃) ₃	H	CH ₂ -CF ₃	Cl	110
I-124	(R) CH(CH ₃)-C(CH ₃) ₃	H	CH ₂ -CF ₃	Cl	105
I-125	(S) CH(CH ₃)-C(CH ₃) ₃	H	CH ₂ -CF ₃	Cl	105
I-126	(R/S) CH(CH ₃)-CF ₃	H	CH ₂ -CF ₃	Cl	179
I-127	(R) CH(CH ₃)-CF ₃	H	CH ₂ -CF ₃	Cl	125
I-128	(S) CH(CH ₃)-CF ₃	H	CH ₂ -CF ₃	Cl	125
I-129	H	H	CH ₂ -CF ₃	Cl	243
I-130	CH(CH ₃) ₂	H	(CH ₂) ₇ -CH ₃	CF ₃	91
I-131	-(CH ₂) ₂ CH(CH ₃)(CH ₂) ₂ -		(CH ₂) ₇ -CH ₃	CF ₃	64
I-132	ciklopentil	H	(CH ₂) ₇ -CH ₃	CF ₃	84
I-133	H	H	(CH ₂) ₇ -CH ₃	CF ₃	177
I-134	CH(CH ₃) ₂	H	(CH ₂) ₂ -CH ₃	CF ₃	162
I-135	-(CH ₂) ₂ CH(CH ₃)(CH ₂) ₂ -		(CH ₂) ₂ -CH ₃	CF ₃	108

I-136	(R) CH(CH ₃)-C(CH ₃) ₃	H	(CH ₂) ₂ -CH ₃	CF ₃	101
I-137	(S) CH(CH ₃)-C(CH ₃) ₃	H	(CH ₂) ₂ -CH ₃	CF ₃	101
I-138	H	H	(CH ₂) ₂ -CH ₃	CF ₃	241
I-139	CH(CH ₃) ₂	H	(CH ₂) ₇ -CH ₃	C ₆ H ₅	83
I-140	-(CH ₂) ₂ CH(CH ₃)(CH ₂) ₂ -		(CH ₂) ₇ -CH ₃	C ₆ H ₅	63
I-141	H	H	(CH ₂) ₇ -CH ₃	C ₆ H ₅	163
I-142	-(CH ₂) ₂ CH(CH ₃)(CH ₂) ₂ -		ciklopentil	Cl	2960, 1610, 1550, 1241
I-143	ciklopentil	H	ciklopentil	Cl	154
I-144	CH-(CH ₃) ₂	CH ₃	ciklopentil	Cl	2958, 1610, 1548, 1239
I-145	(R/S) CH(CH ₃)-CH ₂ -CH ₃	H	ciklopentil	Cl	143
I-146	(S) CH(CH ₃)-CH ₂ -CH ₃	H	ciklopentil	Cl	137
I-147	(R) CH(CH ₃)-CH ₂ -CH ₃	H	ciklopentil	Cl	137
I-148	(R/S) CH(CH ₃)-CH(CH ₃) ₂	H	ciklopentil	Cl	124
I-149	(S) CH(CH ₃)-CH(CH ₃) ₂	H	ciklopentil	Cl	110
I-150	(R) CH(CH ₃)-CH(CH ₃) ₂	H	ciklopentil	Cl	110
I-151	(R/S) CH(CH ₃)-C(CH ₃) ₃	H	ciklopentil	Cl	113
I-152	(S) CH(CH ₃)-C(CH ₃) ₃	H	ciklopentil	Cl	2962, 1610, 1550, 1241
I-153	(R) CH(CH ₃)-C(CH ₃) ₃	H	ciklopentil	Cl	2960, 1610, 1549, 1241
I-154	(R/S) CH(CH ₃)-CF ₃	H	ciklopentil	Cl	129
I-155	(S) CH(CH ₃)-CF ₃	H	ciklopentil	Cl	135
I-156	(R) CH(CH ₃)-CF ₃	H	ciklopentil	Cl	135
I-157	H	H	CH(CH ₃)-(CH ₂) ₅ -CH ₃	CF ₃	129
I-158	H	H	(CH ₂) ₃ -CH(CH ₃) ₂	CF ₃	213



I-159	H	H	(CH ₂) ₆ -CH ₃	CF ₃	180
I-160	H	H	(CH ₂) ₅ -CH ₃	CF ₃	208
I-161	H	H	CH(CH ₂ CH ₃)-(CH ₂) ₃ -CH ₃	CF ₃	162
I-162	H	H	CH(CH ₂ CH ₂ CH ₃) ₂	CF ₃	164
I-163	H	H	CH(CH ₃)-(CH ₂) ₃ -CH ₃	CF ₃	148
I-164	H	H	(CH ₂) ₇ -CH ₃	Cl	277
I-165	H	H	ciklopentil	Cl	8,4(s); 8,2(m); 3,45(m); 1,95(m); 1,8(m); 1,6(m)
I-166	H	H	ciklohexil	Cl	8,45(s); 8,2(m); 3,1(m); 2,1(m); 1,8(m); 1,55(m); 1,4(m)
I-167	CH ₂ -CH ₃	CH ₂ -CH ₃	(CH ₂) ₇ -CH ₃	CN	lásd a 10. példát
I-168	CH ₂ -CH ₃	CH ₂ -CH ₃	(CH ₂) ₇ -CH ₃	OCH ₃	lásd a 11. példát





Példák a káros gombák elleni hatásra.

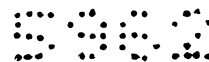
Az (I) általános képletű vegyületek fungicid hatását az alábbi kísérletek mutatják:

A hatóanyagokat együtt vagy egymástól elkülönítve egy 70 tömeg% ciklohexanonból, 20 tömeg% Nekanil® LN-ből (Lutensol® AP6, emulgeáló- és diszpergálóhatású, etoxilezett alkil-fenol bázisú nedvesítőszer) és 10 tömeg% Wettol® EM-ből (etoxilezett ricinusolaj bázisú nem ionos emulgeátor) álló elegyben 10%-os emulzióvá dolgoztuk fel, amit a kívánt koncentrációnak megfelelően vízzel meghígítottunk.

1. alkalmazási példa: — *Botrytis cinerea* elleni hatás, paprika-leveleken

4-5 levelet már jól kifejlesztett „Neusiedler Ideal Elite” fajtajú paprikacsíranövényeket cseppnedvesre permeteztünk be olyan vizes hatóanyag-készítménnyel, amit egy 10% hatóanyagból, 85% ciklohexanonból és 5% emulgeálószerből álló törzsoldatból készítettünk. Másnap a kezelt növényeket megfertőztük a *Botrytis cinerea* spóráiból készült egy 2%-os biomalátaoldatban $1,7 \times 10^6$ spóra/ml koncentrációjú spóraszuszpenzióval. Végül a kísérleti növényeket egy 22-24 °C-os, nagy relatív légnedvességű klímakamrába állítottuk. 5 nap múlva százalékos értékben vizuálisan megállapíthattuk a leveleken a gombabetegség kifejlődésének a mértékét.

Ebben a kísérletben a 250 ppm koncentrációjú I-10, I-61, I-65, I-66, I-68, I-69, I-76, I-78, I-84, I-100, I-101, I-146 és az I-153 — I-155 számú hatóanyagokkal kezelt növények fertőzöttsége 0%-os vagy legfeljebb 15%-os volt, míg a kezeletlen növényeké a 90%-ot is elérte.



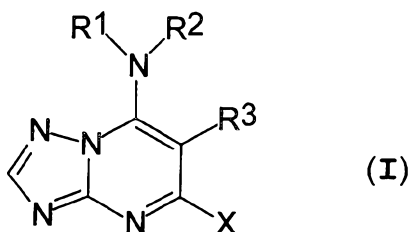
2. alkalmazási példa: — A *Plasmopara viticola* elleni hatás, szőlőn

Cserépben nevelt „Müller-Thurgau” fajtájú szőlő leveleit cseppnedvesre permeteztük be olyan vizes hatóanyag-készítménnyel, amit egy 10% hatóanyagból, 85% ciklohexanonból és 5% emulgeálószerből álló törzsoldatból készítettünk. Másnap a leveleket megfertőztük a *Plasmopara viticola* spóráiból készült vizes spóraszuszpenzióval. Ezután a kísérleti növényeket előbb 48 órára egy vízgőzzel telített levegőjű, 24 °C-os kamrába majd 5 napra egy 20-30 °C-os üvegházba állítottuk. Ezután a spóratokok feltörésének a meggyorsítása céljából a növényeket 16 órára újból a nedves levegőjű kamrába állítottuk. Ezt követte a levelek fonák oldalán a fertőzöttség mértékének a vizuális meghatározása.

Ebben a kísérletben a 250 ppm koncentrációjú I-8, I-9, I-10, I-19, I-25, I-27, I-49, I-60, I-61, I-62, I-69, I-84, I-101, I-113, I-133, I-146 és I-153 — I-155 számú hatóanyagokkal kezelt növények fertőzöttsége 0%-os vagy legfeljebb 15%-os volt, míg a kezeletlen növényeké a 85%-ot is elérte.

Szabadalmi igénypontok

1. Az



általános képletű 7-amino-triazolopirimidinek — amely képletben R^1 és R^2 jelentése hidrogénatom, 1-10 szénatomos alkil-, 2-10 szénatomos alkenil-, 2-10 szénatomos alkinil-, 3-8 szénatomos cikloalkil-, fenil-, naftilcsoport; vagy

heteroatomként egy-négy nitrogénatomot vagy egy-három nitrogénatomot és egy kén- vagy oxigénatomot tartalmazó 5 vagy 6 tagú heterociklilcsoport; vagy

heteroatomként egy-négy nitrogénatomot vagy egy-három nitrogénatomot és egy kén- vagy oxigénatomot tartalmazó 5 vagy 6 tagú heteroarilcsoport,

ahol, ha R^1 és R^2 jelentése a hidrogénatomtól eltérő, akkor ezek egymástól függetlenül részben vagy teljesen halogénezettek és/vagy egy-három R^a csoporttal szubsztituáltak lehetnek, ahol

R^a jelentése ciano-, nitro-, hidroxil-, 1-6 szénatomos alkil-, 1-6 szénatomos halogén-alkil-, 3-6 szénatomos cikloalkil-, 1-6 szénatomos alkoxi-, 1-6 szénatomos halogén-alkoxi-, 1-6 szénatomos alkil-tio-, 1-6 szénatomos alkil-amino-, alkil-részenként 1-6 szénatomos dialkil-amino-, 2-6 szénatomos alkenil-, 2-6 szénatomos alkenil-oxi-, 2-6 szénatomos alkinil-, 3-6 szénatomos alkinil-oxi- és adott esetben halogén-

nezett 1-4 szénatomos oxi-alkilén-oxicsoport; vagy

R^1 és R^2 a közöttük levő nitrogénatommal együtt egy olyan 5 vagy 6 tagú gyűrűt képez, amely heteroatomként egy-négy nitrogénatomot vagy egy-három nitrogénatomot és egy kén- vagy oxigénatomot tartalmaz, és amelyet egy-három R^a csoport szubsztituálhat;

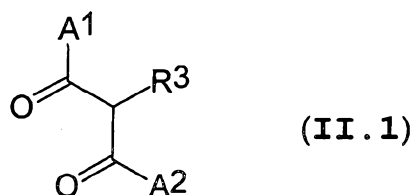
R^3 jelentése 1-10 szénatomos alkil-, 2-10 szénatomos alkenil-, 2-10 szénatomos alkinil-, 3-8 szénatomos cikloalkil- vagy az alkilrészben 1-10 szénatomos fenil-alkilcsoport, amelyek szubsztituálatlanok vagy részben vagy teljesen halogénezettek és/vagy egy-három R^a csoporttal szubsztituáltak lehetnek; vagy 1-10 szénatomos halogén-alkilcsoport, amelyet egy-három R^a csoport szubsztituálhat;

X jelentése halogénatom, ciano-, 1-4 szénatomos alkoxi-, 1-4 szénatomos halogén-alkil-, fenil- vagy R^a csoporttal szubsztituált fenilcsoport —

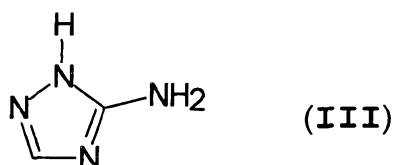
és sóik.

2. Az 1. igénypont szerinti olyan (I) általános képletű 7-amino-triazolopirimidinek, amelyek képletében X halogénatomot jelent.

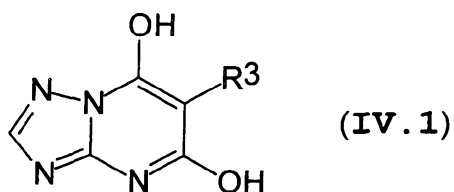
3. Eljárás az 1. igénypont szerinti olyan (I) általános képletű 7-amino-triazolopirimidinek előállítására, amelyek képletében X halogénatomot, ciano- vagy 1-4 szénatomos alkoxicsoportot jelent, azzal jellemezve, hogy



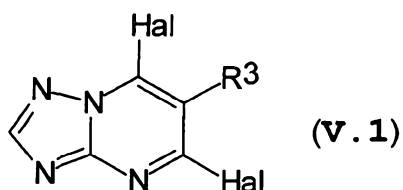
általános képletű dikarbonil-vegyületeket — a képletben A^1 és A^2 1-10 szénatomos alkoxicsoportot jelent —



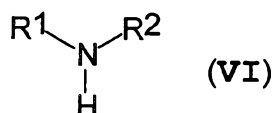
képletű 3-amino-1,2,4-triazollal egy gyűrűzárási reakcióban a megfelelő



általános képletű hidrox-triazolopirimidinekké reagáltatjuk, amelyeket egy halogénezőszerezrel a megfelelő



általános képletű halogén-triazolopirimidinekké — a képletben Hal halogénatomot jelent — alakítunk át, amelyeket végül egy



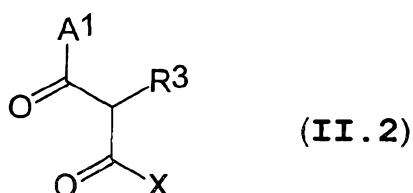
általános képletű aminnal reagáltatva olyan (I) általános képletű 7-amino-triazolopirimidineket nyerünk, amelyek képletében X halogénatomot jelent, és az olyan (I) általános képletű 7-amino-triazolopirimidinek előállítása esetében, amelyek képletében X ciano- vagy 1-4 szénatomos alkoxicsoportot jelent, ezeket egy



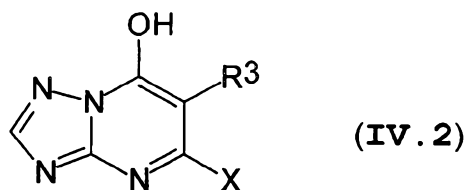
általános képletű vegyülettel — a képletben M egy ammónium-, tetraalkil-ammónium-, alkálifém- vagy alkáliföldfémkationt és X'

ciano- vagy alkoxicsoportot jelent — reagáltatjuk.

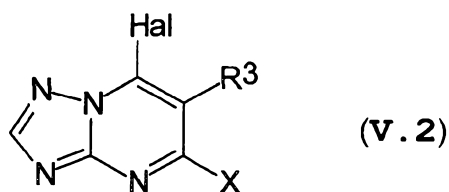
4. Eljárás az 1. igénypont szerinti olyan (I) általános képletű 7-amino-triazolopirimidinek előállítására, amelyek képletében X 1-4 szénatomos halogén-alkil- vagy adott esetben R^a csoporttal szubsztituált fenilcsoportot jelent, azzal jellemezve, hogy



általános képletű dikarbonil-vegyületeket — a képletben A¹ 1-10 szénatomos alkoxicsoportot és X 1-4 szénatomos halogén-alkil- vagy adott esetben R^a csoporttal szubsztituált fenilcsoportot jelent — a 3. igénypontban megadott (III) képletű 3-amino-1,2,4-triazollal egy gyűrűzárási reakcióban a megfelelő



általános képletű hidrox-triazolopirimidinekké reagáltatunk, amelyeket egy halogénezőszerezrel a megfelelő



általános képletű halogén-triazolopirimidinekké — a képletben Hal halogénatomot jelent — alakítunk át, amelyeket végül egy 3. igénypontban megadott (VI) általános képletű aminnal az (I) általános képletű 7-amino-triazolopirimidinekké reagáltatunk.

5. Készítmény káros gombák leküzdésére, amely egy szilárd vagy folyékony hordozóanyagot és hatóanyagként egy 1. igénypont szerinti (I) általános képletű 7-amino-triazolopirimidint tartalmaz.

6. Az 1. igénypont szerinti (I) általános képletű 7-amino-triazolopirimidinek alkalmazása káros gombák leküzdésére alkalmas készítmény előállítására.

7. Eljárás káros gombák leküzdésére, azzal jellemezve, hogy a gombákat vagy a gombafertőzéstől megvédeni kívánt anyagokat, növényeket, vetőmagot vagy magát a talajt egy 1. igénypont szerinti (I) általános képletű 7-amino-triazolopirimidin hatásos mennyiségével kezeljük.

+ 4 réteg csecc
20'
04/08/23

A meghatalmazott:

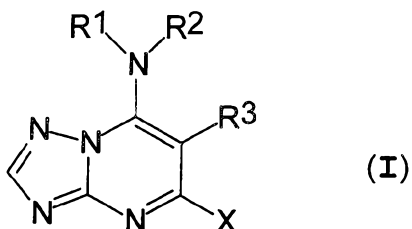


S. B. G. & K.

Szabadalmi Ügyvivői Iroda
H-1062 Budapest, Andrássy út 113.
Telefon: 461-1000, Fax: 461-1099

EREDETI SZABADALMI IGÉNYPONTOK

1. Az



általános képletű 7-amino-triazolopirimidinek — amely képletben R^1 és R^2 jelentése hidrogénatom, 1-10 szénatomos alkil-, 2-10 szénatomos alkenil-, 2-10 szénatomos alkinil-, 3-8 szénatomos cikloalkil-, fenil-, naftilcsoport; vagy heteroatomként egy-négy nitrogénatomot vagy egy-három nitrogénatomot és egy kén- vagy oxigénatomot tartalmazó 5 vagy 6 tagú heterociklilcsoport; vagy heteroatomként egy-négy nitrogénatomot vagy egy-három nitrogénatomot és egy kén- vagy oxigénatomot tartalmazó 5 vagy 6 tagú heteroarilcsoport, ahol ha R^1 és R^2 jelentése a hidrogénatomtól eltérő, úgy ezek egymástól függetlenül részben vagy teljesen halogénezettek és/vagy egy-három R^a csoporttal szubsztituáltak lehetnek, ahol R^a jelentése ciano-, nitro-, hidroxil-, 1-6 szénatomos alkil-, 1-6 szénatomos halogén-alkil-, 3-6 szénatomos cikloalkil-, 1-6 szénatomos alkoxi-, 1-6 szénatomos halogén-alkoxi-, 1-6 szénatomos alkil-tio-, 1-6 szénatomos alkil-amino-, alkil-részenként 1-6 szénatomos dialkil-amino-, 2-6 szénatomos alkenil-, 2-6 szénatomos alkenil-oxi-, 2-6 szénatomos alkinil-, 3-6 szénatomos alkinil-oxi- és adott esetben halogénezett 1-4 szénatomos oxi-alkilén-oxicssoport; vagy

R^1 és R^2 a közöttük levő nitrogénatommal együtt egy olyan 5 vagy 6 tagú gyűrűt képez, amely heteroatomként egy-négy nitrogénatomot vagy egy-három nitrogénatomot és egy kén- vagy oxigénatomot tartalmaz, és amelyet egy-három R^a csoport szubsztituálhat;

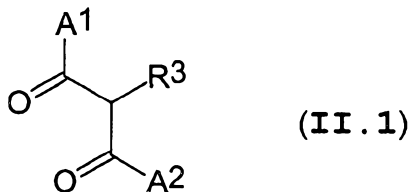
R^3 jelentése 1-10 szénatomos alkil-, 2-10 szénatomos alkenil-, 2-10 szénatomos alkinil-, 3-8 szénatomos cikloalkil- vagy az alkilrészben 1-10 szénatomos fenil-alkilcsoport, amelyek szubsztituálatlanok vagy részben vagy teljesen halogénezettek és/vagy egy-három R^a csoporttal szubsztituáltak lehetnek; vagy 1-10 szénatomos halogén-alkilcsoport, amelyet egy-három R^a csoport szubsztituálhat;

X jelentése halogénatom, ciano-, 1-4 szénatomos alkoxi-, 1-4 szénatomos halogén-alkil-, fenil- vagy R^a csoporttal szubsztituált fenilcsoport —

valamint sóik.

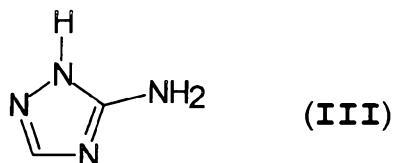
2. Az 1. igénypont szerinti olyan (I) általános képletű 7-amino-triazolopirimidinek, amelyek képletében X halogénatomot jelent.

3. Eljárás az 1. igénypont szerinti olyan (I) általános képletű 7-amino-triazolopirimidinek előállítására, amelyek képletében X halogénatomot, ciano- vagy 1-4 szénatomos alkoxicsoprotot jelent, azzal jellemezve, hogy

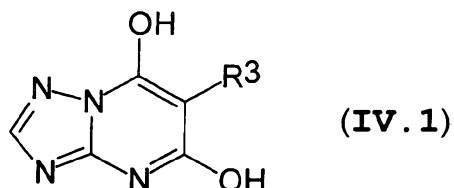


általános képletű dikarbonil-vegyületeket — a képletben A^1 és A^2

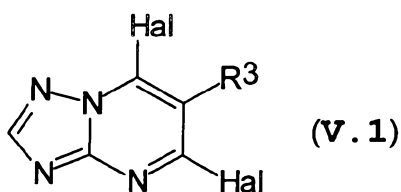
1-10 szénatomos alkoxicsoportot jelent —



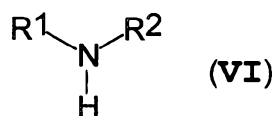
képletű 3-amino-1,2,4-triazollal egy gyűrűzárási reakcióban reagáltatva nyerjük a megfelelő



általános képletű hidrox-triazolopirimidineket, amiket egy halogénezőszerezrel a megfelelő



általános képletű halogén-triazolopirimidinekké — a képletben Hal halogénatomot jelent — alakítunk át, amiket végül egy

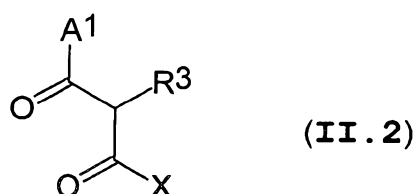


általános képletű aminnal reagáltatva nyerjük az olyan (I) általános képletű 7-amino-triazolopirimidineket, amelyek képletében X halogénatomot jelent, és az olyan (I) általános képletű 7-amino-triazolopirimidinek előállítására, amelyek képletében X ciano- vagy 1-4 szénatomos alkoxicsoportot jelent, ezeket egy

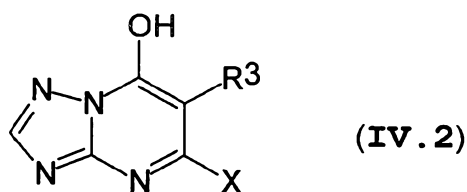


általános képletű vegyülettel — a képletben M egy ammónium-, tetraalkil-ammónium-, alkálifém- vagy alkáliföldfémkationt és X' ciano- vagy alkoxicsoportot jelent — reagáltatjuk.

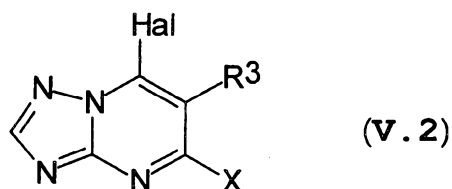
4. Eljárás az 1. igénypont szerinti olyan (I) általános képletű 7-amino-triazolopirimidinek előállítására, amelyek képletében X 1-4 szénatomos halogén-alkil- vagy adott esetben R^a csoporttal szubsztituált fenilcsoportot jelent, azzal jellemezve, hogy



általános képletű dikarbonil-vegyületeket — a képletben A¹ 1-10 szénatomos alkoxicsoprotot és X 1-4 szénatomos halogén-alkil- vagy adott esetben R^a csoporttal szubsztituált fenilcsoportot jelent — a 3. igénypont szerinti (III) képletű 3-amino-1,2,4-triazollal egy gyűrűzárási reakcióban reagáltatva nyerjük a megfelelő

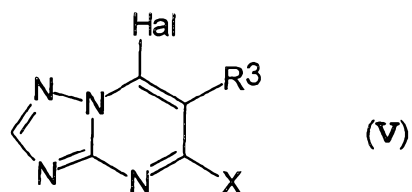
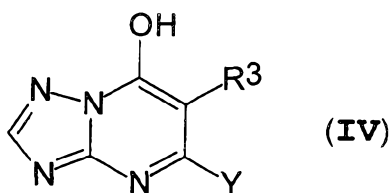


általános képletű hidrox-triazolopirimidineket, amiket egy halogénezőszersrel a megfelelő



általános képletű halogén-triazolopirimidinekké — a képletben Hal halogénatomot jelent — alakítunk át, amiket végül a 3. igénypont szerinti (VI) általános képletű aminnal reagáltatva nyerjük az (I) általános képletű 7-amino-triazolopirimidineket.

5. A



általános képletű 7-hidroxi- és 7-halogén-triazolopirimidinek, a képletekben Y hidroxicsoportot vagy az X csoportok egyikét jelenti, Hal halogénatomot jelent és R³ valamint X jelentése az alábbiakban megadott:

R³ jelentése 1-10 szénatomos alkil-, 2-10 szénatomos alkenil-, 2-10 szénatomos alkinil-, 3-8 szénatomos cikloalkil- vagy az alkilrészben 1-10 szénatomos fenil-alkilcsoport, amelyek szubsztituálatlanok vagy részben vagy teljesen halogénezettek és/vagy egy-három R^a csoporttal szubsztituáltak lehetnek; vagy 1-10 szénatomos halogén-alkilcsoport, amelyet egy-három R^a csoport szubsztituálhat; ahol

R^a jelentése ciano-, nitro-, hidroxi-, 1-6 szénatomos alkil-, 1-6 szénatomos halogén-alkil-, 3-6 szénatomos cikloalkil-, 1-6 szénatomos alkoxi-, 1-6 szénatomos halogén-alkoxi-, 1-6 szénatomos alkil-tio-, 1-6 szénatomos alkil-amino-, alkil-részenként 1-6 szénatomos dialkil-amino-, 2-6 szénatomos alkenil-, 2-6 szénatomos alkenil-oxi-, 2-6 szénatomos alkinil-, 3-6 szénatomos alkinil-oxi- és adott esetben halogénezett 1-4 szénatomos oxi-alkilén-oxicsoport;

X jelentése halogénatom, ciano-, 1-4 szénatomos alkoxi-, 1-4 szénatomos halogén-alkil-, fenil- vagy R^a csoporttal szubsztituált fenilcsoport.

6. Káros gombák leküzdésére alkalmas készítmény, amely egy szilárd vagy folyékony hordozóanyagot és hatóanyagként egy, az 1. igénypont szerinti (I) általános képletű 7-amino-triazolopirimidint tartalmaz.

7. Az 1. igénypont szerinti (I) általános képletű 7-amino-triazolopirimidinek alkalmazása, a káros gombák leküzdésére alkalmas készítmény előállítására.

8. Eljárás káros gombák leküzdésére, azzal jellemezve, hogy a gombákat vagy a gombafertőzéstől megvédeni kívánt anyagokat, növényeket, vetőmagot vagy magát a talajt egy, az 1. igénypont szerinti (I) általános képletű 7-amino-triazolopirimidin hatásos mennyiségével kezeljük.