



H U 0 0 0 2 1 7 6 6 1 B

(19) Országkód

HU

MAGYAR
KÖZTÁRSASÁGMAGYAR
SZABADALMI
HIVATALSZABADALMI
LEÍRÁS

(11) Lajstromszám:

217 661 B

(21) A bejelentés ügyszám: P 94 02502
(22) A bejelentés napja: 1993. 03. 05.
(23) Módosítási elsőbbség: 1994. 07. 01.
(30) Elsőbbségi adatok:
07/848,622 1992. 03. 09. US
(86) Nemzetközi bejelentési szám: PCT/US 93/01961
(87) Nemzetközi közzétételi szám: WO 93/18008

(51) Int. Cl.⁷

C 07 D 231/56

C 07 D 401/04

A 01 N 43/56

(40) A közzététel napja: 1995. 11. 28.
(45) A megadás meghirdetésének dátuma a Szabadalmi
Közlönyben: 2000. 03. 28.

(72) Feltalálók:

Baker, Don R., Orinda, Kalifornia (US)
Fitzjohn, Steven, Brecknell, Berkshire (GB)
Gerdes, John M., Fairfax, Kalifornia (US)
James, Donald Richard, El Sobrante, Kalifornia (US)
Knudsen, Christopher Glade, Berkeley, Kalifornia (US)
Mathews, Christopher, San Francisco, Kalifornia (US)
Michaely, William J., El Cerrito, Kalifornia (US)
Mielich, Steven D., Palo Alto, Kalifornia (US)

(73) Szabadalmaz:

ZENECA Ltd., London (GB)

(74) Képvisező:

Gödölle, Kékes, Mészáros & Szabó Szabadalmi
és Védjegy Iroda, Budapest

(54) Aril-indazol-származékok, eljárás az előállításukra és herbicidként történő
alkalmazásuk

KIVONAT

A találmány az (I) általános képletű, herbicid hatású aril-indazolokra és azok mezőgazdaságilag elfogadható sóira vonatkozik, ahol a képletben

R¹ hidrogén- vagy halogénatomot jelent;

R² hidrogénatomot, nitrocsoporthat, halogénatomot, 1–4 szénatomos alkil-tio-csoportot vagy aminos-csoportot képvisel;

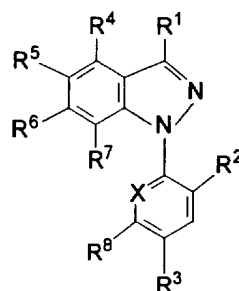
R³ halogénatomot, nitrocsoporthat vagy halogén-(1–4 szénatomos alkil)-csoportot jelent;

R⁴, R⁵ és R⁶ egymástól függetlenül hidrogénatomot, halogénatomot, nitrocsoporthat, aminocsoportot, hidroxilcsoportot, cianocsoportot, 1–4 szénatomos alkilcsoportot, (1–4 szénatomos alkoxi)-imino-(1–4 szénatomos alkil)-csoportot, hidroxi-(1–4 szénatomos alkil)-csoportot, (1–4 szénatomos alkoxi)-(1–4 szénatomos alkil)-csoportot, halogén-(1–4 szénatomos alkil)-szulfonil-amino-(1–4 szénatomos alkil)-csoportot, halogén-(1–4 szénatomos alkil)-csoportot, di(1–4 szénatomos alkoxi)-foszforil-csoportot, 1–4 szénatomos alkil-tio-csoportot, formilcsoportot, karboxilcsoportot, (1–4 szénatomos alkoxi)-karbonil-

csoportot, [(1–4 szénatomos alkil)-karbonil-oxi]₂-(1–4 szénatomos alkil)-csoportot, ahol z értéke 1 vagy 2, –PO(OH)₂-csoportot vagy YR⁹ általános képletű csoportot jelent, ahol

Y jelentése oxigénatom vagy NR¹² általános képletű csoport;

R⁹ jelentése –(R¹¹)_m–COR¹⁰ vagy –(R¹¹)_m–SO₂R¹⁰ általános képletű csoport, 1–4 szénatomos alkilcsoport, 2–4 szénatomos alkenilcsoport, hidroxi-(1–4 szénato-



(I)

mos alkil)-csoport, (1–4 szénatomos alkoxi)-(1–4 szénatomos alkil)-csoport, ciano-(1–4 szénatomos alkil)-csoport, a fenilrészen egy 1–4 szénatomos alkoxi-csoporttal adott esetben szubsztituált fenil-(1–2 szénatomos alkil)-csoport vagy 2–4 szénatomos alkinilcsoport; abban az esetben, ha R^1 , R^4 , R^5 , R^7 és R^8 hidrogénatomot, R^2 klóratomot, R^3 trifluor-metil-csoportot jelent, és X jelentése $=C(Cl)-$, akkor R^6 jelenthet 2-(metoxi-karbonil)-etenil-csoportot, $Q-CH(CH_3)-N-C(O)-Q$

képletű csoportot, amelyben Q etoxi-karbonil-csoportot jelent vagy 1-(izopropilidén-hidrazono-karbonil)-etoxi-csoportot is;

abban az esetben, ha R^1 , R^4 , R^5 , R^7 és R^8 hidrogénatomot, R^2 klóratomot, R^3 trifluor-metil-csoportot és R^6 1-(etoxi-karbonil)-etoxi-csoportot jelent, akkor X olyan $=C(R^{14})-$ képletű csoportot is jelenthet, amelyben R^{14} acetamidocsoportot képvisel;

abban az esetben, ha R^1 , R^4 , R^5 , R^7 és R^8 hidrogénatomot, R^2 klóratomot, R^3 trifluor-metil-csoportot és X nitrogénatomot jelent, akkor R^6 jelenthet 2-acetoxi-etoxi-csoportot is;

abban az esetben, ha R^1 , R^4 , R^5 , R^7 és R^8 hidrogénatomot, R^2 klóratomot, R^3 trifluor-metil-csoportot és X nitrogénatomot vagy $=C(Cl)-$ csoportot jelent, akkor R^6 jelenthet 1-(furfuril-amino-karbonil)-etoxi-csoportot is;

abban az esetben, ha R^1 , R^4 , R^5 , R^7 és R^8 hidrogénatomot, R^2 klóratomot, R^3 trifluor-metil-csoportot és X nitrogénatomot jelent, akkor R^6 jelenthet $-O-CH(CH_3)-C(O)-R^{10'}$ általános képletű csoportot is, amelyben $R^{10'}$ jelentése 1-metil-4-piperidil-csoport vagy $-NH-R^{13}$ általános képletű csoport, ahol R^{13} jelentése morfolino-, 5-tetrazolil-, 2-oxo-3-tetrahidrotienil-, 4-karbamoil-5-imidazolil-, 2-piridil-metil-, 3-piridil-metil-, 2-morfolino-etil- vagy 2-(1-metil-2-pirrolil)-etil-csoport;

R^{10} jelentése hidroxilcsoport, 1–4 szénatomos alkil-csoport, 1–4 szénatomos halogén-alkil-csoport, karboxi-(1–4 szénatomos alkil)-csoport, 1–5 szénatomos alkoxi-csoport, 3–6 szénatomos cikloalkilcsoport, (1–4 szénatomos alkoxi)-(1–4 szénatomos alkoxi)-csoport, (1–4 szénatomos alkoxi)-karbonil-(1–4 szénatomos alkil)-csoport, (1–4 szénatomos alkoxi)-(1–4 szénato-

mos alkil)-amino-csoport, di(1–4 szénatomos alkoxi)-(1–4 szénatomos alkil)-amino-csoport, fenoxicssoport, fenil-(1–2 szénatomos alkil)-csoport, (1–4 szénatomos alkoxi)-karbonil-csoport, hidroxikarbonil-csoport, (1–4 szénatomos alkil) $_n$ -amino-csoport, (1–4 szénatomos alkil) $_n$ -hidrazino-csoport, (1–4 szénatomos alkoxi)-karbonil-(1–4 szénatomos alkil)-amino-csoport, hidroxikarbonil-(1–4 szénatomos alkil)-amino-csoport, (1–4 szénatomos alkil) $_n$ -amino-(1–4 szénatomos alkil)-amino-csoport, (1–4 szénatomos alkil) $_n$ -amino-karbonil-(1–4 szénatomos alkil)-amino-csoport, fenil-szulfonil-amino-csoport, acetyl-amino-(1–4 szénatomos alkil)-amino-csoport, N-(1–4 szénatomos alkoxi)-N-(1–4 szénatomos alkil) $_m$ -amino-csoport, ciano-(1–4 szénatomos alkil)-amino-csoport, (1–4 szénatomos alkoxi)-(1–4 szénatomos alkil)-amino-csoport, 1–4 szénatomos alkilcsoporttal adott esetben szubsztituált szemikarbazidocsoport, vagy egy 5 vagy 6 tagú heterociklusos csoport, amely heteroatomként egy vagy két nitrogénatomot és adott esetben egy oxigén- vagy kénatomot is tartalmaz; azzal a megkötéssel, hogy R^4 , R^5 és R^6 közül csak az egyik jelenthet olyan $-YR^9$ általános képletű csoportot, ahol R^9 jelentése $-(R^{11})_mCOR^{10}$ általános képletű csoport,

R^{11} jelentése 2–4 szénatomos alkilénlánc;

R^{12} jelentése hidrogénatom;

m értéke 0 vagy 1;

n értéke 0, 1 vagy 2;

R^7 hidrogénatomot, 1–4 szénatomos alkilcsoportot vagy nitrocsoportot képvisel;

R^8 jelentése hidrogénatom vagy halogénatom; és

X nitrogénatomot vagy CR^{14} általános képletű csoportot képvisel, ahol

R^{14} jelentése halogénatom vagy cianocsoport,

azzal a feltétellel, hogy

ha R^5 jelentése nitrocsoport, X jelentése nitrogénatom és R^1 , R^2 , R^4 , R^6 és R^7 jelentése hidrogénatom, R^3 jelentése brómatomtól eltérő.

A találmány tárgyát képezi az (I) általános képletű vegyületek előállításának eljárása, herbicidként történő alkalmazása és az ezeket tartalmazó herbicidkészítmények is.

A találmány szubsztituált aril-indazolokra, előállítási eljárásukra és herbicidként történő alkalmazásukra vonatkozik. A találmány különösen az I általános képletű szubsztituált aril-indazolokra vonatkozik, ahol a képletben

R^1 hidrogén- vagy halogénatomot jelent;

R^2 hidrogénatomot, nitrocsoportot, halogénatomot, 1–4 szénatomos alkil-tio-csoportot vagy amino-csoportot képvisel;

R^3 halogénatomot, nitrocsoportot vagy halogén-(1–4 szénatomos alkil)-csoportot jelent;

R^4 , R^5 és R^6 egymástól függetlenül hidrogénatomot, halogénatomot, nitrocsoportot, aminocsoportot, hidroxilcsoportot, cianocsoportot, 1–4 szénatomos

50

55

60

alkilcsoportot, (1–4 szénatomos alkoxi)-imino-(1–4 szénatomos alkil)-csoportot, hidroxikarbonil-(1–4 szénatomos alkil)-csoportot, (1–4 szénatomos alkoxi)-(1–4 szénatomos alkil)-csoportot, halogén-(1–4 szénatomos alkil)-szulfonil-amino-(1–4 szénatomos alkil)-csoportot, halogén-(1–4 szénatomos alkil)-csoportot, di(1–4 szénatomos alkoxi)-foszforil-csoportot, 1–4 szénatomos alkil-tio-csoportot, formilcsoportot, karboxilcsoportot, (1–4 szénatomos alkoxi)-karbonil-csoportot, [(1–4 szénatomos alkil)-karbonil-oxi] $_z$ -(1–4 szénatomos alkil)-csoportot, ahol z értéke 1 vagy 2, $-PO(OH)_2$ -csoportot vagy YR^9 általános képletű csoportot jelent, ahol

Y jelentése oxigénatom vagy NR^{12} általános képletű csoport;

R^9 jelentése $-(\text{R}^{11})_m-\text{COR}^{10}$ vagy $-(\text{R}^{11})_m-\text{SO}_2\text{R}^{10}$ általános képletű csoport, 1–4 szénatomos alkilcsoport, 2–4 szénatomos alkenilcsoport, hidroxil-(1–4 szénatomos alkil)-csoport, (1–4 szénatomos alkoxi)-(1–4 szénatomos alkil)-csoport, ciano-(1–4 szénatomos alkil)-csoport, a fenilrészen egy 1–4 szénatomos alkoxi-csoporttal adott esetben szubsztituált fenil-(1–2 szénatomos alkil)-csoport vagy 2–4 szénatomos alkinilcsoport; abban az esetben, ha R^1 , R^4 , R^5 , R^7 és R^8 hidrogénatomot, R^2 klóratomot, R^3 trifluor-metil-csoportot jelent, és X jelentése $=\text{C}(\text{Cl})-$, akkor R^6 jelenthet 2-(metoxikarbonil)-etenil-csoportot, $\text{Q}-\text{CH}(\text{CH}_3)-\text{N}-\text{C}(\text{O})-\text{Q}$ képletű csoportot, amelyben Q etoxi-karbonil-csoportot jelent vagy 1-(izopropilidén-hidrazono-karbonil)-etoxi-csoportot is;

abban az esetben, ha R^1 , R^4 , R^5 , R^7 és R^8 hidrogénatomot, R^2 klóratomot, R^3 trifluor-metil-csoportot és R^6 1-(etoxi-karbonil)-etoxi-csoportot jelent, akkor X olyan $=\text{C}(\text{R}^{14})-$ képletű csoportot is jelenthet, amelyben R^{14} acetamidocsoportot képvisel; abban az esetben, ha R^1 , R^4 , R^5 , R^7 és R^8 hidrogénatomot, R^2 klóratomot, R^3 trifluor-metil-csoportot és X nitrogénatomot jelent, akkor R^6 jelenthet 2-acetoxi-etoxi-csoportot is; abban az esetben, ha R^1 , R^4 , R^5 , R^7 és R^8 hidrogénatomot, R^2 klóratomot, R^3 trifluor-metil-csoportot és X nitrogénatomot vagy $=\text{C}(\text{Cl})-$ csoportot jelent, akkor R^6 jelenthet 1-(furfuril-amino-karbonil)-etoxi-csoportot is; abban az esetben, ha R^1 , R^4 , R^5 , R^7 és R^8 hidrogénatomot, R^2 klóratomot, R^3 trifluor-metil-csoportot és X nitrogénatomot jelent, akkor R^6 jelenthet $-\text{O}-\text{CH}(\text{CH}_3)-\text{C}(\text{O})-\text{R}^{10'}$ általános képletű csoportot is, amelyben $\text{R}^{10'}$ jelentése 1-metil-4-piperidil-csoport vagy $-\text{NH}-\text{R}^{13}$ általános képletű csoport, ahol R^{13} jelentése morfolino-, 5-tetrazolil-, 2-oxo-3-tetrahidrotienil-, 4-karbamoil-5-imidazolil-, 2-piridil-metil-, 3-piridil-metil-, 2-morfolino-etil- vagy 2-(1-metil-2-pirrolil)-etil-csoport;

R^{10} jelentése hidroxilcsoport, 1–4 szénatomos alkilcsoport, 1–4 szénatomos halogén-alkil-csoport, karboxi-(1–4 szénatomos alkil)-csoport, 1–5 szénatomos alkoxicssoport, 3–6 szénatomos cikloalkilcsoport, (1–4 szénatomos alkoxi)-(1–4 szénatomos alkoxi)-csoport, (1–4 szénatomos alkoxi)-karbonil-(1–4 szénatomos alkil)-csoport, (1–4 szénatomos alkoxi)-(1–4 szénatomos alkil)-amino-csoport, di(1–4 szénatomos alkoxi)-(1–4 szénatomos alkil)-amino-csoport, fenoxicssoport, fenil-(1–2 szénatomos alkil)-csoport, (1–4 szénatomos alkoxi)-karbonil-csoport, hidroxikarbonil-csoport, (1–4 szénatomos alkil) $_n$ -amino-csoport, (1–4 szénatomos alkil) $_n$ -hidrazino-csoport, (1–4 szénatomos alkoxi)-karbonil-(1–4 szénatomos alkil)-amino-csoport, hidroxil-(1–4 szénatomos alkil)-amino-csoport, (1–4 szénatomos alkil) $_n$ -amino-(1–4 szénatomos alkil)-amino-csoport, (1–4 szénatomos alkil)-amino-karbonil-(1–4 szénatomos alkil)-amino-csoport, fenil-szulfonil-amino-csoport, acetil-amino-(1–4 szénatomos alkil)-amino-csoport, N-(1–4 szénatomos alkoxi)-N-(1–4 szénatomos alkil) $_m$ -

amino-csoport, ciano-(1–4 szénatomos alkil)-amino-csoport, (1–4 szénatomos alkoxi)-(1–4 szénatomos alkil)-amino-csoport, 1–4 szénatomos alkilcsoporttal adott esetben szubsztituált szemikarbazidocsoport, vagy egy 5 vagy 6 tagú heterociklusos csoport, amely heteroatomként egy vagy két nitrogénatomot és adott esetben egy oxigén- vagy kénatomot is tartalmaz; azzal a megkötéssel, hogy R^4 , R^5 és R^6 közül csak az egyik jelenthet olyan $-\text{YR}^9$ általános képletű csoportot, ahol R^9 jelentése $-(\text{R}^{11})_m\text{COR}^{10}$ általános képletű csoport,

R^{11} jelentése 2–4 szénatomos alkilénlánc;

R^{12} jelentése hidrogénatom;

m értéke 0 vagy 1;

n értéke 0, 1 vagy 2;

R^7 hidrogénatomot, 1–4 szénatomos alkilcsoportot vagy nitrocsoportot képvisel;

R^8 jelentése hidrogénatom vagy halogénatom; és X nitrogénatomot vagy CR^{14} általános képletű csoportot képvisel, ahol

R^{14} jelentése halogénatom vagy cianocsoport, azzal a feltétellel, hogy

ha R^5 jelentése nitrocsoport, X jelentése nitrogénatom és R^1 , R^2 , R^4 , R^6 és R^7 jelentése hidrogénatom, R^3 jelentése brómatomtól eltérő,

valamint azok mezőgazdaságilag elfogadható sóira.

A fenti vegyületek közül előnyösek azok az I általános képletű vegyületek, amelyeknek a képletében

R^1 hidrogénatomot;

R^2 hidrogénatomot, halogénatomot vagy alkil-tiocsoportot, különösen hidrogén- vagy klóratomot;

R^3 halogénatomot vagy halogén-alkil-csoportot, különösen klóratomot vagy trifluor-metil-csoportot;

R^4 , R^5 és R^6 egymástól függetlenül hidrogénatomot, cianocsoportot, halogénatomot, 1–3 szénatomos alkil-csoportot, nitrocsoportot, halogén-alkil-csoportot, karboxilcsoportot, alkoxi-karbonil-csoportot, YR^9 általános képletű csoportot, ahol

Y jelentése oxigénatom vagy NR^{12} általános képletű csoport;

R^9 jelentése $-(\text{R}^{11})_m-\text{COR}^{10}$ vagy $-(\text{R}^{11})_m-\text{SO}_2\text{R}^{10}$ általános képletű csoport, alkilcsoport, ciano-alkil-csoport vagy alkinilcsoport; és

R^{10} jelentése hidroxilcsoport, alkoxicssoport, alkoxi-alkil-amino-csoport, dialkoxi-alkil-amino-csoport, alkoxi-karbonil-csoport és szemikarbazidocsoport;

R^7 hidrogénatomot vagy metilcsoportot, különösen hidrogénatomot;

R^8 hidrogénatomot vagy klóratomot;

$\text{R}^{11} -\text{CH}_2-$, $-\text{CH}_2-\text{CH}_2-$ vagy $-\text{CH}(\text{CH}_3)-$ csoportot;

X nitrogénatomot vagy CR^{14} általános képletű csoportot, ahol R^{14} halogénatomot jelent.

A találmány egy előnyös kiviteli alakja szerint R^3 halogénatomot vagy halogén-alkil-csoportot, R^4 , R^5 és R^6 egymástól függetlenül hidrogénatomot, halogénatomot, alkilcsoportot, cianocsoportot, halogén-alkil-csoportot és YR^9 általános képletű csoportot, R^7 hidrogénatomot, R^8 hidrogénatomot vagy halogénatomot, és X nitrogénatomot vagy C-halogénatomot képvisel.

A találmány egy másik előnyös kiviteli alakjában R^3 halogénatomot vagy halogén-alkil-csoportot, R^4 hidrogénatomot, halogénatomot, alkilcsoportot, cianocsoportot vagy halogén-alkil-csoportot, R^5 hidrogénatomot, R^6 YR^9 általános képletű csoportot, ahol Y oxigénatomot vagy NR^{12} általános képletű csoportot képvisel, és X nitrogénatomot vagy C-halogénatomot jelent.

A találmány egy további előnyös kiviteli alakja szerint R^3 halogénatomot vagy halogén-alkil-csoportot, R^4 hidrogénatomot és R^5 hidrogénatomot, halogénatomot, alkilcsoportot, cianocsoportot, halogén-alkil-csoportot vagy nitrocsoportot, R^6 YR^9 általános képletű csoportot, ahol Y jelentése oxigénatom vagy NR^{12} általános képletű csoport, és X nitrogénatomot vagy C-halogénatomot képvisel.

A találmány egy másik előnyös kiviteli alakja szerint R^2 hidrogénatomot vagy halogénatomot, R^3 halogénatomot vagy halogén-alkil-csoportot, R^4 hidrogénatomot, R^5 hidrogénatomot, R^6 hidrogénatomot, halogénatomot, cianocsoportot, alkilcsoportot, hidroxialkil-csoportot, alkoxi-alkil-csoportot, alkil-szulfonil-amino-alkil-csoportot, halogén-alkil-szulfonil-amino-alkil-csoportot, halogén-alkil-csoportot, formilcsoportot, karboxilcsoportot, alkoxi-karbonil-csoportot, és X nitrogénatomot vagy C-halogénatomot képvisel.

Indazolok és tetrahydro-indazolok előállítását írják le a J. Org. Chem., 49, 1984, 3310–3314. irodalmi helyen. Herbicid hatású indazolokat ismertetnek az EP 0 152 890 és EP 0 105 721 számon nyilvánosságra hozott szabadalmi bejelentéseiben.

A találmány feladata olyan új indazolvegyszerek előállítása, amelyek hasznossága felülmúlja az ismert herbicid hatású vegyszereket. A találmány szerinti vegyszerek ezt a feladatot teljesítik.

A felsorolt kiviteli alakok a találmány szemléltetésére szolgálnak anélkül, hogy a találmányt ezekre korlátoznánk.

Az „alkilcsoport” kifejezés, valamint az összes, alkilcsoportot tartalmazó csoport, így az alkoxi-alkil-, alkoxi-karbonil-oxi-, halogén-alkil- és hasonló csoportok alatt egyenes és elágazó szénláncú csoportokat értünk. Ezek például a metil-, etil-, n-propil-, izopropil-, n-butil- és tercier-butil-csoport. Az egyes aciklusos alkilcsoportok 1–4 szénatomot tartalmazhatnak. Az alkenilcsoport kifejezés ugyanúgy egyenes vagy elágazó szénláncú, 2–4 szénatomos csoportokat jelent.

A heterociklusos gyűrűk egy N, O vagy S atomot tartalmazó, telített vagy telítetlen gyűrűket jelentenek. Ezek példái a piridinil-, furanil-, pirrolil-, tienil-csoportok.

A fenti definíciókban szereplő „halogénatom” kifejezés fluor-, klór-, bróm- és jódatomokat jelent. A több halogénatomot tartalmazó csoportokban a halogénatom azonos vagy eltérő lehet. A „halogén-alkil” kifejezés egy vagy több halogénatommal szubsztituált alkilcsoportot jelent.

A találmány oltalmi körébe tartoznak az igényelt vegyszerek sztereo- és optikai izomerjei és ezen izomerek bármilyen arányú keverékei is.

A találmány szerinti vegyületekről megállapítottuk, hogy aktív gyomirtó szerek, amelyek kikelés előtt és kikelés után is hatékonyak, és számos növényfaj elpusztítására használhatók, beleértve a széles levelű és a fűféle fajokat is. A vegyületek különösen jól alkalmazhatók kikelés előtt. Amint azt az alábbiakban említeni fogjuk, a vegyületek közül néhány szelektív gyomirtásra használható bizonyos haszonnövény-kultúrákban, így szójabab-, kukorica-, rizs- és gyapotkultúrában.

A találmány tárgyát képezi ezért egy nem kívánt növényzet irtására szolgáló eljárás is, amelynek az értelmében úgy járunk el, hogy a találmány szerinti vegyület gyomirtó hatású mennyiségét gyomirtó szerekben használatos, közömbös hígítószerrel vagy hordozóanyaggal együtt a növényzet kikelés előtt vagy után felvisszük arra a helyre, ahol az ilyen növényzetet ki kell irtani.

A „gyomirtó szer” és „gyomirtó hatású” kifejezést a nem kívánt növényi növekedés teljes megállításának vagy módosításának megjelölésére használjuk. A teljes gátlás vagy módosítás magában foglalja a természetes fejlődéstől való összes eltérést, így például a teljes kipusztítást, a növekedés késleltetését, a lombtalanítást, a kiszáritást, a növekedésszabályozást, az elsatnyulást, a bokrosítást, a serkentést, a lombperzselést és a növekedésgátlást. A „gyomirtó szerként hatásos mennyiség” kifejezés minden olyan mennyiséget magában foglal, amelyet a nem kívánt növényekre vagy az ilyen növényzettel borított területre felvive ilyen növekedésgátlás vagy módosítás elérhető. A „növények” kifejezés magában foglalja a kicsírázott magvakat, kikelő fiatal növényeket és a kifejtett növényzetet, beleértve mind a gyökereket, mind a föld feletti részeket. A „mezőgazdaságilag alkalmazható só” kifejezés olyan sókat jelent, amelyek vizes közegben könnyen ionizálódnak, ilyenek például a nátrium-, kálium-, kalcium-, ammónium-, magnéziumsók, valamint a savanyú sók, így a hidroklorid-, szulfát- és nitrátsók.

A találmány szerinti vegyületeket az alábbi eljárásokkal állítjuk elő.

Általános előállítási eljárás

A találmány szerinti eljárásban kiindulási anyagként szolgáló, nem arilezett indazolvegyszereket az alábbi két eljárással állítjuk elő.

A) eljárás: Az orto-metil-anilineket az irodalomból ismert és az Organic Synthesis, Collective Volume III, 660. oldalán leírt standard diazotáló-ciklizáló módszerrel indazolokká alakítjuk.

Általában az anilint jégecetben vizes nátrium-nitrit-oldat vagy szerves oldószerben oldott szerves nitrit, így izoamil-nitrit hozzáadásával diazotáljuk. A ciklizálás néhány napos állás során lassan vagy a szerves oldószer forráspontján néhány óra alatt megy végbe. Ez az eljárás különösen akkor hatásos, ha az R_4 – R_7 csoportok elektronvonzó csoportok.

B) eljárás: 2-(szubsztituált)-amino-metilén-ketonok előállítása céljából szubsztituált ciklohexanonokat reagáltatunk megnövelt hőmérsékleten amid-acetállal. A ketont tetrahydro-indazol előállítása céljából alkohol-

oldószerben, visszafolyató hűtő alatt hidrazin-hidráttal kondenzáljuk. Ezután a telített gyűrűt dehidratáló katalizátorként szénre felvitt palládiumot tartalmazó dekalinban való melegítéssel aromatizáljuk. Ez az eljárás különösen akkor hatásos, ha R_4 – R_7 alkilcsoportok.

A nem arilezett indazolokat tovább módosíthatjuk és szubsztituálhatjuk számos ismert standard szerves reakcióval, például nitrálással, amelyet Jerry March „Advanced Organic Chemistry” című szakkönyve (4. kiadás, 1992, Wiley–Interscience) is ismerteti.

A szubsztituált indazolt a megfelelő aril-halogeniddel arilezzük, hogy megkapjuk az előállítani kívánt aril-indazolt és kis mennyiségű izomer keverékét (A. reakcióvázlat). Az izomert számos módszerrel, beleértve az átkristályosítást és az oszlopkromatográfiát, távolíthatjuk el.

A kívánt indazolt ezenkívül orto-halogén-benzaldehidekből is előállíthatjuk megfelelő aril-hidrazinnal végzett ciklokondenzációval [B] reakcióvázlat]. A hidrazont acetonitrilben néhány percen át tartó melegítéssel, majd ezt követő hűtéssel állítjuk elő, és elkülönítjük. A terméket bázist tartalmazó semleges oldószerben történő melegítéssel ciklizáljuk. Az utolsó lépésben igen fontos a hőmérséklet-ellenőrzés, hogy elkerüljük a gyűrű hő hatására fellépő felnyílását.

Az aril-hidrazinokat vagy egy szubsztituált anilin standard diazotáló redukciójával vagy egy aril-halogenid-hidrazinnal (Hy) történő helyettesítési reakciójával állítjuk elő.

Az R^4 , R^5 és/vagy R^6 szubsztituensek hidroxilcsoportok (amelyeket metil-éterből vagy aminocsoportból állíthatunk elő), –SH-csoportok (amelyeket egy megfelelő halogenid- vagy diazóniumion merkaptiddal történő helyettesítésével állíthatunk elő) és/vagy $-NH_2$ -csoportok lehetnek (amelyet egy nitro-csoport katalitikus hidrogénezése útján állíthatunk elő). Ha R^4 , R^5 és/vagy R^6 –OH-, –SH- és/vagy $-NH_2$ -csoport, a kiindulási anyagként alkalmazott N^1 -aril-indazolokat két általános eljárással állíthatjuk elő. Az első eljárásban a megfelelő dez-aril-hidroxi-, merkaptó- vagy amino-indazolt a megfelelően szubsztituált acilező- vagy alkilezőreagenssel reagáltatjuk gyenge bázis, így kálium-karbonát jelenlétében. A terméket elkülönítjük, majd bázis jelenlétében a megfelelő halogén-aril közbenső termékkel arilezzük. Ezt az eljárást a C) reakcióvázlat szemlélteti.

Az ilyen típusú anyagok második általános előállítási módja az előző reakció fordítottja. Ennek során először az aril-halogenidet a megfelelően szubsztituált indazollal hozzuk reakcióba, majd a képződött közbenső terméket alkilező- vagy acilezőszerrel reagáltatjuk megfelelő bázis jelenlétében, vagy izocianátok és hasonló esetében bázis távollétében, a D) reakcióvázlat szerint.

Az indazolgyűrűn található –SH-, –OH- és $-NH_2$ -csoportokat alkilezhetjük, acilezhetjük és szulfonálhatjuk, vagy más módon reagáltathatjuk aril-izocianátokkal, alkil-izocianátokkal vagy szulfonil-izocianátokkal, hogy a kívánt termékeket vagy új közbenső termékeket kapjunk.

Ezeket a közbenső termékeket új (reakcióképes) közbenső termékek előállítása céljából hagyományos eljárásokkal tovább módosíthatjuk. Így például az észter (41. vegyület) könnyen savvá hidrolizálható (55. vegyület), majd savkloridjává alakítható (például oxalilklorid/DMF). Ezt a savkloridot aminokkal, hidrazinokkal, szemikarbazinnal és alkoholokkal reagáltatva új amidokat (például 91. vegyület), hidrazidokat (például 133. vegyület), szemikarbazidokat (például 140. vegyület) és észtereket (például 154. vegyület) kapunk. Az R^4 , R^5 és/vagy R^6 szubsztituensek ilyen és más hagyományos átalakítási eljárásai megtalálhatók a standard szakkönyvekben, így az „Advanced Organic Chemistry” című szakkönyvben (4. kiadás, Jerry March, 1992, Wiley–Interscience).

Az alábbi példákkal a találmány szerinti vegyületek képviselőinek a szintézisét mutatjuk be. Szerkezetük összhangban van 1H -NMR-, ^{13}C -NMR-, infravörös és tömegspektrumukkal.

1. példa

1-[2,6-Diklór-4-(trifluor-metil)-fenil]-6-metoxi-5-nitro-1H-indazol

(I. táblázat 20. vegyülete)

A 6-metoxi-5-nitro-indazol közbenső termék előállítás

5-Metoxi-2-metil-4-nitro-anilint (69 g, 360 mmol) összekeverünk 2,5 liter jégcettel, és keverés közben jeges vizes fürdőben körülbelül 15 °C-ra hűtjük. Az elegy lehűlése után egy részletben hozzáadunk 60 ml vízben feloldott 25 g (360 mmol) nátrium-nitritet. A keletkező elegyet keverés közben hagyjuk szobahőmérsékletre melegedni. A diazóniumsó teljes ciklizálódásának az érdekében az oldatot 2 napig szobahőmérsékleten állni hagyjuk. Ezután az oldószer körülből 45 °C-on vákuumban eltávolítjuk, így sötét színű, kátrányszerű maradékot kapunk. Ezt a maradékot szilikagélen végzett kromatografálással tisztítjuk, az eluálást metilén-kloridos etil-acetáttal végezzük. 5 g maradékból körülbelül 1 g sárga színű, kristályos anyagot (olvadáspont: 192–194 °C) kapunk.

1-[2,6-Diklór-4-(trifluor-metil)-fenil]-6-metoxi-5-nitro-1H-indazol előállítás

1,2 g (5 mmol) 3,5-diklór-4-fluor-benzo-trifluoridot összekeverünk 1,0 g (8 mmol) vízmentes, elporított kálium-karbonát 25 ml, 0,05 g 18-korona-6-katalizátort és 0,9 g (5 mmol) 6-metoxi-5-nitro-indazolt tartalmazó vízmentes acetonitrillel készített szuszpenziójával, és az elegyet 3 órán át forraljuk visszafolyató hűtő alatt. Lehűlés után az elegyet vízsugárzivattyúval előállított vákuumban leszűrjük, és a szűrletet vákuumban bepároljuk. A maradékot szilikagélen végzett kromatografálással két tiszta terméké választjuk szét, az eluálást hexános etil-acetáttal végezzük. Az eluens 1,0 g 1-aril-indazolt (20. vegyület) és 0,2 g 2-aril-indazol mellékterméket tartalmaz.

2. példa

5-Nitro-1-(2,4,6-triklór-fenil)-1H-indazol

(I. táblázat 3. vegyülete)

2-Klór-5-nitro-benzaldehid-2,4,6-triklór-fenil-hidrazon közbenső termék előállítása

21,0 g (100 mmol) 2,4,6-triklór-fenil-hidrazint feloldunk 400 ml forrásban lévő acetonitrilben. Ehhez az oldathoz 100 ml forrásban lévő acetonitrilben hozzáadunk 18,6 g (100 mmol) 2-klór-5-nitro-benzaldehidet. A képződött elegy élénksárga színű, pasztaszerű anyaggá alakul, amelyet hagyunk szobahőmérsékletre hűlni. A szilárd anyagot vízsugárszivattyúval előállított vákuumban leszűrjük, 200 ml izopropanollal, majd 200 ml hexánnal mossuk, és levegőn megszáritjuk. Az eljárással 37,2 g kívánt hidrazon közbenső terméket kapunk porszerű, szilárd anyag alakjában.

A 3. vegyület előállítása

1,5 g (4 mmol) 2-klór-5-nitro-benzaldehid-2,4,6-triklór-fenil-hidrazont feloldunk 25 ml, 0,8 g (6 mmol) vízmentes, elporított kálium-karbonátot és 0,05 g 18-korona-6-katalizátort tartalmazó, vízmentes dimetil-formamidban, melegített olajfürdőben (80–90 °C) éjszakán át keverjük, és száraz levegőn megszáritjuk. A keletkező oldatot 250 ml hideg vízbe öntjük, majd az elválasztáshoz szükséges mértékben sóval telítjük. Az elegyet etil-acetáttal extraháljuk, elválasztjuk és nátrium-szulfáttal megszáritjuk. Vákuumban történő bepárlással bíborszínű olajat kapunk, amelyet szilikagélén végzett kromatografálással tisztítunk. Így 1,2 g vöröses színű, kristályos, szilárd anyagot kapunk (kitermelés 93%), amelynek az olvadáspontja a kívánt termékkel egyezően 113–116 °C.

3. példa

1-[2,6-Diklór-4-(trifluor-metil)-fenil]-6-metoxi-1H-indazol

(I. táblázat 18. vegyülete)

6-Metoxi-indazol közbenső termék előállítása

4,8 g (36 mmol) 6-indazolt feloldunk 25 ml dimetil-formamidban (DMF), és nitrogénatmoszférában hozzáadunk 9,95 g (72 mmol) vízmentes kálium-karbonátot. Ezután beadagolunk 5,6 g (39 mmol) metiljodidot, az elegyet 1 órán át keverjük szobahőmérsékleten, majd a reakcióelegyet 350 ml vízbe öntjük. A keletkezett szilárd anyagot egyesítjük a vizes fázis etil-acetát/dietil-éter 1:1 térfogatarányú elegyével kétszer végzett extrahálásának az extraktumával. Ezt a nyers-terméket megszáritjuk, betöményítjük és szilikagélén kromatografáljuk (éter/metilén-klorid). 2,51 g (47%-os kitermelés) 6-metoxivegyületet kapunk.

A 18. vegyület előállítása

3,83 g (26 mmol) 6-metoxi-indazolt nitrogénatmoszférában feloldunk 50 ml dimetil-formamidban (DMF). Ehhez az oldathoz hozzáadunk 6,1 g (26 mmol) 3,5-diklór-4-fluor-benzo-trifluoridot és 7,2 g (52 mmol) vízmentes kálium-karbonátot. Az elegyet szobahőmérsékleten 2 óra hosszat, majd 80–95 °C-on 2 órán át keverjük, majd a lehűlt elegyet 500 ml hideg vízbe öntjük. A vizes fázist nátrium-kloriddal telítjük és etil-acetáttal extraháljuk. A szerves extraktumot vízzel mossuk, megszáritjuk és bepároljuk, így 8,3 g nyers-terméket, majd szilikagéllal végzett kromatografálással (éter/metilén-klorid) tisztítva 4,45 g 18. vegyületet kapunk.

4. példa

1-[3-Klór-5-(trifluor-metil)-2-piridil]-6-indazol-amin

(I. táblázat 22. vegyülete)

5 A 22. vegyület előállítása

2,7 g (20 mmol) 6-indazol-amin, 4,3 g (20 mmol) 2,3-diklór-5-(trifluor-metil)-piridin és 5,5 g (40 mmol) vízmentes kálium-karbonát 50 ml dimetil-formamiddal készített elegyét 4,5 órán át 80–95 °C-on melegítjük. A reakcióelegyet a 3. példában leírt módon feldolgozva 2,76 g 22. vegyületet kapunk (44%-os kitermelés) szilikagélén végzett kromatografálás (éter/metilén-klorid) után.

5. példa

1-[3-Klór-5-(trifluor-metil)-2-piridil]-6-indazol

(I. táblázat 100. vegyülete)

A 100. vegyület előállítása

13,4 g (100 mmol) 6-indazol 100 ml vízmentes dimetil-formamiddal készített elegyéhez keverés és hűtés közben hozzáadunk 22,4 g (200 mmol) kálium-t-butoxidot. Ezután az elegyhez 4–7 °C-on 40 perc alatt hozzáadunk 12,0 ml (86 mmol) 2,3-diklór-5-(trifluor-metil)-piridint. A reakcióelegyet szobahőmérsékleten 2 órán át keverjük, majd 150 ml dietil-éterrel és 200 ml vízzel felhígítjuk. Az éteres fázisban képződő kristályokat leszűrve 11,0 g 2-arilvegyületet kapunk, amelyet minor izomerként azonosítunk. A fenti vizes fázist tömény sósavval megsavanyítjuk, és két alkalommal, 150–150 ml étterrel extraháljuk. Az extraktumokat vízmentes magnézium-szulfát fölött megszáritjuk, az oldószer lepárlása után olajos szilárd anyagot kapunk. A maradékot metilén-kloridban felvesszük, és az oldatot 5 tömeg%-os nátrium-karbonát-oldattal (kétszer 100 ml-es részletekkel) extraháljuk. A karbonátos extraktumot az előzőekben leírtak szerint megsavanyítjuk, és metilén-kloriddal extraháljuk, a fenti módon végzett szárítás és bepárlás után szilárd anyagot kapunk. A szilárd anyagot hexánnal mossuk és leszűrjük, így 3,7 g 100. vegyületet kapunk.

6. példa

Etil-R/S-2-[1-[2,6-diklór-4-(trifluor-metil)-fenil]-1H-indazol-6-il-oxi]-propionát

(I. táblázat 41. vegyülete)

45 Etil-R/S-2-(1H-indazol-6-il-oxi)-propionát előállítása
5,7 g (42 mmol) 6-indazol és 5,8 g (42 mmol) vízmentes kálium-karbonát 50 ml vízmentes dimetil-formamiddal készített elegyéhez keverés közben, 10 °C-on hozzáadunk 5,5 ml (42 mmol) etil-2-brómpropionátot. A reakcióelegyet szobahőmérsékleten 6 órán át keverjük, majd azonos mennyiségű kálium-karbonátot adunk hozzá, és az elegyet további 20 órán át keverjük. A reakcióelegyet 200 ml étterrel felhígítjuk, 150 ml vízzel és 100 ml 5 tömeg%-os nátrium-karbonát-oldattal mossuk, majd vízmentes magnézium-szulfát fölött megszáritjuk. Az oldatot a szárítószer eltávolítása céljából leszűrjük és vákuumban bepároljuk, így 8,7 g kívánt észter közbenső terméket kapunk olajszerű anyag alakjában.
60

A 41. vegyület előállítása

8,7 g (37 mmol) fenti észtert feloldunk 100 ml vízmentes DMF-ben, hűtés és keverés közben egy részletben 4,2 g (37 mmol) kálium-t-butoxidot adunk hozzá, és a hőmérsékletet 15 °C alatt tartjuk. Ezután 8,6 g (37 mmol) 3,5-diklór-4-fluor-benzo-trifluoridot adunk hozzá, miközben a hőmérsékletet 15 °C-on tartjuk, enyhe hőfejlődés következik be az adagolás folyamán. A reakcióelegyet szobahőmérsékleten 5 órán át keverjük, majd 200 ml éterrel felhígítjuk, 150 ml vízzel, 100 ml 5 tömeg%-os sósavval és 75 ml 5 tömeg%-os nátrium-hidrogén-karbonát-oldattal mossuk. A szerves fázist vízmentes magnézium-szulfát fölött megszáritjuk és vákuumban bepároljuk. A maradékot Florisilen éterrel kromatografáljuk, így 12,7 g olajszerű anyagot kapunk, amelyet pentánból kristályosítunk. A 41. kristályos vegyület kitermelése 11,6 g.

7. példa

Etil-R/S-2-[1-[2-klór-6-(metil-tio)-4-(trifluor-metil)-fenil]-1H-indazol-6-il-oxi]-propionát és etil-R/S-2-[1-[2,6-bisz(dimetil-tio)-4-(trifluor-metil)-fenil]-1H-indazol-6-il-oxi]-propionát

(I. táblázat 57. és 58. vegyülete)

Az 57. és 58. vegyület előállítása

Etil-R/S-2-[1-[2-klór-6-fluor-4-(trifluor-metil)-fenil]-1H-indazol-6-il-oxi]-propionát (amelyet a fenti 41. vegyülethez hasonló módon állítottunk elő, azzal az eltéréssel, hogy kiindulási anyagként 3-klór-4,5-difluor-benzo-trifluoridot használtunk) vízmentes dimetil-szulfidos (DMSO) oldatát 0,15 g (2,1 mmol) nátrium-metil-merkaptánnal kezeljük szobahőmérsékleten 3 órán át. Ezt közvetően további 0,15 g (2,1 mmol) nátrium-metil-merkaptánt adunk hozzá, és a keverést 2 órán keresztül folytatjuk. Az elegyet ezután megosztjuk éter és víz között, az éteres fázist nátrium-klorid-oldattal mossuk, magnézium-szulfát fölött megszáritjuk, leszűrjük és vákuumban bepároljuk. A maradékot szilikagélen kromatográfiásan tisztítjuk (éter/hexán), így 0,17 g 57. vegyületet, majd 0,13 g 58. vegyületet kapunk.

8. példa

5-Bróm-1-[2,6-diklór-4-(trifluor-metil)-fenil]-6-metoxi-1H-indazol

(I. táblázat 181. vegyülete)

1-Bróm-2-metoxi-5-metil-4-nitro-benzol előállítása

20 g (110 mmol) 2-metoxi-5-metil-4-nitro-anilin 140 ml vízzel készített elegyét visszafolyató hűtő alatt forraljuk, cseppenként hozzáadunk 56 ml 48 tömeg%-os hidrogén-bromidot, és az elegyet 20 percig melegítjük. A keletkező szuszpenziót 0 °C-ra lehűtjük, és a hőmérsékletet 0 °C-on tartva cseppenként hozzáadunk 7,6 g (110 mmol) vizes nátrium-nitrit-oldatot. A szuszpenziót óvatosan, cseppenként hozzáadjuk 18,1 g (126 mmol) réz(I)-bromid 96 ml vízzel és 38 ml 48 tömeg%-os hidrogén-bromiddal készített, 0 °C hőmérsékletű oldatához. Az elegyet 30 percen át 0 °C-on és 1 órán át szobahőmérsékleten, végül a reakció teljessé tétele céljából gőzfürdön keverjük. A szilárd csapadékot szívótölcséren leszívátjuk, metilén-kloridban fel-

oldjuk, 400 ml 10 tömeg%-os nátrium-hidroxid-oldattal, 5 tömeg%-os nátrium-hidrogén-szulfid-oldattal és vízzel mossuk. A szerves fázist megszáritjuk, leszűrjük és vákuumban bepároljuk, így 24,9 g sötétbarna színű, szilárd anyagot kapunk. Ezt hexánból átkristályosítva 13,4 g brómvegyületet kapunk.

4-Bróm-5-metoxi-2-metil-anilin előállítása

2,4 g (43 mmol) vaspor, 9 ml etanol, 7 ml víz és 0,2 ml tömény sósav elegyét 80 °C-ra felmelegítjük, és 2 g (8,1 mmol) előzőleg előállított nitrovegyületet adunk részletekben hozzá úgy, hogy éppen fenntartsuk a forrást a hőforrás eltávolítása után. A heves forrás lecsillapodása után az elegyet hagyjuk körülbelül 70 °C-ra lehűlni és celiten átszűrjük, amelyet ezután metilén-kloriddal mosunk. A vizes fázist előálasztjuk, metilén-kloriddal mossuk, az egyesített szerves fázisokat megszáritjuk, leszűrjük és vákuumban bepároljuk, így 1,55 g barna színű, szilárd anyagot kapunk. Ezt szilikagélen kromatográfiásan tisztítjuk (metilén-klorid), 1,18 g (67%-os kitermelés) fehér színű, szilárd anilinvegyületet kapunk.

5-Bróm-6-metoxi-1H-indazol előállítása

4,93 g (23 mmol) fenti anilin 50 ml benzollal készített oldatát 1,94 g (24 mmol) nátrium-acetáttal, majd 6,98 g (68 mmol) ecetsavanhidriddel kezeljük. Az elegyet forráspontra melegítjük, miközben fehér színű csapadék keletkezik a lombikban. A forró oldathoz 20 perc alatt 4,00 g (34 mmol) izoamil-nitritet csepegtetünk 10 ml benzolban, és a vöröses elegyet éjszakán át melegítjük. 20 órás melegítés után a reakcióelegyet lehűtjük, éterrel felhígítjuk, vízzel és nátrium-hidrogén-karbonáttal mossuk, megszáritjuk és leszűrjük. Az oldószert vákuumban lepárolva 5,91 g szennyezett terméket kapunk. Ezt szilikagélen kromatografálva (metilén-klorid) tisztítjuk, így 3,75 g acetilezett indazol közbenső terméket kapunk. Ezt 30 ml, 1 ml tömény sósavat tartalmazó etanolban feloldjuk, és az oldatot visszafolyató hűtő alatt 4 óra hosszat forraljuk. Ezután az oldószert vákuumban eltávolítjuk, és a maradékhoz telített vizes nátrium-hidrogén-karbonát-oldatot adunk. A szilárd anyagot leszűrjük, etil-acetát/éter elegyben feloldjuk, megszáritjuk, leszűrjük és bepároljuk, így 3,10 g kívánt indazol közbenső terméket kapunk.

A 181. vegyület előállítása

1,2 g (5 mmol) indazol és 1,15 g (5 mmol) 3,5-diklór-4-fluor-benzo-trifluorid 10 ml, 1,70 g (12,3 mmol) vízmentes kálium-karbonátot tartalmazó, vízmentes dimetil-formamiddal készített oldatát szobahőmérsékleten 2 napon át keverjük. Ezután az elegyet vízbe öntjük, a csapadékot leszűrjük, metilén-kloridban feloldjuk, megszáritjuk, leszűrjük és vákuumban bepároljuk. A szilárd maradék tömege 1,96 g, ezt szilikagélen kromatografálva (hexán/metilén-klorid) tisztítjuk, így 0,26 g tiszta 181. vegyületet és 1,45 g szennyezett terméket kapunk.

9. példa

5-Klór-1-[2,6-diklór-4-(trifluor-metil)-fenil]-1H-indazol-6-ol

(I. táblázat 253. vegyülete)

A 253. vegyület előállítása

1,0 g (3 mmol) 5-klór-1-[2,6-diklór-4-(trifluor-metil)-fenil]-6-metoxi-1H-indazol (amelyet a 181. vegyülethez hasonlóan, a fenti 8. példában leírt módon állítottunk elő) 10 ml vízmentes metilén-kloriddal készített oldatát -78°C -ra lehűtjük, 1,57 g (6 mmol) bór-tribromidot adunk hozzá, és 1,5 órán át ezen az alacsony hőmérsékleten keverjük. Ezt közvetően az oldatot hagyjuk szobahőmérsékletre melegedni, és 2 napon keresztül keverjük. Ezután további 0,63 g (2,5 mmol) bór-tribromidot adunk hozzá, éjszakán át szobahőmérsékleten keverjük, majd az elegyet -78°C -ra lehűtjük, miközben a reakció leállítása céljából 10 ml metanolt adunk hozzá. Az illó oldószereket és a reagens feleslegét vákuumban lepároljuk, a visszamaradó szilárd anyagot vízzel mossuk és leszűrjük. A szilárd anyagot etil-acetátban feloldjuk, az oldatot megszáritjuk, leszűrjük és bepároljuk, így megkapjuk a nyerstermékét. Ezt szilikagélen kromatográfiásan tisztítjuk, így a visszanyert kiindulási anyagon kívül 0,41 g 253. vegyületet kapunk (kitermelés 43%).

10. példa

6-Acetoxi-metil-1-[2,6-diklór-4-(trifluor-metil)-fenil]-1H-indazol

(I. táblázat 66. vegyülete)

6-Bróm-metil-1-[2,6-diklór-4-(trifluor-metil)-fenil]-1H-indazol előállítása

10 mmol 6-metil-1-[2,6-diklór-4-(trifluor-metil)-fenil]-1H-indazolt és 12 mmol N-bróm-szukcinimidet visszafolyató hűtő alatt forralunk 50 ml széntetrakloridban és 275 wattos napfénylámpával megvilágítjuk. 4 óra elteltével a reakcióelegyet lehűtjük, a szukcinimidet kiszűrjük, és az oldószert vákuumban lepároljuk, így 3,12 g nyers bróm-metil-indazolt kapunk.

A 66. vegyület előállítása

A nyers brómszármazékot 50 ml ecetsavban 5 g kálium-acetáthoz adjuk, és az oldatot gőzfürdőn 2 órán át melegítjük. Ezután az elegyet jégre öntjük, miután a jég megolvadt, a szilárd anyagot leszűrjük és megszáritjuk, így nyerstermékét kapunk. Ezt szilikagélen kromatografálva (pentán/metilén-klorid) tisztítjuk, így 1,6 g 66. vegyületet kapunk.

11. példa

1-[2,6-Diklór-4-(trifluor-metil)-fenil]-1H-indazol-6-karboxaldehid és 6-bisz(acetoxi)-metil-1-[2,6-diklór-4-(trifluor-metil)-fenil]-1H-indazol

(I. táblázat 81. és 84. vegyülete)

A 81. és 84. vegyület előállítása

6,4 g 1-[2,6-diklór-4-(trifluor-metil)-fenil]-6-metil-1H-indazolt 50 ml széntetrakloridban kis feleslegben lévő (2,2 egyenérték) N-bróm-szukcinimiddel egyesítünk. Az elegyet visszafolyató hűtő alatt forraljuk 4 órán át, és 275 wattos napfénylámpával megvilágítjuk. Ezután a szukcinimidet szűrővel eltávolítjuk, és az oldószert vákuumban lepároljuk, így nyers 6-(dibrom-metil)-indazolt kapunk. Ezt 7,0 g kálium-acetáthoz adjuk 70 ml ecetsavban, és az elegyet 4 órán

át visszafolyató hűtő alatt forraljuk. Ezután az oldatot jégre öntjük, és a jég megolvadása után a terméket szűrővel elválasztjuk. A nyerstermék keveréket szilikagélen végzett kromatografálással (pentán/éter/metilén-klorid) komponenseire bontjuk, így 4,22 g 81. vegyületet, 1,21 g 66. vegyületet és 0,81 g 84. vegyületet kapunk.

12. példa

Metil-3-[1-[2,6-diklór-4-(trifluor-metil)-fenil]-1H-indazol-6-il]-propenoát

(I. táblázat 85. vegyülete)

A 85. vegyület előállítása

1,98 g metil-trifenil-foszfónium-acetát-bromidsót 20 ml vízmentes tetrahidrofuranban szuszpendálunk, miközben feleslegben lévő (0,12 g) 97 tömeg%-os nátrium-hidridet adunk hozzá. 1 órás, szobahőmérsékleten végzett keverés után 1,12 g aldehidet (81. vegyület), majd 3 csepp etanolt adunk hozzá. A reakcióelegyet éjszakán át keverjük, és a szilárd csapadékot kiszűrjük. Az oldószert a szűrletből vákuumban elpárologtatva kapjuk a nyerstermékét. Ezt az anyagot szilikagélen végzett kromatografálással (metilén-klorid) tisztítjuk, így 1,07 g 85. vegyületet kapunk.

13. példa

1-[2,6-Diklór-4-(trifluor-metil)-fenil]-N,N-dietil-1H-indazol-6-amin

(I. táblázat 230. vegyülete)

A 230. vegyület előállítása

1,0 g (3 mmol) 6-indazol-amint 10 ml, 0,83 g (6 mmol) kálium-karbonátot és 1,8 g (10 mmol) etil-jodidot tartalmazó 10 ml vízmentes DMF-ben éjszakán át 60°C -on melegítünk. Ezt közvetően további 1,8 g (10 mmol) etil-jodidot adagolunk a lombikba, és a melegítést további 8 óra hosszat folytatjuk. Az oldatot 200 ml nátrium-klorid-oldattal felhígítjuk, és kétszer 100 ml etil-acetáttal extraháljuk. Az egyesített szerves fázisokat vékony szilikagélpárnán átszűrjük és bepároljuk. A maradékot szilikagélen kromatografálva tisztítjuk (10 térfogat% etil-acetát/hexán), így 1,5 g halvány-sárga színű, szilárd anyagot (230. vegyület) kapunk.

14. példa

N-[1-[2,6-diklór-4-(trifluor-metil)-fenil]-1H-indazol-6-il]-metánszulfonamid

(I. táblázat 40. vegyülete)

A 40. vegyület előállítása

2 g 1-[2,6-Diklór-4-(trifluor-metil)-fenil]-1H-indazol-6-amint (5 mmol; 21. vegyület) és 0,59 g (5 mmol) trietil-amint metilén-kloridban feloldunk. Ezután szobahőmérsékleten cseppenként hozzáadunk 0,67 g (5 mmol) desztillált metánszulfonil-kloridot, és az oldatot 15–20 percen át keverjük. A sárga színű, szilárd csapadékot szívótölcséren összegyűjtjük, etil-acetátban feloldjuk, és az oldatot vékony szilikagélpárnán átengedve megszáritjuk. Az oldószert elpárologtatjuk, és a maradékot szilikagélen kromatografálva (20% etil-acetát/hexán) tisztítjuk, így 0,96 g 40. vegyületet kapunk.

15. példa

1-[2,6-Diklór-4-(trifluor-metil)-fenil]-6-metil-tio-1H-indazol

(I. táblázat 79. vegyülete)

6-(Metil-tio)-1H-indazol előállítása

4 g (30 mmol) 6-indazol-amint feloldunk 30 ml, 5,4 ml tömény kénsavat tartalmazó, hideg vízben. Jégben lehűtve az oldat pasztaszerűvé válik, a pasztához állandó keverés közben részletekben hozzáadunk 10 ml hideg vízben feloldott 2,2 g nátrium-nitritet. Az elegy hőmérsékletét a nitritoldat beadagolási sebességének a beállításával körülbelül 4 °C alatt tartjuk. A szilárd paszta fokozatosan feloldódik, vörösesbarna színű oldatot kapunk. Ezt az oldatot óvatosan, részletekben, 4 °C-on hozzáadjuk 35 g frissen készített réz(I)-metil-merkaptán 200 ml vízzel készített szuszpenziójához. Azonnal gázfejlődés indul meg, és az adagolást úgy szabályozzuk, hogy megelőzzük az elegy kifutását az edényből. Ezután a vörösesbarna szuszpenziót a gázfejlődés befejeződéséig keverjük. Az oldatot szívótölcséren leszűrjük, a vörösesbarna színű, szilárd anyagot vízzel mossuk és megszáritjuk, így 0,9 g közbenső terméket kapunk.

A 79. vegyület előállítása

0,9 g (6 mmol) fenti 6-(metil-tio)-1H-indazolt feloldunk 1,52 g (11 mmol) vízmentes kálium-karbonátot és 1,3 g (6 mmol) 3,5-diklór-4-fluor-benzo-trifluoridot tartalmazó vízmentes DMF-ben, és az oldatot 60 °C-on éjszakán át keverjük. Az elegyet ezután hideg vízbe öntjük, és a terméket nátrium-szulfát fölött szárított etil-acetáttal extraháljuk, majd bepároljuk, így olajszerű maradékot kapunk. Ezt szilikagélen kromatografálva (5 térfogat% etil-acetát/hexán) két komponensre bontjuk, így 1,1 g 79. vegyületet és 0,1 g 2-aril-izomert kapunk.

16. példa

4-Klór-1-[2,6-diklór-4-(trifluor-metil)-fenil]-5-metil-1H-indazol

(I. táblázat 211. vegyülete)

4-Klór-5-metil-1H-indazol előállítása

4,9 g (96 mmol) 3-klór-2,4-dimetil-anilint 250 ml vízmentes benzolban 9,4 g (96 mmol) kálium-acetáttal és 29,4 g (288 mmol) ecetsavanhidriddel kezelünk. Az elegyet visszafolyató hűtő alatt lassan forrásig melegítjük, eközben csapadék képződik. Ezt közvetően a forrásban lévő szuszpenzióhoz gyorsan 17 g (144 mmol) izoamil-nitritet adunk, és a melegítést 18 órán át folytatjuk. A lehűlt szuszpenziót leszűrjük, és a szilárd anyagot benzollal átmoszuk. Az egyesített szűrleteket bepároljuk, és a szilárd maradékot feloldjuk 200 ml, 1 ml tömény sósavat tartalmazó etanolban. Ezt az elegyet visszafolyató hűtő alatt 5 óra hosszat forraljuk, majd az oldószert vákuumban eltávolítjuk. A szilárd maradékot 5 tömeg%-os nátrium-hidrogén-karbonát-oldattal mossuk, etil-acetátban feloldjuk, nátrium-szulfát fölött megszáritjuk és bepároljuk, így 9,3 g szilárd közbenső terméket kapunk.

A 211. vegyület előállítása

A fenti közbenső terméket a 15. példában leírt módon arilezzük, így 1,4 g 211. vegyületet és 0,23 g 2-aril-izomert kapunk.

17. példa

Dietil-1-[2,6-diklór-4-(trifluor-metil)-fenil]-1H-indazol-5-il-foszfonsát

(I. táblázat 161. vegyülete)

5 Dietil-1H-indazol-5-il-foszfonsát előállítása

3,6 g (36 mmol) trietil-amin és 5,0 g (36 mmol) dietil-foszfát elegyét 1,5 g (13 mmol) palládium-tetrakisz-trifenil-foszfínnal kezeljük. Ehhez az elegyhez keverés közben, részletekben 8,0 g (33 mmol) 1-acetil-5-bróm-indazolt adunk. Miután a fenti indazol körülbelül 4 g-ját hozzáadtuk, a reakcióelegyet 15 ml toluallal felhígítjuk, majd ezt közvetően adagoljuk be a maradék indazolt. Ezután a reakcióelegyet 105 °C-ra melegítjük, és a melegítést 5 órán át folytatjuk. Az elegyet lehűtjük, dietil-éterrel felhígítjuk, és a csapadékot kiszűrjük. A szűrletet vízzel mossuk, megszáritjuk, leszűrjük és bepároljuk, így 11,8 g sötétbarna színű, szilárd anyagot kapunk. Ezt szilikagélen kromatografálva tisztítjuk, így 5,82 g 1-acetil-foszfonsát közbenső terméket kapunk. Ezt 100 ml 10 tömeg%-os sósavval elegyítjük, és gőzfürdőn 30 percig melegítjük. A lehűlt elegyet kloroformmal extraháljuk, majd megszáritjuk, leszűrjük és bepároljuk, így 4,83 g kívánt közbenső terméket kapunk olajos, szilárd anyag alakjában.

25 A 161. vegyület előállítása

1,0 g (4 mmol) fenti indazol-5-il-foszfonsátot a 15. példában leírt módon arilezzük, így 1,74 g 161. vegyületet kapunk (94%-os kitermelés).

18. példa

1-[2,6-Diklór-4-(trifluor-metil)-fenil]-1H-indazol-5-il-foszfonsav

(I. táblázat 163. vegyülete)

A 163. vegyület előállítása

35 0,98 g (2,1 mmol) 161. vegyületet 10 ml metilén-kloridban 0 °C-ra lehűtünk, és egyszerre hozzáadunk 1,6 g (10,3 mmol) trimetil-szilil-bromidot. Az elegyet 1,5 órán át 0 °C-on 1,5 óra hosszat és éjszakán át szobahőmérsékleten keverjük, majd további 0,3 g trimetil-szilil-bromidot adunk hozzá, és a keverést szobahőmérsékleten két órán át folytatjuk. A reagens és az oldószert feleslegét vákuumban elpárologtatva narancssárga színű olajat kapunk, amelyet vízzel eldörzsölve fehér színű, szilárd anyagot kapunk. A szilárd anyagot szívótölcséren leszűrve összegyűjtjük és 1 N nátrium-hidroxidban feloldjuk, majd metilén-kloriddal mossuk. A lúgos fázist 1 M foszforsavval megsavanyítjuk, a fehér színű, szilárd csapadékot leszűrjük, kloroform/metanol elegyben feloldjuk, megszáritjuk, leszűrjük és bepároljuk, így 0,78 g 163. vegyületet kapunk.

19. példa

Metil-1-[2,6-diklór-4-(trifluor-metil)-fenil]-5-nitro-1H-indazol-6-il-karboxilát

(I. táblázat 242. vegyülete)

55 5-(Acetil-amino)-4-metil-2-nitro-benzoát előállítása

8,4 g füstölő salétromsav és 260 g tömény kénsav elegyét 0–10 °C-ra lehűtjük, és keverés közben több részletben hozzáadunk 26,3 g (127 mmol) 3-(acetil-amino)-4-metil-benzoátot. Néhány órai keverés után az

elegyet jégre öntjük, amely ezután megolvad. A terméket szivótolcséren szűrve összegyűjtjük, vízzel mossuk és megszáritjuk. A szilárd anyagot izopropanolból átkristályosítva 27 g sárga színű, por alakú anyagot kapunk.

5-Nitro-1H-indazol-6-il-karboxilát előállítása

A fenti toluidid közbenső terméket a 16. példában leírt módon ciklizálva 4,9 g kívánt észtert kapunk narancssárga színű, szilárd anyag alakjában.

A 242. vegyület előállítása

A fenti indazol közbenső terméket a 16. példában leírt módon arilezve, 1,5 g indazolból kiindulva 1,8 g 242. vegyületet kapunk.

20. példa

1-[2,6-Dinitro-4-(trifluor-metil)-fenil]-5-nitro-1H-indazol

(I. táblázat 108. vegyülete)

A 108. vegyület előállítása

2,0 g (10 mmol) 5-nitro-indazol 40 ml vízmentes DMF-fel készített oldatát 3,32 g (10 mmol) 4-klór-3,5-dinitro-benzo-trifluoriddal és 1,7 g (10 mmol) vízmentes kálium-karbonáttal kezeljük. Ehhez az elegyhez néhány 18-korona-6-katalizátor kristályt adunk, és az oldatot 4 órán át 40 °C-on melegítjük. Ezután az elegyet lehűtjük, metilén-kloriddal felhígítjuk, vízzel, 1 N sósavval, vizes kálium-karbonát-oldattal, vizes nátrium-hidroxid-oldattal mossuk, majd magnézium-szulfát fölött megszáritjuk. Bepárlással és a maradék éterrel való eldörzsölésével 2,75 g (57%-os kitermelés) sárga színű, szilárd anyagot kapunk.

21. példa

Etil-3-[1-[3-klór-5-(trifluor-metil)-2-piridil]-1H-indazol-6-il-amino-3-oxo]-propionát

(I. táblázat 52. vegyülete)

Az 52. vegyület előállítása

3,2 g (10 mmol), 4. példa szerinti módon előállított amino-indazol közbenső terméket 50 ml, 1 ml piridint tartalmazó metilén-kloridban feloldunk. Az oldathoz hűtés közben hozzáadunk 1,40 ml (11 mmol) etil-malonil-kloridot. A reakció exoterm, a reakcióelegyet egy óra hosszat állni hagyjuk, majd 50 ml 5 tömeg%-os sósavval és 50 ml 5 tömeg%-os nátrium-hidrogén-karbonát-oldattal mossuk, és vízmentes magnézium-szulfát fölött megszáritjuk. A megszáritott oldatot vákuumban bepárolva 4,0 g olajszerű anyagot kapunk, amely állás során éter/pentán elegyből kristályosodik, így az első kristályosításkor 2,7 g fehér színű, szilárd 52. vegyületet kapunk.

22. példa

6-(2-Acetoxi-etoxi)-1-[3-klór-5-(trifluor-metil)-2-piridil]-1H-indazol

(I. táblázat 209. vegyülete)

6-(2-Acetoxi-etoxi)-1H-indazol előállítása

13,4 g (100 mmol) 6-hidroxi-indazolból, 100 ml dimetil-formamidból, 13,8 g (100 mmol) aktivált vízmentes kálium-karbonátból és 10 mg 18-korona-6-ból keveréket készítünk. Ehhez a keverékhez nitrogénat-

moszférában, keverés közben, 5 °C-on cseppenként hozzáadunk 11,0 ml (100 mmol) 2-bróm-etil-acetátot. A reakcióelegyet éjszakán át keverjük, majd 300 ml éterrel felhígítjuk, és 150 ml vízzel, kétszer 100-100 ml 5 tömeg%-os nátrium-hidrogén-karbonát-oldattal és 100 ml 5 tömeg%-os nátrium-karbonát-oldattal mossuk, majd vízmentes magnézium-szulfát fölött megszáritjuk. Ezt a megszáritott oldatot nagy vákuumban bepárolva 3,2 g 6-(2-acetoxi-etoxi)-indazolt kapunk olajszerű anyag alakjában.

A 209. vegyület előállítása

A fenti közbenső termék 3,2 g-ját (15 mmol) feloldjuk 50 ml DMF-ben, és ehhez az oldathoz 1,63 g (15 mmol) kálium-tercier-butoxidot adunk. Ezután 5 °C-os, jégfürdőben való hűtés közben egyszerre hozzáadunk 2,1 ml (15 mmol) 2,3-diklór-5-(trifluor-metil)-piridint. A reakcióelegy hőmérsékletét hagyjuk szobahőmérsékletre emelkedni, és az elegyet egy óra hosszat állni hagyjuk. Ezután 150 ml éterrel felhígítjuk, majd 100 ml vízzel, kétszer 100-100 ml 5 tömeg%-os nátrium-hidrogén-karbonát-oldattal mossuk, és vízmentes magnézium-szulfát fölött megszáritjuk, majd vákuumban bepároljuk, így a kívánt terméket (209. vegyület) 4,15 g olajszerű anyag alakjában kapjuk.

23. példa

1-[3-Klór-5-(trifluor-metil)-2-piridil]-6-(2-hidroxi-etoxi)-1H-indazol

(I. táblázat 210. vegyülete)

A 210. vegyület előállítása

Az I. táblázat 209. vegyületét (3,02, 7,6 mmol) 10 ml etanollal, 1,0 ml vízzel és 0,55 g (8,3 mmol) 85 tömeg%-os kálium-hidroxid-pellettel összekeverjük. A reakcióelegyet szobahőmérsékleten 20 órán át keverjük, majd vákuumban bepároljuk, így olajszerű anyagot kapunk, amelyet 100 ml metilén-kloridban felvesszünk, vízzel mossuk, vízmentes magnézium-szulfát fölött megszáritjuk, és a fenti módon bepároljuk. Így 2,14 g olajszerű anyagot kapunk, amely éter-hexán elegyből kristályosodik. Ily módon 0,78 g kívánt terméket kapunk szilárd termék alakjában (210. vegyület).

24. példa

R/S-2-[1-[2,6-Diklór-4-(trifluor-metil)-fenil]-1H-indazol-6-il-oxi]-propionsav

(I. táblázat 55. vegyülete)

Az 55. vegyület előállítása

Az I. táblázat 41. vegyületének 4,5 g-ját (10 mmol) összekeverjük 100 ml metanollal, 10 ml vízzel és 0,73 g (11 mmol) 85 tömeg%-os kálium-hidroxid-pellettel. Ezt az elegyet hűtővízben átkeverjük, majd vákuumban üvegszerű anyaggá bepároljuk, ezt 100 ml vízben felvesszük, 80 ml éterrel mossuk, és 0,91 ml tömény sósavval megsavanyítjuk. Ezt a savanyított elegyet kétszer 75 ml metilén-kloriddal extraháljuk, és az egyesített extraktumokat vízmentes magnézium-szulfát fölött florisillel megszáritjuk. A megszáritott extraktumot vákuumban bepároljuk, így üvegszerű anyagot kapunk, amely éter-hexán elegyből kristályosodik, így első frakcióként 2,7 g kívánt terméket kapunk.

25. példa

Etil-2-[1-[2,6-diklór-4-(trifluor-metil)-fenil]-1H-indazol-6-il-oxi]-propionil-amino-acetát

(I. táblázat 153. vegyülete)

A 153. vegyület előállítása

Az I. táblázat 55. vegyületének 1,2 g-ját (3 mmol) 10 ml metilén-kloridban szuszpendáljuk, majd egyszerre, gázfejlődés közben hozzáadunk 0,65 g (4 mmol) karbonil-diimidazolt. 45 perc múlva gyorsan elegyet készítünk 1,4 g (10 mmol) glicin-etil-észter-hidrokloridból, 20 ml metilén-kloridból és 1,4 ml (10 mmol) trietilaminból, és egyszerre hozzáadjuk az imidazol reakcióelegyhez. A reakció kissé exoterm, 15 perc elteltével az elegyet 150 ml éterrel felhígítjuk, majd 100 ml vízzel, kétszer 75 ml 5 tömeg%-os nátrium-hidrogén-karbonát-oldattal mossuk, vízmentes magnézium-szulfát fölött megszáritjuk, vákuumbepárlással üvegszerű anyagot kapunk. Ezt éter-hexán elegyből kristályosítva 1,25 g kívánt terméket kapunk szilárd anyag alakjában.

26. példa

Etil-R-2-[1-[3-klór-5-(trifluor-metil)-2-piridil]-1H-indazol-6-il-oxi]-propionát

(I. táblázat 255. vegyülete)

Etil-R-2-(1H-indazol-6-il-oxi)-propionát előállítása

6,7 g (50 mmol) 6-hidroxi-indazolból, 100 ml vízmentes DMF-ből, 9,0 ml (50 mmol) 90 tömeg%-os etil-S-2-(metil-szulfonil)-oxi-propionátból és 6,9 g (50 mmol) vízmentes aktivált kálium-karbonátból

(50 mmol) elegyet készítünk. A reakcióelegyet 90 percig nitrogénatmoszférában, keverés közben 80–90 °C-on melegítjük, majd szobahőmérsékletre hűtjük, és a hétvégén állni hagyjuk. Ezután a reakcióelegyet 200 ml éterrel felhígítjuk, majd először 400 ml, majd 100 ml vízzel, 100 ml telített nátrium-hidrogén-karbonát-oldattal és ismét 100 ml vízzel mossuk; ezután magnézium-szulfát fölött megszáritjuk és florisilen éterrel kromatografáljuk, így 6,3 g olajszerű anyagot kapunk, amelyet mágneses magrezonancia (NMR), infravörös spektruma, optikai forgatóképessége és tömegspektruma alapján etil-R-2-(1H-indazol-6-il-oxi)-propionátként azonosítottunk.

A 255. vegyület előállítása

Elegyet készítünk 2,3 g (10 mmol) fenti indazolvegyületből, 50 ml vízmentes DMF-ből és 1,1 g (10 mmol) vízmentes aktivált kálium-karbonátból. Ehhez 1,4 ml (10 mmol), jégfürdőben lehűtött 2,3-diklór-5-(trifluor-metil)-piridint adunk. A reakcióelegyet egy óráan át jégfürdőben és egy óráan át szobahőmérsékleten keverjük, majd 200 ml éterrel felhígítjuk. Az elegyet háromszor 100-100 ml vízzel mossuk, vízmentes magnézium-szulfát fölött megszáritjuk, és nagy vákuumban bepároljuk. Így 2,8 g olajszerű anyagot kapunk, amelyet mágneses magrezonancia (NMR), infravörös spektruma, optikai forgatóképessége és tömegspektruma alapján a kívánt terméként azonosítottunk.

Az alábbi I. táblázatban a találmány szerinti vegyületek képviselőit soroljuk fel.

I. táblázat
I általános képletű vegyületek

Vegyület száma	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	R ⁸	X	Fizikai állandó Olvadáspont (°C) vagy n _D ²⁰
1.	H	Cl	Cl	H	NO ₂	Cl	H	H	C–Cl	61,0–62,0
2.	H	Cl	CF ₃	H	NO ₂	H	H	H	C–Cl	102,0–104,0
3.	H	Cl	Cl	H	NO ₂	H	H	H	C–Cl	113,0–116,0
4.	H	H	Cl	H	NO ₂	H	H	Cl	C–Cl	145,0–148,0
5.	H	H	Cl	H	NO ₂	Cl	H	Cl	C–Cl	166,0–168,0
6.	H	Cl	CF ₃	H	NO ₂	NO ₂	H	H	C–Cl	141,0–142,0
7.	H	Cl	CF ₃	H	NO ₂	H	H	H	(N)	131,0–133,0
8.	H	Cl	CF ₃	H	H	H	H	H	C–Cl	–
9.	H	Cl	CF ₃	H	H	H	H	H	(N)	60,0–65,0
10.	H	H	Cl	H	H	H	H	Cl	C–Cl	–
11.	H	H	Cl	H	NO ₂	H	H	H	C–Cl	80,0–81,0
12.	H	Cl	CF ₃	NO ₂	H	H	H	H	C–Cl	–
13.	Cl	Cl	CF ₃	H	H	H	H	H	C–Cl	–
14.	Cl	Cl	CF ₃	H	NO ₂	H	H	H	C–Cl	93,0–98,0
15.	H	Cl	CF ₃	NO ₂	H	H	H	H	C–Cl	100,0–101,0
16.	H	Cl	CF ₃	H	H	NO ₂	H	H	C–Cl	126,0–127,0
17.	H	Cl	CF ₃	H	NO ₂	Cl	H	H	C–Cl	162,0–164,0
18.	H	Cl	CF ₃	H	H	OCH ₃	H	H	C–Cl	93,0–94,0
19.	H	H	CF ₃	H	NO ₂	H	H	H	C–Cl	149,0–151,0

I. táblázat (folytatás)

Ve- gyü- let szá- ma	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	R ⁸	X	Fizikai állandó Olvadáspont (°C) vagy n _D ²⁰
20.	H	Cl	CF ₃	H	NO ₂	OCH ₂	H	H	C-Cl	215,0–216,0
21.	H	Cl	CF ₃	H	H	NH ₂	H	H	C-Cl	61,0–63,0
22.	H	Cl	CF ₃	H	H	NH ₂	H	H	(N)	222,0–223,0
23.	H	Cl	CF ₃	H	NH ₂	H	H	H	(N)	143,0–144,0
24.	H	Cl	CF ₃	H	NH ₂	H	H	H	C-Cl	126,0–127,0
25.	H	H	CF ₃	H	NO ₂	H	H	H	(N)	112,0–113,0
26.	H	H	CF ₃	H	H	NO ₂	H	H	(N)	142,0–144,0
27.	H	H	CF ₃	H	H	H	H	H	(N)	86,0–87,0
28.	H	Cl	CF ₃	H	NO ₂	NO ₂	H	H	(N)	154,0–155,0
29.	H	H	CF ₃	H	H	NHCOCH ₃	H	H	C-Cl	183,0–184,0
30.	H	H	CF ₃	H	H	NH ₂	H	H	C-Cl	199,0–200,0
31.	H	Cl	CF ₃	H	H	H	NO ₂	H	(N)	143,0–144,0
32.	H	Cl	CF ₃	H	H	H	NO ₂	H	C-Cl	225,0–227,0
33.	H	Cl	CF ₃	H	H	CH ₃	H	H	(N)	58,0–60,0
34.	H	Cl	CF ₃	CH ₃	H	H	H	H	(N)	41,0–45,0
35.	H	Cl	CF ₃	H	H	H	CH ₃	H	(N)	91,0–92,0
36.	H	Cl	CF ₃	CH ₃	H	H	H	H	C-Cl	89,0–91,0
37.	H	Cl	CF ₃	H	H	CH ₃	H	H	C-Cl	90,0–92,0
38.	H	Cl	CF ₃	H	H	H	CH ₃	H	C-Cl	135,0–137,0
39.	H	NO ₂	CF ₃	H	H	NH ₂	H	H	C-Cl	183,0–185,0
40.	H	Cl	CF ₃	H	H	NHSO ₂ CH ₃	H	H	C-Cl	170,0–172,0
41.	H	Cl	CF ₃	H	H	OCHCOOC ₂ H ₅ CH ₃	H	H	C-Cl	67,0–71,0
42.	H	F	CF ₃	H	NO ₂	H	H	H	C-Cl	143,0–144,0
43.	H	Cl	CF ₃	H	H	OCHCOOC ₂ H ₅ CH ₃	H	H	(N)	81,0–82,0
44.	H	Cl	CF ₃	H	H	OCH ₂ C≡H	H	H	C-Cl	130,0–131,0
45.	H	F	CF ₃	H	H	OCHCOOC ₂ H ₅ CH ₃	H	H	C-Cl	–
46.	H	Cl	CF ₃	H	F	H	H	H	C-Cl	71,0–72,0
47.	H	Cl	CF ₃	Cl	H	H	H	H	C-Cl	110,0–112,0
48.	H	Cl	CF ₃	Cl	H	H	H	H	(N)	69,0–72,0
49.	H	Cl	CF ₃	OCHCOOC ₂ H ₅ CH ₃	H	H	H	H	C-Cl	87,0–89,0
50.	H	Cl	CF ₃	H	Br	H	H	H	(N)	–
51.	H	Cl	CF ₃	H	H	O NHCCF ₃	H	H	(N)	125,0–127,0
52.	H	Cl	CF ₃	H	H	O O NHCC ₂ H ₄ C-OC ₂ H ₅	H	H	(N)	112,0–115,0
53.	H	Cl	CF ₃	H	H	O OCH ₂ C-OC ₂ H ₅	H	H	C-Cl	90,0–92,0
54.	H	Cl	CF ₃	H	H	O OCH ₂ -C-OH	H	H	C-Cl	163,0–164,0

I. táblázat (folytatás)

Ve- gyü- let szá- ma	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	R ⁸	X	Fizikai állandó Olvaspont (°C) vagy n _D ²⁰
55.	H	Cl	CF ₃	H	H	$\begin{array}{c} \text{O} \\ \parallel \\ \text{OCH}-\text{C}-\text{OH} \\ \\ \text{CH}_3 \end{array}$	H	H	C-Cl	180,0–181,0
57.	H	SCH ₃	CF ₃	H	H	$\begin{array}{c} \text{OCH}-\text{C}-\text{OC}_2\text{H}_5 \\ \quad \parallel \\ \text{CH}_3 \quad \text{O} \end{array}$	H	H	C-Cl	123,0–124,0
58.	H	SCH ₃	CF ₃	H	H	$\begin{array}{c} \text{OCH}-\text{C}-\text{OC}_2\text{H}_5 \\ \quad \parallel \\ \text{CH}_3 \quad \text{O} \end{array}$	H	H	C-CH ₃	108,0–110,0
59.	H	Cl	CF ₃	H	H	NHSO ₂ CF ₃	H	H	(N)	206,0–207,0
60.	H	Cl	CF ₃	H	H	$\begin{array}{c} \text{O} \\ \parallel \\ \text{NHC}-\triangle \end{array}$	H	H	(N)	207,0–208,0
61.	H	Cl	CF ₃	H	H	$\begin{array}{c} \text{O} \\ \parallel \\ \text{NHC}-\text{NHCH}_3 \end{array}$	H	H	(N)	238,0–240,0
62.	H	Cl	CF ₃	H	H	$\begin{array}{c} \text{O} \quad \text{O} \\ \parallel \quad \parallel \\ \text{NHC}-\text{NHCH}_2\text{C}-\text{OC}_2\text{H}_5 \end{array}$	H	H	(N)	185,0–195,0
63.	H	Cl	CF ₃	H	H	$\begin{array}{c} \text{O} \\ \parallel \\ \text{NHC}-\text{NHSO}_2-\text{C}_6\text{H}_5 \end{array}$	H	H	(N)	168,0–170,0
64.	H	Cl	CF ₃	H	H	$\begin{array}{c} \text{O} \quad \text{O} \\ \parallel \quad \parallel \\ \text{NHC}-(\text{CH}_2)_2\text{C}-\text{OCH}_3 \end{array}$	H	H	(N)	111,0–114,0
65.	H	Cl	CF ₃	H	H	$\begin{array}{c} \text{O} \quad \text{O} \\ \parallel \quad \parallel \\ \text{NHC}-\text{C}-\text{OC}_2\text{H}_5 \end{array}$	H	H	(N)	164,0–166,0
66.	H	Cl	CF ₃	H	H	$\begin{array}{c} \text{O} \\ \parallel \\ \text{CH}_2\text{OC}-\text{CH}_3 \end{array}$	H	H	C-Cl	101,0–102,0
67.	H	Cl	CF ₃	H	C≡N	H	H	H	(N)	92,0–93,0
68.	H	Cl	CF ₃	H	H	$\begin{array}{c} \text{O} \quad \text{O} \\ \parallel \quad \parallel \\ \text{NHC}-\text{CH}_2\text{C}-\text{OH} \end{array}$	H	H	(N)	150,0–151,0
69.	H	Cl	CF ₃	H	H	$\begin{array}{c} \text{O} \quad \text{O} \\ \parallel \quad \parallel \\ \text{NHC}-\text{CH}_2\text{C}-\text{OC}_2\text{H}_5 \end{array}$	H	H	C-Cl	145,0–146,0
70.	H	Cl	CF ₃	H	H	$\begin{array}{c} \text{O} \quad \text{O} \\ \parallel \quad \parallel \\ \text{NHC}-\text{CH}_2\text{C}-\text{OH} \end{array}$	H	H	C-Cl	165,0 (bomlik)
71.	H	Cl	CF ₃	H	H	$\begin{array}{c} \text{O} \quad \text{O} \\ \parallel \quad \parallel \\ \text{NHC}-\text{C}-\text{OC}_2\text{H}_5 \end{array}$	H	H	C-Cl	169,0–171,0
72.	H	Cl	CF ₃	H	H	NHSO ₂ -CF ₃	H	H	C-Cl	190,0–194,0
73.	H	Cl	CF ₃	H	C≡N	H	H	H	C-Cl	88,0–90,0
74.	H	Cl	CF ₃	H	CH ₃	H	H	H	C-Cl	–
75.	H	Cl	CF ₃	H	CH ₃	H	H	H	(N)	108,0–111,0
76.	H	F	CF ₃	H	CH ₃	H	H	H	C-Cl	–
77.	H	Cl	CF ₃	H	H	$\begin{array}{c} \text{COC}_2\text{H}_5 \\ \parallel \\ \text{O} \end{array}$	H	H	C-Cl	108,0–110,0
78.	H	Cl	CF ₃	H	H	Cl	H	H	C-Cl	86,0–88,0
79.	H	Cl	CF ₃	H	H	SCH ₃	H	H	C-Cl	92,0–94,0

I. táblázat (folytatás)

Ve- gyü- let szá- ma	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	R ⁸	X	Fizikai állandó Olvadáspont (°C) vagy n _D ²⁰
80.	H	Cl	CF ₃	H	H	SO ₂ N(CH ₃) ₂	H	H	C-Cl	165,0–167,0
81.	H	Cl	CF ₃	H	H	-CHO	H	H	C-Cl	110,0–111,0
82.	H	H	NO ₂	H	NO ₂	H	H	H	(N)	–
83.	H	NO ₂	NO ₂	H	NO ₂	H	H	H	(N)	–
84.	H	Cl	CF ₃	H	H	$\begin{array}{c} \text{O} \\ \parallel \\ -\text{CH}(\text{OCCH}_3)_2 \end{array}$	H	H	C-Cl	144,0–146,0
85.	H	Cl	CF ₃	H	H	$\begin{array}{c} \text{O} \\ \parallel \\ -\text{CH}=\text{CHCOCH}_3 \end{array}$	H	H	C-Cl	136,0–137,0
86.	H	Cl	CF ₃	H	H	$\begin{array}{c} -\text{COH} \\ \parallel \\ \text{O} \end{array}$	H	H	C-Cl	198,0–200,0
87.	H	Cl	CF ₃	H	H	-CH=NOCH ₃	H	H	C-Cl	109,0–111,0
88.	H	Cl	CF ₃	H	H	-CH ₂ OH	H	H	C-Cl	111,0–112,0
89.	H	Cl	CF ₃	H	H	$\begin{array}{c} \text{O} \\ \parallel \\ -\text{N}-\text{CHCH}_3\text{C}-\text{OC}_2\text{H}_5 \\ \parallel \\ \text{C}-\text{C}-\text{OC}_2\text{H}_5 \\ \parallel \quad \parallel \\ \text{O} \quad \text{O} \end{array}$	H	H	C-Cl	101,0–108,0
90.	H	Cl	CF ₃	H	H	$\begin{array}{c} \text{O} \\ \parallel \\ -\text{NHC}-\text{OCH}_3 \end{array}$	H	H	C-Cl	170,0–172,0
91.	H	Cl	CF ₃	H	H	$\begin{array}{c} \text{O} \\ \parallel \\ -\text{OCHC}-\text{NH}_2 \\ \\ \text{CH}_3 \end{array}$	H	H	C-Cl	178,0–179,0
92.	H	Cl	CF ₃	H	Cl	H	H	H	C-Cl	83,0–89,0
93.	H	Cl	CF ₃	H	Cl	H	H	H	(N)	130,0–132,0
94.	H	F	CF ₃	H	Cl	H	H	H	C-Cl	75,0–76,0
95.	H	Cl	CF ₃	H	CH ₃	CH ₃	H	H	(N)	101,0–102,0
96.	H	Cl	CF ₃	H	CH ₃	CH ₃	H	H	C-Cl	123,0–124,0
97.	H	Cl	CF ₃	H	H	OCH ₂ CH=CH ₂	H	H	(N)	–
98.	H	Cl	CF ₃	H	H	NHSO ₂ CH ₂ COOCH ₃	H	H	(N)	56,0 (bomlik)
99.	H	Cl	CF ₃	H	H	NHSO ₂ CH ₂ CO ₂ H	H	H	(N)	74,0–81,0
100.	H	Cl	CF ₃	H	H	OH	H	H	(N)	153,0–155,0
101.	H	Cl	CF ₃	H	H	I	H	H	C-Cl	112,0–114,0
102.	H	Cl	CF ₃	H	H	CH ₂ NH ₂	H	H	C-Cl	–
103.	H	Cl	CF ₃	H	H	CH ₂ NHSO ₂ CF ₃	H	H	C-Cl	144,0–147,0
104.	H	Cl	CF ₃	H	H	OCH ₂ OC ₂ H ₅	H	H	(N)	–
105.	H	NO ₂	CF ₃	H	H	$\begin{array}{c} \text{OCHCOOC}_2\text{H}_5 \\ \\ \text{CH}_3 \end{array}$	H	H	C-Cl	85,0–88,0
106.	H	Cl	CF ₃	H	H	$\begin{array}{c} \text{OCHCONHCH}_3 \\ \\ \text{CH}_3 \end{array}$	H	H	C-Cl	188,0–190,0
110.	H	Cl	CF ₃	H	Cl	NO ₂	H	H	(N)	158,0–160,0
111.	H	Cl	CF ₃	H	H	CH ₂ OCH ₃	H	H	C-Cl	65,0–66,0
114.	H	Cl	CF ₃	H	H	$\begin{array}{c} \text{O} \\ \parallel \\ \text{NHC}-\text{CH}_3 \end{array}$	H	H	C-Cl	282,0–283,0

I. táblázat (folytatás)

Ve- gyü- let szá- ma	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	R ⁸	X	Fizikai állandó Olvadáspont (°C) vagy n _D ²⁰
115.	H	Cl	CF ₃	$\begin{array}{c} \text{O} \\ \\ -\text{C}-\text{OCH}_3 \end{array}$	H	H	H	H	C-Cl	–
116.	I	Cl	CF ₃	H	H	I	H	H	C-Cl	90,0–92,0
117.	H	Cl	CF ₃	H	H	F	H	H	C-Cl	78,0–80,0
118.	H	Cl	CF ₃	H	$\begin{array}{c} \text{O} \\ \\ \text{NHC}-\text{CH}_3 \end{array}$	H	H	H	C-Cl	245,0–247,0
119.	H	Cl	CF ₃	Br	H	H	H	H	(N)	84,0–85,0
120.	H	Cl	CF ₃	Br	H	H	H	H	C-Cl	112,0–113,0
121.	H	NO ₂	CF ₃	Br	H	H	H	H	C-Cl	135,0–136,0
122.	H	H	CF ₃	H	NO ₂	H	H	H	C-CN	–
123.	H	Cl	CF ₃	H	H	F	H	H	(N)	54,0–55,0
124.	H	Cl	CF ₃	H	H	$\begin{array}{c} \text{O} \\ \\ -\text{C}-\text{OCH}_3 \end{array}$	H	H	C-Cl	136,0–137,0
125.	H	Cl	CF ₃	H	H	Br	H	H	C-Cl	65,0–67,0
126.	H	Cl	CF ₃	H	H	Br	H	H	(N)	93,0–94,0
127.	H	Cl	CF ₃	H	$\begin{array}{c} \text{OCHC}-\text{OC}_2\text{H}_5 \\ \quad \\ \text{CH}_3 \quad \text{O} \end{array}$	H	H	H	C-Cl	–
128.	H	Cl	CF ₃	CN	H	H	H	H	(N)	120,0–121,0
129.	H	Cl	CF ₃	CN	H	H	H	H	C-Cl	144,50
130.	H	Cl	CF ₃	H	H	$\begin{array}{c} \text{O} \\ \\ \text{OCHC}-\text{OC}_2\text{H}_5 \\ \\ \text{CH}_3 \end{array}$	H	H	C-NHAc	94,0–98,0
131.	H	Cl	CF ₃	H	H	NHCOCH ₃	H	H	(N)	115,0–118,0
132.	H	Cl	CF ₃	H	H	$\begin{array}{c} \text{NHCCH}_2\text{CHCH}_2\text{CO}_2\text{H} \\ \quad \\ \text{O} \quad \text{CH}_3 \end{array}$	H	H	(N)	150,0 (bomlik)
133.	H	Cl	CF ₃	H	H	$\begin{array}{c} \text{OCHCNHN}(\text{CH}_3)_2 \\ \quad \\ \text{CH}_3 \quad \text{O} \end{array}$	H	H	C-Cl	140,0–142,0
134.	H	Cl	CF ₃	H	H	$\begin{array}{c} \text{OCHC}-\text{N}(\text{CH}_3)_2 \\ \quad \\ \text{CH}_3 \quad \text{O} \end{array}$	H	H	C-Cl	141,0–142,0
135.	H	Cl	CF ₃	H	H	$\begin{array}{c} \text{OCHCO}_2\text{K} \\ \\ \text{CH}_3 \end{array}$	H	H	C-Cl	–
136.	H	Cl	CF ₃	H	H	$\begin{array}{c} \text{OCHC}-\text{NHCH}_2\text{CH}_2\text{OCH}_3 \\ \quad \\ \text{CH}_3 \quad \text{O} \end{array}$	H	H	C-Cl	105,0–107,0
137.	H	Cl	CF ₃	H	H	$\begin{array}{c} \text{OCHCNHNH}_2 \\ \quad \\ \text{CH}_3 \quad \text{O} \end{array}$	H	H	C-Cl	174,0–175,0
138.	H	Cl	CF ₃	H	H	$\begin{array}{c} \text{OCHC}-\text{N}-\text{OCH}_3 \\ \quad \quad \\ \text{CH}_3 \quad \text{O} \quad \text{CH}_3 \end{array}$	H	H	C-Cl	120,0–122,0
139.	H	Cl	CF ₃	H	H	$\begin{array}{c} \text{OCHC}-\text{NHN}=\text{C} \\ \quad \quad \diagup \quad \diagdown \\ \text{CH}_3 \quad \text{O} \quad \text{CH}_3 \quad \text{CH}_3 \end{array}$	H	H	C-Cl	162,0–165,0

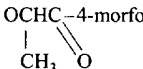
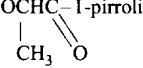
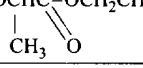
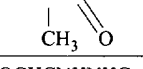
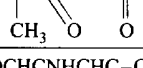
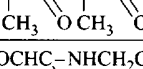
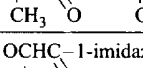
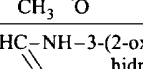
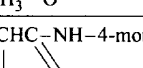
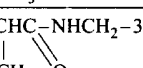
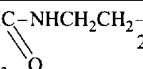
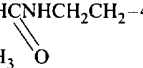
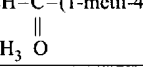
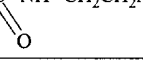
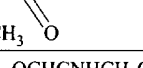
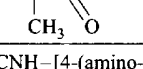
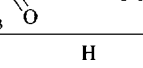
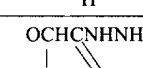
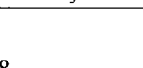
I. táblázat (folytatás)

Vc- gyü- let szá- ma	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	R ⁸	X	Fizikai állandó Olvadáspont (°C) vagy n _D ²⁰
140.	H	Cl	CF ₃	H	H	$\begin{array}{c} \text{OCHC}-\text{NHNH}-\text{C}-\text{NHCH}_3 \\ \quad \parallel \quad \parallel \\ \text{CH}_3 \quad \text{O} \quad \text{O} \end{array}$	H	H	C-Cl	202,0–204,0
141.	H	Cl	CF ₃	H	H	$\begin{array}{c} \text{OCH}-\text{C}-\text{NH}-\text{OCH}_3 \\ \quad \parallel \\ \text{CH}_3 \quad \text{O} \end{array}$	H	H	C-Cl	157,0–159,0
142.	H	F	CF ₃	H	H	OCH ₂ C≡CH	H	H	C-Cl	43,0–45,0
143.	H	F	CF ₃	H	H	Br	H	H	C-Cl	57,0–59,0
144.	H	Cl	CF ₃	H	NHSO ₂ CH ₃	H	H	H	C-Cl	180,0–181,0
145.	H	Cl	CF ₃	NHCOCH ₃	H	H	H	H	C-Cl	–
146.	H	Cl	CF ₃	H	NO ₂	H	H	Cl	(N)	–
147.	H	Cl	CF ₃	H	PO(OC ₂ H ₅) ₂	H	H	H	(N)	–
148.	H	Cl	CF ₃	NHSO ₂ CH ₃	H	H	H	H	C-Cl	193,0–196,0
149.	H	Cl	CF ₃	N(COCH ₃) ₂	H	H	H	H	C-Cl	151,0–153,0
150.	H	NH ₂	CF ₃	H	H	$\begin{array}{c} \text{O} \\ \parallel \\ \text{OCHCOC}_2\text{H}_5 \\ \\ \text{CH}_3 \end{array}$	H	H	C-Cl	153,0–155,0
151.	H	Cl	CF ₃	H	H	$\begin{array}{c} \text{OCHC}-\text{NHCH}_2\text{CH}_2\text{CN} \\ \quad \parallel \\ \text{CH}_3 \quad \text{O} \end{array}$	H	H	C-Cl	149,0–151,0
152.	H	Cl	CF ₃	H	H	$\begin{array}{c} \text{OCH}-\text{C}-\text{NHCH}_2- \\ \quad \parallel \quad \text{ } \\ \text{CH}_3 \quad \text{O} \end{array}$ 	H	H	C-Cl	135,0–140,0
153.	H	Cl	CF ₃	H	H	$\begin{array}{c} \text{O} \\ \parallel \\ \text{OCH}-\text{C}-\text{NHCH}_2\text{C}-\text{OC}_2\text{H}_5 \\ \quad \parallel \\ \text{CH}_3 \quad \text{O} \end{array}$	H	H	C-Cl	95,0–110,0
154.	H	Cl	CF ₃	H	H	$\begin{array}{c} \text{OCH}-\text{C}-\text{O}-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{OCH}_3 \\ \quad \parallel \\ \text{CH}_3 \quad \text{O} \end{array}$	H	H	C-Cl	66,0–68,0
155.	H	Cl	CF ₃	H	H	$\begin{array}{c} \text{OCH}-\text{C}-4\text{-morfolinil} \\ \quad \parallel \\ \text{CH}_3 \quad \text{O} \end{array}$	H	H	C-Cl	182,0–184,0
156.	H	Cl	CF ₃	H	H	$\begin{array}{c} \text{OCH}-\text{C}-1\text{-pirrolidinil} \\ \quad \parallel \\ \text{CH}_3 \quad \text{O} \end{array}$	H	H	C-Cl	159,0–161,0
157.	H	Cl	CF ₃	H	H	$\begin{array}{c} \text{OCH}-\text{COCH}_2\text{CH}_2\text{CH}_3 \\ \quad \parallel \\ \text{CH}_3 \quad \text{O} \end{array}$	H	H	C-Cl	75,0–76,0
158.	H	Cl	CF ₃	H	CO ₂ C ₂ H ₅	H	H	H	C-Cl	104,0–105,0
159.	H	Cl	CF ₃	H	CO ₂ H	H	H	H	C-Cl	202,0–205,0
160.	H	Cl	CF ₃	H	H	OCH ₂ C≡CH	H	H	(N)	75,0–76,0
161.	H	Cl	CF ₃	H	PO(OC ₂ H ₅) ₂	H	H	H	C-Cl	–
162.	H	Cl	CF ₃	H	NO ₂	OCH ₃	H	H	(N)	158,0–162,0
163.	H	Cl	CF ₃	H	PO(OH) ₂	H	H	H	C-Cl	187,0–192,0
164.	H	Cl	CF ₃	H	H	$\begin{array}{c} \text{O} \\ \parallel \\ \text{OCHC}-\text{OCH}_3 \\ \\ \text{CH}_3 \end{array}$	H	H	C-Cl	88,0–89,0

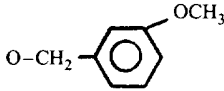
I. táblázat (folytatás)

Ve- gyü- let szá- ma	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	R ⁸	X	Fizikai állandó Olvadáspont (°C) vagy n _D ^{3°}
165.	H	Cl	CF ₃	H	H	$\begin{array}{c} \text{OHC}-\text{NHCH}_2\text{CH}_2\text{OH} \\ \quad \parallel \\ \text{CH}_3 \quad \text{O} \end{array}$	H	H	C-Cl	97,0–102,0
166.	H	Cl	CF ₃	H	H	$\begin{array}{c} \text{OHC}-\text{OCH}(\text{CH}_3)_2 \\ \quad \parallel \\ \text{CH}_3 \quad \text{O} \end{array}$	H	H	C-Cl	90,0–91,0
167.	H	Cl	CF ₃	H	H	OCH ₃	H	H	(N)	58,0–60,0
168.	H	Cl	CF ₃	$\begin{array}{c} \text{O} \\ \parallel \\ \text{C}-\text{OC}_2\text{H}_5 \end{array}$	H	H	H	H	C-Cl	82,0–85,0
169.	H	Cl	CF ₃	$\begin{array}{c} \text{O} \\ \parallel \\ \text{C}-\text{OC}_2\text{H}_5 \end{array}$	H	H	H	H	(N)	70,0–72,0
170.	H	Cl	CF ₃	CO ₂ H	H	H	H	H	(N)	240,0–243,0
171.	H	Cl	CF ₃	H	H	$\begin{array}{c} \text{OCH}-\text{CO}_2\text{H} \\ \\ \text{CH}_3 \end{array}$	H	H	(N)	134,0–136,0
172.	H	Cl	CF ₃	H	H	$\begin{array}{c} \text{CH}_3 \quad \text{O} \\ \quad \parallel \\ \text{OCH}-\text{C}-\text{NHCH}_2\text{CH}_2\text{N}(\text{CH}_3)_2 \end{array}$	H	H	C-Cl	–
173.	H	Cl	CF ₃	H	H	$\begin{array}{c} \text{OCH}-\text{CNHCH}_2\text{CH}_2\text{NH}_2 \\ \quad \parallel \\ \text{CH}_3 \quad \text{O} \end{array}$	H	H	C-Cl	125,0–126,0
174.	H	Cl	CF ₃	H	H	$\begin{array}{c} \text{O} \\ \parallel \\ \text{OHC}-\text{O}^{\oplus}\text{NH}_3\text{CH}(\text{CH}_3)_2 \\ \\ \text{CH}_3 \end{array}$	H	H	C-Cl	147,0–149,0
175.	H	Cl	CF ₃	H	H	$\begin{array}{c} \text{OHCNHCH}_2-2\text{-piridil} \\ \quad \parallel \\ \text{CH}_3 \quad \text{O} \end{array}$	H	H	C-Cl	138,0–139,0
176.	H	Cl	CF ₃	H	H	$\begin{array}{c} \text{OHC}-\text{NH}_2 \\ \quad \parallel \\ \text{CH}_3 \quad \text{O} \end{array}$	H	H	(N)	180,0–181,0
177.	H	Cl	CF ₃	H	H	$\begin{array}{c} \text{OHC}-\text{NHCH}_2\text{CH}_2\text{OCH}_3 \\ \quad \parallel \\ \text{CH}_3 \quad \text{O} \end{array}$	H	H	(N)	133,0–134,0
178.	H	Cl	CF ₃	H	H	$\begin{array}{c} \text{OHC}-\text{NHCH}_2\text{C}-\text{OC}_2\text{H}_5 \\ \quad \parallel \quad \parallel \\ \text{CH}_3 \quad \text{O} \quad \text{O} \end{array}$	H	H	(N)	114,0–116,0
179.	H	Cl	CF ₃	H	H	$\begin{array}{c} \text{OHC}-\text{O}^{\oplus}\text{NH}_3\text{CH}(\text{CH}_3)_2 \\ \quad \parallel \\ \text{CH}_3 \quad \text{O} \end{array}$	H	H	(N)	–
180.	H	Cl	CF ₃	H	H	$\begin{array}{c} \text{OCH}-\text{C}-\text{NH}-\text{OCH}_3 \\ \quad \parallel \\ \text{CH}_3 \quad \text{O} \end{array}$	H	H	(N)	187,0–188,0
181.	H	Cl	CF ₃	H	Br	OCH ₃	H	H	C-Cl	183,0–184,0
182.	H	Cl	CF ₃	H	H	$\begin{array}{c} \text{OHCNHCH}_2\text{CH}_2\text{CN} \\ \quad \parallel \\ \text{CH}_3 \quad \text{O} \end{array}$	H	H	(N)	150,0–151,0
183.	H	Cl	CF ₃	H	H	$\begin{array}{c} \text{OHC}-\text{NHCH}_2-\text{C}_4\text{H}_7\text{O} \\ \quad \parallel \\ \text{CH}_3 \quad \text{O} \end{array}$	H	H	(N)	108,0–109,0
184.	H	Cl	CF ₃	CO ₂ H	H	H	H	H	C-Cl	213,0–215,0
185.	H	Cl	CF ₃	H	H	$\begin{array}{c} \text{OCH}-\text{C}-\text{OCH}_2\text{CH}_2\text{OCH}_3 \\ \quad \parallel \\ \text{CH}_3 \quad \text{O} \end{array}$	H	H	(N)	82,0–83,0

I. táblázat (folytatás)

Vc- gyü- let szá- ma	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	R ⁸	X	Fizikai állandó Olvadáspont (°C) vagy n _D ²⁰
186.	H	Cl	CF ₃	H	H		H	H	(N)	151,0–152,0
187.	H	Cl	CF ₃	H	H		H	H	(N)	132,0–133,0
188.	H	Cl	CF ₃	H	H		H	H	(N)	–
189.	H	Cl	CF ₃	H	H		H	H	(N)	54,0–56,0
190.	H	Cl	CF ₃	H	H		H	H	(N)	170,0–175,0
191.	H	Cl	CF ₃	H	H		H	H	(N)	96,0–98,0
192.	H	Cl	CF ₃	H	H		H	H	(N)	139,0–143,0
193.	H	Cl	CF ₃	H	H		H	H	(N)	123,0–127,0
194.	H	Cl	CF ₃	H	H		H	H	(N)	157,0–160,0
195.	H	Cl	CF ₃	H	H		H	H	(N)	220,0–222,0
196.	H	Cl	CF ₃	H	H		H	H	(N)	155,0–156,0
197.	H	Cl	CF ₃	H	H		H	H	(N)	105,0–109,9
198.	H	Cl	CF ₃	H	H		H	H	(N)	115,0–118,0
199.	H	Cl	CF ₃	H	H		H	H	(N)	130,0–131,0
200.	H	Cl	CF ₃	H	H		H	H	(N)	192,0–195,0
201.	H	Cl	CF ₃	H	H		H	H	(N)	101,0–103,0
202.	H	Cl	CF ₃	H	H		H	H	(N)	151,0–152,0
203.	H	Cl	CF ₃	H	H		H	H	(N)	123,0–126,0
204.	H	Cl	CF ₃	CF ₃	H	H	H	H	C–Cl	88,0–90,0
205.	H	Cl	CF ₃	CF ₃	H	H	H	H	(N)	67,0–69,0
206.	H	Cl	CF ₃	H	H		H	H	(N)	75,0–80,0

I. táblázat (folytatás)

Ve- gyü- let szá- ma	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	R ⁸	X	Fizikai állandó Olvadáspont (°C) vagy n _D ²⁰
207.	H	Cl	CF ₃	H	H	$\begin{array}{c} \text{OHCNH-5-tetrazolil} \\ \\ \text{CH}_3 \end{array}$	H	H	(N)	210,0 (bomlik)
208.	H	Cl	CF ₃	H	H	$\begin{array}{c} \text{OHC-OC(CH}_3)_3 \\ \\ \text{CH}_3 \end{array}$	H	H	(N)	–
209.	H	Cl	CF ₃	H	H	$\begin{array}{c} \text{OCH}_2\text{CH}_2\text{OCCH}_3 \\ \\ \text{O} \end{array}$	H	H	(N)	–
210.	H	Cl	CF ₃	H	H	OCH ₂ CH ₂ OH	H	H	(N)	115,0–123,0
211.	H	Cl	CF ₃	Cl	CH ₃	H	H	H	C–Cl	86,0–88,0
212.	H	Cl	CF ₃	Cl	CH ₃	H	H	H	(N)	152,0–153,0
213.	H	Cl	CF ₃	H	Cl	OCH ₃	H	H	(N)	–
214.	H	Cl	CF ₃	H	H	$\begin{array}{c} \text{OCH-C-NOCH}_3 \\ \quad \quad \\ \text{CH}_3 \quad \text{O} \quad \text{CH}_3 \end{array}$	H	H	(N)	–
215.	H	Cl	CF ₃	H	CHO	OCH ₃	H	H	(N)	–
216.	H	Cl	CF ₃	H	Br	OCH ₃	H	H	(N)	177,0–178,0
217.	H	Cl	CF ₃	H	H	SO ₂ CH ₃	H	H	C–Cl	142,0–143,0
218.	H	Cl	CF ₃	H	H	SO ₃ CH ₃	H	H	(N)	129,0–131,0
219.	H	Cl	CF ₃	H	H	$\begin{array}{c} \text{OCH-CCH}_3 \\ \\ \text{CH}_3 \end{array}$	H	H	(N)	–
220.	H	Cl	CF ₃	H	H		H	H	(N)	–
221.	H	Cl	CF ₃	H	H	OCH ₂ CN	H	H	(N)	90,0–92,0
222.	H	Cl	CF ₃	H	Cl	OCH ₃	H	H	C–Cl	196,0–198,0
223.	H	Cl	CF ₃	H	Cl	OCH ₃	Cl	H	C–Cl	–
224.	H	H	CF ₃	H	H	$\begin{array}{c} \text{OHC-OC}_2\text{H}_5 \\ \\ \text{CH}_3 \end{array}$	H	H	C–Cl	–
225.	H	H	CF ₃	H	H	NO ₂	H	H	C–Cl	–
226.	H	Cl	CF ₃	H	H	OCH(CH ₃) ₂	H	H	C–Cl	–
227.	H	Cl	CF ₃	H	H	OCH(CH ₃) ₂	H	H	(N)	–
228.	H	H	CF ₃	Cl	H	H	H	H	C–Cl	73,0–75,0
229.	H	Cl	CF ₃	OCH ₃	H	H	H	H	C–Cl	97,0–99,0
230.	H	Cl	CF ₃	H	H	N(C ₂ H ₅) ₂	H	H	C–Cl	105,0–107,0
231.	H	Cl	CF ₃	H	N(C ₂ H ₅) ₂	H	H	H	C–Cl	73,0–75,0
232.	H	Cl	CF ₃	N(C ₂ H ₅) ₂	H	H	H	H	C–Cl	–
233.	H	Cl	CF ₃	H	Cl	NHSO ₂ CF ₃	H	H	(N)	–
234.	H	Cl	CF ₃	H	CHO	H	H	H	C–Cl	–
235.	H	Cl	CF ₃	H	H	$\begin{array}{c} \text{OHCN} \\ \\ \text{CH}_3 \end{array}$	H	H	(N)	92,0–99,0
236.	H	Cl	CF ₃	H	H	$\begin{array}{c} \text{OHCN} \\ \\ \text{CH}_3 \end{array}$	H	H	C–Cl	85,0–91,0
237.	H	H	CF ₃	H	H	CH ₃	H	H	C–Cl	78,0–82,0
238.	H	Cl	CF ₃	H	H	CH(Br) ₂	H	H	C–Cl	98,0–100,0
239.	H	H	CF ₃	CN	H	H	H	H	C–Cl	149,0–150,0

I. táblázat (folytatás)

Ve- gyü- let szá- ma	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	R ⁸	X	Fizikai állandó Olvasáspont (°C) vagy n _D ²⁰
240.	H	Cl	CF ₃	H	I	OCH ₃	H	H	C-Cl	162,0–164,0
241.	H	Cl	CF ₃	H	H	Cl	H	H	(N)	–
242.	H	Cl	CF ₃	H	NO ₂	CO ₂ CH ₃	H	H	C-Cl	–
243.	H	Cl	CF ₃	H	F	OCH ₃	H	H	C-Cl	128,0–130,0
244.	H	Cl	CF ₃	H	CHF ₂	H	H	H	C-Cl	92,0–95,0
245.	H	H	CF ₃	H	H		H	H	C-Cl	99,0–101,0
246.	H	Cl	CF ₃	H	H		H	H	(N)	–
247.	H	Cl	CF ₃	H	H		H	H	(N)	–
248.	H	Cl	CF ₃	H	H		H	H	(N)	161,0–167,0
249.	H	Cl	CF ₃	H	NO ₂		H	H	(N)	138,0–139,0
250.	H	H	CF ₃	H	NO ₂		H	H	C-Cl	164,0–165,0
251.	H	H	CF ₃	H	Cl	H	H	H	C-Cl	–
252.	H	H	CF ₃	H	H	Cl	H	H	C-Cl	–
253.	H	Cl	CF ₃	H	Cl	OH	H	H	C-Cl	–
254.	H	Cl	CF ₃	H	H		H	H	(N)	132,0–135,0
255.	H	Cl	CF ₃	H	H		H	H	(N)	80,0–82,0

Herbicid hatás vizsgálata

Az alábbi módon megvizsgáltuk az előző táblázatban felsorolt vegyületek herbicid hatását. Amint az a szakemberek előtt ismeretes, a herbicid hatás vizsgálata során kapott eredményeket számos, nem könnyen ellenőrizhető tényező befolyásolja. Az ilyen tényezők példái a környezeti feltételek, így a napfény és víz mennyisége, a talaj típusa, a talaj pH-ja, a hőmérséklet és a páratartalom. Egyéb, a vizsgálati eredményeket befolyásoló tényezők a beültetés mélysége és a herbicid felvitt mennyisége, valamint a vizsgálandó haszonnövény jellege. Az eredmények haszonnövényről haszonnövényre és a növényfajtán belül is változnak.

Kikelés előtti herbicid hatás vizsgálata

A kezelés előtti napon számos különböző gyomnövény magját homokos vályogtalajba vetettük, egy sorba azonos fajta magját vetve, és a sorokat a tepsikben keresztirányban alakítottuk ki. Az elvetett gyomok az alábbiak: zöld muhar (SETVI) (*Setaria viridis*), vadzab

(AVEFA) (*Avea fatua*), kakaslábfű (ECHCG) (*Echinochloa crus-galli*), vad mustár (SINAR) (*Brassica kaber*), szépasszonytenyere (ABUTH) (*Abutilon theophrasti*), bíbor hajnalka (PHBU) (*Ipomoea purpurea*) [vagy hajnalka (IPOSS) (*Ipomoea sp.*)] és mandulafű (CYPES) (*Cyperus esculentus*). Megfelelő számú magot vetettünk, hogy kikelés után soronként a növények méretétől függően körülbelül 20–40 magonc legyen.

A vizsgálandó vegyületekből oldatokat készítettünk oly módon, hogy a vegyületek 400 vagy 100 milligrammját (mg) 60 ml-es széles szájú üvegekbe mértük, majd a vegyületet 25 ml, 1 tömeg% Tween 20-at (polietilén-szorbitán-monolaurát emulgeátor) tartalmazó acetonban feloldottuk. Ha a vegyület feloldásához szükséges volt, további oldószereket is használtunk, legfeljebb 5 ml mennyiségben. Az oldatból 20,5 ml-es aliquot részt kivettünk, és 25 ml, 19:1 térfogatarányú aceton-víz eleggyel felhígítottuk, amely 1 tömeg% Tween 20-at tartalmazott, hogy permetezhető oldatot kapjunk.

A tepsiket 21–29,5 °C hőmérsékletű melegházba helyeztük és vízzel bepermeteztük. Az elvetés utáni napon a tepsiket bepermeteztük a permetezőoldat olyan mennyiségével, hogy 1 hektárra számítva 400 liter oldatot vigyünk fel. A felvitt hatóanyag-mennyiség 4,0 vagy 1,0 kg/ha volt.

A tepsiket visszahelyeztük melegházba és naponta vízzel megöntöztük. A gyomirtási fokot a kezelés után 3 héttel értékeltük ki és jegyeztük fel, és ugyanazon fajtájú, azonos korú, kezeletlen növény növekedésének a

5

10

A százalékban kifejezett hatás a növényen tapasztalható összes károsodás, beleértve a gátolt kicsírázást, a növényi szövetek kikelés utáni elpusztulását, az elsatnyulást, a deformálódást, a klorózist és az egyéb károsodástípusokat. A károsodási fok 0–100%-ig változik, ahol 0 azt jelenti, hogy nincs hatás, a növekedés azonos a kezeletlen kontrolléval, és 100 teljes pusztulást jelent, a kötőjel pedig azt jelenti, hogy nem végeztünk vizsgálatot.

A kikelés előtti vizsgálat eredményeit a II. és III. táblázatban foglaljuk össze.

II. táblázat
Kikelés előtti herbicid hatás
Alkalmazott hatóanyag-mennyiség 4,0 kg/ha

Vegyület száma	SETVI	AVEFA	ECHCG	SINAR	ABUTH	PHBPU	IPOSS	CYPES
1.	100	0	0	80	50	100	–	0
2.	100	90	100	100	100	100	–	0
3.	100	0	50	0	0	0	–	0
4.	0	0	0	0	0	0	–	0
5.	0	0	0	0	0	0	–	0
6.	100	100	100	100	100	100	–	5
7.	100	100	100	100	100	100	–	40
8.	100	30	60	100	100	98	–	0
9.	100	75	100	100	100	100	–	5
10.	0	0	0	0	0	0	–	0
11.	100	10	0	0	30	0	–	0
12.	100	10	25	90	85	80	–	0
13.	0	0	0	0	0	0	–	0
14.	100	0	0	0	0	0	–	0
15.	60	50	50	100	100	100	–	0
16.	60	0	0	60	30	10	–	0
17.	90	0	10	100	30	30	–	0
18.	100	95	100	100	100	100	–	0
19.	100	10	50	60	75	75	–	0
20.	100	10	100	100	100	20	–	0
21.	0	0	0	10	50	10	–	0
22.	10	0	0	30	100	70	–	0
23.	50	0	0	0	0	0	–	0
24.	–	0	0	0	0	0	–	0
25.	0	0	0	0	0	0	–	0
26.	10	0	0	0	5	0	–	0
27.	0	0	0	0	0	0	–	0
28.	100	10	25	95	100	60	–	5
29.	100	10	30	100	95	65	–	0
30.	50	0	0	100	20	30	–	0
31.	10	0	0	0	0	0	–	0
32.	10	5	0	10	0	0	–	0

II. táblázat (folytatás)

Vegyület száma	SETVI	AVEFA	ECHCG	SINAR	ABUTH	PHBPU	IPOSS	CYPES
33.	100	85	100	100	100	95	–	0
34.	100	80	100	100	100	70	–	5
35.	15	10	100	80	90	15	–	0
36.	100	10	100	100	100	95	–	5
37.	100	15	100	100	100	100	–	5
38.	10	0	0	20	60	0	–	0
40.	100	80	85	100	100	100	–	5
41.	100	100	100	100	100	100	–	95
42.	100	90	100	100	100	100	–	20
43.	100	100	100	100	100	–	100	100
44.	100	70	100	100	100	–	90	20
45.	100	100	100	100	100	–	100	100
46.	100	80	100	100	100	–	100	25
47.	100	80	100	100	100	–	100	5
48.	100	100	100	100	100	–	100	30
49.	75	5	10	90	40	–	25	0
50.	100	5	80	0	0	–	5	0
51.	100	25	85	0	100	–	30	10
52.	100	75	100	100	100	–	100	65
55.	100	100	100	100	100	–	100	100
59.	100	100	100	100	100	–	100	100
60.	50	5	25	10	80	–	0	0
61.	30	0	0	30	40	–	5	0
62.	100	60	85	90	95	–	75	5
63.	100	70	20	100	100	–	100	0
64.	100	90	100	100	100	–	100	60
65.	100	90	100	100	100	–	100	50
66.	100	85	100	100	100	–	98	0
67.	100	50	100	100	95	–	90	20
73.	100	40	100	100	100	–	100	10
74.	100	40	100	100	100	–	50	0
75.	100	50	100	0	100	–	50	0
76.	100	50	100	100	100	–	60	0
78.	100	0	30	75	100	–	40	0
80.	100	0	50	100	100	–	85	0
81.	100	85	100	100	100	–	100	15
82.	0	0	0	0	0	–	0	0
83.	0	0	0	0	0	–	0	0
85.	100	10	5	100	100	–	80	0
87.	100	15	15	100	100	–	60	0
92.	100	60	100	100	100	–	95	0
93.	100	65	100	0	50	–	10	5
94.	100	90	100	100	100	–	100	5

II. táblázat (folytatás)

Vegyület száma	SETVI	AVEFA	ECHCG	SINAR	ABUTH	PHBPU	IPOSS	CYPES
101.	100	5	15	100	100	–	30	5
102.	50	40	15	10	100	–	100	0
110.	100	5	10	75	100	–	75	5
114.	0	0	0	60	20	–	5	5
115.	100	50	98	100	100	–	75	30
116.	0	0	0	0	0	–	0	0
117.	100	5	85	50	100	–	90	5
118.	0	0	0	25	10	–	5	0
122.	100	5	95	100	100	–	100	10
123.	100	5	60	0	80	–	40	0
125.	100	10	20	100	100	–	85	0
126.	100	10	5	100	100	–	85	0
127.	70	0	5	100	100	–	60	0
143.	100	20	100	100	100	–	70	0
144.	60	5	30	100	95	–	30	0
145.	30	5	5	60	50	–	25	0
146.	100	0	0	0	20	–	60	0
147.	60	0	15	60	95	–	60	0
148.	5	0	0	0	0	–	5	0
158.	0	0	0	100	30	–	30	0
159.	75	15	0	100	100	–	30	0
161.	10	0	5	85	40	–	0	0
162.	100	98	100	100	100	–	100	40
163.	0	0	0	0	0	–	0	0
168.	100	0	10	15	30	–	0	0
169.	5	0	0	5	70	–	0	0
170.	0	0	0	15	80	–	5	0
181.	100	20	60	100	100	–	100	0
184.	10	0	0	60	10	–	0	0
204.	100	10	60	100	100	–	60	0
205.	100	80	100	100	100	–	100	5
211.	100	90	100	100	100	–	100	5
212.	100	90	100	100	100	–	100	10
213.	100	95	100	10	98	–	20	5
215.	100	85	100	100	60	–	25	0
216.	100	10	15	10	5	–	10	0
217.	100	50	100	100	100	–	100	75
218.	100	90	100	100	100	–	100	85
223.	100	0	0	30	60	–	5	0
224.	100	100	100	100	100	–	100	85
225.	0	0	0	0	0	–	0	0
228.	100	50	100	100	100	–	100	5
229.	100	10	100	100	100	–	100	15

II. táblázat (folytatás)

Vegyület száma	SETVI	AVEFA	ECHCG	SINAR	ABUTH	PHBPU	IPOSS	CYPES
230.	100	0	5	10	0	–	0	0
231.	10	0	0	0	0	–	100	0
232.	0	0	0	0	0	–	0	0
233.	100	100	100	100	100	–	100	90
234.	30	0	5	100	100	–	85	0
238.	100	40	100	100	100	–	100	0
239.	100	30	85	100	100	–	90	0
240.	100	20	60	100	100	–	100	0
241.	100	60	100	15	30	–	20	0
244.	100	60	100	100	100	–	95	5
251.	100	50	100	95	100	–	60	5
252.	100	5	15	10	100	–	0	0

III. táblázat

Kikelés előtti herbicid hatás
Alkalmazott hatóanyag-mennyiség 1,0 kg/ha

Vegyület száma	SETVI	AVEFA	ECHCG	SINAR	ABUTH	PHBPU	IPOSS	CYPES
1.	100	0	0	0	0	0	–	0
2.	100	80	100	100	100	100	–	0
3.	100	0	30	0	0	0	–	0
4.	0	0	0	0	0	0	–	0
5.	0	0	0	0	0	0	–	0
59.	100	100	100	100	100	–	100	25
68.	100	50	100	100	85	–	70	15
69.	95	10	5	100	100	–	95	10
70.	95	75	70	100	100	–	100	25
71.	20	0	0	100	75	–	80	0
72.	100	80	70	100	100	–	100	5
77.	100	40	20	100	100	–	70	0
79.	100	40	100	100	100	–	100	60
84.	80	30	10	100	100	–	75	5
86.	100	90	15	100	100	–	90	5
88.	85	40	20	100	100	–	60	5
89.	30	0	0	30	30	–	0	0
90.	90	0	0	60	20	–	5	0
91.	100	75	100	100	100	–	100	5
95.	100	25	100	70	100	–	20	0
96.	100	15	70	100	100	–	10	0
97.	100	60	100	100	100	–	100	10
98.	100	5	20	100	100	–	100	5
99.	100	10	40	100	100	–	100	5
100.	70	5	30	5	40	–	15	0

III. táblázat (folytatás)

Vegyület száma	SETVI	AVEFA	ECHCG	SINAR	ABUTH	PHBPU	IPOSS	CYPES
103.	20	5	0	100	100	–	65	0
104.	100	30	100	0	10	–	10	0
105.	70	25	10	100	100	–	100	0
106.	100	20	5	100	100	–	65	0
111.	100	60	100	100	100	–	98	5
119.	100	95	100	100	100	–	100	5
120.	100	40	100	100	100	–	100	0
121.	30	0	0	70	60	–	15	0
124.	100	5	20	100	100	–	100	0
128.	100	85	100	100	100	–	100	15
129.	100	15	85	100	100	–	100	0
130.	10	0	0	15	50	–	50	0
131.	100	10	95	15	100	–	80	0
132.	90	95	80	100	100	–	70	20
133.	100	95	80	100	100	–	100	25
134.	100	5	10	100	100	–	100	0
135.	100	100	90	100	100	–	100	60
136.	100	25	100	100	100	–	100	0
137.	100	95	100	100	100	–	100	15
138.	100	5	100	100	100	–	100	0
139.	100	100	100	100	100	–	100	30
140.	100	95	100	100	100	–	100	25
141.	100	100	100	100	100	–	100	20
142.	100	75	100	100	100	–	100	5
150.	10	0	0	20	40	–	5	0
151.	85	5	5	100	100	–	40	0
152.	100	10	5	100	100	–	30	0
153.	100	100	100	100	100	–	100	60
154.	100	100	100	100	100	–	100	90
155.	100	25	50	100	100	–	40	0
156.	60	0	5	98	100	–	40	0
157.	100	100	100	100	100	–	100	70
160.	100	85	100	20	85	–	40	10
164.	100	100	100	100	100	–	100	90
165.	100	100	100	100	100	–	100	75
166.	100	100	100	100	100	–	100	80
167.	100	100	100	100	100	–	85	15
171.	100	100	100	100	100	–	100	95
172.	10	0	0	5	10	–	5	0
173.	5	0	0	10	50	–	10	0
174.	100	98	100	100	100	–	100	80
175.	95	20	5	100	100	–	100	0
176.	100	100	100	100	100	–	100	60

III. táblázat (folytatás)

Vegyület száma	SETVI	AVEFA	ECHCG	SINAR	ABUTH	PHBPU	IPOSS	CYPES
177.	100	100	100	100	100	–	60	30
178.	100	100	100	100	100	–	100	80
179.	100	100	100	100	100	–	100	60
180.	100	100	100	100	100	–	100	80
182.	100	80	100	100	100	–	60	0
183.	100	75	100	98	100	–	40	40
185.	100	100	100	100	100	–	100	95
186.	100	50	100	100	100	–	70	10
187.	100	60	60	100	100	–	40	15
188.	100	100	100	100	100	–	100	95
189.	100	100	100	100	100	–	100	98
190.	100	100	100	100	100	–	100	85
191.	100	100	100	100	100	–	90	75
192.	100	100	100	100	100	–	100	75
193.	100	100	100	100	100	–	100	98
194.	100	80	98	100	100	–	100	50
195.	100	85	100	100	100	–	100	40
196.	100	15	10	100	98	–	10	5
197.	100	100	25	90	100	–	60	5
198.	10	0	0	5	30	–	10	0
199.	100	50	15	100	100	–	5	5
200.	100	15	5	5	100	–	15	0
201.	100	80	100	100	100	–	70	50
202.	100	90	100	100	100	–	80	40
203.	100	70	95	20	100	–	60	25
206.	100	100	100	100	100	–	100	75
207.	100	95	100	100	90	–	100	70
208.	100	100	100	100	100	–	100	80
209.	100	90	100	100	100	–	95	70
210.	100	100	100	100	100	–	100	90
214.	100	15	60	90	100	–	60	15
219.	100	5	80	0	60	–	0	0
220.	0	0	0	0	0	–	0	0
221.	100	90	100	100	100	–	65	50
222.	100	20	100	100	100	–	30	0
226.	100	10	90	100	100	–	50	0
227.	100	85	100	98	100	–	100	0
235.	100	95	100	100	100	–	100	15
236.	100	10	100	100	100	–	100	5
237.	100	25	100	85	100	–	60	0
242.	100	70	100	100	100	–	85	5
243.	100	100	100	100	100	–	100	40
245.	100	95	100	100	100	–	70	60

III. táblázat (folytatás)

Vegyület száma	SETVI	AVEFA	ECHCG	SINAR	ABUTH	PHBPU	IPOSS	CYPES
246.	100	100	100	100	100	–	100	95
247.	100	100	100	100	100	–	100	90
248.	10	0	5	15	20	–	0	0
249.	100	70	100	100	100	–	95	10
250.	100	0	5	70	40	–	10	5
255.	100	100	100	100	100	–	100	98

Kikelés utáni herbicid hatás vizsgálata

A talajt ugyanúgy készítettük elő és vetettük be ugyanazokkal a növénymagokkal, mint a kikelés előtti vizsgálat esetében. A tepsiket 21–29 °C hőmérsékletű melegházba helyeztük és megöntöztük. A mago-

kat 10–12 nappal a kezelés előtt vetettük el. Az öntözővizet a talaj felületére öntöttük, nem a kicsírázó növények leveleire.

A kikelés utáni vizsgálatok eredményeit az alábbi IV. és V. táblázatban foglaljuk össze.

IV. táblázat

Kikelés utáni herbicid hatás
Alkalmazott hatóanyag-mennyiség 4,0 kg/ha

Vegyület száma	ETVI	AVEFA	ECHCG	SINAR	ABUTH	PHBPU	IPOSS	CYPES
1.	100	0	0	90	100	100	–	0
2.	100	80	100	100	100	100	–	5
3.	100	0	50	50	100	100	–	0
4.	100	0	0	20	0	0	–	0
5.	10	0	10	10	0	0	–	0
6.	100	60	30	100	100	100	–	5
7.	95	60	100	100	100	100	–	25
8.	30	0	0	70	100	100	–	0
9.	100	30	60	40	100	100	–	0
10.	0	0	0	50	25	0	–	0
11.	70	10	10	50	80	90	–	0
12.	80	10	10	100	100	100	–	0
13.	0	0	0	10	20	10	–	0
14.	0	0	0	30	40	60	–	0
15.	10	10	10	20	100	90	–	0
16.	10	10	0	40	100	80	–	0
17.	40	10	10	60	100	100	–	0
18.	100	98	100	100	100	100	–	5
19.	30	20	20	10	80	60	–	0
20.	100	20	30	100	100	90	–	0
21.	10	0	0	100	60	100	–	0
22.	40	0	0	90	90	100	–	0
23.	10	0	10	10	20	40	–	0
24.	30	10	10	10	40	60	–	0
25.	0	0	0	0	0	10	–	0
26.	10	5	0	10	10	20	–	0

IV. táblázat (folytatás)

Vegyület száma	ETVI	AVEFA	ECHCG	SINAR	ABUTH	PHBPU	IPOSS	CYPES
27.	0	0	0	0	0	10	–	0
28.	50	30	5	100	100	100	–	5
29.	30	10	10	75	90	60	–	0
30.	10	5	10	20	40	100	–	0
31.	5	5	0	0	0	0	–	0
32.	0	0	0	10	0	5	–	0
33.	85	25	85	80	100	100	–	5
34.	100	20	95	85	100	100	–	5
35.	15	0	0	5	95	80	–	0
36.	100	20	60	100	100	100	–	5
37.	90	15	85	100	100	100	–	5
38.	15	10	5	20	70	50	–	0
40.	80	60	40	100	100	100	–	15
41.	100	100	100	100	100	100	–	100
42.	100	25	100	100	100	100	–	20
43.	100	100	100	100	100	–	100	100
44.	100	25	100	100	100	–	100	15
45.	100	100	100	100	100	–	100	100
46.	100	60	100	100	100	–	100	20
47.	100	60	100	100	100	–	100	10
48.	100	100	100	100	100	–	100	40
49.	20	0	10	80	98	–	95	0
50.	85	5	70	0	90	–	100	0
51.	85	10	85	0	100	–	100	5
52.	100	80	100	100	100	–	100	85
55.	100	100	100	100	100	–	100	100
59.	100	100	100	100	100	–	100	100
60.	10	5	5	20	10	–	100	0
61.	15	10	0	10	20	–	70	0
62.	85	40	80	80	90	–	100	5
63.	100	50	40	100	100	–	100	40
64.	100	80	100	100	100	–	100	65
65.	100	80	100	100	100	–	100	50
66.	85	60	85	100	100	–	100	15
67.	100	5	100	40	100	–	100	5
73.	100	25	100	100	100	–	100	5
74.	100	15	100	100	100	–	100	5
75.	100	5	100	0	100	–	100	0
76.	100	5	70	60	100	–	100	5
78.	100	10	25	100	100	–	100	5
80.	40	15	5	100	100	–	100	5
81.	80	75	90	100	100	–	100	10
82.	0	0	0	10	0	–	0	0

IV. táblázat (folytatás)

Vegyület száma	ETVI	AVEFA	ECHCG	SINAR	ABUTH	PHBPU	IPOSS	CYPES
83.	0	0	0	0	0	–	0	0
85.	20	10	15	100	100	–	100	5
87.	60	5	10	100	100	–	100	10
92.	100	50	100	100	100	–	100	5
93.	100	5	98	0	98	–	100	0
94.	100	60	100	100	100	–	100	10
101.	60	5	5	60	100	–	100	0
102.	85	10	10	100	100	–	100	0
110.	10	5	5	40	80	–	100	0
114.	10	0	0	15	10	–	5	0
115.	50	20	30	100	90	–	30	20
116.	0	0	0	0	5	–	5	0
117.	50	5	10	25	100	–	90	5
118.	10	0	5	30	15	–	15	0
122.	75	10	85	15	100	–	20	10
123.	85	5	10	0	100	–	100	5
125.	95	5	20	90	100	–	100	5
126.	75	5	10	25	85	–	75	0
127.	30	5	10	100	100	–	100	0
143.	60	5	15	85	100	–	100	5
144.	10	5	5	60	5	–	60	0
145.	15	0	0	80	10	–	50	0
146.	50	10	5	5	95	–	100	0
147.	70	20	25	98	95	–	100	5
148.	10	0	0	60	15	–	5	0
158.	10	0	0	70	100	–	70	0
159.	40	5	5	100	100	–	100	5
161.	10	5	5	90	75	–	60	5
162.	90	100	100	98	100	–	100	40
163.	0	0	0	10	0	–	5	0
168.	5	5	0	40	60	–	40	0
169.	10	0	0	5	30	–	25	0
170.	0	0	0	10	5	–	5	0
181.	95	10	25	100	100	–	100	5
184.	25	5	10	25	5	–	10	0
204.	60	0	0	50	100	–	100	5
205.	98	5	60	60	100	–	100	5
211.		30	80	100	100	–	100	5
212.		98	100	100	100	–	100	50
213.		70	70	5	100	–	100	5
215.	80	80	50	100	100	–	100	5
216.	50	15	20	5	100	–	100	5
217.	100	60	100	100	100	–	100	75

IV. táblázat (folytatás)

Vegyület száma	ETVI	AVEFA	ECHCG	SINAR	ABUTH	PHBPU	IPOSS	CYPES
218.	100	75	100	100	100	–	100	80
223.	15	0	0	40	100	–	100	0
224.	100	90	100	100	100	–	100	100
225.	20	0	5	0	30	–	10	0
228.	100	15	100	100	100	–	100	15
229.	100	10	100	100	100	–	100	5
230.	50	5	5	50	100	–	100	5
231.	5	0	0	5	50	–	50	0
232.	10	0	0	25	25	–	15	0
233.	100	95	60	100	100	–	100	100
234.	10	5	5	100	100	–	100	0
238.	100	10	90	100	100	–	100	5
239.	90	10	30	70	100	–	100	0
240.	80	10	30	30	100	–	100	10
241.	80	10	25	10	100	–	100	10
244.	100	25	98	95	100	–	100	20
251.	100	10	100	25	100	–	100	5
252.	50	5	5	25	100	–	100	0

V. táblázat

Kikelés utáni herbicid hatás
Alkalmazott hatóanyag-mennyiség 1,0 kg/ha

Vegyület száma	ETVI	AVEFA	ECHCG	SINAR	ABUTH	PHBPU	IPOSS	CYPES
1.	100	0	0	80	100	100	–	0
2.	100	60	100	100	100	100	–	0
3.	100	0	0	0	0	0	–	0
4.	100	0	0	0	0	0	–	0
5.	0	0	0	0	0	0	–	0
59.	100	100	100	100	100	–	100	95
68.	100	5	100	100	100	–	100	30
69.	80	10	20	100	100	–	100	5
70.	70	15	40	100	100	–	100	15
71.	60	10	10	100	100	–	100	10
72.	40	10	20	100	100	–	100	20
77.	95	60	95	100	100	–	100	15
79.	100	20	75	100	100	–	100	40
84.	10	5	5	100	100	–	100	15
86.	90	60	90	100	100	–	100	30
88.	60	60	20	100	100	–	100	20
89.	25	10	20	100	100	–	100	10
90.	15	10	5	100	100	–	100	5
91.	100	70	95	100	100	–	100	30

V. táblázat (folytatás)

Vegyület száma	ETVI	AVEFA	ECHCG	SINAR	ABUTH	PHBPU	IPOSS	CYPES
95.	85	5	75	15	100	–	100	0
96.	85	10	30	100	100	–	100	5
97.	100	0	95	30	100	–	100	15
98.	100	0	30	100	100	–	100	15
99.	80	10	10	100	90	–	100	10
100.	75	5	15	0	70	–	100	5
103.	80	5	10	85	100	–	100	10
104.	90	5	20	5	100	–	100	10
105.	40	5	5	15	100	–	100	5
106.	60	5	5	90	100	–	85	5
111.	60	10	30	100	100	–	100	5
119.	100	50	100	100	100	–	100	5
120.	100	10	85	100	100	–	100	5
121.	10	5	5	60	100	–	100	0
124.	85	10	15	100	100	–	100	5
128.	100	25	100	100	100	–	100	5
129.	75	15	75	100	100	–	100	5
130.	10	0	5	60	50	–	60	0
131.	90	20	25	30	75	–	100	5
132.	100	98	100	100	100	–	100	25
133.	60	80	60	100	100	–	100	65
134.	50	15	40	100	100	–	100	25
135.	100	100	100	100	100	–	100	80
136.	95	50	75	100	100	–	100	10
137.	30	85	20	100	100	–	100	20
138.	85	80	30	100	100	–	100	25
139.	95	50	100	100	100	–	100	35
140.	60	75	95	100	100	–	100	25
141.	100	100	100	100	100	–	100	75
142.	100	10	90	100	100	–	100	5
150.	10	0	5	60	100	–	85	5
151.	70	5	5	100	100	–	100	20
152.	100	10	5	100	100	–	100	15
153.	100	100	100	100	100	–	100	85
154.	100	100	100	100	100	–	100	98
155.	100	50	30	100	100	–	100	5
156.	60	10	10	100	100	–	100	10
157.	100	100	100	100	100	–	100	70
160.	100	15	95	5	100	–	100	10
164.	100	100	100	100	100	–	100	98
165.	85	100	30	100	100	–	100	60
166.	100	100	100	100	100	–	100	80
167.	98	30	90	80	100	–	100	5

V. táblázat (folytatás)

Vegyület száma	ETVI	AVEFA	ECHCG	SINAR	ABUTH	PHBPU	IPOSS	CYPES
171.	100	100	100	100	100	–	100	60
172.	30	10	10	100	100	–	100	5
173.	10	5	5	90	95	–	100	5
174.	100	100	100	100	100	–	100	60
175.	90	25	60	100	100	–	100	10
176.	95	100	100	100	100	–	100	40
177.	100	70	50	100	100	–	95	25
178.	100	100	100	100	100	–	100	30
179.	100	100	100	100	100	–	100	60
180.	100	100	100	100	100	–	100	70
182.	70	10	30	15	100	–	90	0
183.	95	5	20	70	100	–	98	5
185.	100	100	100	100	100	–	100	95
186.	75	20	20	100	100	–	100	20
187.	85	20	15	70	90	–	100	5
188.	100	100	100	100	100	–	100	70
189.	100	100	100	100	100	–	100	75
190.	100	75	100	90	100	–	100	30
191.	100	100	100	100	100	–	100	40
192.	100	100	100	100	100	–	100	40
193.	100	80	100	100	100	–	100	60
194.	70	30	70	100	100	–	100	20
195.	90	30	60	50	100	–	100	15
196.	60	10	15	90	100	–	100	10
197.	100	60	60	100	100	–	100	5
198.	30	5	15	100	100	–	100	5
199.	30	10	15	85	100	–	100	5
200.	30	5	5	80	100	–	100	5
201.	100	80	75	100	100	–	100	50
202.	100	75	100	95	100	–	100	15
203.	70	60	70	100	100	–	100	5
206.	98	100	100	100	100	–	100	30
207.	100	95	100	100	100	–	100	25
208.	100	98	85	50	40	–	100	50
209.	100	85	75	75	100	–	100	85
210.	100	75	100	100	100	–	100	85
214.		85	85	100	100	–	100	20
219.	95	10	40	0	100	–	100	10
220.	10	0	0	10	30	–	15	0
221.	100	100	100	100	100	–	100	40
222.	100	15	100	100	100	–	100	5
226.	100	15	80	100	100	–	100	0
227.	100	10	100	5	100	–	100	10

V. táblázat (folytatás)

Vegyület száma	ETVI	AVEFA	ECHCG	SINAR	ABUTH	PHBPU	IPOSS	CYPES
235.	100	90	100	100	100	–	100	30
236.	100	15	15	100	100	–	100	10
237.	90	5	5	5	100	–	100	10
242.	100	20	70	100	100	–	100	30
243.	100	100	100	100	100	–	100	60
245.	100	95	100	100	100	–	100	60
246.	100	100	100	100	100	–	100	70
247.	100	98	100	100	100	–	100	75
248.	10	5	5	20	50	–	50	5
249.	100	75	100	100	100	–	100	40
250.	75	5	10	100	100	–	100	10
255.	100	100	100	100	100	–	100	100

A találmány szerinti vegyületek gyomirtó szerként alkalmazhatók, és számos, a szakirodalomból jól ismert módon különböző koncentrációban vihetjük fel őket. A gyakorlatban a vegyületeket készítmények alakjában alkalmazzuk, amelyek különböző ismert vagy az iparban alkalmazott adjuvánsokat vagy hordozóanyagokat tartalmaznak a diszpergálódás megkönnyítésére. Egy adott vegyület esetében a készítmény és az alkalmazás módjának a kiválasztása befolyásolhatja a vegyület hatékonyságát, ennek megfelelően szelektálunk. Így a találmány szerinti vegyületeket granulátum, nedvesíthető por, emulgeálható koncentrátum, por vagy porszerű készítmény, így szabadon folyó ilyen készítmény, oldat, szuszpenzió vagy emulzió vagy pedig szabályozottan felszabaduló készítmény, így mikrokapszula alakjában készíthetjük el. Ezek a készítmények egészen csekély mennyiségű, így körülbelül 0,5 tömeg% hatóanyagot vagy akár körülbelül 95 tömeg% vagy ennél nagyobb mennyiségű hatóanyagot tartalmazhatnak. Az adott vegyület optimális mennyisége a kiirtandó mag vagy növény természetétől függ. A felhasznált mennyiség általában körülbelül 0,0112–1,12 kg/hektár között változik, előnyösen körülbelül 0,0224–4,48 kg/hektár.

A nedvesíthető porok olyan finoman eloszlatott részecskékből állnak, amelyek vízben vagy más folyékony vivőanyagban könnyen oldódnak. A részecskék a hatóanyagot szilárd mátrixban tartják. Tipikus szilárd mátrix a Fuller-föld, a kaolinagyag, a szilikátok és más, könnyen nedvesedő szerves vagy szervesetlen szilárd anyagok. A nedvesíthető porok általában körülbelül 5–körülbelül 95 tömeg% hatóanyagot és kis mennyiségű nedvesítő-, diszpergáló- vagy emulgeálószeret tartalmaznak.

Az emulgeálható koncentrátumok vízben vagy más folyadékban diszpergálható homogén folyékony készítmények, amelyek állhatnak kizárólag a hatóanyagból és egy folyékony vagy szilárd emulgeálószerből, azonban egy folyékony hordozót is tartalmazhatnak, így xilolt, nehéz aromás naftákat, izoforont vagy más, nem

illő szerves oldószert. A felhasználáskor ezeket a koncentrátumokat vízben vagy más folyadékban diszpergáljuk, és a kezelendő felületre általában permet formájában visszük fel. A hatóanyag mennyisége a koncentrátumnak körülbelül 0,5–körülbelül 95 tömeg%-át teszi ki.

A granulált készítmények mind extrudált, mind durva szemcsés részecskéket tartalmaznak, és rendszerint hígítás nélkül visszük fel ezeket az olyan területre, ahol a növényzet kiirtása a cél. A granulált készítmények tipikus hordozóanyagai a homok, Fuller-föld, attapulgitagyag, bentonitagyag, montmorillonitagyag, vermikulit, perlit és más olyan szerves vagy szervesetlen anyagok, amelyek abszorbeálják a hatóanyagot vagy amelyeket bevonhatunk a hatóanyaggal. A granulált készítmények általában körülbelül 5–körülbelül 25 tömeg% hatóanyagot tartalmaznak, és tartalmazhatnak felületaktív szereket is, így nehéz aromás naftákat, kerozint és más petróleumfrakciókat, vagy növényi olajokat és/vagy kötőanyagokat, így dextrinet, enyvet vagy szintetikus gyantákat.

A porok a hatóanyag és olyan, finoman eloszlatott szilárd anyagok, így talkum, agyagok, lisztek és más szerves vagy szervesetlen szilárd anyagok szabadon folyó keverékei, amelyek diszpergálószerként vagy hordozóanyagként szolgálnak.

A mikrokapszulák általában a hatóanyag olyan közbős porózus vázba bezárt cseppjei vagy granulátumai, amely hagyja, hogy a bezárt anyag szabályozott sebességgel a környezetbe távozzon. A kapszulázott cseppcsekék átmérője általában körülbelül $1-50 \cdot 10^{-6}$ m. A bezárt folyadék általában a kapszula tömegének a körülbelül 50–95 tömeg%-át teszi ki, és a hatóanyagot kívül oldószert is tartalmazhat. A kapszulázott granulátumok általában olyan pórusos membránnal rendelkező pórusos granulátumok, amelyek lezárják a granulátumok pórusnyílásait, folyékony állapotban tartják a hatóanyagot a granulátum pórusainak a belsejében. A granulátumok átmérője általában 1 mm és 1 cm között-

ti, előnyösen 1–2 mm. A granulumokat extrudálással, agglomerálással vagy prillingezéssel állítjuk elő, vagy előfordulnak a természetben. Az ilyen anyagok példái a vermikulit, szinterelt agyag, kaolin, attapulgitagyag, fűrészpórá és granulált szén. A váz- vagy membránanyagok közé tartoznak a természetes és szintetikus gumik, cellulózok, sztirol-butadién-kopolimerek, poliakrilnitrilek, poliakrilátok, poliészterek, poliamidok, polikarbamidok, poliuretánok és keményítőxantátok.

Más, herbicid alkalmazásra felhasználható készítmények a hatóanyag egyszerű oldatait, ahol az oldószer a hatóanyagot a kívánt koncentrációban teljesen feloldja, ilyen például az acetón, alkilezett naftalinok, xilol és más szerves oldószerek. Olyan nyomás alatti permeterizőket is alkalmazhatunk, amelyekben a hatóanyag finom eloszlású formában van diszpergálva egy alacsony forráspontú diszpergáló oldószer hordozóanyag, így freonok elpárolgásának eredményeként.

Az ilyen készítmények a hatóanyagon kívül különféle hordozóanyagokat vagy hígítószerkeket, nedvesítő-, diszpergáló- vagy emulgeálószerkeket, oldószereket (víz vagy szerves oldószerek, így aromás oldószerek vagy klórozott alifás oldószerek), kötőanyagokat, sűrítőanyagokat és más anyagokat is tartalmazhatnak. A felületaktív anyagok példái az alkil- és alkil-arilszulfonátok és -szulfátok, valamint sóik, a többértékű alkoholok, a polietoxilezett alkoholok, észterek és zsír-aminok. Ha ilyen anyagokat használunk, ezek a készítménynek rendszerint 0,1–15 tömeg%-át teszik ki.

A találmány szerinti vegyületeket más herbicidekkel és/vagy lombtalanítószerekkel, kiszáritószerekkel, növekedésgátlókkal, inszekticidekkel, fungicidekkel, nematocidokkal és hasonlókkal kombinálva is alkalmazhatjuk. Ezek az egyéb anyagok a hatóanyagnak körülbelül 5–körülbelül 95 tömeg%-át tehetik ki a készítményekben. Ezek a kombinációk gyakran növelik a gyomirtó szer hatásosságát, és gyakran olyan eredményeket mutatnak, amelyek az egyes herbicidek készítményeit külön-külön alkalmazva nem érhetők el. A készítmények más peszticideket, valamint műtrágyákat is tartalmazhatnak, amelyek mindegyikét ugyanolyan területen történő alkalmazásra szánjuk és készítjük el.

A találmány szerinti vegyületekkel kombinálva alkalmazható egyéb herbicidek, lombtalanító-, kiszáritó- és növény-növekedést gátló szerek példái az alábbiak.

A kiegészítő herbicidek példái:

A) benzo-[2,1,3]-tiadiazin-4-on-2,2-dioxidok, így a betanzon;

B) hormon herbicidek, különösen a fenoxi-alkán-savak, így az MCPA, MCPA-tioetil, diklór-prop, 2,4,5-T, MCPB, 2,4-D, 2,4-DB, mekoprop, triklopir, fluroxi-pir, klopíralid és ezek származékai (például sói, észterei és amidjai);

C) 1,3-dimetil-pirazol-származékok, így a pirazoxifen, pirazolat és benzofenap;

D) dinitro-fenolok és származékaik (például acetátok, így DNOC, dinoterb, dinozeb és észterei, dinozeb-acetát);

E) dinitro-anilin herbicidek, így a dinitramin, trifluralin, etalfluralin, pendimetalin és orizalin;

F) aril-karbamid herbicidek, így a diuron, flumeturon, metoxuron, neburon, izoproturon, klórtoluron, klóroxuron, linuron, monolinuron, klór-brómuron, daimuron és metabenzthiazuron;

G) fenil-karbamoil-oxi-fenil-karbamátok, így a fenmedifam és dezmedifam;

H) 2-fenil-piridazin-3-onok, így a kloridazon és norflurazon;

I) uracil herbicidek, így a lenacil, bromacil és terbacil;

J) triazin herbicidek, így az atrazin, szimazin, aziprotrin, cianazin, prometrin, dimetametrin, szimetrin és terbutrin;

K) foszforotioát herbicidek, így a piperofosz, benzulid és butamifosz;

L) tiolkarbamát herbicidek, így a cikloát, vernolát, molinát, tiobenkarb, butilát, EPTC, triallát, diallát, etileszprokarb, tiokarbazil, piridát és dimepiperát;

M) 1,2,4-triazin-5-on herbicidek, így a metamitron és metribuzin;

N) benzo-esav herbicidek, így a 2,3,6-TBA, dikamba és kloramben;

O) anilid herbicidek, így pretilaklór, butaklór, alaklór, propaklór, propanil, metazaklór, metolaklór, acetoklór és dimetaklór;

P) dihalo-benzonitril herbicidek, így diklobenil, bromoxinil és ioxinil;

Q) halo-alkán herbicidek, így dalapon, TCA és sói; R) difenil-éter herbicidek, így laktófen, fluorglikofen vagy azok észterek, illetve sói, nitrofen, bifenox, acifluorfen és sói vagy észterei, oxifluorfen és fomeszafen, klórnitrofen és kometoxifen;

S) fenoxi-fenoxi-propionát herbicidek, így diklofop és észterei, így metil-észtere, fluazifop és észterei, halo-xifop és észterei, kvizalofop és észterei és fenoxa-prop és észterei, így etil-észtere;

T) ciklohexán-dion herbicidek, így alloxidim és sói, szetoxidim, cikloxiidim, tralkoxidim és kletodim;

U) szulfonil-karbamid herbicidek, így klór-szulfuron, szulfometuron, metszulfuron és észterei, benz-szulfuron és észterei, így metil-észtere, DPX-M6313, klorimuron és észterei, így etil-észtere, pirimiszulfuron és észterei, így metil-észtere, DPX-LS300 és pirazo-szulfuron;

V) imidazolidinon herbicidek, így imazakvin, imazametabenz, imazapir és izopropil-ammóniumsói, imazetapir;

W) aril-anilid herbicidek, így flamprop és észterei, benzoilprop-etil, diflufenikan;

X) aminosav herbicidek, így glifozát és glifozinát és sóik, valamint észterei, szulfozát és bilanafosz;

Y) szerves arzéntartalmú herbicidek, így MSMA;

Z) herbicid hatású amidszármazékok, így napropamid, propizamid, karbetamid, tebutam, bromobutid, izoxaben, naproanilid, difenamid és nap-talam;

AA) egyéb herbicidek, ezek közé tartozik az etofumezát, cinmetilin, difenzokvat és sói, így metil-

szulfátsója, klorazon, oxadiazon, brómfenoxim, barban, tridifan, (3:1 arányú) fluorkloridon, kvinklorak és mefanacet;

BB. az alkalmazható kontakt herbicidek példái a bipiridilium herbicidek, így azok, amelyekben a hatóanyag parakvat, valamint azok, amelyekben a hatóanyag dikvat.

Ezeket a készítményeket olyan területeken alkalmazhatjuk, ahol az irtás kívánatos, az alkalmazást a szokásos módon végezhetjük. A por alakú és folyékony készítményeket például porszóró gépekkel, tartályos és kézi permetezővel vihetjük fel. A készítményeket azonban repülőgépről is felvihetjük por vagy permet alakjában. A kicsírázott magok vagy kikelt magoncok növekedésének a megváltoztatása vagy elfojtása céljából por vagy folyadék alakú készítményeket oszlatunk el a talajban a felszíntől számított legalább 1,27 cm mélységben, vagy felvihetjük ezeket csak a talaj felszínére is permetezéssel vagy öntözéssel. A készítményeket az öntözővízhez adagolva is alkalmazhatjuk. Ez lehetővé teszi azt, hogy a készítmények az öntözővízzel együtt hatoljanak be a talajba. A talajfelületre felvitt por-, granulált vagy folyékony készítményeket a szokásos módokon oszlatunk el a talaj felszíne alatt, így például tárcsázással, boronálással vagy összekeveréssel.

Az alábbiakban néhány jellegzetes készítményt mutatunk be. (A % mindig tömeg%-ot, a rész tömegrészt jelent.)

5%-os por: 5 rész hatóanyag,
95 rész talkum.
2%-os por: 2 rész hatóanyag,
1 rész nagy diszperzitású kovásv,
97 rész talkum.

Ezeket a porkészítményeket a komponensek összekeverésével és a keverék kívánt szemcsenagyságúra történő őrlésével állítjuk elő.

5%-os granulátum: 5 rész hatóanyag,
0,25 rész epiklórhidrin,
0,25 rész cetil-poliglikol-éter,
3,5 rész polietilén-glikol,
91 rész kaolin (részecskeméret:
0,3–0,8 mm).

A granulátum előállításához a hatóanyagot epiklórhidrinrel keverjük össze, és a keveréket 6 rész acetonban feloldjuk. Ezután polietilén-glikolt és cetil-poliglikol-étert adunk hozzá. A keletkező oldatot kaolinra permetezzük, és az acetont vákuumban elpárologtatjuk.

Nedvesíthető porok:

70%-os: 70 rész hatóanyag,
5 rész nátrium-dibutil-naftalin-szulfonát,
3 rész naftalinszulfonsav/fenol-szulfonsav/formaldehid kondenzátum (3:2:1),
10 rész kaolin,
12 rész Champagne-kréta.
40%-os: 40 rész hatóanyag,
5 rész nátrium-ligninszulfonát,

1 rész nátrium-dibutil-naftalinszulfonát,

54 rész kovásv,
25 rész hatóanyag,
4,5 rész kalcium-lignin-szulfát,
1,9 rész Champagne-kréta/hidroxi-etil-cellulóz (1:1),
1,5 rész nátrium-dibutil-naftalin-szulfonát,
19,5 rész kovásv,
19,5 rész Champagne-kréta,
28,1 rész kaolin.
25%-os: 25 rész hatóanyag,
2,5 rész izooktil-fenoxi-polietilén-etanol,
1,7 rész Champagne-kréta/hidroxi-etil-cellulóz (1:1),
8,3 rész nátrium-alumínium-szilikát,
16,5 rész kovaföld,
46 rész kaolin.
10%-os: 10 rész hatóanyag,
3 rész telített zsíralkohol-szulfátok nátriumsóinak keveréke,
5 rész naftalinszulfonsav/formaldehid kondenzátum,
82 rész kaolin.

Ezeket a nedvesíthető porokat úgy állítjuk elő, hogy a hatóanyagokat alkalmas keverőben alaposan összekeverjük az adalékanyagokkal, és a keletkező keveréket malomban vagy hengerek között megőröljük.

Emulgeálható koncentrátumok:

25%-os: 25 rész hatóanyag,
2,5 rész epoxilált növényi olaj,
10 rész alkil-arilszulfonát/zsíralkohol-poliglikol-éter keverék,
5 rész dimetil-formamid,
57,5 rész xilol.
50%-os: 50 rész hatóanyag,
45 rész kerozin,
5 rész emulgeálószer (hosszú szénláncú, etoxilezett poliéterek és hosszú szénláncú szulfonát elegye).

SZABADALMI IGÉNYPONTOK

1. (I) általános képletű vegyületek és azok mezőgazdaságilag elfogadható sói, ahol a képletben R¹ hidrogén- vagy halogénatomot jelent; R² hidrogénatomot, nitrocsoportot, halogénatomot, 1–4 szénatomos alkil-tio-csoportot vagy aminosoportot képvisel; R³ halogénatomot, nitrocsoportot vagy halogén-(1–4 szénatomos alkil)-csoportot jelent; R⁴, R⁵ és R⁶ egymástól függetlenül hidrogénatomot, halogénatomot, nitrocsoportot, aminocsoportot, hidroxilcsoportot, cianocsoportot, 1–4 szénatomos alkil-csoportot, (1–4 szénatomos alkoxi)-imino-(1–4 szénatomos alkil)-csoportot, hidroxi-(1–4 szénatomos

alkil)-csoportot, (1–4 szénatomos alkoxi)-(1–4 szénatomos alkil)-csoportot, halogén-(1–4 szénatomos alkil)-szulfonil-amino-(1–4 szénatomos alkil)-csoportot, halogén-(1–4 szénatomos alkil)-csoportot, di(1–4 szénatomos alkoxi)-foszforil-csoportot, 1–4 szénatomos alkil-tio-csoportot, formilcsoportot, karboxilcsoportot, (1–4 szénatomos alkoxi)-karbonil-csoportot, [(1–4 szénatomos alkil)-karbonil-oxi]_z-(1–4 szénatomos alkil)-csoportot, ahol z értéke 1 vagy 2, –PO(OH)₂-csoportot vagy YR⁹ általános képletű csoportot jelent, ahol

Y jelentése oxigénatom vagy NR¹² általános képletű csoport;

R⁹ jelentése –(R¹¹)_m–COR¹⁰ vagy –(R¹¹)_m–SO₂R¹⁰ általános képletű csoport, 1–4 szénatomos alkilcsoport, 2–4 szénatomos alkenilcsoport, hidrox-(1–4 szénatomos alkil)-csoport, (1–4 szénatomos alkoxi)-(1–4 szénatomos alkil)-csoport, ciano-(1–4 szénatomos alkil)-csoport, a fenilrészen egy 1–4 szénatomos alkoxi-csoporttal adott esetben szubsztituált fenil-(1–2 szénatomos alkil)-csoport vagy 2–4 szénatomos alkinilcsoport; abban az esetben, ha R¹, R⁴, R⁵, R⁷ és R⁸ hidrogénatomot, R² klóratomot, R³ trifluor-metil-csoportot jelent, és X jelentése =C(Cl)–, akkor R⁶ jelenthet 2-(metoxi-karbonil)-etenil-csoportot, Q–CH(CH₃)–N–C(O)–Q

képletű csoportot, amelyben Q etoxi-karbonil-csoportot jelent vagy 1-(izopropilidén-hidrazono-karbonil)-etoxi-csoportot is;

abban az esetben, ha R¹, R⁴, R⁵, R⁷ és R⁸ hidrogénatomot, R² klóratomot, R³ trifluor-metil-csoportot és R⁶ 1-(etoxi-karbonil)-etoxi-csoportot jelent, akkor X olyan =C(R¹⁴)– képletű csoportot is jelenthet, amelyben R¹⁴ acetamidocsoportot képvisel;

abban az esetben, ha R¹, R⁴, R⁵, R⁷ és R⁸ hidrogénatomot, R² klóratomot, R³ trifluor-metil-csoportot és X nitrogénatomot jelent, akkor R⁶ jelenthet 2-acetoxi-etoxi-csoportot is;

abban az esetben, ha R¹, R⁴, R⁵, R⁷ és R⁸ hidrogénatomot, R² klóratomot, R³ trifluor-metil-csoportot és X nitrogénatomot vagy =C(Cl)– csoportot jelent, akkor R⁶ jelenthet 1-(furfuril-amino-karbonil)-etoxi-csoportot is; abban az esetben, ha R¹, R⁴, R⁵, R⁷ és R⁸ hidrogénatomot, R² klóratomot, R³ trifluor-metil-csoportot és X nitrogénatomot jelent, akkor R⁶ jelenthet –O–CH(CH₃)–C(O)–R^{10'} általános képletű csoportot is, amelyben R^{10'} jelentése 1-metil-4-piperidil-csoport vagy –NH–R¹³ általános képletű csoport, ahol R¹³ jelentése morfolino-, 5-tetrazolil-, 2-oxo-3-tetrahidrotienil-, 4-karbamoil-5-imidazolil-, 2-piridil-metil-, 3-piridil-metil-, 2-morfolino-etil- vagy 2-(1-metil-2-pirrolil)-etil-csoport;

R¹⁰ jelentése hidroxilcsoport, 1–4 szénatomos alkilcsoport, 1–4 szénatomos halogén-alkil-csoport, karboxi-(1–4 szénatomos alkil)-csoport, 1–5 szénatomos alkoxics csoport, 3–6 szénatomos cikloalkilcsoport, (1–4 szénatomos alkoxi)-(1–4 szénatomos alkoxi)-csoport, (1–4 szénatomos alkoxi)-karbonil-(1–4 szénatomos alkil)-csoport, (1–4 szénatomos alkoxi)-(1–4 szénatomos alkil)-amino-csoport, di(1–4 szénatomos alkoxi)-(1–4 szénatomos alkil)-amino-csoport,

fenoxics csoport, fenil-(1–2 szénatomos alkil)-csoport, (1–4 szénatomos alkoxi)-karbonil-csoport, hidroxikarbonil-csoport, (1–4 szénatomos alkil)_n-amino-csoport, (1–4 szénatomos alkil)_n-hidrazino-csoport, (1–4 szénatomos alkoxi)-karbonil-(1–4 szénatomos alkil)-amino-csoport, hidrox-(1–4 szénatomos alkil)-amino-csoport, (1–4 szénatomos alkil)_n-amino-(1–4 szénatomos alkil)-amino-csoport, (1–4 szénatomos alkil)_n-amino-karbonil-(1–4 szénatomos alkil)-amino-csoport, fenil-szulfonil-amino-csoport, acetil-amino-(1–4 szénatomos alkil)-amino-csoport, N-(1–4 szénatomos alkoxi)-N-(1–4 szénatomos alkil)_m-amino-csoport, ciano-(1–4 szénatomos alkil)-amino-csoport, (1–4 szénatomos alkoxi)-(1–4 szénatomos alkil)-amino-csoport, 1–4 szénatomos alkilcsoporttal adott esetben szubsztituált szemikarbazidocsoport, vagy egy 5 vagy 6 tagú heterociklusos csoport, amely heteroatomként egy vagy két nitrogénatomot és adott esetben egy oxigén- vagy kénatomot is tartalmaz;

20 azzal a megkötéssel, hogy R⁴, R⁵ és R⁶ közül csak az egyik jelenthet olyan –YR⁹ általános képletű csoportot, ahol R⁹ jelentése –(R¹¹)_mCOR¹⁰ általános képletű csoport,

R¹¹ jelentése 2–4 szénatomos alkilénlánc;

R¹² jelentése hidrogénatom;

m értéke 0 vagy 1;

n értéke 0, 1 vagy 2;

R⁷ hidrogénatomot, 1–4 szénatomos alkilcsoportot vagy nitrocsoportot képvisel;

30 R⁸ jelentése hidrogénatom vagy halogénatom; és X nitrogénatomot vagy CR¹⁴ általános képletű csoportot képvisel, ahol

R¹⁴ jelentése halogénatom vagy cianocsoport, azzal a feltétellel, hogy

35 ha R⁵ jelentése nitrocsoport, X jelentése nitrogénatom és R¹, R², R⁴, R⁶ és R⁷ jelentése hidrogénatom, R³ jelentése brómatomtól eltérő.

2. Az 1. igénypont szerinti vegyületek, ahol a képletben

40 R² jelentése hidrogénatom, halogénatom vagy alkil-tio-csoport,

R³ jelentése halogénatom vagy halogén-alkil-csoport, R⁴, R⁵ és R⁶ egymástól függetlenül hidrogénatomot, cianocsoportot, halogénatomot, alkilcsoportot, nitrocsoportot, halogén-alkil-csoportot, karboxilcsoportot, alkoxi-karbonil-csoportot vagy YR⁹ csoportot jelent, ahol

Y jelentése oxigénatom vagy NR¹² csoport,

R⁹ jelentése –(R¹¹)_m–COR¹⁰, –(R¹¹)_m–SO₂R¹⁰, alkilcsoport, ciano-alkil-csoport vagy alkinilcsoport, R⁷ jelentése hidrogénatom, és

X jelentése nitrogénatom vagy CR¹⁴ csoport, ahol

R¹⁴ halogénatomot képvisel.

3. Az 1. igénypont szerinti vegyületek, ahol a képletben

55 R⁴, R⁵ és R⁶ jelentése egymástól függetlenül hidrogénatom, halogénatom, alkilcsoport és YR⁹ csoport, ahol

Y oxigénatomot képvisel, és

R⁹ jelentése –(R¹¹)_m–COR¹⁰ vagy

60 –(R¹¹)_m–SO₂R¹⁰ csoport, alkilcsoport, ciano-alkil-

csoport, acetoxi-alkil-csoport, alkoxi-alkil-csoport vagy alkinilcsoport, és

R^{11} jelentése $-\text{CH}_2-$, $-\text{CH}(\text{CH}_3)-$ vagy $-\text{CH}_2-\text{CH}_2-$ csoport.

4. A 3. igénypont szerinti vegyületek, amelyek kép-
letében X nitrogénatomot képvisel.

5. A 3. igénypont szerinti vegyületek, amelyek kép-
letében X C-halogénatomot képvisel.

6. A 2. igénypont szerinti vegyületek, amelyek kép-
letében

R^2 hidrogén- vagy halogénatomot,

R^3 halogén-alkil-csoportot,

R^4 hidrogénatomot,

R^5 hidrogénatomot,

R^6 YR^9 általános képletű csoportot,

R^7 hidrogénatomot

R^8 hidrogénatomot, és

X nitrogén- vagy C-halogénatomot jelent.

7. Az 1. igénypont szerinti vegyületek, amelyek
képletében

R^1, R^4, R^5, R^7 és R^8 hidrogénatomot;

R^2 hidrogén- vagy halogénatomot;

R^3 $-\text{CF}_3$ -csoportot;

X nitrogénatomot vagy C-klóratomot; és

R^6 OR_9 -csoportot jelent.

8. A 7. igénypont szerinti vegyületek, amelyek kép-
letében

R^9 $-(R^{11})_m\text{C}-R^{10}$, alkil- vagy alkoxi-alkil-csoportot
||
O
jelent.

9. Eljárás nem kívánt vegetáció szabályozására, az-
zal jellemezve, hogy az ilyen vegetációra vagy annak
előfordulási helyére készítmény formájában egy 1.
igénypont szerinti vegyület 0,01–12 kg/ha mennyisé-
gét visszük fel.

10. Herbicid készítmény, azzal jellemezve, hogy

a) egy 1. igénypont szerinti vegyület 0,1–95,0 tö-
meg% mennyiségét és

b) egy herbicidekkel együtt alkalmazható hígító-
szert vagy hordozóanyagot tartalmaz.

11. Eljárás az (I) általános képletű vegyületek és
azok mezőgazdaságilag elfogadható sóinak az előállítá-
sára, ahol a képletben

R^1 hidrogén- vagy halogénatomot jelent;

R^2 hidrogénatomot, nitrocsoportot, halogénatomot,
1–4 szénatomos alkil-tio-csoportot vagy amino-
csoportot képvisel;

R^3 halogénatomot, nitrocsoportot vagy halogén-
(1–4 szénatomos alkil)-csoportot jelent,

R^4, R^5 és R^6 egymástól függetlenül hidrogénatomot,
halogénatomot, nitrocsoportot, aminocsoportot,
hidroxilcsoportot, cianocsoportot, 1–4 szénatomos
alkilcsoportot, (1–4 szénatomos alkoxi)-imino-
(1–4 szénatomos alkil)-csoportot, hidroxil-(1–4 szén-
atomos alkil)-csoportot, (1–4 szénatomos alkoxi)-
(1–4 szénatomos alkil)-csoportot, halogén-(1–4 szén-
atomos alkil)-szulfonil-amino-(1–4 szénatomos alkil)-
csoportot, halogén-(1–4 szénatomos alkil)-csoportot,
di(1–4 szénatomos alkoxi)-foszforil-csoportot,
1–4 szénatomos alkil-tio-csoportot, formilcsoportot,

karboxilcsoportot, (1–4 szénatomos alkoxi)-karbonil-
csoportot, [(1–4 szénatomos alkil)-karbonil-oxi] $_2$ -
(1–4 szénatomos alkil)-csoportot, ahol z értéke 1 vagy
2, $-\text{PO}(\text{OH})_2$ -csoportot vagy YR^9 általános képletű
csoportot jelent, ahol

Y jelentése oxigénatom vagy NR^{12} általános képle-
tű csoport;

R^9 jelentése $-(R^{11})_m-\text{COR}^{10}$ vagy $-(R^{11})_m-\text{SO}_2\text{R}^{10}$
általános képletű csoport, 1–4 szénatomos alkilcsoport,
2–4 szénatomos alkenilcsoport, hidroxil-(1–4 szénato-
mos alkil)-csoport, (1–4 szénatomos alkoxi)-(1–4 szén-
atomos alkil)-csoport, ciano-(1–4 szénatomos alkil)-
csoport, a fenilrészben egy 1–4 szénatomos alkoxi-
csoporttal adott esetben szubsztituált fenil-(1–2 szénato-
mos alkil)-csoport vagy 2–4 szénatomos alkinilcsoport;
5
10
15
20
képletű csoportot, amelyben Q etoxi-karbonil-csoportot
jelent vagy 1-(izopropilidén-hidrazono-karbonil)-etoxi-
csoportot is;

abban az esetben, ha R^1, R^4, R^5, R^7 és R^8 hidrogénato-
mot, R^2 klóratomot, R^3 trifluor-metil-csoportot és R^6 1-
(etoxi-karbonil)-etoxi-csoportot jelent, akkor X olyan
 $=\text{C}(\text{R}^{14})-$ képletű csoportot is jelenthet, amelyben R^{14}
acetamidocsoportot képvisel;

abban az esetben, ha R^1, R^4, R^5, R^7 és R^8 hidrogénato-
mot, R^2 klóratomot, R^3 trifluor-metil-csoportot és X nit-
rogénatomot jelent, akkor R^6 jelenthet 2-acetoxi-etoxi-
csoportot is;

abban az esetben, ha R^1, R^4, R^5, R^7 és R^8 hidrogénato-
mot, R^2 klóratomot, R^3 trifluor-metil-csoportot és X nit-
rogénatomot vagy $=\text{C}(\text{Cl})-$ csoportot jelent, akkor R^6
jelenthet 1-(furfuril-amino-karbonil)-etoxi-csoportot is;

abban az esetben, ha R^1, R^4, R^5, R^7 és R^8 hidrogén-
atomot, R^2 klóratomot, R^3 trifluor-metil-csoportot és
X nitrogénatomot jelent, akkor R^6 jelenthet
40
45
50
55
60
 $-\text{O}-\text{CH}(\text{CH}_3)-\text{C}(\text{O})-\text{R}^{10'}$ általános képletű csoportot
is, amelyben $\text{R}^{10'}$ jelentése 1-metil-4-piperidil-csoport,
vagy $-\text{NH}-\text{R}^{13}$ általános képletű csoport, ahol R^{13} jelen-
tése morfolino-, 5-tetrazolil-, 2-oxo-3-tetrahidrotienil-, 4-
karbamoil-5-imidazolil-, 2-piridil-metil-, 3-piridil-metil-,
2-morfolino-etil- vagy 2-(1-metil-2-pirrolil)-etil-csoport;
 R^{10} jelentése hidroxilcsoport, 1–4 szénatomos alkil-
csoport, 1–4 szénatomos halogén-alkil-csoport,
karboxi-(1–4 szénatomos alkil)-csoport, 1–5 szénato-
mos alkoxicssoport, 3–6 szénatomos cikloalkilcsoport,
(1–4 szénatomos alkoxi)-(1–4 szénatomos alkoxi)-
csoport, (1–4 szénatomos alkoxi)-karbonil-(1–4 szén-
atomos alkil)-csoport, (1–4 szénatomos alkoxi)-
(1–4 szénatomos alkil)-amino-csoport, di(1–4 szén-
atomos alkoxi)-(1–4 szénatomos alkil)-amino-csoport,
fenoxicssoport, fenil-(1–2 szénatomos alkil)-csoport,
(1–4 szénatomos alkoxi)-karbonil-csoport, hidroxil-
karbonil-csoport, (1–4 szénatomos alkil) $_n$ -amino-
csoport, (1–4 szénatomos alkil) $_n$ -hidrazino-csoport,
(1–4 szénatomos alkoxi)-karbonil-(1–4 szénatomos
alkil)-amino-csoport, hidroxil-(1–4 szénatomos alkil)-

amino-csoport, (1–4 szénatomos alkil)_n-amino-(1–4 szénatomos alkil)-amino-csoport, (1–4 szénatomos alkil)_n-amino-karbonil-(1–4 szénatomos alkil)-amino-csoport, fenil-szulfonil-amino-csoport, acetyl-amino-(1–4 szénatomos alkil)-amino-csoport, N-(1–4 szénatomos alkoxi)-N-(1–4 szénatomos alkil)_m-amino-csoport, ciano-(1–4 szénatomos alkil)-amino-csoport, (1–4 szénatomos alkoxi)-(1–4 szénatomos alkil)-amino-csoport, 1–4 szénatomos alkilcsoporttal adott esetben szubsztituált szemikarbazidocsoport, vagy egy 5 vagy 6 tagú heterociklusos csoport, amely heteroatomként egy vagy két nitrogénatomot és adott esetben egy oxigén- vagy kénatomot is tartalmaz; azzal a megkötéssel, hogy R⁴, R⁵ és R⁶ közül csak az egyik jelenthet olyan –YR⁹ általános képletű csoportot, ahol R⁹ jelentése –(R¹¹)_mCOR¹⁰ általános képletű csoport,

R¹¹ jelentése 2–4 szénatomos alkilénlánc;

R¹² jelentése hidrogénatom;

m értéke 0 vagy 1;

n értéke 0, 1 vagy 2;

R⁷ hidrogénatomot, 1–4 szénatomos alkilcsoportot vagy nitrocsoportot képvisel;

R⁸ jelentése hidrogénatom vagy halogénatom; és X nitrogénatomot vagy CR¹⁴ általános képletű csoportot képvisel, ahol

R¹⁴ jelentése halogénatom vagy cianocsoport,

5 azzal a feltétellel, hogy

ha R⁵ jelentése nitrocsoport, X jelentése nitrogénatom és R¹, R², R⁴, R⁶ és R⁷ jelentése hidrogénatom, R³ jelentése brómatomtól eltérő,

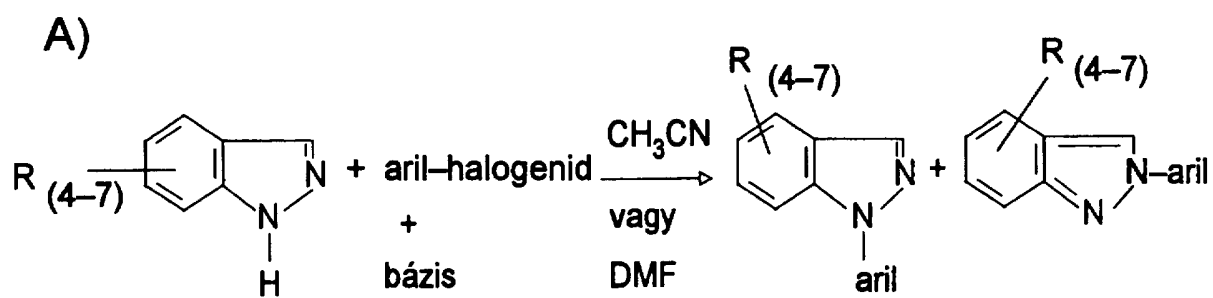
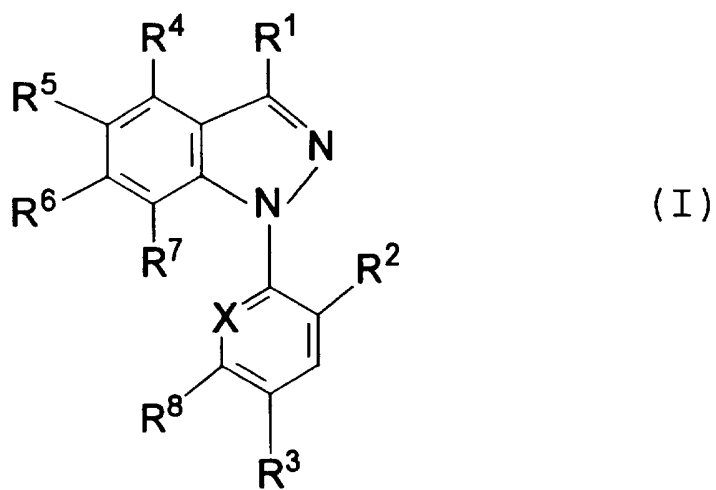
azzal jellemezve, hogy

10 a) egy (II) általános képletű vegyületet – ahol R¹, R⁴, R⁵, R⁶ és R⁷ a fenti jelentésű – bázis jelenlétében egy (III) általános képletű vegyülettel – ahol R¹³ halogénatomot jelent, és R², R³, R⁸ és X a fenti jelentésű, vagy

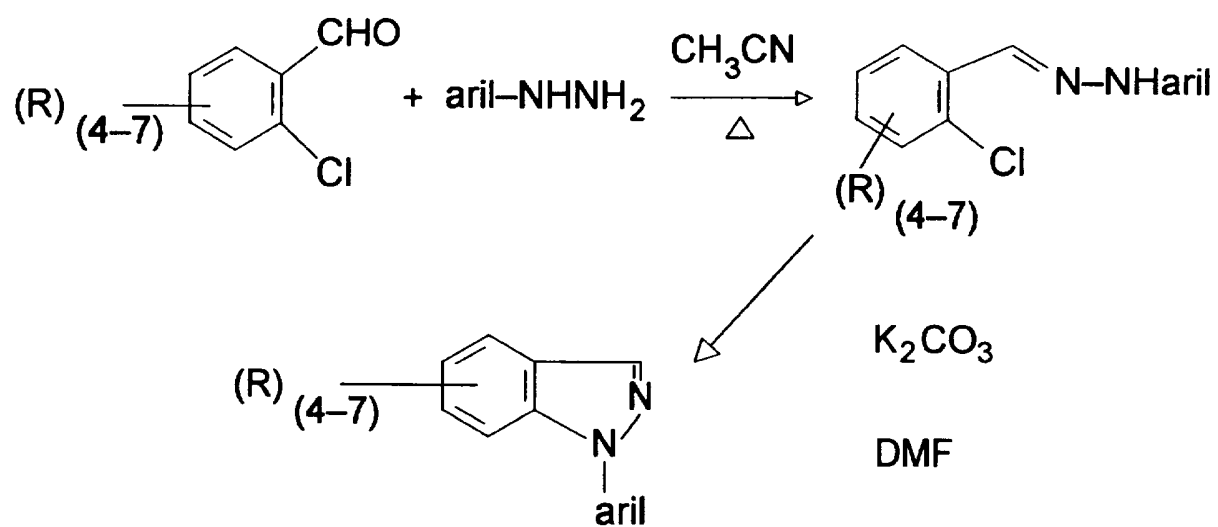
15 b) egy (IV) általános képletű vegyületet – ahol R⁴, R⁵, R⁶ és R⁷ a fenti jelentésű – egy (V) általános képletű vegyülettel – ahol R², R³ és R⁸ a fenti jelentésű – reagáltatunk, és

20 a kapott (VI) általános képletű vegyületet gyenge bázis jelenlétében (I) általános képletű vegyületté alakítjuk, és

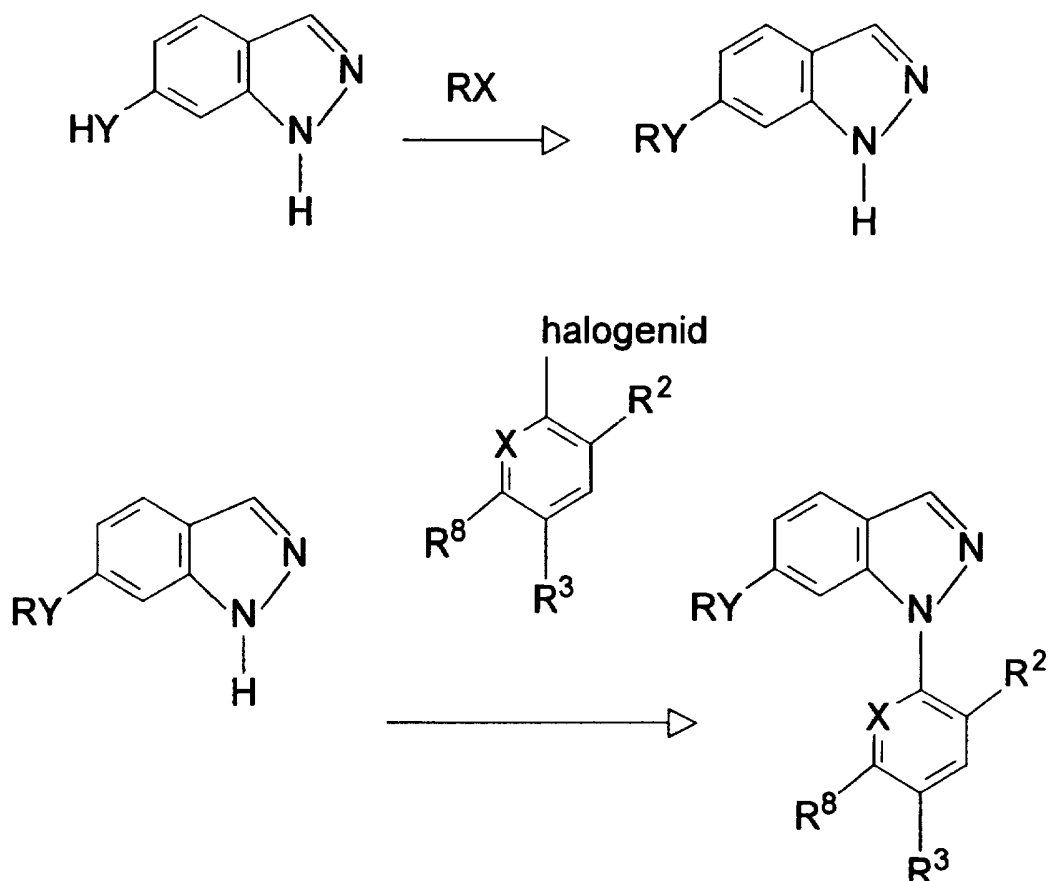
kívánt esetben a kapott (I) általános képletű vegyületet mezőgazdaságilag elfogadható sóvá alakítjuk.



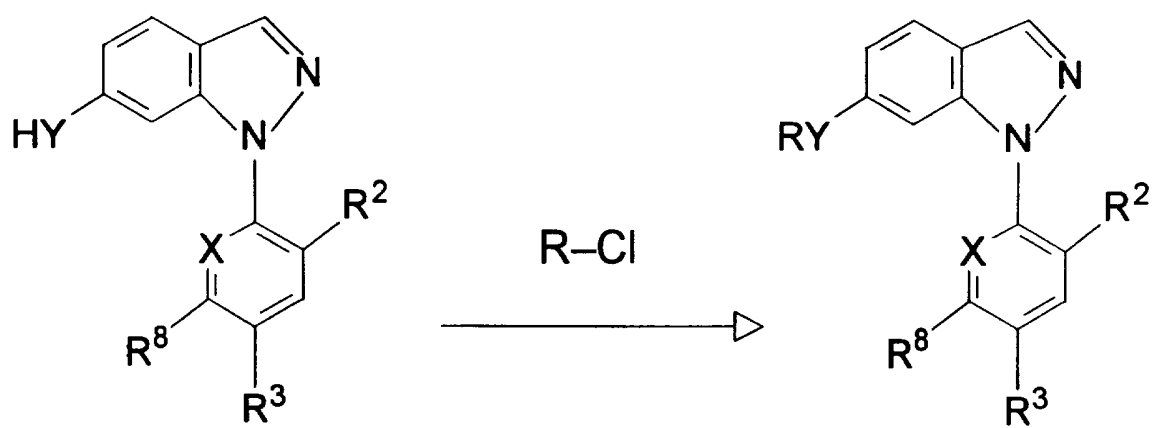
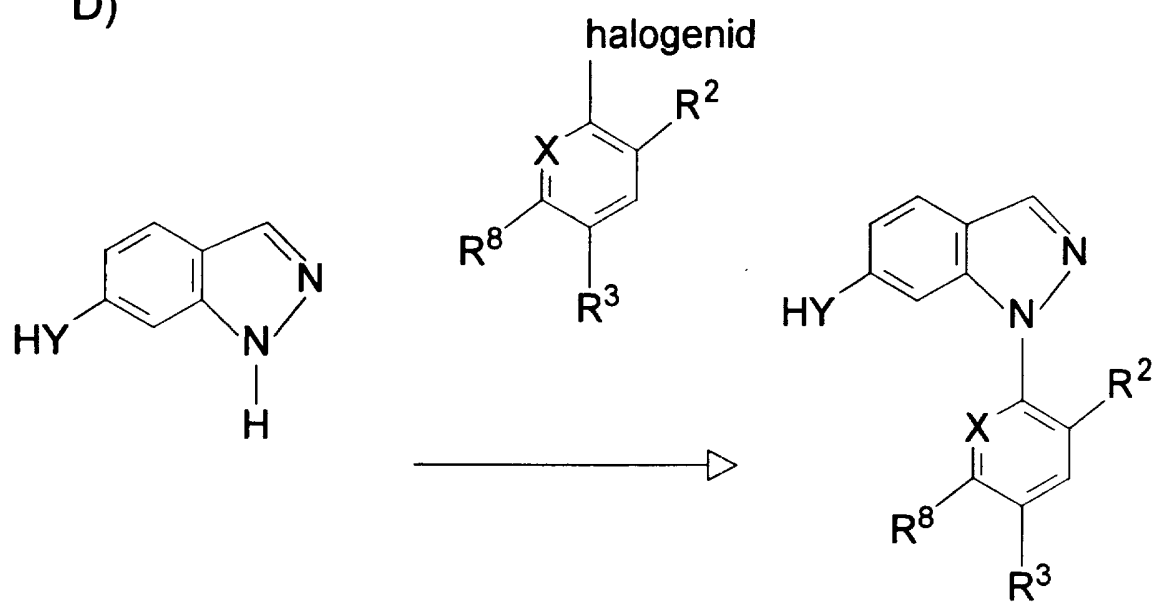
B)

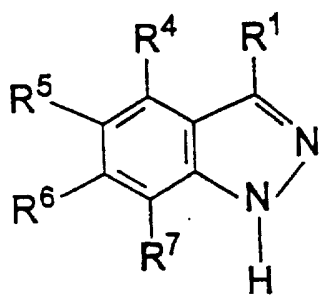


C)

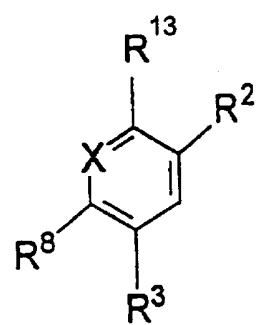


D)

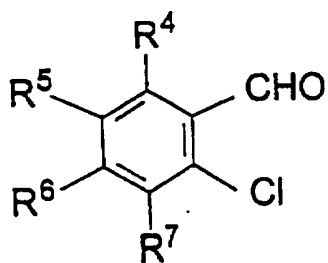




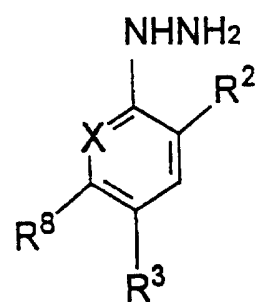
(II)



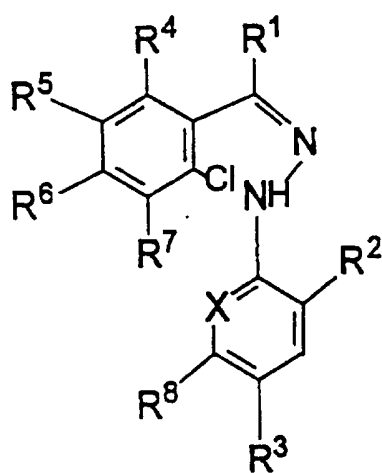
(III)



(IV)



(V)



(VI)