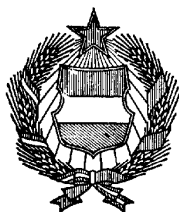


(19) HU
MAGYAR
NÉPKÖZTÁRSASÁG



ORSZÁGOS
TALÁLmányi
HIVATAL

SZABADALMI LEÍRÁS

(11)
182463

A bejelentés napja: (22) 1979. II. 28. (21) BO—1767

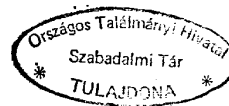
A bejelentés elsőbbsége: (33) GB: (32) 1978. III. 01.
(31) (8002/78, 8003/78)

A közzététel napja: (42) 1983. IV. 28.

Megjelent: (45) 1986. július 30.

Nemzetközi
osztályjelzet:

(51) NSzO₃
A 01 N 33/26
C 07 C 109/16



(72) Feltaláló(k):

Copping Leonard George, vegyész, Kerry John Cecil, vegyész, Watkins Thomas Iswel, vegyész, Willis Robert John, vegyész, Palmer Bryan Harpet, vegyész, Nottingham, GB

(73) Szabadalmaz:

The Boots Company Ltd., Nottingham, GB

(54) Benzofenon-hidrazon-származékokat tartalmazó rovarirtószeres és eljárás benzofenon-hidrazon-származékok előállítására

1

2

(57) K I V O N A T

A találmány hatékonyként 0,001—95 s% (I) általános képletű szubsztituált benzofenon-hidrazon-származékot szilárd vagy folyékony hordozó-, illetve hígítószerrel és felületaktív adalékkal együtt tartalmazó rovarirtószerre, valamint az (I) általános képletű szubsztituált benzofenon-hidrazon-származékok előállítására szolgáló eljárásra vonatkozik. Az (I) általános képletben m értéke 0 és n értéke 0, vagy m értéke 1 és n értéke 0 vagy 1; p értéke 0, 2 vagy 3, x értéke 0 vagy 1;

R¹ jelentése hidrogénatom, trifluor-metil-, alkil-, alkoxi- vagy alkil-tio-csoport;

R² jelentése hidrogénatom, alkil-, alkoxi-karbonil- vagy cikloalkil-metil-karbonil-csoport;

R³ jelentése alkenilcsoport, adott esetben szubsztituált alkilcsoport, dialkil-amino-csoport, adott esetben szubsztituált fenil-csoport;

R⁴ jelentése hidrogénatom, alkil-, karboxi-fenil-, 2-imidazolil-, alkil-tio-karbonil-csoport, —C—OR⁵ általános képletű észter-

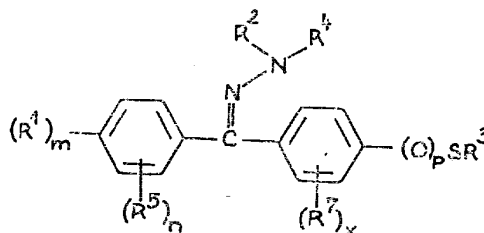
csoport, —C—R⁶ általános képletű acil-

csoport, —C—NR¹⁰R¹¹ általános képletű

||
O
karbamoilescsoport vagy —C—NR¹⁰R¹² ál-
||
S

talános képletű tiokarbamoiel-csoport;
R² és R⁴ együtt adott esetben oxigénatommal meg-

szakított alkilén-csoport;
R⁵ és R⁷ halogénatom vagy alkilcsoport;
R¹ és R⁵ együtt naftilcsoport;
és ha p értéke 0, R² vagy R⁴ hidrogénatom.



182463

1

A találmány szubsztituált benzotienon-hidrazon-származékokat hatóanyagként tartalmazó rovarirtó szerekre, valamint a benzotienon-hidrazon-származékok előállítására vonatkozik.

A kereskedelmi forgalomban lévő rovarirtó szerek hatóanyagai lényegében négy fő csoportba tartoznak, azaz klórozott vegyületek — például a DDT, kamfeklór és benzol-hexaklorid — szerves foszforvegyületek — például a paration — karbamátok — például a karbaril —, valamint az utóbbi időben kifejlesztett piretroidok — ilyen a permetrin — lehetnek.

Bizonyos alkalmazási idő után a rovarölő szerekkel szemben gyakran alakul ki rezisztencia, ezért állandóan szükség van új rovarölő szerek forgalomba hozatalára, különösen új típusú hatóanyagok kidolgozására.

A szakirodalomban számos utalás látott napvilágot arra vonatkozóan, hogy bizonyos vegyületcsoportoknak kártevőirtó hatásuk van, azaz kártevőirtó szerek hatóanyagaként alkalmazhatók, de későbbiek során kitént, hogy a vegyületek alkalmazása gazdaságosan nem valósítható meg.

Megállapítottuk, hogy bizonyos benzotienon-hidrazon-származékok hatékonyan alkalmazhatók rovarölő szerek hatóanyagaként és számos kártékony rovar ellen hatásosak.

A 3 732 307 számú amerikai egyesült államokbeli szabadalmi leírás [a] általános képletű benzotienon-hidrazonokat ismerteti, és ebben a képletben

X legfeljebb 4 szénatomos perfluor-alkil-, perfluor-alkoxi- vagy perfluor-alkil-tio-csoportot és

Y hidrogén-, klór-, bróm- vagy fluoratomot vagy legfeljebb 4 szénatomos alkil-, alkoxi-, alkil-tio-, perfluor-alkil-, perfluor-alkoxi- vagy perfluor-alkil-tio-csoportot jelent.

A leírásban ismertetett vegyületek J. R. Do Amaral és munkatársai, J. Med. Chem. 12, 21 (1969) közleményében leírt benzotienon-hidrazonoktól többek között abban különböznek, hogy a hidrazin-csoport aminocsoportja nem szubsztituált. A 3 732 307 számú amerikai egyesült államokbeli szabadalmi leírás szerint a vegyületek növényi növekedést szabályozó hatásúak, habár megemlítik, hogy rovarok ellen is hatékonyak. A leírásban ismertetett 24 példa közül 20 olyan vegyületet ír le, amelyek sem alkil-tio-, sem perfluor-alkil-tio-csoportot nem tartalmaznak. A leírás elsősorban azokat a vegyületeket emeli ki, amelyek perfluor-alkil-csoporttal, különösen trifluor-metil-csoporttal szubsztituáltak, és arra nem található utalás, hogy olyan vegyületek, amelyek bármelyik benzolgyűrű 4-helyzetében alkil-tio- vagy perfluor-alkil-tio-csoporttal szubsztituáltak, különösen hasznosak lennének, és azt sem említik, hogy 4-helyzetben szubsztituált, továbbá egyéb szubsztituenseket tartalmazó vegyületek különösen hatásosak lennének.

Találmányunk olyan (I) általános képletű szubsztituált benzotienon-hidrazonokat tartalmazó rovarölő szerekre, valamint (I) általános képletű benzotienon-hidrazon-származékok előállítására vonatkozik, amelyek képletében m értéke 0 és n értéke 0 vagy 1 és n értéke 0 vagy 1; p értéke 0, 2 vagy 3, x értéke 0 vagy 1;

R¹ jelentése halogénatom, trifluor-metilesoport, 1—4 szénatomos alkil-, 1—4 szénatomos alkoxi- vagy 1—4 szénatomos alkil-tio-csoport;

R² jelentése hidrogénatom, 1—4 szénatomos alkil-csoport, (1—4 szénatomos alkoxi)-karbonil-csoport vagy (3—6 szénatomos cikloalkil)-metil-karbonil-csoport;

R³ jelentése 2—3 szénatomos alkenilesoport — adott esetben halogénatommal szubsztituált — 1—4 szénatomos alkil-csoport, N,N-di(1—2 szénatomos alkil)-amino-csoport vagy — adott esetben egy halogénatommal vagy egy metil-csoporttal szubsztituált — fenilesoport;

R⁴ jelentése hidrogénatom, 1—4 szénatomos alkil-csoport, karboxi-fenil-csoport, 2-imidazolil-csoport — hidrogén-bromiddal alkotott sója alakjában — (1—4 szénatomos alkil)-tio-karbonil-csoport, —C—OR⁸ általános képletű észter-

es csoport, —C—R⁹ általános képletű acilesoport,

—C—NR¹⁰R¹¹ általános képletű karbamoil-

csoport vagy —C—NR¹⁰R¹² általános képletű

tiokarbamoilcsoport; az általános képletekben

R⁸ jelentése naftilesoport, 3—7 szénatomos cikloalkilesoport — adott esetben egy halogénatommal vagy 1—4 szénatomos alkoxicsoporthal, legfeljebb két 1—4 szénatomos alkilesoporttal szubsztituált — fenilesoport, 1—12 szénatomos alkilesoport, 2—6 szénatomos alkenilesoport, 3—6 szénatomos alkinilesoport, 2—5 halogénatommal helyettesített 1—6 szénatomos alkilesoport, ciano-, hidroxi-, 1—4 szénatomos alkoxi-, 2—6 szénatomos alkanoil-oxi-, N-(1—4 szénatomos alkil)-karbamoil-oxi-, 3—6 szénatomos cikloalkil- vagy fenil-csoporttal monoszubsztituált 1—4 szénatomos alkilesoport;

R⁹ jelentése hidrogénatom, naftil-, furil-, tienil-, piridil-, morfolino-, karbamoil-, etoxi-karbonil-, 3—7 szénatomos cikloalkilesoport — adott esetben egy nitro-, fenil-, 1—4 szénatomos alkil-tio-, N,N-di(1—4 szénatomos alkil)-amino- vagy halogén-(1—4 szénatomos alkil)-csoporttal vagy legfeljebb két halogénatommal, 1—4 szénatomos alkil- vagy 1—4 szénatomos alkoxicsoporthal szubsztituált — fenilesoport; 1—12 szénatomos alkilesoport, 2—10 szénatomos alkenilesoport, halogén-(1—6 szénatomos alkil)-csoport; — adott esetben a fenilgyűrűn halogénatommal monoszubsztituált — sztirilesoport; hidroxicsoporttal, 1—4 szénatomos alkoxicsoporthal, karboxilesoporttal, karboxi-metoxi-csoporttal vagy 3—6 szénatomos cikloalkilesoporttal egyszeresen — adott esetben halogénatommal monoszubsztituált — fenilesoporttal egyszeresen vagy — adott esetben halogénatommal, nitro, vagy 1—4 szénatomos alkoxicsoporthal monoszubsztituált —

fenoxycsoporttal egyszerűen szubsztituált 1—4 szénatomos alkilcsoport;

R¹⁰ és R¹² jelentése egymástól függetlenül halogénatom vagy 1—4 szénatomos alkilcsoport;

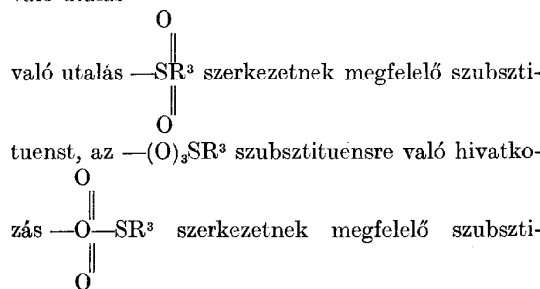
R¹¹ jelentése hidrogénatom — adott esetben halogénatommal vagy etoxi-karbonil-csoporttal monoszubsztituált — 1—4 szénatomos alkilcsoport, fenilcsoport vagy halogénatommal szubsztituált 2—4 szénatomos alkanoilcsoport;

R² és R⁴ együtt adott esetben egy oxigénatommal megszakított 4—6 tagú alkilcsoportot is jelenthet, amely az oxigénatom melletti szénatomon egy allil-oxi-metil-csoporttal és/vagy egy oxocsoporttal lehet helyettesítve;

R⁵ és R⁷ egymástól függetlenül halogénatomot, vagy 1—4 szénatomos alkilcsoportot jelent, R¹ és R⁵ együtt a fenilgyűrűvel naftilcsoportot is képezhet, azzal a megszorítással, hogy ha p értéke 0, R² vagy R⁴ hidrogénatomot jelent.

Ha az (I) általános képletben p értéke 0, akkor a benzolgyűrűk egyike —SR³ általános képletű csoporttal szubsztituált, és a hidrazincsoport aminos csoportjának szubsztituálnak kell lennie. Különösen meglepő például az, hogy hatásos vegyületet kapunk, ha R⁴ alkilcsoportot vagy — első sorban — az előzőekben meghatározott acil-, észter-, karbamoil- vagy tio-karbamoil-csoportot jelent.

Az (I) általános képletben p értéke 2 vagy 3 lehet. Itt utalunk arra, hogy az —(O)₂SR³ szubsztituensre való utalás



Azok a vegyületek, amelyek képletében p értéke 3, különösen előnyösek. Ezek a szubsztituensek teljesen eltérnek a 3 732 307 számú amerikai egyesült államokbeli szabadalmi leírásban említett szubsztituensektől.

Ebben a leírásban halogénatomon mindig fluor-, klór-, bróm- vagy jódatomot, előnyösen fluor-, klór- vagy brómatomot értünk.

Előnyösek azok az (I) általános képletű vegyületek, amelyek képletében p, n és x értéke 0, m értéke 1, R¹ halogénatomot, R² hidrogénatomot, R³ 1—4 szénatomos alkilcsoportot és R⁴ acil- vagy alkoxi-karbonil-csoportot jelent.

További előnyös vegyületek azok, amelyek képletében p értéke 3, x értéke 0, R² hidrogénatomot, R¹ és R³ halogénatomot, R⁴ hidrogénatomot, acil- vagy alkoxi-karbonil-csoportot és R³ alkilcsoportot, vagy adott esetben szubsztituált fenilcsoportot jelent.

Az (I) általános képletben R¹, R⁵ és R⁷ előnyösen halogénatomot, első sorban klóratomot jelentenek. Ha ezek a csoportok alkil-, illetve alkoxycsoportot képviselnek, 1—4 szénatomosak lehetnek, és elő-

nyösen metil- vagy metoxi-csoportot jelentenek. Általában előnyös, ha m értéke 1 és n és x értéke 0.

Az R² jel előnyösen hidrogénatomot képvisel, és R⁴ előnyösen hidrogénatomtól eltérő jelentésű, általában karbonil-származék. Ha R² vagy R⁴ alkilcsoportot jelentenek, akkor ez 1—4 szénatomos, előnyösen metilcsoport. Ha R² és R⁴ a hozzájuk kapcsolódó nitrogénatommal együtt gyűrűt alkotnak, akkor ez például piperidin-, pirrolidin-, első sorban morfolincsoport lehet.

Az R³ jel előnyösen — adott esetben halogénatommal szubsztituált — 1—4 szénatomos alkilcsoportot képvisel. Ha R³ alkenilcsoport, akkor ez általában 1-propenil-csoport. Ha R³ dialkil-amino-csoport, akkor ez előnyösen dimetil-amino-csoport. Különösen előnyös, ha R³ metil- vagy trifluor-metil-csoportot jelent.

Különösen előnyösek azok az (I) általános képletű vegyületek, amelyek képletében m értéke 1, n és x értéke 0, p értéke 3, R¹ halogénatomot, R³ adott esetben halogénatommal szubsztituált 1—4 szénatomos alkilcsoportot és R² hidrogénatomot jelent.

További előnyös vegyületek azok, amelyek képletében R³ metil- vagy trifluor-metil-csoportot, és R⁴ R³ (O)₂ CO-általános képletű csoportot képvisel, ahol q értéke 0 vagy 1, R³ adott esetben 1—4 szénatomos alkoxycsoporttal szubsztituált 1—4 szénatomos alkilcsoportot, 3—7 szénatomos cikloalkilcsoportot, fenil-csoportot vagy szubsztituált fenilcsoportot, 2—6 szénatomos alkenil-csoportot, és ha q értéke 0, akkor R³ hidrogénatomot is jelent.

Az (I) általános képletű vegyületeket hatóanyagként tartalmazó szerek számos, gazdaságilag jelentős károkat okozó rovarok ellen hatékonyak, például a Lepidoptera rendbe tartozó rovarok ellen, így a káposztamoly (*Plutella maculipennis*), a fehér káposztalepke (*Pieris brassicae*), az egyiptomi gypotipille (*Spodoptera littoralis*) és *Heliothis* spp., például *H. armigera*, *H. virescens* és *H. zea* hernyói ellen. A vegyületeket tartalmazó szerek hatékonynak bizonyultak más hernyókkal, például az almamoly (*Laspeyresia pomonella*) hernyójával szemben is. Egyes vegyületeket tartalmazó szerek hatásosak egyéb rovarokkal szemben, például a Coleoptera rendbe tartozó bogarakkal szemben, beleértve a tormaevő bogarat (*Phaedon cochleariae*), gabonasziszikeket (*Sitophilus granarius*), kukoricabogarat (*Tribolium castaneum*) és lisztbogarat (*Tenebrio molitor*); az Orthoptera rendbe tartozó csótányokkal szemben, például a német csótánnyal (*Blattella germanica*) szemben; a Hemiptera rendbe tartozó levéltetvekkel szemben, beleértve a *Megoura viciae*-t.

A vegyületeket tartalmazó szerek állatok, beleértve a háziállatok atka- és rovarkártevői ellen is hatásosak. Például számos szer hatásos volt a Diptera rendbe tartozó rovarok lárvái, például csordalégy (*Lucilia* spp.), valamint moszkító, például *Aedes aegypti* ellen. Azok a szerek, amelyek hatóanyagként olyan (I) általános képletű vegyületet tartalmaznak, amelyben R⁴ megfelelő karbamoil- vagy tiokarbamoil-csoportot jelent, szisztemikus hatásúak, azaz ezekkel a szerekkel kezelt állatok felhámja mentes volt az élősködő rovaroktól. Ez a tulajdonság például szarvasmarhák kezelésénél

jelentős lehet, mivel ezek felhámjába egyes rovarok, például bögöly (*Hypoderma* spp.) élőskeződhet. Egyes vegyületek élőskeződő tetvek, kullancsok is atkafélék, például közönséges kullancs (*Boophilus microplus*) és atka (*Sacoptes* spp.) ellen is hatásosak.

Néhány (I) általános képletű vegyület gombaölő szer, gyomirtó szer és növényi növekedést szabályozó szer hatóanyagként is alkalmazható.

A találmány szerinti rovarölő szer az (I) általános képletű vegyület hatásos mennyiségét és inert hordozóanyagot tartalmaz. Egy szer több hatóanyagot is tartalmazhat, és a hordozóanyag folyékony vagy szilárd lehet, továbbá a szer felületaktív adalékot, például diszpergáló-, emulgeáló- vagy nedvesítőszer is tartalmazhat.

A találmány szerinti szerhez aktivitásának fokozására vagy hatásspektrumának növelésére egy vagy több további, kártevőirtó szerek hatóanyagaként alkalmazható vegyületet adhatunk, illetve ilyen szerekkel együtt alkalmazhatók.

Ezek közül a hatóanyagok körül megemlíthetjük a szerves foszforvegyületeket, például tetra-klórvinfoszt, fenitrothiont, demeton-S-metilt, fozalánt, dioxationt, klórfevinfoszt, diklórsvost, bromofoszetilt, diazinont, dimetoátot, metil-parationt és az O-etil-O-(4-metil-tiofenil)-S-propil-tiozotioat (Bolstar) és a klórpirifoszt; karbamátokat, például metomilt, karbarilt; pirimikarbot vagy promekarbot; hídval kapcsolódó difenil-vegyületeket, például tetradifont, tetrasult vagy DDT-t; klórozott szénhidrogéneket, például benzol-hexakloridot, endosulfánt, endrint és taxofént; az akaricid hatóanyagok közül az amitrazt, klór-dimeformot, klenpirint, klórmetiuront és nimidánt; a szintetikus piretroidok közül például a permetrint, fenvalerátot és cipermetrint, valamint az óntartalmú hatóanyagok közül a cihexatint és a fenbutatin-oxidot.

A találmány szerinti szer például oldat, vizes diszperzió, vizes emulzió, emulgeálható koncentrátum, diszpergálható por, porozószer vagy granulátum. A szer lehet közvetlenül felhasználható alakban, de olyan koncentrátum is lehet, amely felhasználás előtt megfelelő mennyiségű vízzel vagy más hígítószerrel hígítható.

A diszperzió a hatóanyagot vizes közegben diszpergálva tartalmazza. Általában célszerű, ha a felhasználóhoz a szer koncentrátum alakjában kerül, amely vízzel hígítva a kívánt koncentrációjú diszperzióvá alakítható és a következőkben leírt formákban alkalmazható. A diszpergálható oldat a hatóanyagot vízzel elegyedő oldószerben diszpergálószerrel együtt tartalmazza; a diszpergálható por a hatóanyagot és egy diszpergálószer tartalmaz. Egy másik megoldás szerint a finom por alakú hatóanyagot diszpergálószerrel együtt vízzel bensőségesen összekeverjük, így egy pasztát vagy krémet kapunk, amely olaj a vízben emulzióhoz adható, és így a hatóanyag diszperzióját vizes-olajos emulzió alakjában kapjuk.

Az emulzió a hatóanyagot vízzel nem elegyedő oldószerben tartalmazza, amelyhez emulgeálószer jelenlétében vizet adunk. A kívánt koncentrációjú emulziót úgy állíthatjuk elő, hogy a tömény hatóanyagtartalmú emulziót emulgeálószer jelenlétében

vízzel és vízzel nem elegyedő oldószerrel hígítjuk. Olyan emulgeálható koncentrátum is készíthető, amely a hatóanyagot vízzel nem elegyedő oldószerben emulgeálószerrel együtt tartalmazza.

5 A porozószer a hatóanyagot szilárd, porított hordozó anyaggal, például kaolinnal alaposan összekevert és őrölt formában tartalmazza.

A szilárd granulátumban a hatóanyag a porozószerben alkalmazott hordozóanyagokkal van együtt, de ezt a keveréket ismert módon granulátumokká dolgozzuk fel. A hatóanyagot előre formált granulátumhordozókon, így fullerföldön, attapulgiton vagy agyagon adszorbeálthatjuk, vagy adszorbeálthatjuk.

10 A szokásos kezelési módszerekkel közvetlenül felhasználható szerekben a hatóanyag koncentrációja — ha egy hatóanyag van jelen — előnyösen 0,001—10 s%, célszerűen 0,005—5 s%, de légi-permetezés esetén lényegesen töményebb szerek — legfeljebb

20 20 s%-osak — is alkalmazhatók. A tömény szerekben — amelyek felhasználás előtt hígíthatók — a hatóanyag koncentrációja tág határok között változhat, például 5—95 s% lehet.

Előnyös módszer a találmány szerinti szer alkalmazására például, ha a kártevőkkel fertőzött növényeket a szerrel közvetlenül permetezzük vagy beporozzuk, de szerrel, például granulátumokkal a talaj is kezelhető, vagy a szer a növények gyökereire is juttatható. Utóbbi esetben a növény gyökerei a hatóanyagot adszorbeálják, és ez a növényeknek védelmet kölcsönöz a kártevőkkel szemben. Az alkalmazott hatóanyag mennyisége tág határok között változhat a körülményektől függően; általában mennyisége hektáronként 0,01—20 kg, előnyösen hektáronként 0,1—10 kg lehet.

35 Az (I) általános képletű vegyületeket a következő módszerekkel állíthatjuk elő:

a) Egy (II) általános képletű vegyületet egy $\text{NH}_2\text{NR}^2\text{R}^1$ általános képletű vegyülettel reagáltatunk. Ha R^1 hidrogénatomot jelent, akkor a kapott terméket (i) olyan vegyület előállítására, amelyben R^1 acilcsoportot jelent, savhalogéniddel vagy savanhidriddel acilezhetjük, vagy (ii) olyan vegyület előállítására, amelyben R^1 észtercsoport, klórhangyasavészterrel vagy klórtiohangyasavészterrel acilezhetjük, vagy (iii) olyan vegyület előállítására, amelynek képletében R^1 karbamoil- vagy tiokarbamoil-csoport, megfelelő izocianáttal vagy izotiocianáttal acilezhetjük.

50 A leírásban használt acilezőszer kifejezés erre a három reagencsoportra vonatkozik.

A hidrazinnal vagy hidrazin-származékkal való reagáltatást általában 50 és 100 °C között ecetsav jelenlétében végezzük.

55 Az acilezést előnyösen inert, szerves, folyékony közegben végezzük, és ez a reagensek oldószeréül is szolgálhat. A művelet hőmérséklete 0 és 100 °C között van.

Célszerűen a reagáltatást megfelelő savmegkötő szer, például tercier alkil-amin, piridin vagy alkálifém-karbonát jelenlétében hajtjuk végre. Ha acilezőszerként halogenidet használunk, akkor célszerű a klóridd használata.

60 Azok a (II) általános képletű vegyületek, amelyek képletében p értéke 3, újak, és úgy állíthatók

elő, hogy egy R^3SO_2X általános képletű szulfonil-halogenidet — ebben a képletben X halogénatom, előnyösen klóratom — egy megfelelő, (III) általános képletű 4'-hidroxi-vegyülettel reagáltatunk. A műveletet inert, szerves oldószerben és savmegkötő szer jelenlétében végezzük.

Azok a (II) általános képletű vegyületek, amelyek képletében p értéke 0, úgy állíthatók elő, hogy egy $[b]$ általános képletű vegyületet — Y halogénatom, előnyösen klóratom — egy $[c]$ általános képletű vegyülettel Friedel-Crafts reakcióban reagáltatunk. Azok a (II) általános képletű vegyületek, amelyek képletében p értéke 2, a megfelelő olyan (II) általános képletű vegyület oxidációjával, például hidrogénperoxiddal, állíthatók elő, amelyek képletében p értéke 0.

b) Olyan (I) általános képletű vegyületek előállítására, amelyek képletében p értéke 3, egy (IV) általános képletű vegyületet — ebben a képletben R^2 és R^4 egyike hidrogénatomtól eltérő jelentésű — egy R^3SO_2Y általános képletű vegyülettel reagáltatunk — ebben a képletben Y halogénatomot, előnyösen klóratomot jelent. — A reakciót 0 és 100 °C között, előnyösen savmegkötő szer jelenlétében végezzük.

A (IV) általános képletű vegyületek egy megfelelő, $NH_2NR^2R^4$ általános képletű hidrazin-származék és egy (III) általános képletű vegyület reagáltatásával inert, szerves oldószerben, előnyösen ecetsav jelenlétében állíthatók elő. Azok a (IV) általános képletű vegyületek, amelyek képletében R^2 és R^4 közül egyik hidrogénatomtól eltérő jelentésű, újak.

Korábbi ismereteink arra utalnak, hogy a fenti reakciók során kapott termék E- és Z-izomerek elege.

A találmány szerint előállított vegyületeket szemléltető (I) általános képlet tehát mindkét izomert felöleli. Minden esetben az izomerpárok szokásos módszerekkel, például kromatografálással, vagy frakcionált kristályosítással elkülöníthetők, azonban az izomerelegyek felhasználhatók a rovarölő szerek hatóanyagaként, ezért az izomerek szétválasztásának nincs különösebb előnye. Az egyes vegyületek valamely izomerjének hatása eltérő lehet, és egyes esetekben az egyik izomer gyakorlatilag hatástalannak bizonyulhat; hatástalan izomereket tartalmazó szerek nem tartoznak a találmány körébe. A (IV) általános képletű vegyületek szintén izomer alakban létezhetnek, és képletük felöleli mindkét izomert.

Az (I) általános képletű vegyületek előállítását a [1], [2], [3], [4], [5], [6] és [7] reakciósémák szemléltetik. Ezekben a sémákban a szubsztituensek a bevezetőben megadott jelentésűek.

A sémákban ábrázolt műveleteket részleteikben az 1—7. példákban ismertetjük. A hőmérsékleti adatokat Celsius-fokban adjuk meg.

1. példa

4-klór-4'-(metil-szulfonil-oxi)-benzofenon-(etoxi-karbonil)-hidrazon ([1] reakcióséma)

Friedel-Crafts reakció körülményei között fenolt alumínium-klorid jelenlétében p -klór-benzonil-kloriddal reagáltatva 4-klór-4'-hidroxi-benzofenont ka-

punk [op. 179—181°; (A) általános képlet]. A kapott 5 g termék 6 ml piridinnel készült oldatához szobahőmérsékleten 2,5 g metil-szulfonil-kloridot adunk. A reakcióelegyet gőzfürdőn 1,5 óra hosszat melegítjük, majd a folyékony terméket híg sósavba öntve szilárd anyagot kapunk, ezt leszívjuk, és levegőn szárítjuk. Ezt a szilárd anyagot metanolból átkristályosítva 4-klór-4'-(metil-szulfonil-oxi)-benzofenont kapunk [op. 120—121°; (B) általános képlet]. Ebből a vegyületből 9,4 g-ot és 7,8 g etil-karbazátot 8 ml jégecetben és 200 ml etanolban 48 óra hosszat visszafolyatás közben forralunk, majd vákuumban szárazra bepároljuk. A kapott maradékot 250 ml metilén-kloriddal extraháljuk és a kivonatot vízzel, 2,5 n vizes nátrium-hidroxid-oldattal és vízzel mossuk, majd szárítjuk, és szárazra bepárolva 4-klór-4'-(metil-szulfonil-oxi)-benzofenon-(etoxi-karbonil)-hidrazont kapunk. Olvadáspontja: 132,5—140°; [(C) általános képlet]

2. példa

4-klór-4'-(metil-szulfonil-oxo)-benzofenon-hidrazon ([2] reakcióséma)

Az 1. példában kapott 4-klór-4'-(metil-szulfonil-oxi)-benzofenonból [(B) általános képlet] 0,35 g-ot feloldunk 200 ml etanolban, hozzáadunk 8 ml hidrazin-hidrátot, majd 1,5 ml jégecet. A reakcióelegyet keverés és visszafolyatás közben 17 óra hosszat forraljuk. Ezután az oldószert csökkentett nyomáson elpárologtatjuk, és a kapott olajat kloroformmal extraháljuk. A kivonatot vízzel, vizes nátrium-hidroxid-oldattal és vízzel mossuk, majd vízmentes magnézium-szulfáton szárítjuk. Az oldószert csökkentett nyomáson elpárologtatjuk, és a kapott olajat állni hagyjuk. Állás közben a 4-klór-4'-(metil-szulfonil-oxi)-benzofenon-hidrazon kikristályosodik. Olvadáspontja 70—110°; [(D) általános képlet].

3. példa

4-klór-4'-(metil-szulfonil-oxi)-benzofenon-propionil-hidrazon ([3] reakcióséma)

2 g propionil-klorid 15 ml éterrel készült oldatát keverés közben 30 perc alatt 0—5°C-on hozzácepegtetjük a 2. példában kapott 4-klór-4'-(metil-szulfonil-oxi)-benzofenon-hidrazon [(D) általános képlet] 6,3 g-nyi mennyiségének 20 ml piridinnel készült oldatához. A reakcióelegyet 1,5 óra hosszat szobahőmérsékleten keverjük, majd 1 liter vízbe öntjük, és a kivált szilárd anyagot kiszűrjük, híg sósavval és vízzel mossuk, majd vákuumban 60°C-on 1,5 óra hosszat szárítjuk. 4-klór-4'-(metil-szulfonil-oxi)-benzofenon-propionil-hidrazont kapunk. Olvadáspontja: 128—144°; [(C) általános képlet].

4. példa

4-klór-4'-(metil-szulfonil-oxi)-benzofenon-(etoxi-karbonil)-hidrazon ([4] reakcióséma)

92,8 g 4-klór-4'-hidroxi-benzofenon [(A) általános képlet]. 100 g etil-karbazát, 100 ml jégecet 1 liter etanollal készült oldatát keverés közben 48 óra hosszat visszafolyatás közben forraljuk. Ezután az oldószert csökkentett nyomáson elpárologtatjuk, és a kapott szuszpenzióból a szilárd anyagot kiszűr-

jük. Ezt a szilárd anyagot kevés, hideg metanollal mossuk, majd vákuumban 50°-on szárítjuk.

A szűredéket csökkentett nyomáson ismét bepároljuk, és a kapott olajat kloroformmal extraháljuk, majd a kivonatot vizes nátrium-karbonát-oldattal és vízzel mossuk, ezután vízmentes magnézium-szulfáton szárítjuk, és csökkentett nyomáson bepárolva további terméket kapunk.

Az egyesített szilárd anyagot metanolból átkristályosítva 4-klór-4'-(hidroxi-benzofenon-(etoxi-karbonil)-hidrazont kapunk; olvadáspontja 185—187°; [(E) általános képlet].

95,55 g 4-klór-4'-(hidroxi-benzofenon-(etoxi-karbonil)-hidrazon és 90 ml trietil-amin 700 ml tetrahidrofuránnal készült oldatához 35 perc alatt hozzácsapegetjük 44,7 g metil-szulfonil-klorid 25 ml tetrahidrofuránnal készült oldatát. Hőfejlődés közben finom eloszlású csapadék keletkezik; a reakcióelegyet éjszakán át keverjük, Ezután a reakcióelegyet 500 ml vízbe öntjük, és 500 ml metilén-dikloriddal extraháljuk. A kivonatot 5 ízben 500—500 ml vízzel mossuk, majd vízmentes magnézium-szulfáton szárítjuk. Az oldószert csökkentett nyomáson elpárologtatva félig szilárd maradékot kapunk, ezt metanollal eldörzsöljük, szűrjük, majd mossuk. Fehér, szilárd anyagot kapunk, ezt vákuumban 75°-on 3 óra hosszat szárítjuk. A kapott 4-klór-4'-(metil-szulfonil-oxi)-benzofenon-(etoxi-karbonil)-hidrazon olvadáspontja 132—142°; [(C) általános képlet]

5. példa

4-klór-4'-(izopropil-tio)-benzofenon-(etoxi-karbonil)-hidrazon [(5) reakciósema]

Izopropil-fenil-szulfidot Friedel-Crafts reakciókörülmények között alumínium-klorid jelenlétében 4-klór-benzoil-kloriddal reagáltatva 4-klór-4'-(izopropil-tio)-benzofenont kapunk; olvadáspontja 105—107°; [(F) általános képlet].

101 g 4-klór-4'-(izopropil-tio)-benzofenon 650 ml etanollal készült oldatához 67,5 ml hidrazin-hidráttal adunk. A reakcióelegyet 24 óra hosszat visszafolytás közben forraljuk, majd az oldószert csökkentett nyomáson elpárologtatjuk. A kapott maradékhoz vizet adunk, majd kloroformmal extraháljuk vizes nátrium-hidroxid-oldattal, és vízzel mossuk. A szerves kivonatot vízmentes magnézium-szulfáton szárítjuk, és csökkentett nyomáson bepárolva száraz maradék alakjában 4-klór-4'-(izopropil-tio)-benzofenon-hidrazont kapunk; forráspontja 0,13 mbar nyomáson 188—190°; [(G) általános képlet]. Ezt a terméket a 3. példában leírt módon klór-hangyasav-etil-észterrel reagáltatva 4-klór-4'-(izopropil-tio)-benzofenon-(etoxi-karbonil)-hidrazont kapunk; olvadáspontja 115—135°; [(H) általános képlet].

6. példa

4-klór-4'-(propil-szulfonil)-benzofenon-propionil-hidrazon [(6) reakciósema]

Az 5 példában leírt módon Friedel-Crafts reakcióval 4-klór-4'-(propil-tio)-benzofenont állítunk elő; olvadáspontja 94—95°; [(F) általános képlet]. Ebből a vegyületből 2,9 g-ot feloldunk jégcetben, és hozzáadunk 3,5 ml 100 tf%-os hidrogén-peroxi-

dot. A reakcióelegyet 60°C-on 5 óra hosszat keverjük, majd vízbe öntjük. A kívánt szilárd terméket kiszűrjük, vízzel mossuk, szárítjuk és etanolból átkristályosítva 4-klór-4'-(propil-szulfonil)-benzofenont kapunk; olvadáspontja 140,5—142,5°; [(I) általános képlet]. Ezt a terméket a 5. példában leírt módon hidrazin-hidráttal reagáltatva 4-klór-4'-(propil-szulfonil)-benzofenon-hidrazont kapunk; olvadáspontja 110—120°C; [(J) általános képlet]. A terméket az 5. példában leírt módon propionil-kloriddal reagáltatva 4-klór-4'-(propil-szulfonil)-benzofenon-propionil-hidrazont kapunk; olvadáspontja 155—170°; [(K) általános képlet].

15 7. példa

4-klór-4'-(izopropil-tio)-benzofenon-(etoxi-karbonil)-hidrazon [(7) reakciósema]

14,52 g 4-klór-4'-(izopropil-tio)-benzofenon [(F) általános képlet] etanolos oldatát az 1. példában leírt módon etil-karbazáttal reagáltatva 4-klór-4'-(izopropil-tio)-benzofenon-(etoxi-karbonil)-hidrazont kapunk; olvadáspontja 115—135°.

Az 1—7. és a következő példákban a termékeket általában geometriai izomerjeik elegyei alakjában kapjuk, a két izomer aránya termékenként változik.

8—321. példák

A következő I. táblázatban feltüntetett, az (I) általános képlet körébe tartozó, (V) általános képlettel szemléltetett vegyületeket az [1]—[7] reakciósemaikban vázolt módon, az 1—7. példákkal analóg módszerekkel állítottuk elő.

A végtermék fizikai adatait (olvadáspont °C-ban, ha más nem adunk meg) a J oszlopban, a kiindulási vegyület azonosítási adatait a K oszlopban, illetve a közbülső termékekét az L oszlopban ismertetjük.

A [3] reakciósema szerinti szintézishez az előző példa termékét használjuk kiindulási anyagnaként.

A kiindulási anyag (K oszlop) (A) általános képletű vegyület, ha a [1], [2] és [4] reakciósema szerint járunk el, illetve (F) általános képletű vegyület, ha az [5] vagy [7] séma szerint járunk el.

A közbülső vegyület (B) általános képletű vegyület (L oszlop), ha [1] vagy [2] séma szerint járunk el, illetve (E) általános képletű vegyület, ha a [4] sémát és (G) általános képletű, ha [5] sémát alkalmazzuk.

Az A oszlopban adjuk meg az acilezőszer vagy hidrazin-származék típusát a következő rövidítéssel:

Acilezőszerek:

M	savhalogenid
N	savanhidrid
N'	ecetsav-hangyasavanhidrid
O	metil-izocianát
P	fenil-izocianát
Q	metil-izotiocianát
MM	(p-klór-fenil)-izocianát
NN	etil-izocianát
OO	terc-butil-izocianát
PP	butil-izocianát

QQ propil-izocianát
 N'' ftálsavanhidrid
 RR (2-klór-etil)-izocianát
 MA β -butirolakton
 MB etil-oxalil-klorid
 MC etil-fluor-acétát
 MD izopropil-izocianát
 ME (triklór-acetil)-izocianát
 MF etoxi-karbonil-metil-izocianát
 MG terc-butil-izocianát
 MH borostyánkősavanhidrid
 MJ 2,2'-oxi-diecetsavanhidrid
 MK klór-hangyasav-vinil-észter

Hidrazin-származékok:

S etil-karbazát
 T metil-karbazát
 U szemikarbazid
 V benzil-karbazát
 W N-amino-morfolin
 X tioszemikarbazid
 Y 4,4-dimetil-szemikarbazid
 Z N-karbazoil-morfolin
 SS 2-karbazoil-2-metoxi-propán
 TT 2-karbazoil-2-metoxi-propán
 TT 2-karbazoil-etanol
 UU 2-karbazoil-propan-2—01
 VV amino-piperidin
 WW (2,2,2-triklór-etil)-karbazát
 XX oxamoi-hidrazin
 YY 1H, 1H-heptafluor-butil-karbazát
 ZZ 3-amino-2-oxo-oxazolidin
 SA (2,2,2-trifluor-etil)-karbazát
 SB 2-metil-szemikarbazid
 SC 2-imidazolin-2-il-hidrazin-hidrobromid

SD 2,2,3,3-tetrafluor-propil-karbazát
 SE terc-butil-karbazát
 SF 2,4-dimetil-szemikarbazid
 SG 3-amino-perhidro-1,3-oxazin-2-on
 5 SH 2,4,4-trimetil-szemikarbazid
 SJ propinil-karbazát
 SK 1,1-dimetil-hidrazin
 SL (2-metil-allil)-karbazát
 SN 3-amino-5-(allil-oxi-metil)-oxazolidin-2-on
 10 SO 2,4-dimetil-tioszemikarbazid
 SP 2,4,4-trimetil-tioszemikarbazid
 SQ 2-metil-4-(terc-butil)-szemikarbazid
 SR 1,1-dimetil-2-propinil-karbazát
 ST 2-izopropil-szemikarbazid
 15 SU (3-fenoxi-benzil)-karbonát
 SV 1-etil-1-metil-2-propinil-karbazát
 SW 4,4-dimetil-tioszemikarbazid
 A B oszlop az alkalmazott reakciósémát jelzi.
 A C oszlop a kiindulási anyag előállítását szemléltető példára utal.
 A táblázatban
 DD „nem határoztuk meg”-et jelölt;
 * a kiindulási anyag a 2. példa termékének metil-hidrazinnal való reagáltatásával kapott klór-4'-(metil-szulfonil-oxi)-benzofenon-metil-hidrazon.
 25 (+) L készült 4-amino-4'-klór-benzofenon diazotálásával, majd kén-dioxiddal való kezelésével, a kapott szulfonil-klorid-származékot (op. 113—114°C) a megfelelő dialkil-aminnal reagáltattuk,
 30 (1) L készült a 6. példában leírt módon, a metil-tio-benzofenon 132—133, 5°C-on olvad,
 (2) L készült a K vegyület hidrazinnal való reagáltatásával, majd vajsavhidriddel való kezeléssel.
 35

I. táblázat
 (V) általános képletű vegyületek

Példa	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	P	R ¹	R ²	R ³
8	Cl	H	H	Pr	3	H	H	—COOEt
9	Br	H	H	Me	3	H	H	—COOEt
10	F	H	H	Me	3	H	H	—COOEt
11	Cl	H	H	Et	3	H	H	H
12	Cl	H	H	Me	3	H	H	—COPr
13	Me	H	H	Me	3	H	H	—COOEt
14	Cl	H	H	Me	3	H	H	—COBu
15	Cl	H	H	Me	3	H	H	—COMe
16	MeO	H	H	Me	3	H	H	—COOEt
17	Cl	H	H	Me	3	H	H	—COCH ₂ OMe
18	Cl	H	H	Me	3	H	H	—COPh
19	Cl	H	H	Me	3	H	H	—CO(CH ₂) ₂ CH=CH ₂
20	Cl	H	H	Me	3	H	H	—CO—

	J	K	L	A	B	C
8	112—136	179—181	185—190	S	4	
9	151,5—158	187,5—191	135—136,5	S	1	
10	167,5—169	169,5—171,5	110—111	S	1	
11	99,5—100	179—181	99,5—100		2	
12	138—154			M	3	2

I. táblázat folytatása

	J	K	L	A	B	C
13	117—119	171—173	88,5—91	S	1	
14	115—147			M	3	2
15	148—159			M	3	2
16	120—130	114,5—145,5	146,5—149,5	S	1	
17	144—146,5			M	3	2
18	174—178			M	3	2
19	138—148			M	3	2
20	158—167			M	3	2

Példa	R ¹	R	R ⁵	R ³	p	R ⁷	R ²	R ⁴
21	Cl	H	H	Me	3	H	H	—COOPr
22	Cl	H	H	Me	3	H	H	—COOEt
23	Cl	H	H	Me	3	H	H	—COC ₆ H ₁₁
24	Cl	H	H	Me	3	H	H	—COSEt
25	Cl	H	H	Et	3	H	H	—COPr
26	Cl	H	H	Et	3	H	H	—COBu
27	Cl	H	H	ClCH ₂ —	3	H	H	—COOEt
28	Cl	H	H	Me	3	H	H	—COC ₈ H ₁₇
29	Cl	H	H	Me	3	H	H	—COC ₆ H ₁₃
30	Cl	H	H	Et	3	H	H	—COOPr
31	Cl	H	H	Me	3	H	H	—CO—  —OMe
32	Cl	H	H	Me	3	H	H	—COPr ¹
33	Cl	H	H	Me	3	H	H	—COBu ¹
34	H	H	H	Me	3	H	H	H
35	H	H	H	Me	3	H	H	—COPr
36	H	H	H	Me	3	H	H	—CCOEt
37	Cl	H	H	Me	3	H	H	—CO—  —OEt

Példa	J	K	L	A	B	C
21	127—145			M	3	2
22	90—115	179—181	185—190	S	4	
23	122—132			M	3	2
24	156—171			M	3	2
25	112—119			M	3	11
26	105—125			M	3	11
27	110—130	179—181	185—190	S	4	
28	134—137			M	3	2
29	118—133			M	3	2
30	120—124			M	3	11
31	159—161			M	3	2
32	147—149			M	3	2
33	145—151			M	3	2
34	74—83	ND	102,5—104,5		2	
35	111—126			M	3	34
36	95—124			M	3	34
37	175—178			M	3	2

Példa	R ¹	R ⁵	R ⁶	R ³	p	R ⁷	R ²	R ⁴
38	Cl	H	H	Me	3	H	H	—COOPr ¹
39	Cl	H	H	Pr	3	H	H	H
40	Cl	H	H	Me	3	H	H	—CO— 
41	Cl	H	H	Me	3	H	H	—COC ₇ H ₁₅
42	Cl	H	H	Me	3	H	H	—COCHClMe ₉
43	Cl	H	H	Bu	3	H	H	—COOEt
44	Cl	H	H	Me	3	H	H	—COOC ₅ H ₁₁
45	Cl	H	H	Me	3	H	H	—CO—  —Cl
46	Cl	Cl	H	Me	3	H	H	—COOEt

I. táblázat folytatása

Példa	R ¹	R ⁵	R ⁶	R ³	p	R ⁷	R ²	R ⁴
47	Cl	H	H	Me	3	Cl	H	—COOEt
48	Br	H	H	Me	3	H	H	H
49	Cl	H	H	Me	3	Me	H	—COOEt
50	Cl	H	H	Cl(CH ₂) ₃	3	H	H	—COOEt
51	Cl	H	H	Me	3	H	H	—CO— 
52	Cl	H	H	Me	3	H	H	—CO— 
53	Cl	H	H	Me	3	H	H	—COOPh

Példa	J	K	L	A	B	C
38	150—185			M	3	2
39	86,5—93	179—181	71—73	S	2	
40	160—173			M	3	2
41	113—133			M	3	2
42	145—147			M	3	2
43	116—118	179—181	185—190	S	4	
44	115—122			M	3	2
45	160—173			M	3	2
46	168—178	158,5—170	85,5—86,5	S	1	
47	171—181	52,5—53,5	79—80	S	1	
48	110—113	187,5—191	135—136,5		2	
49	131—140	211—211,5	90—91	S	1	
50	109—116	179—181	185—190	S	4	
51	150—161			M	3	2
52	173—182			M	3	2
53	133—153			M	3	2

Példa	R ¹	R ⁵	R ⁶	R ³	p	R ⁷	R ²	R ⁴
54	Br	H	H	Me	3	H	H	—COPr
55	Br	H	H	Me	3	H	H	—COBu
56	Br	H	H	ClCH ₂ —	3	H	H	—COOEt
57	Cl	Br	H	Me	3	H	H	—COOEt
58	Br	H	H	Me	3	H	H	—CO— 
59	Cl	I	H	Me	3	H	H	—COOEt
60	Cl	H	H	Me	3	H	H	—COC (Me ₂) Pr
61	Cl	H	H	Me	3	H	H	—CONHMe
62	Et	H	H	Me	3	H	H	—COOEt
63	Br	H	H	Me	3	H	H	—CONH ₂
64	Cl	H	H	Me	3	H	H	—COOBu
65	Cl	H	H	Me	3	H	H	—COCH ₂ CH (Me) Et
66	Cl	H	H	Me	3	H	H	—CO— 
67	Cl	H	H	Me	3	H	H	—COCHCl ₂
68	Cl	H	H	Me	3	H	H	—COOC ₈ H ₁₇
69	Cl	H	H	Me	3	H	H	—COO— 
70	Cl	H	H	Cl— 	3	H	H	—COOEt

Példa	J	K	L	A	B	C
54	154—157,5			M	3	48
55	140—144			M	3	48
56	129,5—130,5	187,5—191	200,5—203	S	4	
57	193—194	193—194	89,5—92	S	1	
58	177—180			M	3	48
59	164—168	191—192	82—85	S	1	
60	130—140			M	3	2
61	186—188			O	3	2

I. táblázat folytatása

Példa	J	K	L	A	B	C
62	142—147	99—100	88—89	S	1	
63	97—103	187,5—191	135—136,5	U	1	
64	121—125			M	3	2
65	128—131			M	3	2
66	139—146			M	3	2
67	139—141			M	3	2
68	95—97			M	3	2
69	150—162			M	3	2
70	157—160	179—181	185—190	S	4	

Példa	R ¹	R ²	R ³	p	R ⁷	R ⁸	R ⁴	
71	Cl	H	H	Me	3	H	H	—CO— 
72	Cl	H	H	Me	3	H	H	—CO— 
73	Cl	H	H	Me	3	H	H	—CO— 
74	OMe	Cl	H	Me	3	H	H	—COOEt
75	Cl	H	H	Me	3	H	H	—CONH ₂
76	SMe	H	H	Me	3	H	H	—COOEt
77	Cl	H	H	Me	3	H	H	—CO— 
78	Cl	H	H	Me	3	H	H	—COOC ₇ H ₁₅
79	Cl	H	H	Me	3	H	H	—CO— 
80	Cl	H	H	Me	3	H	H	—CO— 
81	Cl	H	H	Me	3	H	H	—CO— 
82	Me	Cl	H	Me	3	H	H	—COOEt
83	Cl	H	H	CF ₃	3	H	H	—COOEt
84	Cl	H	H	Me	3	H	H	—COBu ^t
85	Cl	H	H	Me	3	H	H	—COOBu ^t
86	Cl	H	H	Me	3	H	H	—COC ₁₁ H ₂₃

Példa	J	K	L	A	B	C
71	180—186			M	3	2
72	166—169			M	3	2
73	182—186			M	3	2
74	184—188	167—168	125—127	S	1	
75	144—148	179—181	120—121	U	1	
76	114—118	133—134	ND	S	1	
77	158—174			M	3	2
78	98—97			M	3	2
79	166—168			M	3	2
80	128—129,5			M	3	2
81	156—158			M	3	2
82	150—165	153—154	136—137	S	1	
83	94—122	179—181	185—190	S	4	
84	115—132			M	3	2
85	105—127			M	3	2
86	102—132			M	3	2

Példa	R ¹	R ⁵	R ⁶	R ³	p	R ⁷	R ²	R ⁴
87	Cl	H	H	Me	3	F	H	—COOEt
88	Cl	H	H	Me	3	H	H	—CO—  —Br
89	Cl	H	H	Me	3	H	H	—CO— 
90	Cl	H	H	Me	3	H	H	—COCH ₂ OPh
91	Cl	H	H	Me	3	H	H	—COO— 

I. táblázat folytatása

Példa	R ¹	R ⁵	R ⁶	R ³	p	R ⁷	R ²	R ₁
92	Cl	H	H	Me	3	H	H	—COO—  OMe
93	Cl	H	H	Pr ¹	3	H	H	—COOEt
94	Cl	H	H	Me	3	H	H	—CO—  Cl
95	Cl	H	H	Me	3	H	H	—CO—  Bu ¹
96	Cl	H	Cl	Me	3	H	H	H
97	Cl	H	H	NMe ₂	3	H	H	—COOEt
98	Cl	H	H	Me	3	H	H	—CO—  F
99	Cl	H	H	Me	3	H	H	—COO—  Me
100	Cl	H	H	Me	3	H	H	—CO—  s

Példa	J	K	L	A	B	C
87	138—144	173—176,5	85,5—87,5	S	1	
88	137—175			M	3	2
89	150—156			M	3	2
90	143—145			M	3	2
91	177—178			M	3	2
92	161—167			M	3	2
93	104—107	179—181	185—190	S	4	
94	185—186,5			M	3	2
95	161,5—164			M	3	2
96	olaj	134—135	119—120		2	
97	135—140	179—181	185—190	S	4	
98	174—178			M	3	2
99	167—170			M	3	2
100	157—158			M	3	2

Példa	R ¹	R ⁵	R ⁶	R ³	p	R ⁷	R ²	R ⁴
101	Cl	H	H	Me	3	H	H	—COC ₆ H ₁₃
102	Cl	H	H	BrCH ₂	3	H	H	—COOEt
103	Cl	H	H	Me	3	H	H	—CO(CH ₂) ₃ CH=CH ₂
104	Cl	H	H	Me	3	H	H	—CO—  — 
105	Cl	H	H	Me	3	H	H	—COOC ₁₂ H ₂₅
106	Cl	H	H	Me	3	H	H	—CHO
107	Cl	H	H	Me	3	H	H	—COOCH ₂ CH=CH ₂
108	Cl	H	H	Me	3	H	H	—COO—  Me
109	Cl	H	H	Me	3	H	H	—CO—  Pr
110	Cl	H	H	Me	3	H	H	—CO—  Et
111	Cl	H	H	Me	3	H	H	—CO—  Br
112	Cl	H	H	Me	3	H	H	—CO—  Br
113	Cl	H	H	Me	3	H	H	—CO—  CH ₂ Cl
114	Cl	Me	H	Me	3	H	H	—COOEt
115	Cl	H	H	Me	3	H	H	—COCH ₂ — 

Példa	J	K	L	A	B	C
101	126—132			M	3	2
102	138—143	179—181	185—190	S	4	
103	105—115			M	3	2
104	210—212			M	3	2
105	86—100			M	3	2
106	197—198			N	3	2

I. táblázat folytatása

Példa	J	K	L	A	B	C
107	115—121			M	3	2
108	135—140			M	3	2
109	148—151,5			M	3	2
110	176—178			M	3	2
111	132—134			M	3	2
112	165—168			M	3	2
113	139—144,5			M	3	2
114	135—140	154—156	96—99	S	1	
115	133—136			M	3	2

Példa	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	p	R ⁷	R ⁸	R ⁹
116	Cl	H	H	Me	3	H	H	—CO— 
117	Cl	H	H	Me	3	H	H	—COCH ₂ OEt
118	Cl	H	H	Me	3	H	H	—COC ₂ F ₅
119	Cl	H	H	Me	3	H	H	—CO—  —SMe
120	Me	Me	H	Me	3	H	H	—COOEt
121	Cl	H	H	Et ₃ N	3	H	H	—COOEt
122	Cl	H	H	Bu ¹	3	H	H	—COOEt
123	Cl	H	H	Me	3	H	H	—COCH ₂ Cl
124	Cl	H	H	Me	3	H	H	—CO—  —CF ₃
125	Cl	H	H	Me	3	H	H	—COO—  —Br
126	Cl	H	H	Me	3	H	H	—CO— 
127	Cl	H	H	Me	3	H	H	—COO— 
128	Cl	H	H	Me	3	H	H	—COCH=CHPh
129	Cl	H	H	Me	3	H	H	—CO—  —Me
130	Cl	H	H	Me	3	H	H	—COO—  —Cl

Példa	J	K	L	A	B	C
116	196—197			M	3	2
117	147—149			M	3	2
118	103—106			M	3	2
119	172—174			M	3	2
120	133—137			M	3	2
121	121—142	179—181	185—190	S	4	
122	108—113	179—181	185—190	S	4	
123	124—126			M	3	2
124	152—155			M	3	2
125	144—150			M	3	2
126	168—169			M	3	2
127	104—106			M	3	2
128	178—181			M	3	2
129	184—187,5			M	3	2
130	134,5—141			M	3	2

Példa	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	p	R ⁷	R ⁸	R ⁹
131	Cl	H	H	Me	3	H	H	—COCH ₂ O—  —F
132	Cl	H	H	Me	3	H	H	—COCH ₂ —  —Br
133	Cl	H	H	Me	3	H	H	—COCH ₂ —  —F
134	Cl	H	H	Me	3	H	H	—COCH=CH—  —Cl
135	Cl	H	H	Me	3	H	H	—COCH ₂ —  —NO ₂
136	Cl	H	H	Me	3	H	H	—COCH ₂ OBu
137	Cl	H	H	Me	3	H	H	—COCH=CHCH ₃
138	Cl	H	H	CH ₃ CH=CH	3	H	H	—COOEt

I. táblázat folytatása

Példa	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	p	R ⁷	R ⁸	R ⁴
139	Cl	H	H	Bu ⁺	3	H	H	—COOEt
140	Cl	H	H	Me	3	H	H	—CO—  —NMe ₂
141	Cl	H	H	Me	3	H	H	—COOCH ₂ C=CH
142	Cl	H	H	Me	3	H	H	—COOMe
143	Cl	H	H	Pr	0	H	H	—COMe
144	Cl	H	H	Pr	0	H	H	—COEt
145	Cl	H	H	Pr ¹	0	H	H	—COOMe
146	Cl	H	H	Bu ¹	0	H	H	—COEt

Példa	J	K	L	A	B	C
131	115—128			M	3	2
132	150—160			M	3	2
133	162—163			M	3	2
134	196—198			M	3	2
135	172—176			M	3	2
136	110—113			M	3	2
137	149—161			M	3	2
138	154—158,5	179—181	185—190	S	4	
139	89—92	179—181	185—190	S	4	
140	216—129				3	2
141	90—121				3	2
142	149,5—154,5	179—181	223—227	T	4	
143	117—127	94—95	81—83	N	5	
144	90—110	94—95	81—83	N	5	
145	151—153	103—105		T	7	
146	129—131	81—83	olaj	N	5	

Példa	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	p	R ⁷	R ⁸	R ⁴
147	Br	H	H	Pr ¹	0	H	H	—COOEt
148	Cl	H	Cl	Pr	0	H	H	—COMe
149	Cl	H	H	Ph	3	H	H	—COOEt
150	Cl	H	H	Et	3	H	H	—COOEt
151	Br	H	H	Pr ¹	0	H	H	—COEt
152	Cl	H	H	Bu ⁺	0	H	H	—COPr
153	Cl	H	H	Me	0	H	H	—COOEt
154	Cl	H	H	Pr	0	H	H	—COCH ₂ CH ₂ Cl
155	Cl	H	H	Pr	0	H	H	—COCH ₂ Cl
156	Cl	H	H	Pr	0	H	H	—CHO
157	Cl	H	H	Pr ¹	0	H	H	—COPr ¹
158	Cl	H	H	Pr	0	H	H	—COBu
159	Cl	H	H	Pr	0	H	H	—COBu ¹
160	Cl	H	H	Pr ¹	0	H	H	—COC ₂ H ₁₁
161	Cl	H	H	Pr ¹	0	H	H	—COCHClCH ₃
162	Cl	H	H	Pr ¹	0	H	H	—COCH ₂ OMe
163	Cl	H	H	Pr ¹	0	H	H	—CO—  —OMe
164	Cl	H	H	Pr ¹	0	H	H	—COCH ₂ CH ₂ Cl

Példa	J	K	L	A	B	C
147	118—126	98—100		S	7	
148	138—140	fp. 180—2/0,07	olaj	N	5	
149	130—133	179—181	185—190	S	4	
150	113—127	179—181	185—190	S	4	
151	89—108	98—100	olaj	M	5	
152	105—113	olaj	olaj	M	5	
153	95—124	132—133,5		S	7	

I. táblázat folytatása

Példa	J	K	L	A	B	C
154	113—120	94—95	81—83	M	5	
155	113—120	94—95	81—83	M	5	
156	139—145	94—95	81—83	N	5	
157	82—114	103—105	fp. 188—90/0,1	M	5	
158	123—125	94—95	81—83	M	5	
159	97—102	94—95	81—83	M	5	
160	115—132	103—105	fp. 188—90/0,1	M	5	
161	128—131	103—105	fp. 188—90/0,1	M	5	
162	97—103	103—105	fp. 188—90/0,1	M	5	
163	100—120	103—105	fp. 188—90/0,1	M	5	
164	110—120	103—105	fp. 188—90/0,1	M	5	

Példa	R ¹	R ⁵	R ⁶	R ³	p	R ⁷	R ²	R ⁴
165	Cl	H	H	Pr ¹	0	H	H	—COOEt
166	Cl	H	H	Pr	0	H	H	—COOMe
167	Cl	H	H	Pr	0	H	H	—COPr
168	Cl	H	H	Bu ¹	0	H	H	—COPr
169	Cl	H	H	Pr ¹	0	H	H	—COEt
170	Cl	H	H	Pr ¹	0	H	H	—COOH ₂ OPh
171	Cl	H	H	Pr ¹	0	H	H	—COMe
172	Cl	H	H	Pr ¹	0	H	H	—COPr
173	Cl	H	H	Pr ¹	0	H	H	—COBu
174	Cl	H	H	Pr ¹	0	H	H	—CHO
175	Cl	H	H	Pr	0	H	H	—COPr ¹
176	Cl	H	H	Pr	0	H	H	—CO—  —Cl
177	Cl	H	H	Pr ¹	0	H	H	—CO—  —Me
178	Cl	H	H	Pr ¹	0	H	H	—COC ₆ H ₁₇
179	Cl	H	H	Pr ¹	0	H	H	—CO—  —Cl
180	Cl	H	H	Pr ¹	0	H	H	—CO—  —Cl
181	Cl	H	H	Pr ¹	0	H	H	—COC ₆ H ₁₃
182	Cl	H	H	Pr ¹	0	H	H	—CO—  —Cl

Példa	J	K	L	A	B	C
165	115—135	103—105		S	7	
166	120—141	94—95		T	7	
167	128,5—134	94—95	81—83	M	5	
168	135—137	81—83	olaj	M	5	
169	138—140	103—105	fp. 188—90/0,1	N	5	
170	112—125	103—105	fp. 188—90/0,1	M	5	
171	146—149	103—105	fp. 188—90/0,1	N	5	
172	146—147	103—105	fp. 188—90/0,1	N	5	
173	137—139	103—105	fp. 188—90/0,1	M	5	
174	145—162	103—105	fp. 188—90/0,1	N	5	
175	87—127	94—95	81—83	M	5	
176	90—140	94—95	81—83	M	5	
177	132—147	103—105	fp. 188—90/0,1	M	5	
178	88—191	103—105	fp. 188—90/0,1	M	5	
179	120—123	103—105	fp. 188—90/0,1	M	5	
180	126—143	103—105	fp. 188—90/0,1	M	5	
181	111—122	103—105	fp. 188—90/0,1	M	5	
182	130—144	103—105	fp. 188—90/0,1	M	5	

Példa	R ¹	R ⁵	R ⁶	R ³	p	R ⁷	R ²	R ⁴
183	Cl	H	H	Pr ¹	0	H	H	—CO— 
184	Cl	H	H	Pr ¹	0	H	H	—COCHCl ₂
185	Cl	H	H	Pr ¹	0	H	H	—CO— 

I. táblázat folytatása

Példa	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	p	R ⁷	R ⁸	R ⁴
186	Cl	H	H	Pr ¹	0	H	H	—COPh
187	Cl	H	H	Pr ¹	0	H	H	—CO— 
188	Cl	H	H	Pr ¹	0	H	H	—COCH ₂ O— 
189	Cl	H	H	Pr ¹	0	H	H	—COCH ₂ OEt
190	Cl	H	H	Pr ¹	0	H	H	—COCH(Me)OPh
191	Cl	H	H	Pr ¹	0	H	H	—CO— 
192	Cl	H	H	Pr ¹	0	H	H	—COOPr
193	Cl	H	H	Pr ¹	0	H	H	—COSEt
194	Cl	H	H	Pr ¹	0	H	H	—COPr ¹
195	Cl	H	H	Pr ¹	0	H	H	—COCH ₂ OPr
196	Cl	H	H	Pr ¹	0	H	H	—CO— 
197	Cl	H	H	Pr ¹	0	H	H	—COCH ₂ OBu
198	Cl	H	H	Pr ¹	0	H	H	—COCH ₂ CH ₂ OEt

Példa	J	K	L	A	B	C
183	138—143	103—105	fp. 188—90/0,1	M	5	
184	121—126	103—105	fp. 188—90/0,1	M	5	
185	125—135	103—105	fp. 188—90/0,1	M	5	
186	120—129	103—105	fp. 188—90/0,1	M	5	
187	90—120	103—105	fp. 188—90/0,1	M	5	
188	110—123	103—105	fp. 188—90/0,1	M	5	
189	98—123	103—105	fp. 188—90/0,1	M	5	
190	124—125	103—105	fp. 188—90/0,1	M	5	
191	139—141	103—105	fp. 188—90/0,1	M	5	
192	100—105	103—105	fp. 188—90/0,1	M	5	
193	121—125	103—105	fp. 188—90/0,1	M	5	
194	132—135	103—105	fp. 188—90/0,1	M	5	
195	120—127	103—105	fp. 188—90/0,1	M	5	
196	100—130	103—105	fp. 188—90/0,1	M	5	
197	98—102	103—105	fp. 188—90/0,1	M	5	
198	99—102	103—105	fp. 188—90/0,1	M	5	

Példa	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	p	R ⁷	R ⁸	R ⁴
199	Cl	H	H	Pr ¹	0	H	H	—COOH=CM ₂
200	Cl	H	H	Pr ¹	0	H	H	—CO(CH ₂) ₂ CH=CH ₂
201	Br	H	H	Pr ¹	0	H	H	—COPr
202	Br	H	H	Pr ¹	0	H	H	—CO— 
203	Br	H	H	Pr ¹	0	H	H	—COCH ₂ OEt
204	Br	H	H	Pr ¹	0	H	H	—COCH ₂ OMe
205	Me	H	H	Pr ¹	0	H	H	—COPr
206	Me	H	H	Pr ¹	0	H	H	—COPr ¹
207	MeO	H	H	Pr ¹	0	H	H	—COPr
208	Cl	H	H	Bu ¹	0	H	H	—COPr
209	Cl	H	H	Bu ¹	0	H	H	—COBu
210	Cl	H	H	Pr ¹	0	H	H	—COOCH ₂ — 
211	Cl	H	H	Me	3	H	—COCH ₂ — 	—COCH ₂ —
212	együtt = benzo	H	H	Me	3	H	H	—COOEt
213	Cl	H	H	Me	3	H	együtt = N'N'-3-oxapentamotilén	
214	I	H	H	Me	3	H	H	—COOEt
215	Cl	H	H	Me	3	H	H	—CONMe ₂

Példa	J	K	L	A	B	C
199	115—120	103—105	fp. 188—90/0,1	M	5	
200	123—128	103—105	fp. 188—90/0,1	M	5	
201	106—125	98—100	olaj	M	5	

I. táblázat folytatása

Példa	J	K	L	A	B	C
202	144—146	98—100	olaj	M	5	
203	102—106	98—100	olaj	M	5	
204	95—108	98—100	olaj	M	5	
205	93—101	79—83	fp. 180—84/0,1	M	5	
206	114—118	79—83	fp. 180—84/0,1	M	5	
207	90—100	69—71	olaj	M	5	
208	141—144	81—83	olaj	M	5	
209	122—127	81—83	olaj	M	5	
210	120—135	103—105		V	7	
211	147—147,5			M	3	2
212	gyanta	ND	142—3	S	4	
213	130—138	179—181	185—190	W	4	
214	145—150	181,5—182,5	140—140,5	S	1	
215	152—162	179—181	120—121	Y	1	

Példa	R ¹	R ⁵	R ⁶	R ³	p	R ⁷	R ²	R ⁴
216	Cl	H	H	Me	3	H	H	—CONHPh
217	Cl	H	H	Me	3	H	H	—CSNHCH ₃
218	Cl	H	H	Me	3	H	H	—CO—  —Cl
219	Cl	H	H	Me	3	H	H	—CONHEt
220	Cl	H	H	Me	3	H	Me	—COPr
221	CF ₃	H	H	Me	3	H	H	—COOEt
222	CF ₃	H	H	CF ₃	3	H	H	—COOEt

Példa	J	K	L	A	B	C
216	175—180			P	3	2
217	218—222			R	3	2
218	208—213			MM	3	2
219	155—177			NN	3	2
220	113—175			M	3	*
221	130—131	142—143	98—99	S	1	
222	123—124,5	142—143	98—99	S	1	

Példa	R ¹	R ⁵	R ⁶	R ³	p	R ⁷	R ²	R ⁴
223	Cl	H	H	Me	3	H	H	—COCH=CH ₂
224	Cl	H	H	Me	3	H	H	—CON 
225	Cl	H	H	Me	3	H	H	—COO—  — 
226	Cl	H	H	Me	3	H	H	—COCF ₃
227	Cl	H	H	CF ₃	3	H	H	—H
228	Cl	H	H	Me	3	H	H	—CO— 
229	Cl	H	H	CF ₃	3	H	H	—CONH ₂
230	Cl	H	H	CF ₃	3	H	H	—CONHMe
231	Cl	H	H	Me	3	H	H	—COO—  —Cl
232	Cl	H	H	CF ₃	3	H	H	—CO— 
233	Cl	H	H	CF ₃	3	H	H	—CO—  —Cl
234	Cl	H	H	Me	3	H	P	—COO—  —Me
235	Cl	H	H	CF ₃	3	H	H	—COC ₃ H ₇
236	Cl	H	H	CF ₃	3	H	H	—COC ₃ H ₇ ¹
237	Cl	H	H	CF ₃	3	H	H	—COPh
238	Cl	H	H	CF ₃	3	H	H	—CHO
239	Cl	H	H	Me	3	H	H	—FONHBu ¹
240	Cl	H	H	Me	3	H	H	—CONHBu
241	Cl	H	H	Me	3	H	H	—COCM ₂ OMe
242	Cl	H	H	Me	3	H	H	—CONHPr

I. táblázat folytatása

Példa	R ¹	R ⁵	R ⁶	R ³	p	R ⁷	R ²	R ⁴
243	Cl	H	H	Me	3	H	H	—COOH
244	Cl	H	H	Me	3	H	H	—COOCH ₂ CH ₂ OH
245	Cl	H	H	Me	3	H	H	—COOCH ₂ CH ₂ Cl
246	Cl	H	H	Me	3	H	H	—COC(ON)Me ₂
247	Cl	H	H	CF ₃	3	H	H	—COOCH ₂ CH ₂ CN
248	Cl	H	H	Me	3	H	együtt pentametilén	
249	Cl	H	H	Me	3	H	H	—CONHH ₄ CH ₂ Cl
250	F	H	H	Me	3	H	H	—CONHC ₂

Példa	J	K	L	A	B	C
223	145—146			M	3	
224	159—166	179—181	120—121	Z		
225	158—160			M	3	2
226	115—115,5			M	3	2
227	84—99	179—181	57—60		2	
228	178—181			M	3	2
229	165—171	179—181	57—60	U	1	
230	190—192			O	3	227
231	147—151			M	3	2
232	170—174			M	3	227
233	135—153			M	3	227
234	101,5—105,5			M	3	2
235	137—143			M	3	227
236	142—145			M	3	227
237	140—142			M	3	227
238	130—134			N	3	227
239	149			OO	3	2
240	180—187			PP	3	2
241	119—121	179—181	120—121	SS	1	
242	150—120			QQ	3	2
243	171—173			N''	3	2
244	172—173			TT	1	
245	177—179			M	3	2
246	95—105	179—181	120—121	UU	1	
247	118—121			M	3	227
248	142—146	179—181	120—121	VV	1	
249	170—176			RR	3	2
250	148,5—152	169,5—171,5	110—111	V	1	

Példa	R ¹	R ⁵	R ⁶	R ³	p	R ⁷	R ²	R ⁴
251	Bu ^t	H	H	Me	3	H	H	—COOEt
252	Cl	H	Cl	Me	3	H	H	—COOEt
253	Cl	H	Cl	CF ₃	3	H	H	—H
254	Cl	H	Cl	Me	3	H	H	—COOCH ₂ CCl ₃
255	Cl	H	H	Me	3	H	H	—COCONH ₂
256	Cl	H	H	Me	3	H	H	—COCH ₂ CH(OH)CH ₃
257	Cl	H	H	Me	3	H	H	—COCOOEt
258	Cl	H	H	Me ₂ N	2	H	H	—COOEt
259	Cl	H	H	Me	3	H	H	—COOCH ₂ (CF ₃)CF ₃
60	Cl	H	H	Me	3	H	H	—COCH ₂ F
261	Cl	H	H	Me	3	H	együtt 1-oxo-2-oxa-tetrametilén	
262	Cl	H	H	Me	3	H	H	—COOCH ₂ CF ₃
263	Cl	H	H	Me	3	H	H	—COO(CH ₂)OCONHMe
264	Cl	H	H	Me	3	H	H	—CONHPr ⁱ
265	Cl	H	H	Me	3	H	H	—CONHCOCCl ₃
266	Cl	H	H	Me	3	H	Me	—CONH ₂
267	Cl	H	H	Et ₂ N	2	H	H	—COOEt

I. táblázat folytatása

Példa	J	K	L	A	B	C
251	159—160	130—131	109—116	S		
252	179—180			M	3	96
253	Oil	134—135	bp161—2/0,7 mm			
254	96—97	179—181	120—121	WW	1	
255	170—175			XX	1	
256	139—141			MA	3	2
257	135—139,5			MB	3	2
258	142—150			S	1+	
259	152—153		133—135	YY	1	
260	157—159			MC	3	2
261	140—141	179—181	120—121	ZZ	1	
262	150—170	179—181	120—121	SA	1	
263	143—144			O	3	224
264	165—170			MD	1	
265	182			ME	3	2
266	138—142	179—181	120—121	SB	1	
267	132—4	179—181	123—124	S	1(+)	

Példa	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	p	R ⁷	R ⁸	R ⁹
268	Cl	H	H	CF ₃	3	H	H	—COOCH ₂ CF ₃
269	Cl	H	H	CF ₃	3	H	H	—  HBr
270	Cl	H	H	Me	3	H	COOEt	CONHCOCCl ₂
271	Cl	H	H	Me	3	H	H	COOCH ₂ CF ₂ CHF ₃
272	Cl	H	H	Me	3	H	H	CONHCH ₂ COOEt
273	Cl	H	H	CF ₂ CH ₂	3	H	H	COOEt
274	Cl	H	H	CF ₂ H	3	H	H	COOEt
275	Cl	H	H	CH ₂ I	3	H	H	COOEt
276	Cl	H	H	CF ₃	3	H	H	COOCH ₂ CCl ₂
277	Cl	H	H	Me	3	H	H	COO(CH ₂)OCOBur
278	Cl	H	H	CF ₃	3	H	Me	CONH ₂
279	Cl	H	H	CF ₃	3	H	együtt 1-oxo-2-oxa-tetrametilén	
280	Cl	H	H	CF ₃	3	H	H	COOCH ₂ CF ₂ CHF ₃
281	Cl	H	H	Me	2	H	H	COOEt
282	Cl	H	H	CF ₃	3	H	H	COOBu ¹
283	Cl	H	H	CF ₃	3	H	H	COMe
284	Cl	H	H	CF ₃	3	H	Me	CONHMe
285	Cl	H	H	CF ₃	3	H	H	CONMe ₂
286	Cl	H	H	Me	3	H	együtt 1-oxo-2-oxapentametilén	
287	Cl	H	H	CF ₃	3	H	Me	CONMe ₂
288	Cl	H	H	CF ₃	3	H	H	—COOCH ₂ C=CH
289	Cl	H	H	CF ₃	3	H	Me	Me
290	Cl	H	H	CF ₃	3	H	H	COOMe
291	Cl	H	H	Me	3	H	H	COOCH ₂ Ph
292	Cl	H	H	CF ₃	3	H	együtt 1-oxo-2-oxapentametilén	
293	Cl	H	H	CF ₃	3	H	H	—CO— 
294	Cl	H	H	Me	3	H	H	—COCH ₂ CH ₂ COOH
295	Cl	H	H	Me	3	H	H	—COCH ₂ OCH ₂ COOH
296	Cl	H	H	Me	3	H	Me	—CONHMe
297	Cl	H	H	Me	3	H	Me	—CONMe ₂
298	Cl	H	H	Me	3	H	H	—COCH=CH ₂
299	Cl	H	H	CF ₃	3	H	H	—COCH ₂ OBu
300	Cl	H	H	CF ₃	3	H	H	—COCH ₂ — 

Példa	J	K	L	A	B	C
268	156—159	179—181	57—60	SA	1	
269	278—280	179—181	57—60	SC	1	
270	102—105			ME	3	4

I. táblázát folytatása

Példa	J	K	L	A	B	C
271	164—174	179—181	120—121	SD	1	
272	140—145			MF	3	2
273	128—131	179—181	185—180	S	4	
274	130—145	179—181	185—190	S	4	
275	üveg	179—181	185—190	S	4	
276	166—168	179—181	57—60	WW	1	
277	157—163			MG	3	244
278	125—130	179—181	57—60	SB	1	
279	125—140	179—181	57—60	ZZ	1	
280	179—180	179—181	57—60	SD	1	
281	162—175		176,5—178,5 ⁽¹⁾	S	1	
282	122—126	179—181	57—60	SE	1	
283	141—145			M	3	227
284	149—150	179—181	57—60	SF	1	
285	165—166	179—181	57—60	Y	1	
286	olaj	179—181	120—121	SG	1	
287	olaj	179—181	57—60	SH	1	
288	107—108	179—181	57—60	SJ	1	
289	85—91	179—181	57—60	SK	1	
290	113—117	179—181	57—60	T	1	
291	137—138	179—181	120—121	V	1	
292	50—100	179—181	57—60	SG	1	
293	194—196			M	3	227
294	195—196			MH	3	2
295	127—130			MJ	3	2
296	150—151	179—181	120—121	SF	1	
297	116—117	179—181	120—121	SH	1	
298	156—157			MK	3	2
299	99—105			M	3	227
300	147—148			M	3	227

Példa	R ¹	R ⁵	R ⁶	R ³	p	R ⁷	R ²	R ⁴
301	Cl	H	H	Me	3	H	H	—COOCH ₂ C(Me)=CH ₂
302	Cl	H	H	CF ₃	3	H	H	—COOCH ₂ C(Me)=CH ₂
303	Cl	H	H	CH ₂ Br	3	H	H	—COOCH ₂ CF ₃
304	Cl	H	H	CH ₂ Br	3	H	H	—COPr
305	Cl	H	H	CF ₃	3	H	H	—COOCH ₂ CH ₂ Cl
306	Cl	H	H	Me	3	H		együtt 3-(allil-oxi-metil)-1-oxo-2-oxa-tetrametilén
307	Cl	H	H	CF ₃	3	H	Me	—CSNHMe
308	Cl	H	H	Me	3	H	Me	—CSNMe ₂
309	Cl	H	H	Me	3	H	Me	—CSNHMe
310	Cl	H	H	CF ₃	3	H	Me	—CSNMe ₂
311	Cl	H	H	Me	3	H	Me	—CONHBu ^t
312	Cl	H	H	Me	3	H	Me	—COOC(Me ₂)C=CH
313	Cl	H	H	CF ₃	3	H	Prr	—CONH ₂
314	Cl	H	H	CF ₃	3	H	H	—COOCH ₂ Ph
315	Cl	H	H	Me	3	H	H	—COOCH ₂ —  OPh
316	Cl	H	H	Me	3	H	H	—COOC(Me)(Et)C=CH
317	Cl	H	H	CF ₃	3	H	H	—COOC(Me ₂)C=CH
318	Cl	H	H	CF ₃	3	H	H	—COOC(Me)(Et)C=CCH
319	Cl	H	H	CF ₃	3	H		együtt 3-(allil-oxi-metil)-1-oxo-2-oxa-tetrametilén
320	Cl	H	H	CF ₃	3	H	H	—CSNMe ₂
321	Cl	H	H	Me	3	H	H	—CSNMe ₂

I. táblázat folytatása

Példa	J	K	L	A	B	C
301	159—160	179—181	120—121	SL	1	
302	137—138	179—181	57—60	SL	1	
303	olaj	179—181	183—184	SA	4	
304	113—118	179—181	196—197 ²		4	
305	148—150			M	3	227
306	olaj	179—181	120—121	SN	1	
307	194—195	179—181	57—60	SO	1	
308	116—122	179—181	120—121	SP	1	
309	191—192	179—181	120—121	SO	1	
310	81	179—181	57—60	SP	1	
311	150—151	179—181	120—121	SQ	1	
312	164—166	179—181	120—121	SR	1	
313	olaj	179—181	57—60	ST	1	
314	139—140	179—181	57—60	V	1	
315	olaj	179—181	120—121	SU	1	
316	64—66	179—181	120—121	SV	1	
317	141—142	179—181	57—60	SR	1	
318	47—50	179—181	57—60	SV	1	
319	olaj	179—181	57—60	SN	1	
320	159—160	179—181	57—60	SN	1	
321	131—132	179—181	120—121	SN	1	

322. példa

A 4. példában kapott 4-klór-4'-(metil-szulfonil-oxi)-benzofenon-(etoxi-karbonil)-hidrazont nagynyomású folyadékkromatográfiával geometriai izomerjeivé választottuk szét. Az E-izomer olvadáspontja 160—161 °C; a Z-izomer olvadáspontja 152—156 °C.

323. példa

A 269. példában kapott vegyületet nátrium-karbonáttal semlegesítve a szabad bázist kapjuk; olvadáspontja 188—190 °C.

324. példa

A 322. példában kapott vegyületeket dimetil-szulfáttal és nátrium-hidriddel reagáltatva (E)-4-klór-4'-(metil-szulfonil-oxi)-benzofenon-N-(etoxi-karbonil)-N-metil-hidrazont (op. 105—106 °C) és a megfelelő Z-izomert kapjuk (op. 100—101 °C).

325. példa

A következő szereket állítottuk elő:

Nedvesíthető porkoncentrátum:

4. példa terméke	90 s%
Dyapol PT ^a	5,0 s%
Aerosol OT—B ^a	0,5 s%
kovasavgél	4,5 s%

Vízben diszpergálható koncentrátum:

4. példa terméke	15,0 s/tf %
Ethylan BV ¹	15,0 s/tf %
Ethylan C40 AH ²	15,0 s/tf %
Ciklohexanon	30,0 s/tf %
N-metil-pirrolidonnal kiegészítve	100,0 tf %-ra.

Vizes permetlé:

30	4. példa terméke	33,0 s/tf %
	Dyapol PT ^a	5,0 s/tf %
	Monolan PB ^a	0,25 s/tf %
	habzást gátló M30 ^a	0,5 s/tf %
35	Rhodopol 2%-os gél ^a	0,1 s/tf %
	vízzel kiegészítve	100,0 tf %-ra.

Olajos szuszpenzió:

40	4. példa terméke	33,0 s/tf %
	Dyapol PT ^a	1,0 s/tf %
	Ethylan ENTX ⁷	15,0 s/tf %
	Habzást gátló 411 ^a	0,5 s/tf %
45	könnyű, folyékony paraffinnal kiegészítve	100,0 tf %-ra.

Diszpergálható por:

50	4. példa terméke	50,0 súly %
	Dyapol PT ^a	10,0 súly %
	Aerosol OT—B ^a	0,5 súly %
	kovasavgél	10,0 súly %
	Polyviol M13/140 ¹⁰	2,0 súly %
	kaolin	27,5 súly %
55	1 nonil-fenol-etoxilát,	
	2 AH etoxilezett ricinusolaj,	
	3 krezol-szulfonsav és formaldehid kondenzációs termékének nátriumsója,	
	4 etilén-oxid és propilén-oxid kopolimer,	
60	5 szilikon alapú emulzió,	
	6 nagy molekulású poliszacharid,	
	7 alkil-tenol-etoxilát,	
	8 szilikon alapú emulzió,	
	9 nátrium-szulfoszekecsinsav-dioktilészter,	
65	10 polivinil-alkohol.	

326. példa

Ebben a példában a találmány szerint előállított vegyületeket hatóanyagként tartalmazó szerek rovarölő hatására utaló vizsgálatot ismertetjük a káposztamoly (*Plutella maculipennis*) lárváival szemben.

Tíz lárvát kémcsőbe helyeztünk, majd táplálékul a vizsgált vegyület oldatával átitatott és megszáritott 6,45 cm²-es káposztalevelet kaptak. 24 óra múlva táplálékul kezeletlen káposztalevelet kaptak, majd további 24 óra múlva meghatároztuk az elpusztult lárvák számát.

Mindegyik vegyületet 2–2 kísérletben vizsgáltuk, és különböző koncentrációjú oldatokat alkalmaztunk. Az eredményekből kiszámítottuk az LD₅₀ értékét. Az eredményeket a II. táblázatban ismertetjük.

II. táblázat: Hatástani adatok

Példa	LD ₅₀ (ppm)	Példa	LD ₅₀ (ppm)
1	13	36	500
2	33	37	100
3	14	38	25
4	13	39	110
5	27	40	100
6	190	41	21
7	27	42	50
8	50	43	270
9	16	44	24
10	110	45	13
11	27	46	18
12	33	47	43
13	91	48	50
14	11	49	37
15	33	50	100
16	190	51	16
17	<500	52	27
18	14	53	18
19	20	54	37
20	43	55	33
21	19	56	14
22	270	57	50
23	16	58	18
24	50	59	43
25	14	60	520
26	18	61	50
27	33	62	220
28	50	63	190
29	33	64	21
30	12	65	67
31	43	66	61
32	33	67	50
33	27	68	58
34	520	69	67
35	780	70	220
71	27	106	18
72	10	107	16
73	10	108	50
74	780	109	25
75	110	110	37
76	2000	111	2200
77	25	112	29
78	67	113	43

Példa	LD ₅₀ (ppm)	Példa	LD ₅₀ (ppm)
79	33	114	220
80	33	115	220
81	1900	116	50
82	1600	117	25
83	2,2	118	16
84	33	119	21
85	19	120	190
86	500	121	570
87	850	122	220
88	25	123	320
89	27	124	18
90	50	125	42
91	33	126	925
92	37	127	33
93	37	128	25
94	14	129	280
95	33	130	220
96	820	131	29
97	43	132	520
98	160	133	1100
99	59	134	110
100	50	135	18
101	1600	136	12
102	9	137	220
103	50	138	2200–5000
104	50	139	77
105	710	140	120
141	20	184	59
142	16	185	50
143	190	186	50
144	37	187	58
145	160	188	500
146	50	189	59
147	67	190	190
148	2200	191	>2500
149	37	192	31
150	13	193	2500
151	25	194	650
152	67	195	50
153	190	196	710
155	2200	197	550
156	2200	198	700
157	43	199	310
158	220	200	59
159	250	201	37
160	42	202	610
161	2000	203	67
162	100	204	43
163	190	205	1600
164	2500	206	780
165	27	207	1600
166	280	208	200
167	140	209	270
168	59	210	91
169	78	211	1600
170	140	212	37
171	77	213	50
172	50	214	710
173	110	215	100
174	190	216	2200
175	220	217	820
176	220	218	220
177	3000	219	220

II. táblázat folytatása

Példa	LD ₅₀ (ppm)	Példa	LD ₅₀ (ppm)
178	83	220	100
179	160	221	16
180	220	222	<500
181	160	223	100
182	210		
183	590	224	2200
		225	160
226	25	266	110
227	10	267	160
228	13	268	7
229	14	269	220
230	50	270	43
231	61	271	14
232	6	272	370
233	11	273	58
234	190	274	16
235	2	275	18
236	3	276	23
237	2	277	160
238	1	278	50
239	330	279	7
240	*	280	8
241	50	281	50
242	710	282	77
243	190	283	7
244	110	284	220
245	13	285	50
246	37	286	37
247	4	287	110
248	780	288	7
249	77	289	<100
250	570	290	5
251	2200	291	27
252	570	292	9
253	610	293	50
254	27	294	540
255	43	295	610
256	33	296	320
257	67	297	500
258	140	298	43
259	50	299	7
260	33	300	5
261	<100		
262	25		
263	42		
264	190		
265	190		
301	67		
302	6		
303	31		
304	<100		
305	2		
306	500		
307	11		
308	160		
309	37		
310	<100		
311	<100		
312	220		

*LD₅₀=41
döglégys ellen

Példa	LD ₅₀ (ppm)
313	8,2
314	7,7
315	37
316	43
317	33
318	21
319	59
320	43
321	500
322	12 (E-izomer)
	16 (Z-izomer)
323	67
324	50 (E-izomer)
	33 (Z-izomer)
metomil	130
(1-(metil-tio)-etilidén- -amino-N-metil-karbamát)	
Szabadalmi igénypontok	
1. Rovarirtó szer azzal jellemezve, hogy hatóanyagként 0,001—95 s% mennyiségben (I) általános képletű szubsztituált benzofenon-hidrazon-származékot tartalmaz — ebben a képletben	
m	értéke 0 és n értéke 0, vagy m értéke 1 és n értéke 0 vagy 1;
p	értéke 0, 2 vagy 3;
x	értéke 0 vagy 1;
R ¹	jelentése halogénatom, trifluor-metil-csoport, 1—4 szénatomos alkil-, 1—4 szénatomos alkoxi- vagy 1—4 szénatomos alkil-tio-csoport;
R ²	jelentése hidrogénatom, 1—4 szénatomos alkil-csoport (1—4 szénatomos alkoxi)-karbonil-csoport vagy (3—6 szénatomos cikloalkil)-metil-karbonil-csoport;
R ³	jelentése 2—3 szénatomos alkenilcsoport — adott esetben halogénatommal szubsztituált — 1—4 szénatomos alkilcsoport, N,N-di(1—2 szénatomos alkil)-amino-csoport vagy — adott esetben egy halogénatommal vagy egy metil-csoporttal szubsztituált — fenilcsoport;
R ⁴	jelentése hidrogénatom, 1—4 szénatomos alkilcsoport, karboxi-fenil-csoport, 2-imidazolil-csoport — hidrogén-bromiddal alkotott sója alakjában — (1—4 szénatomos alkil)-tio-karbonil-csoport —C—OR ⁵ általános képletű
	 O
	észtercsoport, —C—R ⁶ általános képletű acil-
	 O
	csoport, —C—NR ¹⁰ R ¹¹ általános képletű kar-
	 O
	bamoilcsoport vagy —C—NR ¹⁰ R ¹¹ általános
	 S
	képletű tiokarbamoilcsoport; az általános képletekben
R ⁵	jelentése naftilcsoport, 3—7 szénatomos cikloalkilcsoport — adott esetben egy halogénatommal vagy 1—4 szénatomos alkoxycsoport-

tal, legfeljebb két 1—4 szénatomos alkilcsoporttal szubsztituált — fenilcsoport, 1—12 szénatomos alkilcsoport, 2—6 szénatomos alkenilcsoport, 3—6 szénatomos alkinilcsoport, 2—5 halogénatommal helyettesített 1—6 szénatomos alkilcsoport, ciano-, hidroxi-, 1—4 szénatomos alkoxi-, 2—6 szénatomos alkanoil-oxi-, N-(1—4 szénatomos alkil)-karbamoil-oxi-, 3—6 szénatomos cikloalkil- vagy fenilcsoporttal monoszubsztituált 1—4 szénatomos alkilcsoport;

R⁹ jelentése hidrogénatom, naftil-, furil-, tienil-, piridil-, morfolino-, karbamoil-, etoxi-karbonil-, 3—7 szénatomos cikloalkilcsoport — adott esetben egy nitro-, fenil-, 1—4 szénatomos alkil-tio-, N,N-di(1—4 szénatomos alkil)-amino- vagy halogén-(1—4 szénatomos alkil)-csoporttal vagy legfeljebb két halogénatommal, 1—4 szénatomos alkil- vagy 1—4 szénatomos alkoxicsoporthal szubsztituált — fenilcsoport; 1—12 szénatomos alkilcsoport, 2—10 szénatomos alkenilcsoport, halogén-(1—6 szénatomos alkil)-csoport; — adott esetben a fenilgyűrűn halogénatommal monoszubsztituált — sztirilcsoport; hidroxicsoporthal, 1—4 szénatomos alkoxicsoporthal, karboxilcsoporttal, karboxi-metoxi-csoporttal vagy 3—6 szénatomos cikloalkilcsoporttal egyszerűen — adott esetben halogénatommal monoszubsztituált — fenilcsoporttal egyszerűen vagy — adott esetben halogénatommal, nitro- vagy 1—4 szénatomos alkoxicsoporthal monoszubsztituált — fenoxicsoporthal egyszerűen szubsztituált 1—4 szénatomos alkilcsoport;

R¹⁰ és **R¹²** jelentése egymástól függetlenül hidrogénatom vagy 1—4 szénatomos alkilcsoport;

R¹¹ jelentése hidrogénatom, — adott esetben halogénatommal vagy etoxi-karbonil-csoporttal monoszubsztituált — 1—4 szénatomos alkilcsoport, fenilcsoport, vagy halogénatommal szubsztituált 2—4 szénatomos alkanoilcsoport;

R² és **R⁴** együtt adott esetben egy oxigénatommal megszakított 4—6 tagú aklilén-csoportot is jelenthet, amely az oxigénatom melletti szénatomon egy alil-oxi-metil-csoporttal és/vagy egy oxocsoporttal lehet helyettesítve;

R⁵ és **R⁷** egymástól függetlenül halogénatomot, vagy 1—4 szénatomos alkilcsoportot jelent, és **R¹** és **R⁵** együtt a fenilgyűrűvel naftilcsoportot is képezhet,

azzal a megszorítással, hogy ha **p** értéke 0, **R²** vagy **R⁴** hidrogénatomtól eltérő jelentésű — szilárd vagy folyékony hordozó-, illetve hígítóanyag — előnyösen mesterséges vagy természetes ásványi őrlemény, ásványolaj-frakció, alifás, aromás vagy ciklusos szénhidrogén — és felületaktív adalék — előnyösen anionos vagy nemionos diszpergáló-, emulgeáló- és nedvesítőszer — legalább egyikével együtt. (Elsőbbsége: 1979. február 28.)

2. Az 1. igénypont szerinti rovarirtó szer kiviteli alakja azzal jellemezve, hogy hatóanyagként olyan (I) általános képletű szubsztituált benzofenon-hidrazon-származékot tartalmaz, amelynek képle-

tében **m** értéke 1, **n** értéke 0, **x** értéke 0, **p**, **R¹**, **R²**, **R³** és **R⁴** az 1. igénypontban megadott. (Elsőbbsége: 1979. február 28.).

3. Az 1. vagy 2. igénypont szerinti rovarirtó szer kiviteli alakja azzal jellemezve, hogy hatóanyagként olyan (I) általános képletű szubsztituált benzofenon-hidrazon-származékot tartalmaz, amelynek képletében **R¹** klóratom, **m**, **n**, **p**, **x**, **R²**, **R³**, **R⁴**, **R⁵** és **R⁷** az 1. igénypontban megadott. (Elsőbbsége: 1979. február 28.)

4. Az 1—3. igénypontok bármelyike szerinti rovarirtó szer kiviteli alakja azzal jellemezve, hogy hatóanyagként olyan (I) általános képletű szubsztituált benzofenon-hidrazon-származékot tartalmaz, amelynek képletében **p** értéke 0, **R⁴**, **R⁵**, **XCO-** általános képletű észter- vagy tioészter-csoportot vagy **R'CO-** általános képletű acilcsoportot jelent, **R¹**, **R²**, **R³**, **R⁵**, **R⁷**, **R⁸**, **R⁹**, **m**, **n** és **x** az 1. igénypontban megadott. (Elsőbbsége: 1979. február 28.)

5. Az 1. igénypont szerinti rovarirtó szer kiviteli alakja azzal jellemezve, hogy hatóanyagként olyan (I) általános képletű szubsztituált benzofenon-hidrazon-származékot tartalmaz, amelynek képletében **m** értéke 1, **n** értéke 0, **x** értéke 0, **p** értéke 0, **R¹** halogénatomot, **R²** hidrogénatomot, **R⁴**, **R⁵**, **R⁶** általános képletű acilcsoportot vagy (1—12 szénatomos alkoxi)-karbonil-csoportot és **R³** 1—4 szénatomos alkilcsoportot jelent, **R⁹** az 1. igénypontban megadott. (Elsőbbsége: 1978. március 1.)

6. Az 1—3. igénypontok bármelyike szerinti rovarirtó szer kiviteli alakja azzal jellemezve, hogy hatóanyagként olyan (I) általános képletű szubsztituált benzofenon-hidrazon-származékot tartalmaz, amelynek képletében **p** értéke 3, **R¹**, **R²**, **R³**, **R⁴**, **R⁵**, **R⁷**, **m**, **n** és **x** az 1. igénypontban megadott jelentésű. (Elsőbbsége: 1979. február 28.)

7. Az 1. igénypont szerinti rovarirtó szer kiviteli alakja azzal jellemezve, hogy hatóanyagként olyan (I) általános képletű szubsztituált benzofenon-hidrazon-származékot tartalmaz, amelynek képletében **p** értéke 3, **x** értéke 0, **R²** hidrogénatomot, **R¹** és **R⁵** halogénatomot, **R⁴** hidrogénatomot, **R⁶**, **R⁷** általános képletű acilcsoportot vagy (1—12 szénatomos alkoxi)-karbonilcsoportot és **R³** 1—4 szénatomos alkilcsoportot, adott esetben halogénatommal vagy metilcsoporttal szubsztituált fenilcsoportot jelent, **R⁹** az 1. igénypontban megadott. (Elsőbbsége: 1978. március 1.)

8. A 6. igénypont szerinti rovarirtó szer kiviteli alakja azzal jellemezve, hogy hatóanyagként olyan (I) általános képletű szubsztituált benzofenon-hidrazon-származékot tartalmaz, amelynek képletében **R³** adott esetben halogénatommal szubsztituált 1—4 szénatomos alkilcsoport, **p** értéke 3, **m**, **n**, **x**, **R¹**, **R²**, **R⁴**, **R⁵** és **R⁷** az 1. igénypontban megadott. (Elsőbbsége: 1979. február 28.)

9. A 8. igénypont szerinti rovarirtó szer kiviteli alakja azzal jellemezve, hogy hatóanyagként olyan (I) általános képletű szubsztituált benzofenon-hidrazon-származékot tartalmaz, amelynek képletében **p** értéke 3, **R³** metil-csoportot jelent, **R¹**, **R²**, **R⁴**, **R⁵**, **R⁷**, **m**, **n** és **x** az 1. igénypontban megadott. (Elsőbbsége: 1979. február 28.)

10. Az 1—9. igénypontok bármelyike szerinti rovarirtó szer kiviteli alakja azzal jellemezve, hogy

hatóanyagként olyan (I) általános képletű szubsztituált benzofenon-hidrazon-származékot tartalmaz, amelynek képletében R^2 hidrogénatom és R^4 hidrogénatomtól eltérő, az 1. igénypontban megadott jelentésű, R^1 , R^3 , R^5 , R^7 , m , n , p és x az 1. igénypontban megadott. (Elsőbbsége: 1979. február 28.)

11. A 10. igénypont szerinti rovarirtó szer kiviteli alakja azzal jellemezve, hogy hatóanyagként olyan (I) általános képletű szubsztituált benzofenon-hidrazon-származékot tartalmaz, amelynek képletében R^2 hidrogénatom és R^4 $R^s(O)_qCO$ - általános képletű csoport, amelyben q értéke 0 vagy 1, R^s 1—4 szénatomos alkilcsoport, amely halogénatommal, 1—4 szénatomos alkoxycsoporttal, 3—6 szénatomos cikloalkilcsoporttal, fenilcsoporttal lehet szubsztituálva; 3—7 szénatomos cikloalkilcsoport; 2—6 szénatomos alkenilcsoport vagy fenilcsoport, és ha q értéke 0, R^s hidrogénatomot is jelenthet, R^1 , R^3 , R^5 , R^7 , m , n , p és x az 1. igénypontban megadott. (Elsőbbsége: 1979. február 28.)

12. Az 1. igénypont szerinti rovarirtó szer kiviteli alakja azzal jellemezve, hogy hatóanyagként 4-klór-4'-(metil-szulfonil-oxi)-benzofenon-formilhidrazont, 4-klór-4'-(metil-szulfonil-oxi)-benzofenon-pentanoilhidrazont, 4-klór-4'-(metil-szulfonil-oxi)-benzofenon-(etoxi-karbonil)-hidrazont, 4-klór-4'-(metil-szulfonil-oxi)-benzofenon-ciklopentilhidrazont, 4-klór-4'-(metil-szulfonil-oxi)-benzofenon-(2,2-dimetil-propanoil)-hidrazont, 4-klór-4'-(metil-szulfonil-oxi)-benzofenon-(heptafluor-butiril)-hidrazont, 4-klór-4'-(metil-szulfonil-oxi)-benzofenon-(4-klór-benzoil)-hidrazont, 4-klór-4'-(metil-szulfonil-oxi)-benzofenon-(3-klór-benzoil)-hidrazont, 4-klór-4'-(metil-szulfonil-oxi)-benzofenon-benzoilhidrazont, 4-klór-4'-(metil-szulfonil-oxi)-benzofenon-(4-fluor-benzoil)-hidrazont, 4-klór-4'-(metil-szulfonil-oxi)-benzofenon-(3-fluor-benzoil)-hidrazont, 4-klór-4'-(metil-szulfonil-oxi)-benzofenon-(3,4-diklór-benzoil)-hidrazont, 4-klór-4'-(metil-szulfonil-oxi)-benzofenon-(4-trifluor-metil-benzoil)-hidrazont, 4-klór-4'-(trifluor-metil-szulfonil-oxi)-benzofenon-(etoxi-karbonil)-hidrazont,

4-klór-4'-(metil-szulfonil-oxi)-benzofenon-4-metil-szemikarbazont,

4-bróm-4'-(metil-szulfonil-oxi)-benzofenon-szemikarbazont,

5 4-klór-4'-(metil-szulfonil-oxi)-benzofenon-szemikarbazont,

4-klór-4'-(metil-szulfonil-oxi)-benzofenon-(izopropoxi-karbonil)-hidrazont vagy

10 4-klór-4'-(metil-szulfonil-oxi)-benzofenon-(fenoxi-karbonil)-hidrazont tartalmaz. (Elsőbbsége: 1979. február 28.)

13. Eljárás az (I) általános képletű szubsztituált benzofenon-hidrazon-származékok előállítására — ebben a képletben R^1 , R^3 , R^5 , R^7 , m , n , p és x az 1. igénypontban megadott jelentésű — azzal jellemezve, hogy

15 a) egy (II) általános képletű szubsztituált benzofenont — R^1 , R^3 , R^5 , R^7 , m , n , x és p a fenti — egy $NH_2NR^2R^4$ általános képletű hidrazin-származékkal — R^2 és R^4 a fenti — reagáltatunk, és ha a kapott vegyületben R^4 hidrogénatom, továbbá (i)

20 p értéke 0, a kapott vegyületet acilezzük, vagy ha (ii) p értéke 2 vagy 3, a kapott vegyületet kívánt esetben acilezzük, és az acilezést

25 a₁) olyan (I) általános képletű vegyület előállítására, amelynek képletében R^4 R^sCO - általános képletű acilcsoport — R^s a fent megadott — megfelelő savhalogeniddel vagy savanhidriddel;

30 a₂) olyan (I) általános képletű vegyület előállítására, amelynek képletében R^4 R^sXCO - általános képletű csoport — R^s és X a fent megadott — megfelelő klór-hangyasav-észterrel vagy klór-tiohangyasav-észterrel;

35 a₃) olyan (I) általános képletű vegyület előállítására, amelynek képletében R^4 $CONR^{10}R^{11}$ általános képletű karbamoil-csoport — R^{10} és R^{11} a fent megadott — vagy N-(1—4 szénatomos alkil)- vagy

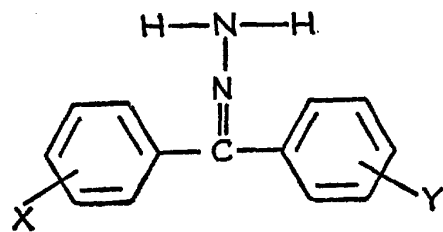
40 N,N-di(1—4 szénatomos alkil)-tiokarbamoil-csoport, megfelelő izocianáttal vagy izotiocianáttal végezzük, vagy

b) olyan (I) általános képletű vegyületek előállítására, amelyek képletében p értéke 3, egy (IV) általános képletű szubsztituált benzofenon-hidrazon-származékot — R^1 , R^3 , R^5 , R^7 , m , n és x a fent megadott, de R^4 hidrogénatomtól eltérő — egy R^3SO_2Y általános képletű szulfonil-halogeniddel —

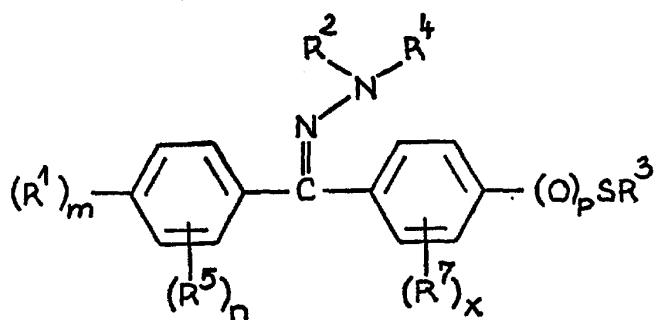
45 R^3 a fenti, Y halogénatom — reagáltatunk. (Elsőbbsége: 1979. február 28.)

50

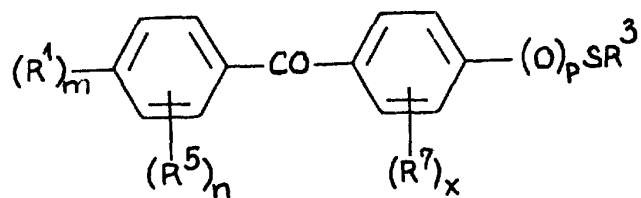
6 rajz



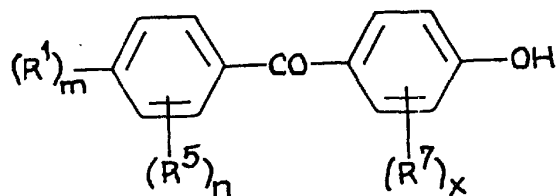
a



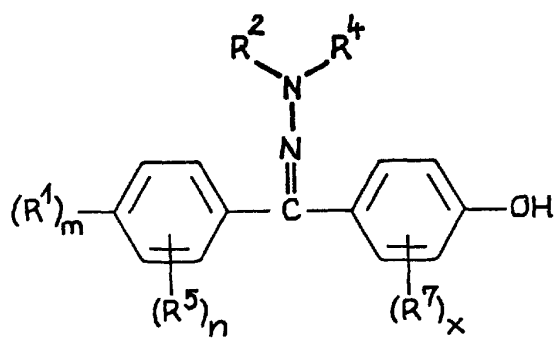
I



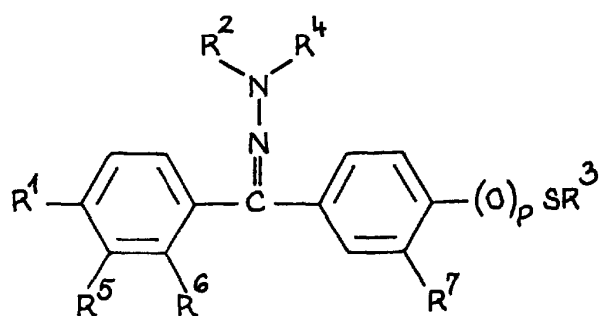
II



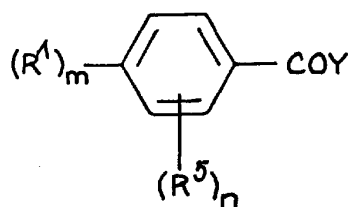
III



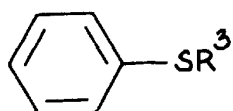
IV



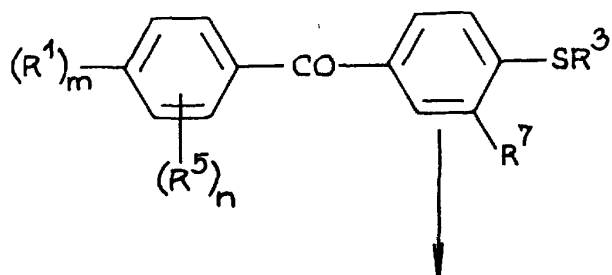
V



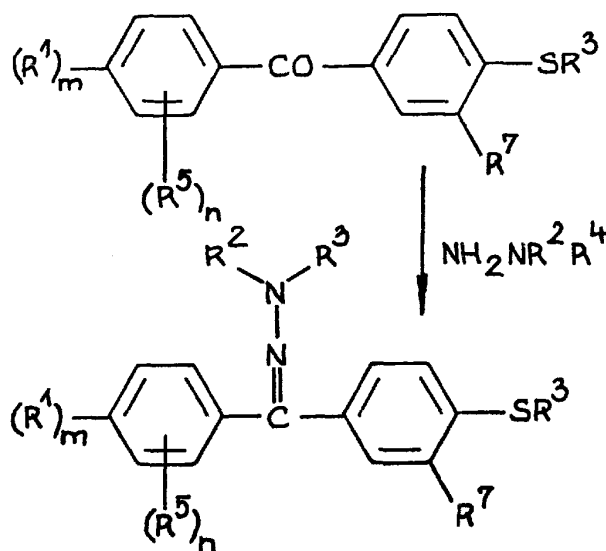
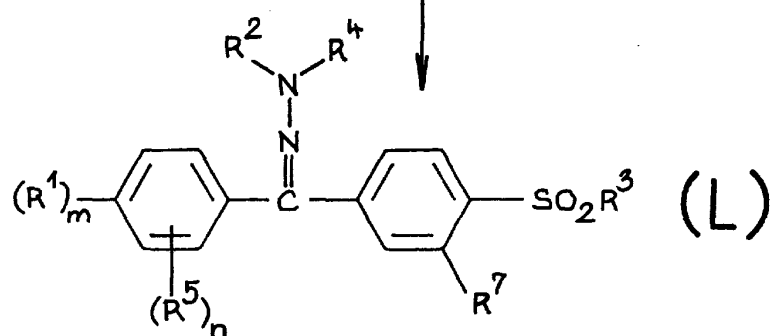
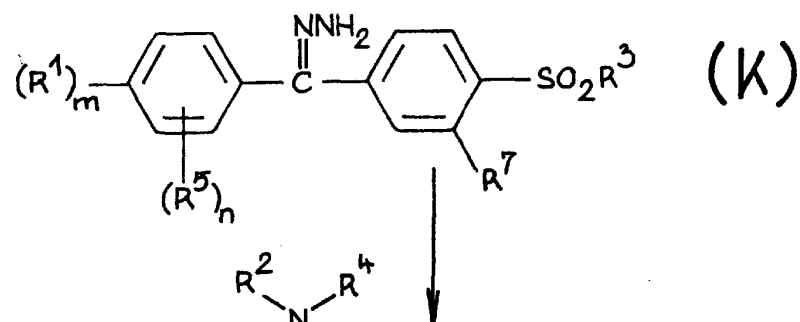
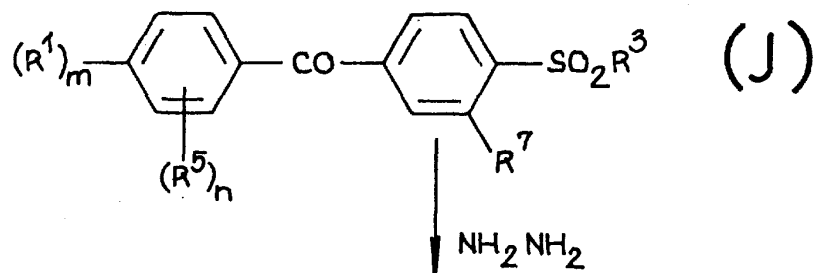
b



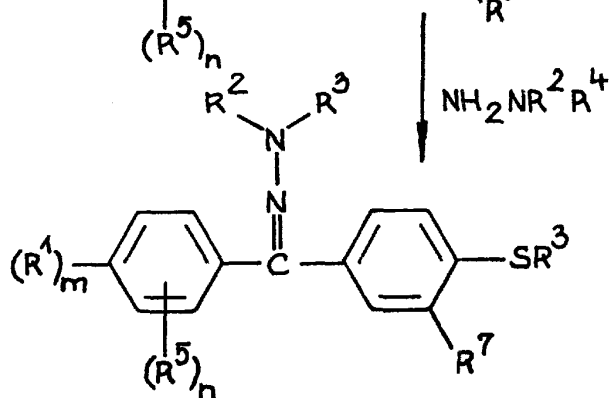
c

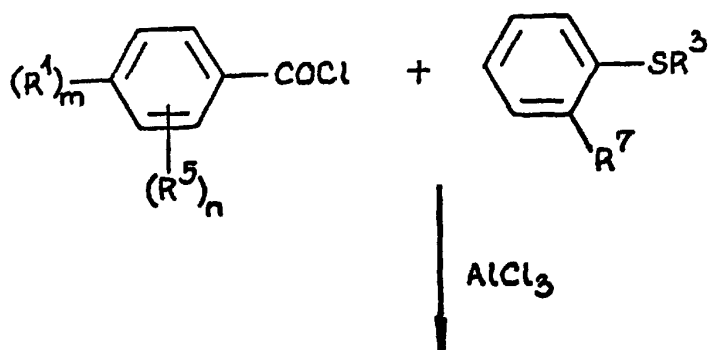


[6]

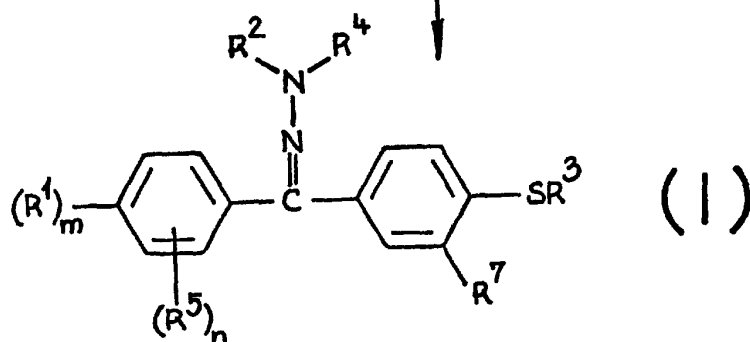
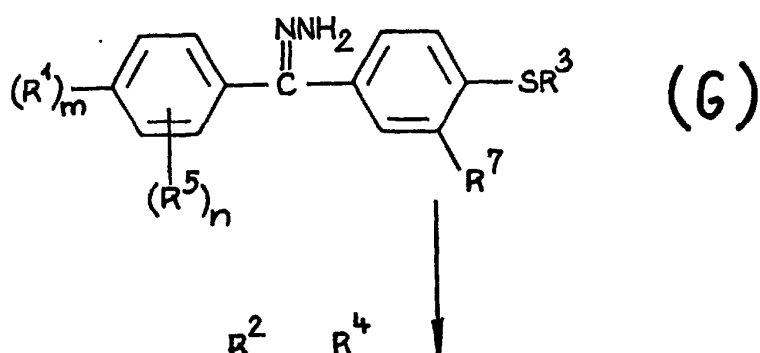
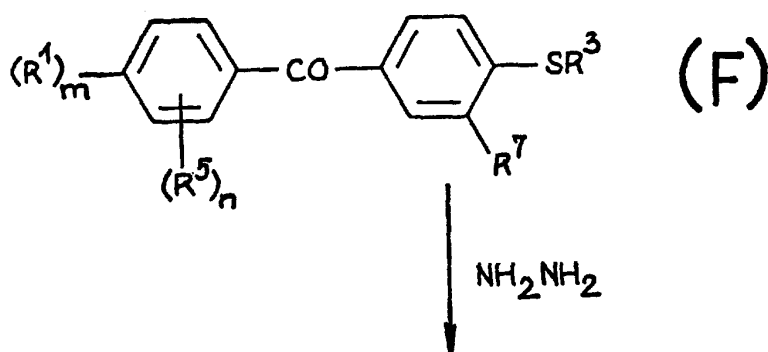


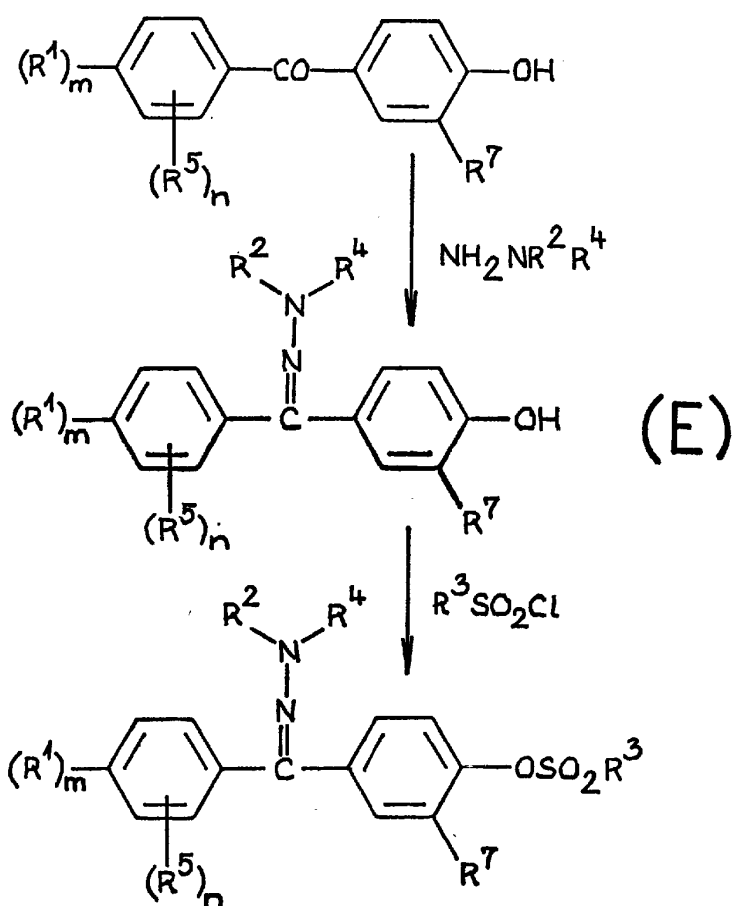
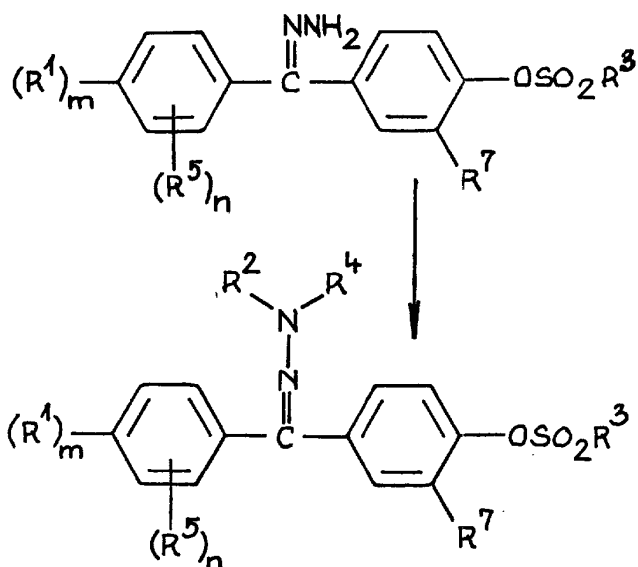
[7]

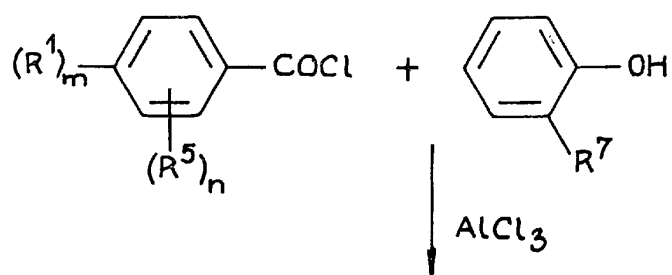




[5]







[1]

