

KÁRTEVŐIRTÓ HATÁSÚ Δ^1 -PIRROLINSZÁRMAZÉKOK, INTERMEDIÉRIJEIK,
ELŐÁLLÍTÁSUK ÉS ALKALMAZÁSUK

KIVONAT

A találmány az új (I) általános képletű Δ^1 -pirrolinszármazékokra, előállításukra szolgáló több eljárásra, valamint kártevőirtókénti alkalmazásukra vonatkozik.

Az (I) általános képletben

R^1 jelentése halogénatom vagy metilcsoport;

R^2 jelentése hidrogén- vagy halogénatom;

R^3 jelentése halogénatom vagy adott esetben szubsztituált alkil-, alkoxi- vagy alkiltiocsoport;

m jelentése egész szám, melynek értéke 0, 1, 2, 3 vagy 4;

Q jelentése adott esetben szubsztituált piridil-, piridazinil-, pirazinil- vagy pirimidinilcsoport.

A találmány tárgya még az intermediereként alkalmazható új (II) általános képletű Δ^1 -pirrolinszármazékok – amelyek képletében R^1 , R^2 , R^3 , és m jelentése a fenti és Z jelentése klór-, bróm- vagy jódatom, $-\text{OSO}_2\text{CF}_3$ vagy $-\text{OSO}_2(\text{CF}_2)_3\text{CF}_3$ csoport – valamint új (IV) általános képletű Δ^1 -pirrolinszármazékok – amelyek képletében R^1 , R^2 , R^3 és m jelentése a fenti, és A jelentése $-\text{B}(\text{OH})_2$, (4,4,5,5-tetrametil-1,3,2-dioxaborolán)-2-il-, (5,5-dimetil-1,3,2-dioxaborinán)-2-il-, (4,4,6-trimetil-1,3,2-dioxaborinán)-2-il- vagy 1,3,2-benzodioxaborol-2-il-csoport.

(I), (II), (IV)

20016

P 03 03 2 8 2

KÁRTEVŐÍRTÓ HATÁSÚ Δ^1 -PIRROLINSZÁRMAZÉKOK, INTERMEDIÉRIJEIK, ELŐÁLLÍTÁSUK ÉS ALKALMAZÁSUK

A találmány új Δ^1 -pirrolinszármazékokra, előállításukra szolgáló eljárásokra, valamint kártevőirtókénti alkalmazásukra vonatkozik.

- 5 Ismert, hogy számos Δ^1 -pirrolinszármazék rovarirtó tulajdonsággal rendelkezi (ld. WO 00/21958, WO 99/59968, WO 99/59967 vagy WO 98/22438 közrebocsátási iratokat). A fenti vegyületek hatása jó, azonban néhány esetben nem kielégítő.

- 10 A találmány olyan (I) általános képletű Δ^1 -pirrolinszármazékokra vonatkozik, amelyek képletében

R^1 jelentése halogénatom vagy metilcsoport;

R^2 jelentése hidrogén- vagy halogénatom;

R^3 jelentése halogénatom vagy adott esetben szubsztituált alkil-, alkoxi- vagy alkiltiocsoport;

- 15 m jelentése egész szám, melynek értéke 0, 1, 2, 3 vagy 4;

Q jelentése (a), (b), (c), (d), (e) vagy (f) képletű csoport, ahol

R^4 jelentése hidrogén-, halogénatom, ciano-, formil-, nitro-, trialkilszililcsoport; adott esetben szubsztituált alkil-, alkenil-, alkoxi-, alkeniloxics csoport; pentafluortiocsoport, $-S(O)_pR^6$, $-NR^7R^8$, $-COR^6$, $-CO_2R^6$, $-CONR^9R^{10}$,
20 $-N(R^{11})COR^{12}$ vagy $-C(R^{13})=N-OR^{14}$ általános képletű csoport; vagy adott esetben szubsztituált cikloalkil-, cikloalkilalkil-, aril-, arilalkil-, telített vagy telítetlen heterociklil- vagy heterociklilalkilcsoport; vagy

R^4 jelentése $-CH=NOH$ képletű csoport, formilcsoport; adott esetben szubsztituált cikloalkiloxi- vagy cikloalkilalkiloxics csoport;

- 25 R^5 jelentése halogénatom, ciano-, formil-, nitro-, trialkilszililcsoport; adott esetben szubsztituált alkil-, alkenil-, alkoxi-, alkeniloxics csoport; pentafluortiocsoport, $-S(O)_pR^6$, $-NR^7R^8$, $-COR^6$, $-CO_2R^6$, $-CONR^9R^{10}$, $-N(R^{11})COR^{12}$ vagy $-C(R^{13})=N-OR^{14}$ általános képletű csoport; vagy adott esetben szubsztituált cikloalkil-, cikloalkilalkil-, aril-, arilalkil-, telített vagy telítetlen
30 heterociklil- vagy heterociklilalkilcsoport;

p jelentése egész szám, melynek értéke 0, 1 vagy 2;

- n jelentése egész szám, melynek értéke 0, 1, 2 vagy 3, ahol az R^5 szubsztituensek jelentése azonos vagy eltérő, amikor n értéke 2 vagy 3;
- r jelentése egész szám, melynek értéke 0, 1 vagy 2, ahol az R^5 szubsztituensek jelentése azonos vagy eltérő, amikor r értéke 2;
- 5 R^6 jelentése adott esetben szubsztituált alkil-, cikloalkil-, aril- vagy arilalkil-csoport;
- R^7 és R^8 jelentése egymástól függetlenül hidrogénatom, $-SO_2R^6$, $-COR^6$ vagy $-CO_2R^6$ általános képletű csoport, adott esetben szubsztituált alkil-, alkenil-, cikloalkil-, cikloalkilalkil-, aril-, arilalkil-, telített vagy telítetlen heterociklil- vagy heterociklilalkilcsoport, továbbá
- 10 R^7 és R^8 jelentése együttesen egy adott esetben szubsztituált alkenilén- vagy alkiléncsoport, ahol az alkilénlánc minden esetben -O-, -S- atommal vagy $-NR^{15}$ - általános képletű csoporttal lehet megszakítva, továbbá
- R^7 és R^8 jelentése együttesen egy adott esetben szubsztituált alkiléncsoport, ahol az alkilénlánc C=O vagy C=NO-alkil-csoporttal lehet megszakítva;
- 15 R^9 és R^{10} jelentése egymástól függetlenül hidrogénatom, $-SO_2R^6$ általános képletű csoport, adott esetben szubsztituált alkil-, alkenil-, cikloalkil-, cikloalkilalkil-, aril-, arilalkil-, telített vagy telítetlen heterociklil- vagy heterociklilalkilcsoport, továbbá
- 20 R^9 és R^{10} jelentése együttesen egy adott esetben szubsztituált alkiléncsoport, ahol az alkilénlánc minden esetben -O-, -S- atommal vagy $-NR^{15}$ - csoporttal lehet megszakítva;
- R^{11} és R^{12} jelentése egymástól függetlenül hidrogénatom, adott esetben szubsztituált alkil-, cikloalkil-, cikloalkilalkil-, aril- vagy arilalkilcsoport; továbbá
- 25 R^{11} és R^{12} jelentése együttesen egy adott esetben szubsztituált alkenilén- vagy alkiléncsoport;
- R^{13} és R^{14} jelentése egymástól függetlenül hidrogénatom, adott esetben szubsztituált alkil- vagy alkenilcsoport; és
- 30 R^{15} jelentése hidrogénatom, $-SO_2R^6$, $-COR^6$ vagy $-CO_2R^6$ általános képletű csoport, adott esetben szubsztituált alkil-, alkenil-, cikloalkil-, cikloalkilalkil-, aril-, arilalkil-, telített vagy telítetlen heterociklil- vagy heterociklilalkilcsoport.

A szubsztituensek számától és típusától függően a találmány szerinti (I) általános képletű vegyületek adott esetben geometriai és/vagy optikai izomerek, régioizomerek vagy azok különböző összetételű izomerelegyek alakjában lehetnek jelen. A találmány oltalmi köre kiterjed mind a tiszta izomerekre mind az izomerelegyekre.

Továbbá azt találtuk, hogy az (I) általános képletű Δ^1 -pirrolin-származékokat valamely alábbi eljárással állíthatjuk elő:

- A) egy (II) általános képletű Δ^1 -pirrolinszármazékot – amelynek képletében R^1 , R^2 , R^3 és m jelentése a fenti, és Z jelentése klór-, bróm- vagy jódatom, $-\text{OSO}_2\text{CF}_3$ vagy $-\text{OSO}_2(\text{CF}_2)_3\text{CF}_3$ csoport – egy (III) általános képletű heterociklusos vegyülettel – amelynek képletében Q jelentése a fenti, és X jelentése klór-, bróm- vagy jódatom, $-\text{OSO}_2\text{CF}_3$ vagy $-\text{OSO}_2(\text{CF}_2)_3\text{CF}_3$ csoport – valamilyen katalizátor, dibórsavészter, kívánt esetben valamilyen savmegkötő és kívánt esetben egy hígítószer jelenlétében reagáltatunk; vagy
- B) egy (IV) általános képletű Δ^1 -pirrolinszármazékot – amelynek képletében R^1 , R^2 , R^3 és m jelentése a fenti, és A jelentése $-\text{B}(\text{OH})_2$, (4,4,5,5-tetrametil-1,3,2-dioxaborolán)-2-il-, (5,5-dimetil-1,3,2-dioxaborinán)-2-il-, (4,4,6-trimetil-1,3,2-dioxaborinán)-2-il- vagy 1,3,2-benzodioxaborol-2-il-csoport – egy (III) általános képletű heterociklusos vegyülettel – amelynek képletében Q és X jelentése a fenti – valamilyen katalizátor, kívánt esetben valamilyen savmegkötő és kívánt esetben egy hígítószer jelenlétében reagáltatunk; vagy
- C) egy (II) általános képletű Δ^1 -pirrolinszármazékot – amelynek képletében R^1 , R^2 , R^3 , m és Z jelentése a fenti – egy (V) általános képletű bórsav-származékkal – amelynek képletében Q és A jelentése a fenti – valamilyen katalizátor, kívánt esetben valamilyen savmegkötő és kívánt esetben egy hígítószer jelenlétében reagáltatunk; vagy
- D) egy (II-a) általános képletű Δ^1 -pirrolinszármazékot – amelynek képletében R^1 , R^2 , R^3 és m jelentése a fenti, és Z jelentése bróm- vagy jódatom – egy (VI) általános képletű fémorganikus vegyülettel – amelynek képletében Q jelentése a fenti, és M jelentése ZnCl , $\text{Sn}(\text{Me})_3$ vagy $\text{Sn}(\text{n-Bu})_3$

képletű csoport – valamilyen katalizátor, kívánt esetben valamilyen savmegkötő és kívánt esetben egy hígítószer jelenlétében reagáltatunk.

Azt találtuk továbbá, hogy a találmány szerinti (I) általános képletű vegyületek nagyon jó rovarirtó tulajdonságokkal rendelkeznek, és mind termésvédelemben, mind a nem-kívánt kártevők, így rovarok leküzdésére használt anyagok védelmére alkalmazhatók.

A találmány szerinti Δ^1 -pirrolinszármazékokat a fenti (I) általános képlet általánosan definiálja.

R^1 előnyös jelentése halogénatom vagy metilcsoport.

10 R^2 előnyös jelentése hidrogén- vagy halogénatom.

R^3 előnyös jelentése halogénatom, adott esetben halogénatommal szubsztituált alkil-, alkoxi- vagy alkiltiocsoport.

m előnyös jelentése 0, 1, 2, 3 vagy 4.

Q előnyös jelentése (a), (b), (c), (d), (e) vagy (f) képletű csoport.

15 R^4 előnyös jelentése hidrogénatom, halogénatom, ciano-, formil-, nitro-, trialkilszilil-csoport; alkil-, alkenil-, alkoxi-, alkeniloxicssoport, amelyek mindegyike adott esetben, egyszeresen vagy többszörösen, azonos vagy eltérő szubsztituenssel, éspedig halogénatommal, ciano- és/vagy $-NR^7R^8$ általános képletű csoporttal lehet szubsztituálva; pentafluortio-, $-S(O)_pR^6$,
20 $-NR^7R^8$, $-COR^6$, $-CO_2R^6$, $-CONR^9R^{10}$, $-N(R^{11})COR^{12}$ vagy $-C(R^{13})=N-OR^{14}$ általános képletű csoport; vagy cikloalkil-, cikloalkilalkil-, aril-, arilalkil-, telített vagy telítetlen, 5-10-tagú heterociklil- vagy heterociklilalkilcsoport, amelyek mindegyike adott esetben, egyszeresen vagy többszörösen, azonos vagy eltérő szubsztituenssel, éspedig halogénatommal, ciano-,
25 nitro-, alkil-, halogénalkil-, alkenil-, halogénalkenil-, alkoxi-, halogénalkoxi-, alkiltio- és/vagy halogénalkiltiocsoporttal lehet szubsztituálva.

R^4 további előnyös jelentése $-CH=NOH$, formilcsoport; vagy cikloalkiloxi- vagy cikloalkilalkiloxicssoport, amelyek mindegyike adott esetben, egyszeresen vagy többszörösen, azonos vagy eltérő szubsztituenssel, éspedig halogénatommal és/vagy alkilcsoporttal lehet szubsztituálva.

30 R^5 előnyös jelentése halogénatom, ciano-, formil-, nitro-, trialkilszililcsoport; alkil-, alkenil-, alkoxi-, alkeniloxicssoport, amelyek mindegyike adott eset-

- ben, egyszeresen vagy többszörösen, azonos vagy eltérő szubsztituenssel, éspedig halogénatommal, ciano- és/vagy $-NR^7R^8$ általános képletű csoporttal lehet szubsztituálva; pentafluortio-, $-S(O)_pR^6$, $-NR^7R^8$, $-COR^6$, $-CO_2R^6$, $-CONR^9R^{10}$, $-N(R^{11})COR^{12}$ vagy $-C(R^{13})=N-OR^{14}$ általános képletű csoport; vagy cikloalkil-, cikloalkilalkil-, aril-, arilalkil-, telített vagy telítetlen, 5-10-tagú heterociklil- vagy heterociklilalkilcsoport, amelyek mindegyike adott esetben, egyszeresen vagy többszörösen, azonos vagy eltérő szubsztituenssel, éspedig halogénatommal, alkil-, halogénalkil-, alkenil-, halogénalkenil-, alkoxi-, halogénalkoxi-, alkiltio- és/vagy halogénalkiltiocsoporttal lehet szubsztituálva.
- 5 p előnyös jelentése 0, 1 vagy 2.
- n előnyös jelentése 0, 1, 2 vagy 3, ahol az R^5 szubsztituensek jelentése azonos vagy eltérő, amikor n értéke 2 vagy 3.
- r előnyös jelentése 0, 1 vagy 2, ahol az R^5 szubsztituensek jelentése azonos vagy eltérő, amikor r értéke 2.
- 15 R^6 előnyös jelentése olyan alkilcsoport, amely adott esetben halogénatommal vagy $-NR^7R^8$ általános képletű csoporttal egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált; vagy cikloalkil-, aril- vagy arilalkilcsoport, amelyek mindegyike adott esetben halogénatommal, ciano-, alkil-, halogénalkil-, alkoxi-, halogénalkoxi-, alkiltio- és/vagy halogénalkiltiocsoporttal egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált.
- 20 R^6 további előnyös jelentése olyan alkilcsoport, amely adott esetben egy vagy több, azonos vagy eltérő szubsztituenssel szubsztituált, ahol a szubsztituensek adott esetben alkoxi-, alkiltio-, halogénalkoxi- és/vagy halogénalkiltiocsoporttal lehetnek szubsztituálva.
- 25 R^7 és R^8 előnyös jelentése egymástól függetlenül hidrogénatom, $-SO_2R^6$, $-COR^6$, $-CO_2R^6$ általános képletű csoport; adott esetben egy vagy több, azonos vagy eltérő szubsztituenssel, éspedig halogénatommal, alkilkarbonil-, alkilkarboniloxi-, alkilamino-, dialkilamino-, alkoxi-, halogénalkoxi-, alkiltio- és/vagy halogénalkiltio-csoporttal szubsztituált alkil- vagy alkenilcsoport; adott esetben egy vagy több, azonos vagy eltérő szubsztituenssel, éspedig halogénatommal, ciano-, alkil-, halogénalkil-, alkoxi-, halogén-
- 30

alkoxi-, alkiltio- és/vagy halogénalkiltio-csoporttal szubsztituált cikloalkil-, cikloalkilalkil-, aril-, arilalkil-, telített vagy telítetlen, 5-10-tagú heterociklil- vagy heterociklilalkilcsoport.

5 R^7 és R^8 további előnyös jelentése együttesen egy olyan alkeniléncsoport, amely adott esetben egy vagy több, azonos vagy eltérő szubsztituenssel, éspedig halogénatommal, ciano-, alkoxi-, halogénalkoxi-, alkiltio- és/vagy halogénalkiltio-csoporttal szubsztituált; vagy olyan alkiléncsoport, amely adott esetben egy vagy több, azonos vagy eltérő szubsztituenssel, éspedig halogénatommal, ciano-, alkil-, halogénalkil-, alkoxi-, halogénalkoxi-, alkil-
10 tio- és/vagy halogénalkiltio-csoporttal szubsztituált, és ahol az alkilénlancok mindegyike adott esetben -O-, -S- vagy $-NR^{15}$ - általános képletű csoporttal lehet megszakítva.

R^7 és R^8 további előnyös jelentése együttesen egy olyan alkiléncsoportot alkot, amely adott esetben egy vagy több, azonos vagy eltérő szubsztitu-
15 enssel, éspedig alkoxikarbonil- és/vagy oxialkilénoxi-csoporttal szubsztituált.

R^7 és R^8 további előnyös jelentése együttesen egy olyan alkiléncsoport alkot, ahol az alkilénlanc $C=O$ vagy $C=NO$ -alkil-csoporttal lehet megszakítva.

R^9 és R^{10} előnyös jelentése egymástól függetlenül hidrogénatom, $-SO_2R^6$, álta-
20 lános képletű csoport; adott esetben egy vagy több, azonos vagy eltérő szubsztituenssel, éspedig halogénatommal, alkilamino-, dialkilamino-, alkoxi- és/vagy alkiltiocsoporttal szubsztituált alkil- vagy alkenilcsoport; adott esetben egy vagy több, azonos vagy eltérő szubsztituenssel, éspedig halogénatommal, ciano-, alkil-, halogénalkil-, alkoxi-, halogénalkoxi-,
25 alkiltio- és/vagy halogénalkiltio-csoporttal szubsztituált cikloalkil-, cikloalkilalkil-, aril-, arilalkil-, telített vagy telítetlen, 5-10-tagú heterociklil- vagy heterociklilalkilcsoport.

R^9 és R^{10} további előnyös jelentése együttesen egy olyan alkiléncsoportot alkot, amely adott esetben egy vagy több, azonos vagy eltérő szubsztitu-
30 enssel, éspedig halogénatommal, ciano-, alkil-, halogénalkil-, alkoxi-, halogénalkoxi-, alkiltio- és/vagy halogénalkiltio-csoporttal szubsztituált, és ahol az alkilénlancok mindegyike adott esetben -O-, -S- vagy $-NR^{15}$ - álta-

- lános képletű csoporttal lehet megszakítva.
- R^{11} és R^{12} előnyös jelentése egymástól függetlenül hidrogénatom; adott esetben egy vagy több, azonos vagy eltérő szubsztituenssel, éspedig halogénatommal, ciano-, alkoxi- és/vagy alkiltiocsoporttal szubsztituált alkilcsoport;
- 5 adott esetben egy vagy több, azonos vagy eltérő szubsztituenssel, éspedig halogénatommal, ciano-, alkil-, halogénalkil-, alkoxi-, halogénalkoxi-, alkiltio- és/vagy halogénalkiltio-csoporttal szubsztituált cikloalkil-, cikloalkilalkil-, aril- vagy arilalkilcsoport.
- R^{11} és R^{12} további előnyös jelentése együttesen egy olyan alkilén- vagy alkenilén-csoportot alkotnak, amelyek mindegyike adott esetben egy vagy
- 10 több, azonos vagy eltérő szubsztituenssel, éspedig halogénatommal, alkil-, halogénalkil-, alkoxi-, halogénalkoxi-, alkiltio- és/vagy halogénalkiltio-csoporttal szubsztituált.
- R^{13} és R^{14} előnyös jelentése egymástól függetlenül hidrogénatom vagy esetben egy vagy több halogénatommal szubsztituált alkil- vagy alkenilcsoport.
- 15 R^{15} előnyös jelentése hidrogénatom, $-SO_2R^6$, $-COR^6$, $-CO_2R^6$ általános képletű csoport; adott esetben egy vagy több, azonos vagy eltérő szubsztituenssel, éspedig halogénatommal, ciano-, alkilamino-, dialkilamino-, alkoxi-, halogénalkoxi-, alkiltio- és/vagy halogénalkiltio-csoporttal szubsztituált alkil-
- 20 vagy alkenilcsoport; adott esetben egy vagy több, azonos vagy eltérő szubsztituenssel, éspedig halogénatommal, ciano-, alkil-, halogénalkil-, alkoxi-, halogénalkoxi-, alkiltio- és/vagy halogénalkiltio-csoporttal szubsztituált cikloalkil-, cikloalkilalkil-, aril-, arilalkil-, telített vagy telítetlen, 5-10-tagú heterociklil- vagy heterociklilalkilcsoport.
- 25 R^1 különösen előnyös jelentése fluor-, klór-, brómatom vagy metilcsoport.
- R^2 különösen előnyös jelentése hidrogén-, fluor-, klór- vagy brómatom.
- R^3 különösen előnyös jelentése fluor-, klór- vagy brómatom, adott esetben egy-nyolc halogénatommal szubsztituált 1-6 szénatomos alkil-, 1-6 szénatomos alkoxi- vagy 1-6 szénatomos alkiltiocsoport.
- 30 m különösen előnyös jelentése 0, 1, 2 vagy 3.
- Q különösen előnyös jelentése (a), (b), (c), (d), (e) vagy (f) képletű csoport.
- R^4 különösen előnyös jelentése hidrogén-, fluor-, klór-, brómatom, ciano-,

- formil-, nitro-, tri(1-6 szénatomos alkil)szilil-csoport; adott esetben egy vagy több, azonos vagy eltérő szubsztituenssel, és/pedig halogénatommal, cianocsoporttal és/vagy $-NR^7R^8$ általános képletű csoporttal szubsztituált
- 5 1-20 szénatomos alkil-, 2-20 szénatomos alkenil-, 1-20 szénatomos alkoxi- vagy 2-20 szénatomos alkeniloxics csoport; pentafluortio-, $-S(O)_pR^6$, $-NR^7R^8$, $-COR^6$, $-CO_2R^6$, $-CONR^9R^{10}$, $-N(R^{11})COR^{12}$ vagy $-C(R^{13})=N-OR^{14}$ általános képletű csoport; vagy adott esetben egy vagy több, azonos vagy eltérő szubsztituenssel, és/pedig halogénatommal, ciano- nitro-, 1-6 szénatomos alkil-, 1-6 szénatomos halogénalkil-, 2-6 szénatomos alkenil-, 2-6 szén-
- 10 atomos halogénalkenil-, 1-6 szénatomos alkoxi-, 1-6 szénatomos halogénalkoxi-, 1-6 szénatomos alkiltio- és/vagy 1-6 szénatomos halogénalkiltio-csoporttal szubsztituált 3-12 szénatomos cikloalkil-, (3-7 szénatomos cikloalkil)-(1-4 szénatomos alkil)-, aril-, aril-(1-4 szénatomos alkil)-, telített vagy telítetlen, 5-10-tagú heterociklil- vagy heterociklil-(1-4 szénatomos alkil)-
- 15 csoport, ahol a heterociklilcsoport 1-4 heteroatomot tartalmazhat, amelyek közül 0-4 nitrogénatom, 0-2 nem-szomszédos oxigénatom és/vagy 0-2 nem-szomszédos kénatom lehet (így különösen tetrazolil-, furil-, furfuril-, benzofuril-, tetrahydrofuril-, tienil-, tenil-, benzotienil-, tiolanil-, pirrolil-, indolil-, pirrolinil-, pirrolidino-, pirrolidinil-, oxazolil-, benzoxazolil-, izoxazo-
- 20 lil-, imidazolil-, pirazolil-, tiazolil-, benzotiazolil-, tiazolidinil-, piridinil-, pirimidinil-, piridazil-, pirazinil-, piperidinil-, piperidino-, morfolinil-, tiomorfolinil-, morfolino-, tiomorfolino-, triazinil-, triazolil-, kinolinil- vagy izokinolinilcsoport).
- R^4 különösen előnyös jelentése $-CH=NOH$ képletű csoport, formilcsoport; vagy
- 25 adott esetben 1-4, azonos vagy eltérő fluor-, klór- vagy brómatommal és/vagy 1-2 szénatomos alkilcsoporttal szubsztituált 3-6 szénatomos cikloalkiloxi- vagy (3-6 szénatomos cikloalkil)-(1-4 szénatomos alkoxi)-csoport.
- R^5 különösen előnyös aril-(1-4 , ciano-, formil-, nitro-, tri(1-6 szénatomos
- 30 alkil)szililcsoport; adott esetben 1-13 halogénatommal szubsztituált 1-6 szénatomos alkil-, 2-6 szénatomos alkenil-, 1-6 szénatomos alkoxi-, 2-6 szénatomos alkeniloxics csoport; pentafluortiocsoport, $-S(O)_pR^6$, $-NR^7R^8$,

- COR⁶, -CO₂R⁶, -CONR⁹R¹⁰ vagy -N(R¹¹)COR¹² általános képletű csoport.
 p különösen előnyös jelentése 0, 1 vagy 2.
 n különösen előnyös jelentése 0, 1, 2 vagy 3, ahol az R⁵ szubsztituensek jelentése azonos vagy eltérő, amikor n értéke 2 vagy 3.
 5 r különösen előnyös jelentése 0, 1 vagy 2, ahol az R⁵ szubsztituensek jelentése azonos vagy eltérő, amikor r értéke 2.
 R⁶ különösen előnyös jelentése adott esetben egy vagy több, azonos vagy eltérő szubsztituenssel, éspedig halogénatommal és/vagy -NR⁷R⁸ általános képletű csoporttal szubsztituált 1-20 szénatomos alkilcsoport, adott
 10 esetben egy vagy több, azonos vagy eltérő szubsztituenssel, éspedig halogénatommal, ciano-, 1-6 szénatomos alkil-, 1-6 szénatomos halogénalkil-, 1-6 szénatomos alkoxi-, 1-6 szénatomos halogénalkoxi-, 1-6 szénatomos alkiltio- és/vagy 1-6 szénatomos halogénalkiltio-csoporttal szubsztituált 3-6 szénatomos cikloalkil-, aril- vagy aril-(1-4 szénatomos alkil)-
 15 csoport.
 R⁶ további különösen előnyös jelentése egyszeresen vagy többszörösen, azonos vagy eltérő szubsztituenssel szubsztituált 1-20 szénatomos alkilcsoport, ahol a szubsztituens 1-6 szénatomos alkoxi-, 1-6 szénatomos alkiltio-, 1-6 szénatomos halogénalkoxi- vagy 1-6 szénatomos halogénalkiltio-csoport lehet.
 20 R⁷ és R⁸ különösen előnyös jelentése, egymástól függetlenül hidrogénatom, -SO₂R⁶, -COR⁶, -CO₂R⁶ általános képletű csoport; adott esetben egy vagy több, azonos vagy eltérő szubsztituenssel, éspedig halogénatommal, 1-6 szénatomos alkilkarbonil-, 1-6 szénatomos alkilkarboniloxi-, 1-6 szénatomos alkilamino-, di(1-6 szénatomos alkil)amino-, 1-6 szénatomos alkoxi-,
 25 1-6 szénatomos halogénalkoxi-, 1-6 szénatomos alkiltio- és/vagy 1-6 szénatomos halogénalkiltio-csoporttal szubsztituált 1-20 szénatomos alkil- vagy 2-20 szénatomos alkenilcsoport; adott esetben 1-4, azonos vagy eltérő szubsztituenssel, éspedig halogénatommal, ciano-, 1-6 szénatomos alkil-,
 30 1-6 szénatomos halogénalkil-, 1-6 szénatomos alkoxi-, 1-6 szénatomos halogénalkoxi-, 1-6 szénatomos alkiltio- és/vagy 1-6 szénatomos halogénalkiltio-csoporttal szubsztituált 3-12 cikloalkil-, (3-7 szénatomos cik-

- loalkil)-(1-4 szénatomos alkil)-, aril-, aril-(1-4 szénatomos alkil)-, telített vagy telítetlen, 5-10-tagú heterociklil- vagy heterociklil-(1-4 szénatomos alkil)-csoport, ahol a heterociklilcsoport 1-4 heteroatomot tartalmazhat, amelyek közül 0-4 nitrogénatom, 0-2 nem-szomszédos oxigénatom és/vagy 0-2 nem-szomszédos kénatom lehet (így különösen tetrazolil-, furil-, furfuril-, benzofuril-, tetrahidrofuril-, tienil-, tenil-, benztienil-, tiolanil-, pirrolil-, indolil-, pirrolinil-, pirrolidinil-, oxazolil-, benzoxazolil-, izoxazolil-, imidazolil-, pirazolil-, tiazolil-, benzotiazolil-, tiazolidinil-, piridinil-, pirimidinil-, piridazil-, pirazinil-, piperidinil-, morfolinil-, tiomorfolinil-, triazinil-, triazolil-, kinolinil- vagy izokinolinilcsoport lehet).
- 5
- R^7 és R^8 további különösen előnyös jelentése egymástól függetlenül adott esetben 1-4, azonos vagy eltérő szubsztituenssel, éspedig halogénatommal, ciano-, 1-6 szénatomos alkil-, 1-6 szénatomos halogénalkil-, 1-6 szénatomos alkoxi-, 1-6 szénatomos halogénalkoxi-, 1-6 szénatomos alkiltio- és/vagy 1-6 szénatomos halogénalkiltio-csoporttal szubsztituált heterociklil-(1-4 szénatomos alkil)-csoport, ahol a heterociklilcsoport 1-4 heteroatomot tartalmazhat, amelyek közül 0-4 nitrogénatom, 0-2 nem-szomszédos oxigénatom és/vagy 0-2 nem-szomszédos kénatom lehet (így különösen piridinilmetil-, piridiniletil-, pirimidinilmetil-, pirimidiniletil-, piridazilmetil-, piridaziletil-, pirazinilmetil vagy piraziniletilcsoport).
- 10
- R^7 és R^8 további különösen előnyös jelentése együttesen egy adott esetben egy vagy több, azonos vagy eltérő szubsztituenssel, éspedig halogénatommal, ciano-, 1-6 szénatomos alkoxi-, 1-6 szénatomos halogénalkoxi-, 1-6 szénatomos alkiltio- és/vagy 1-6 szénatomos halogénalkiltio-csoporttal szubsztituált 2-12 szénatomos alkenilén- vagy jelentése adott esetben egy vagy több, azonos vagy eltérő szubsztituenssel, éspedig halogénatommal, ciano-, 1-6 szénatomos alkil-, 1-6 szénatomos halogénalkil-, 1-6 szénatomos alkoxi-, 1-6 szénatomos halogénalkoxi-, 1-6 szénatomos alkiltio- és/vagy 1-6 szénatomos halogénalkiltio-csoporttal szubsztituált 3-12 szénatomos alkiléncsoportot alkothatnak, ahol az alkilénlánc minden esetben -O-, -S- atommal vagy $-NR^{15}$ - csoporttal lehet megszakítva.
- 15
- R^7 és R^8 további különösen előnyös jelentése együttesen egy adott esetben
- 20
- 25
- 30

- egy vagy több, azonos vagy eltérő szubsztituenssel szubsztituált 3-12 szénatomos alkilénecsoporthat alkothatnak, ahol a szubsztituens 1-4 szénatomos alkoxikarbonil- vagy oxi-(1-4 szénatomos alkilén)-oxi-csoport lehet.
- 5 R^7 és R^8 további különösen előnyös jelentése együttesen egy olyan 3-8 szénatomos alkilénecsoporthat alkothatnak, ahol az alkilénlánc $C=O$ vagy $C=NO$ -alkil-csoporttal lehet megszakítva.
- R^9 és R^{10} különösen előnyös jelentése egymástól függetlenül hidrogénatom, $-SO_2R^6$ általános képletű csoport; adott esetben 1-13, azonos vagy eltérő szubsztituenssel, éspedig halogénatommal, 1-6 szénatomos alkilamino-,
 10 di(1-6 szénatomos alkil)amino-, 1-6 szénatomos alkoxi-, 1-6 szénatomos halogénalkoxi-, 1-6 szénatomos alkiltio- és/vagy 1-6 szénatomos halogénalkiltiocsoporttal szubsztituált 1-6 szénatomos alkil- vagy 2-6 szénatomos alkenilcsoport; adott esetben 1-4, azonos vagy eltérő szubsztituenssel, éspedig halogénatommal, ciano-, 1-6 szénatomos alkil-, 1-6 szénatomos halogénalkil-, 1-6 szénatomos alkoxi-, 1-6 szénatomos halogénalkoxi-, 1-6 szénatomos alkiltio- és/vagy 1-6 szénatomos halogénalkiltio-csoporttal szubsztituált 3-7 szénatomos cikloalkil-, (3-7 szénatomos cikloalkil)-(1-4 szénatomos alkil)-, aril-, aril-(1-4 szénatomos alkil)-, telített vagy telítetlen, 5-10-tagú heterociklil- vagy heterociklil-(1-4 szénatomos alkil)-csoport, ahol a
 15 heterociklilcsoport 1-4 heteroatomot tartalmazhat, amelyek közül 0-4 nitrogénatom, 0-2 nem-szomszédos oxigénatom és/vagy 0-2 nem-szomszédos kénatom lehet (így különösen tetrazolil-, furil-, furfuril-, benzofuril-, tetrahydrofuril-, tienil-, tenil-, benztienil-, tiolanil-, pirrolil-, indolil-, pirrolinil-, pirrolidinil-, oxazolil-, benzoxazolil-, izoxazolil-, imidazolil-, pirazolil-, tiazolil-, benzotiazolil-,
 20 tiazolidinil-, piridinil-, pirimidinil-, piridazil-, pirazinil-, piperidinil-, morfolinil-, tio-morfolinil-, triazinil-, triazolil-, kinolinil- vagy izokinolinilcsoport).
- R^9 és R^{10} további különösen előnyös jelentése együttesen egy, az alkilénláncban adott esetben 1-4, azonos vagy eltérő szubsztituenssel, éspedig halogénatommal, ciano-, 1-6 szénatomos alkil-, 1-6 szénatomos halogénalkil-, 1-6 szénatomos alkoxi-, 1-6 szénatomos halogénalkoxi-, 1-6 szénatomos alkiltio- és/vagy 1-6 szénatomos halogénalkiltio-csoporttal szubsztituált 3-6 szénatomos alkilénecsoporthat, $-(CH_2)_2-O-(CH_2)_2-$, $-(CH_2)_2-S-(CH_2)_2-$ vagy
- 30

$-(CH_2)_2-N(R^{15})-(CH_2)_2-$ képletű csoportot alkothatnak.

R^{11} és R^{12} különösen előnyös jelentése, egymástól függetlenül hidrogénatom, adott esetben 1-13, azonos vagy eltérő szubsztituenssel, és pedig halogén-
atommal, ciano-, 1-6 szénatomos alkoxi-, 1-6 szénatomos alkiltio-csoporttal
5 szubsztituált 1-6 szénatomos alkilcsoport, adott esetben 1-8, azonos vagy el-
térő szubsztituenssel, és pedig halogénatommal, ciano-, 1-6 szénatomos
alkil-, 1-6 szénatomos halogénalkil-, 1-6 szénatomos alkoxi-, 1-6 szénatomos
halogénalkoxi-, 1-6 szénatomos alkiltio- és/vagy 1-6 szénatomos halogén-
alkiltio-csoporttal szubsztituált 3-7 szénatomos cikloalkil-, (3-7 szénatomos
10 cikloalkil)-(1-4 szénatomos alkil)-, aril- vagy aril-(1-4 szénatomos alkil)-
csoport.

R^{11} és R^{12} további különösen előnyös jelentése együttesen egy adott esetben
1-8, azonos vagy eltérő szubsztituenssel, és pedig halogénatommal, 1-6
szénatomos alkil-, 1-6 szénatomos halogénalkil-, 1-6 szénatomos alkoxi-,
15 1-6 szénatomos halogénalkoxi-, 1-6 szénatomos alkiltio-, 1-6 szénatomos
halogénalkiltio-csoporttal szubsztituált 3-10 szénatomos alkilén- vagy 3-10
szénatomos alkeniléncsoport.

R^{13} és R^{14} egymástól függetlenül, különösen előnyös jelentése hidrogénatom,
adott esetben egy vagy több halogénatommal szubsztituált 1-6 szénato-
20 mos alkil- vagy 2-6 szénatomos alkenilcsoport.

R^{15} különösen előnyös jelentése hidrogénatom, $-SO_2R^6$, $-COR^6$ vagy $-CO_2R^6$
általános képletű csoport; adott esetben egy vagy több, azonos vagy eltérő
szubsztituenssel, és pedig halogénatommal, ciano-, 1-6 szénatomos alkil-
amino-, di(1-6 szénatomos alkil)amino-, 1-6 szénatomos alkoxi-, 1-6 szén-
25 atomos halogénalkoxi-, 1-6 szénatomos alkiltio- és/vagy 1-6 szénatomos
halogénalkiltiocsoporttal szubsztituált 1-20 szénatomos alkil- vagy 2-20
szénatomos alkenilcsoport; adott esetben 1-4, azonos vagy eltérő
szubsztituenssel, és pedig halogénatommal, ciano-, 1-6 szénatomos alkil-,
1-6 szénatomos halogénalkil-, 1-6 szénatomos alkoxi-, 1-6 szénatomos
30 halogénalkoxi-, 1-6 szénatomos alkiltio- és/vagy 1-6 szénatomos halogén-
alkiltiocsoporttal szubsztituált 3-12 szénatomos cikloalkil-, (3-7 szénatomos
cikloalkil)-(1-4 szénatomos alkil)-, aril-, aril-(1-4 szénatomos alkil)-csoport,

- telített vagy telítetlen, 5-10-tagú heterociklil- vagy heterociklil-(1-4 szénatomos alkil)-csoport ahol a heterociklilcsoport 1-4 heteroatomot tartalmazhat, amelyek közül 0-4 nitrogénatom, 0-2 nem-szomszédos oxigénatom és/vagy 0-2 nem-szomszédos kénatom lehet (így különösen
- 5 tetrazolil-, furil-, furfuril-, benzofuril-, tetrahydrofuril-, tienil-, tenil-, benzo-tienil-, tiolanil-, pirrolil-, indolil-, pirrolinil-, pirrolidinil-, oxazolil-, benzoxazolil-, izoxazolil-, imidazolil-, pirazolil-, tiazolil-, benzotiazolil-, tiazolidinil-, piridinil-, pirimidinil-, piridazil-, pirazinil-, piperidinil-, morfolinil-, tiomorfolinil-, triazinil-, triazolil-, kinolinil- vagy izokinolinilcsoport).
- 10 R^1 nagyon különösen előnyös jelentése fluor-, klóratom vagy metilcsoport.
 R^2 nagyon különösen előnyös jelentése hidrogén-, fluor- vagy klóratom.
 R^3 nagyon különösen előnyös jelentése fluor-, klóratom, 1-4 szénatomos alkil-, 1-4 szénatomos alkoxi-, 1-4 szénatomos alkiltio-, 1-4 szénatomos halogénalkil-, 1-4 szénatomos halogénalkoxi-, 1-4 szénatomos halogénalkiltiocsoport, amelyek mindegyike 1-9 fluor-, klór- és/vagy brómatommal lehet szubsztituálva.
- 15 m nagyon különösen előnyös jelentése 0, 1 vagy 2.
Q nagyon különösen előnyös jelentése (a), (b), (c), (d), (e) vagy (f) képletű csoport.
- 20 R^4 nagyon különösen előnyös jelentése hidrogén-, fluor-, klór- vagy brómatom, ciano-, formil-, nitro-, tri(1-4 szénatomos alkil)zililcsoport; adott esetben egy vagy több, azonos vagy eltérő szubsztituenssel, és pedig fluor-, klór- és/vagy brómatommal, cianocsoporttal és/vagy $-NR^7R^8$ általános képletű csoporttal szubsztituált 1-16 szénatomos alkil-, 2-16 szénatomos alkenil-,
- 25 1-16 szénatomos alkoxi-, 1-16 szénatomos alkeniloxics csoport; $-S(O)_pR^6$, $-NR^7R^8$, $-COR^6$, $-CO_2R^6$, $-CONR^9R^{10}$ vagy $-N(R^{11})COR^{12}$ általános képletű csoport; vagy adott esetben 1-3, azonos vagy eltérő szubsztituenssel, és pedig fluor-, klór- és/vagy brómatommal, cianocsoporttal, 1-4 szénatomos alkil-, 1-4 szénatomos halogénalkil-, 2-6 szénatomos alkenil-, 2-6 szénatomos halogénalkenil-, 1-4 szénatomos alkoxi-, 1-4 szénatomos halogénalkoxi-, 1-4 szénatomos alkiltio-, 1-4 szénatomos halogénalkiltiocsoporttal szubsztituált 3-10 szénatomos cikloalkil-, (3-6 szénatomos cik-
- 30

loalkil)-(1-4 szénatomos alkil)-, fenil-, benzil-, feniletil-, tetrazolil-, furil-, fur-
 furil-, benzofuril-, tetrahidrofuril-, tienil-, tenil-, benztienil-, tiolanil-, pirrolil-,
 indolil-, pirrolinil-, pirrolidino-, pirrolidinil-, oxazolil-, benzoxazolil-, izoxazo-
 5 lil-, imidazolil-, pirazolil-, tiazolil-, benzotiazolil-, tiazolidinil-, piridinil-,
 pirimidinil-, piridazil-, pirazinil-, piperidinil-, piperidino-, morfolinil-,
 tiomorfolinil-, morfolino-, tiomorfolino-, triazinil-, triazolil-, kinolinil- vagy
 izokinolinilcsoport.

R^4 további nagyon különösen előnyös jelentése -CHNOH, formilcsoport; adott
 esetben 1-3, azonos vagy eltérő fluor- vagy klóratommal és/vagy metil-
 10 csoporttal szubsztituált ciklopropiloxi-, ciklobutiloxi-, ciklopentiloxi-, ciklo-
 hexiloxi-, ciklopropilmetoxi-, ciklobutilmetoxi-, ciklopentilmetoxi- vagy
 ciklohexilmetoxicsoport.

R^5 nagyon különösen előnyös jelentése fluor- vagy klóratom, trimetilszilil-
 csoport; adott esetben 1-9, azonos vagy eltérő fluor-, klór- és/vagy bróm-
 15 atommal szubsztituált 1-4 szénatomos alkil-, 2-6 szénatomos alkenil-, 1-4
 szénatomos alkoxi-, 2-6 szénatomos alkeniloxicsoport; vagy $-S(O)_pR^6$,
 $-NR^7R^8$, $-COR^6$, $-CO_2R^6$ vagy $-CONR^9R^{10}$ általános képletű csoport.

p nagyon különösen előnyös jelentése 0, 1 vagy 2.

n nagyon különösen előnyös jelentése 0, 1 vagy 2 ahol az R^5 szubsztituensek
 20 jelentése azonos vagy eltérő, amikor n értéke 2.

r nagyon különösen előnyös jelentése 0, 1 vagy 2, ahol az R^5 szubsztituensek
 jelentése azonos vagy eltérő, amikor r értéke 2.

R^6 nagyon különösen előnyös jelentése adott esetben egy vagy több, azonos
 vagy eltérő szubsztituenssel, éspedig fluor-, klór- vagy brómatommal
 25 és/vagy $-NR^7R^8$ általános képletű csoporttal szubsztituált 1-10 szénatomos
 alkilcsoport; adott esetben 1-4, azonos vagy eltérő szubsztituenssel, és-
 pedig fluor-, klór- vagy brómatommal, ciano-, 1-4 szénatomos alkil-, 1-4
 szénatomos halogénalkil-, 1-4 szénatomos alkoxi-, 1-4 szénatomos
 halogénalkoxi-, 1-4 szénatomos alkiltio- és/vagy 1-4 szénatomos halogén-
 30 alkiltio-csoporttal szubsztituált ciklopropil-, ciklopentil-, ciklohexil-, fenil-
 vagy benzilcsoport.

R^6 további nagyon különösen előnyös jelentése 1-3, azonos vagy eltérő

szubsztituenssel szubsztituált 1-10 szénatomos alkilcsoport, ahol a szubsztituens 1-4 szénatomos alkoxi-, 1-4 szénatomos alkiltio-, 1-4 szénatomos halogénalkoxi- és/vagy 1-4 szénatomos halogénalkiltiocsoport lehet.

- 5 R^7 és R^8 nagyon különösen előnyös jelentése, egymástól függetlenül hidrogénatom, $-SO_2R^6$, $-COR^6$, $-CO_2R^6$ általános képletű csoport; adott esetben egy vagy több, azonos vagy eltérő szubsztituenssel, éspedig fluor-, klór- vagy brómatommal, 1-4 szénatomos alkilkarbonil-, 1-4 szénatomos alkilkarboniloxi-, 1-4 szénatomos alkilamino-, di(1-4 szénatomos alkil)amino-,
10 1-4 szénatomos alkoxi-, 1-4 szénatomos halogénalkoxi-, 1-4 szénatomos alkiltio- és/vagy 1-4 szénatomos halogénalkiltio-csoporttal szubsztituált 1-16 szénatomos alkil- vagy 2-16 szénatomos alkenilcsoport; jelentése adott esetben 1-3, azonos vagy eltérő szubsztituenssel, éspedig fluor-, klór- vagy brómatommal, ciano-, 1-4 szénatomos alkil-, 1-4 szénatomos
15 halogénalkil-, 1-4 szénatomos alkoxi-, 1-4 szénatomos halogénalkoxi-, 1-4 szénatomos alkiltio- és/vagy 1-4 szénatomos halogénalkiltiocsoporttal szubsztituált 3-10 szénatomos cikloalkil-, (3-6 szénatomos cikloalkil)-(1-4 szénatomos alkil)-, fenil-, benzil-, feniletil-, tetrazolil-, furil-, furfuril-, benzofuril-, tetrahidrofuril-, tienil-, tenil-, benzotienil-, tiolanil-, pirrolil-,
20 indolil-, pirrolinil-, pirrolidinil-, oxazolil-, benzoxazolil-, izoxazolil-, imidazolil-, pirazolil-, tiazolil-, benzotiazolil-, tiazolidinil-, piridinil-, pirimidinil-, piridazil-, pirazinil-, piperidinil-, morfolinil-, tiomorfolinil-, triazinil-, triazolil-, kinolinil- vagy izokinolinilcsoport.

- R^7 és R^8 további nagyon különösen előnyös jelentése egymástól függetlenül
25 adott esetben 1-3, azonos vagy eltérő szubsztituenssel, éspedig fluor-, klór- vagy brómatommal, ciano-, 1-4 szénatomos alkil-, 1-4 szénatomos halogénalkil-, 1-4 szénatomos alkoxi-, 1-4 szénatomos halogénalkoxi-, 1-4 szénatomos alkiltio- és/vagy 1-4 szénatomos halogénalkiltiocsoporttal szubsztituált piridinilmetil-, piridiniletil-, pirimidinilmetil-, pirimidiniletil-, piri-
30 dazilmetil-, piridaziletil-, pirazinilmetil- vagy piraziniletilcsoport.

R^7 és R^8 további nagyon különösen előnyös jelentése együttesen egy adott esetben egy vagy több, azonos vagy eltérő szubsztituenssel, éspedig flu-

- or-, klór- vagy brómatommal, 1-4 szénatomos alkoxi-, 1-4 szénatomos halogénalkoxi-, 1-4 szénatomos alkiltio- és/vagy 1-4 szénatomos halogénalkiltiocsoporttal szubsztituált 2-10 szénatomos alkenilén-csoport; vagy adott esetben egy vagy több, azonos vagy eltérő szubsztituenssel, éspe-
- 5 dig fluor- vagy klóratommal, ciano-, 1-4 szénatomos alkil-, 1-4 szénatomos halogénalkil-, 1-4 szénatomos alkoxi-, 1-4 szénatomos halogénalkoxi-, 1-4 szénatomos alkiltio-, 1-4 szénatomos halogénalkiltiocsoporttal szubsztituált 3-10 szénatomos alkilén-csoport, ahol az alkilénlánc minden esetben -O-, -S- atommal vagy -NR¹⁵- csoporttal lehet megszakítva.
- 10 R⁷ és R⁸ további nagyon különösen előnyös jelentése együttesen egy 1-3, azonos vagy eltérő szubsztituenssel szubsztituált 3-10 szénatomos alkilén-csoport, ahol a szubsztituens n-propoxi-karbonil-, izopropoxi-karbonil-, etoxi-karbonil-, metoxi-karbonil-, oxipropilénoxi-, oxietilénoxi- és/vagy oximetilénoxics csoport lehet.
- 15 R⁷ és R⁸ további nagyon különösen előnyös jelentése együttesen egy 3-6 szénatomos alkilén-csoport, ahol az alkilénlánc C=O vagy C=NO-(1-4 szénatomos alkil)-csoporttal lehet megszakítva.
- R⁹ és R¹⁰ nagyon különösen előnyös jelentése, egymástól függetlenül hidrogénatom, -SO₂R⁶ általános képletű csoport; adott esetben 1-9, azonos
- 20 vagy eltérő szubsztituenssel, éspe dig fluor-, klór- és/vagy brómatommal, 1-4 szénatomos alkilamino-, di(1-4 szénatomos alkil)amino-, 1-4 szénatomos alkoxi-, 1-4 szénatomos halogénalkoxi-, 1-4 szénatomos alkiltio-, 1-4 szénatomos halogénalkiltio-csoporttal szubsztituált 1-4 szénatomos alkil- vagy 2-6 szénatomos alkenil-csoport; adott esetben 1-3, azonos vagy eltérő
- 25 szubsztituenssel, éspe dig fluor-, klór- és/vagy brómatommal, 1-4 szénatomos alkil-, ciano-, 1-4 szénatomos halogénalkil-, 1-4 szénatomos alkoxi-, 1-4 szénatomos halogénalkoxi-, 1-4 szénatomos alkiltio-, 1-4 szénatomos halogénalkiltiocsoporttal szubsztituált 3-6 szénatomos cikloalkil-, (3-6 szénatomos cikloalkil)-(1-4 szénatomos alkil)-, fenil-, benzil-, feniletil-,
- 30 tetrazolil-, furil-, furfuril-, benzofuril-, tetrahidrofuril-, tienil-, tenil-, benzo-tienil-, tiolanil-, pirrolil-, indolil-, pirrolinil-, pirrolidinil-, oxazolil-, benzoxazolil-, izoxazolil-, imidazolil-, pirazolil-, tiazolil-, benzotiazolil-, tiazolidinil-,

piridinil-, pirimidinil-, piridazil-, pirazinil-, piperidinil-, morfolinil-, tiomorfolinil-, triazinil-, triazolil-, kinolinil- vagy izokinolinilcsoport.

- 5 R^9 és R^{10} további nagyon különösen előnyös jelentése együttesen egy az alkil-
nláncban 1-4, azonos vagy eltérő szubsztituenssel, éspedig fluor- vagy klór-
atommal, ciano-, 1-4 szénatomos alkil-, 1-4 szénatomos halogénalkil-, 1-4
szénatomos alkoxi-, 1-4 szénatomos halogénalkoxi-, 1-4 szénatomos alkiltio-,
1-4 szénatomos halogénalkiltiocsoporttal szubsztituált 4-5 szénatomos
alkiléncsoport, $-(CH_2)_2-O-(CH_2)_2-$, $-(CH_2)_2-S-(CH_2)_2-$, $-(CH_2)_2-N(R^{15})-(CH_2)_2-$
általános képletű csoport.
- 10 R^{11} és R^{12} nagyon különösen előnyös jelentése, egymástól függetlenül hidro-
génatom, adott esetben 1-9, azonos vagy eltérő szubsztituenssel, éspedig
fluor-, klór- vagy brómatommal, 1-4 szénatomos alkoxi-, 1-4 szénatomos
alkiltiocsoporttal szubsztituált 1-6 szénatomos alkilcsoport; adott esetben 1-4,
azonos vagy eltérő szubsztituenssel, éspedig fluor-, klór- vagy brómatom-
mal, 1-4 szénatomos alkil-, 1-4 szénatomos halogénalkil-, 1-4 szénatomos
15 alkoxi-, 1-4 szénatomos halogénalkoxi-, 1-4 szénatomos alkiltio-, 1-4 szén-
atomos halogénalkiltiocsoporttal szubsztituált 3-6 szénatomos cikloalkil-, (3-6
szénatomos cikloalkil)-(1-4 szénatomos alkil)-, fenil-, benzil- vagy feniletil-
csoport.
- 20 R^{11} és R^{12} további nagyon különösen előnyös jelentése együttesen egy adott
esetben 1-4, azonos vagy eltérő szubsztituenssel, éspedig fluor-, klór-,
brómatommal, 1-4 szénatomos alkil-, 1-4 szénatomos halogénalkil-, 1-4 szén-
atomos alkoxi-, 1-4 szénatomos halogénalkoxi-, 1-4 szénatomos alkiltio-, 1-4
szénatomos halogénalkiltiocsoporttal szubsztituált 3-8 szénatomos alkilén-
25 vagy 3-8 szénatomos alkeniléncsoport.
- R^{15} nagyon különösen előnyös jelentése hidrogénatom, $-SO_2R^6$, $-COR^6$ vagy
 $-CO_2R^6$ általános képletű csoport; adott esetben egy vagy több, azonos vagy
eltérő szubsztituenssel, éspedig fluor-, klór- vagy brómatommal, ciano-,
metilamino-, etilamino-, di(1-6 szénatomos alkil)amino-, 1-4 szénatomos
30 alkoxi-, 1-4 szénatomos halogénalkoxi-, 1-4 szénatomos alkiltio-, 1-4 szén-
atomos halogénalkiltiocsoporttal szubsztituált 1-16 szénatomos alkil vagy 2-
16 szénatomos alkenilcsoport; adott esetben 1-3, azonos vagy eltérő

szubsztituenssel, éspedig fluor-, klór- vagy brómatommal, ciano-, 1-4 szénatomos alkil-, 1-4 szénatomos halogénalkil-, 1-4 szénatomos alkoxi-, 1-4 szénatomos halogénalkoxi-, 1-4 szénatomos alkiltio-, 1-4 szénatomos halogénalkiltiocsoporttal szubsztituált 3-10 szénatomos cikloalkil-, (3-6 szénatomos cikloalkil)-(1-4 szénatomos alkil)-, fenil-, benzil-, feniletíl-, tetrazolil-, furil-, furfuril-, benzofuril-, tetrahidrofuril-, tienil-, tenil-, benztienil-, tiolanil-, pirrolil-, indolil-, pirrolinil-, pirrolidinil-, oxazolil-, benzoxazolil-, izoxazolil-, imidazolil-, pirazolil-, tiazolil-, benzotiazolil-, tiazolidinil-, piridinil-, pirimidinil-, piridazil-, pirazinil-, piperidinil-, morfolinil-, tiomorfolinil-, triazinil-, triazolil-, kinolinil- vagy izokinolinilcsoport.

R¹ legelőnyösebb jelentése fluor- vagy klóratom.

R² legelőnyösebb jelentése hidrogén- vagy fluoratom.

R³ legelőnyösebb jelentése fluor- vagy klóratom, metil-, etil-, n-propil-, izopropil-, n-butyl-, izobutyl-, *sze*k-butyl; *terc*-butyl-, trifluormetil-, trifluoretíl-, metoxi-, etoxi-, n-propoxi-, izopropoxi-, n-butoxi-, izobutoxi-, *sze*k-butoxi-, *terc*-butoxi-, trifluormetoxi-, trifluoretoxi-, metiltio-, etiltio-, n-propiltio-, izopropiltio-, n-butiltio-, izobutiltio-, *sze*k-butiltio-, *terc*-butiltio-, trifluormetiltio- vagy trifluoretiltiocsoport.

m legelőnyösebb jelentése 0 vagy 1.

Q legelőnyösebb jelentése (h), (i), (j), (k), (l) vagy (m) általános képletű csoport.

R⁴ legelőnyösebb jelentése hidrogén-, fluor-, klór- vagy brómatom, ciano-, formilcsoport; adott esetben egy vagy több, azonos vagy eltérő szubsztituenssel, éspedig fluor-, klór- vagy brómatommal, cianocsoporttal és/vagy NR⁷R⁸ általános képletű csoporttal szubsztituált 1-16 szénatomos alkil-, 2-16 szénatomos alkenil-, 1-16 szénatomos alkoxi-, 2-16 szénatomos alkeniloxics csoport; -S(O)_pR⁶, -NR⁷R⁸, -COR⁶, -CO₂R⁶, -CONR⁹R¹⁰, -N(R¹¹)COR¹² általános képletű csoport; vagy adott esetben 1-3, azonos vagy eltérő szubsztituenssel, éspedig fluor-, klór- vagy brómatommal, ciano-, metil-, etil-, n-propil-, izopropil-, -CF₃, -CHF₂, -CClF₂, -CF₂CHFCl, -CF₂CH₂F, -CF₂CCl₃, -CH₂CF₃, -CF₂CHF₂CF₃, -CH₂CF₂H, -CH₂CF₂CF₃, -CF₂CF₂H, -CF₂CHF₂CF₃, vinil-, allil-, 1-propenil-, butenil-, -CF=CHF,

- CF=CH₂, -CF=CCl₂, -CH=CF₂, -CF₂CF=CF₂, -CH=CFH, -CH₂CF=CF₂,
 -CF=CF₂, -CF₂CH=CF₂, metoxi-, etoxi-, n-propoxi-, izopropoxi-, n-butoxi-,
 izobutoxi-, *szek*-butoxi-, *terc*-butoxi-, trifluormetoxi-, difluormetoxi-, klór-
 difluormetoxi-, trifluoretoxi-, metiltio-, etiltio-, n-propiltio-, izopropiltio-,
 5 n-butiltio-, izobutiltio-, *szek*-butiltio-, *terc*-butiltio-, trifluormetiltio-, difluor-
 metiltio-, klór-difluormetiltio- és/vagy trifluoretiltiocsoporttal szubsztituált
 ciklopropil-, ciklopentil-, ciklohexil-, ciklopropilmetil-, ciklopentilmetil-, ciklo-
 hexilmetil-, fenil-, benzil-, feniletil-, tetrazolil-, furil-, furfuril-, benzofuril-, tet-
 rahidrofuril-, tienil-, tenil-, benzotienil-, tiolanil-, pirrolil-, indolil-, pirrolinil-,
 10 pirrolidino-, pirrolidinil-, oxazolil-, benzoxazolil-, izoxazolil-, imidazolil-, pira-
 zolil-, tiazolil-, benzotiazolil-, tiazolidinil-, piridinil-, pirimidinil-, piridazil-, pi-
 razinil-, piperidinil-, piperidino-, morfolinil-, tiomorfolinil-, morfolino-, tiomor-
 folino-, triazinil-, triazolil-, kinolinil- vagy izokinolinilcsoport.
- R⁴ további legelőnyösebb jelentése -CH=NOH, formil-, ciklopropiloxi-, ciklobu-
 15 tiloxi-, ciklopentiloxi-, ciklohexiloxi-, ciklopropilmetoxi-, ciklobutilmetoxi-, cik-
 lopentilmetoxi- vagy ciklohexilmetoxicssoport.
- p legelőnyösebb jelentése 0, 1 vagy 2.
- R⁶ legelőnyösebb jelentése metil-, etil-, n-propil-, izopropil-, n-butil-, izobutil-,
szek-butil-, *terc*-butil-, pentil-, hexil-, -CF₃, -CHF₂, -CCl₃, -CCl₂F, dimeti-
 20 laminometil-, dimetilaminoetil-, dietilaminometil-, dietilaminoetil-, ciklo-
 propil-, ciklopentil-, ciklohexil-, fenil- vagy benzilcsoport.
- R⁶ további legelőnyösebb jelentése metoximetil-, trifluormetoxi-metil-, metiltio-
 metil- vagy trifluormetiltio-metilcsoport.
- R⁷ és R⁸ legelőnyösebb jelentése egymástól függetlenül hidrogénatom,
 25 -SO₂R⁶, -COR⁶, -CO₂R⁶ általános képletű csoport; adott esetben egy vagy
 több, azonos vagy eltérő szubsztituenssel, éspedig fluor-, klór- vagy
 brómatommal, 1-4 szénatomos alkilkarbonil-, 1-4 szénatomos alkilkar-
 boniloxi-, 1-4 szénatomos alkilamino-, di(1-4 szénatomos alkil)amino-, 1-4
 szénatomos alkoxi-, 1-4 szénatomos halogénalkoxi-, 1-4 szénatomos
 30 alkiltio- és/vagy 1-4 szénatomos halogénalkiltiocsoporttal szubsztituált 1-16
 szénatomos alkil- vagy 2-16- szénatomos alkenilcsoport; adott esetben
 1-3, azonos vagy eltérő szubsztituenssel, éspedig fluor-, klór- vagy bróm-

5 atommal, ciano-, 1-4 szénatomos alkil-, 1-4 szénatomos halogénalkil-, 1-4 szénatomos alkoxi-, 1-4 szénatomos halogénalkoxi-, 1-4 szénatomos alkiltio- és/vagy 1-4 szénatomos halogénalkiltiocsoporttal szubsztituált 3-8 szénatomos cikloalkil-, ciklopropilmetil-, ciklopentilmetil-, ciklohexilmetil-,
10 ciklopropiletil-, ciklopentiletil-, ciklohexiletil-, fenil-, benzil-, feniletil-, tetrazolil-, furil-, furfuril-, benzofuril-, tetrahidrofuril-, tienil-, tenil-, benztienil-, tiolanil-, pirrolil-, indolil-, pirrolinil-, pirrolidinil-, oxazolil-, benzoxazolil-, izoxazolil-, imidazolil-, pirazolil-, tiazolil-, benzotiazolil-, tiazolidinil-, piridinil-, pirimidinil-, piridazil-, pirazinil-, piperidinil-, morfolinil-, tiomorfolinil-,
15 triazinil-, triazolil-, kinolinil- vagy izokinolinilcsoport.

R⁷ és R⁸ további legelőnyösebb jelentése, egymástól függetlenül, adott esetben 1-3, azonos vagy eltérő szubsztituenssel, éspedig fluor-, klór- és/vagy brómatommal, ciano-, 1-4 szénatomos alkil-, 1-4 szénatomos halogénalkil-,
20 1-4 szénatomos alkoxi-, 1-4 szénatomos halogénalkoxi-, 1-4 szénatomos alkiltio- és/vagy 1-4 szénatomos halogénalkiltiocsoport szubsztituált piridinilmetil-, pirimidinilmetil-, piridazilmetil- vagy pirazinilmetilcsoport.

R⁷ és R⁸ további legelőnyösebb jelentése, együttesen egy adott esetben egy vagy több, azonos vagy eltérő szubsztituenssel, éspedig fluor-, klór- és/vagy brómatommal, 1-4 szénatomos alkoxi-, 1-4 szénatomos halogén-
25 alkoxi-, 1-4 szénatomos alkiltio- és/vagy 1-4 szénatomos halogénalkiltiocsoporttal szubsztituált 2-8 szénatomos alkenilén- vagy adott esetben az alkilénláncon egy vagy több, azonos vagy eltérő szubsztituenssel, éspedig fluor- vagy klóratommal, ciano-, metil-, etil-, n-propil-, izopropil-, n-butil-, izobutil-, *sze*k-butil-, *terc*-butil-, 1-4 szénatomos halogénalkil-, metoxi-,
30 etoxi-, n-propoxi-, izopropoxi-, n-butoxi-, izobutoxi-, *sze*k-butoxi-, *terc*-butoxi-, 1-4 szénatomos halogénalkoxi-, metiltio-, etiltio-, n-propiltio-, izopropiltio-, n-butiltio-, izobutiltio-, *sze*k-butiltio-, *terc*-butiltio-, 1-4 szénatomos halogénalkiltiocsoporttal szubsztituált 3-8 szénatomos alkilén-csoport, ahol az alkilénlánc minden esetben -O-, -S- atommal vagy -NR¹⁵- csoporttal lehet megszakítva.

R⁷ és R⁸ további legelőnyösebb jelentése, együttesen egy, egy vagy két, azonos vagy eltérő szubsztituenssel szubsztituált 3-9 szénatomos alkilén-

csoport, ahol a szubsztituens etoxi-karbonil-, metoxi-karbonil- és/vagy oxietilénoxicsoport lehet.

R^7 és R^8 további legelőnyösebb jelentése, együttesen egy $-\text{CH}_2\text{-CH}_2\text{-C(=O)-CH}_2\text{-CH}_2\text{-}$, $-\text{CH}_2\text{-CH}_2\text{-C(=NO-Me)-CH}_2\text{-CH}_2\text{-}$, $-\text{CH}_2\text{-CH}_2\text{-C(=NO-Et)-CH}_2\text{-CH}_2\text{-}$ vagy $-\text{CH}_2\text{-CH}_2\text{-C(=NO-iPr)-CH}_2\text{-CH}_2\text{-}$ képletű csoport.

R^9 és R^{10} legelőnyösebb jelentése, egymástól függetlenül hidrogénatom, $-\text{SO}_2\text{CF}_3$, metil-, etil-, n-propil-, izopropil-, n-butil-, izobutil-, *szek*-butil-, *terc*-butil-, pentil-, hexil-, $-\text{CF}_3$, $-\text{CH}_2\text{CF}_3$, $-(\text{CF}_2)_3\text{CF}_3$, ciklopropil-, ciklopentil-, ciklohexil-, metoxi-metil-, metoxi-etil-csoport, vagy adott esetben fluor-, klór- vagy brómatommal, metil-, trifluormetil-, metoxi-, trifluormetoxicsoporttal szubsztituált fenil- vagy benzilcsoport.

R^9 és R^{10} további legelőnyösebb jelentése, együttesen egy $-(\text{CH}_2)_4\text{-}$, $-(\text{CH}_2)_5\text{-}$, $-(\text{CH}_2)_6\text{-}$, $-\text{CH}_2\text{-CH}(\text{CH}_3)\text{-CH}_2\text{-CH}(\text{CH}_3)\text{-CH}_2\text{-}$, $-(\text{CH}_2)_2\text{-O}(\text{CH}_2)_2\text{-}$, $-(\text{CH}_2)_2\text{-S}(\text{CH}_2)_2\text{-}$ képletű csoport vagy $-(\text{CH}_2)_2\text{-N}(\text{R}^{15})\text{-(CH}_2)_2\text{-}$ általános képletű csoport.

R^{11} és R^{12} legelőnyösebb jelentése, egymástól függetlenül metil-, etil-, n-propil-, izopropil-, n-butil-, izobutil-, *szek*-butil-, *terc*-butil-, n-hexil-, trifluormetil-, trifluoretal-, ciklopropil-, ciklopentil-, ciklohexilcsoport vagy adott esetben fluor-, klór- vagy brómatommal, metil-, trifluormetil-, metoxi-, trifluormetoxicsoporttal szubsztituált fenil- vagy benzilcsoport.

R^{11} és R^{12} további legelőnyösebb jelentése, együttesen egy adott esetben fluor-, klór- vagy brómatommal, metil-, etil-, metoxi-, etoxi-, metiltio-, etiltio-, trifluormetil-, trifluormetoxi-, trifluormetiltiocsoporttal szubsztituált $-(\text{CH}_2)_3\text{-}$, $-(\text{CH}_2)_4\text{-}$, $-(\text{CH}_2)_5\text{-}$ vagy $-(\text{CH}_2)_6\text{-}$ képletű csoport.

R^{15} legelőnyösebb jelentése hidrogénatom, $-\text{SO}_2\text{R}^6$, $-\text{COR}^6$ vagy $-\text{CO}_2\text{R}^6$ általános képletű csoport; adott esetben egy vagy több, azonos vagy eltérő szubsztituenssel, éspedig fluor-, klór- vagy brómatommal, ciano-, metil-amino-, etilamino-, di(1-6 szénatomos alkil)amino-, 1-4 szénatomos alkoxi-, 1-4 szénatomos halogénalkoxi-, 1-4 szénatomos alkiltio-, 1-4 szénatomos halogénalkiltiocsoporttal szubsztituált 1-16 szénatomos alkil-, 2-16 szénatomos alkenilcsoport; adott esetben 1-3, azonos vagy eltérő szubsztituenssel, éspedig fluor-, klór- és/vagy brómatommal, ciano-, metil-, etil-,

n-propil-, izopropil-, n-butil-, izobutil-, *szek*-butil-, *terc*-butil-, 1-4 szénatomos halogénalkil-, metoxi-, etoxi-, n-propoxi-, izopropoxi-, n-butoxi-, izobutoxi-, *szek*-butoxi-, *terc*-butoxi-, 1-4 szénatomos halogénalkoxi-, metiltio-, etiltio-, n-propiltio-, izopropiltio-, n-butiltio-, izobutiltio-, *szek*-butiltio-, *terc*-butiltio-, 1-4 szénatomos halogénalkiltiocsoporttal szubsztituált 3-8 szénatomos cikloalkil-, ciklopropilmetil-, ciklopentilmetil-, ciklohexilmetil-, ciklopropiletil-, ciklopentiletil-, ciklohexiletil-, fenil-, benzil-, feniletil-, tetrazolil-, furil-, furfuril-, benzofuril-, tetrahidrofuril-, tienil-, tenil-, benztienil-, tiolanil-, pirrolil-, indolil-, pirrolinil-, pirrolidinil-, oxazolil-, benzoxazolil-, izoxazolil-, imidazolil-, pirazolil-, tiazolil-, benzotiazolil-, tiazolidinil-, piridinil-, pirimidinil-, piridazil-, pirazinil-, piperidinil-, morfolinil-, tiomorfolinil-, triazinil-, triazolil-, kinolinil- vagy izokinolinilcsoport.

A találmány szerinti (I) általános képletű vegyületek legelőnyösebb vegyületek csoportját képezik az olyan (I-a)-(I-f) általános képletű vegyületek, ahol a képletekben

R¹ jelentése fluor- vagy klóratom;

R² jelentése hidrogén- vagy fluoratom és

R⁴ jelentése a fenti.

A találmány szerinti (I) általános képletű vegyületek további legelőnyösebb vegyületek csoportját képezik az (I-g)-(I-l) általános képletű vegyületek, ahol a képletekben

R¹ jelentése fluor- vagy klóratom;

W jelentése hidrogén- vagy fluoratom és

R⁴ jelentése a fenti.

A találmány szerinti (I-g)-(I-l) általános képletű vegyületeket szokásos optikai rezolválással, így például a megfelelő racemátok egy királis állófázison történő kromatografálásával állíthatjuk elő. Így lehetővé válik mindkét racém végtermék, mind a racém közttermékek két enantiomerre történő elválasztása.

A telített szénhidrogén csoportok, így az alkilcsoportok egyenes vagy – ahol ez lehetséges - elágazó szénláncúak lehetnek, és további heteroatomokkal társíthatók, amint például az alkoxics csoportban van.

A halogénatommal szubsztituált csoportok, így a halogénalkilcsoportok egyszeresen vagy többszörösen lehetnek szubsztituálva, de legfeljebb a lehetséges szubsztituensek számával megegyező számban halogénezettek. Többszörös halogénezés esetében a halogénatomok lehetnek azonosak vagy
5 különbözőek. A halogénatom jelentése fluor-, klór-, bróm- vagy jódatom, előnyösen fluor-, klór- vagy brómatom.

Mindezek mellett a fenti általános vagy előnyös csoportdefiníciók vagy illusztrációk kívánt esetben egymás közt, tehát az adott tartományok és az előnyös tartományok között is tetszőlegesen kombinálhatók. És ezek a definíciók
10 mind a végtermékekre, mind a megfelelő elő- és köztitermékekre egyaránt vonatkoznak.

Amennyiben kiindulási anyagként 5-(2,6-difluorfenil)-2-(4-brómfenil)-3,4-dihidro-2H-pirrolt, *N*-(5-bróm-2-pirimidinil)-*N*-etil-*N*-propilamint és 4,4,4',4',5,5,5',5'-oktametil-2,2'-bis-1,3,2-dioxaborolánt és katalizátorként egy
15 palládiumkatalizátort alkalmazunk, a találmány szerinti (A) eljárást az (A) reakcióvázlattal írhatjuk le.

Amennyiben kiindulási anyagként 5-(2,6-difluorfenil)-2-[4-(4,4,5,5-tetrametil-1,3,2-dioxaborolán-2-il)fenil]-3,4-dihidro-2H-pirrolt és 5-bróm-2-(2,2,2-trifluoretoxi-)pirimidint és katalizátorként egy palládiumkatalizátort alkalmazunk a
20 találmány szerinti (B) eljárást a (B) reakcióvázlattal írhatjuk le.

Amennyiben kiindulási anyagként 5-(2,6-difluorfenil)-2-[4-(trifluormetilszulfoniloxi-)fenil]-3,4-dihidro-2H-pirrolt és 6-(dimetilamino)-3-piridazinilboronsavat és katalizátorként egy palládiumkatalizátort alkalmazunk a találmány szerinti (C) eljárást a (C) reakcióvázlattal írhatjuk le.

25 Amennyiben kiindulási anyagként 5-(2,6-difluorfenil)-2-(4-bromfenil)-3,4-dihidro-2H-pirrolt és 2-trifluormetil-5-(tributilón)piridint és katalizátorként egy palládiumkatalizátort alkalmazunk a találmány szerinti (D) eljárást a (D) reakcióvázlattal írhatjuk le.

Az (A) eljárás első lépésében egy (II) általános képletű vegyületet egy
30 dibórsavészterrel kapcsoljuk, palládiumkatalizátor és adott esetben egy savmegkötő jelenlétében, adott esetben egy oldószerben. A második reakciólépésben a köztitermék elválasztása nélkül, ugyanabban a reakcióedényben a

köztterméket és a (III) általános képletű vegyületet valamilyen katalizátor és adott esetben egy savmegkötő jelenlétében, adott esetben egy oldószerben kapcsoljuk [ld. például Tetrahedron Lett. 38, 3841 (1997)].

5 A találmány szerinti (A) eljárást két útvonalon hajthatjuk végre. A reakcióedénybe először a (II) általános képletű vegyületet töltjük be, vagy először betölthetjük a (III) általános képletű vegyületet. Az (A) eljárást a (B) és a (C) eljárások tandem reakciójaként tekinthetjük.

10 Az (A) eljáráshoz szükséges Δ^1 -pirrolinszármazékokat a (II) általános képlettel általánosan definiáljuk. E vegyületek képletében R^1 , R^2 , R^3 és m általános, előnyös, különösen előnyös és legelőnyösebb jelentése megegyezik az (I) általános képletű vegyületek esetében megadott általános, előnyös, stb. jelentéssel, és Z előnyös jelentése bróm-, jódatom, $-\text{OSO}_2\text{CF}_3$ vagy $-\text{OSO}_2(\text{CF}_2)_3\text{CF}_3$ képletű csoport, különösen előnyös jelentése brómatom, $-\text{OSO}_2\text{CF}_3$ vagy $-\text{OSO}_2(\text{CF}_2)_3\text{CF}_3$ képletű csoport, legelőnyösebb jelentése
15 brómatom vagy $-\text{OSO}_2\text{CF}_3$ képletű csoport.

A (II) általános képletű Δ^1 -pirrolszármazékokat az irodalomban ismert eljárásokkal állíthatjuk elő (ld. WO 98/22438).

20 Az (A) eljáráshoz szükséges heterociklusos-csoportot a (III) általános képlettel általánosan definiáljuk. E vegyületek képletében Q általános, előnyös, különösen előnyös és legelőnyösebb jelentése megegyezik az (I) általános képletű vegyületek esetében megadott általános, előnyös, stb. jelentéssel, és X előnyös jelentése bróm-, klór-, jódatom vagy $-\text{OSO}_2\text{CF}_3$ képletű csoport, különösen előnyös jelentése bróm-, klór- vagy jódatom brómatom, legelőnyösebb jelentése bróm- vagy klóratom.

25 A (III) általános képletű heterociklusos vegyületeket az irodalomban ismert eljárásokkal állíthatjuk elő [ld. Aust. J. Chem. 17, 794 (1964); Chem. Ber. 125, 1169 (1992); Chem. Pharm. Bull. 43, 247 (1995); Eur. J. Med. Chem. 24, 249 (1989); J. Chem. Soc. C 1889 (1971); J. Chem. Soc. Perkin Trans. 1 2497 (1925); J. Med. Chem. 34, 315 (1991); J. Org. Chem. 49, 2240 (1984); J. Org.
30 Chem. 55, 69 (1990); Org. Prep. Proced. Int. 30, 433 (1998); Synthesis 1163 (1999); Tetrahedron 40, 7975 (1999); Tetrahedron Lett. 37, 4447 (1996); Tetrahedron Lett. 41, 4335 (2000)].

A találmány szerinti (A) eljárásban dibórsavként 4,4,4',4',5,5,5',5'-oktametil-2,2'-bisz-1,3,2-dioxaborolánt, 5,5,5',5'-tetrametil-2,2'-bisz-1,3,2-dioxaborinánt, 4,4,4',4',6,6'-hexametil-2,2'-bisz-1,3,2-dioxaborinánt vagy 2,2'-bisz-1,3,2-benzodioxaborolt használhatunk. Előnyösen 4,4,4',4',5,5,5',5'-oktametil-2,2'-bisz-1,3,2-dioxaborolánt, 5,5,5',5'-tetrametil-2,2'-bisz-1,3,2-dioxaborinánt vagy 4,4,4',4',6,6'-hexametil-2,2'-bisz-1,3,2-dioxaborinánt, különösen előnyösen 4,4,4',4',5,5,5',5'-oktametil-2,2'-bisz-1,3,2-dioxaborolánt vagy 5,5,5',5'-tetrametil-2,2'-bisz-1,3,2-dioxaborinánt, legelőnyösebben 4,4,4',4',5,5,5',5'-oktametil-2,2'-bisz-1,3,2-dioxaborolánt használhatunk.

10 A találmány szerinti (A) eljárás megvalósításakor egy mól (II) általános képletű vegyületre általában 1 mól vagy csekély feleslegben lévő dibórésztert és 1 mól vagy csekély feleslegben lévő (III) általános képletű vegyületet, valamint 3% palládium katalizátort alkalmazunk. Mindezek mellett, az összetevőket más arányban is alkalmazhatjuk. Először a (II) általános képletű vegyületet
15 töltjük be, de más módszerként először a (III) általános képletű vegyületet is betölthetjük. A feldolgozást szokásos módszerekkel hajtjuk végre. A reakcióelegyet általában vízzel hígítjuk és etilacetáttal extraháljuk. A szerves fázist vízzel mossuk, szárítjuk, szűrjük és bepároljuk. A kapott maradékot, kívánt esetben a jelenlévő szennyező anyagoktól szokásos módszerekkel, így például kromatográfiás módszerrel vagy átkristályosítással tisztítjuk.
20

A találmány szerinti (B) eljáráshoz szükséges Δ^1 -pirrolinszármazékokat a (IV) általános képlettel általánosan definiáljuk. E vegyületek képletében R^1 , R^2 , R^3 és m előnyös, különösen előnyös és legelőnyösebb jelentése megegyezik az (I) általános képletű vegyületek esetében megadott előnyös, különösen előnyös, stb. jelentéssel. Így előnyös lehet a (4,4,5,5-tetrametil-1,3,2-dioxaborolán)-2-il-, (5,5-dimetil-1,3,2-dioxaborinán)-2-il-, (4,4,6-trimetil-1,3,2-dioxaborinán)-2-il- vagy a 1,3,2-benzodioxaborol-2-il-, különösen előnyös a (4,4,5,5-tetrametil-1,3,2-dioxaborolán)-2-il-, (5,5-dimetil-1,3,2-dioxaborinán)-2-il- vagy a (4,4,6-trimetil-1,3,2-dioxaborinán)-2-il-, legelőnyösebb a (4,4,5,5-tetrametil-1,3,2-dioxaborolán)-2-il- vagy a (5,5-dimetil-1,3,2-dioxaborinán)-2-il-csoport.
25
30

A (IV) általános képletű Δ^1 -pirrolinszármazékot előállíthatjuk az (a) eljárás

rás szerint, amelynek megfelelően egy (II) általános képletű vegyületet – ahol R^1 , R^2 , R^3 , m és Z jelentése a fenti – egy dibórsavészterrel, egy katalizátor és kívánt esetben egy savmegkötő jelenlétében reagáltatjuk, kívánt esetben valamilyen hígítószerben [Id. J. Org. Chem. 60, 7508 (1995); Tetrahedron Lett. 38, 3447 (1997)].

Az (a) eljárás megvalósítására használt, megfelelő dibórsavésztereket a találmány szerinti (A) eljárásnál ismertettük.

A találmány szerinti (B) eljáráshoz szükséges kiindulási anyagként a fenti (A) eljárásnál ismertetett (III) általános képletű heterociklusos-vegyületet alkalmazzuk.

A találmány szerinti (B) eljárás megvalósításakor egy mól (IV) általános képletű vegyületre általában 1 mól vagy csekély feleslegben lévő (III) általános képletű vegyületet alkalmazunk. Mindezek mellett, az összetevőket más arányban is alkalmazhatjuk. A feldolgozást szokásos módszerekkel hajtjuk végre. A reakcióelegyet általában etilacetátban felvesszük, majd a szerves fázist vízzel mossuk, vízmentes nátriumszulfáton szárítjuk, szűrjük és bepároljuk. A kapott maradékot, kívánt esetben a jelenlévő szennyező anyagoktól szokásos módszerekkel, így például kromatográfiás módszerrel vagy átkristályosítással tisztítjuk.

A találmány szerinti (C) eljáráshoz szükséges kiindulási anyagként a fenti (A) eljárásnál ismertetett (III) általános képletű Δ^1 -pirrolinszármazékot alkalmazzuk.

A találmány szerinti (C) eljáráshoz szükséges bórsavszármazékokat az (V) általános képlettel általánosan definiáljuk. E vegyületek képletében Q előnyös, különösen előnyös és legelőnyösebb jelentése megegyezik az (I) általános képletű vegyületek esetében megadott előnyös, különösen előnyös, stb. jelentéssel. Így előnyös lehet a (4,4,5,5-tetrametil-1,3,2-dioxaborolán)-2-il-, (5,5-dimetil-1,3,2-dioxaborinán)-2-il-, (4,4,6-trimetil-1,3,2-dioxaborinán)-2-il- vagy a 1,3,2-benzodioxaborol-2-il-, különösen előnyös a (4,4,5,5-tetrametil-1,3,2-dioxaborolán)-2-il-, (5,5-dimetil-1,3,2-dioxaborinán)-2-il- vagy a (4,4,6-trimetil-1,3,2-dioxaborinán)-2-il-, legelőnyösebb a (4,4,5,5-tetrametil-1,3,2-dioxaborolán)-2-il- vagy a (5,5-dimetil-1,3,2-dioxaborinán)-2-il-csoport.

Az (V) általános képletű vegyületek ismertek vagy ismert eljárásokkal állíthatók elő [Id. J. Org. Chem. 60, 7508 (1995); Tetrahedron Lett. 38, 3447 (1997)].

A találmány szerinti (C) eljárás megvalósításakor egy mól (II) általános képletű vegyületre általában 1 mól vagy csekély feleslegben lévő (V) általános képletű vegyületet alkalmazunk. Mindezek mellett, az összetevőket más arányban is alkalmazhatjuk. A feldolgozást szokásos módszerekkel hajtjuk végre. A reakcióelegyet általában etilacetátban felvesszük, majd a szerves fázist vízzel mossuk, vízmentes nátriumsulfáton szárítjuk, szűrjük és bepároljuk. A kapott maradékot, kívánt esetben a jelenlévő szennyező anyagoktól szokásos módszerekkel, így például kromatográfiás módszerrel vagy átkristályosítással tisztítjuk.

A találmány szerinti (D) eljáráshoz szükséges Δ^1 -pirrolinszármazékokat a (II-a) általános képlettel általánosan definiáljuk. E vegyületek képletében R^1 , R^2 , R^3 és m előnyös, különösen előnyös és legelőnyösebb jelentése megegyezik az (I) általános képletű vegyületek esetében megadott előnyös, különösen előnyös, stb. jelentéssel, és Z^1 előnyös jelentése bróm- vagy jódatom.

A (II-a) általános képletű Δ^1 -pirrolszármazékokat az irodalomban ismert eljárásokkal állíthatjuk elő (Id. WO 98/22438).

A találmány szerinti (B) eljáráshoz szükséges fémorganikus-vegyületet a (VI) általános képlettel általánosan definiáljuk. E vegyületek képletében Q előnyös, különösen előnyös és legelőnyösebb jelentése megegyezik az (I) általános képletű vegyületek esetében megadott előnyös, különösen előnyös stb. jelentéssel, és M előnyös jelentése $ZnCl$, $Sn(Me)_3$ vagy $Sn(n-Bu)_3$ képletű csoport.

Néhány (VI) általános képletű fémorganikus-vegyület ismert vagy ismert eljárásokkal állítható elő. A (VI) általános képletű vegyületet előállíthatjuk még *in situ* olyan (III) általános képletű vegyületből, amelynek képletében X jelentése $-OSO_2CF_3$ csoport [Id. Tetrahedron Lett. 36, 9085, (1995)].

A találmány szerinti (D) eljárás megvalósításakor egy mól (II-a) általános képletű vegyületre általában 1 mól vagy csekély feleslegben lévő (VI) általános képletű vegyületet alkalmazunk. Mindezek mellett, az összetevőket más

arányban is alkalmazhatjuk. A feldolgozást szokásos módszerekkel hajtjuk végre. A reakcióelegyet általában etilacetátban felvesszük, majd a szerves fázist vízzel mossuk, vízmentes nátriumszulfáton szárítjuk, szűrjük és bepároljuk. A kapott maradékot, kívánt esetben a jelenlévő szennyező anyagoktól szokásos módszerekkel, így például kromatográfiás módszerrel vagy átkristá-
 5 lyosítással tisztítjuk.

A következőkben az (I-g)-(I-l) általános képletű királis vegyületek előállítását ismertetjük

Az (I-g)-(I-l) általános képletű királis vegyületek előállítására például a
 10 (II-b) Δ^1 -pirrolszármazékot – ahol R^1 , R^2 , R^3 és m jelentése a fenti, és Z jelentése klór-, bróm- vagy jódatom – optikai rezolválásnak vethetjük alá. Ennek végén például preparatív kromatográfiás, előnyösen magas felbontású folyadék kromatográfiás [High Performance Liquid Chromatography (HPLC)] eljárást végezhetünk el. Ebben az esetben állófázisként királis szilikagélt alkalmazhatunk. Azt találtuk, hogy a (II-b) általános képletű vegyületek enantiomerekké történő elválasztására különösen megfelelő a kereskedelmi forgalomban kapható trisz(3,5-dimetilfenilkarbamát)-cellulóz-módosított szilikagél. Mindezek mellett, bármely más állófázis alkalmazható. Mozgófázisként a szokásosan inert, szerves oldószereket vagy ezek elegyeit alkalmazhatjuk. Mozgófázisként előnyösen az adott esetben halogénezett alifás, aliciklusos vagy
 20 aromás szénhidrogének, így petróleuméter, hexán, heptán, ciklohexán; diklórmétán, kloroform; alkoholok, így metanol, etanol, propanol; nitrilek, így acetonitril; észterek így ecetsavmetilészter vagy ecetsavetilészter alkalmazhatók. Különösen előnyös mozgófázis az alifás szénhidrogének, így a hexán vagy a heptán, és az alkoholok, így a metanol vagy a propanol, legelőnyösebb mozgófázis az n-heptán és az izopropanol vagy ezek elegye. Az elválasztást általában 10°C és 60°C közötti, előnyösen 10°C és 40°C közötti hőmérsékleten, különösen előnyösen szobahőmérsékleten hajtjuk végre. Az így kapott (R)-konfigurációjú enantiomerek kiindulási anyagként használjuk tovább az
 30 (A), (C) vagy (D) eljárásokban.

A találmány szerinti (A), (B), (C) és (D) eljárások megvalósításakor minden esetben valamely palládium-katalizátort alkalmazunk, amelyet további

ligandumok hozzáadásával vagy a nélkül alkalmazhatunk. Katalizátorként előnyös a $\text{PdCl}_2(\text{dppf})$ [$\text{dppf} = 1,1'$ -bisz(difenilfoszfino)ferrocén], $\text{Pd}(\text{PPh}_3)_4$, $\text{PdCl}_2(\text{PPh}_3)_2$, $\text{PdCl}_2(\text{CH}_3\text{CN})_2$, $\text{Pd}_2(\text{dba})_3$ [$\text{dba} = \text{dibenzilidénaceton}$] vagy $\text{Pd}(\text{OAc})_2$, különösen előnyös a $\text{PdCl}_2(\text{dppf})$, $\text{Pd}(\text{PPh}_3)_4$, $\text{PdCl}_2(\text{PPh}_3)_2$, vagy

5 $\text{Pd}(\text{OAc})_2$, legelőnyösebb a $\text{PdCl}_2(\text{dppf})$ vagy $\text{PdCl}_2(\text{PPh}_3)_2$.

Megfelelő ligandumként triarilfoszfinokat, trialkilfoszfinokat vagy arzinokat alkalmazhatunk. Ligandumként előnyösen dppf -t, PPh_3 -t, $\text{P}(\text{terc-Bu})_3$ -t, Pcy_3 -t vagy AsPh_3 -t, különösen előnyösen dppf -t alkalmazhatunk.

A találmány szerinti (A), (B) és (C) eljárások megvalósításakor hígítószerként a szokásosan inert, szerves oldószereket vagy ezek elegyeit alkalmazhatjuk. Így hígítószerként előnyösen az adott esetben halogénezett alifás, aliciklusos vagy aromás szénhidrogének, így petróleuméter, hexán, heptán, ciklohexán, metilciklohexán, benzol, toluol, xilol vagy dekalin; klórbenzol, diklórbenzol, diklórmétán, kloroform, tetraklórmétán, diklóretán vagy tri-

15 klóretán; éterek, így dietiléter, diizopropiléter, metil-*terc*-butiléter, metil-*terc*-amiléter, dioxán, tetrahidrofurán, 1,2-dimetoxi-etán, 1,2-dietoxi-etán vagy anizol; nitrilek, így acetonitril, propionitril, *n*- vagy *i*-butironitril vagy benzonitril; amidok, így *N,N*-dimetilformamid, *N,N*-dimetilacetamid, *N*-metilformanilid, *N*-metilpirrolidon vagy hexametilfoszforsavtriamid; észterek így ecetsav-

20 metilészter vagy ecetsavetilészter, szulfoxidok, így dimetilszulfoxid vagy szulfonok, így szulfolán alkalmazhatók. Hígítószerként különösen előnyösen acetone, dimetoxietán, dioxán, tetrahidrofurán, dimetilformamid, dimetilacetamid, dimetilszulfoxid, etanol, toluol vagy adott esetben a fenti hígítószerek vizes elegyei alkalmazhatók.

25 A találmány szerinti (D) eljárás megvalósításakor hígítószerként a szokásosan inert, szerves oldószereket vagy ezek elegyeit alkalmazhatjuk. Így hígítószerként előnyösen az adott esetben halogénezett alifás, aliciklusos vagy aromás szénhidrogének, így petróleuméter, hexán, heptán, ciklohexán, metilciklohexán, benzol, toluol, xilol vagy dekalin; klórbenzol, diklórbenzol, dik-

30 lórmétán, kloroform, tetraklórmétán, diklóretán vagy triklóretán; valamely éter, így dietiléter, diizopropiléter, metil-*terc*-butiléter, metil-*terc*-amiléter, dioxán, tetrahidrofurán, 1,2-dimetoxietán, 1,2-dietoxietán vagy anizol alkalmazható.

Hígítószerként különösen előnyösen dioxán, tetrahidrofurán vagy toluol alkalmazható.

A találmány szerinti (A), (B), (C) és (D) eljárások megvalósításakor savmegkötőként az ilyen eljárásokban szokásosan használt szervetlen vagy szerves bázisokat alkalmazhatjuk. Így savmegkötőként előnyösen alkáliföldfém- vagy alkálifém-hidroxidokat, így nátrium-hidroxidot, kalcium-hidroxidot, kálium-hidroxidot, vagy valamely ammónium-hidroxidot, alkálifém-karbonátot, így nátrium-karbonátot, kálium-karbonátot, kálium-hidrogénkarbonátot, nátrium-hidrogénkarbonátot, alkáli- vagy alkáliföldfém-acetátot, így nátrium-acetátot, kálium-acetátot, kalcium-acetátot, alkálifém-fluoridokat vagy tercieraminokat, így trimetilamint, trietilamint, tributilamint, *N,N*-dimetilnilint, piridint, *N*-metilpiperidint, *N,N*-dimetilaminopiridint, diazabiciklooktánt (dabco), diazabiciklononént (dbn) vagy diazabicikloundecént (dbu). Mindezek mellett az eljárást végrehathatjuk járulékos savmegkötő hozzáadása nélkül vagy az aminkomponens feleslegben történő adagolásával, amely így savmegkötőként működik. Különösen előnyös savmegkötő a bárium-hidroxid, nátrium-hidroxid, kálium-hidroxid, trikálium-foszfát, cézium-karbonát, kálium-karbonát, nátrium-karbonát, kálium-acetát, trietilamin, kálium-*terc*-butanolát, cézium-fluorid vagy a kálium-fluorid.

A találmány szerinti (A), (B) és (C) eljárások megvalósításakor a reakcióhőmérsékletet széles tartományban változtathatjuk. A reakciót általában 0°C és 140°C közötti, előnyösen 20°C és 120°C közötti, különösen előnyösen 60°C és 100°C közötti hőmérsékleten hajtjuk végre.

A találmány szerinti (D) eljárás megvalósításakor a reakcióhőmérsékletet széles tartományban változtathatjuk. A reakciót általában 0°C és 140°C közötti, előnyösen 20°C és 120°C közötti hőmérsékleten hajtjuk végre.

A találmány szerinti eljárásokat általában légköri nyomáson végezzük el. Mindezek mellett, minden esetben emelt vagy csökkentett nyomás alatt is dolgozhatunk.

A találmány szerinti hatóanyagok olyan állati kártevők, különösen rovarok, pókrendűek és nematodák leküzdésére alkalmazhatók, amelyek a mezőgazdaságban, erdészetben, a készlet- és anyagvédelemben és az egészség-

- ügyi szektorban fordulnak elő. A találmány szerinti hatóanyagok nagyon jó növény toleranciával rendelkeznek, és kedvező toxicitást mutatnak a melegvérű állatokra. A találmány szerinti hatóanyagokat előnyösen növényvédőszerként alkalmazhatjuk. Normálisan érzékeny és rezisztens fajok ellen
- 5 hatásosak a fejlődés egyes vagy összes szakaszában lévő kártevők ellen alkalmazhatók. Így az előbbi kártevő fajok közé tartoznak az alábbiak:
- az *Isopoda* rendből például *Oniscus asellus*, *Armadillidium vulgare*, *Porcellio scaber*;
- a *Diplopoda* rendből például *Blaniulus guttulatus*;
- 10 a *Chilopoda* rendből például *Geophilus carpophagus*, *Scutigera* spp.;
- a *Symphyla* rendből például *Scutigera* spp.;
- a *Thysanura* rendből például *Lepisma saccharina*;
- a *Collembola* rendből például *Onychiurus armatus*;
- az *Orthoptera* rendből például *Acheta domesticus*, *Gryllotalpa* spp., *Locusta migratoria migratorioides*, *Melanoplus* spp., *Schistocerca gregaria*;
- 15 a *Blattaria* rendből például *Blatta orientalis*, *Periplaneta americana*, *Leucophaea maderae*, *Blattella germanica*;
- a *Dermaptera* rendből például *Forficula auricularia*;
- az *Isoptera* rendből például *Reticulitermes* spp.;
- 20 a *Phthiraptera* rendből például *Pediculus humanus corporis*, *Haematopinus* spp., *Linognathus* spp., *Trichodectes* spp., *Damalinia* spp.;
- a *Thysanoptera* rendből például *Hercinothrips femoralis*, *Thrips tabaci*, *Thrips palmi*, *Frankliniella accidentalis*;
- a *Heteroptera* rendből például *Eurygaster* spp., *Dysdercus intermedius*,
- 25 *Piesma quadrata*, *Cimex lectularius*, *Rhodnius prolixus*, *Triatoma* spp.;
- a *Homoptera* rendből például *Aleurodes brassicae*, *Bemisia tabaci*, *Trialeurodes vaporariorum*, *Aphis gossypii*, *Brevicoryne brassicae*, *Cryptomyzus ribis*, *Aphis fabae*, *Aphis pomi*, *Eriosoma lanigerum*, *Hyalopterus arundinis*, *Phylloxera vastatrix*, *Pemphigus* spp., *Macrosiphum avenae*, *Myzus* spp.,
- 30 *Phorodon humuli*, *Rhopalosiphum padi*, *Empoasca* spp., *Euscelis bilobatus*, *Nephotettix cincticeps*, *Lecanium corni*, *Saissetia oleae*, *Laodelphax striatellus*, *Nilaparvata lugens*, *Aonidiella aurantii*, *Aspidiotus hederae*, *Pseudococcus*

spp., *Psylla* spp.;

- a *Lepidoptera* rendből például *Pectinophora gossypiella*, *Bupalus piniarius*, *Cheimatobia brumata*, *Lithocolletis blancardella*, *Hyponomeuta padella*, *Plutella xylostella*, *Malacosoma neustria*, *Euproctis chrysorrhoea*, *Lymantria* spp., *Bucculatrix thurberiella*, *Phyllocnistis citrella*, *Agrotis* spp., *Euxoa* spp.,
 5 *Feltia* spp., *Earias insulana*, *Heliothis* spp., *Mamestra brassicae*, *Panolis flammea*, *Spodoptera* spp., *Trichoplusia ni*, *Carpocapsa pomonella*, *Pieris* spp., *Chilo* spp., *Pyrausta nubilalis*, *Ephestia kuehniella*, *Galleria mellonella*, *Tineola bisselliella*, *Tinea pellionella*, *Hofmannophila pseudospretella*, *Cacoe-*
 10 *cia podana*, *Capua reticulana*, *Choristoneura fumiferana*, *Clysia ambiguella*, *Homona magnanima*, *Tortrix viridana*, *Cnaphalocenis* spp., *Oulema oryzae*;

- a *Coleoptera* rendből például *Anobium punctatum*, *Rhizopertha dominica*, *Bruchidius obtectus*, *Acanthoscelides obtectus*, *Hylotrupes bajulus*, *Agelastica alni*, *Leptinotarsa decemlineata*, *Phaedon cochleariae*, *Diabrotica* spp.,
 15 *Psylliodes chrysocephala*, *Epilachna varivestis*, *Atomaria* spp., *Oryzaephilus surinamensis*, *Anthonomus* spp., *Sitophilus* spp., *Otiorrhynchus sulcatus*, *Cosmopolites sordidus*, *Ceuthorrhynchus assimilis*, *Hypera postica*, *Dermestes* spp., *Trogvagyma* spp., *Anthrenus* spp., *Attagenus* spp., *Lyctus* spp., *Meligethes aeneus*, *Ptinus* spp., *Niptus hololeucus*, *Gibbium psyllioides*,
 20 *Tribolium* spp., *Tenebrio molitor*, *Agriotes* spp., *Convagys* spp., *Melolontha melolontha*, *Amphimallon solstitialis*, *Costelytra zealandica*, *Lissorhoptrus oryzophilus*;

a *Hymenoptera* rendből például *Diprion* spp., *Hoplocampa* spp., *Lasius* spp., *Monomorium pharaonis*, *Vespa* spp.;

- a *Diptera* rendből például *Aedes* spp., *Anopheles* spp., *Culex* spp.,
 25 *Drosophila melanogaster*, *Musea* spp., *Fannia* spp., *Calliphora erythrocephala*, *Lucilia* spp., *Chrysomyia* spp., *Cuterebra* spp., *Gastrophilus* spp., *Hyppobosca* spp., *Stomoxys* spp., *Oestrus* spp., *Hypvagyma* spp., *Tabanus* spp., *Tannia* spp., *Bibio hortulanus*, *Oscinella frit*, *Phorbia* spp.,
 30 *Pegomyia hyoscyami*, *Ceratitis capitata*, *Dacus oleae*, *Tipula paludosa*, *Hylemyia* spp., *Liriomyza* spp.;

a *Siphonaptera* rendből például *Xenopsylla cheopis*, *Ceratophyllus*

spp.;

az *Arachnida* osztályból például *Scorpio maurus*, *Latrodectus mactans*,
Acarus siro, *Argas spp.*, *Ornithodoros spp.*, *Dermanyssus gallinae*, *Eriophyes*
ribis, *Phyllocoptruta oleivora*, *Boophilus spp.*, *Rhipicephalus spp.*, *Amblyomma*
5 *spp.*, *Hyalomma spp.*, *Ixodes spp.*, *Psoroptes spp.*, *Chorioptes spp.*,
Sarcoptes spp., *Tarsonemus spp.*, *Bryobia praetiosa*, *Panonychus spp.*,
Tetranychus spp., *Hemitarsonemus spp.*, *Brevipalpus spp.*;

a növényparazita nematodák közül például *Pratylenchus spp.*,
Radopholus similis, *Ditylenchus dipsaci*, *Tylenchulus semipenetrans*,
10 *Heterovagya spp.*, *Globvagya spp.*, *Meloidogyne spp.*, *Aphelenchoides spp.*,
Longidorus spp., *Xiphinema spp.*, *Trichodorus spp.*, *Bursaphelenchus spp.*

Közelebbről a találmány szerinti (I) általános képletű vegyületek kima-
gaslóan jó hatást mutatnak hernyók, bogárlárvák, pókatkák, levéltetvek és ak-
nát rágó legyek ellen.

15 Kívánt esetben a találmány szerinti vegyületek bizonyos koncentrációk-
ban vagy alkalmazási arányokban növényirtó- vagy mikrobaölő szerként, így
például fungicid szerként, gombafertőzések elleni szerként vagy baktériumölő
szerként alkalmazhatók

Minden növény és növényi rész a találmánynak megfelelően kezelhető.

20 Az itt használt „növény” kifejezés minden növényre és növény populációra, így
kívánt és nem-kívánt vad vagy termést hozó növényre (beleértve a természet-
ben előforduló termést hozó növényeket) vonatkozik. A „termést hozó növé-
nyek” kifejezés olyan növényekre vonatkozik, amelyeket szokásos növényne-
mesítő és optimalizáló eljárásokkal, biotechnológiai vagy rekombináns mód-
szerekkel vagy ezek kombinálásával kapnak, ideértve a transzgenikus növé-
25 nyeket és a növénynemesítő jogok által védhető vagy nem-védhető kultúrnö-
vény-változatokat. A „növényi részek” kifejezés a növények föld alatti vagy
feletti összes részére és szervére, így hajtásaira, levelére, virágára és gyökér-
re, például levelekre, fenyőtűkre, szárakra, törzsekre, virágokra, termőrügyek-
30 re, gyümölcsökre, magvakra, gyökerekre, gumós gyökerekre vagy gyökértör-
zsekre vonatkozik. A „növényi részek” kifejezésbe bele tartoznak a betakarított
anyagok, valamint a tenyésztett és a fejlesztett eredeztető anyagok, így pél-

dául a bujtóágak, gumós gyökerek, gyökértörzsek, hajtások és a magok.

A találmány szerinti növények és növényi részek kezelését a hatóanyaggal közvetlenül végezzük el vagy hagyjuk a vegyületet a körülvevő, környezeti vagy tárolási területen hatni. Így alkalmazhatunk szokásos kezelési eljárásokat, például belemerítés, porlasztás, elpárologtatás, elpárásítás, szét-
5 szórás, bekenés vagy az eredeztető anyagok, különösen a magok esetében egy vagy több réteg felvitelét.

A találmány szerinti hatóanyagokat szokásos szerformákká (készítményekké) alakíthatók. Ilyen készítmények például az oldatok, emulziók, nedvesíthető porok, szuszpenziók, porok, porozószerke-
10 s, kenőcsök, oldható porok, granulátumok, szuszpenziós-emulziós koncentrátumok, hatóanyaggal átitatott természetes és szintetikus anyagok vagy polimer anyagokkal készült mikrokapszulák.

A készítményeket önmagukban ismert módon állítjuk elő, például úgy,
15 hogy a találmány szerinti hatóanyagokat vivőanyagokkal, így folyékony oldószerekkel és/vagy szilárd hordozóanyagokkal összekeverjük, amikor is adott esetben felületaktív anyagokat, azaz emulgeálószerke-
t és/vagy diszpergálószereket és/vagy habképző anyagokat is adhatunk az elegyhez.

Abban az esetben, ha vivőanyagként vizet alkalmazunk, társoldószerként szerves oldószereket is alkalmazhatunk. Folyékony oldószerként lényegében az alábbiak jönnek szóba: aromás vegyületek, így xilol, toluol, vagy alkil-naftalin, klórozott aromás vagy klórozott alifás szénhidrogének, így klórbenzol, klóretilén vagy metilénklorid, alifás szénhidrogének, így ciklohexán vagy paraffin, például ásványiolaj-frakciók, ásványi- vagy növényi olajok, alko-
20 holok, például butanol vagy glikol, valamint ezek étereit és észtereit, ketonok, például acetont, metil-etil-ketont, metil-izobutil-ketont vagy ciklohexanont, erősen poláros oldószereket, például dimetilformamidot és dimetilszulfidot, továbbá a vizet.

Szilárd hordozóként számításba jönnek például az ammóniumsók és a természetes kőzetlisztek, például a kaolin, agyagok, talkum, kréta, kvarc, attapulgit, montmorillonit vagy diatóma-
30 földek, és a szintetikus kőzetlisztek, például a nagy diszperzitású kovásva, az alumíniumoxid és a szilikátok; szilárd hordozóanyagként granulátumokhoz számításba jönnek például az őrölt

és frakcionált természetes kőzetek, például a kalcit, márvány, horzsakő, szepiolit, dolomit, valamint a szerves vagy szerves lisztekből készült szintetikus granulátumok, továbbá a szerves anyagokból, mint például falisztból, kókuszhéjból, kukoricacsutkákból vagy dohányszárból készült granulátumok; 5 emulgeálószerként és/vagy habképző-szerként használhatunk például nemionos vagy anionos emulgeálószeret, például poli(oxi-etilén)-zsírsavésztereket, poli(oxi-etilén)-zsíralkohol-étereket, például alkil-aril-poliglikol-étert, alkil-szulfonátot, alkil-szulfátot, aril-szulfonátot, valamint fehérje hidrolizátumot; diszpergálószerként számításba jön például a ligninszulfit- 10 szennylúg és a metil-cellulóz.

A készítmények ragasztószereket, például karboximetil-cellulózt, természetes és szintetikus, porított, szemcsés vagy latex formájú polimereket, például gumiarábikumot, poli(vinil-alkohol)-t, poli(vinil-acetát)-ot, valamint természetes foszfolipideket, például kefalint és lecitint és szintetikus 15 foszfolipideket is tartalmazhatnak. További adalékként ásványi vagy növényi olajokat is használhatunk.

Alkalmazhatunk továbbá színezőanyagokat, például szerves pigmenteket, így például vasoxidot, titánoxidot, ferrociankéket; és szerves színezékeket, például alizarin-, azo- és fém-ftalocianin-színezékeket, valamint nyomnyi 20 mennyiségben szükséges tápanyagokat, például vas-, mangán-, bór-, réz-, kobalt-, molibdén- és cinksókat is.

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

A találmány szerinti hatóanyagok az azonnali alkalmazásra szánt készítményekben, valamint a készítményekből előállított alkalmazási formákban 25 egyéb hatóanyagokkal, például inszekticidekkel, csalogatószerekkel, sterilizálószerekkel, baktériumölő szerekkel, akaricidekkel, nematocidekkel, fungicidekkel, növekedésszabályozó anyagokkal vagy herbicidekkel alkotott elegyeik formájában is lehetnek. Az inszekticidek közé tartoznak például a 30 foszforsavészterek, karbamátok, karbonsav-észterek, klórozott szénhidrogének, fenil-karbamidok, mikroorganizmusok által termelt anyagok.

Közelebbről az alábbi vegyületeket említhetjük:

fungicid hatású vegyületek:

- aldimorf, ampropilfosz, ampropilfosz-kálium, andoprim, anilazin, azakonazol, azoxisztrobin, benalaxil, benodanil, benomil, benzamakril, benzamakril-izobutil, bialafosz, binapakril, bifenil, bitertanol, blasticidin-S, bromukonazol,
- 5 bupirimat, butiobat, kalcium-poliszulfid, capsimicin, captafol, captán, karbendazim, karboxin, carvon, kinometionát, klobentiazon, klórfenazol, kloroneb, kloropikrin, klorotalonil, klozolinat, klozilakon, cufraneb, cimoxanil, ciprokonazol, ciprodinil, ciprofuram, debakarb, diklorofen, diklobutrazol, diklofluamid, diklomezin, diklorán, dietofenkarb, difenokonazol, dimetirimol,
- 10 dimetomorf, dinikonazol, dinikonazol-M, dinocap, difenilamin, dipirition, ditalimfosz, ditianon, dodemorf, dodin, drazoxolon, edifenfosz, epoxikonazol, etakonazol, etirimol, etridiazol, famoxadon, fenapanil, fenarimol, fenbukonazol, fenfuram, fenitropán, fempiklonil, fenpropidin, fenpropimorf, fentinacetát, fentinhidroxid, ferbam, ferimzon, fluazinam, flumetover, fluoromid,
- 15 flukinkonazol, flurprimidol, flusilazol, fluszulfamid, flutolanil, flutriafol, folpet, foszetil-alumínium, foszetil-nátrium, ftalid, fuberidazol, furalaxil, furametpir, furkarbonil, furkonazol, furkonazol-cisz, furmeciklox, guazatin, hexaklórbenzol, hexakonazol, himexazol, imazalil, imibenkonazol, iminoctadin, iminoctadin-albezilát, iminoctadin-triacetát, jodokarb, ipkonazol, iprobenfosz (IBP),
- 20 iprodione, irumamicin, izoprothiolán, izovaledion, kasugamicin, kreloxim-metil, rézvegyületek, például: réz-hidroxid, réz-naftenát, réz-oxiklorid, réz-szulfát, réz-oxid, oxin- réz és Bordeaux-elegy, mancozeb, maneb, meferimzon, mepanipirim, mepronil, metalaxil, metkonazol, metaszulfokarb, metfuroxám, metirám, metomeclám, metszulfovax, mildiomicin, miklobutanil,
- 25 miklozolin, nikkel-dimetilditiokarbamat, nitrotál-izopropil, nuarimol, ofurac, oxadixil, oxamokarb, oxolinsav, oxikarboxim, oxifentiin, paklobutrazol, pefurazoát, penkonazol, pencikuron, foszdifen, pimaricin, piperalin, polioxin, polioxorim, probenazol, prokloraz, procimidon, propamokarb, propanozin-nátrium, propikonazol, propineb, pirazofosz, pirifenox, pirimetanil, piroquilon,
- 30 piroxifur, kvinkonazol, kvintozen (PCNB), kén és kénkészítmények, tebukonazol, tekloftalám, tecnazen, tetciklakis, tetrakonazol, tiabendazol, ticiofen, tifluzamid, tiofanát-metil, tirám, tioximid, tolklofosz-metil, tolilfluamid,

triadimefon, triadimenol, triazbutil, triazoxid, triklamid, triciklazol, tridemorf, triflumizol, triforin, tritikonazol, unikonazol, validamicin A, vinklozolin, vinikonazol, zarilamid, zineb, ziram, valamint

Dagger G, OK-8705, OK-8801 márkanévű vegyületek,

- 5 α -(1,1-dimetiletil)- β -(2-fenoxi-etil)-1*H*-1,2,4-triazol-1-etanol,
 α -(2,4-diklórfenil)- β -fluor- β -propil-1*H*-1,2,4-triazol-1-etanol,
 α -(2,4-diklórfenil)- β -metoxi- α -metil-1*H*-1,2,4-triazol-1-etanol,
 α -(5-metil-1,3-dioxan-5-il)- β -[[4-(trifluormetil)-fenil]-metilén]-1*H*-1,2,4-triazol-1-etanol,
- 10 (5*RS*,6*RS*)-6-hidroxi-2,2,7,7-tetrametil-5-(1*H*-1,2,4-triazol-1-il)-3-oktanon,
(E)- α -(metoxi-imino)-*N*-metil-2-fenoxi-fenilacetamid,
[2-metil-1-({1-(4-metilfenil)-etil}-amino)-karbonil]-propil-karbaminsav-1-izopropilészter,
1-(2,4-diklórfenil)-2-(1*H*-1,2,4-triazol-1-il)-etanon-*O*-(fenilmetil)-oxim,
- 15 1-(2-metil-1-naftalenil)-1*H*-pirrol-2,5-dion,
1-(3,5-diklórfenil)-3-(2-propenil)-2,5-pirrolidindion,
1-[(dijódmetil)-szulfonil]-4-metil-benzol,
1-[[2-(2,4-diklórfenil)-1,3-dioxolan-2-il]-metil]-1*H*-imidazol,
1-[[2-(4-klórfenil)-3-feniloxiranil]-metil]-1*H*-1,2,4-triazol,
- 20 1-(1-{2-[(2,4-diklórfenil)-metoxi]-fenil}-etenil)-1*H*-imidazol,
1-metil-5-nonil-2-(fenilmetil)-3-pirrolidinol,
2',6'-dibróm-2-metil-4'-trifluormetoxi-4'-trifluormetil-1,3-tiazol-5-karboxanilid,
2,2-diklór-*N*-[1-(4-klórfenil)-etil]-1-etil-3-metil-ciklopropánkarboxamid,
2,6-diklór-5-(metiltio)-4-pirimidinil-tio-cianát,
- 25 2,6-diklór-*N*-(4-trifluormetilbenzil)-benzamid,
2,6-diklór-*N*-[[4-(trifluormetil)-fenil]-metil]-benzamid,
2-(2,3,3-trijód-2-propenil)-2*H*-tetrazol,
2-[(1-metiletil)-szulfonil]-5-(triklórmetil)-1,3,4-tiadiazol,
2-[[6-dezoxi-4-*O*-(4-*O*-metil- β -D-glikopiranozil)- α -D-glükopiranozil]-amino}-4-
- 30 metoxi-1*H*-pirrolo[2,3-*d*]pirimidin-5-karbonitril,
2-aminobután,
2-bróm-2-(brómmetil)-pentándinitril,

- 2-klór-*N*-(2,3-dihidro-1,1,3-trimetil-1*H*-indén-4-il)-3-piridinkarboxamid,
 2-klór-*N*-(2,6-dimetilfenil)-*N*-(izotio-cianátmetil)-acetamid,
 2-fenilfenol (OPP),
 3,4-diklór-1-[4-(difluormetoxi)-fenil]-1*H*-pirrol-2,5-dion,
 5 3,5-diklór-*N*-{ciano[(1-metil-2-propinil)-oxi-]-metil}-benzamid,
 3-(1,1-dimetilpropil-1-oxo-1*H*-indén-2-karbonitril,
 3-[2-(4-klórifenil)-5-etoxi-3-izoxazolidinil]-piridin,
 4-klór-2-ciano-*N,N*-dimetil-5-(4-metilfenil)-1*H*-imidazol-1-szulfonamid,
 4-metil-tetrazolo[1,5-*a*]kinazolin-5(4*H*)-on,
 10 8-(1,1-dimetiletil)-*N*-etil-*N*-propil-1,4-dioxaspiro[4.5]dekán-2-metánamin,
 8-hidroxi-kinolinszulfát,
 9*H*-xantén-2-[(fenilamino)-karbonil]-9-karbonsav-hidrazid,
 bisz(1-metiletil)-3-metil-4-[(3-metilbenzoi)-oxi-]-2,5-tiofén-dicarboxilát,
cisz-1-(4-klórifenil)-2-(1*H*-1,2,4-triazol-1-il)-cikloheptanol,
 15 *cisz*-4-[3-[4-(1,1-dimetilpropil)-fenil-2-metilpropil]-2,6-dimetil-morfolin-
 hidroklorid,
 etil-[(4-klórifenil)-azo]-cianoacetát,
 káliumhidrogénkarbonát,
 metántetratiol-nátriumsó,
 20 1-(2,3-dihidro-2,2-dimetil-1*H*-indén-1-il)-1*H*-imidazol-5-karbonsav-
 metilészter,
N-(2,6-dimetilfenil)-*N*-(5-izoxazoli(karbonil)-DL-alanin-metilészter,
N-(klóracetil)-*N*-(2,6-dimetilfenil)-DL-alanin-metilészter,
N-(2,3-diklór-4-hidroxi-fenil)-1-metil-ciklohexánkarboxamid,
 25 *N*-(2,6-dimetilfenil)-2-metoxi-*N*-(tetrahydro-2-oxo-3-furanil)-acetamid,
N-(2,6-dimetilfenil)-2-metoxi-*N*-(tetrahydro-2-oxo-3-tienil)-acetamid,
N-(2-klór-4-nitrofenil)-4-metil-3-nitro-benzolszulfonamid,
N-(4-ciklohexilfenil)-1,4,5,6-tetrahydro-2-pirimidinamin,
N-(4-hexilfenil)-1,4,5,6-tetrahydro-2-pirimidinamin,
 30 *N*-(5-klór-2-metilfenil)-2-metoxi-*N*-(2-oxo-3-oxazolidinil)-acetamid,
N-(6-metoxi)-3-piridinil)-ciklopropánkarboxamid,
N-{2,2,2-triklór-1-[(klóracetil)-amino]-etil}-benzamid,

N-[3-klór-4,5-bisz(2-propiniloxi-)-fenil]-*N'*-metoxi-metánimidamid,

N-formil-*N*-hidroxi-DL-alanin-nátriumsó,

[2-(dipropilamino)-2-oxoetil]-etilfoszforamidotio-*O,O*-dietiléter,

S-fenil-fenilpropilfoszforamidotio-*O*-metiléter,

5 1,2,3-benzotiadiazol-7-karbotio-*S*-metiléter,

spiro[2*H*]-1-benzopiran-2,1'(3'*H*)-izobenzofurán]-3'-on;

baktericid hatású vegyületek:

bronopol, diklorofen, nitrapirin, nikkel-dimetilditio-karbamát, kasugamicin,

oktilinon, furánkarbonsav, oxitetraciklin, probenazol, streptomycin, tekloftalám,

10 réz-szulfát és más réz-készítmény.

Inszekticid, akaricid, nematocid hatású vegyületek:

abamektin, acefát, acetamiprid, akrinatrín, alanikarb, aldikarb, aldoxikarb,

alfacipermetrin, alfametrin, amitráz, avermektin, AZ 60541, azadiraktin,

azametifosz, azinfosz A, azinfosz M, azociklotin, *Bacillus popilliae*, *Bacillus*

15 *sphaericus*, *Bacillus subtilis*, *Bacillus thuringiensis*, bakulovírusok, *Beauveria*

bassiana, *Beauveria tenella*, bendiokarb, benfurakarb, benszultap,

benzoximát, betaciflutrin, bifenazát, bifentrin, bioetanometrin, biopermetrin,

BPMC, bromofosz A, bufenkarb, buprofezin, butatiofosz, butokarboxim,

butilpiridaben, cadusafosz, karbaril, karbofurán, karbofenotion, karboszulfán,

20 cartap, kloetokarb, klóretoxifosz, klórfenapir, klórfenvinfosz, klórfluazuron,

klórmefosz, klórpírifosz, klórpírifosz M, klovaortrin, cisz-reszmetrin,

ciszpermetrin, klocitrin, kloetokarb, klofentezine, cianofosz, cikloprén,

cikloprotrin, ciflutrin, cihalotrin, cihexatin, cipermetrin, ciromazin, deltametrin,

demeton M, demeton S, demeton-S-metil, diafentiuron, diazinon, diklórvos,

25 diflubenzuron,-dimetoát, dimetilvinfosz, diofenolán, diszulfoton, docusat-

sodium, dofenapin, efluszilanát, emamektin, empentrin, endoszulfán,

Entomopftora spp., eprinomektin, esfenvalerát, etiofenkarb, etion, etoprofosz,

etofenprox, etoxazol, etrimfosz, fenamifosz, fenazakin, fenbutatin-oxid,

fenitrothion, fenotiokarb, fenoxakrim, fenoxikarb, fenpropatrin, fenpirád,

30 fenpiritrin, fenpiroximát, fenvalerát, fipronil, fluazuron, flubrocitrinát,

flucikloxuron, flucitrinát, flufenoxuron, flutenzin, fluvalinát, fonofosz,

foszmetilán, fosztiazát, fubfenprox, furatiokarb, granulóz vírusok, halofenozid,

- HCH, heptenofosz, hexaflumuron, hexitiazox, hidroprén, imidaklopid, izazofosz, izofenfosz, izoxation, ivermektin, sejtmagvas poliéder vírusok, lambda-cihalotrin, lufenuron, malation, mekarbam, metaldehid, metamidofosz, *Metarhizium anisopliae*, *Metarhizium flavoviride*, metidation, metiokarb,
- 5 metomil, metoxifenozyd, metolkarb, metoxadiazon, mevinfosz, milbemektin, monocrotofosz, naled, nitenpirám, nitiazin, novaluron ometoát, oxamil, oxidemeton M, *Paecilomyces fumosoroseus*, paration A, paration M, permetrin, fentoát, forát, foszalon, foszmet, foszfamidon, foxim, pirimikarb, pirimifosz A, pirimifosz M, profenofosz, promekarb, propoxur, protiofosz, protoát,
- 10 pimetrozin, piraklofosz, piresmetrin, piretrum, piridaben, piridation, pirimidifen, piriproxifen, kvinalfosz, ribavirin, szalition, szebufosz, szelanrektin, szilafluofen, szpinoszad, szulfotep, szulprofosz, tau-fluvalinát, tebufenozide, tebufenpirád, tebupirimifosz, teflubenzuron, teflutrin, temefosz, temivinfosz, terbufosz, tetraklórvinfosz, teta-cipermetrin, tiametoxám, tiapronil, tiatrifosz,
- 15 tiociklám-hidrogénoxalát, tiodikarb, tiofanox, thuringiensin, tralocitrin, tralometrin, triaratén, triazamát, triazofosz, triazuron, triklofenidin, triklorfon, triflumuron, trimetakarb, vamidotion, vaniliprol, *Verticillium lecanii*, Yi 5302 márkanevű vegyület, zeta-cipermetrin, zolaprofosz, valamint
- (1*R*-*cisz*)-[5-(fenilmetil)-3-furanil]-metil-3-[(dihidro-2-oxo-3(2*H*)-furanilidén)-
- 20 metil]-2,2-dimetilciklopropánkarboxilát,
- (3-fenoxi-fenil)-metil-2,2,3,3-tetrametilciklopropánkarboxilát,
- 1-[(2-klór-5-tiazolil)metil]tetrahydro-3,5-dimetil-*N*-nitro-1,3,5-triazin-2(1*H*)imin,
- 2-(2-klór-6-fluorfenil)-4-[4-(1,1-dimetiletil)fenil]-4,5-dihidro-oxazol,
- 2-(acetlioxi)-3-dodecil-1,4-naftalindion,
- 25 2-klór-*N*-([4-(1-feniletoxi)-fenil]-amino)-karbonil-benzamid,
- 2-klór-*N*-([4-(2,2-diklór-1,1-difluoretoxi)-fenil]-amino)-karbonil-benzamid,
- 3-metilfenil-propilkarbamát,
- 4-[4-(4-etoxi-fenil)-4-metilpentil]-1-fluor-2-fenoxi-benzol,
- 4-klór-2-(1,1-dimetiletil)-5-[[2-(2,6-dimetil-4-fenoxi-fenoxi)-etil]tio]-
- 30 3(2*H*)piridazinon,
- 4-klór-2-(2-klór-2-metilpropil)-5-[(6-jód-3-piridinil)metoxi]-3(2*H*)piridazinon,
- 4-klór-5-[(6-klór-3-piridinil)metoxi]-2-(3,4-diklórfenil)-3(2*H*)piridazinon

- Bacillus thuringiensis EG-2348 törzs,
 [2-benzoil-1-(1,1-dimetiletil)]benzolsav-hidrazid,
 2,2-dimetil-3-(2,4-diklórfenil)-2-oxo-1-oxaspiro[4.5]dec-3-én-4-il-butánsavészter,
 {3-[(6-klór-3-piridinil)metil]-2-tiazolidinilidén}-ciánamid,
 5 dihidro-2-(nitrometilén)-2*H*-1,3-tiazine-3(4*H*)-karboxaldehid,
 etil-(2-[[1,6-dihidro-6-oxo-1-(fenilmetil)-4-piridazinil]oxi-}etil)-karbamát,
N-(3,4,4-trifluor-1-oxo-3-butenil)-glicin,
N-(4-klórfenil)-3-[4-(difluormetoxi)fenil]-4,5-dihidro-4-fenil-1*H*-pirazol-1-
 karboxamid,
 10 *N*-[(2-klór-5-tiazolil)metil]-*N'*-metil-*N'*-nitro-guanidin,
N-metil-*N'*-(1-metil-2-propenil)-1,2-hidrazindikarbotioamid,
N-metil-*N'*-2-propenil-1,2-hidrazindikarbotioamid,
 [2-(dipropilamino)-2-oxoetil]-etilfoszforamidotio-*O*,*O*-dietiléter.

- A találmány szerinti készítményekbe további, ismert hatóanyagokat, például herbicideket, termékenyítőszereket vagy növekedésszabályozó szereket is keverhetünk.

- Inszekticidként történő alkalmazásukkor a találmány szerinti hatóanyagok továbbá szokásos készítményeikben, valamint az azokból előállított alkalmazási formákban szinergista anyagokkal kombinációban is előfordulhatnak.
- 20 Szinergista anyagok azok a vegyületek, amelyek a találmány szerinti hatóanyag hatását növelik anélkül, hogy a hozzáadott szinergista anyagnak önmagának hatásosnak kellene lennie.

- A szokásos készítményekből előállított felhasználási formák hatóanyag-tartalma tág határok között változhat. A felhasználási formák hatóanyag-
- 25 koncentrációja 0,0000001 és 95 tömeg%, előnyösen 0,0001 és 1 tömeg% között lehet.

Az alkalmazás a felhasználási formának megfelelő módon történhet.

- Az egészségre ártalmas kártevők és a raktározott készleteket megtámadó kártevők ellen alkalmazva a találmány szerinti hatóanyagok kitűnnek azzal,
- 30 hogy fán és agyagon rendkívül tartós a hatásuk, valamint a meszes területeken jó alkális stabilitásuk tűnik ki.

Amint azt a fentiekben már ismertettük minden növény és annak bármely

része kezelhető a találmány szerinti megoldással. Az egyik előnyös kiviteli alakban vad- és kultúrnövény-változatok, illetve a szokásos biológiai nemesítéssel, például fajkeresztezéssel vagy protoplasztfúzióval kapott növények kezelhetők. Egy másik előnyös kiviteli alak szerint a transzgenikus növényeket és az adott esetben a szokásos módszerekkel kombinált géntechnológiai (génse-

5 bészeti) módszerek útján kapott kultúrnövény-változatokat, illetve azok részeit is kezelhetjük. A „részek”, „növények részei”, valamint a „növényi részek” kifejezéseket a fentiekben ismertettük.

Különösen előnyösen a kereskedelmi forgalomban lévő vagy használt

10 növények és kultúrnövény-változatok kezelhetők a találmány szerinti megoldással.

A növény fajtától vagy a kultúrnövény-változattól, azok elhelyezkedésétől és a termesztési körülményektől (talajtól, klímától, tenyésztési időszaktól, tápláléktól) függően a találmány szerinti kezelés szuperadditív (szinergetikus) hatásokat eredményezhet. Ilyen szuperadditív hatás lehet például az alkalmazási

15 arány csökkenése és/vagy a hatásspektrum szélesedése és/vagy a találmány szerint alkalmazandó vegyületek vagy készítmények hatásának fokozódása, jobb növénytermesztés, magas vagy alacsony hőmérsékletre mutatott fokozott tolerancia, szárazság esetében vagy vízre vagy a talaj sótartalmára mutatott

20 fokozott tolerancia, virágzási teljesítmény fokozódása, betakarítás egyszerűsödése, megérés felgyorsulása, betakarítási hozamok növekedése, a betakarított termékek minőségének javulása és/vagy tápértékének növekedése, a betakarított termékek tárolási stabilitásának és/vagy feldolgozhatóságának javulása, és amelyek felülmúlják a jelenleg elvárt hatásokat.

A találmány szerinti hatóanyagokkal vagy az azokat tartalmazó készítményekkel kezelendő előnyös transzgenikus növények és kultúrnövény-változatok olyan növények, amelyek a kezelt növénybe különösen előnyösen

25 hasznos tulajdonságokat („jellemvonásokat”) átvivő genetikai anyagot fogadnak be. Ilyen tulajdonságok például a jobb növénytermesztés, magas vagy alacsony

30 hőmérsékletre mutatott fokozott tolerancia, szárazság esetében vagy vízre vagy a talaj sótartalmára mutatott fokozott tolerancia, virágzási teljesítmény fokozódása, betakarítás egyszerűsödése, megérés felgyorsulása, betakarítási hoza-

mok növekedése, a betakarított termékek minőségének javulása és/vagy tápértékének növekedése, a betakarított termékek tárolási stabilitásának és/vagy feldolgozhatóságának javulása. További különösen fontos ilyen tulajdonság például növények állati és mikrobiális kártevők elleni védekező képesség javu-

5 lása, ilyen kártevők a rovarok, atkák, fitopatogén gombák, baktérium és/vagy vírusok, valamint a növények bizonyos herbicid hatású vegyületekkel szembeni tolerancia fokozódása. Ilyen transzgenikus növények példáuliként megemlíthetjük a fontos termést hozó növényeket, például a gabonanövények (így búza, rizs), kukorica, szója, babok, burgonyák, gyapot, olajrepce és gyümölcsös növények

10 (így például az almás, körtés, citrus gyümölcsöket és szőlős gyümölcsöket hozó növények), különösen előnyösek a kukorica, szója, babok, burgonyák, gyapot és az olajrepce. Különösen előnyös jellemvonás növényben termelődő toxinok által, különösen a *Bacillus thuringiensis* fajtából származó genetikai anyag (például CryIA(a), CryIA(b), CryIA(c), CryIIA, CryIIIA, CryIIIB2, Cry9c Cry2Ab,

15 Cry3Bb és CryIF gének, és ezek kombinációi) által termelt toxinok előidézte a növény rovarok elleni védekezőképességének fokozódása (a továbbiakban ezeket „Bt növények”-nek jelöljük). További különösen előnyös jellemvonás a növények bizonyos herbicid hatású vegyületekkel szembeni tolerancia fokozódása, ilyen herbicid hatóanyagok például az imidazolinonok,

20 szulfonilkarbamidok, glifoszfát vagy a foszfinotricin (például a „PAT”-gén). A transzgenikus növényben a kívánt jellemvonást átvivő gének egymással társíthatók. Így „Bt növények”-ént a következőket említhetjük meg: Yield Guard® (például kukorica, gyapot, szója), KnockOut® (például kukorica), Starlink® (például kukorica), Bollgard® (gyapot), Nucotn® (gyapot) és NewLeaf® (burgonya) márkanév alatt kereskedelmi forgalomban kapható kukoricafajták, gyapotfajták, szójafajták és burgonyafajták. Herbicid hatóanyagokkal szemben toleráns növényekként a következőket említhetjük meg: Roundup Ready® (glifoszfáttal szemben mutatnak toleranciát, például kukorica, gyapot, szója), Liberty Link® (foszfinotricinnel szemben mutatnak toleranciát, például repcék),

25 IMI® (imidazolinonokkal szemben mutatnak toleranciát) és STS® (szulfonilkarbamátokkal szemben mutatnak toleranciát, például kukorica) márkanév alatt kereskedelmi forgalomban kapható kukoricafajták, gyapotfajták és

30

szójafajták. Herbicid hatóanyagokkal szemben rezisztens növényként (herbicid hatóanyagokkal szemben toleranciára szokásos módon termesztett növény) a Clearfield® (például kukorica) márkanév alatt kereskedelmi forgalomban kapható fajtákat említjük meg. Az magától értetődik, hogy a fenti ismertetés alkalmazandó minden olyan fejlesztendő genetikai jellemvonással rendelkező kultúrnövény-változatokra is, amelyeket a jövőben fejlesztenek ki és/vagy kerülnek kereskedelmi forgalomba.

A találmány megvalósításában a fenti növényeket egy különösen előnyös módon a találmány szerinti (I) általános képletű vegyületekkel vagy a találmány szerinti hatóanyag elegyekkel kezelhetjük. A fentiekben ismertetett hatóanyag vagy hatóanyagelegy előnyös tartományok ugyancsak alkalmazhatók az előbbi növények esetében is. Különösen kihangsúlyozzuk a jelen leírásban kifejezetten megnevesített vegyületekkel vagy azok elegyeivel történő kezeléseket.

A találmány szerinti hatóanyagok nem csak a növényeket károsító, az egészségre ártalmas és a raktározott készleteket megtámadó kártevők ellen hatékonyak, hanem az állatgyógyászat területén is, ahol az állatokon élősködő paraziták (ektoparaziták), például pajzskullancs, bőrkullancs, rühátka, legyek (szűrő és rágó egyaránt), parazita életmódot folytató légylárvák, tetvek és bolhák ellen alkalmazhatók. Ezekhez a parazitákhoz tartoznak:

20 az *Anoplurida* rendből például *Haematopinus spp.*, *Linognathus spp.*, *Pediculus spp.*, *Phtirus spp.*, *Solenopotes spp.*;

a *Mallophagida* rendből és az *Amblycerina* és *Ischnocerina* szubrendből például *Trimenopon spp.*, *Menopon spp.*, *Trinoton spp.*, *Bovicola spp.*, *Werneckiella spp.*, *Lepikentron spp.*, *Damalina spp.*, *Trichodectes spp.*, *Felicola*
25 *spp.*;

a *Diptera* rendből és a *Nematocerina* és *Brachycerina* szubrendből például *Aedes spp.*, *Anopheles spp.*, *Culex spp.*, *Simulium spp.*, *Eusimulium spp.*, *Phlebotomus spp.*, *Lutzomyia spp.*, *Culicoides spp.*, *Chrysops spp.*, *Hybomitra spp.*, *Atylotus spp.*, *Tabanus spp.*, *Haematopota spp.*, *Philipomyia*
30 *spp.*, *Braula spp.*, *Musca spp.*, *Hydrotaea spp.*, *Stomoxys spp.*, *Haematobia spp.*, *Morellia spp.*, *Fannia spp.*, *Glossina spp.*, *Calliphora spp.*, *Lucilia spp.*, *Chrysomyia spp.*, *Wohlfahrtia spp.*, *Sarcophaga spp.*, *Oestrus spp.*,

Hypvagyma spp., *Gasterophilus spp.*, *Hippobosca spp.*, *Lipoptena spp.*,
Melophagus spp.;

a *Siphonapterida* rendből például *Pulex spp.*, *Ctenocephalides spp.*,
Xenopsylla spp., *Ceratophyllus spp.*;

5 a *Heteropterida* rendből például *Cimex spp.*, *Triatoma spp.*, *Rhodnius*
spp., *Panstrongylus spp.*;

a *Blattarida* rendből például *Blatta orientalis*, *Periplaneta americana*,
Blattella germanica, *Supella spp.*;

10 az *Acaria* (*Acarida*) szubrendből, valamint a *Meta-* és *Mesostigmata*
rendből például *Argas spp.*, *Ornithodoros spp.*, *Otobius spp.*, *Ixodes spp.*,
Amblyomma spp., *Boophilus spp.*, *Dermacentor spp.*, *Haemophysalis spp.*,
Hyalomma spp., *Rhipicephalus spp.*, *Dermanyssus spp.*, *Raillietia spp.*,
Pneumonyssus spp., *Sternostoma spp.*, *Varroa spp.*;

15 az *Actinedida* (*Prostigmata*) és az *Acaridida* (*Astigmata*) rendből példá-
ul *Acarapis spp.*, *Cheyletiella spp.*, *Ornithocheyletia spp.*, *Myobia spp.*,
Psorergates spp., *Demodex spp.*, *Trombicula spp.*, *Listrophorus spp.*, *Acarus*
spp., *Tyrophagus spp.*, *Caloglyphus spp.*, *Hypodectes spp.*, *Pterolichus spp.*,
Psoroptes spp., *Chorioptes spp.*, *Otodectes spp.*, *Sarcoptes spp.*, *Notoedres*
spp., *Knemidocoptes spp.*, *Cytodites spp.*, *Laminosioptes spp.*.

20 A hatóanyagok kullancsok, például az *Amblyomma hebraeum*, parazita
legyek, például a *Lucilia cuprina* és legyek, például a *Ctenocephalides felis*
összes lárvás fejlődési szakasza ellen kiváló hatást mutatnak.

A találmány szerinti (I) általános képletű hatóanyagok ízeltlábúak ellen is
alkalmazhatók, amelyek a mezőgazdasági haszonállatokat, például szarvas-
25 marhát, juhot, kecskét, lovat, sertést, szamarat, tevét, bivalyt, nyulat, csirkét,
pulykát, kacsát, libát, méhet, ezenkívül a háziállatokat, például a kutyát, macs-
kát, díszmadarat, díszhalat, valamint az úgynevezett kísérleti állatokat, például
hörcsögöt, tengerimalacot, patkányt és egeret károsítják. A fenti ízeltlábúak el-
leni hatás következtében a pusztulás és a teljesítménycsökkenés (a hús-, tej-,
30 gyapjú-, bőr-, tojás- vagy mézhozamban stb.) mérséklődik, ezért a találmány
szerinti hatóanyagok alkalmazásával gazdaságosabb és egyszerűbb állattartás
válik lehetővé.

A találmány szerinti hatóanyagokat az állatgyógyászatban szokásos módon alkalmazhatjuk, enterális adagolással, például tabletták, kapszulák, italok, állatgyógyászati folyékony készítmények, granulátumok, kenőcsök, bóluszok formájában, táplálékba keverve, vagy kúpok formájában, vagy parenterális adagolással, például injekciók (intramuszkuláris, szubkután, intravénás, intraperitoneális, stb.), implantátumok formájában; nazális alkalmazással, intradermálisan, például bemerítő- vagy fürdetőszerek, permetek, ráöntéses készítmények (pour-on vagy spot-on készítmények), lemosószerek, porozószer-
 5 rek formájában, valamint hatóanyagot tartalmazó formázott testek segítségével, mint amilyenek például a nyakörvek, a fülbe vagy farokra helyezett bélyegek, végtagszalagok, kantárok, jelölőeszközök stb.

Haszonállatok, baromfi, háziállatok stb. kezelésekor a találmány szerinti (I) általános képletű hatóanyagokat készítmények (így porok, emulziók, szaba-
 don folyó készítmények) alakjában alkalmazhatjuk, ezek 1–80 tömeg% találmány szerinti hatóanyagot tartalmazhatnak és azok közvetlenül vagy 100–
 15 10000-szeres hígításban kerülnek alkalmazásra, például kémiai fürdő formájában.

Azt találtuk továbbá, hogy a találmány szerinti (I) általános képletű vegyületek az olyan rovarok ellen is kiválóan hatásosak, amelyek a készleteket és
 20 nyersanyagokat támadják meg. Példaként és előnyösként az alábbi rovarokat – de nem csak ezekre korlátozva – említhetjük meg:

bogarak például *Hylotrupes bajulus*, *Chlorphorus pilosis*, *Anobium punctatum*, *Xestobium rufovillosum*, *Ptilinus pecticornis*, *Dendrobium pertinex*, *Ernobius mollis*, *Priobium carpini*, *Lyctus brunneus*, *Lyctus africanus*, *Lyctus planicollis*, *Lyctus linearis*, *Lyctus pubescens*, *Trogoxi-lon aequale*, *Minthes rugicollis*, *Xyleborus spec.* *Tryptodendron spec.*, *Apate monachus*, *Bostrychus capucins*, *Heterobostrychus brunneus*, *Sinoxi-lon spec.* *Dinvagyus minutus*;

a Hymenopterons rendből például *Sirex juvencus*, *Urocerus gigas*, *Urocerus gigas taignus*, *Urocerus augur*;

termeszek például *Kaloterme flavicollis*, *Cryptoterme brevis*, *Heteroterme indicola*, *Reticuliterme flavipes*, *Reticuliterme santonensis*, *Reticuliterme lucifugus*, *Mastoterme darwiniensis*, *Zootermopsis*

nevadensis, *Coptotermes formosanus*;

ezüstmolyok például *Lepisma saccharina*.

A leírásban használt „raktározott anyagok és nyersanyagok” kifejezés nem-élő anyagokra, például, előnyösen műanyagokra, ragasztókra, enyvekre, papírokra és kartonra, bőrre, fa és fafeldolgozási termékekre, valamint bevonóanyagokra vonatkozik.

A találmány szerinti hatóanyagokkal vagy az azokat tartalmazó készítményekkel például az alábbi fa és fafeldolgozási termékeket lehet védelmezni: építésfa, fagerendák, vasúti talpfák, hídszerkezeti részek, csónakstégek, fából készült járművek, ládák, raklapok, konténerek, távíróoszlopok, faburkolatok, nyílászárók, rétegelt falemezek, pozdorjalemezek, olyan fatermékek, amelyek az ácsszakmákban vagy a házépítésben felhasználásra kerülnek.

A találmány szerinti hatóanyagokat önmagukban, koncentrátumok formájában vagy az általánosan szokásos készítmények, például porok, granulátumok, oldatok, szuszpenziók, emulziók vagy kenőcsök formájában alkalmazhatjuk.

A készítményeket önmagukban ismert módon állíthatjuk elő, például úgy, hogy a találmány szerinti hatóanyagot legalább egy oldó- ill. hígítószerrel, emulgeálószerrel, diszpergálószerrel és/vagy kötő- vagy rögzítő-anyaggal, valamint vízlepergető anyagokkal, adott esetben szárítóanyagokkal és UV-stabilizáló anyagokkal és adott esetben színezőanyagokkal és pigmentekkel, valamint további feldolgozási segédanyagokkal összekeverjük.

A fa és a fából készített félkésztermék védelmét szolgáló inszekticid hatású készítmény vagy koncentrátum 0,0001 és 95 tömeg%, előnyösen 0,001 és 60 tömeg% közötti találmány szerinti hatóanyagot tartalmaz.

Az alkalmazott készítmény vagy koncentrátum mennyisége a rovarok fajtájától és előfordulásától, valamint a közegtől függ. Az optimális mennyiség minden esetben teszt sorozatokkal határozható meg. Általában azonban elegendőnek bizonyult, ha a védeni kívánt anyag tömegére vonatkoztatva 0,0001 és 20 tömeg%, előnyösen 0,001 és 10 tömeg% közötti hatóanyag alkalmazunk.

Oldó- és/vagy hígítószerként valamely szerves kémiai oldószer vagy

oldószerkeleg és/vagy valamely nem illékony, olajos vagy olajszerű szerves kémiai oldószer vagy oldószerkeleg és/vagy valamely poláros szerves kémiai oldószer vagy oldószerkeleg és/vagy víz szolgál, adott esetben valamely emulgálószerrel és/vagy nedvesítőszerrel.

5 Szerves kémiai oldószerként előnyösen olajos vagy olajszerű 35-nél nagyobb párolgási számú és 30°C feletti, előnyösen 45°C feletti lobbanáspontú oldószer alkalmazunk. Az ilyen nem-illékony, vízben nem-oldódó, olajos vagy olajszerű oldószer példák az ásványiolajok vagy azok aromás frakciója vagy ásványiolajat, előnyösen könnyűbenzint, petróleumot és/vagy
10 alkilbenzolt tartalmazó oldószerkelegyek. Előnyösek a 170°C és 220°C közötti forrástartományú ásványiolajok, a 170°C és 220°C közötti forrástartományú könnyűbenzinek, a 250°C és 350°C közötti forrástartományú orsóolaj, a 160°C és 280°C közötti forrástartományú petróleum és aromás-frakciók, terpentinolaj, és más hasonló.

15 Az egyik előnyös kiviteli alakban a 180°C és 210°C közötti forrástartományú folyékony alifás szénhidrogének vagy a 180°C és 220°C közötti forrástartományú alifás és aromás szénhidrogének elegyei és/vagy orsóolaj és/vagy valamely monoklórnaftalin, előnyösen α -klórnaftalin kerül felhasználásra.

Az olajos vagy olajszerű, 35 feletti párolgási számú és 30°C, különösen
20 45°C feletti lobbanáspontú nem-illékony szerves oldószerkeleg egy része könnyen vagy közepesen illó szerves oldószerkeleggel kiváltható, feltéve, hogy az oldószerkeleg párolgási száma szintén 35 feletti, lobbanáspontja 30°C, előnyösen 45°C feletti, és az inszekticid/fungicid hatású elegy oldható vagy emulgeálható ebben az oldószerkelegben.

25 Egy előnyös kiviteli alaknak megfelelően a szerves kémiai oldószer vagy oldószerkeleg egy része alifás poláros szerves kémiai oldószerrel vagy oldószerkeleggel helyettesíthető. Előnyös, ha az alifás szerves kémiai oldószer hidroxil- és/vagy észter- és/vagy étercsoportokat tartalmazó vegyület, mint például a glikol-éterek, észterek és más hasonló.

30 A találmány keretében szerves kémiai kötőanyagon az önmagukban ismert vízben hígítható és/vagy az alkalmazott szerves kémiai oldószerkelegben oldódó, diszpergálható vagy emulgeálható műgyantákat és/vagy száradó olaj-

jokat értjük. Közelebbről a kötőanyag előnyösen akrilgyanta, vinilgyanta, például polivinil-acetát, poliésztergyantát, polikondenzációs vagy poliaddíciós gyanta, poliuretángyanta, alkidgyanta vagy módosított alkidgyanta, fenolgyanta, szénhidrogéngyanta, például indol-kumarongyanta, szilikon-gyantát, száradó (például növényi eredetű) olajokat és/vagy fizikai úton száradó, természetes vagy szintetikus gyanta bázisú kötőanyag.

A kötőanyagként alkalmazott műgyanta emulzió, diszperzió vagy oldat alakjában kerülhet alkalmazásra. Kötőanyagként bitumen vagy bitumen jellegű anyagok is alkalmazhatók legfeljebb 10 tömeg% mennyiségben. Járulékosan önmagukban ismert színezőanyagok, pigmentek, vízlepergető anyagok, illatosítók, inhibitorok vagy korrózió ellen védő anyagok is alkalmazhatók.

A találmány szerint a készítmény vagy a koncentrátum szerves kémiai kötőanyagként előnyösen legalább egy alkidgyantát vagy módosított alkidgyantát és/vagy egy száradó növényiolajat tartalmaz. A legalább 45 tömeg%, előnyösen 50-68 tömeg% olajat tartalmazó alkidgyantát előnyben részesítjük.

Az említett kötőanyag részben vagy teljesen fixálószerrel (eleggyel) vagy lágyítóval (eleggyel) helyettesíthető. Ezek az adalékok a hatóanyag elillanását, kristályosodását, ill. kicsapását gátolják. Az alkalmazott kötőanyag tömegére vonatkoztatva előnyösen 0,01 és 30 tömeg% közötti kötőanyag váltható ki.

A lágyítók lehetnek például: ftálsavészterek, így dibutil-, dioktil- vagy benzil-butil-ftalát, foszforsavészterek, így tributil-foszfát, adipinsavészterek, így di(2-etil-hexil)-adipát, sztearátok, így butilsztearát vagy amilsztearát, oleátok, így butil-oleát, glicerín-éterek vagy nagyobb móltömegű glikoléterek, glicerínészterek valamint p-toluolsulfonsavészterek.

A fixálószerrek poli(vinil-alkil-éter)-eken, például poli(vinil-metil-éter)-en vagy ketonokon, például benzofenonon, etilén-benzofenonon alapulnak.

Oldó- vagy hígítószerként főleg víz jöhet számításba, adott esetben egy vagy több fentiekben ismertetett szerves kémiai oldó-, illetve hígítószerrel, emulgeálószerrel vagy diszpergálószerrel együtt.

A faanyag különösen hatásos védelme ipari impregnáló eljárásokkal, például vákuum-, kettős vákuum- vagy nyomás alatti impregnálással érhető el.

Az azonnali alkalmazására szánt készítmények adott esetben további inszekticid hatású vegyületeket és adott esetben egy vagy több fungicid hatású vegyületet tartalmazhatnak. Hozzákeverhető hatóanyag-partnerként előnyösen a WO 94/29968 számú közrebocsátási iratban ismertetett inszekticid és fungicid hatású vegyületeket jöhetnek számításba. Az e dokumentumban megnevezett vegyületek a jelen bejelentés kifejezett részét képezik.

Különösen előnyösen a találmány szerinti hatóanyagokkal összekeverhető egyéb hatóanyagok közé az alábbi inszekticidek, például klorpirifosz, foxim, szilafluofin, alfametrin, ciflutrin, cipermetrin, deltametrin, permetrin, imidakloprid, NI-25, flufenoxuron, hexaflumuron, transzflutrin, tiakloprid, metoxifenozyd és triflumuron, és fungicidek, például epoxikonazol, hexakonazol, azakonazol, propikonazol, tebukonazol, ciprokonazol, metkonazol, imazalil, diklórfluanid, tolilfluánid, 3-jód-2-propinil-butylkarbamát, N-oktil-izotiazolin-3-on és 4,5-diklór-N-oktil-izotiazolin-3-on tartoznak.

Ezzel egyidejűleg a találmány szerinti vegyületek alkalmazhatók algásodás ellen sósvízzel vagy brakkvízzel érintkezésben lévő tárgyak, például hajótestek, védőfalak, hálóanyagok, épületek, kikötőkötelek és jelzőrendszerek védelmére. A szesszilis *Oligochaeta*, például a *Serpulidae*, a kagylók és a *Ledamorpha* (kacsakagyló) rendből származó fajták, például a *Lepas*- és a *Scalpellum*-fajták, vagy a *Balanomorpha* (tengeri makk) rendből származó fajták, például a *Balanus*- vagy a *Pollicipes*-fajták által okozott algásodás fokozza a hajó súrlódásos lassulását és ennek következményeként a fokozott energia felhasználás valamint a szárazdokkba vontatott állapotban való tartózkodás gyakoriságának növekedése miatt egy jelentős üzemeltetési költség-növekedéshez vezet.

A fenti algákon kívül különösen fontosak például az *Ectocarpus sp.* és *Ceramium sp.*, a szesszilis *Entomostraka* rendből származó fajták, azaz a *Cirripedia* (kacslábú rákok) generikus név alatt ismert fajták által okozott algásodás.

Meglepő módon azt találtuk, hogy a találmány szerinti vegyületek önmagukban vagy más hatóanyagokkal társítva kiváló algásodást gátló hatással rendelkeznek.

A találmány szerinti vegyületek önmagukban vagy más hatóanyagokkal kombinációban való alkalmazása hozzájárul nehézfémek, például bisz(trialkil-
ón)-szulfidok, tri-*n*-butil-ón-laurát, tri-*n*-butil-ón-klorid, réz(I)-oxid, trietil-ón-
klórid, tri-*n*-butil(2-fenil-4-klór-fenoxi)-ón, tributil-ón-oxid, molibdén-diszulfid,
5 antimon-oxid, poli(butil-titanát), fenil-(biszpiridin)-bizmut-klorid, tri-*n*-butil-ón-
fluorid, mangán-etilén-bisziokarbamát, cink-dimetil-ditiokarbamát, cink-etilén-
bisz(tiokarbamát), 2-piridintiol-1-oxid cink- és rézsói, biszdimetilditiokarbamoil-
cink-etilén-bisziokarbamát, cink-oxid, réz(I)-etilen-biszditiokarbamát, réz-
tiocianát, réz-naftenát és tributil-ón-halogenidek diszperzióban történő alkal-
10 mazásukhoz vagy ezen vegyületek koncentrációja lényegesen csökkenthető.

Az azonnali alkalmazásra szánt algásodást gátló mázok adott esetben egyéb hatóanyagokat, előnyösen algicid, fungicid, herbicid, molluszcicid, vagy
egyéb algásodást gátló hatóanyagokat tartalmazhatnak. A találmány szerinti
algásodást gátló mázzal kombinációban előnyösen az alábbi hatóanyagok al-
15 kalmazhatók:

algicid hatású vegyületek: 2-*terc*-butilamino-4-ciklopropilamino-6-
metiltio-1,3,5-triazin, diklorofén, diuron, endotal, fentinacetát, izoproturon,
metabenzotiazuron, oxifluorfen, kvinoklamin és terbutrin;

fungicid hatású vegyületek: benzo[*b*]tio-fenkarbonsavciklohexilamid-
20 S,S-dioxid, diklofluamid, fluorfolpet, 3-jód-2-propinil-butylkarbamát, toliifluamid
és azolok, így azakonazol, ciprokonazol, epoxikonazol, hexakonazol,
metkonazol, propikonazol és tebukonazol;

molluszcicid hatású vegyületek: fentinacetát, metaldehid, metiokarb,
nikloszamid, tiodikarb és trimetakarb;

25 valamint az alábbi szokásos algásodást gátló vegyületek:

4,5-diklór-2-oktil-4-izotiazolin-3-on, dijódmethylparatriszulfon, 2-(*N,N*-di-
metiltio-karbamoiltio)-5-nitrotiazil, 2-piridintiol-1-oxid kálium-, réz-, nátrium- és
cinksói, piridin-trifenilborán, tetrabutildiónoxán, 2,3,5,6-tetraklór-4-(metil-
szulfonil)-piridin, 2,4,5,6-tetraklóroizoftalonitril, tetrametiltiurám-diszulfid és
30 2,4,6-triklórfenilmaleinimid.

Az algásodást gátló készítmény 0,001 és 50 tömeg%, előnyösen 0,01
és 20 tömeg% közötti találmány szerinti hatóanyagot tartalmaz.

Továbbá a találmány szerinti algásodást gátló készítmények a szokásosan alkalmazott összetevőket, például az Ungerer, Chem. Ind. 37, 730-732 (1985), valamint a Williams, Antifouling Marine Coatings, Noyes, Park Ridge, (1973) szakirodalmi hivatkozási helyeken ismertetett összetevőket tartalmazhatják.

A találmány szerinti algásodást gátló mázok az algicid, fungicid, molluszcicid hatóanyagok és a találmány szerinti inszekticid hatóanyagok mellett különösen kötőanyagokat tartalmaznak.

Ilyen elismert kötőanyagok például a polivinil-klorid valamilyen oldószerrendszerben, klórozott gumi valamilyen oldószerrendszerben, akril-gyanta valamilyen oldószerrendszerben, különösen vizes rendszerben, vinil-klorid/vinil-acetát-kopolimerrendszer vizes diszperzióban vagy valamilyen szerves oldószerrendszerben, butadién/sztirol/akrilnitril gumi, száradó olajok, így lenmagolaj, gyantaészterek vagy dermedt gyanták kátránnyal vagy bituminnal készített elegyei, aszfalt és epoxi-vegyületek, kis mennyiségű klórozott gumi, klórozott polipropilén és vinil-gyanta.

A találmány szerinti mázok adott esetben tartalmazhatnak még olyan szerves pigmenteket, szerves pigmenteket vagy színezőanyagokat, amelyek előnyösen nem-oldódnak sós vízben. A mázok olyan további anyagokat tartalmazhatnak, amelyek hozzájárulnak a hatóanyag szabályozott felszabadulásához, ilyen például a fenyőgyanta. A találmány szerinti mázok tartalmazhatnak még plastifikálószer, reológiai sajátosságot befolyásoló módosító szereket és egyéb szokásos összetevőket. A találmány szerinti vegyületeket és a fentiekben ismertetett elegyeket öncsiszoló algásodást gátló rendszerekbe is beépíthetjük.

A találmány szerinti hatóanyagok ugyancsak hatásosak olyan állati kártevők, különösen rovarok, pókfélék és atkák leküzdésére, amelyekkel zárt helyeken, így például lakásokban, gyártelepeken, irodákban, járművek kabinjaiban stb. találkozunk. A találmány szerinti vegyületeket önmagukban vagy egyéb hatóanyagokkal és az ilyen rovarkártevők leküzdésére használt háztartási inszekticid termékek esetében használt segédanyagokkal együtt alkalmazhatjuk. Azok érzékeny és rezisztens fajok ellen hatásosak és a fejlődés

mindegyik fázisában lévő kártevők ellen alkalmazhatók. Így az előbbi kártevő fajok közé tartoznak az alábbiak:

- a *Scorpionidea* rendből például *Buthus occitanus*;
- az *Acarina* rendből például *Argas persicus*, *Argas reflexus*, *Bryobia* ssp., *Dermanyssus gallinae*, *Glyciphagus domesticus*, *Ornithodoros moubat*,
5 *Rhipicephalus sanguineus*, *Trombicula alfreddugesi*, *Neutrombicula autumnalis*, *Dermatophagoides pteronissimus*, *Dermatophagoides forinae*;
- az *Araneae* rendből például *Aviculariidae*, *Araneidae*;
- az *Opiliones* rendből például *Pseudoscorpiones chelifer*, *Pseudoscor-*
10 *piones cheiridium*, *Opiliones phalangium*;
- az *Isopoda* rendből például *Oniscus asellus*, *Porcellio scaber*;
- a *Diplopoda* rendből például *Blaniulus guttulatus*, *Polydesmus* spp.;
- a *Chilopoda* rendből például *Geophilus* spp.;
- a *Zygentoma* rendből például *Ctenolepisma* spp., *Lepisma saccharina*,
15 *Lepismodes inquilinus*;
- a *Blattaria* rendből például *Blatta orientalis*, *Blattella germanica*,
Blattella asahinai, *Leucophaea maderae*, *Panchlora* spp., *Parcoblatta* spp.,
Periplaneta australasiae, *Periplaneta americana*, *Periplaneta brunnea*,
Periplaneta fuliginosa, *Supella longipalpa*;
- a *Saltatoria* rendből például *Acheta domesticus*;
- a *Dermaptera* rendből például *Forficula auricularia*;
- az *Isoptera* rendből például *Kaloterms* spp., *Reticulitermes* spp. Az
Psocoptera rendből például *Lepinatus* spp., *Liposcelis* spp.;
- a *Coleptera* rendből például *Anthrenus* spp., *Attagenus* spp.,
25 *Dermestes* spp., *Latheticus oryzae*, *Necrobia* spp., *Ptinus* spp., *Rhizopertha dominica*,
Sitophilus granarius, *Sitophilus oryzae*, *Sitophilus zeamais*,
Stegobium paniceum;
- a *Diptera* rendből például *Aedes aegypti*, *Aedes albopictus*, *Aedes taeniorhynchus*,
Anopheles spp., *Calliphora erythrocephala*, *Chrysosoma*
30 *pluvialis*, *Culex quinquefasciatus*, *Culex pipiens*, *Culex tarsalis*, *Drosophila*
spp., *Fannia canicularis*, *Musca domestica*, *Phlebotomus* spp., *Sarcophaga carnaria*,
Simulium spp., *Stomoxys calcitrans*, *Tipula paludosa*;

a *Lepidoptera* rendből például *Achroia grisella*, *Galleria mellonella*, *Plodia interpunctella*, *Tinea kloacella*, *Tinea pellionella*, *Tineola bisselliella*;

a *Siphonaptera* rendből például *Ctenocephalides canis*, *Ctenocephalides felis*, *Pulex irritans*, *Tunga penetrans*, *Xenopsylla cheopis*;

5 a *Hymenoptera* rendből például *Camponotus herculeanus*, *Lasius fuliginosus*, *Lasius niger*, *Lasius umbratus*, *Monomorium pharaonis*, *Paravespula* spp., *Tetramorium caespitum*;

a *Anoplura* rendből például *Pediculus humanus capitis*, *Pediculus humanus corporis*, *Phthirus pubis*;

10 a *Heteroptera* rendből például *Cimex hemipterus*, *Cimex lectularius*, *Rhodinus prolixus*, *Triatoma infestans*.

Háztartási inszekticidként történő alkalmazásukkor a találmány szerinti hatóanyagok önmagukban vagy egyéb hatóanyagokkal, például foszforsavészterekkel, karbamátokkal, piretroidokkal, növekedésszabályozókkal vagy más ismert inszekticid osztályból származó hatóanyaggal együtt
15 használhatjuk.

A fentiekben említett készítményeket aeroszol, nyomás-mentes sprayek, például pumpás vagy permetező sprayek, automatikusan párasódó rendszerek, párasítók, habok, zselék, cellulózból vagy polimerből készült elpárolgó tablettákkal készített párologtató termékek, folyékony párologtatók, gél és membránpárologtatók, propeller által hajtott párologtatók, energia-mentes, vagy passzív párologtató rendszerek, molypapírok, molyzacskók és molygélek, granulátumokként vagy porokként szétszórandó csálétek vagy csalik alakjában alkalmazhatjuk.

25 A találmány szerinti vegyületek előállítását az alábbi példákkal szemléltetjük.

Előállítási példák

1. példa: (1) képletű vegyület előállítása

(A) eljárás

30 8,40 g (0,025 mol) 2-(4-brómfenil)-5-(2,6-difluorfenil)-3,4-dihidro-2H-pirrol, 7,60 g (0,03 mol) bisz(pinakolato)dibór, 7,40 g (0,075 mol) kálium-acetát, 0,56 g (75 mmol) PdCl₂[dppf] 150 ml dimetilacetamiddal készített ele-

gyét 3 óra hosszat keverjük 80°C hőmérsékleten. Ezután a kapott reakcióelegyet szobahőmérsékletre hűtjük, majd 6,30 g (0,026 mol) *N*-(5-bróm-2-pirimidinil)-*N*-etil-*N*-propilamint, 0,56 g (75 mmol) PdCl₂[dppf]-t és 75 ml, 2 mol/l-es vizes nátriumkarbonát-oldatot adagolunk hozzá, és 16 óra hosszat 5 80°C hőmérsékleten keverjük. A reakcióelegyet szobahőmérsékletre hűtjük, vízzel hígítjuk, és celitrétegen keresztül, szívással szűrjük. A szűrőlepenyt etilacetáttal mossuk, a szerves fázist vízzel mossuk, vízmentes nátriumszulfáton szárítjuk és szűrjük. Ezután 60 g florisilt adagolunk, majd az oldószert csökkentett nyomáson bepároljuk. A kapott nyersterméket szilikagél oszlopon 10 (futtatószer: *n*-hexán/etilacetát 4:1 térfogat/térfogat) történő kromatografálással tisztítjuk.

Így 5,10 g (az elméleti hozam 57 %-a) *N*-(5-{4-[5-(2,6-difluorfenil)-3,4-dihidro-2*H*-pirrol-2-il]fenil)-2-pirimidinil)-*N*-etil-*N*-propilamint kapunk.

HPLC: log P (pH értéke 2,3) = 3,57 (tisztaság: 99 %)

15 Op. 88-89°C.

2. példa: (2) képletű vegyület előállítása

(A) eljárás

10,10 g (0,025 mol) 4-[5-(2,6-difluorfenil)-3,4-dihidro-2*H*-pirrol-2-il]-feniltrifluormetánszulfonát, 7,60 g (0,03 mol) bisz(pinakolato)dibór, 7,40 g 20 (0,075 mol) kálium-acetát, 0,56 g (75 mmol) PdCl₂[dppf] 150 ml dimetilacetamiddal készített elegyét 3 óra hosszat keverjük 80°C hőmérsékleten. Ezután a kapott reakcióelegyet szobahőmérsékletre hűtjük, majd 4,72 g (0,026 mol) 2-bróm-5-trifluormetilpiridint, 0,56 g (75 mmol) PdCl₂[dppf]-t és 75 ml, 2 mol/l-es vizes nátriumkarbonát-oldatot adagolunk hozzá, és 16 óra hosszat 25 80°C hőmérsékleten keverjük. A reakcióelegyet szobahőmérsékletre hűtjük, vízzel hígítjuk, és celitrétegen keresztül, szívással szűrjük. A kapott szilárd maradékot etilacetáttal felvesszük, vízzel mossuk, vízmentes nátriumszulfáton szárítjuk és szűrjük. Ezután 60 g florisilt adagolunk, majd az oldószert csökkentett nyomáson bepároljuk. A kapott nyersterméket szilikagél oszlopon (futtatószer: *n*-hexán/etilacetát 4:1 térfogat/térfogat) történő kromatografálással 30 tisztítjuk.

Így 7,10 g (az elméleti hozam 71 %-a) 2-{4-[5-(2,6-difluorfenil)-3,4-

dihidro-2*H*-pirrol-2-il]fenil}-5-(trifluormetil)piridint kapunk.

HPLC: log P (pH értéke 2,3) = 3,25 (tisztaság: 97,90 %)

Op.: 125°C.

3. példa: (3) képletű vegyület előállítása

5 (B) eljárás

A reakcióedénybe először 15 ml dimetoxietánba visszünk 0,96 g (2,50 mmol) 5-(2,6-difluorfenil)-2-[4-(4,4,5,5-tetrametil-1,3,2-dioxaborolán-2-il)fenil]-3,4-dihidro-2*H*-pirrolt, ezután sorba 0,71 g (2,75 mmol) 5-bróm-2-(2,2,2-trifluoretoxi)pirimidint, 56 mg (0,075 mmol) PdCl₂[dppf]-t 3,75 ml és telített, 10 vizes nátrium-karbonátoldatot adagolunk, majd a reakcióelegyet 16 óra hossz-
szat 80°C hőmérsékleten keverjük. Ezután az elegyet szobahőmérsékletre hűtjük, majd vizet és etilacetátot adagolunk hozzá. A szerves fázist elválasztjuk, vízmentes nátriumszulfáton szárítjuk, szűrjük, majd az oldószert csökkentett nyomáson bepároljuk. A kapott nyerste-
15 méréket szilikagél oszlopon (futtató-
szer: n-hexán/etilacetát 9:1 → 3:1 térfogat/térfogat minden esetben) történő kromatografálással tisztítjuk.

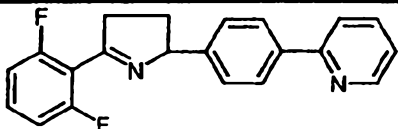
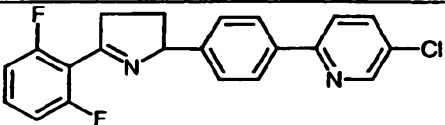
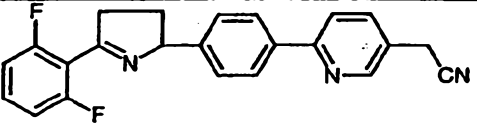
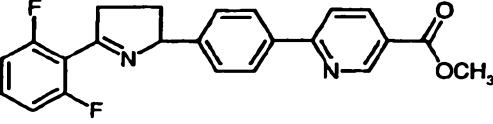
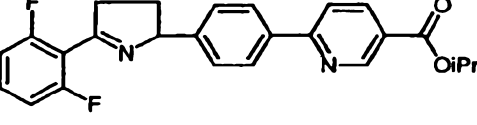
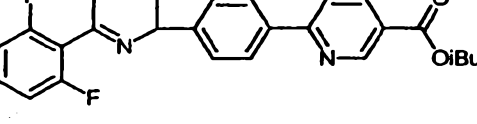
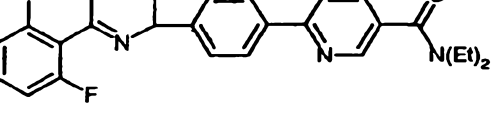
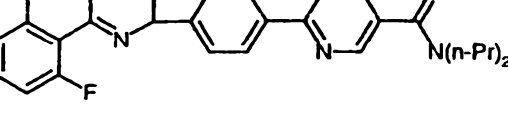
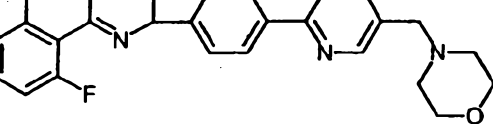
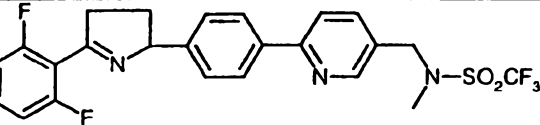
Így 0,71 g (az elméleti hozam 64 %-a) 5-{4-[5-(2,6-difluorfenil)-3,4-dihidro-2*H*-pirrol-2-il]fenil}-2-(2,2,2-trifluoretoxi)piridint kapunk.

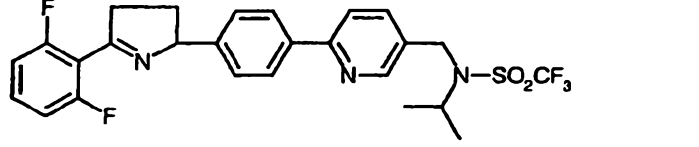
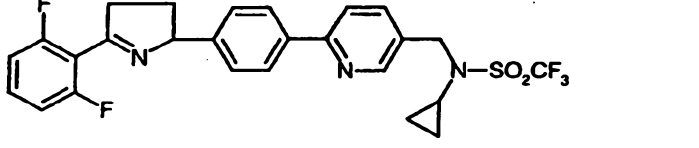
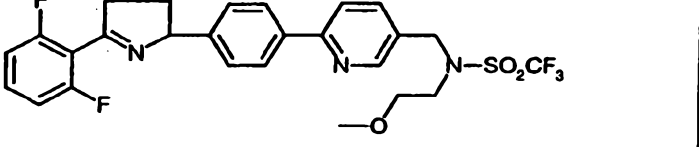
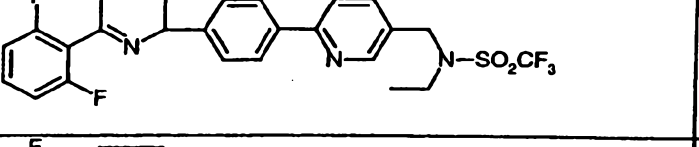
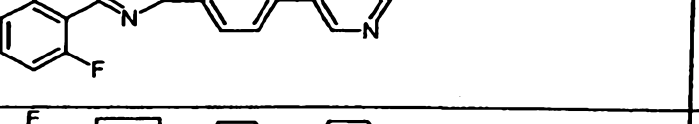
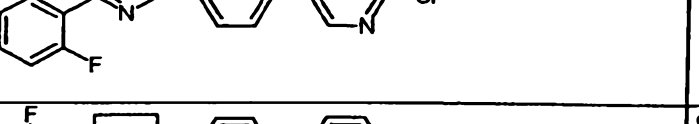
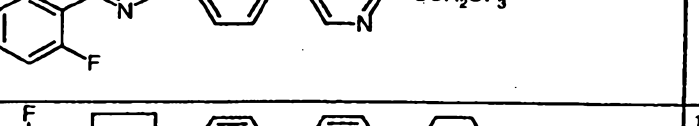
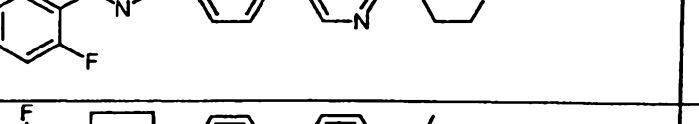
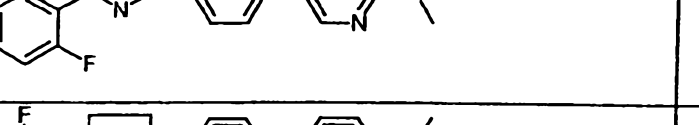
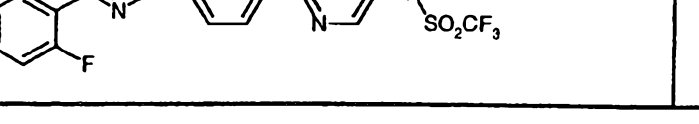
HPLC: log P (pH értéke 2,3) = 2,88 (tisztaság: 98 %)

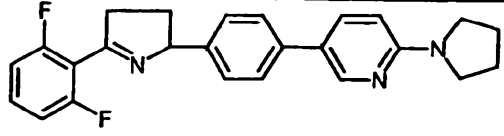
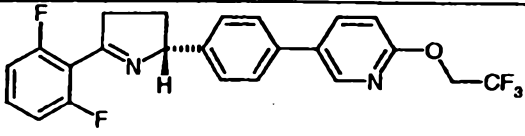
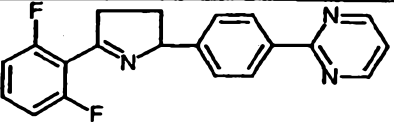
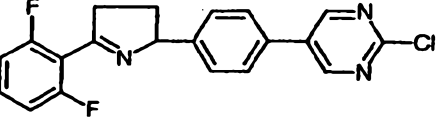
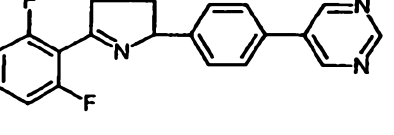
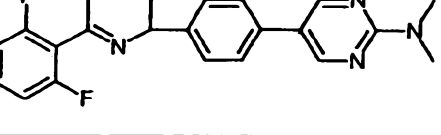
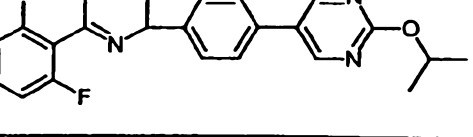
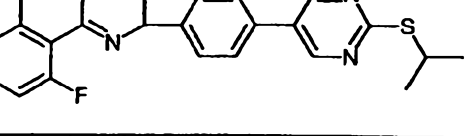
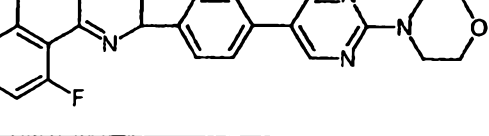
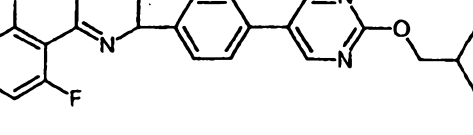
20 Op. 112-114°C.

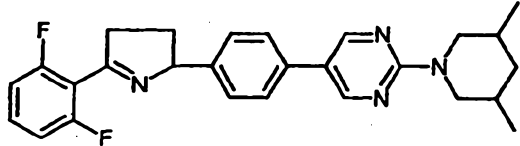
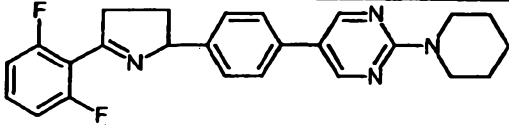
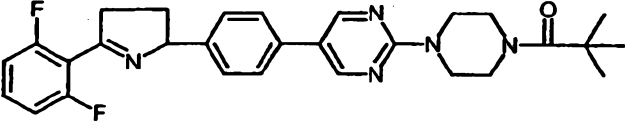
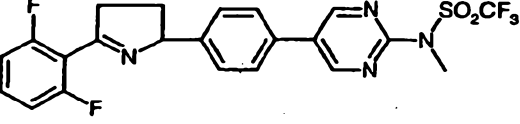
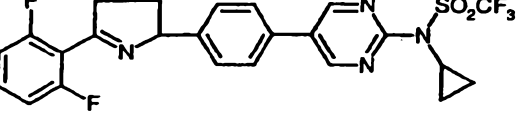
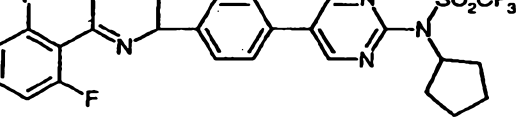
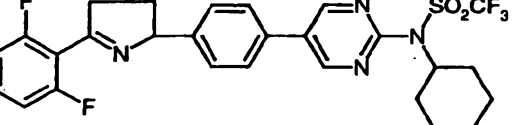
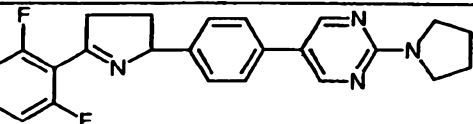
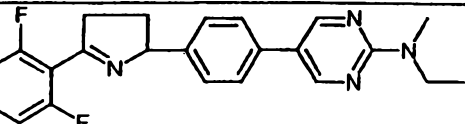
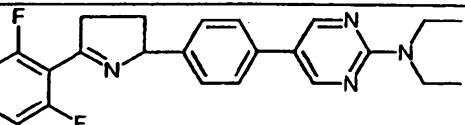
Az alábbi 1. táblázatban bemutatott vegyületeket valamely fenti (A), (B), (C) vagy (D) eljárással azonos módon állíthatjuk elő.

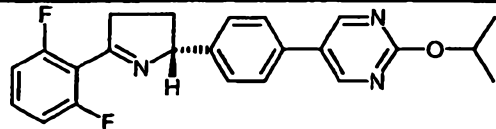
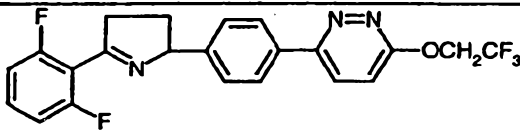
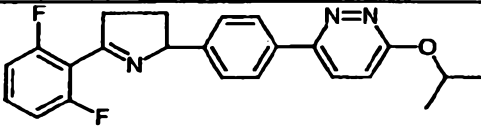
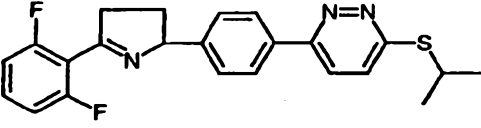
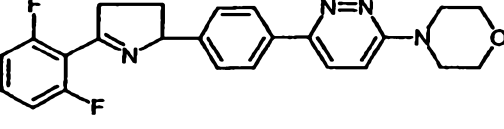
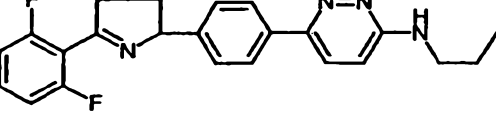
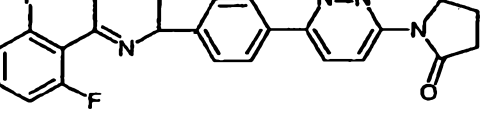
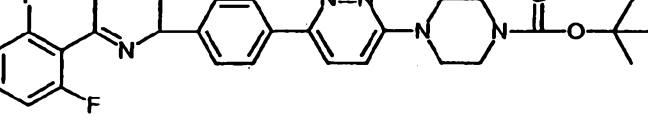
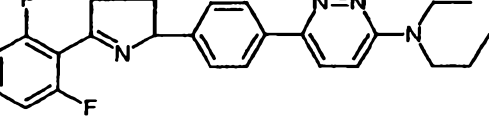
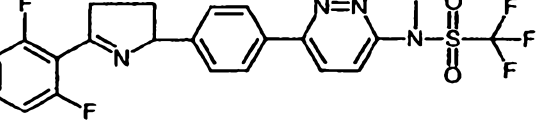
A táblázatban alkalmazott jelölések jelentése a következő: No. = vegyület száma; Structure = szerkezeti képlet; m.p. = olvadáspont; oil = olaj; 25 methanol = metanol

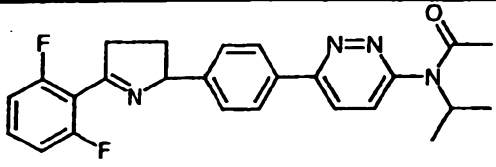
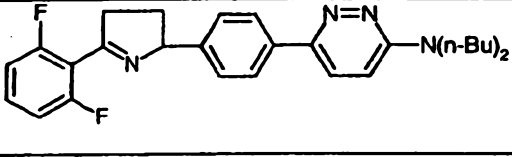
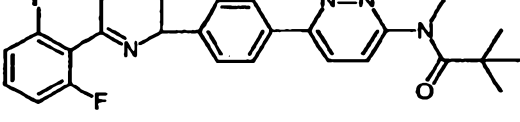
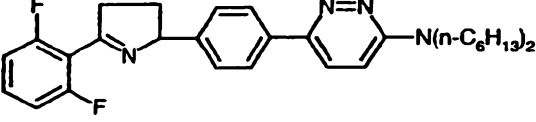
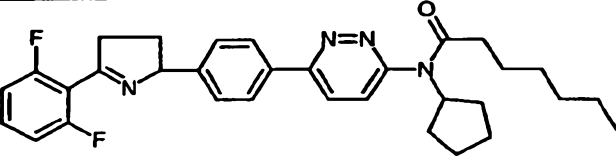
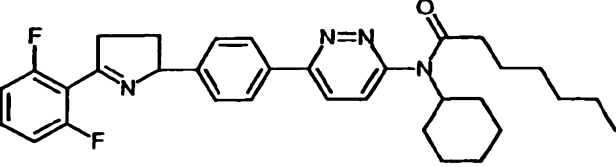
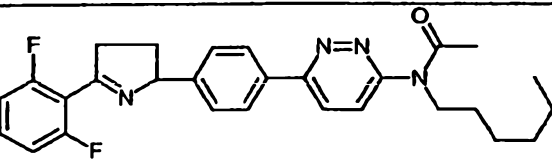
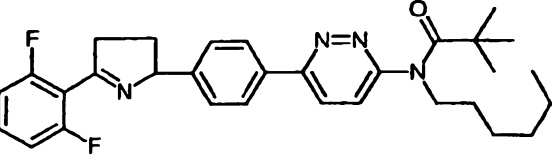
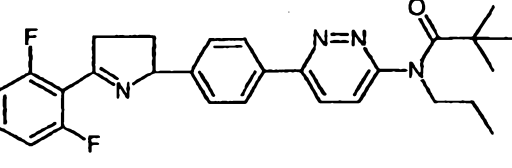
No.	Structure	m.p. (°C)	log P (pH 2,3)
4		oil	1,24
5		119-121	2,86
6		120-127	1,74
7		oil	2,39
8		oil	3,89
9		115-119	3,28
10		oil	2,02
11		oil	2,70
12			
13			3,06

No.	Structure	m.p. (°C)	log P (pH 2,3)
14		oil	3,48
15			3,39
16			3,21
17			3,35
18		85-89	1,12
19		158	2,58
20		86-90	3,66
21		140-142	1,44
22			
23			2,63

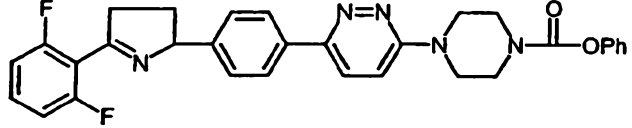
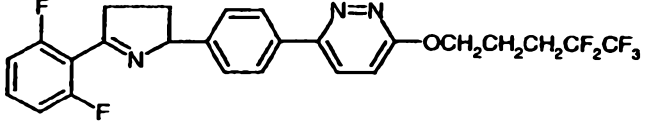
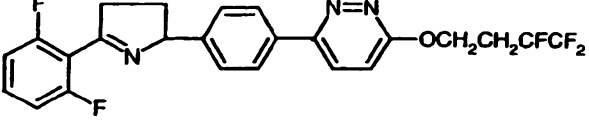
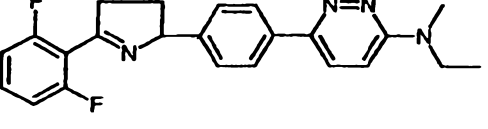
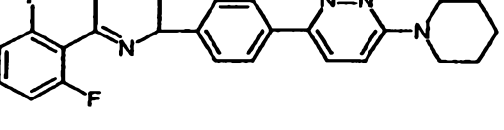
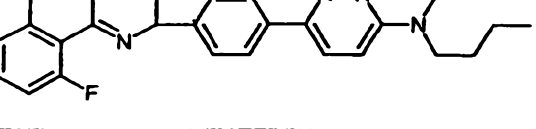
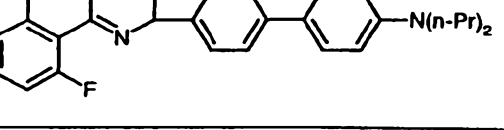
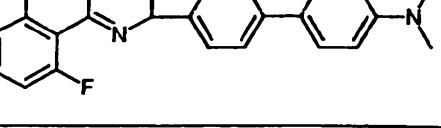
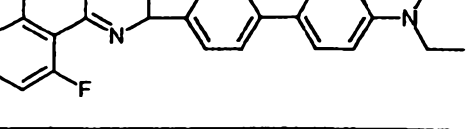
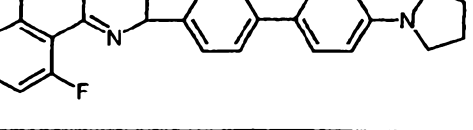
No.	Structure	m.p. (°C)	log P (pH 2,3)
24			1,45
25	 [α] _D ²⁰ = +34.1 (c = 0.42, methanol)	120-123	
26			1,79
27		195-198	1,98
28		133-134	1,49
29		127-130	3,62
30		109	2,61
31		132	3,49
32		178	2,18
33		109-111	3,22

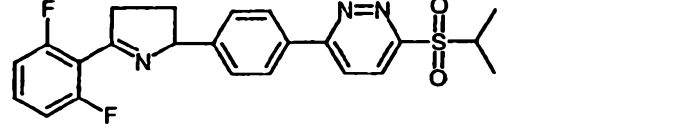
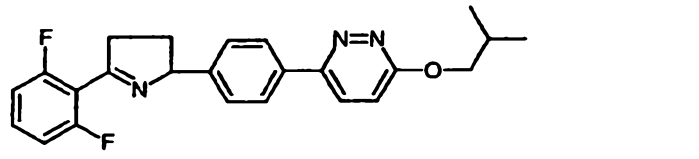
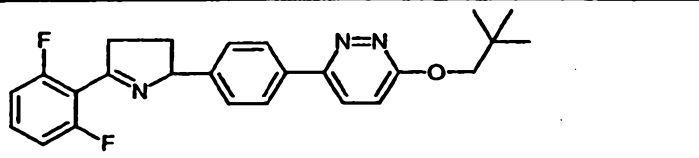
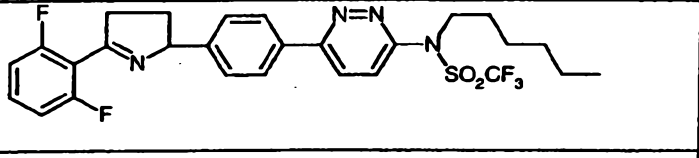
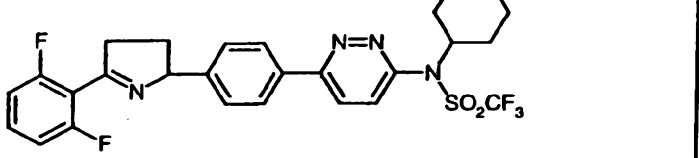
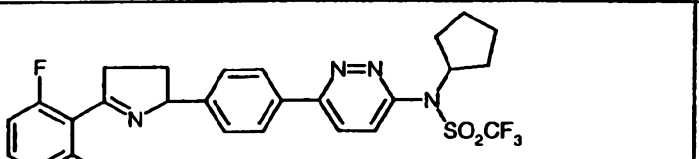
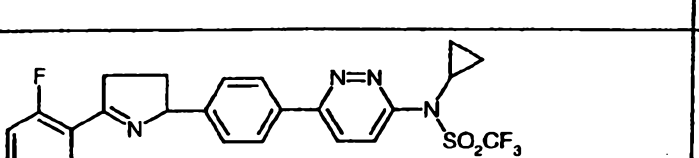
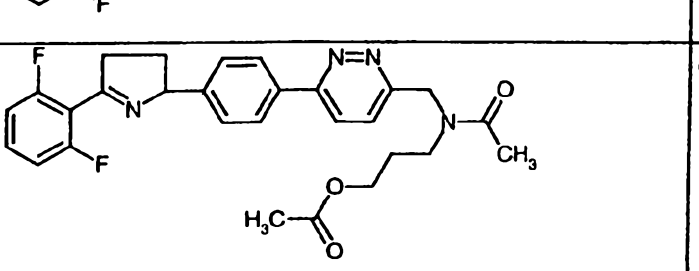
No.	Structure	m.p. (°C)	log P (pH 2,3)
34		139-142	4,39
35		108-112	3,40
36		192-194	2,81
37			3,50
38			3,63
39			
40			
41			2,11
42			2,40
43			3,00

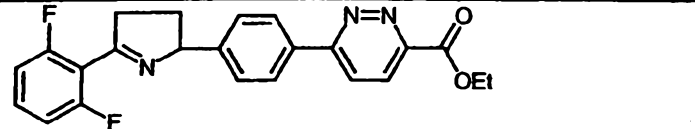
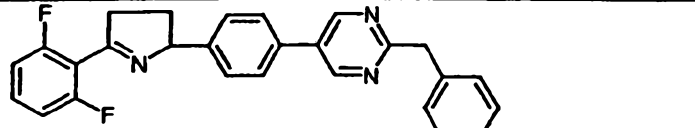
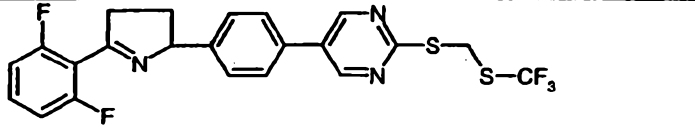
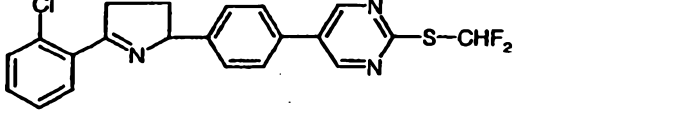
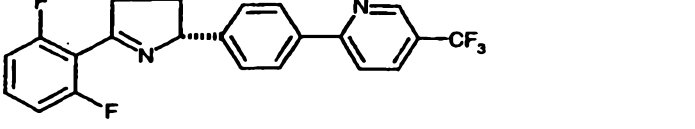
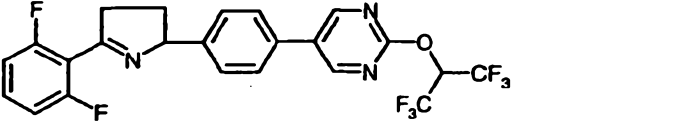
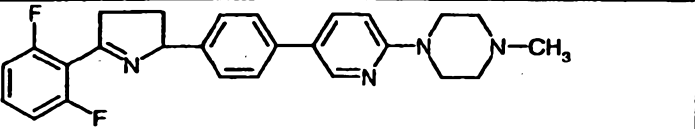
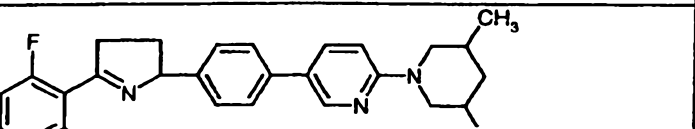
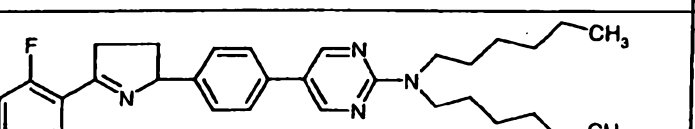
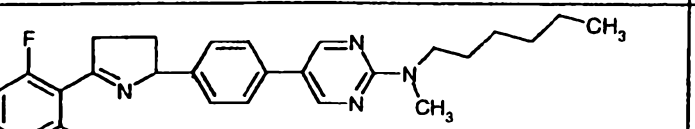
No.	Structure	m.p. (°C)	log P (pH 2,3)
44	 $[\alpha]_D^{20} = +38,6$ (c = 0,39, methanol)	132	
45		126	3,77
46			2,50
47		110-112	2,94
48		174	1,19
49		149	1,26
50		173	1,85
51		152-155	2,07
52		oil	1,60
53		123-127	1,66

No.	Structure	m.p. (°C)	log P (pH 2,3)
54		oil	2,03
55		oil	2,56
56		169-171	2,29
57		oil	3,71
58		oil	4,82
59		oil	4,35
60		oil	3,11
61		97-101	4,35
62		oil	2,95

No.	Structure	m.p. (°C)	log P (pH 2,3)
63		134-138	3,22
64			3,89
65		oil	3,56
66		179-181	2,53
67		87-91	1,48
68		91-95	3,24
69		70-76	3,70
70		oil	1,63
71			1,91

No.	Structure	m.p. (°C)	log P (pH 2,3)
72			
73			3,58
74			2,95
75			1,23
76			
77			1,82
78			1,86
79			1,08
80			1,39
81			1,28

No.	Structure	m.p. (°C)	log P (pH 2,3)
82			1,40
83			
84			
85			
86			
87			
88			
89		oil	1,77

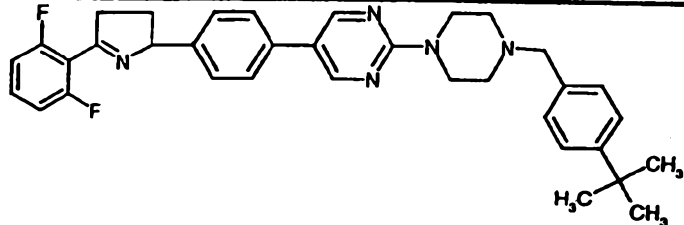
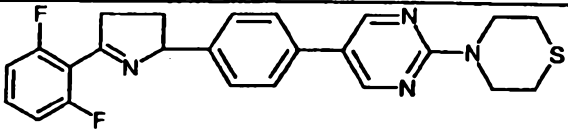
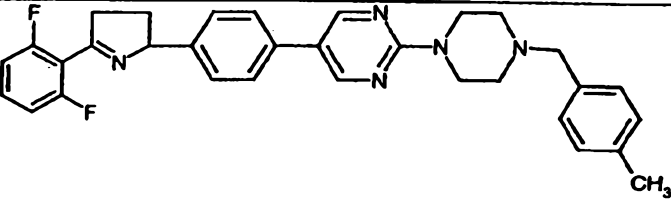
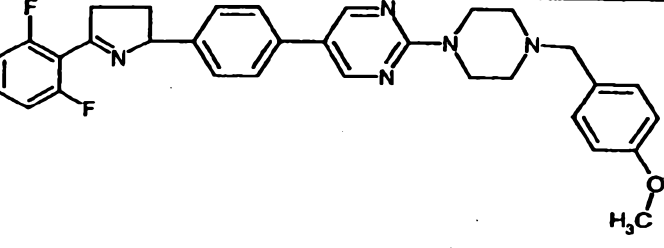
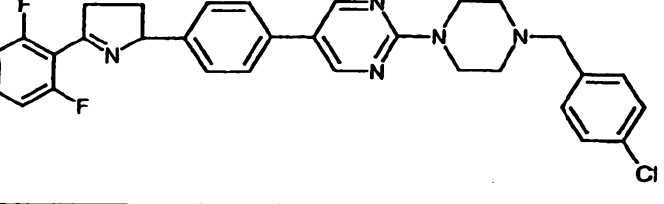
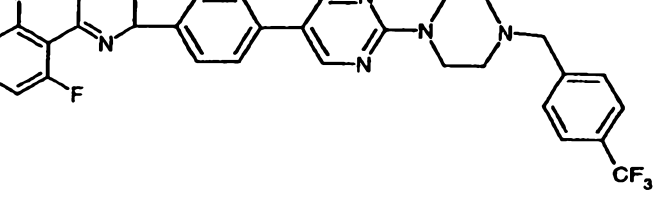
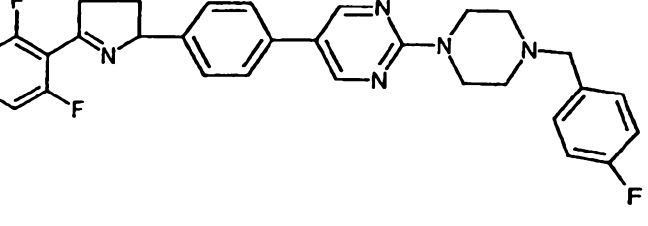
No.	Structure	m.p. (°C)	log P (pH 2,3)
90			
91		122-126	2,79
92			4,00
93			3,38
94			3,28
95			3,85
96			1,04
97			2,10
98			
99			4,94

No.	Structure	m.p. (°C)	log P (pH 2,3)
100			2,72
101			1,24
102			2,21
103			5,82
104			3,00
105			3,41
106			2,25
107			2,48
108			3,74

No.	Structure	m.p. (°C)	log P (pH 2,3)
109			1,65
110			3,07
111			1,49
112			1,65
113			1,30
114			1,28
115			2,29
116			3,88
117			2,70
118			1,55

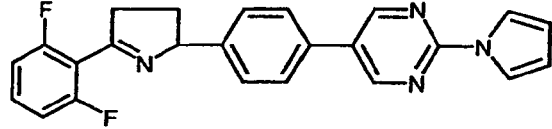
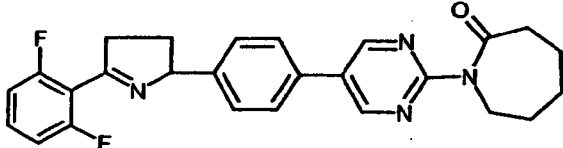
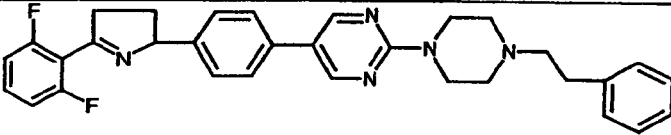
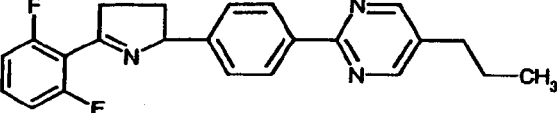
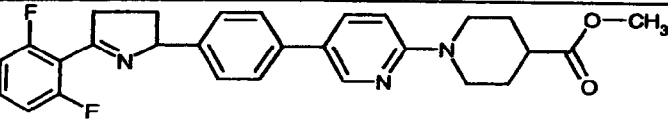
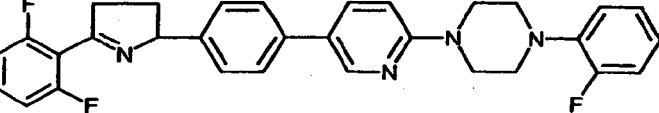
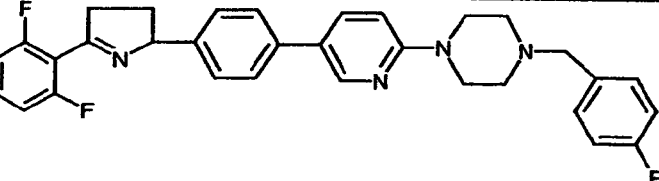
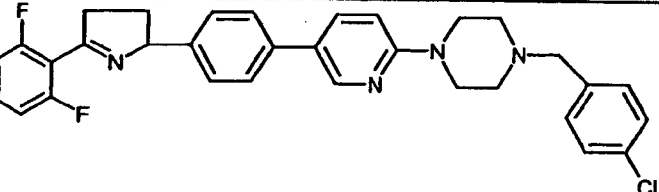
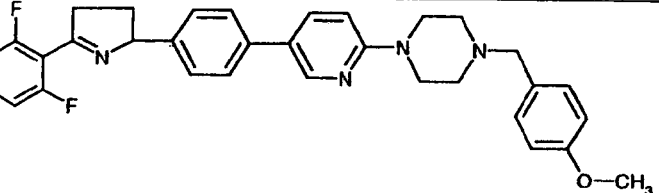
No.	Structure	m.p. (°C)	log P (pH 2,3)
119			5,47
120			4,38
121			4,58
122			3,84
123			2,12
124			1,25
125			1,47
126			1,38
127			3,13
128			6,70

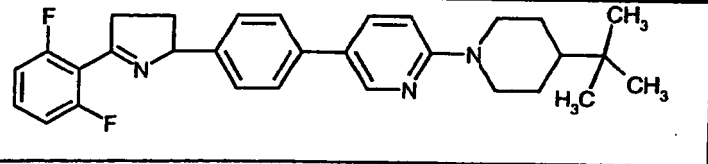
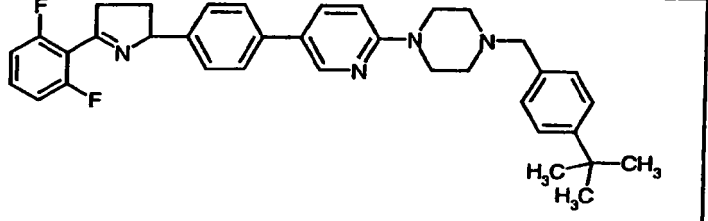
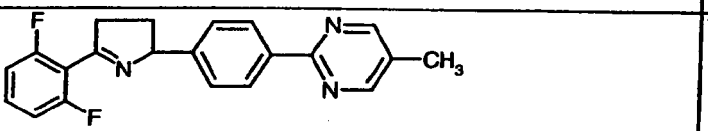
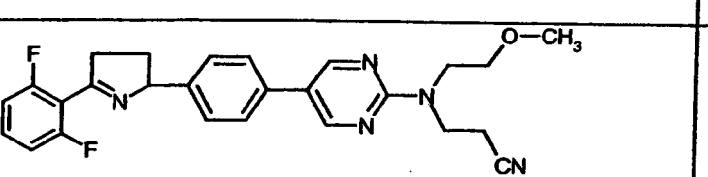
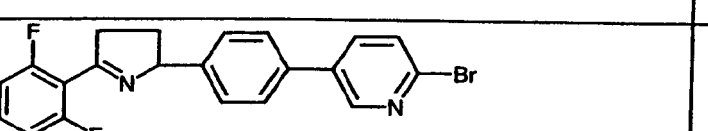
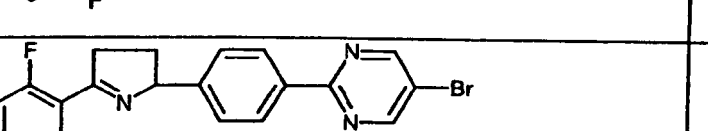
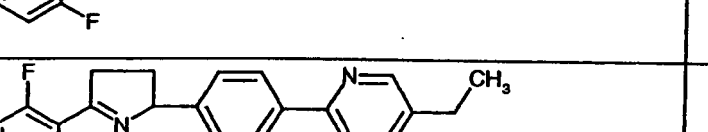
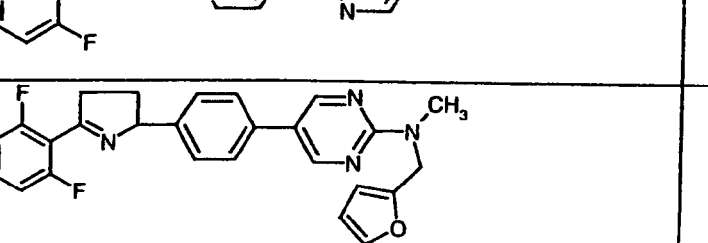
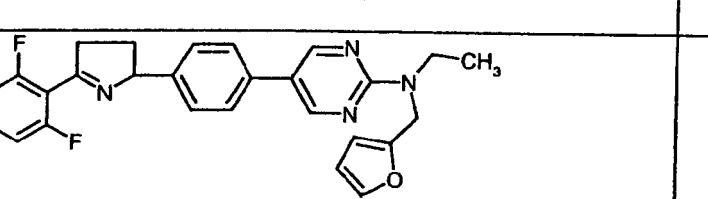
No.	Structure	m.p. (°C)	log P (pH 2,3)
129			2,29
130			1,98
131			1,69
132			3,00
133			2,30
134			5,78
135			2,13
136			4,83
137			3,03
138			1,39

No.	Structure	m.p. (°C)	log P (pH 2,3)
139			3,30
140			3,13
141			2,28
142			2,22
143			2,25
144			4,70
145			1,78

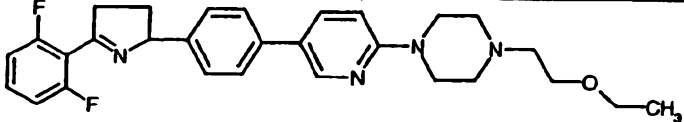
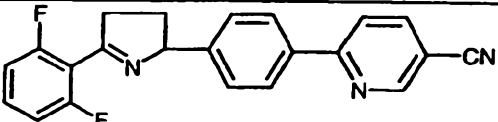
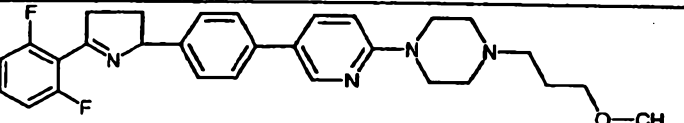
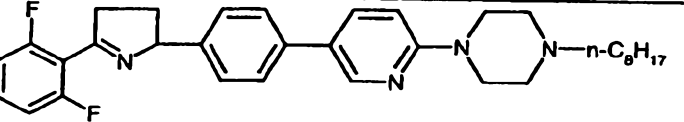
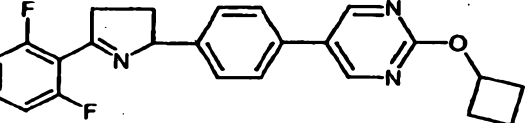
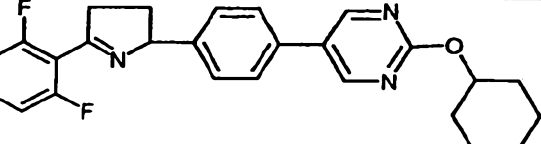
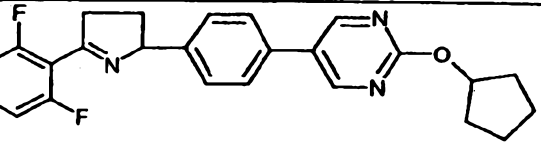
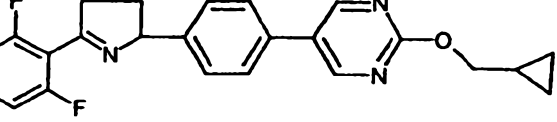
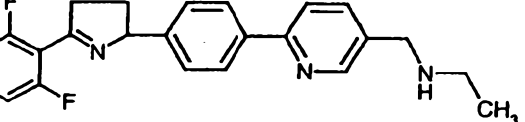
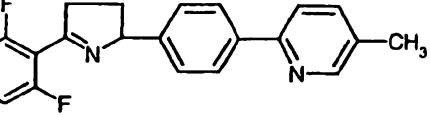
No.	Structure	m.p. (°C)	log P (pH 2,3)
146			3,78
147			1,48
148			1,49
149			3,95
150			3,28
151			2,40
152			1,92
153			3,10
154			2,90
155			2,02

No.	Structure	m.p. (°C)	log P (pH 2,3)
156			
157			3,63
158			1,65
159			2,06
160			1,65
161			2,58
162			3,00
163		98-99	3,58
164		149-150	1,27
165			3,17

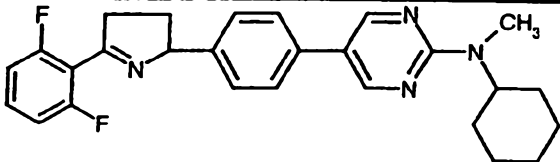
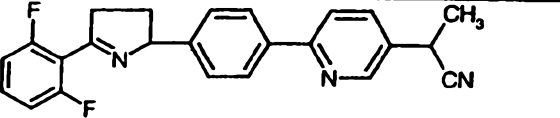
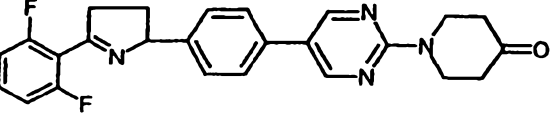
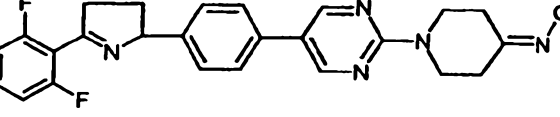
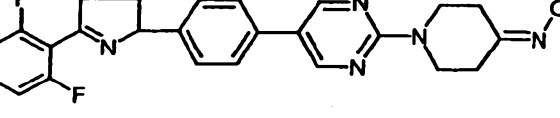
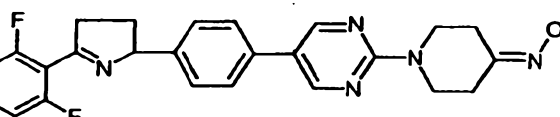
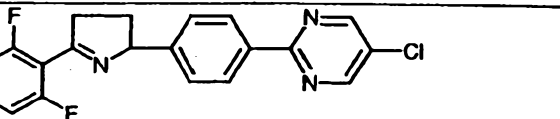
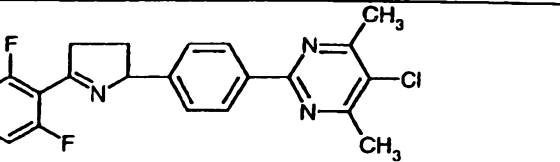
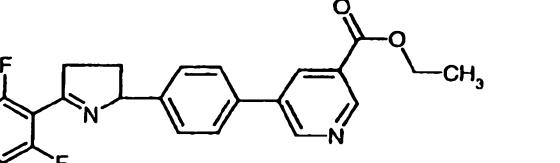
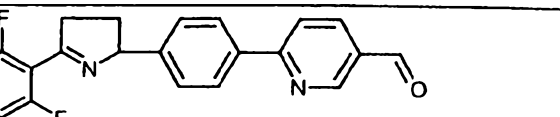
No.	Structure	m.p. (°C)	log P (pH 2,3)
166			3,58
167			1,89
168			1,84
169			2,96
170			1,61
171			2,51
172			1,64
173			1,83
174			1,59

No.	Structure	m.p. (°C)	log P (pH 2,3)
175			2,89
176			2,23
177			2,02
178			2,45
179			2,69
180			3,08
181			2,46
182			3,10
183			3,59

No.	Structure	m.p. (°C)	log P (pH 2,3)
184			2,31
185			4,54
186			3,40
187			2,51
188			4,12
189			1,50
190			3,09
191			2,58
192			1,14

No.	Structure	m.p. (°C)	log P (pH 2,3)
193			1,26
194			
195			1,16
196			2,28
197			2,88
198			3,67
199			3,21
200			2,74
201			0,90
202			1,24

No.	Structure	m.p. (°C)	log P (pH 2,3)
203			3,00
204			1,50
205			3,76
206			2,32
207			3,09
208			2,89
209			3,60
210			1,58
211			2,00

No.	Structure	m.p. (°C)	log P (pH 2,3)
212			4,11
213			1,98
214			2,00
215			2,65
216			3,10
217			3,83
218			2,87
219			3,90
220			2,42
221			1,95

A (III) általános képletű kiindulási vegyületek előállítása**III-1. példa: (III-1) képletű vegyület előállítása**

50,00 g (0,21 mol) 2,5-dibrómpiridin és 38,62 g (0,44 mmol) morfolin 300 ml toluollal készített oldatát 24 óra hosszat visszafolyatós hűtő alatt forraljuk. Hűtés után a reakcióelegyet bepároljuk, és a kapott maradékot diklórmétánban felvesszük. A szerves oldatot vízzel mossuk, vízmentes magnéziumszulfáton szárítjuk, szűrjük és bepároljuk. A kapott nyerterméket szilikagél oszlopon (futtatószer: ciklohexán/etilacetát 10:1, térfogat/térfogat) történő kromatografálással tisztítjuk.

Így 23,65 g (az elméleti hozam 46 %-a) 4-(5-bróm-2-piridinil)morfolint kapunk.

HPLC: Log P (pH értéke 2,3) = 1,63 (tisztaság: 100 %)

Op. 65-68°C.

III-2. példa: (III-2) képletű vegyület előállítása

Argongáz atmoszféra alatt 10°C hőmérsékleten 0,75 g (18,64 mmol) nátriumhidridet szuszpendálunk 50 ml DMF-ben, majd a szuszpenzióhoz cseppenként 1,71 g (17,09 mmol) 2,2,2-trifluoretanol adagolunk. A reakcióelegyet egy óra hosszat 10°C hőmérsékleten keverjük, majd kis adagonként 3,68 g (15,53 mmol) 2,5-dibrómpiridint adagolunk, és a reakcióelegyet 16 óra hosszat szobahőmérsékleten keverjük. Ezután a reakcióelegyhez elővigyázatosan vizet adagolunk és etilacetáttal extraháljuk. A szerves fázist vízmentes magnéziumszulfáton szárítjuk, szűrjük és bepároljuk.

Így 3,15 g (az elméleti hozam 69 %-a) 5-bróm-2-(2,2,2-trifluoroetoxi)piridint kapunk.

HPLC: Log P (pH értéke 2,3) = 3,48 (tisztaság: 87 %)

III-3. példa: (III-3) képletű vegyület előállítása

4,80 g (0,05 mol) *N*-etil-*N*-propilamint feloldunk 200 ml acetonitrilben. A reakcióelegyhez 7,60 g (0,055 mol) kálium-karbonátot adagolunk, majd egy óra hosszat szobahőmérsékleten keverjük. Ezután 9,67 g (0,055 mol) 5-bróm-2-klórpirimidint adagolunk hozzá, és a reakcióelegyet 16 óra hosszat visszafolyatós hűtő alatt forraljuk. Lehűtés után a reakcióelegyet 500 ml vízbe keverjük, majd 2 x 300 ml etilacetáttal extraháljuk. A szerves fázist vízmentes nátrium-

szulfáton szárítjuk, szűrjük és bepároljuk.

Így 12,20 g (az elméleti hozam 99 %-a) *N*-(5-bróm-2-pirimidinil)-*N*-etil-*N*-propilamint kapunk.

HPLC: Log P (pH értéke 2,3) = 4,38 (tisztaság: 95 %).

5 **III-4. példa: (III-4) képletű vegyület előállítása**

Egy autoklávban 2,04 g (25 mmol) *N,N*-dimetilaminhidroklóridot 6,91 g (50 mmol) kálium-karbonátot, 4,35 g (22,50 mmol) 5-bróm-2-klórpirimidint és 25 ml toluolt helyezünk, majd 20 óra hosszat 110°C hőmérsékleten (fürdőhőmérséklet) melegítjük. Ezután a reakcióelegyhez 50 ml etilacetátot adagolunk, majd a szerves fázist 2 x 50 ml vízzel mossuk, vízmentes nátriumszulfáton szárítjuk, szűrjük és bepároljuk.

Így 4,01 g (az elméleti hozam 72 %-a) *N*-(5-bróm-2-pirimidinil)-*N,N*-dimetilamint kapunk.

HPLC: Log P (pH értéke 2,3) = 2,20 (tisztaság: 91 %)

15 Op. 68-69°C.

III-5. példa: (III-5) képletű vegyület előállítása

1,44 g (16,5 mmol) morfolint oldunk 70 ml acetonitrilben, ezután a reakcióelegyhez 2,30 g (16,5 mmol) kálium-karbonátot adagolunk, majd egy óra hosszat szobahőmérsékleten keverjük. A reakcióelegyhez 2,90 g (15,0 mmol) 5-bróm-2-klórpirimidin adagolunk, és 16 óra hosszat visszafolyatós hűtő alatt forraljuk. Lehűtés után a reakcióelegyet 100 ml vízbe keverjük, majd 2 x 50 ml etilacetáttal extraháljuk. A szerves fázist vízmentes nátriumszulfáton szárítjuk, szűrjük és bepároljuk.

25 Így 2,95 g (az elméleti hozam 81 %-a) 4-(5-bróm-2-pirimidinil)morfolint kapunk.

HPLC: Log P (pH értéke 2,3) = 2,15 (tisztaság: 92 %)

Op. 90°C.

III-6. példa: (III-6) képletű vegyület előállítása

1,43 g (5,90 mmol) 5-bróm-2-(1-piperazinil)pirimidint és (1 ml) trietilamint szuszpendálunk 30 ml etilacetátban. A reakcióelegyhez 10°C hőmérsékleten 0,8 ml (6,5 mmol) pivaloil-savkloridot adagolunk, szobahőmérsékleten 16 óra hosszat keverjük, majd sorban etilacetáttal és vízzel elkeverjük. A

szerves fázist vizes, telített nátriumklorid-oldattal mossuk, vízmentes nátrium-szulfáton szárítjuk, szűrjük és bepároljuk.

Így 1,47 g (az elméleti hozam 76 %-a) 1-(*terc*-butilkarbonil)-4-(5-bróm-2-pirimidinil)piperazint kapunk.

5 HPLC: Log P (pH értéke 2,3) = 2,86 (tisztaság: 99 %)

Op. 166-172°C.

III-7. példa: (III-7) képletű vegyület előállítása

Argongáz atmoszféra alatt 25 ml izopropanolban 0,50 g, 60 %-os (16,5 mmol) nátrium-hidridet szuszpendálunk, és a reakcióelegyet 30 percig 60°C
10 hőmérsékleten keverjük. Ezután a reakcióelegyhez 2,90 g (15,0 mmol) 5-bróm-2-klórpirimidint adagolunk, majd 16 óra hosszat visszafolyatós hűtő alatt forraljuk. Lehűtés után a reakcióelegyet 75 ml vízbe keverjük, majd 2 x 75 ml etilacetáttal extraháljuk. A szerves fázist vízmentes nátriumszulfáton szárítjuk, szűrjük és bepároljuk. A nyersterméket szilikagél oszlopon (futtatószer: n-
15 hexán/etilacetát 9:1, térfogat/térfogat) történő kromatografálással tisztítjuk.

Így 2,10 g (az elméleti hozam 65 %-a) 5-bróm-2-pirimidinilizopropilétert kapunk.

HPLC: Log P (pH értéke 2,3) = 2,39 (tisztaság: 99 %).

III-8. példa: (III-8) képletű vegyület előállítása

20 1,62 g, (16,5 mmol) nátrium-2-propántiolátot elkeverünk 40 ml DMF-ben. A reakcióelegyhez szobahőmérsékleten 2,90 g (15,0 mmol) 5-bróm-2-klórpirimidint adagolunk, majd szobahőmérsékleten 16 óra hosszat keverjük. A reakcióelegyet 100 ml vízbe keverjük, majd 2 x 75 ml etilacetáttal extraháljuk. A szerves fázist vizes, telített nátriumklorid-oldattal mossuk, vízmentes nátrium-
25 szulfáton szárítjuk, szűrjük és bepároljuk. A kapott nyersterméket szilikagél oszlopon (futtatószer: n-hexán/etilacetát 20:1, térfogat/térfogat) történő kromatografálással tisztítjuk.

Így 0,40 g (az elméleti hozam 11 %-a) 5-bróm-2-pirimidinil-izopropilszulfidot kapunk.

30 HPLC: Log P (pH értéke 2,3) = 3,34 (tisztaság: 100 %).

III-9. példa: (III-9) képletű vegyület előállítása

Egy autoklávban 3,35 g (22,5 mmol) 3,6-diklórpíridazin, 3,45 g (25,0

mmol) kálium-karbonát és 1,78 g (25,0 mmol) pirrolidin 25 ml toluollal készített oldatát 20 óra hosszat 110°C hőmérsékleten (fürdőhőmérséklet) melegítjük. Ezután a toluolt csökkentett nyomáson eltávolítjuk, az így kapott nyersterméket vízzel elkeverjük, majd a terméket szivással leszűrjük.

5 Így 3,57 g (az elméleti hozam 86 %-a,) 3-klór-6-(1-pirrolidinil)piridazint kapunk.

Op. 129-131 °C

III-10. példa: (III-10) képletű vegyület előállítása

Egy autoklávban 3,35 g (22,5 mmol) 3,6-diklórpiridazin, 3,45 g (25,0
10 mmol) kálium-karbonát és 1,83 g (25,0 mmol) *N,N*-dietilamin 25 ml toluollal készített oldatát 20 óra hosszat 110°C hőmérsékleten (fürdőhőmérséklet) melegítjük. A reakcióelegyhez 50 ml vizet és 25 ml etilacetátot adagolunk, majd a fázisokat elválasztjuk. A vizes fázist 25 ml etilacetáttal újra extraháljuk, és az egyesített szerves fázisokat vízmentes nátriumszulfáton szárítjuk és szűrjük. A
15 szűrlethez 10 g florisilt adagolunk, majd az elegyet bepároljuk. A nyersterméket szilikagél oszlopon (futtatószer: *n*-hexán/etilacetát 3:1, térfogat/térfogat) történő kromatografálással tisztítjuk.

Így 1,25 g (az elméleti hozam 30 %-a) *N*-(6-klór-3-piridazinil)-*N,N*-etilamint kapunk.

20 HPLC: Log P (pH értéke 2,3) = 0,51 (tisztaság: 97 %)

Op. 42-46°C

III-11. példa: (III-11) képletű vegyület előállítása

Egy autoklávban 3,35 g (22,5 mmol) 3,6-diklórpiridazin, 3,45 g (25,0
25 mmol) kálium-karbonát és 1,48 g (25,0 mmol) *N*-metil-*N*-etilamin 25 ml toluollal készített oldatát 20 óra hosszat 110°C hőmérsékleten (fürdőhőmérséklet) melegítjük. A reakcióelegyhez 50 ml vizet és 50 ml etilacetátot adagolunk, majd a fázisokat elválasztjuk. A vizes fázist 25 ml etilacetáttal újra extraháljuk, és az egyesített szerves fázisokat vízmentes nátriumszulfáton szárítjuk és szűrjük. A szűrlethez 10 g florisilt adagolunk, majd az elegyet bepároljuk. A
30 nyersterméket szilikagél oszlopon (futtatószer: *n*-hexán/etilacetát 4:1, térfogat/térfogat) történő kromatografálással tisztítjuk.

Így 2,50 g (az elméleti hozam 65 %-a) *N*-(6-klór-3-piridazinil)-*N*-metil-*N*-

etilamint kapunk.

Op. 61-63°C

III-12. példa: (III-12) képletű vegyület előállítása

2,53 g (25,0 mmol) *N,N*-dipropilamint és 3,45 g (25,0 mmol) kálium-
5 karbonátot 50 ml DMF-ben szuszpendálunk, majd 30 percig keverjük, ezután
3,35 g (22,5 mmol) 3,6-diklórpíridazint adagolunk, és a reakcióelegyet 16 óra
hosszat 110°C hőmérsékleten keverjük. A DMF-et csökkentett nyomáson be-
pároljuk, a kapott maradékhoz 50 ml vizet és 50 ml etilacetátot adagolunk. A
szerves fázist vízmentes nátriumszulfáton szárítjuk és szűrjük. A szűrlethez 10
10 g florisilt adagolunk, majd az elegyet bepároljuk. A nyersterméket szilikagél
oszlopon (futtatószer: *n*-hexán/etilacetát 9:1→4:1, térfogat/térfogat minden
esetben) történő kromatografálással tisztítjuk.

Így 1,10 g (az elméleti hozam 30 %-a) *N*-(6-klór-3-píridazinil)-*N,N*-
dipropilamint kapunk.

15 HPLC: Log P (pH értéke 2,3) = 1,82 (tisztaság: 99 %)

Op. 64-66°C.

III-13. példa: (III-13) képletű vegyület előállítása

2,20 g (0,01 mol) piperazin-*N*-karbonsavbenzilésztert szuszpendálunk
50 ml acetonitrilben, majd a reakcióelegyhez 1,38 g (0,01 mol) kálium-
20 karbonátot adagolunk, és 30 percig szobahőmérsékleten keverjük. A reakció-
elegyhez 1,49 g (0,01 mol) 3,6-diklórpíridazint adagolunk, majd 16 óra hosszat
100°C hőmérsékleten keverjük. A reakcióelegyet szobahőmérsékletre hűtjük,
majd 100 ml vízben elkeverjük. A terméket szívással kiszűrjük.

25 Így 1,95 g (az elméleti hozam 58 %-a) benzil 4-(6-klór-3-píridazinil)-1-
piperazin-karboxilátot kapunk.

HPLC: Log P (pH értéke 2,3) = 2,36 (tisztaság: 95 %)

Op. 124-125°C.

III-14. példa: (III-14) képletű vegyület előállítása

0,80 g, 60 %-os (0,02 mol) nátrium-hidridet szuszpendálunk 40 ml
30 DMF-ben. Ezután a szuszpenzióhoz argongáz áram alatt 10°C hőmérsékleten
1,70 g (0,02 mol) 2-pírrolidont csepegtettünk. A reakcióelegyet hagyjuk szo-
bahőmérsékletre melegedni, majd 2,23 g, (0,015 mol) 3,6-diklórpíridazint ada-

golunk, és a reakcióelegyet 16 óra hosszat szobahőmérsékleten keverjük. A reakcióelegyet 300 ml vízben elkeverjük, és 200 ml etilacetáttal extraháljuk. A szerves fázist vizes, telített nátriumklorid-oldattal mossuk, vízmentes nátrium-szulfáton szárítjuk, szűrjük és bepároljuk. A nyersterméket szilikagél oszlopon (futtatószer: n-hexán/etilacetát 1:1→3:7, térfogat/térfogat minden esetben) történő kromatografálással tisztítjuk.

Így 0,68 g (az elméleti hozam 17 %-a) 1-(6-klór-3-piridazinil)-2-pirro-
lidinont kapunk.

HPLC: Log P (pH értéke 2,3) = 1,09 (tisztaság: 75 %)

10 **III-15. példa: (III-15) képletű vegyület előállítása**

Egy reakcióedényben 11,20 g (0,075 mol) 3,6-diklórpíridazint, 25,70 ml (0,225 mol) ciklohexilamint és 37,5 ml vizet helyezünk el, majd ehhez az elegyhez szobahőmérsékleten 1,5 ml tömény (37 %-os) sósavat adagolunk, és a reakcióelegyet 20 óra hosszat 100°C hőmérsékleten (fürdőhőmérséklet) keverjük. A reakcióelegyet szobahőmérsékletre hűtjük, majd 30 ml, vizes, telített nátrium-hidrogénkarbonát-oldatot adagolunk hozzá. A kivált csapadékot szívással szűrjük ki, és többször vízzel átmossuk.

Így 12,30 g (az elméleti hozam 78 %-a) *N*-(6-klór-3-piridazinil)-*N*-ciklohexilamint kapunk.

20 HPLC: Log P (pH értéke 2,3) = 0,95 (tisztaság: 99 %)

Op. 161-163°C.

III-16. példa: (III-16) képletű vegyület előállítása

Egy autoklávban 25,0 g (0,17 mol) 3,6-diklórpíridazint, 39,0 g (0,50 mol), 40%-os, vizes metilamin-oldatot, 50 ml vizet és 3,4 ml tömény (37 %-os) sósavat helyezünk, majd a reakcióelegyet 20 óra hosszat 100°C hőmérsékleten (fürdőhőmérséklet) melegítjük. Lehűtés után a kivált csapadékot szívással szűrjük ki, és telített, vizes nátrium-hidrogénkarbonát-oldattal többször átmossuk.

30 Így 20,95 g (az elméleti hozam 78 %-a) *N*-(6-klór-3-piridazinil)-*N*-metilamint kapunk.

Op. 194-196°C

GC/MS: index 1472 (tisztaság: 100 %); M^+ = 143/145

III-17. példa: (III-17) képletű vegyület előállítása

50 ml etilacetátban szuszpendálunk 1,08 g (0,0075 mol) *N*-(6-klór-3-piridazinil)-*N*-metilamint és 1,4 ml (0,01 mol) trietilamint. Ezután 60°C hőmérsékleten 1,23 ml (0,01 mol) pivaloil-savkloridot adagolunk, és a reakcióelegyet 16 óra hosszat 60°C hőmérsékleten keverjük. Lehűtés után a reakcióelegyet vízzel mossuk, a szerves fázist vízmentes nátriumszulfáton szárítjuk, szűrjük és bepároljuk.

Így 1,21 g (az elméleti hozam 71 %-a) *N*-(6-Klór-3-piridazinil)-*N*-metil-2,2-trimetilpropánamidot kapunk.

10 HPLC: Log P (pH értéke 2,3) =1,69 (tisztaság: 95 %)

Op. 84-87°C.

III-18. példa: (III-18) képletű vegyület előállítása

Argongáz áram alatt egy reakcióedénybe 60 ml izopropanolt helyezünk, majd szobahőmérsékleten, kis adagonként 1,0 g, 80 %-os (0,033 mol) nátrium-hidridet adagolunk, és az elegyet 30 percig 60°C hőmérsékleten keverjük. Szobahőmérsékleten 4,50 g (0,03 mol) 3,6-diklórpíridazint adagolunk, és a reakcióelegyet 48 óra hosszat visszafolyatós hűtő alatt forraljuk. A reakcióelegyet 100 ml vízzel elkeverjük, majd 2 x 100 ml etilacetáttal extraháljuk. A szerves fázist vízmentes nátriumszulfáton szárítjuk, szűrjük és bepároljuk. A nyersterméket szilikagél oszlopon (futtatószer: n-hexán/etilacetát 9:1, térfogat/térfogat) történő kromatografálással tisztítjuk.

Így 1,85 g (az elméleti hozam 36 %-a) 3-klór-6-izopropoxipiridazint kapunk.

HPLC: Log P (pH értéke 2,3) =1,94 (tisztaság: 98 %)

25 Op. 83-85°C.

III-19. példa: (III-19) képletű vegyület előállítása

200 ml acetonitrilben 25,0 g (0,25 mol) trifluoetanol szuszpendálunk. A reakcióelegyhez 6,90 g (0,05 mol) kálium-karbonátot adagolunk, és 1 óra hosszat szobahőmérsékleten keverjük. Ezután 11,20 g (0,075 mol) 3,6-diklórpíridazint adagolunk, és a reakcióelegyet 16 óra hosszat visszafolyatós hűtő alatt forraljuk. A reakcióelegyet 500 ml vízzel elkeverjük, és 2 x 300 ml etilacetáttal extraháljuk. A szerves fázist vízmentes nátriumszulfáton szárítjuk,

szűrjük és bepároljuk.

Így 12,38 g (az elméleti hozam 68 %-a) 3-klór-6-(2,2,2-trifluor-
etoxi)piridazint kapunk.

HPLC: Log P (pH értéke 2,3) = 2,05 (tisztaság: 88 %)

5 **III-20. példa: (III-20) képletű vegyület előállítása**

1,62 g, (16,5 mmol) nátrium-2-propántiolátot elkeverünk 30 ml DMF-
ben. A reakcióelegyhez szobahőmérsékleten hozzáadagolunk 2,20 g (15,0
mmol) 3,6-diklórpíridazin 10 ml DMF-ben készített oldatát, majd szobahőmér-
sékleten 16 óra hosszat keverjük. A reakcióelegyet 100 ml vízbe keverjük,
10 majd 2 x 75 ml etilacetáttal extraháljuk. A szerves fázist 2 x 75 ml vizes, telített
nátriumklorid-oldattal mossuk, vízmentes nátriumszulfáton szárítjuk, szűrjük és
bepároljuk. A kapott nyersteget szilikagél oszlopon (futtatószer:
n-hexán/etilacetát 9:1, térfogat/térfogat) történő kromatográfiával tisztítjuk.

Így 1,40 g (az elméleti hozam 50 %-a) 6-klór-3-píridazinil-
15 izopropilszulfidot kapunk.

HPLC: Log P (pH értéke 2,3) = 2,34 (tisztaság: 100 %)

Op. 90-91 °C

III-21. példa: (III-21) képletű vegyület előállítása

Szobahőmérsékleten 1,90 g (0,01 mol) 6-klór-3-píridazinilizopropil-
20 szulfid 100 ml diklórmétánnal készített elegyéhez kis adagokban 5,06 g (0,022
mol) 3-klórperoxi-benzoésavat adagolunk, és a reakcióelegyet szobahőmér-
sékleten keverjük 16 óra hosszat, majd szírással szűrjük és elválasztjuk. A
szűrletett sorban vizes nátriumditionit-oldattal, 2 x 50 ml telített, vizes nátrium-
hidrogénkarbonát-oldattal és 1 x 50 ml vízzel mossuk, vízmentes nátriumszul-
25 fáton szárítjuk, szűrjük és bepároljuk.

Így 1,93 g (az elméleti hozam 76 %-a) 6-klór-3-píridazinil-
izopropilszulfont kapunk.

HPLC: Log P (pH értéke 2,3) = 1,20 (tisztaság: 88 %)

Op. 122-124°C.

30 **III-22. példa: (III-22) képletű vegyület előállítása**

Szobahőmérsékleten 3,20 g (0,025 mmol) 3-amino-6-klórpíridazin 100
ml diklórmétánnal készített szuszpenziójához sorban 4,20 ml (0,025 mol) tri-

etilamint és 4,20 ml (0,025 mol) trifluormetánszulfonsavanhidridet csepegtünk. A reakcióelegyet szobahőmérsékleten egy óra hosszat keverjük, sorban 3 x 50 ml telített, vizes nátrium-hidrogénkarbonát-oldattal és 1 x 50 ml telített, vizes nátriumklorid-oldattal mossuk, vízmentes nátriumszulfáton szárítjuk, 5 szűrjük és bepároljuk. A nyersterméket szilikagél oszlopon (futtatószer: n-hexán/etilacetát 3:1 → 0:1, térfogat/térfogat minden esetben) történő kromatográfiával tisztítjuk.

Így 2,51 g (az elméleti hozam 38 %-a) *N*-(6-klór-3-piridazinil)(trifluor)metán-szulfonamidot kapunk.

10 HPLC: Log P (pH értéke 2,3) = 1,56 (tisztaság: 99 %).

III-23. példa: (III-23) képletű vegyület előállítása

Szobahőmérsékleten 1,20 g (4,6 mmol) *N*-(6-klór-3-piridazinil)(trifluor)metánszulfonamid 40 ml acetonitrillel készített elegyéhez 0,95 g (6,7 mmol) kálium-karbonátot adagolunk, és 30 percig keverjük. A reakció-
15 elegyhez szobahőmérsékleten 0,42 ml (6,7 mmol) metiljodidot adagolunk, és 40°C hőmérsékleten keverjük 16 óra hosszat. A reakcióelegyet 50 ml vízben elkeverjük, a csapadékot szívással kiszűrjük, és 2 x 50 ml etilacetáttal mossuk. Az egyesített szerves fázisokat 1 x 50 ml telített, vizes nátriumklorid-oldattal mossuk, vízmentes nátriumszulfáton szárítjuk, szűrjük és bepároljuk.
20 A nyersterméket szilikagél oszlopon (futtatószer: n-hexán/etilacetát 4:1, térfogat/térfogat) történő kromatográfiával tisztítjuk.

Így 0,68 g (az elméleti hozam 54 %-a) *N*-(6-klór-3-piridazinil)(trifluor)-*N*-metil-metánszulfonamidot kapunk.

HPLC: Log P (pH értéke 2,3) = 2,18 (tisztaság: 100 %).

25 A fenti log P értékeket az EK 79/831 számú európai közösségi rendeletek V:A8 függelékének megfelelően, HPLC-elemzéssel [magas felbontású folyadék kromatográfiás (High Performance Liquid Chromatography)], fordított fázisú oszlop (C 18) alkalmazásával, 43°C hőmérsékleten határoztuk meg.

A meghatározásokhoz alkalmazott mozgó fázisok savas tartományban voltak. A mozgó fázis összetétele: 0,1% vizes foszforsav, acetonitril; lineáris
30 gradiens 10%-os acetonitriltől 90%-os acetonitrilig.

A kalibrálást ismert log P értékű, nem-elágazó, 3-16 szénatomos alkán-

2-onok alkalmazásával határoztuk meg (a log P értékeket két egymást követő alkanon lineáris interpolációjával kapott retenciós időkből határoztuk meg).

A lambda max értékeket 200 nm és 400 nm közötti UV spektrumok kromatográfiás jeleinek maximumából határoztuk meg.

5 **Biológia vizsgálatok**

A) példa: *Heliothis virescens* elleni hatás

Oldószer: 30 tömegrész dimetilformamid

Emulgeátor: 1 tömegrész alkilaril-poliglikol-éter

10 Alkalmas hatóanyag-készítmény előállítása céljából 1 tömegrész hatóanyagot a megadott mennyiségű oldószerrel és megadott mennyiségű emulgeátorral összekeverünk, és a kapott koncentrátumot emulgeátort tartalmazó vízzel a kívánt koncentrációra hígítjuk.

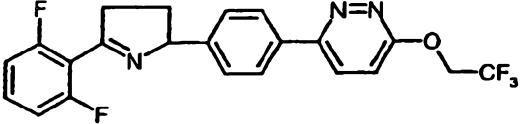
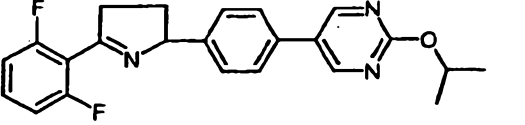
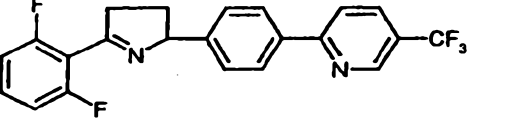
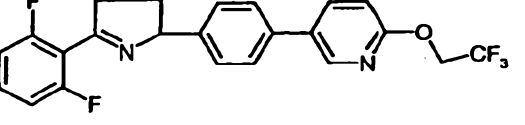
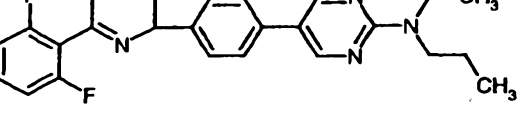
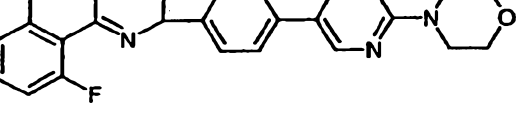
15 Szójababhajtásokat (*Glycine max*) a kívánt koncentrációjú hatóanyag-készítménybe történő bemártással kezelünk, és a még nedves leveleket a gyapotmagfőreg (*Heliothis virescens*) hernyóival betelepítjük.

A kívánt idő elteltével meghatározzuk a pusztulási fokot százalékban. A 100% azt jelenti, hogy az összes hernyó elpusztult, míg a 0% azt jelenti, hogy egyetlen hernyó sem pusztult el.

20 Az ebben a vizsgálatban alkalmazott hatóanyagokat, hatóanyag-koncentrációkat és vizsgálati eredményeket az alábbi A) táblázatban mutatjuk be.

A) táblázat

Növénykárosító rovar: *Heliothis virescens*

Hatóanyag	Hatóanyag-konc. (ppm)	Pusztulási arány 7 nap után (%)
	40	100
	40	100
	40	100
	500	100
	40	100
	500	100

B) példa: *Phaedon*-lárva elleni hatás

Oldószer: 30 tömegrész dimetilformamid

Emulgeátor: 1 tömegrész alkilaril-poliglikol-éter

- 5 Alkalmas hatóanyag-készítmény előállítása céljából 1 tömegrész hatóanyagot a megadott mennyiségű oldószerrel és megadott mennyiségű emulgeátorral összekeverünk, és a kapott koncentrátumot emulgeátort tartalmazó vízzel a kívánt koncentrációra hígítjuk.

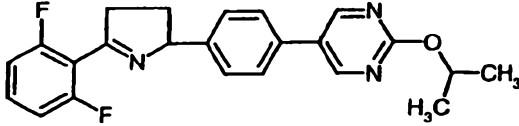
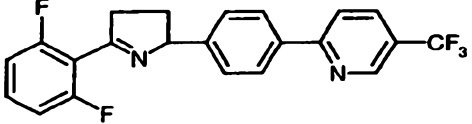
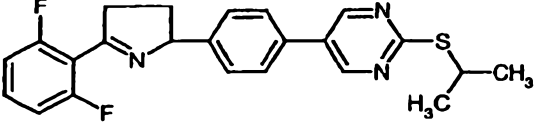
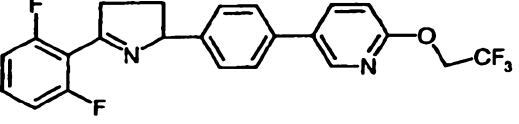
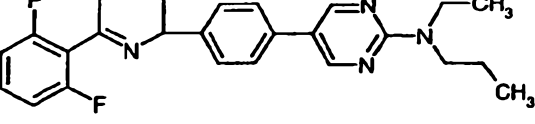
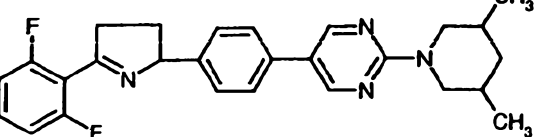
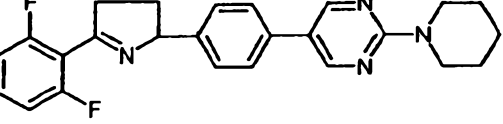
- 10 Káposztaleveleket (*Brassica oleracea*) a kívánt koncentrációjú hatóanyag-készítménybe történő bemártással kezelünk, és a még nedves leveleket a tormalevélbogár (*Phaedon cochleariae*) lárváival betelepítjük.

A kívánt idő elteltével meghatározzuk a pusztulási fokot százalékban. A 100% azt jelenti, hogy az összes lárva elpusztult, míg a 0% azt jelenti, hogy egyetlen lárva sem pusztult el.

- 15 Az ebben a vizsgálatban alkalmazott hatóanyagokat, hatóanyag-koncentrációkat és vizsgálati eredményeket az alábbi B) táblázatban mutatjuk be.

B) táblázat

Növénykárosító rovar: *Phaedon*-lárva

Hatóanyag	Hatóanyag-konc. (ppm)	Pusztulási arány 7 nap után (%)
	1000	100
	1000	100
	1000	100
	1000	100
	1000	100
	1000	100
	1000	100

C) példa: *Spodoptera exigua* elleni hatás

Oldószer: 30 tömegrész dimetilformamid

Emulgeátor: 1 tömegrész alkilaril-poliglikol-éter

- Alkalmas hatóanyag-készítmény előállítása céljából 1 tömegrész ható-
5 anyagot a megadott mennyiségű oldószerrel és megadott mennyiségű
emulgeátorral összekeverünk, és a kapott koncentrátumot emulgeátort tartal-
mazó vízzel a kívánt koncentrációra hígítjuk.

- Káposztaleveleket (*Brassica oleracea*) a kívánt koncentrációjú ható-
anyag-készítménybe történő bemártással kezelünk, és a még nedves leveleket
10 a gyapotlepke (*Spodoptera exigua*) hernyóival betelepítjük.

A kívánt idő elteltével meghatározzuk a pusztulási fokot százalékban. A
100% azt jelenti, hogy az összes hernyó elpusztult, míg a 0% azt jelenti, hogy
egyetlen hernyó sem pusztult el.

- Az ebben a vizsgálatban alkalmazott hatóanyagokat, hatóanyag-
15 koncentrációkat és vizsgálati eredményeket az alábbi C) táblázatban mutatjuk
be.

D) példa: *Spodoptera frugiperda* elleni hatás

Oldószer: 30 tömegrész dimetilformamid

Emulgeátor: 1 tömegrész alkilaril-poliglikol-éter

5 Alkalmas hatóanyag-készítmény előállítás céljából 1 tömegrész hatóanyagot a megadott mennyiségű oldószerrel és megadott mennyiségű emulgeátorral összekeverünk, és a kapott koncentrátumot emulgeátort tartalmazó vízzel a kívánt koncentrációra hígítjuk.

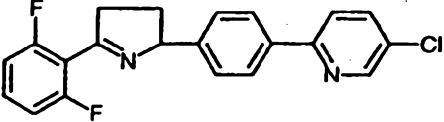
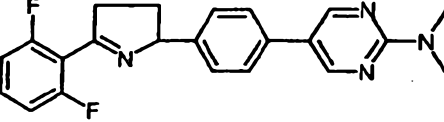
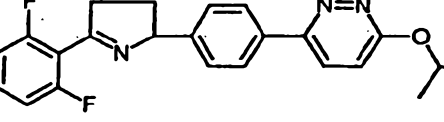
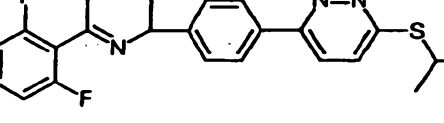
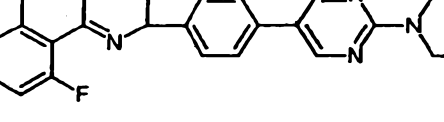
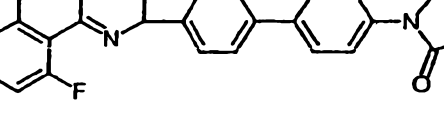
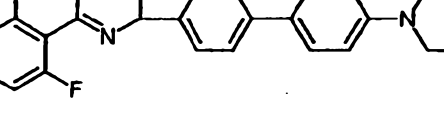
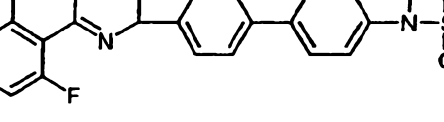
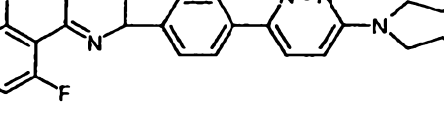
10 Káposztaleveleket (*Brassica oleracea*) a kívánt koncentrációjú hatóanyag-készítménybe történő bemártással kezelünk, és a még nedves leveleket a *Spodoptera frugiperda* hernyóival betelepítjük.

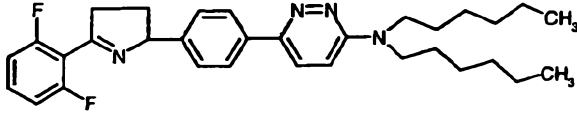
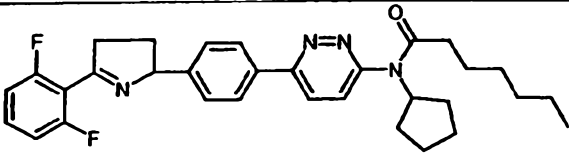
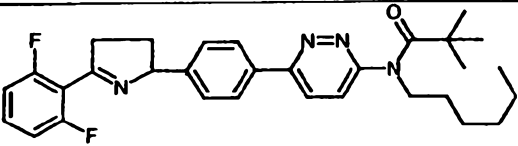
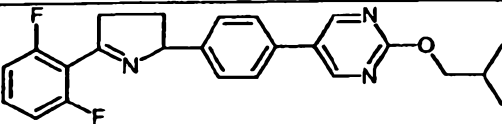
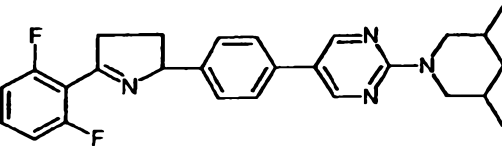
A kívánt idő elteltével meghatározzuk a pusztulási fokot százalékban. A 100% azt jelenti, hogy az összes hernyó elpusztult, míg a 0% azt jelenti, hogy egyetlen hernyó sem pusztult el.

15 Az ebben a vizsgálatban alkalmazott hatóanyagokat, hatóanyag-koncentrációkat és vizsgálati eredményeket az alábbi D) táblázatban mutatjuk be.

D) táblázat

Növénykárosító rovar: *Spodoptera frugiperda*

Hatóanyag	Hatóanyag-konc. (ppm)	Pusztulási arány 7 nap után (%)
	1000	100
	1000	100
	1000	100
	1000	100
	1000	100
	500	100
	500	100
	500	100
	500	100

Hatóanyag	Hatóanyag-konc. (ppm)	Pusztulási arány 7 nap után (%)
	1000	100
	1000	100
	1000	100
	1000	100
	1000	100

E) példa: *Tetranychus* elleni hatás (OP-rezisztens/merítéses kezelés)

Oldószer: 30 tömegrész dimetilformamid

Emulgeátor: 1 tömegrész alkilaril-poliglikol-éter

Alkalmas hatóanyag-készítmény előállítása céljából 1 tömegrész ható-
 5 anyagot a megadott mennyiségű oldószerrel és megadott mennyiségű emulge-
 átorral összekeverünk, és a kapott koncentrátumot emulgeátort tartalmazó víz-
 zel a kívánt koncentrációra hígítjuk.

A *Tetranychus urticae* összes fejlődési szakaszával erősen fertőzött
 babnövényeket (*Phaseolus vulgaris*) a kívánt koncentrációjú hatóanyag-
 10 készítménybe mártjuk.

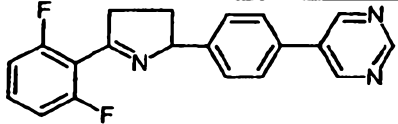
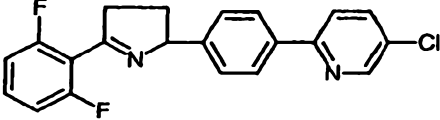
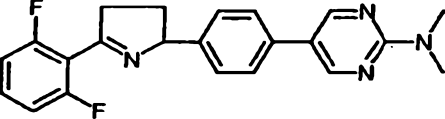
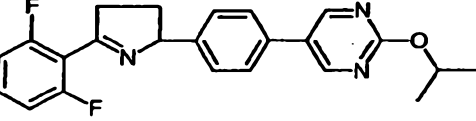
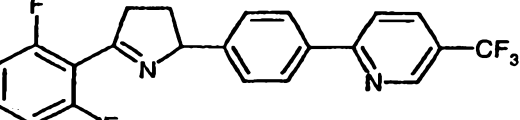
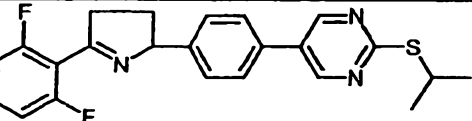
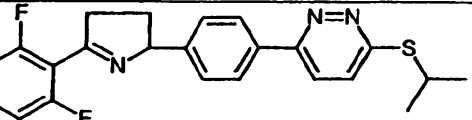
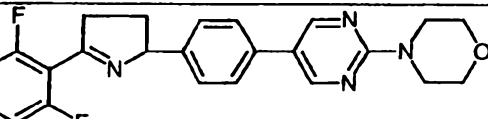
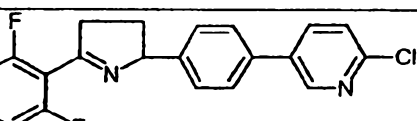
A kívánt idő elteltével meghatározzuk a pusztulási fokot százalékban. A
 100% azt jelenti, hogy az összes pókatka elpusztult, míg a 0% azt jelenti, hogy
 egyetlen pókatka sem pusztult el.

Az ebben a vizsgálatban alkalmazott hatóanyagokat, hatóanyag-
 15 koncentrációkat és vizsgálati eredményeket az alábbi E) táblázatban mutatjuk
 be.

E) táblázat

Növénykárosító rovar: *Tetranychus* elleni hatás

(OP-rezisztens/merítéses kezelés)

Hatóanyag	Hatóanyag-konc. (ppm)	Pusztulási arány 7 nap után (%)
	100	98
	100	98
	100	98
	100	98
	100	98
	100	98
	100	98
	100	98
	100	98

F) példa: *Diabrotica balteata* elleni hatás (földben lévő lárvák)

Kritikus koncentráció teszt / talajrovarok – transzgenikus növények kezelése

Oldószer: 7 tömegrész dimetilformamid

Emulgeátor: 1 tömegrész alkilaril-poliglikol-éter

- 5 Alkalmas hatóanyag-készítmény előállítása céljából 1 tömegrész hatóanyagot a megadott mennyiségű oldószerrel és megadott mennyiségű emulgeátorral összekeverünk, és a kapott koncentrátumot emulgeátort tartalmazó vízzel a kívánt koncentrációra hígítjuk.

- 10 A hatóanyag-készítményt a talajon szétszórjuk. Ebben az esetben a készítmény hatóanyag-koncentrációja tulajdonképpen közömbös, csak a talaj 1 térfogatrészére vonatkoztatott hatóanyag mennyiség lényeges, és azt ppm (mg/l) mértékegységben állapítjuk meg. Az előkészített földet 0,25 l-es virágcserepekbe visszük, és 20°C hőmérsékleten hagyjuk állni.

- 15 Közvetlenül az elkészítés után minden virágcserepbe 5 előcsíráztatott Yield Guard® (Monsanto Comp., USA cég márkaneve) kukoricaszemet helyezünk. Két nap után a megfelelő tesztrovart helyezzük a kezelt földbe. További 7 nap eltelte után az előbukkanó kukoricánövények megszámlálásával meghatározzuk a kísérleti vegyület hatékonyságát (1 növény = 20%-os hatás).

G) példa: *Heliothis virescens* elleni hatás (transzgenikus növények kezelése)

- 20 Oldószer: 7 tömegrész dimetilformamid

Emulgeátor: 1 tömegrész alkilaril-poliglikol-éter

- 25 Alkalmas hatóanyag-készítmény előállítása céljából 1 tömegrész hatóanyagot a megadott mennyiségű oldószerrel és megadott mennyiségű emulgeátorral összekeverünk, és a kapott koncentrátumot emulgeátort tartalmazó vízzel a kívánt koncentrációra hígítjuk.

Roundup Ready® (Monsanto Comp., USA cég márkaneve) szójababhajtasokat (*Glycine max*) a kívánt koncentrációjú hatóanyag-készítménybe történő bemártással kezelünk, és a még nedves leveleket a gyapotmagféreg (*Heliothis virescens*) hernyóival betelepítjük.

- 30 A kívánt idő elteltével meghatározzuk a pusztulási fokot százalékban. A 100% azt jelenti, hogy az összes hernyó elpusztult, míg a 0% azt jelenti, hogy egyetlen hernyó sem pusztult el.

Szabadalmi igénypontok

1. (I) általános képletű Δ^1 -pirrolinszármazékok, amelyek képletében
 - R^1 jelentése halogénatom vagy metilcsoport;
 - R^2 jelentése hidrogén- vagy halogénatom;
 - 5 R^3 jelentése halogénatom vagy adott esetben szubsztituált alkil-, alkoxi- vagy alkiltiocsoport;
 - m jelentése egész szám, melynek értéke 0, 1, 2, 3 vagy 4;
 - Q jelentése (a), (b), (c), (d), (e) vagy (f) képletű csoport, ahol
 - R^4 jelentése hidrogén-, halogénatom, ciano-, formil-, nitro-, trialkilszililcsoport;
 - 10 adott esetben szubsztituált alkil-, alkenil-, alkoxi-, alkeniloxics csoport;
 - pentafluortiocsoport, $-S(O)_pR^6$, $-NR^7R^8$, $-COR^6$, $-CO_2R^6$, $-CONR^9R^{10}$, $-N(R^{11})COR^{12}$ vagy $-C(R^{13})=N-OR^{14}$ általános képletű csoport; vagy adott esetben szubsztituált cikloalkil-, cikloalkilalkil-, aril-, arilalkil-, telített vagy telítetlen heterociklil- vagy heterociklilalkilcsoport; vagy
 - 15 R^4 jelentése $-CH=NOH$ képletű csoport, formilcsoport; adott esetben szubsztituált cikloalkiloxi- vagy cikloalkilalkiloxics csoport;
 - R^5 jelentése halogénatom, ciano-, formil-, nitro-, trialkilszililcsoport; adott esetben szubsztituált alkil-, alkenil-, alkoxi-, alkeniloxics csoport; pentafluortiocsoport, $-S(O)_pR^6$, $-NR^7R^8$, $-COR^6$, $-CO_2R^6$, $-CONR^9R^{10}$, $-N(R^{11})COR^{12}$
 - 20 vagy $-C(R^{13})=N-OR^{14}$ általános képletű csoport; vagy adott esetben szubsztituált cikloalkil-, cikloalkilalkil-, aril-, arilalkil-, telített vagy telítetlen heterociklil- vagy heterociklilalkilcsoport;
 - p jelentése egész szám, melynek értéke 0, 1 vagy 2;
 - n jelentése egész szám, melynek értéke 0, 1, 2 vagy 3, ahol az R^5
 - 25 szubsztituensek jelentése azonos vagy eltérő, amikor n értéke 2 vagy 3;
 - r jelentése egész szám, melynek értéke 0, 1 vagy 2, ahol az R^5 szubsztituensek jelentése azonos vagy eltérő, amikor r értéke 2;
 - R^6 jelentése adott esetben szubsztituált alkil-, cikloalkil-, aril- vagy arilalkilcsoport;
 - 30 R^7 és R^8 jelentése egymástól függetlenül hidrogénatom, $-SO_2R^6$, $-COR^6$ vagy $-CO_2R^6$ általános képletű csoport, adott esetben szubsztituált alkil-, alke-

nil-, cikloalkil-, cikloalkilalkil-, aril-, arilalkil-, telített vagy telítetlen heterociklil- vagy heterociklilalkilcsoport, továbbá

R^7 és R^8 jelentése együttesen egy adott esetben szubsztituált alkenilén- vagy alkiléncsoport, ahol az alkilénlánc minden esetben -O-, -S- atommal vagy -NR¹⁵- általános képletű csoporttal lehet megszakítva, továbbá

R^7 és R^8 jelentése együttesen egy adott esetben szubsztituált alkiléncsoport, ahol az alkilénlánc C=O vagy C=NO-alkil-csoporttal lehet megszakítva;

R^9 és R^{10} jelentése egymástól függetlenül hidrogénatom, -SO₂R⁶ általános képletű csoport, adott esetben szubsztituált alkil-, alkenil-, cikloalkil-, cikloalkilalkil-, aril-, arilalkil-, telített vagy telítetlen heterociklil- vagy heterociklilalkilcsoport, továbbá

R^9 és R^{10} jelentése együttesen egy adott esetben szubsztituált alkiléncsoport, ahol az alkilénlánc minden esetben -O-, -S- atommal vagy -NR¹⁵- csoporttal lehet megszakítva;

R^{11} és R^{12} jelentése egymástól függetlenül hidrogénatom, adott esetben szubsztituált alkil-, cikloalkil-, cikloalkilalkil-, aril- vagy arilalkilcsoport; továbbá

R^{11} és R^{12} jelentése együttesen egy adott esetben szubsztituált alkenilén- vagy alkiléncsoport;

R^{13} és R^{14} jelentése egymástól függetlenül hidrogénatom, adott esetben szubsztituált alkil- vagy alkenilcsoport; és

R^{15} jelentése hidrogénatom, -SO₂R⁶, -COR⁶ vagy -CO₂R⁶ általános képletű csoport, adott esetben szubsztituált alkil-, alkenil-, cikloalkil-, cikloalkilalkil-, aril-, arilalkil-, telített vagy telítetlen heterociklil- vagy heterociklilalkilcsoport.

2. Az 1. igénypont szerinti olyan (I) általános képletű Δ^1 -pirrolin-származékok, amelyek képletében

R^4 jelentése hidrogén-, halogénatom, ciano-, formil-, nitro-, trialkilszililcsoport; adott esetben szubsztituált alkil-, alkenil-, alkoxi-, alkeniloxics csoport; pentafluortiocsoport, -S(O)_pR⁶, -NR⁷R⁸, -COR⁶, -CO₂R⁶, -CONR⁹R¹⁰, -N(R¹¹)COR¹² vagy -C(R¹³)=N-OR¹⁴ általános képletű csoport; vagy adott esetben szubsztituált cikloalkil-, cikloalkilalkil-, aril-, arilalkil-, telített vagy telítetlen heterociklil- vagy heterociklilalkilcsoport;

- R^7 és R^8 jelentése egymástól függetlenül hidrogénatom, $-\text{SO}_2\text{R}^6$, $-\text{COR}^6$ vagy $-\text{CO}_2\text{R}^6$ általános képletű csoport, adott esetben szubsztituált alkil-, alkenil-, cikloalkil-, cikloalkilalkil-, aril-, arilalkil-, telített vagy telítetlen heterociklil- vagy heterociklilalkilcsoport, továbbá
- 5 R^7 és R^8 jelentése együttesen egy adott esetben szubsztituált alkenilén- vagy alkilén-csoport, ahol az alkilénlánc minden esetben -O-, -S- atommal vagy $-\text{NR}^{15}$ - általános képletű csoporttal lehet megszakítva, és R^1 , R^2 , R^3 , m, Q, R^5 , p, n, r, R^6 , R^9 , R^{10} , R^{11} , R^{12} , R^{13} , R^{14} és R^{15} jelentése az 1. igénypont szerinti.
- 10 3. Az 1. igénypont szerinti olyan (I) általános képletű Δ^1 -pirrolin-származékok, amelyek képletében
- R^1 jelentése halogénatom vagy metilcsoport,
 R^2 jelentése hidrogén- vagy halogénatom,
 R^3 jelentése halogénatom, adott esetben halogénatommal szubsztituált alkil-,
 15 alkoxi- vagy alkiltiocsoport,
 m jelentése 0, 1, 2, 3 vagy 4,
 Q jelentése (a), (b), (c), (d), (e) vagy (f) képletű csoport,
 R^4 jelentése hidrogénatom, halogénatom, ciano-, formil-, nitro-, trialkilszilil-csoport; alkil-, alkenil-, alkoxi-, alkeniloxics csoport, amelyek mindegyike
 20 adott esetben, egyszeresen vagy többszörösen, azonos vagy eltérő szubsztituenssel, és pedig halogénatommal, ciano- és/vagy $-\text{NR}^7\text{R}^8$ általános képletű csoporttal lehet szubsztituálva; pentafluortio-, $-\text{S}(\text{O})_p\text{R}^6$, $-\text{NR}^7\text{R}^8$, $-\text{COR}^6$, $-\text{CO}_2\text{R}^6$, $-\text{CONR}^9\text{R}^{10}$, $-\text{N}(\text{R}^{11})\text{COR}^{12}$ vagy $-\text{C}(\text{R}^{13})=\text{N}-\text{OR}^{14}$ általános képletű csoport; vagy cikloalkil-, cikloalkilalkil-, aril-, arilalkil-, telített vagy telítetlen, 5-10-tagú heterociklil- vagy heterociklilalkilcsoport,
 25 amelyek mindegyike adott esetben, egyszeresen vagy többszörösen, azonos vagy eltérő szubsztituenssel, és pedig halogénatommal, ciano-, nitro-, alkil-, halogénalkil-, alkenil-, halogénalkenil-, alkoxi-, halogénalkoxi-, alkiltio- és/vagy halogénalkiltiocsoporttal lehet szubsztituálva,
- 30 R^4 további jelentése $-\text{CH}=\text{NOH}$, formilcsoport; vagy cikloalkiloxi- vagy cikloalkilalkiloxics csoport, amelyek mindegyike adott esetben, egyszeresen vagy többszörösen, azonos vagy eltérő szubsztituenssel, és pedig halo-

- génatommal és/vagy alkilcsoporttal lehet szubsztituálva,
- R^5 jelentése halogénatom, ciano-, formil-, nitro-, trialkilszililcsoport; alkil-, alkenil-, alkoxi-, alkeniloxicsoport, amelyek mindegyike adott esetben, egyszeresen vagy többszörösen, azonos vagy eltérő szubsztituenssel,
- 5 és pedig halogénatommal, ciano- és/vagy $-NR^7R^8$ általános képletű csoporttal lehet szubsztituálva; pentafluortio-, $-S(O)_pR^6$, $-NR^7R^8$, $-COR^6$, $-CO_2R^6$, $-CONR^9R^{10}$, $-N(R^{11})COR^{12}$ vagy $-C(R^{13})=N-OR^{14}$ általános képletű csoport; vagy cikloalkil-, cikloalkilalkil-, aril-, arilalkil-, telített vagy telítetlen, 5-10-tagú heterociklil- vagy heterociklilalkilcsoport, amelyek mind-
- 10 egyike adott esetben, egyszeresen vagy többszörösen, azonos vagy eltérő szubsztituenssel, és pedig halogénatommal, alkil-, halogénalkil-, alkenil-, halogénalkenil-, alkoxi-, halogénalkoxi-, alkiltio- és/vagy halogénalkiltiocsoporttal lehet szubsztituálva,
- p jelentése 0, 1 vagy 2,
- 15 n jelentése 0, 1, 2 vagy 3, ahol az R^5 szubsztituensek jelentése azonos vagy eltérő, amikor n értéke 2 vagy 3,
- r jelentése 0, 1 vagy 2, ahol az R^5 szubsztituensek jelentése azonos vagy eltérő, amikor r értéke 2,
- R^6 jelentése olyan alkilcsoport, amely adott esetben halogénatommal vagy $-NR^7R^8$ általános képletű csoporttal egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált; vagy cikloalkil-, aril- vagy arilalkilcsoport, amelyek mindegyike adott esetben egy vagy több azonos vagy eltérő szubsztituenssel, és pedig halogénatommal, ciano-, alkil-, halogénalkil-, alkoxi-, halogénalkoxi-, alkiltio- és/vagy halogénalkiltiocsoporttal szubsztituált,
- 20 R^6 további jelentése olyan alkilcsoport, amely adott esetben egy vagy több, azonos vagy eltérő szubsztituenssel szubsztituált, ahol a szubsztituensek lehetnek alkoxi-, alkiltio-, halogénalkoxi- és/vagy halogénalkiltiocsoporttal lehetnek szubsztituálva,
- 25 R^7 és R^8 jelentése egymástól függetlenül hidrogénatom, $-SO_2R^6$, $-COR^6$, $-CO_2R^6$ általános képletű csoport; adott esetben egy vagy több, azonos vagy eltérő szubsztituenssel, és pedig halogénatommal, alkilkarbonil-, alkilkarboniloxi-, alkilamino-, dialkilamino-, alkoxi-, halogénalkoxi-, alkiltio-
- 30

és/vagy halogénalkiltio-csoporttal szubsztituált alkil- vagy alkenilcsoport; adott esetben egy vagy több, azonos vagy eltérő szubsztituenssel, éspedig halogénatommal, ciano-, alkil-, halogénalkil-, alkoxi-, halogénalkoxi-, alkiltio- és/vagy halogénalkiltio-csoporttal szubsztituált cikloalkil-, ciklo-
5 alkilalkil-, aril-, arilalkil-, telített vagy telítetlen, 5-10-tagú heterociklil- vagy heterociklilalkilcsoport,

R^7 és R^8 további jelentése együttesen egy olyan alkenilcsoport, amely adott esetben egy vagy több, azonos vagy eltérő szubsztituenssel, éspedig halogénatommal, ciano-, alkoxi-, halogénalkoxi-, alkiltio- és/vagy halogén-
10 alkiltio-csoporttal szubsztituált; vagy olyan alkilcsoport, amely adott esetben egy vagy több, azonos vagy eltérő szubsztituenssel, éspedig halogénatommal, ciano-, alkil-, halogénalkil-, alkoxi-, halogénalkoxi-, alkiltio- és/vagy halogénalkiltio-csoporttal szubsztituált, és ahol az alkilénláncok mindegyike adott esetben -O-, -S- vagy $-NR^{15}$ - általános képletű csoporttal
15 lehet megszakítva,

R^7 és R^8 további jelentése együttesen egy olyan alkilcsoportot alkot, amely adott esetben egy vagy több, azonos vagy eltérő alkoxikarbonil- és/vagy oxialkilénoxi-csoporttal szubsztituált,

R^7 és R^8 további jelentése együttesen egy olyan alkilcsoport alkot, ahol az
20 alkilénlánc C=O vagy C=NO-alkil-csoporttal lehet megszakítva,

R^9 és R^{10} jelentése egymástól függetlenül hidrogénatom, $-SO_2R^6$, általános képletű csoport; adott esetben egy vagy több, azonos vagy eltérő szubsztituenssel, éspedig halogénatommal, alkilamino-, dialkilamino-, alkoxi- és/vagy alkiltiocsoporttal szubsztituált alkil- vagy alkenilcsoport;
25 adott esetben egy vagy több, azonos vagy eltérő szubsztituenssel, éspedig halogénatommal, ciano-, alkil-, halogénalkil-, alkoxi-, halogénalkoxi-, alkiltio- és/vagy halogénalkiltio-csoporttal szubsztituált cikloalkil-, ciklo-alkilalkil-, aril-, arilalkil-, telített vagy telítetlen, 5-10-tagú heterociklil- vagy heterociklilalkilcsoport,

30 R^9 és R^{10} további jelentése együttesen egy olyan alkilcsoportot alkot, amely adott esetben egy vagy több, azonos vagy eltérő szubsztituenssel, éspedig halogénatommal, ciano-, alkil-, halogénalkil-, alkoxi-, halogénalkoxi-,

alkiltio- és/vagy halogénalkiltio-csoporttal szubsztituált, és ahol az alkilénláncok mindegyike adott esetben -O-, -S- vagy -NR¹⁵- általános képletű csoporttal lehet megszakítva,

5 R¹¹ és R¹² jelentése egymástól függetlenül hidrogénatom; adott esetben egy vagy több, azonos vagy eltérő szubsztituenssel, éspedig halogénatommal, ciano-, alkoxi- és/vagy alkiltiocsoporttal szubsztituált alkilcsoport; adott esetben egy vagy több, azonos vagy eltérő szubsztituenssel, éspedig halogénatommal, ciano-, alkil-, halogénalkil-, alkoxi-, halogénalkoxi-, alkiltio- és/vagy halogénalkiltio-csoporttal szubsztituált cikloalkil-, cikloalkilalkil-,
10 aril- vagy arilalkilcsoport,

R¹¹ és R¹² további jelentése együttesen egy olyan alkilén- vagy alkenilén-csoportot alkotnak, amelyek mindegyike adott esetben egy vagy több, azonos vagy eltérő szubsztituenssel, éspedig halogénatommal, alkil-, halogénalkil-, alkoxi-, halogénalkoxi-, alkiltio- és/vagy halogénalkiltio-csoporttal szubsztituált,
15

R¹³ és R¹⁴ jelentése egymástól függetlenül hidrogénatom vagy esetben egy vagy több halogénatommal szubsztituált alkil- vagy alkenilcsoport,

R¹⁵ jelentése hidrogénatom, -SO₂R⁶, -COR⁶, -CO₂R⁶ általános képletű csoport; adott esetben egy vagy több, azonos vagy eltérő szubsztituenssel, éspedig halogénatommal, ciano-, alkilamino-, dialkilamino-, alkoxi-, halogénalkoxi-, alkiltio- és/vagy halogénalkiltio-csoporttal szubsztituált alkil- vagy alkenilcsoport; adott esetben egy vagy több, azonos vagy eltérő szubsztituenssel, éspedig halogénatommal, ciano-, alkil-, halogénalkil-, alkoxi-, halogénalkoxi-, alkiltio- és/vagy halogénalkiltio-csoporttal szubsztituált cikloalkil-, cikloalkilalkil-, aril-, arilalkil-, telített vagy telítetlen, 5-10-
20 tagú heterociklil- vagy heterociklilalkilcsoport.

4. Az 1. igénypont szerinti olyan (I) általános képletű Δ^1 -pirrolin-származékok, amelyek képletében

30 R⁴ jelentése hidrogénatom, halogénatom, ciano-, formil-, nitro-, trialkilszililcsoport; alkil-, alkenil-, alkoxi-, alkeniloxicssoport, amelyek mindegyike adott esetben, egyszeresen vagy többszörösen, azonos vagy eltérő szubsztituenssel, éspedig halogénatommal, ciano- és/vagy -NR⁷R⁸ álta-

- lános képletű csoporttal lehet szubsztituálva; pentafluortio-, $-S(O)_pR^6$, $-NR^7R^8$, $-COR^6$, $-CO_2R^6$, $-CONR^9R^{10}$, $-N(R^{11})COR^{12}$ vagy $-C(R^{13})=N-OR^{14}$ általános képletű csoport; vagy cikloalkil-, cikloalkilalkil-, aril-, arilalkil-, telített vagy telítetlen, 5-10-tagú heterociklil- vagy heterociklilalkilcsoport,
- 5 amelyek mindegyike adott esetben, egyszeresen vagy többszörösen, azonos vagy eltérő szubsztituenssel, és pedig halogénatommal, ciano-, nitro-, alkil-, halogénalkil-, alkenil-, halogénalkenil-, alkoxi-, halogénalkoxi-, alkiltio- és/vagy halogénalkiltiocsoporttal lehet szubsztituálva,
- R^6 jelentése olyan alkilcsoport, amely adott esetben halogénatommal és/vagy
- 10 $-NR^7R^8$ általános képletű csoporttal egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált; vagy cikloalkil-, aril- vagy arilalkilcsoport, amelyek mindegyike adott esetben egy vagy több azonos vagy eltérő szubsztituenssel, és pedig halogénatommal, ciano-, alkil-, halogénalkil-, alkoxi-, halogénalkoxi-, alkiltio- és/vagy halogénalkiltiocsoporttal szubsztituált,
- 15 R^7 és R^8 jelentése egymástól függetlenül hidrogénatom, $-SO_2R^6$, $-COR^6$, $-CO_2R^6$ általános képletű csoport; adott esetben egy vagy több, azonos vagy eltérő szubsztituenssel, és pedig halogénatommal, alkilkarbonil-, alkilkarboniloxi-, alkilamino-, dialkilamino-, alkoxi-, halogénalkoxi-, alkiltio- és/vagy halogénalkiltio-csoporttal szubsztituált alkil- vagy alkenilcsoport;
- 20 adott esetben egy vagy több, azonos vagy eltérő szubsztituenssel, és pedig halogénatommal, ciano-, alkil-, halogénalkil-, alkoxi-, halogénalkoxi-, alkiltio- és/vagy halogénalkiltio-csoporttal szubsztituált cikloalkil-, cikloalkilalkil-, aril-, arilalkil-, telített vagy telítetlen, 5-10-tagú heterociklil- vagy heterociklilalkilcsoport,
- 25 R^7 és R^8 további jelentése együttesen egy olyan alkeniléncsoport, amely adott esetben egy vagy több, azonos vagy eltérő szubsztituenssel, és pedig halogénatommal, ciano-, alkoxi-, halogénalkoxi-, alkiltio- és/vagy halogénalkiltio-csoporttal szubsztituált; vagy olyan alkiléncsoport, amely adott esetben egy vagy több, azonos vagy eltérő szubsztituenssel, és pedig halogénatommal, ciano-, alkil-, halogénalkil-, alkoxi-, halogénalkoxi-, alkiltio-
- 30 és/vagy halogénalkiltio-csoporttal szubsztituált és ahol az alkilénláncok mindegyike adott esetben $-O-$, $-S-$ vagy $-NR^{15}$ - általános képletű csoporttal

lehet megszakítva, és

R^1 , R^2 , R^3 , m , Q , R^5 , p , n , r , R^9 , R^{10} , R^{11} , R^{12} , R^{13} , R^{14} és R^{15} jelentése a 3. igénypont szerinti.

- 5 Az 1. igénypont szerinti olyan (I) általános képletű Δ^1 -pirrolin-származékok, amelyek képletében
- R^1 jelentése fluor-, klór-, brómatom vagy metilcsoport,
- R^2 jelentése hidrogén-, fluor-, klór- vagy brómatom,
- R^3 jelentése fluor-, klór- vagy brómatom, adott esetben egy-nyolc halogén-atommal szubsztituált 1-6 szénatomos alkil-, 1-6 szénatomos alkoxi- vagy
- 10 1-6 szénatomos alkiltiocsoport,
- m jelentése 0, 1, 2 vagy 3,
- Q jelentése (a), (b), (c), (d), (e) vagy (f) képletű csoport,
- R^4 jelentése hidrogén-, fluor-, klór, brómatom, ciano-, formil-, nitro-, tri(1-6 szénatomos alkil)szililcsoport; adott esetben egy vagy több, azonos vagy
- 15 eltérő szubsztituenssel, éspedig halogénatommal, cianocsoporttal és/vagy $-NR^7R^8$ általános képletű csoporttal szubsztituált 1-20 szénatomos alkil-, 2-20 szénatomos alkenil-, 1-20 szénatomos alkoxi- vagy 2-20 szénatomos alkeniloxics csoport; pentafluortio-, $-S(O)_pR^6$, $-NR^7R^8$, $-COR^6$, $-CO_2R^6$, $-CONR^9R^{10}$, $-N(R^{11})COR^{12}$ vagy $-C(R^{13})=N-OR^{14}$ általános képletű csoport;
- 20 vagy adott esetben egy-négy azonos vagy eltérő szubsztituenssel, éspedig halogénatommal, ciano- nitro-, 1-6 szénatomos alkil-, 1-6 szénatomos halogénalkil-, 2-6 szénatomos alkenil-, 2-6 szénatomos halogénalkenil-, 1-6 szénatomos alkoxi-, 1-6 szénatomos halogénalkoxi-, 1-6 szénatomos alkiltio- és/vagy 1-6 szénatomos halogénalkiltio-csoporttal szubsztituált
- 25 3-12 szénatomos cikloalkil-, (3-7 szénatomos cikloalkil)-(1-4 szénatomos alkil)-, aril-, aril-(1-4 szénatomos alkil)-, telített vagy telítetlen, 5-10-tagú heterociklil- vagy heterociklil-(1-4 szénatomos alkil)-csoport, ahol a heterociklilcsoport 1-4 heteroatomot tartalmazhat, amelyek közül 0-4 nitrogénatom, 0-2 nem-szomszédos oxigénatom és/vagy 0-2 nem-szomszédos
- 30 kénatom lehet (így különösen tetrazolil-, furil-, furfuril-, benzofuril-, tetrahydrofuril-, tienil-, tenil-, benzotienil-, tiolanil-, pirrolil-, indolil-, pirrolinil-, pirrolidino-, pirrolidinil-, oxazolil-, benzoxazolil-, izoxazolil-, imidazolil-,

pirazolil-, tiazolil-, benzotiazolil-, tiazolidinil-, piridinil-, pirimidinil-, piridazil-, pirazinil-, piperidinil-, piperidino-, morfolinil-, tiomorfolinil-, morfolino-, tiomorfolino-, triazinil-, triazolil-, kinolinil- vagy izokinolinilcsoport),

5 R^4 jelentése $-CH=NOH$ képletű csoport, formilcsoport; vagy adott esetben 1-4, azonos vagy eltérő szubsztituenssel, éspedig fluor-, klór- és/vagy brómatommal és/vagy 1-2 szénatomos alkilcsoporttal szubsztituált 3-6 szénatomos cikloalkiloxi- vagy (3-6 szénatomos cikloalkil)-(1-4 szénatomos alkoxi)-csoport,

10 R^5 jelentése fluor-, klór- vagy brómatom, ciano-, formil-, nitro-, tri-(1-6 szénatomos alkil)szililcsoport; adott esetben 1-13 halogénatommal szubsztituált 1-6 szénatomos alkil-, 2-6 szénatomos alkenil-, 1-6 szénatomos alkoxi-, 2-6 szénatomos alkeniloxics csoport; pentafluortiocsoport, $-S(O)_pR^6$, $-NR^7R^8$, $-COR^6$, $-CO_2R^6$, $-CONR^9R^{10}$ vagy $-N(R^{11})COR^{12}$ általános képletű csoport,

p jelentése 0, 1 vagy 2,

15 n jelentése 0, 1, 2 vagy 3, ahol az R^5 szubsztituensek jelentése azonos vagy eltérő, amikor n értéke 2 vagy 3,

r jelentése 0, 1 vagy 2, ahol az R^5 szubsztituensek jelentése azonos vagy eltérő, amikor r értéke 2,

20 R^6 jelentése adott esetben egy vagy több, azonos vagy eltérő halogénatommal és/vagy $-NR^7R^8$ általános képletű csoporttal szubsztituált 1-20 szénatomos alkilcsoport, adott esetben egy vagy több, azonos vagy eltérő szubsztituenssel, éspedig halogénatommal, ciano-, 1-6 szénatomos alkil-, 1-6 szénatomos halogénalkil-, 1-6 szénatomos alkoxi-, 1-6 szénatomos halogénalkoxi-, 1-6 szénatomos alkiltio- és/vagy 1-6 szénatomos halogénalkiltio-csoporttal szubsztituált 3-6 szénatomos cikloalkil-, aril- vagy aril-

25 (1-4 szénatomos alkil)-csoport,

R^6 további jelentése egyszeresen vagy többszörösen, azonos vagy eltérő szubsztituenssel szubsztituált 1-20 szénatomos alkilcsoport, ahol a szubsztituensek 1-6 szénatomos alkoxi-, 1-6 szénatomos alkiltio-, 1-6 szénatomos halogénalkoxi- és/vagy 1-6 szénatomos halogénalkiltio-

30 csoport lehetnek,

R^7 és R^8 jelentése, egymástól függetlenül hidrogénatom, $-SO_2R^6$, $-COR^6$,

- CO₂R⁶ általános képletű csoport; adott esetben egy vagy több, azonos vagy eltérő szubsztituenssel, éspedig halogénatommal, 1-6 szénatomos alkilkarbonil-, 1-6 szénatomos alkilkarboniloxi-, 1-6 szénatomos alkil-amino-, di(1-6 szénatomos alkil)amino-, 1-6 szénatomos alkoxi-, 1-6 szénatomos halogénalkoxi-, 1-6 szénatomos alkiltio- és/vagy 1-6 szénatomos halogénalkiltio-csoporttal szubsztituált 1-20 szénatomos alkil- vagy 2-20 szénatomos alkenilcsoport; adott esetben 1-4, azonos vagy eltérő szubsztituenssel, éspedig halogénatommal, ciano-, 1-6 szénatomos alkil-, 1-6 szénatomos halogénalkil-, 1-6 szénatomos alkoxi-, 1-6 szénatomos halogénalkoxi-, 1-6 szénatomos alkiltio- és/vagy 1-6 szénatomos halogénalkiltio-csoporttal szubsztituált 3-12 cikloalkil-, (3-7 szénatomos cikloalkil)-(1-4 szénatomos alkil)-, aril-, aril-(1-4 szénatomos alkil)-, telített vagy telítetlen, 5-10-tagú heterociklil- vagy heterociklil-(1-4 szénatomos alkil)-csoport, ahol a heterociklilcsoport 1-4 heteroatomot tartalmazhat, amelyek közül 0-4 nitrogénatom, 0-2 nem-szomszédos oxigénatom és/vagy 0-2 nem-szomszédos kénatom lehet (így különösen tetrazolil-, furil-, furfuril-, benzofuril-, tetrahydrofuril-, tienil-, tenil-, benzotienil-, tiolanil-, pirrolil-, indolil-, pirrolinil-, pirrolidinil-, oxazolil-, benzoxazolil-, izoxazolil-, imidazolil-, pirazolil-, tiazolil-, benzotiazolil-, tiazolidinil-, piridinil-, pirimidinil-, piridazil-, pirazinil-, piperidinil-, morfolinil-, tiomorfolinil-, triazinil-, triazolil-, kinolinil- vagy izokinolinilcsoport lehet),
- R⁷ és R⁸ további jelentése egymástól függetlenül adott esetben 1-4, azonos vagy eltérő szubsztituenssel, éspedig halogénatommal, ciano-, 1-6 szénatomos alkil-, 1-6 szénatomos halogénalkil-, 1-6 szénatomos alkoxi-, 1-6 szénatomos halogénalkoxi-, 1-6 szénatomos alkiltio- és/vagy 1-6 szénatomos halogénalkiltio-csoporttal szubsztituált heterociklil-(1-4 szénatomos alkil)-csoport, ahol a heterociklilcsoport 1-4 heteroatomot tartalmazhat, amelyek közül 0-4 nitrogénatom, 0-2 nem-szomszédos oxigénatom és/vagy 0-2 nem-szomszédos kénatom lehet (így különösen piridinilmetil-, piridiniletil-, pirimidinilmetil-, pirimidiniletil-, piridazilmetil-, piridaziletil-, pirazinilmetil vagy piraziniletilcsoport),
- R⁷ és R⁸ további jelentése együttesen egy adott esetben egy vagy több, azo-

- nos vagy eltérő szubsztituenssel, és pedig halogénatommal, ciano-, 1-6 szénatomos alkoxi-, 1-6 szénatomos halogénalkoxi-, 1-6 szénatomos alkiltio- és/vagy 1-6 szénatomos halogénalkiltio-csoporttal szubsztituált 2-12 szénatomos alkenilénecsopót, vagy pedig jelentése adott esetben egy vagy
- 5 több, azonos vagy eltérő szubsztituenssel, és pedig halogénatommal, ciano-, 1-6 szénatomos alkil-, 1-6 szénatomos halogénalkil-, 1-6 szénatomos alkoxi-, 1-6 szénatomos halogénalkoxi-, 1-6 szénatomos alkiltio- és/vagy 1-6 szénatomos halogénalkiltio-csoporttal szubsztituált 3-12 szénatomos alkilénecsopót alkothatnak, ahol az alkilénlánc minden esetben
- 10 -O-, -S- atommal vagy $-NR^{15}$ - általános képletű csoporttal lehet megszakítva,
- R^7 és R^8 további jelentése együttesen egy adott esetben egy vagy több, azonos vagy eltérő szubsztituenssel szubsztituált 3-12 szénatomos alkilénecsopót alkothatnak, ahol a szubsztituensek 1-4 szénatomos alkoxi-
- 15 karbonil- vagy oxi-(1-4 szénatomos alkilén)-oxi-csoport lehetnek,
- R^7 és R^8 további jelentése együtt olyan 3-8 szénatomos alkilénecsopót alkothatnak, ahol az alkilénlánc C=O vagy C=NO-alkil-csoporttal lehet megszakítva,
- R^9 és R^{10} jelentése egymástól függetlenül hidrogénatom, $-SO_2R^6$ általános
- 20 képletű csoport; adott esetben 1-13, azonos vagy eltérő szubsztituenssel, és pedig halogénatommal, 1-6 szénatomos alkilamino-, di(1-6 szénatomos alkil)amino-, 1-6 szénatomos alkoxi-, 1-6 szénatomos halogénalkoxi-, 1-6 szénatomos alkiltio- és/vagy 1-6 szénatomos halogénalkiltiocsoporttal szubsztituált 1-6 szénatomos alkil- vagy 2-6 szénatomos alkenilcsopót;
- 25 adott esetben 1-4, azonos vagy eltérő szubsztituenssel, és pedig halogénatommal, ciano-, 1-6 szénatomos alkil-, 1-6 szénatomos halogénalkil-, 1-6 szénatomos alkoxi-, 1-6 szénatomos halogénalkoxi-, 1-6 szénatomos alkiltio- és/vagy 1-6 szénatomos halogénalkiltio-csoporttal szubsztituált 3-7 szénatomos cikloalkil-, (3-7 szénatomos cikloalkil)-(1-4 szénatomos alkil)-,
- 30 aril-, aril-(1-4 szénatomos alkil)-, telített vagy telítetlen, 5-10-tagú heterociklil- vagy heterociklil-(1-4 szénatomos alkil)-csoport, ahol a heterociklilcsopót 1-4 heteroatomot tartalmazhat, amelyek közül 0-4 nitrogénatom, 0-2 nem-

szomszédos oxigénatom és/vagy 0-2 nem-szomszédos kénatom lehet (így különösen tetrazolil-, furil-, furfuril-, benzofuril-, tetrahydrofuril-, tienil-, tenil-, benztienil-, tiolanil-, pirrolil-, indolil-, pirrolinil-, pirrolidinil-, oxazolil-, benzoxazolil-, izoxazolil-, imidazolil-, pirazolil-, tiazolil-, benzotiazolil-,
5 tiazolidinil-, piridinil-, pirimidinil-, piridazil-, pirazinil-, piperidinil-, morfolinil-, tiomorfolinil-, triazinil-, triazolil-, kinolinil- vagy izokinolinilcsoport),

R^9 és R^{10} további jelentése együttesen egy az alkilénláncban adott esetben 1-4, azonos vagy eltérő szubsztituenssel, éspedig halogénatommal, ciano-, 1-6 szénatomos alkil-, 1-6 szénatomos halogénalkil-, 1-6 szénatomos alkoxi-, 1-6
10 szénatomos halogénalkoxi-, 1-6 szénatomos alkiltio- és/vagy 1-6 szénatomos halogénalkiltio-csoporttal szubsztituált 3-6 szénatomos alkilencsoport, $-(CH_2)_2-O-(CH_2)_2-$, $-(CH_2)_2-S-(CH_2)_2-$ vagy $-(CH_2)_2-N(R^{15})-(CH_2)_2-$ képletű csoportot alkothatnak,

R^{11} és R^{12} jelentése, egymástól függetlenül hidrogénatom, adott esetben 1-13,
15 azonos vagy eltérő szubsztituenssel, éspedig halogénatommal, ciano-, 1-6 szénatomos alkoxi-, 1-6 szénatomos alkiltio-csoporttal szubsztituált 1-6 szénatomos alkilcsoport, adott esetben 1-8, azonos vagy eltérő szubsztituenssel, éspedig halogénatommal, ciano-, 1-6 szénatomos alkil-, 1-6 szénatomos halogénalkil-, 1-6 szénatomos alkoxi-, 1-6 szénatomos halogénalkoxi-, 1-6
20 szénatomos alkiltio- és/vagy 1-6 szénatomos halogénalkiltio-csoporttal szubsztituált 3-7 szénatomos cikloalkil-, (3-7 szénatomos cikloalkil)-(1-4 szénatomos alkil)-, aril- vagy aril-(1-4 szénatomos alkil)-csoport,

R^{11} és R^{12} további jelentése együttesen egy adott esetben 1-8, azonos vagy eltérő szubsztituenssel, éspedig halogénatommal, 1-6 szénatomos alkil-, 1-6
25 szénatomos halogénalkil-, 1-6 szénatomos alkoxi-, 1-6 szénatomos halogénalkoxi-, 1-6 szénatomos alkiltio-, 1-6 szénatomos halogénalkiltio-csoporttal szubsztituált 3-10 szénatomos alkilén- vagy 3-10 szénatomos alkenilencsoport,

R^{13} és R^{14} egymástól függetlenül, jelentése hidrogénatom, adott esetben egy
30 vagy több halogénatommal szubsztituált 1-6 szénatomos alkil- vagy 2-6 szénatomos alkenilcsoport,

R^{15} jelentése hidrogénatom, $-SO_2R^6$, $-COR^6$ vagy $-CO_2R^6$ általános képletű

csoport; adott esetben egy vagy több, azonos vagy eltérő szubsztituenssel, éspedig halogénatommal, ciano-, 1-6 szénatomos alkilamino-, di(1-6 szénatomos alkil)amino-, 1-6 szénatomos alkoxi-, 1-6 szénatomos halogénalkoxi-, 1-6 szénatomos alkiltio- és/vagy 1-6 szénatomos halogénalkiltiocsoporttal szubsztituált 1-20 szénatomos alkil- vagy 2-20 szénatomos alkenilcsoport; adott esetben 1-4, azonos vagy eltérő szubsztituenssel, éspedig halogénatommal, ciano-, 1-6 szénatomos alkil-, 1-6 szénatomos halogénalkil-, 1-6 szénatomos alkoxi-, 1-6 szénatomos halogénalkoxi-, 1-6 szénatomos alkiltio- és/vagy 1-6 szénatomos halogénalkiltiocsoporttal szubsztituált 3-12 szénatomos cikloalkil-, (3-7 szénatomos cikloalkil)-(1-4 szénatomos alkil)-, aril-, aril-(1-4 szénatomos alkil)-csoport, telített vagy telítetlen, 5-10-tagú heterociklil- vagy heterociklil-(1-4 szénatomos alkil)-csoport ahol a heterociklilcsoport 1-4 heteroatomot tartalmazhat, amelyek közül 0-4 nitrogénatom, 0-2 nem-szomszédos oxigénatom és/vagy 0-2 nem-szomszédos kénatom lehet (így különösen tetrazolil-, furil-, furfuril-, benzofuril-, tetrahydrofuril-, tienil-, tenil-, benztienil-, tiolanil-, pirrolil-, indolil-, pirrolinil-, pirrolidinil-, oxazolil-, benzoxazolil-, izoxazolil-, imidazolil-, pirazolil-, tiazolil-, benztiazolil-, tiazolidinil-, piridinil-, pirimidinil-, piridazil-, pirazinil-, piperidinil-, morfolinil-, tiomorfolinil-, triazinil-, triazolil-, kinolinil- vagy izokinolinilcsoport).

6. Az 1. igénypont szerinti olyan (I) általános képletű Δ^1 -pirrolin-származékok, amelyek képletében

R^4 jelentése hidrogén-, fluor-, klór, brómatom, ciano-, formil-, nitro-, tri(1-6 szénatomos alkil)zililcsoport; adott esetben egy vagy több, azonos vagy eltérő szubsztituenssel, éspedig halogénatommal, cianocsoporttal és/vagy $-NR^7R^8$ általános képletű csoporttal szubsztituált 1-20 szénatomos alkil-, 2-20 szénatomos alkenil-, 1-20 szénatomos alkoxi- vagy 2-20 szénatomos alkeniloxics csoport; pentafluortio-, $-S(O)_pR^6$, $-NR^7R^8$, $-COR^6$, $-CO_2R^6$, $-CONR^9R^{10}$, $-N(R^{11})COR^{12}$ vagy $-C(R^{13})=N-OR^{14}$ általános képletű csoport; vagy adott esetben 1-4, azonos vagy eltérő szubsztituenssel, éspedig halogénatommal, ciano- nitro-, 1-6 szénatomos alkil-, 1-6 szénatomos halogénalkil-, 2-6 szénatomos alkenil-, 2-6 szénatomos halogénalkenil-,

- 1-6 szénatomos alkoxi-, 1-6 szénatomos halogénalkoxi-, 1-6 szénatomos alkiltio- és/vagy 1-6 szénatomos halogénalkiltio-csoporttal szubsztituált 3-12 szénatomos cikloalkil-, 3-7 szénatomos cikloalkil-(1-4 szénatomos alkil)-, aril-, aril-(1-4 szénatomos alkil)-, telített vagy telítetlen, 5-10-tagú heterociklil- vagy heterociklil-(1-4 szénatomos alkil)-csoport, ahol a heterociklilcsoport 1-4 heteroatomot tartalmazhat, amelyek közül 0-4 nitrogénatom, 0-2 nem-szomszédos oxigénatom és/vagy 0-2 nem-szomszédos kénatom lehet (így különösen tetrazolil-, furil-, furfuril-, benzofuril-, tetrahydrofuril-, tienil-, tenil-, benzotienil-, tiolanil-, pirrolil-, indolil-, pirrolinil-, pirrolidino-, pirrolidinil-, oxazolil-, benzoxazolil-, izoxazolil-, imidazolil-, pirazolil-, tiazolil-, benzotiazolil-, tiazolidinil-, piridinil-, pirimidinil-, piridazil-, pirazinil-, piperidinil-, piperidino-, morfolinil-, tiomorfolinil-, morfolino-, tiomorfolino-, triazinil-, triazolil-, kinolinil- vagy izokinolinilcsoport),
- R^6 jelentése adott esetben egy vagy több, azonos vagy eltérő szubsztituenssel, éspedig halogénatommal és/vagy $-NR^7R^8$ általános képletű csoporttal szubsztituált 1-20 szénatomos alkilcsoport, adott esetben 1-8, azonos vagy eltérő szubsztituenssel, éspedig halogénatommal, ciano-, 1-6 szénatomos alkil-, 1-6 szénatomos halogénalkil-, 1-6 szénatomos alkoxi-, 1-6 szénatomos halogénalkoxi-, 1-6 szénatomos alkiltio- és/vagy 1-6 szénatomos halogénalkiltio-csoporttal szubsztituált 3-6 szénatomos cikloalkil-, aril- vagy aril-(1-4 szénatomos alkil)-csoport,
- R^7 és R^8 jelentése egymástól függetlenül hidrogénatom, $-SO_2R^6$, $-COR^6$, $-CO_2R^6$ általános képletű csoport; adott esetben egy vagy több, azonos vagy eltérő szubsztituenssel, éspedig halogénatommal, 1-6 szénatomos alkilkarbonil-, 1-6 szénatomos alkilkarboniloxi-, 1-6 szénatomos alkilamino-, di(1-6 szénatomos alkil)amino-, 1-6 szénatomos alkoxi-, 1-6 szénatomos halogénalkoxi-, 1-6 szénatomos alkiltio- és/vagy 1-6 szénatomos halogénalkiltio-csoporttal szubsztituált 1-20 szénatomos alkil- vagy 2-20 szénatomos alkenilcsoport; adott esetben 1-4, azonos vagy eltérő szubsztituenssel, éspedig halogénatommal, ciano-, 1-6 szénatomos alkil-, 1-6 szénatomos halogénalkil-, 1-6 szénatomos alkoxi-, 1-6 szénatomos halogénalkoxi-, 1-6 szénatomos alkiltio- és/vagy 1-6 szénatomos halogén-

alkiltio-csoporttal szubsztituált 3-12 cikloalkil-, (3-7 szénatomos cikloalkil)-
(1-4 szénatomos alkil)-, aril-, aril-(1-4 szénatomos alkil)-, telített vagy telítet-
tlen, 5-10-tagú heterociklil- vagy heterociklil-(1-4 szénatomos alkil)-
csoport, ahol a heterociklilcsoport 1-4 heteroatomot tartalmazhat, amelyek
5 közül 0-4 nitrogénatom, 0-2 nem-szomszédos oxigénatom és/vagy 0-2
nem-szomszédos kénatom lehet (így különösen tetrazolil-, furil-, furfuril-,
benzofuril-, tetrahidrofuril-, tienil-, tenil-, benztienil-, tiolanil-, pirrolil-,
indolil-, pirrolinil-, pirrolidinil-, oxazolil-, benzoxazolil-, izoxazolil-, imidazolil-,
pirazolil-, tiazolil-, benzotiazolil-, tiazolidinil-, piridinil-, pirimidinil-, piridazil-,
10 pirazinil-, piperidinil-, morfolinil-, tiomorfolinil-, triazinil-, triazolil-, kinolinil-
vagy izokinolinilcsoport lehet),

R^7 és R^8 további jelentése együttesen egy adott esetben egy vagy több, azo-
nos vagy eltérő szubsztituenssel, éspedig halogénatommal, ciano-, 1-6
szénatomos alkoxi-, 1-6 szénatomos halogénalkoxi-, 1-6 szénatomos
15 alkiltio- és/vagy 1-6 szénatomos halogénalkiltio-csoporttal szubsztituált
2-12 szénatomos alkeniléncsoport, vagy pedig jelentése adott esetben egy
vagy több, azonos vagy eltérő szubsztituenssel, éspedig halogénatommal,
ciano-, 1-6 szénatomos alkil-, 1-6 szénatomos halogénalkil-, 1-6 szénato-
mos alkoxi-, 1-6 szénatomos halogénalkoxi-, 1-6 szénatomos alkiltio-
20 és/vagy 1-6 szénatomos halogénalkiltio-csoporttal szubsztituált 3-12 szén-
atomos alkiléncsoportot alkothatnak, ahol az alkilénlánc minden esetben
-O-, -S- atommal vagy $-NR^{15}$ - csoporttal lehet megszakítva,

R^1 , R^2 , R^3 , m, Q, R^5 , p, n, r, R^9 , R^{10} , R^{11} , R^{12} , R^{13} , R^{14} és R^{15} jelentése 5. igény-
pont szerinti.

25 7. Az 1. igénypont szerinti olyan (I) általános képletű Δ^1 -pirrolin-
származékok, amelyek képletében

R^1 jelentése fluor-, klóratom vagy metilcsoport,

R^2 jelentése hidrogén-, fluor- vagy klóratom,

R^3 jelentése fluor-, klóratom, 1-4 szénatomos alkil-, 1-4 szénatomos alkoxi-,
30 1-4 szénatomos alkiltio-, 1-4 szénatomos halogénalkil-, 1-4 szénatomos
halogénalkoxi-, 1-4 szénatomos halogénalkiltiocsoport, amelyek mindegyi-
ke 1-9 fluor-, klór- és/vagy brómatommal lehet szubsztituálva,

m jelentése 0, 1 vagy 2,

Q jelentése (a), (b), (c), (d), (e) vagy (f) képletű csoport,

R⁴ jelentése hidrogén-, fluor-, klór- vagy brómatom, ciano-, formil-, nitro-, tri(1-4 szénatomos alkil)szililcsoport; adott esetben egy vagy több, azonos vagy eltérő szubsztituenssel, éspedig fluor-, klór- vagy brómatommal, cianocsoporttal és/vagy -NR⁷R⁸ általános képletű csoporttal szubsztituált 1-16 szénatomos alkil-, 2-16 szénatomos alkenil-, 1-16 szénatomos alkoxi-, 1-16 szénatomos alkeniloxics csoport; -S(O)_pR⁶, -NR⁷R⁸, -COR⁶, -CO₂R⁶, -CONR⁹R¹⁰ vagy -N(R¹¹)COR¹² általános képletű csoport; vagy adott esetben 1-3, azonos vagy eltérő szubsztituenssel, éspedig fluor-, klór- vagy brómatommal, cianocsoporttal, 1-4 szénatomos alkil-, 1-4 szénatomos halogénalkil-, 2-6 szénatomos alkenil-, 2-6 szénatomos halogénalkenil-, 1-4 szénatomos alkoxi-, 1-4 szénatomos halogénalkoxi-, 1-4 szénatomos alkiltio-, 1-4 szénatomos halogénalkiltiocsoporttal szubsztituált 3-10 szénatomos cikloalkil-, (3-6 szénatomos cikloalkil)-(1-4 szénatomos alkil)-, fenil-, benzil-, feniletil-, tetrazolil-, furil-, furfuril-, benzofuril-, tetrahidrofuril-, tienil-, tenil-, benzotienil-, tiolanil-, pirrolil-, indolil-, pirrolinil-, pirrolidino-, pirrolidinil-, oxazolil-, benzoxazolil-, izoxazolil-, imidazolil-, pirazolil-, tiazolil-, benzotiazolil-, tiazolidinil-, piridinil-, pirimidinil-, piridazil-, pirazinil-, piperidinil-, piperidino-, morfolinil-, tiomorfolinil-, morfolino-, tiomorfolino-, triazinil-, triazolil-, kinolinil- vagy izokinolinilcsoport,

R⁴ további jelentése -CHNOH, formilcsoport; adott esetben 1-3, azonos vagy eltérő szubsztituenssel, éspedig fluor- és/vagy klóratommal és/vagy metilcsoporttal szubsztituált ciklopropiloxi-, ciklobutiloxi-, ciklopentiloxi-, ciklohexiloxi-, ciklopropilmetoxi-, ciklobutilmetoxi-, ciklopentilmetoxi- vagy ciklohexilmetoxics csoport,

R⁵ jelentése fluor- vagy klóratom, trimetilszililcsoport; adott esetben 1-9, azonos vagy eltérő szubsztituenssel, éspedig fluor-, klór- és/vagy brómatommal szubsztituált 1-4 szénatomos alkil-, 2-6 szénatomos alkenil-, 1-4 szénatomos alkoxi-, 2-6 szénatomos alkeniloxics csoport; vagy -S(O)_pR⁶, -NR⁷R⁸, -COR⁶, -CO₂R⁶ vagy -CONR⁹R¹⁰ általános képletű csoport,

- p jelentése 0, 1 vagy 2,
n jelentése 0, 1 vagy 2, ahol az R^5 szubsztituensek jelentése azonos vagy eltérő, amikor n értéke 2,
r jelentése 0, 1 vagy 2, ahol az R^5 szubsztituensek jelentése azonos vagy eltérő, amikor r értéke 2,
- 5 R^6 jelentése adott esetben egy vagy több, azonos vagy eltérő szubsztituenssel, éspedig fluor-, klór- és/vagy brómatommal és/vagy $-NR^7R^8$ általános képletű csoporttal szubsztituált 1-10 szénatomos alkilcsoport; adott esetben 1-4, azonos vagy eltérő fluor-, klór- vagy brómatommal, ciano-, 1-4 szénatomos alkil-, 1-4 szénatomos halogénalkil-, 1-4 szénatomos alkoxi-, 1-4 szénatomos halogénalkoxi-, 1-4 szénatomos alkiltio- és/vagy 1-4 szénatomos halogénalkiltio-csoporttal szubsztituált ciklopropil-, ciklopentil-, ciklohexil-, fenil- vagy benzilcsoport,
- 10 R^6 további jelentése 1-3, azonos vagy eltérő szubsztituenssel szubsztituált 1-10 szénatomos alkilcsoport, ahol a szubsztituensek 1-4 szénatomos alkoxi-, 1-4 szénatomos alkiltio-, 1-4 szénatomos halogénalkoxi- és/vagy 1-4 szénatomos halogénalkiltiocsoport lehetnek,
- 15 R^7 és R^8 jelentése, egymástól függetlenül hidrogénatom, $-SO_2R^6$, $-COR^6$, $-CO_2R^6$ általános képletű csoport; adott esetben egy vagy több, azonos vagy eltérő szubsztituenssel, éspedig fluor-, klór- és/vagy brómatommal, 1-4 szénatomos alkilkarbonil-, 1-4 szénatomos alkilkarboniloxi-, 1-4 szénatomos alkilamino-, di(1-4 szénatomos alkil)amino-, 1-4 szénatomos alkoxi-, 1-4 szénatomos halogénalkoxi-, 1-4 szénatomos alkiltio- és/vagy 1-4 szénatomos halogénalkiltio-csoporttal szubsztituált 1-16 szénatomos alkil- és/vagy 2-16 szénatomos alkenilcsoport; jelentése adott esetben 1-3,
- 20 azonos vagy eltérő szubsztituenssel, éspedig fluor-, klór- és/vagy brómatommal, ciano-, 1-4 szénatomos alkil-, 1-4 szénatomos halogénalkil-, 1-4 szénatomos alkoxi-, 1-4 szénatomos halogénalkoxi-, 1-4 szénatomos alkiltio- és/vagy 1-4 szénatomos halogénalkiltiocsoporttal szubsztituált 3-10 szénatomos cikloalkil-, (3-6 szénatomos cikloalkil)-(1-4 szénatomos alkil)-, fenil-, benzil-, feniletil-, tetrazolil-, furil-, furfuril-, benzofuril-, tetrahydrofuril-, tienil-, tenil-, benzotienil-, tiolanil-, pirrolil-, indolil-, pirrolinil-, pirrolidinil-,
- 25 30

oxazolil-, benzoxazolil-, izoxazolil-, imidazolil-, pirazolil-, tiazolil-, benzotiazolil-, tiazolidinil-, piridinil-, pirimidinil-, piridazil-, pirazinil-, piperidinil-, morfolinil-, tiomorfolinil-, triazinil-, triazolil-, kinolinil- vagy izokinolinilcsoport,

5 R^7 és R^8 további jelentése egymástól függetlenül adott esetben 1-3, azonos vagy eltérő fluor-, klór- vagy brómatommal, ciano-, 1-4 szénatomos alkil-, 1-4 szénatomos szubsztituenssel, éspedig halogénalkil-, 1-4 szénatomos alkoxi-, 1-4 szénatomos halogénalkoxi- 1-4 szénatomos alkiltio- és/vagy 1-4 szénatomos halogénalkiltiocsoporttal szubsztituált piridinilmetil-, piri-
10 diniletil-, pirimidinilmetil-, pirimidiniletil-, piridazilmetil-, piridaziletil-, pirazinilmetil- vagy piraziniletilcsoport,

R^7 és R^8 további jelentése együttesen egy adott esetben egy vagy több, azo-
nos vagy eltérő szubsztituenssel, éspedig fluor-, klór- és/vagy brómatom-
mal, 1-4 szénatomos alkoxi-, 1-4 szénatomos halogénalkoxi-, 1-4 szén-
15 atomos alkiltio- és/vagy 1-4 szénatomos halogénalkiltiocsoporttal
szubsztituált 2-10 szénatomos alkeniléncsoport; vagy adott esetben egy
vagy több, azonos vagy eltérő szubsztituenssel, éspedig fluor- és/vagy
klóratommal, ciano-, 1-4 szénatomos alkil-, 1-4 szénatomos halogénalkil-,
1-4 szénatomos alkoxi-, 1-4 szénatomos halogénalkoxi-, 1-4 szénatomos
20 alkiltio-, 1-4 szénatomos halogénalkiltiocsoporttal szubsztituált 3-10 szén-
atomos alkiléncsoport, ahol az alkilénlánc minden esetben -O-, -S- atom-
mal vagy $-NR^{15}$ - csoporttal lehet megszakítva,

R^7 és R^8 további jelentése együttesen egy 1-3, azonos vagy eltérő
szubsztituenssel szubsztituált 3-10 szénatomos alkiléncsoport, ahol a
25 szubsztituensek n-propoxi-karbonil-, izopropoxi-karbonil-, etoxi-karbonil-,
metoxi-karbonil-, oxipropilénoxi-, oxietilénoxi- és/vagy oximetilénoxics csoport
lehetnek,

R^7 és R^8 további jelentése együttesen egy 3-6 szénatomos alkiléncsoport,
ahol az alkilénlánc C=O vagy C=NO-(1-4 szénatomos alkil)-csoporttal lehet
30 megszakítva,

R^9 és R^{10} jelentése, egymástól függetlenül hidrogénatom, $-SO_2R^6$ általános
képletű csoport; adott esetben 1-9, azonos vagy eltérő szubsztituenssel,

- és pedig fluor-, klór- és/vagy brómatommal, 1-4 szénatomos alkilamino-, di(1-4 szénatomos alkil)amino-, 1-4 szénatomos alkoxi-, 1-4 szénatomos halogénalkoxi-, 1-4 szénatomos alkiltio-, 1-4 szénatomos halogénalkiltio-csoporttal szubsztituált 1-4 szénatomos alkil- és/vagy 2-6 szénatomos al-
- 5 kenilcsoport; adott esetben 1-3, azonos vagy eltérő szubsztituenssel, és pedig fluor-, klór- és/vagy brómatommal, 1-4 szénatomos alkil-, ciano-, 1-4 szénatomos halogénalkil-, 1-4 szénatomos alkoxi-, 1-4 szénatomos halogénalkoxi-, 1-4 szénatomos alkiltio-, 1-4 szénatomos halogénalkiltio-csoporttal szubsztituált 3-6 szénatomos cikloalkil-, (3-6 szénatomos ciklo-
- 10 alkil)-(1-4 szénatomos alkil)-, fenil-, benzil-, feniletil-, tetrazolil-, furil-, furfuril-, benzofuril-, tetrahidrofuril-, tienil-, tenil-, benzotienil-, tiolanil-, pirrolil-, indolil-, pirrolinil-, pirrolidinil-, oxazolil-, benzoxazolil-, izoxazolil-, imidazolil-, pirazolil-, tiazolil-, benzotiazolil-, tiazolidinil-, piridinil-, pirimidi-
- 15 nil-, piridazil-, pirazinil-, piperidinil-, morfolinil-, tiomorfolinil-, triazinil-, triazolil-, kinolinil- vagy izokinolinilcsoport,
- R^9 és R^{10} további jelentése együttesen egy az alkilénláncban 1-4, azonos vagy eltérő szubsztituenssel, és pedig fluor- és/vagy klóratommal, ciano-, 1-4 szénatomos alkil-, 1-4 szénatomos halogénalkil-, 1-4 szénatomos alkoxi-, 1-4 szénatomos halogénalkoxi-, 1-4 szénatomos alkiltio-, 1-4 szénatomos halogén-
- 20 nalkiltiocsoporttal szubsztituált 4-5 szénatomos alkiléncsoport, $-(CH_2)_2-O-(CH_2)_2-$, $-(CH_2)_2-S-(CH_2)_2-$, $-(CH_2)_2-N(R^{15})-(CH_2)_2-$ általános képletű csoport,
- R^{11} és R^{12} jelentése, egymástól függetlenül hidrogénatom, adott esetben 1-9, azonos vagy eltérő szubsztituenssel, és pedig fluor-, klór- és/vagy bróm-
- 25 atommal, 1-4 szénatomos alkoxi- vagy 1-4 szénatomos alkiltiocsoporttal szubsztituált 1-6 szénatomos alkilcsoport; adott esetben 1-4, azonos vagy eltérő szubsztituenssel, és pedig fluor-, klór- és/vagy brómatommal, 1-4 szén-
- 30 atomos alkil-, 1-4 szénatomos halogénalkil-, 1-4 szénatomos alkoxi-, 1-4 szénatomos halogénalkoxi-, 1-4 szénatomos alkiltio-, 1-4 szénatomos halogénalkiltiocsoporttal szubsztituált 3-6 szénatomos cikloalkil-, (3-6 szén-
- atomos cikloalkil)-(1-4 szénatomos alkil)-, fenil-, benzil- vagy feniletilcsoport,
- R^{11} és R^{12} további jelentése együttesen egy adott esetben 1-4, azonos vagy eltérő szubsztituenssel, és pedig fluor-, klór-, brómatommal, 1-4 szénatomos

alkil-, 1-4 szénatomos halogénalkil-, 1-4 szénatomos alkoxi-, 1-4 szénatomos halogénalkoxi-, 1-4 szénatomos alkiltio-, 1-4 szénatomos halogénalkiltiocsoporttal szubsztituált 3-8 szénatomos alkilén- vagy 3-8 szénatomos alkenilénecsopott,

- 5 R^{15} jelentése hidrogénatom, $-\text{SO}_2R^6$, $-\text{COR}^6$ vagy $-\text{CO}_2R^6$ általános képletű csoport; adott esetben egy vagy több, azonos vagy eltérő szubsztituenssel, és pedig fluor-, klór- és/vagy brómatommal, ciano-, metilamino-, etilamino-, di(1-6 szénatomos alkil)amino-, 1-4 szénatomos alkoxi-, 1-4 szénatomos halogénalkoxi-, 1-4 szénatomos alkiltio-, 1-4 szénatomos halogénalkiltiocsoporttal szubsztituált 1-16 szénatomos alkil vagy 2-16 szénatomos alkenilcsopott; adott esetben 1-3, azonos vagy eltérő fluor-, klór- vagy brómatommal, ciano-, 1-4 szénatomos alkil-, 1-4 szénatomos halogénalkil-, 1-4 szénatomos alkoxi-, 1-4 szénatomos halogénalkoxi-, 1-4 szénatomos alkiltio-, 1-4 szénatomos halogénalkiltiocsoporttal szubsztituált 3-10 szénatomos cikloalkil-, 3-6 szénatomos cikloalkil-(1-4 szénatomos alkil)-, fenil-, benzil-, feniletil-, tetrazolil-, furil-, furfuril-, benzofuril-, tetrahidrofuril-, tienil-, tenil-, benztienil-, tiolanil-, pirrolil-, indolil-, pirrolinil-, pirrolidinil-, oxazolil-, benzoxazolil-, izoxazolil-, imidazolil-, pirazolil-, tiazolil-, benzotiazolil-, tiazolidinil-, piridinil-, pirimidinil-, piridazil-, pirazinil-, piperidinil-, morfolinil-, tiomorfolinil-, triazinil-, triazolil-, kinolinil- vagy izokinolinilcsopott.

8. Az 1. igénypont szerinti olyan (I) általános képletű Δ^1 -pirrolin-származékok, amelyek képletében

- R^4 jelentése hidrogén-, fluor-, klór- vagy brómatom, ciano-, formil-, nitro-, tri(1-4 szénatomos alkil)zililcsopott; adott esetben egy vagy több, azonos vagy eltérő szubsztituenssel, és pedig fluor-, klór- és/vagy brómatommal, cianocsopottal és/vagy $-\text{NR}^7R^8$ általános képletű csopottal szubsztituált 1-16 szénatomos alkil-, 2-16 szénatomos alkenil-, 1-16 szénatomos alkoxi-, 1-16 szénatomos alkeniloxicsopott; $-\text{S}(\text{O})_pR^6$, $-\text{NR}^7R^8$, $-\text{COR}^6$, $-\text{CO}_2R^6$, $-\text{CONR}^9R^{10}$ vagy $-\text{N}(\text{R}^{11})\text{COR}^{12}$ általános képletű csopott; vagy
- 30 adott esetben 1-3, azonos vagy eltérő fluor-, klór- vagy brómatommal, cianocsopottal, 1-4 szénatomos alkil-, 1-4 szénatomos halogénalkil-, 2-6 szénatomos alkenil-, 2-6 szénatomos halogénalkenil-, 1-4 szénatomos

- alkoxi-, 1-4 szénatomos halogénalkoxi-, 1-4 szénatomos alkiltio-, 1-4 szénatomos halogénalkiltiocsoporttal szubsztituált 3-10 szénatomos cikloalkil-, (3-6 szénatomos cikloalkil)-(1-4 szénatomos alkil)-, fenil-, benzil-, feniletil-, tetrazolil-, furil-, furfuril-, benzofuril-, tetrahidrofuril-, tienil-,
- 5 tenil-, benztienil-, tiolanil-, pirrolil-, indolil-, pirrolinil-, pirrolidino-, pirrolidinil-, oxazolil-, benzoxazolil-, izoxazolil-, imidazolil-, pirazolil-, tiazolil-, benzotiazolil-, tiazolidinil-, piridinil-, pirimidinil-, piridazil-, pirazinil-, piperidinil-, piperidino-, morfolinil-, tiomorfolinil-, morfolino-, tiomorfolino-, triazinil-, triazolil-, kinolinil- vagy izokinolinilcsoport,
- 10 R^6 jelentése adott esetben egy vagy több, azonos vagy eltérő szubsztituenssel, éspedig fluor-, klór- és/vagy brómatommal és/vagy $-NR^7R^8$ általános képletű csoporttal szubsztituált 1-10 szénatomos alkilcsoport; adott esetben 1-4, azonos vagy eltérő fluor-, klór- vagy brómatommal, ciano-, 1-4 szénatomos alkil-, 1-4 szénatomos halogénalkil-, 1-4
- 15 szénatomos alkoxi-, 1-4 szénatomos halogénalkoxi-, 1-4 szénatomos alkiltio- és/vagy 1-4 szénatomos halogénalkiltio-csoporttal szubsztituált ciklopropil-, ciklopentil-, ciklohexil-, fenil- vagy benzilcsoport,
- R^7 és R^8 jelentése, egymástól függetlenül hidrogénatom, $-SO_2R^6$, $-COR^6$, $-CO_2R^6$ általános képletű csoport; adott esetben egy vagy több, azonos
- 20 vagy eltérő szubsztituenssel, éspedig fluor-, klór- és/vagy brómatommal, 1-4 szénatomos alkilkarbonil-, 1-4 szénatomos alkilkarboniloxi-, 1-4 szénatomos alkilamino-, di(1-4 szénatomos alkil)amino-, 1-4 szénatomos alkoxi-, 1-4 szénatomos halogénalkoxi-, 1-4 szénatomos alkiltio- és/vagy 1-4 szénatomos halogénalkiltio-csoporttal szubsztituált 1-16 szénatomos
- 25 alkil- vagy 2-16 szénatomos alkenilcsoport; jelentése adott esetben 1-3, azonos vagy eltérő szubsztituenssel, éspedig fluor-, klór- és/vagy brómatommal, ciano-, 1-4 szénatomos alkil-, 1-4 szénatomos halogénalkil-, 1-4 szénatomos alkoxi-, 1-4 szénatomos halogénalkoxi-, 1-4 szénatomos alkiltio- és/vagy 1-4 szénatomos halogénalkiltiocsoporttal szubsztituált 3-10
- 30 szénatomos cikloalkil-, (3-6 szénatomos cikloalkil)-(1-4 szénatomos alkil)-, fenil-, benzil-, feniletil-, tetrazolil-, furil-, furfuril-, benzofuril-, tetrahidrofuril-, tienil-, tenil-, benztienil-, tiolanil-, pirrolil-, indolil-, pirrolinil-, pirrolidinil-,

oxazolil-, benzoxazolil-, izoxazolil-, imidazolil-, pirazolil-, tiazolil-, benzotiazolil-, tiazolidinil-, piridinil-, pirimidinil-, piridazil-, pirazinil-, piperidinil-, morfolinil-, tiomorfolinil-, triazinil-, triazolil-, kinolinil- vagy izokinolinilcsoport,

- 5 R^7 és R^8 további jelentése együttesen egy adott esetben egy vagy több, azonos vagy eltérő szubsztituenssel, éspedig fluor-, klór- és/vagy brómatommal, 1-4 szénatomos alkoxi-, 1-4 szénatomos halogénalkoxi-, 1-4 szénatomos alkiltio- és/vagy 1-4 szénatomos halogénalkiltiocsoporttal szubsztituált 2-10 szénatomos alkeniléncsoport; vagy adott esetben egy
- 10 vagy több, azonos vagy eltérő fluor- vagy klóratommal, ciano-, 1-4 szénatomos alkil-, 1-4 szénatomos halogénalkil-, 1-4 szénatomos alkoxi-, 1-4 szénatomos halogénalkoxi-, 1-4 szénatomos alkiltio-, 1-4 szénatomos halogénalkiltiocsoporttal szubsztituált 3-10 szénatomos alkiléncsoport, ahol az alkilénlánc minden esetben -O-, -S- atommal vagy $-NR^{15}$ - csoporttal lehet megszakítva, és
- 15 R^1 , R^2 , R^3 , m, Q, R^5 , p, n, r, R^9 , R^{10} , R^{11} , R^{12} , R^{13} , R^{14} és R^{15} jelentése 7. igénypont szerinti.

9. Az 1. igénypont szerinti olyan (I) általános képletű Δ^1 -pirrolin-származékok, amelyek képletében

- 20 R^1 jelentése fluor- vagy klóratom,
 R^2 jelentése hidrogén- vagy fluoratom,
 R^3 jelentése fluor- vagy klóratom, metil-, etil-, n-propil-, izopropil-, n-butil-, izobutil-, *szek*-butil; *terc*-butil-, trifluormetil-, trifluoretill-, metoxi-, etoxi-, n-propoxi-, izopropoxi-, n-butoxi-, izobutoxi-, *szek*-butoxi-, *terc*-butoxi-,
- 25 trifluormetoxi-, trifluoretoxi-, metiltio-, etiltio-, n-propiltio-, izopropiltio-, n-butiltio-, izobutiltio-, *szek*-butiltio-, *terc*-butiltio-, trifluormetiltio- vagy trifluoretiltiocsoport,
- m jelentése 0 vagy 1,
Q jelentése (h), (i), (j), (k), (l) vagy (m) általános képletű csoport,
- 30 R^4 jelentése hidrogén-, fluor-, klór- vagy brómatom, ciano-, formilcsoport; adott esetben egy vagy több, azonos vagy eltérő szubsztituenssel, éspedig fluor-, klór- és/vagy brómatommal, cianocsoporttal és/vagy NR^7R^8 képletű

- csoporttal szubsztituált 1-16 szénatomos alkil-, 2-16 szénatomos alkenil-, 1-16 szénatomos alkoxi-, 2-16 szénatomos alkeniloxicsoport; $-S(O)_pR^6$, $-NR^7R^8$, $-COR^6$, $-CO_2R^6$, $-CONR^9R^{10}$, $-N(R^{11})COR^{12}$ általános képletű csoport; vagy adott esetben 1-3, azonos vagy eltérő szubsztituenssel, és pedig
- 5 fluor-, klór- és/vagy brómatommal, ciano-, metil-, etil-, n-propil-, izopropil-, $-CF_3$, $-CHF_2$, $-CClF_2$, $-CF_2CHFCl$, $-CF_2CH_2F$, $-CF_2CCl_3$, $-CH_2CF_3$, $-CF_2CHFCH_2F$, $-CH_2CF_2H$, $-CH_2CF_2CF_3$, $-CF_2CF_2H$, $-CF_2CHFCH_2F$, vinil-, allil-, 1-propenil-, butenil-, $-CF=CHF$, $-CF=CH_2$, $-CF=CCl_2$, $-CH=CF_2$, $-CF_2CF=CF_2$, $-CH=CFH$, $-CH_2CF=CF_2$, $-CF=CF_2$, $-CF_2CH=CF_2$, metoxi-,
- 10 etoxi-, n-propoxi-, izopropoxi-, n-butoxi-, izobutoxi-, *szek*-butoxi-, *terc*-butoxi-, trifluormetoxi-, difluormetoxi-, klór-difluormetoxi-, trifluoretoxi-, metiltio-, etiltio-, n-propiltio-, izopropiltio-, n-butiltio-, izobutiltio-, *szek*-butiltio-, *terc*-butiltio-, trifluormetiltio-, difluormetiltio-, klór-difluormetiltio- és/vagy trifluoretiltiocsoporttal szubsztituált ciklopropil-, ciklopentil-, ciklohexil-,
- 15 ciklopropilmetil-, ciklopentilmetil-, ciklohexilmetil-, fenil-, benzil-, feniletil-, tetrazolil-, furil-, furfuril-, benzofuril-, tetrahydrofuril-, tienil-, tenil-, benzotienil-, tiolanil-, pirrolil-, indolil-, pirrolinil-, pirrolidino-, pirrolidinil-, oxazolil-, benzoxazolil-, izoxazolil-, imidazolil-, pirazolil-, tiazolil-, benzotiazolil-, tiazolidinil-, piridinil-, pirimidinil-, piridazil-, pirazinil-,
- 20 piperidinil-, piperidino-, morfolinil-, tiomorfolinil-, morfolino-, tiomorfolino-, triazinil-, triazolil-, kinolinil- vagy izokinolinilcsoport,
- R^4 további jelentése $-CH=NOH$, formil-, ciklopropiloxi-, ciklobutiloxi-, ciklopentiloxi-, ciklohexiloxi-, ciklopropilmetoxi-, ciklobutilmetoxi-, ciklopentilmetoxi- vagy ciklohexilmetoxicsoport,
- 25 p jelentése 0, 1 vagy 2,
- R^6 jelentése metil-, etil-, n-propil-, izopropil-, n-butil-, izobutil-, *szek*-butil-, *terc*-butil-, pentil-, hexil-, $-CF_3$, $-CHF_2$, $-CCl_3$, $-CCl_2F$, dimetilaminometil-, dimetilaminoetil-, dietilaminometil-, dietilaminoetil-, ciklopropil-, ciklopentil-, ciklohexil-, fenil- vagy benzilcsoport,
- 30 R^6 további jelentése metoximetil-, trifluormetoxi-metil-, metiltio-metil- vagy trifluormetiltio-metilcsoport,
- R^7 és R^8 jelentése egymástól függetlenül hidrogénatom, $-SO_2R^6$, $-COR^6$,

- CO₂R⁶ általános képletű csoport; adott esetben egy vagy több, azonos vagy eltérő szubsztituenssel, éspedig fluor-, klór- és/vagy brómatommal, 1-4 szénatomos alkilkarbonil-, 1-4 szénatomos alkilkarboniloxi-, 1-4 szénatomos alkilamino-, di(1-4 szénatomos alkil)amino-, 1-4 szénatomos alkoxi-, 1-4 szénatomos halogénalkoxi-, 1-4 szénatomos alkiltio- és/vagy 1-4 szénatomos halogénalkiltiocsoporttal szubsztituált 1-16 szénatomos alkil- vagy 2-16- szénatomos alkenilcsoport; adott esetben 1-3, azonos vagy eltérő szubsztituenssel, éspedig fluor-, klór- és/vagy brómatommal, ciano-, 1-4 szénatomos alkil-, 1-4 szénatomos halogénalkil-, 1-4 szénatomos alkoxi-, 1-4 szénatomos halogénalkoxi-, 1-4 szénatomos alkiltio- és/vagy 1-4 szénatomos halogénalkiltiocsoporttal szubsztituált 3-8 szénatomos cikloalkil-, ciklopropilmetil-, ciklopentilmetil-, ciklohexilmetil-, ciklopropiletil-, ciklopentiletil-, ciklohexiletil-, fenil-, benzil-, feniletil-, tetrazolil-, furil-, furfuril-, benzofuril-, tetrahidrofuril-, tienil-, tenil-, benzotienil-, tiolanil-, pirrolil-, indolil-, pirrolinil-, pirrolidinil-, oxazolil-, benzoxazolil-, izoxazolil-, imidazolil-, pirazolil-, tiazolil-, benzotiazolil-, tiazolidinil-, piridinil-, pirimidinil-, piridazil-, pirazinil-, piperidinil-, morfolinil-, tiomorfolinil-, triazinil-, triazolil-, kinolinil- vagy izokinolinilcsoport,
- R⁷ és R⁸ további jelentése, egymástól függetlenül, adott esetben 1-3, egy vagy több azonos vagy eltérő szubsztituenssel, éspedig fluor-, klór- és/vagy brómatommal, ciano-, 1-4 szénatomos alkil-, 1-4 szénatomos halogénalkil-, 1-4 szénatomos alkoxi-, 1-4 szénatomos halogénalkoxi-, 1-4 szénatomos alkiltio- és/vagy 1-4 szénatomos halogénalkiltiocsoporttal szubsztituált piridinilmetil-, pirimidinilmetil-, piridazilmetil- vagy pirazinilmetilcsoport,
- R⁷ és R⁸ további jelentése, együtt adott esetben egy vagy több, azonos vagy eltérő szubsztituenssel, éspedig fluor-, klór- és/vagy brómatommal, 1-4 szénatomos alkoxi-, 1-4 szénatomos halogénalkoxi-, 1-4 szénatomos alkiltio- és/vagy 1-4 szénatomos halogénalkiltiocsoporttal szubsztituált 2-8 szénatomos alkenilén- vagy adott esetben az alkilénláncon egy vagy több, azonos vagy eltérő szubsztituenssel, éspedig fluor- és/vagy klóratommal, ciano-, metil-, etil-, n-propil-, izopropil-, n-butil-, izobutil-, szek-butil-, terc-butil-, 1-4 szénatomos halogénalkil-, metoxi-, etoxi-, n-propoxi-, izoprop-

5 oxi-, n-butoxi-, izobutoxi-, szek-butoxi-, *terc*-butoxi-, 1-4 szénatomos halogénalkoxi-, metiltio-, etiltio-, n-propiltio-, izopropiltio-, n-butiltio-, izobutiltio-, szek-butiltio-, *terc*-butiltio-, 1-4 szénatomos halogénalkiltio-csoporttal szubsztituált 3-8 szénatomos alkiléncsoport, ahol az alkilénlánc minden esetben -O-, -S- atommal vagy -NR¹⁵- csoporttal lehet megszakítva,

10 R⁷ és R⁸ további jelentése, együttesen egy, egy vagy két, azonos vagy eltérő szubsztituenssel szubsztituált 3-9 szénatomos alkiléncsoport, ahol a szubsztituensek etoxi-karbonil-, metoxi-karbonil- és/vagy oxietilénoxi-csoport lehet,

R⁷ és R⁸ további jelentése, együttesen -CH₂-CH₂-C(=O)-CH₂-CH₂-,
-CH₂-CH₂-C(=NO-Me)-CH₂-CH₂-,
-CH₂-CH₂-C(=NO-Et)-CH₂-CH₂- vagy
-CH₂-CH₂-C(=NO-iPr)-CH₂-CH₂- képletű csoport,

15 R⁹ és R¹⁰ jelentése, egymástól függetlenül hidrogénatom, -SO₂CF₃, metil-, etil-, n-propil-, izopropil-, n-butil-, izobutil-, szek-butil-, *terc*-butil-, pentil-, hexil-, -CF₃, -CH₂CF₃, -(CF₂)₃CF₃, ciklopropil-, ciklopentil-, ciklohexil-, metoxi-metil-, metoxi-etil-csoport, vagy adott esetben fluor-, klór- vagy brómatommal, metil-, trifluormetil-, metoxi-, trifluormetoxicsoporttal
20 szubsztituált fenil- vagy benzilcsoport,

R⁹ és R¹⁰ további jelentése, együttesen egy -(CH₂)₄-, -(CH₂)₅-, -(CH₂)₆-, -CH₂-CH(CH₃)-CH₂-CH(CH₃)-CH₂-, -(CH₂)₂-O-(CH₂)₂-, -(CH₂)₂-S-(CH₂)₂- képletű csoport vagy -(CH₂)₂-N(R¹⁵)-(CH₂)₂- általános képletű csoport,

25 R¹¹ és R¹² jelentése, egymástól függetlenül metil-, etil-, n-propil-, izopropil-, n-butil-, izobutil-, szek-butil-, *terc*-butil-, n-hexil-, trifluormetil-, trifluoretill-, ciklopropil-, ciklopentil-, ciklohexilcsoport vagy adott esetben fluor-, klór- vagy brómatommal, metil-, trifluormetil-, metoxi-, trifluormetoxicsoporttal szubsztituált fenil- vagy benzilcsoport,

30 R¹¹ és R¹² további jelentése, együttesen egy adott esetben fluor-, klór- vagy brómatommal, metil-, etil-, metoxi-, etoxi-, metiltio-, etiltio-, trifluormetil-, trifluormetoxi-, trifluormetiltiocsoporttal szubsztituált -(CH₂)₃-, -(CH₂)₄-, -(CH₂)₅- vagy -(CH₂)₆- képletű csoport,

R^{15} jelentése hidrogénatom, $-SO_2R^6$, $-COR^6$ vagy $-CO_2R^6$ általános képletű csoport; adott esetben egy vagy több, azonos vagy eltérő fluor-, klór- vagy brómatommal, ciano-, metilamino-, etilamino-, di(1-6 szénatomos alkil)-amino-, 1-4 szénatomos alkoxi-, 1-4 szénatomos halogénalkoxi-, 1-4 szénatomos alkiltio-, 1-4 szénatomos halogénalkiltiocsoporttal szubsztituált 1-16 szénatomos alkil-, 2-16 szénatomos alkenilcsoport; adott esetben 1-3, azonos vagy eltérő szubsztituenssel, éspedig fluor-, klór- és/vagy brómatommal, ciano-, metil-, etil-, n-propil-, izopropil-, n-butil-, izobutil-, *szek*-butil-, *terc*-butil-, 1-4 szénatomos halogénalkil-, metoxi-, etoxi-, n-propoxi-, izopropoxi-, n-butoxi-, izobutoxi-, *szek*-butoxi-, *terc*-butoxi-, 1-4 szénatomos halogénalkoxi-, metiltio-, etiltio-, n-propiltio-, izopropiltio-, n-butiltio-, izobutiltio-, *szek*-butiltio-, *terc*-butiltio-, 1-4 szénatomos halogénalkiltiocsoporttal szubsztituált 3-8 szénatomos cikloalkil-, ciklopropilmetil-, ciklopentilmetil-, ciklohexilmetil-, ciklopropiletil-, ciklopentiletil-, ciklohexil-etil-, fenil-, benzil-, feniletil-, tetrazolil-, furil-, furfuril-, benzofuril-, tetrahidrofuril-, tienil-, tenil-, benzotienil-, tiolanil-, pirrolil-, indolil-, pirrolinil-, pirrolidinil-, oxazolil-, benzoxazolil-, izoxazolil-, imidazolil-, pirazolil-, tiazolil-, benzotiazolil-, tiazolidinil-, piridinil-, pirimidinil-, piridazil-, pirazinil-, piperidinil-, morfolinil-, tiomorfolinil-, triazinil-, triazolil-, kinolinil- vagy izokinolinilcsoport.

10. Az 1. igénypont szerinti olyan (I) általános képletű Δ^1 -pirrolin-származékok, amelyek képletében

R^4 jelentése hidrogén-, fluor-, klór- vagy brómatom, ciano-, formilcsoport; adott esetben egy vagy több, azonos vagy eltérő szubsztituenssel, éspedig fluor-, klór- és/vagy brómatommal, cianocsoporttal és/vagy NR^7R^8 képletű csoporttal szubsztituált 1-16 szénatomos alkil-, 2-16 szénatomos alkenil-, 1-16 szénatomos alkoxi-, 2-16 szénatomos alkeniloxics csoport; $-S(O)_pR^6$, $-NR^7R^8$, $-COR^6$, $-CO_2R^6$, $-CONR^9R^{10}$, $-N(R^{11})COR^{12}$ általános képletű csoport; vagy adott esetben 1-3, azonos vagy eltérő szubsztituenssel, éspedig fluor-, klór- és/vagy brómatommal, ciano-, metil-, etil-, n-propil-, izopropil-, $-CF_3$, $-CHF_2$, $-CClF_2$, $-CF_2CHFCl$, $-CF_2CH_2F$, $-CF_2CCl_3$, $-CH_2CF_3$, $-CF_2CHFCH_2F$, $-CH_2CF_2H$, $-CH_2CF_2CF_3$, $-CF_2CF_2H$, $-CF_2CHFCH_2F$, vinil-, allil-, 1-propenil-, butenil-, $-CF=CHF$, $-CF=CH_2$, $-CF=CCl_2$, $-CH=CF_2$,

-CF₂CF=CF₂, -CH=CFH, -CH₂CF=CF₂, -CF=CF₂, -CF₂CH=CF₂, metoxi-, etoxi-, n-propoxi-, izopropoxi-, n-butoxi-, izobutoxi-, *szek*-butoxi-, *terc*-butoxi-, trifluormetoxi-, difluormetoxi-, klór-difluormetoxi-, trifluoretoxi-, metiltio-, etiltio-, n-propiltio-, izopropiltio-, n-butiltio-, izobutiltio-, *szek*-butiltio-, *terc*-butiltio-, trifluormetiltio-, difluormetiltio-, klór-difluormetiltio- és/vagy trifluoretiltiocsoporttal szubsztituált ciklopropil-, ciklopentil-, ciklohexil-, ciklopropilmetil-, ciklopentilmetil-, ciklohexilmetil-, fenil-, benzil-, feniletil-, tetrazolil-, furil-, furfuril-, benzofuril-, tetrahidrofuril-, tienil-, tenil-, benzotienil-, tiolanil-, pirrolil-, indolil-, pirrolinil-, pirrolidino-, pirrolidinil-, oxazolil-, benzoxazolil-, izoxazolil-, imidazolil-, pirazolil-, tiazolil-, benzotiazolil-, tiazolidinil-, piridinil-, pirimidinil-, piridazil-, pirazinil-, piperidinil-, piperidino-, morfolinil-, tiomorfolinil-, morfolino-, tiomorfolino-, triazinil-, triazolil-, kinolinil- vagy izokinolinilcsoport,

R⁶ jelentése metil-, etil-, n-propil-, izopropil-, n-butil-, izobutil-, *szek*-butil-, *terc*-butil-, pentil-, hexil-, -CF₃, -CHF₂, -CCl₃, -CCl₂F, dimetilaminometil-, dimetilaminoetil-, dietilaminometil-, dietilaminoetil-, ciklopropil-, ciklopentil-, ciklohexil-, fenil- vagy benzilcsoport,

R⁷ és R⁸ jelentése egymástól függetlenül hidrogénatom, -SO₂R⁶, -COR⁶, -CO₂R⁶ általános képletű csoport; adott esetben egy vagy több, azonos vagy eltérő szubsztituenssel, éspedig fluor-, klór- és/vagy brómatommal, 1-4 szénatomos alkilkarbonil-, 1-4 szénatomos alkilkarboniloxi-, 1-4 szénatomos alkilamino-, di(1-4 szénatomos alkil)amino-, 1-4 szénatomos alkoxi-, 1-4 szénatomos halogénalkoxi-, 1-4 szénatomos alkiltio- és/vagy 1-4 szénatomos halogénalkiltiocsoporttal szubsztituált 1-16 szénatomos alkil- vagy 2-16- szénatomos alkenilcsoport; adott esetben 1-3, azonos vagy eltérő szubsztituenssel, éspedig fluor-, klór- és/vagy brómatommal, ciano-, 1-4 szénatomos alkil-, 1-4 szénatomos halogénalkil-, 1-4 szénatomos alkoxi-, 1-4 szénatomos halogénalkoxi-, 1-4 szénatomos alkiltio- és/vagy 1-4 szénatomos halogénalkiltiocsoporttal szubsztituált 3-8 szénatomos cikloalkil-, ciklopropilmetil-, ciklopentilmetil-, ciklohexilmetil-, ciklopropiletil-, ciklopentiletil-, ciklohexiletil-, fenil-, benzil-, feniletil-, tetrazolil-, furil-, furfuril-, benzofuril-, tetrahidrofuril-, tienil-, tenil-, benzotienil-, tiolanil-,

pirrolil-, indolil-, pirrolinil-, pirrolidinil-, oxazolil-, benzoxazolil-, izoxazolil-, imidazolil-, pirazolil-, tiazolil-, benzotiazolil-, tiazolidinil-, piridinil-, pirimidinil-, piridazil-, pirazinil-, piperidinil-, morfolinil-, tiomorfolinil-, triazinil-, triazolil-, kinolinil- vagy izokinolinilcsoport,

- 5 R^7 és R^8 további jelentése, együtt adott esetben egy vagy több, azonos vagy eltérő szubsztituenssel, éspedig fluor-, klór- és/vagy brómatommal, 1-4 szénatomos alkoxi-, 1-4 szénatomos halogénalkoxi-, 1-4 szénatomos alkiltio- és/vagy 1-4 szénatomos halogénalkiltiocsoporttal szubsztituált 2-8 szénatomos alkenilénecsopott, vagy pedig adott esetben az alkilénláncon
- 10 egy vagy több, azonos vagy eltérő szubsztituenssel, éspedig fluor- és/vagy klóratommal, ciano-, metil-, etil-, n-propil-, izopropil-, n-butil-, izobutil-, szek-butil-, *terc*-butil-, 1-4 szénatomos halogénalkil-, metoxi-, etoxi-, n-propoxi-, izopropoxi-, n-butoxi-, izobutoxi-, szek-butoxi-, *terc*-butoxi-, 1-4 szénatomos halogénalkoxi-, metiltio-, etiltio-, n-propiltio-,
- 15 izopropiltio-, n-butiltio-, izobutiltio-, szek-butiltio-, *terc*-butiltio-, 1-4 szénatomos halogénalkiltiocsoporttal szubsztituált 3-8 szénatomos alkilénecsopott, ahol az alkilénlánc minden esetben -O-, -S- atommal vagy $-NR^{15}$ -csoporttal lehet megszakítva,

- 20 R^1 , R^2 , R^3 , m, Q, R^5 , p, n, r, R^9 , R^{10} , R^{11} , R^{12} és R^{15} jelentése a 9. igénypont szerinti.

11. Az 1-10. igénypontok bármelyike szerinti olyan (I) általános képletű Δ^1 -pirrolinszármazékok, amelyek képletében R^1 és R^2 jelentése fluoratom.

12. Az 1-11. igénypontok bármelyike szerinti olyan (I) általános képletű Δ^1 -pirrolinszármazékok, amelyek képletében Q jelentése (a) általános képletű
- 25 csoport.

13. Az 1-11. igénypontok bármelyike szerinti olyan (I) általános képletű Δ^1 -pirrolinszármazékok, amelyek képletében Q jelentése (d) általános képletű csoport.

14. Az 1-11. igénypontok bármelyike szerinti olyan (I) általános képletű
- 30 Δ^1 -pirrolinszármazékok, amelyek képletében Q jelentése (b) általános képletű csoport.

15. Az 1-11. igénypontok bármelyike szerinti olyan (I) általános képletű

Δ^1 -pirrolinszármazékok, amelyek képletében Q jelentése (e) általános képletű csoport.

16. Az 1-11. igénypontok bármelyike szerinti olyan (I) általános képletű Δ^1 -pirrolinszármazékok, amelyek képletében Q jelentése (c) általános képletű csoport.

17. Az 1-11. igénypontok bármelyike szerinti olyan (I) általános képletű Δ^1 -pirrolinszármazékok, amelyek képletében Q jelentése (f) általános képletű csoport.

18. Az 1. igénypont szerinti (I) általános képletű Δ^1 -pirrolinszármazékok oltalmi körébe tartozó olyan (I-a)-(I-f) általános képletű vegyületek, ahol a képletekben

R^1 jelentése fluor- vagy klóratom;

R^2 jelentése hidrogén- vagy fluoratom és

R^4 jelentése az 1-10. igénypontok bármelyike szerinti.

19. Az 1. igénypont szerinti (I) általános képletű Δ^1 -pirrolinszármazékok oltalmi körébe tartozó olyan (I-g)-(I-l) általános képletű, *R*-konfigurációjú vegyületek, ahol a képletekben

R^1 jelentése fluor- vagy klóratom;

R^2 jelentése hidrogén- vagy fluoratom és

R^4 jelentése az 1-10. igénypontok bármelyike szerinti.

20. Eljárás az 1. igénypont szerinti (I) általános képletű Δ^1 -pirrolinszármazékok előállítására, azzal jellemezve, hogy:

A) egy (II) általános képletű Δ^1 -pirrolinszármazékot – amelynek képletében R^1 , R^2 , R^3 és m jelentése az 1. igénypont szerinti, és Z jelentése klór-, bróm- vagy jódatom, $-\text{OSO}_2\text{CF}_3$ vagy $-\text{OSO}_2(\text{CF}_2)_3\text{CF}_3$ csoport – egy (III) általános képletű heterociklusos vegyülettel – amelynek képletében Q jelentése az 1. igénypont szerinti, és X jelentése klór-, bróm- vagy jódatom, $-\text{OSO}_2\text{CF}_3$ vagy $-\text{OSO}_2(\text{CF}_2)_3\text{CF}_3$ csoport – valamilyen katalizátor, dibórsav-észter, kívánt esetben valamilyen savmegkötő és kívánt esetben egy hígítószer jelenlétében reagáltatunk; vagy

B) egy (IV) általános képletű Δ^1 -pirrolinszármazékot – amelynek képletében R^1 , R^2 , R^3 és m jelentése az 1. igénypont szerinti, és A jelentése $-\text{B}(\text{OH})_2$,

(4,4,5,5-tetrametil-1,3,2-dioxaborolán)-2-il-, (5,5-dimetil-1,3,2-dioxaborinán)-2-il-, (4,4,6-trimetil-1,3,2-dioxaborinán)-2-il- vagy 1,3,2-benzodioxaborol-2-il-csoport – egy (III) általános képletű heterociklusos vegyülettel - amelynek képletében Q és X jelentése az 1. igénypont szerinti – valami-
 5 lyen katalizátor, kívánt esetben valamilyen savmegkötő és kívánt esetben egy hígítószer jelenlétében reagáltatunk; vagy

C) egy (II) általános képletű Δ^1 -pirrolinszármazékot – amelynek képletében R^1 , R^2 , R^3 , m és Z jelentése az 1. igénypont szerinti – egy (V) általános képletű bórsavszármazékkal - amelynek képletében Q és A jelentése az 1.
 10 igénypont szerinti – valamilyen katalizátor, kívánt esetben valamilyen savmegkötő és kívánt esetben egy hígítószer jelenlétében reagáltatunk; vagy

D) egy (II-a) általános képletű Δ^1 -pirrolinszármazékot – amelynek képletében R^1 , R^2 , R^3 és m jelentése az 1. igénypont szerinti, és Z jelentése bróm- vagy jódatom – egy (VI) általános képletű fémorganikus vegyülettel -
 15 amelynek képletében Q jelentése az 1. igénypont szerinti, és M jelentése $ZnCl$, $Sn(Me)_3$ vagy $Sn(n-Bu)_3$ képletű csoport – valamilyen katalizátor, kívánt esetben valamilyen savmegkötő és kívánt esetben egy hígítószer jelenlétében reagáltatunk.

21. (II) általános képletű Δ^1 -pirrolinszármazékok, amelyek képletében
 20 R^1 , R^2 , R^3 és m jelentése az 1. igénypont szerinti; és Z jelentése klór-, bróm- vagy jódatom, $-OSO_2CF_3$ vagy $-OSO_2(CF_2)_3CF_3$ képletű csoport.

22. (IV) általános képletű Δ^1 -pirrolinszármazékok, amelyek képletében R^1 , R^2 , R^3 és m jelentése az 1. igénypont szerinti; és A jelentése $-B(OH)_2$,
 25 il-, (4,4,5,5-tetrametil-1,3,2-dioxaborolán)-2-il-, (5,5-dimetil-1,3,2-dioxaborinán)-2-il-, (4,4,6-trimetil-1,3,2-dioxaborinán)-2-il- vagy 1,3,2-benzodioxaborol-2-il-csoport.

23. Kártevőirtószer, amely legalább egy, 1. igénypont szerinti (I) általános képletű vegyületet tartalmaz hordozó- és/vagy felületaktív-anyagok mellett.

30 24. Az 1. igénypont szerinti (I) általános képletű vegyületek alkalmazása kártevők irtására.

25. Eljárás kártevők leküzdésére, azzal jellemezve, hogy valamely 1.

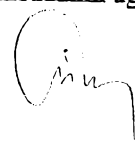
igénypont szerinti (I) általános képletű vegyületeket a kártevőkre és/vagy élet-
terükre juttatjuk ki.

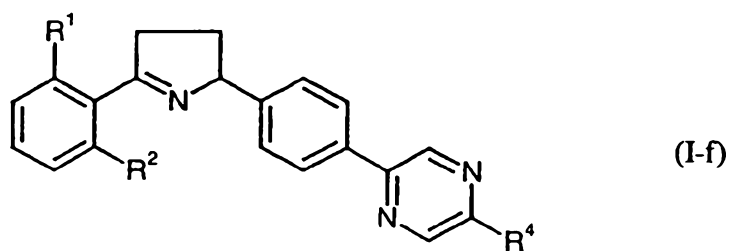
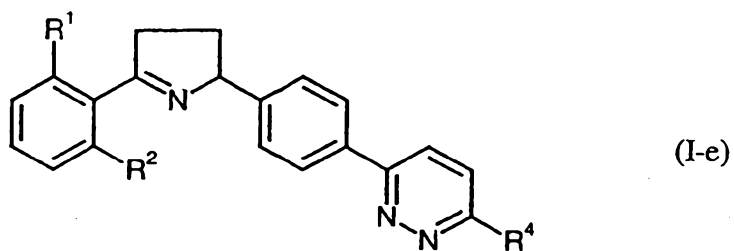
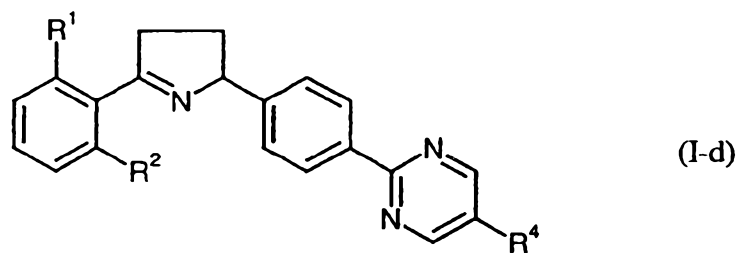
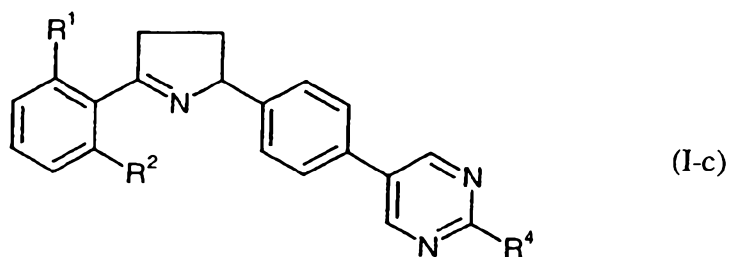
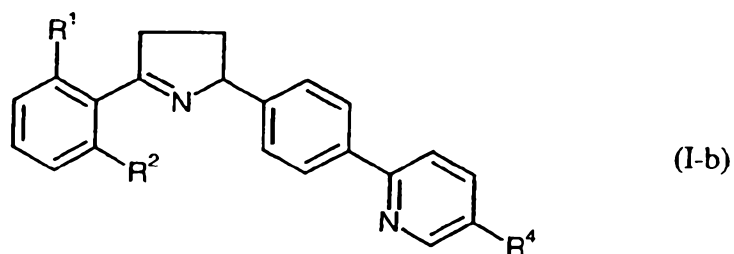
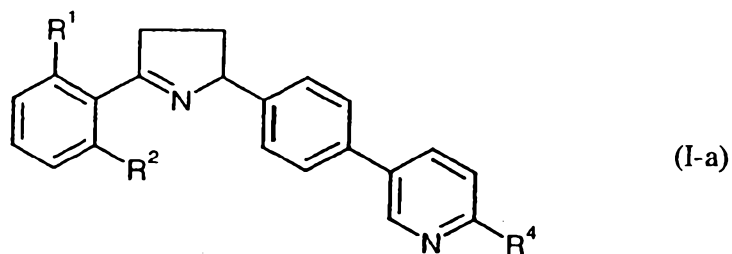
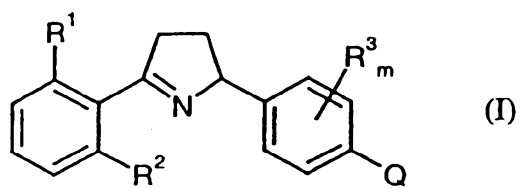
26. Eljárás kártevőirtószerek előállítására, azzal jellemezve, hogy egy
vagy több az 1. igénypont szerinti (I) általános képletű vegyületet hordozó-
5 anyagokkal és/vagy felületaktív-anyagokkal összekeverünk.

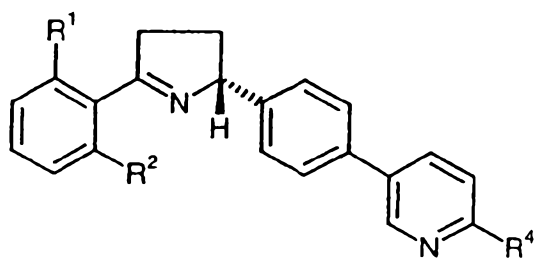
A meghatalmazott:

DANUBIA
Szabadalmi és Védjegy Iroda Kft.
Dr. Gárdonyi Zoltánné
szabadalmi ügyvivő

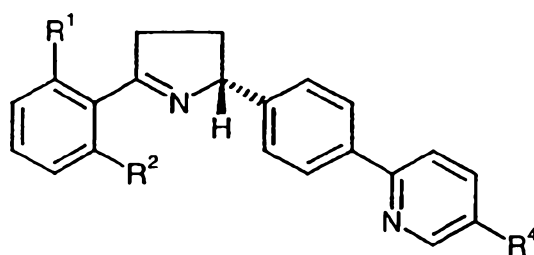
+ 61042



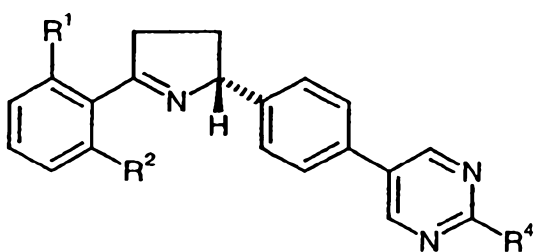




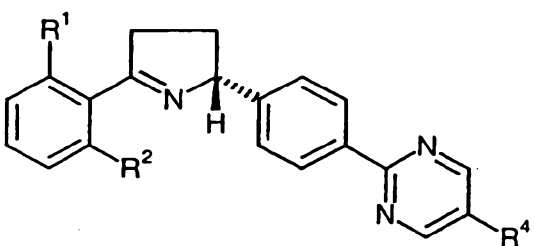
(I-g)



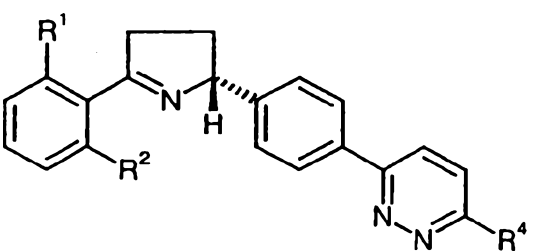
(I-h)



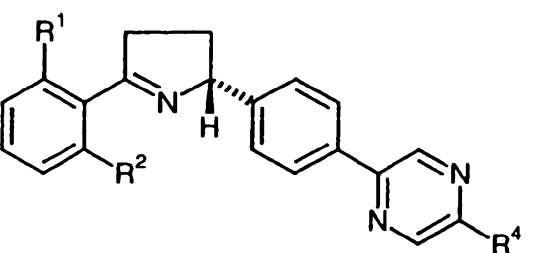
(I-i)



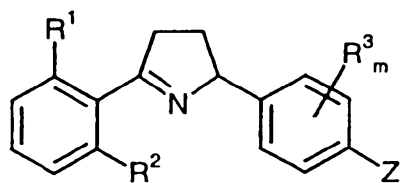
(I-j)



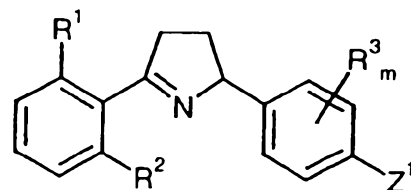
(I-k)



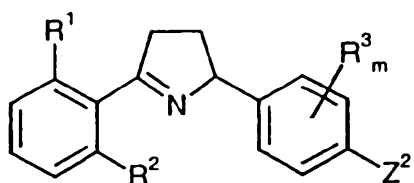
(I-l)



(II)



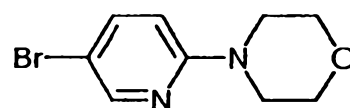
(II-a)



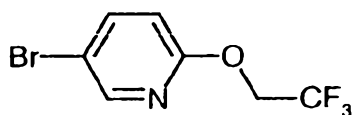
(II-b)

Q-X

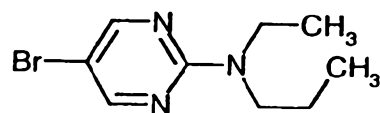
(III)



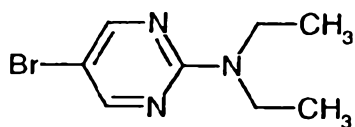
(III-1)



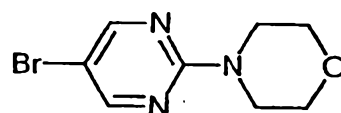
(III-2)



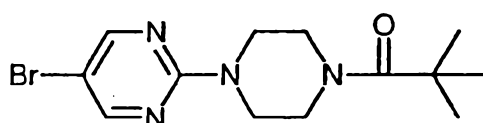
(III-3)



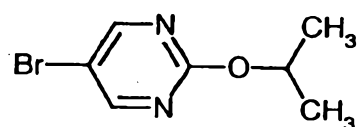
(III-4)



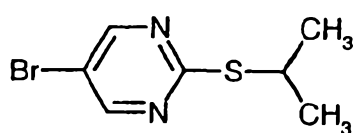
(III-5)



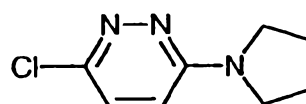
(III-6)



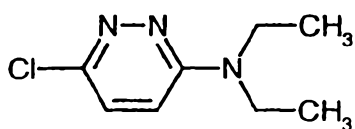
(III-7)



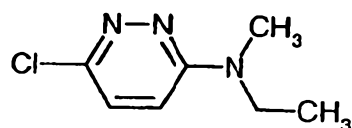
(III-8)



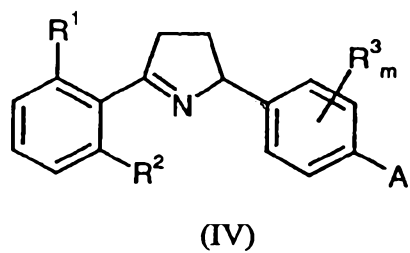
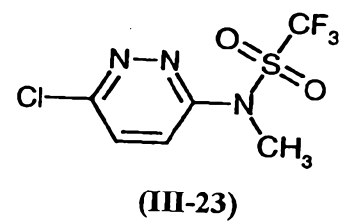
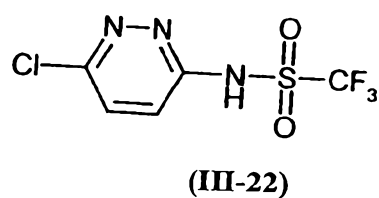
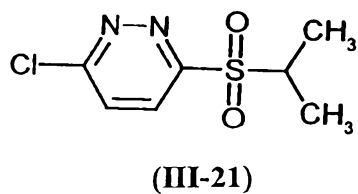
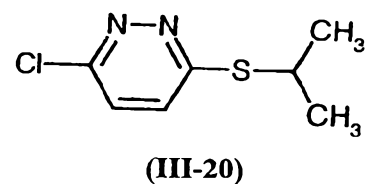
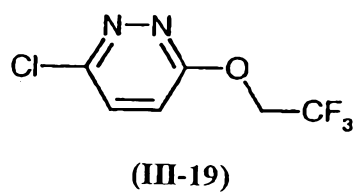
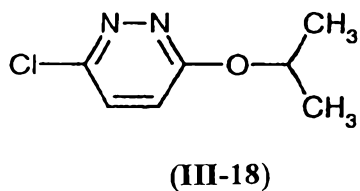
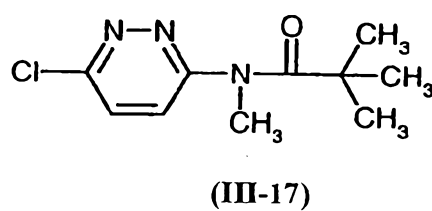
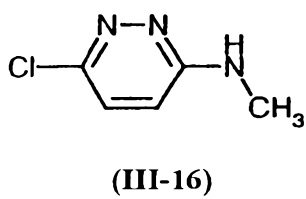
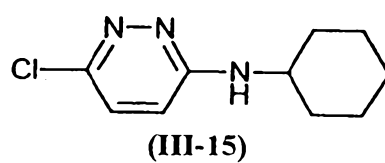
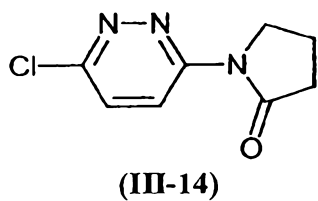
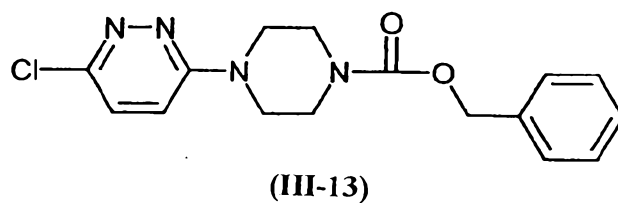
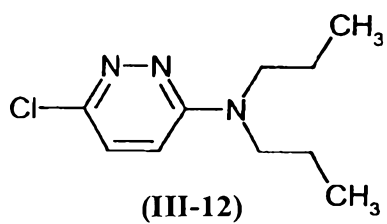
(III-9)



(III-10)

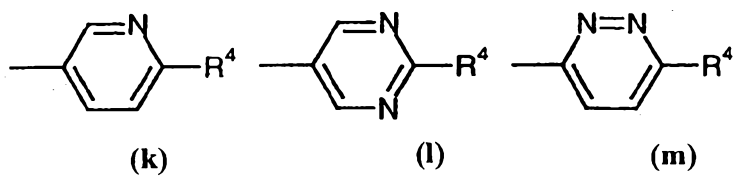
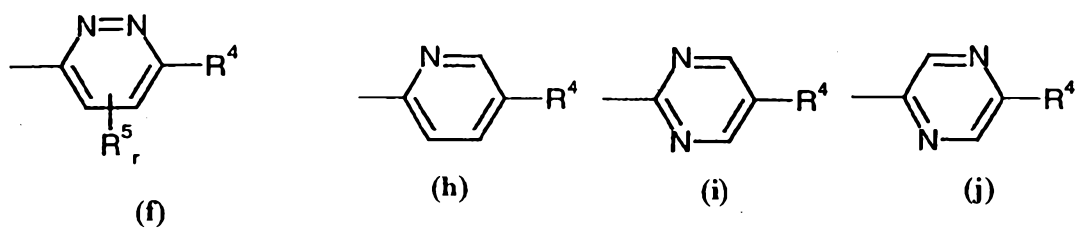
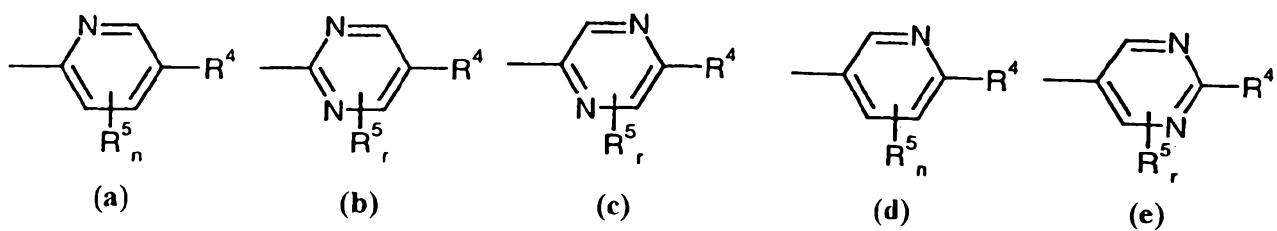
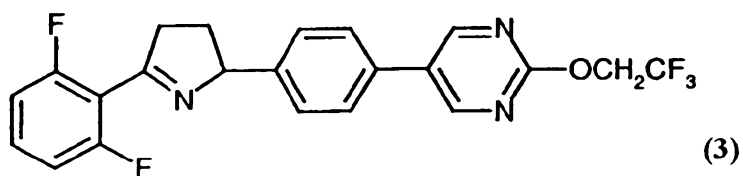
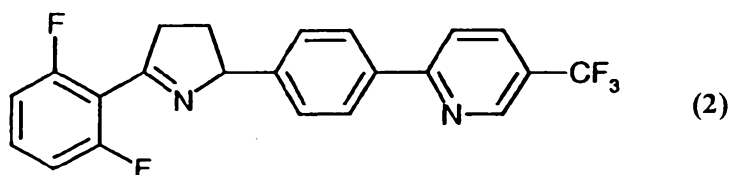
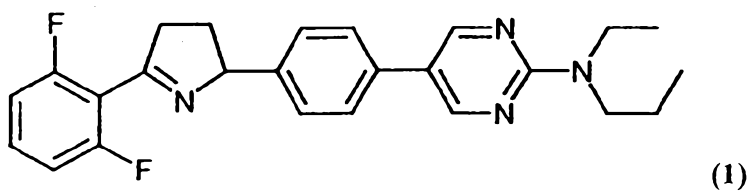


(III-11)

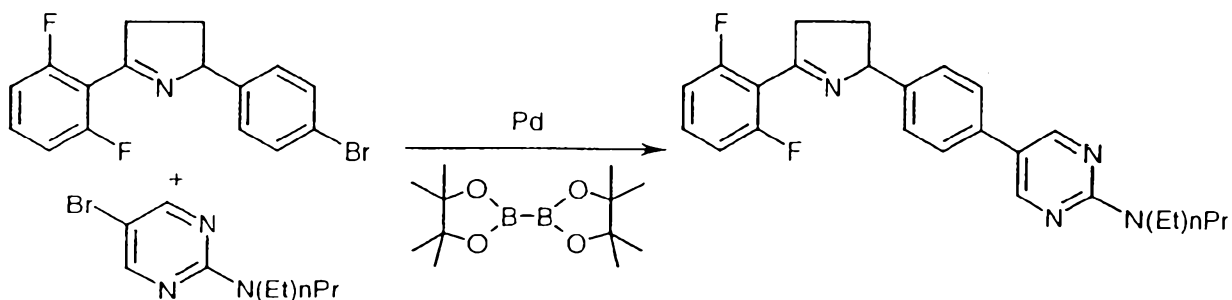


Q-A
(V)

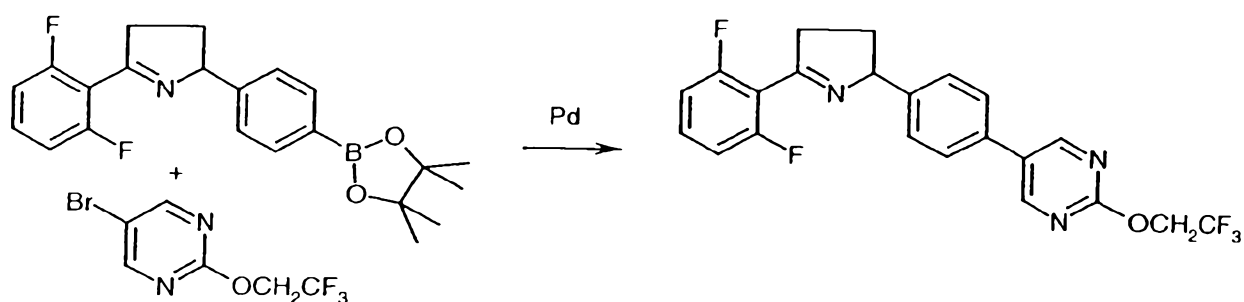
Q-M
(VI)



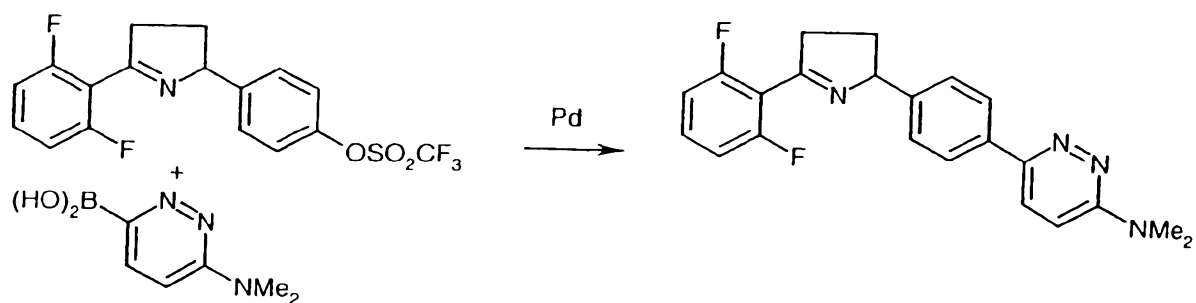
A) reakcióvázlat



B) reakcióvázlat



C) reakcióvázlat



D) reakcióvázlat

