



(19) Republik
Österreich
Patentamt

(11) Nummer: AT 395 507 B

(12)

PATENTSCHRIFT

(21) Anmeldenummer: 15/89

(51) Int.Cl.⁵ : A01N 43/08

(22) Anmeldetag: 13. 6.1984

(42) Beginn der Patentdauer: 15. 6.1992

(45) Ausgabetag: 25. 1.1993

(62) Ausscheidung aus Anmeldung Nr.: 1929/84

(30) Priorität:

17. 6.1983 US 505169 beansprucht.
9. 5.1984 US 607610 beansprucht.

(73) Patentinhaber:

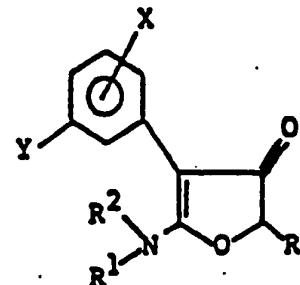
CHEVRON RESEARCH COMPANY
SAN FRANCISCO (US).

(56) Entgegenhaltungen:

US-A-4441910

(54) UNKRAUTVERNICHUNGSMITTEL

(57) Unkrautvernichtungsmittel, bei welchem eine herbizid wirksame Menge einer Verbindung der Formel (I) mit einem geeigneten Trägerstoff vermischt wird.



B
AT 395 507 B

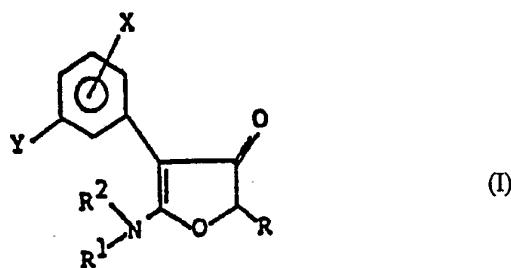
Die Erfindung bezieht sich auf ein Unkrautvernichtungsmittel, welches erfindungsgemäß dadurch gekennzeichnet ist, daß es einen geeigneten Trägerstoff und eine herbizid wirksame Menge einer Verbindung der Formel

5

10

15

20



enthält, in welcher R niederes Alkyl, Cycloalkyl mit 3 bis 7 Kohlenstoffatomen, niederes Alkenyl, Haloalkyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen und 1 bis 3 Halogenatomen aus jeweils einem Element der Gruppe Fluor, Chlor, Brom oder Jod; Haloalkenyl mit 2 bis 4 Kohlenstoffatomen und 1 bis 3 Halogenatomen aus jeweils einem Element der Gruppe Fluor, Chlor, Brom oder Jod; niederes Alkoxy; niederes Alkylthio; niederes Alkoxyalkyl, dessen Alkyl- und Alkoxykomponenten unabhängig voneinander 1 bis 3 Kohlenstoffatome aufweisen; Alkylthioalkyl, dessen Alkylkomponenten jeweils 1 bis 3 Kohlenstoffatome aufweisen; Phenyl, Naphth-1-yl, Inden-1-yl; 4-Fluorphenyl; Arylalkylen mit 1 bis 3 Kohlenstoffatomen in der Alkylenkomponente, wobei die Arylkomponente Phenyl, Naphth-1-yl oder Inden-1-yl ist; oder ein substituiertes Aryl oder substituiertes Arylalkylen aus der Gruppe der Formeln

25

30

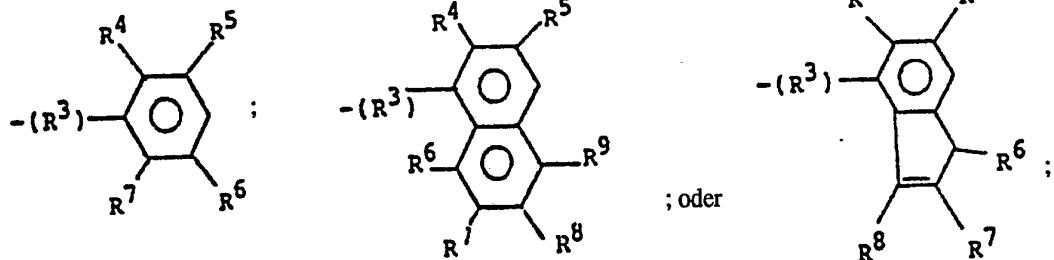
35

40

45

50

55



ist, worin einer, zwei oder drei der Substituenten R⁴, R⁵, R⁶, R⁷, R⁸ und R⁹ jeweils ein Element aus der Gruppe niederes Alkyl, niederes Alkoxy, Halogen, Nitro oder Haloalkyl mit 1 bis 3 Kohlenstoffatomen und 1 bis 3 Halogenatomen, die gleich oder verschieden sein können, und der Rest Wasserstoff ist und worin R³ eine Einfachbindung oder Alkylen mit 1 bis 3 Kohlenstoffatomen ist; R¹ Wasserstoff oder Alkyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen; R² Wasserstoff, Alkyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen, Alkenyl mit 3 oder 4 Kohlenstoffatomen, niederes Alkoxy carbonylalkyl, niederes Alkoxyalkyl oder niederes Alkylthioalkyl ist; R¹ und R² zusammen mit dem Stickstoffatom, mit dem sie verbunden sind, einen gesättigten oder ungesättigten Stickstoff-Heterozyklus mit 3 bis 6 Ringatomen, von denen eines Stickstoff und die übrigen Kohlenstoffatome sind, bilden; X Wasserstoff, niederes Alkyl, niederes Alkoxy, Halogen oder Trifluormethyl ist und an jeder beliebigen Stelle des Phenylringes stehen kann, und Y niederes Alkyl, niederes Alkoxy, Halogen, niederes Haloalkyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen und 1 bis 3 Halogenatomen, die gleich oder verschieden sein können, niederes Haloalkyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen und 1 bis 3 Halogenatomen, die gleich oder verschieden sein können, oder niederes Haloalkylthio mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen und 1 bis 3 Halogenatomen, die gleich oder verschieden sein können, ist, vorausgesetzt, daß, wenn Y Halogen ist, R, R¹ und R² nicht alle Wasserstoff sind, und weiter vorausgesetzt, daß, wenn Y nicht Trifluormethyl und X nicht Wasserstoff ist und R¹ und R² jeweils Wasserstoff sind, R Methyl, Äthyl, Propyl, 2-Halophenyl, 2-Niederalkylphenyl oder 4-Fluorphenyl ist, sowie geeignete Salze derselben, oder Mischungen dieser Verbindungen mit dem Trägerstoff enthält.

Solche Unkrautvernichtungsmittel besitzen sowohl prä- als auch postemergente herbizide Wirksamkeit, wobei eine besonders gute präemergente Herbizidwirkung bei einer Vielzahl von breitblättrigen Unkräutern sowie Unkrautgräsern erzielt wurde. Bei geringeren Dosierungsmengen besitzen die erfindungsgemäßen Verbindungen auch das Pflanzenwachstum regulierende Eigenschaften.

Man hat auch gefunden, daß durch Vorhandensein eines 3-Trifluormethylsubstituenten in der 4-Phenylgruppe der Verbindungen der vorliegenden Erfindung die herbizide Wirksamkeit im allgemeinen wesentlich erhöht wird. Gemäß der vorliegenden Erfindung wird auch ein Verfahren geschaffen, nach dem unerwünschtes Pflanzen-

wachstum verhindert oder kontrolliert wird und welches dadurch gekennzeichnet ist, daß das Wachstumsmedium und/oder die Blätter solcher Pflanzen mit einer herbizid wirksamen Menge der Verbindung(en) der Formel I und/oder geeigneter Salze derselben behandelt werden.

5 Gemäß einem weiteren Aspekt der vorliegenden Erfindung wird ein das Pflanzenwachstum regulierender Stoff geschaffen, der aus einem geeigneten Trägerstoff und einer das Pflanzenwachstum regulierenden Menge der Verbindung der Formel I, von geeigneten Salzen oder Mischungen derselben besteht, welche Menge ausreicht, um den normalen Wachstumsverlauf solcher Pflanzen zu verändern.

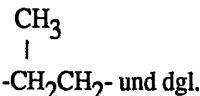
10 Gemäß der vorliegenden Erfindung wird auch eine Methode zur Regulierung des Pflanzenwuchses geschaffen, welche darin besteht, daß das Wachstumsmedium und/oder die Blätter solcher Pflanzen mit einer auf die Pflanzen wachstumsregulierend wirkenden Menge der Verbindung(en) der Formel I und/oder geeigneter Salze derselben behandelt werden, welche Menge ausreicht, um den normalen Wachstumsverlauf dieser Pflanzen zu verändern.

Definitionen:

15 Die nachfolgend aufgezählten, im vorliegenden Text verwendeten Ausdrücke haben folgende Bedeutung, wenn nicht ausdrücklich etwas anderes angegeben ist:

Der Begriff „niederes Alkyl“ bezieht sich auf Alkylgruppen mit sowohl gerader als auch verzweigter Kohlenstoffkette mit insgesamt 1 bis 4 Kohlenstoffatomen und umfaßt primäre, sekundäre und tertiäre Alkylgruppen. Beispiele für typische niedere Alkyle sind Methyl, Äthyl, n-Propyl, Isopropyl, n-Butyl, t-Butyl.

20 Der Begriff „Alkylen“ bezieht sich auf sowohl gerad- als auch verzweigtetige Alkylengruppen, wie z. B. -CH₂;-
-CH₂CH₂- und dgl.



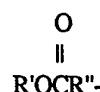
25 „Niederes Alkoxy“ bezieht sich im vorliegenden Text auf die Gruppe -OR', worin R' niederes Alkyl ist.

„Niederes Alkylthio“ bezieht sich auf die Gruppe -SR', worin R' niederes Alkyl ist.

„Niederes Alkoxyalkyl“ bezieht sich auf die Gruppe R'OR"-, worin R' und R" unabhängig voneinander gerad- oder verzweigtetige Alkylgruppen mit 1 bis 3 Kohlenstoffatomen sind.

30 Der Ausdruck „niederes Alkylthioalkyl“ bezieht sich auf die Gruppe R' SR"-, worin R' und R" jedes für sich gerad- oder verzweigtetige Alkylgruppen mit 1 bis 3 Kohlenstoffatomen sind.

Der Begriff „niederes Alkoxy carbonylalkyl“ bezieht sich auf die Gruppe



35 worin R' niederes Alkyl und R" Alkylen mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen ist, die gerad- oder verzweigtetig sein können. Typische Alkoxy carbonylalkylgruppen sind beispielsweise -CH₂C(O)OCH₃; -CH(CH₃)C(O)CC₂H₅ und dgl.

40 „Halogen“ bezieht sich auf die Gruppe Fluor, Chlor, Brom und Jod.

„Niederes Haloalkyl“ bezieht sich auf Halogenalkylverbindungen mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen und 1 bis 3 Halogenatomen aus der Gruppe Fluor, Chlor, Brom und Jod. Vorzugsweise hat die niedere Halogenalkylgruppe 1 oder 2 Kohlenstoffatome.

45 Der Ausdruck „niederes Haloalkoxy“ bezieht sich auf „Niederalkoxy“-Gruppen mit 1 bis 3 Halogenatomen aus einem der Elemente Fluor, Chlor, Brom oder Jod.

„Aryl“ bezieht sich auf Arylgruppen mit 6 bis 10 Kohlenstoffatomen, beispielsweise Phenyl, Naphthyl, Indenyl. In charakteristischer Weise wird als Arylgruppe Phenyl oder Naphthyl verwendet werden, da Verbindungen mit solchen Gruppen viel leichter im Handel erhältlich sind als andere Arylverbindungen.

50 Der Ausdruck „substituiertes Aryl“ bezieht sich auf Arylgruppen mit 1 bis 3 Substituenten jeweils aus der Gruppe niederes Alkyl, niederes Alkoxy, Halonitro oder Haloalkyl mit 1 bis 3 Kohlenstoffatomen und 1 bis 3 Halogenatomen. Typische substituierte Arylgruppen sind beispielsweise 2-Fluorphenyl; 2-Chlorphenyl; 2,6-Dimethylphenyl; 4-Fluorphenyl; 2-Methylphenyl; 2-Chlor, 3-chlormethylphenyl; 2-Nitro,5-methylpheyl; 2,6-Dichlorphenyl; 3-Trifluormethylphenyl; 2-Methoxyphenyl; 2-Bromonaphth-1-yl; 3-Methoxyinden-1-yl, und dgl.

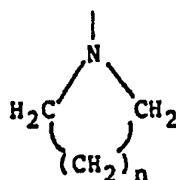
55 Der Ausdruck „Arylalkylen“ bezieht sich auf die Gruppe ArR³-, worin Ar Aryl und R³ Alkylen mit 1 bis 3 Kohlenstoffatomen ist, und umfaßt sowohl gerad- als auch verzweigtetige Alkylene wie z. B. Methylen, Äthyl, 1-Methyläthyl und Propyl.

Der Ausdruck „(substituiertes Aryl)alkylen“ oder „Ring-substituiertes Arylalkylen“ bezieht sich auf die Gruppe $\text{Ar}'\text{R}^3$ -, worin Ar' substituiertes Aryl und R^3 Alkylen gemäß der Definition für „Arylalkylen“ ist.

Der Ausdruck „substituierter Stickstoff-Heterocyclus“, wie er im vorliegenden Text für R^1 und R^2 der Formel I verwendet wird, bezieht sich auf die Gruppe der Formeln

5

10

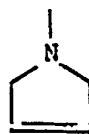


worin n 1, 2 oder 3 ist.

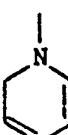
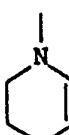
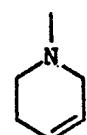
Der Begriff „ungesättigter Stickstoff-Heterocyclus“, wie er im vorliegenden Text für R^1 und R^2 der Formel I verwendet wird, bezieht sich auf die Gruppen der Formeln

15

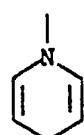
20



25



und



Der Begriff „geeignetes Salz“ bezieht sich auf Salze, die die herbiciden Eigenschaften der Stammverbindung nicht nennenswert verändern. Geeignete Salze sind u. a. Kationensalze, wie z. B. die Kationsalze von Lithium, Natrium, Kalium, Erdalkalimetalle, Ammoniak, aurternäre Ammoniumsalze, und dgl.

Der Begriff „Raumtemperatur“ bezieht sich auf etwa 20-25 °C.

Die Verbindungen der Formel I zeigen sowohl vor- als auch nachemergente Herbicidwirkung, wobei die voremergente Herbicidwirkung besonders gut ist.

Im allgemeinen wird bei Anwendung nach dem Pflanzenaustrieb die Herbicidverbindung direkt auf die Blätter oder andere Teile der Pflanze aufgebracht. Bei Anwendung vor dem Austrieb werden die Herbicidverbindungen auf das Wachstumsmedium bzw. das vorgesehene Wachstumsmedium der Pflanze aufgebracht. Die optimale Menge an Herbicidverbindung oder -gemisch variiert je nach Pflanzensorte und Stärke des Pflanzenwuchses, wenn überhaupt ein solcher stattfindet, und hängt weiters davon ab, welcher Teil der Pflanze mit dem Herbicid in Berührung kommt und in welchem Ausmaß. Die optimale Dosierungsgröße kann auch je nach Standort oder Umgebung (z. B. überdachte Fläche wie z. B. Treib- oder Glashäuser im Gegensatz zu exponierten Flächen wie Felder etc.) und Art und Ausmaß der gewünschten Hemmwirkung verschieden sein. Im allgemeinen werden sowohl für vor- als auch für nachemergente Unkrautvernichtung die Verbindungen der vorliegenden Erfindung in Mengen von etwa 0,02 bis 60 kg/ha, vorzugsweise etwa 0,02 bis 10 kg/ha, aufgebracht.

Die Verbindungen werden, obwohl sie theoretisch auch unverdünnt verwendet werden können, in der Praxis im allgemeinen als Gemisch aus einer wirksamen Menge der Verbindung(en) und einem geeigneten Trägerstoff angewendet. Geeignet (d. h. landwirtschaftlich unbedenklich) ist ein Trägerstoff dann, wenn er die durch die Wirkstoffverbindungen erzielte gewünschte biologische Wirkung nicht beeinträchtigt, also höchstens eine Verdünnung der Verbindungen bewirkt. In charakteristischer Weise enthält so ein Gemisch etwa 0,05 bis 95 Gew.% der Verbindung der Formel I oder von Mischungen derselben. Es können auch Konzentrate von hoher Konzentration hergestellt werden, die dann vor Anwendung verdünnt werden müssen. Der Trägerstoff kann fest, flüssig oder ein Aerosol sein. Die eigentlichen Wirkstoffgemische können als Granulat, Pulver, Staub, Lösungen, Emulsionen, Aufschlämmung, Aerosol, etc. verwendet werden.

Geeignete feste Trägerstoffe sind z. B. natürliche Tone (wie z. B. Kaolin, Attapulgit, Montmorillonit, etc.), Talcum, Pyrophyllit, Kieselgur, synthetischer Kieselsand, Kalziumaluminumsilikat, Tricalciumphosphat, und dgl. Auch organische Stoffe wie z. B. gemahlene Nußschalen, die äußere Hülle des Baumwollsamens, Weizenmehl, Sägemehl, Rindenmehl, und dgl. können als Trägerstoffe verwendet werden. Geeignete flüssige Streckungsmittel sind beispielsweise Wasser, organische Lösungsmittel (z. B. Kohlenwasserstoffe wie Benzol, Toluol, Dimethylsulfoxid,

Kerosin, Dieselöl, Heizöl, Schwerbenzin, etc.) und dgl. Geeignete Aerosole sind z. B. alle herkömmlichen Aerosolträgerstoffe, wie z. B. halogenierte Alkane, etc.

Das Gemisch kann auch verschiedene Katalysatoren und oberflächenaktive Stoffe enthalten, die die Zufuhr der wirksamen Substanz in das Pflanzengewebe beschleunigen, wie z. B. organische Lösungsmittel, Netzmittel und Öle, sowie bei Gemischen, die für voremergente Anwendung bestimmt sind, Stoffe, die das Versickern der Verbindung im Boden verhindern bzw. die Erdstabilität der Verbindung erhöhen.

Das Gemisch kann auch verschiedene geeignete Adjuvantien, Stabilisatoren, Bodenverbesserer, Insekticide, Fungicide und gegebenenfalls andere herbicid wirksame Verbindungen enthalten.

In geringeren Dosierungsmengen können die Verbindungen der vorliegenden Erfindung auch das Pflanzenwachstum regulierende Eigenschaften entwickeln und so zur Beeinflussung des normalen Wachstumsverlaufes von Grünpflanzen verwendet werden.

Die Verbindungen der Formel I können als Pflanzenwuchsregulantien in reiner Form verwendet werden, in der Praxis werden sie jedoch wie bei Anwendung als Unkrautvernichter in Verbindung mit einem Trägerstoff verwendet werden. Hiefür können die gleichen Trägerstoffe verwendet werden, die beispielhaft für die Herbicidgemische aufgezählt wurden. Je nach der gewünschten Anwendungsform können die Pflanzenwuchsregulantien auch andere geeignete Zusatzstoffe, wie z. B. Trockenmittel, Entlaubungsmittel, oberflächenaktive Stoffe, Adjuvantien, Fungicide und Insekticide, enthalten bzw. zusammen mit diesen angewendet werden. In charakteristischer Weise enthält das Pflanzenwuchsregulans etwa 0,005 bis 90 Gew.% der Verbindung(en) der Formel I, je nachdem ob das Gemisch direkt oder in verdünnter Form aufgebracht werden soll.

Im folgenden wird die Erfindung anhand von Beispielen, auf die die Erfindung jedoch nicht beschränkt ist, näher erläutert, wobei, soferne nicht ausdrücklich anders angegeben, alle Temperaturangaben in Celsiusgraden gegeben sind und der Begriff „Raumtemperatur“ sich auf eine Temperatur von etwa 20-25 °C bezieht. Der Ausdruck „%“ bezieht sich auf Gewichtsprozent und „Mol“ auf Grammol. Der Ausdruck „äquivalent“, „Äquivalenz-“ bezieht sich auf eine Reagensmenge von ebensoviel Mol wie der in dem Beispiel angeführte vorangegangene oder nachfolgende Reaktionspartner in bestimmten Mol oder bestimmtem Gewicht oder Volumen. Soweit verwendet, wurde das proton- bzw. kernmagnetische Resonanzspektrum (PMR oder NMR) bei 60 mHz ermittelt, die Signale werden als Singulets (s), breite Singulets (bs), Dubletts (d), Doppeldoublets (dd), Triplets (t), Doppeltriplets (dt), Quartetts (q) und Multipletts (m) bezeichnet; cps bedeutet cycles per second (Hz). Weiters werden, soweit notwendig, Beispiele wiederholt, um zusätzliche Ausgangsstoffe für nachfolgende Beispiele zu erhalten.

Vorschrift 1:

(3-Trifluormethylphenyl)-benzylcarbonylacetonitril

In diesem Beispiel wurden 4,91 g metallisches Natrium 110 ml wasserfreiem Äthanol bei Raumtemperatur beigegeben und das Ganze bis zur vollständigen Auflösung des Natriums gerührt. Ein Gemisch aus 18,76 g (3-Trifluormethylphenyl)acetonitril und 21,73 g Äthylphenylacetat wurde dann tropfenweise beigemengt und die so entstandene Mischung etwa 18 Stunden im Rückfluß gerührt. Das Gemisch wurde dann in 300 ml Wasser gegossen und dreimal mit Äthyläther extrahiert. Der pH-Wert der extrahierten wässrigen Schicht wurde mit wässriger 10 Gew.% Salzsäure auf etwa 1 eingestellt, worauf wiederum dreimal mit Äthyläther extrahiert wurde. Die organische Schicht wurde zweimal mit gesättigtem wässrigen Natriumbicarbonat gewaschen, über Magnesiumsulfat getrocknet und unter Vakuum zur Trockene eingedampft. Man erhielt 22,6 g der o. a. Verbindung.

In ähnlicher Weise kann das oben beschriebene Verfahren dahingehend abgewandelt werden, daß das entsprechend substituierte Phenylacetonitril und äthyl-substituierte Phenylacetat als Ausgangsstoff verwendet wird, wodurch die folgenden Verbindungen gewonnen werden können:

- (5-Chlor-3-trifluormethylphenyl)-benzylcarbonyl-acetonitril;
- (4-Chlor-3-trifluormethylphenyl)-benzylcarbonyl-acetonitril;
- (2-Brom-3-trifluormethylphenyl)-benzylcarbonyl-acetonitril;
- (6-Fluor-3-trifluormethylphenyl)-benzylcarbonyl-acetonitril;
- (4-Methyl-3-trifluormethylphenyl)-benzylcarbonyl-acetonitril;
- (5-Methoxy-3-trifluormethylphenyl)-benzylcarbonyl-acetonitril;
- (6-Methyl-3-trifluormethylphenyl)-benzylcarbonyl-acetonitril;
- (3,5-Di-trifluormethylphenyl)-benzylcarbonyl-acetonitril;
- (3-Difluormethoxyphenyl)-benzylcarbonyl-acetonitril;
- (3-Trifluormethoxyphenyl)-benzylcarbonyl-acetonitril;
- (3-Trifluormethylphenyl)-(4-fluor benzylcarbonyl)-acetonitril;
- (3-Trifluormethylphenyl)-1-naphthylmethylen-acetonitril;
- (2-Chlor-3-methylphenyl)-benzylcarbonyl-acetonitril;

(4-Äthyl-3-methylphenyl)-benzylcarbonyl-acetonitril;
 (5-Methoxy-3-chlorphenyl)-benzylcarbonyl-acetonitril;
 (3-Jodophenyl)-benzylcarbonyl-acetonitril;
 (3-Difluormethylthiophenyl)-benzylcarbonyl-acetonitril;
 5 (3-Trifluor methylthiophenyl)-benzylcarbonyl-acetonitril;
 (3,5-Diäthoxyphenyl)-benzylcarbonyl-acetonitril;
 (3-Bromophenyl)-(2-nitrobenzylcarbonyl)-acetonitril;
 (2-Chloro-3-methylphenyl)-benzylcarbonyl-acetonitril;
 10 (3-Bromo-2-äthylphenyl)-naphth-1-ylmethylen-carbonyl-acetonitril;
 (2,3-Dimethylphenyl)-beta-naphth-1-ylmethyl-carbonyl-acetonitril;
 (3-Chlorophenyl)-benzylcarbonyl-acetonitril;
 (3-Methylphenyl)-benzylcarbonyl-acetonitril;
 (3-t-Butoxyphenyl)-benzylcarbonyl-acetonitril;
 15 (3-Propylphenyl)-benzylcarbonyl-acetonitril;
 (3-Bromophenyl)-benzylcarbonyl-acetonitril;
 (3-Jodophenyl)-(3-nitrobenzylcarbonyl)-acetonitril;
 (3-Trifluormethylphenyl)-(2,3-dichlorbenzyl-carbonyl)-acetonitril;
 (3-Methoxyphenyl)-1-naphthylmethylen carbonylacetoneitril;
 20 (3-Trifluormethyl)-(3-chlor-8-fluornaphth-1-ylmethylen-carbonyl)-acetonitril;
 (3-Trifluormethyl)-[(2-trifluormethyl-3-methyl-8-methoxy-naph-1-yl)methylcarbonyl]-acetonitril;
 (3-Trifluormethyl)-(inden-1-ylmethylen-carbonyl)-acetonitril; und
 (3-Trifluormethyl)-(2-fluorinden-1-yl-methylcarbonyl)-acetonitril;

Vorschrift 2:

2-Phenyl-3-oxo-4-(3-trifluormethylphenyl)-5-amino-2,3-dihydrofuran

Eine Lösung aus 21,8 g (3-Trifluormethylphenyl)-benzylcarbonyl-acetonitril in 60 ml Essigsäure wurde tropfenweise mit einer Lösung aus 12,65 g Brom in 20 ml Eisessig behandelt. Das Reaktionsgemisch wurde etwa 16 Stunden bei Raumtemperatur verrührt. Das Reaktionsgemisch wurde dann in 250 ml Wasser gegossen und das entstehende Gemisch wurde drei Mal mit Äthyläther extrahiert. Die organischen Extrakte wurden mit gesättigtem wäßrigen Natriumbicarbonat gewaschen, über Magnesiumsulfat getrocknet und unter Vakuum konzentriert. Man erhielt 8,4 g eines weißen Feststoffes, der nach Trocknung 7,0 g der o. a. Verbindung ergab.

In ähnlicher Weise kann das o. a. Verfahren auf die in Beispiel 1 angeführten Verbindungen abgestellt werden, wodurch die folgenden Verbindungen hergestellt werden können:

35 2-Phenyl-3-oxo-4-(5-chlor-3-trifluormethylphenyl)-5-amino-2,3-dihydrofuran;
 2-Phenyl-3-oxo-4-(4-chlor-3-trifluormethylphenyl)-5-amino-2,3-dihydrofuran;
 2-Phenyl-3-oxo-4-(2-brom-3-trifluormethylphenyl)-5-amino-2,3-dihydrofuran;
 2-Phenyl-3-oxo-4-(6-fluor-3-trifluormethylphenyl)-5-amino-2,3-dihydrofuran;
 2-Phenyl-3-oxo-4-(4-methyl-3-trifluormethylphenyl)-5-amino-2,3-dihydrofuran;
 40 2-Phenyl-3-oxo-4-(5-methoxy-3-trifluormethylphenyl)-5-amino-2,3-dihydrofuran;
 2-Phenyl-3-oxo-4-(6-methyl-3-trifluormethylphenyl)-5-amino-2,3-dihydrofuran;
 2-Phenyl-3-oxo-4-(3,5-di-trifluormethylphenyl)-5-amino-2,3-dihydrofuran;
 2-Phenyl-3-oxo-4-(3-difluormethoxyphenyl)-5-amino-2,3-dihydrofuran;
 45 2-Phenyl-3-oxo-4-(3-trifluormethoxyphenyl)-5-amino-2,3-dihydrofuran;
 2-(4-Fluorphenyl)-3-oxo-4-(3-trifluormethylphenyl)-5-amino-2,3-dihydrofuran;
 2-(1-Naphthyl)-3-oxo-4-(3-trifluormethylphenyl)-5-amino-2,3-dihydrofuran;
 2-Phenyl-3-oxo-4-(2-chlor-3-methylphenyl)-5-amino-2,3-dihydrofuran;
 2-Phenyl-3-oxo-4-(4-äthyl-3-methylphenyl)-5-amino-2,3-dihydrofuran;
 50 2-Phenyl-3-oxo-4-(5-methoxy-3-chlorphenyl)-5-amino-2,3-dihydrofuran;
 2-Phenyl-3-oxo-4-(3-jodophenyl)-5-amino-2,3-dihydrofuran;
 2-Phenyl-3-oxo-4-(3-difluormethylthiophenyl)-5-amino-2,3-dihydrofuran;
 2-Phenyl-3-oxo-4-(3-trifluormethylthiophenyl)-5-amino-2,3-dihydrofuran;
 2-Phenyl-3-oxo-4-(3,5-diäthoxyphenyl)-5-amino-2,3-dihydrofuran;
 55 2-(2-Nitrophenyl)-3-oxo-4-(3-bromophenyl)-5-amino-2,3-dihydrofuran;
 2-Phenyl-3-oxo-4-(2-chlor-3-methylphenyl)-5-amino-2,3-dihydrofuran;
 2-(1-Naphthyl)-3-oxo-4-(3-bromo-2-äthylphenyl)-5-amino-2,3-dihydrofuran;
 2-(1-Naphthyl)-3-oxo-4-(2,3-dimethylphenyl)-5-amino-2,3-dihydrofuran;

- 2-Phenyl-3-oxo-4-(3-chlorphenyl)-5-amino-2,3-dihydrofuran;
 2-Phenyl-3-oxo-4-(3-methylphenyl)-5-amino-2,3-dihydrofuran;
 2-Phenyl-3-oxo-4-(3-butoxyphenyl)-5-amino-2,3-dihydrofuran;
 2-Phenyl-3-oxo-4-(3-propylphenyl)-5-amino-2,3-dihydrofuran;
 5 2-Phenyl-3-oxo-4-(3-bromophenyl)-5-amino-2,3-dihydrofuran;
 2-(3-Nitrophenyl)-3-oxo-4-(3-jodophenyl)-5-amino-2,3-dihydrofuran;
 2-(2,3-Dichlorophenyl)-3-oxo-4-(3-trifluormethylphenyl)-5-amino-2,3-dihydrofuran;
 2-(1-Naphthyl)-3-oxo-4-(3-methoxyphenyl)-5-amino-2,3-dihydrofuran;
 10 2-(3-Chlor-8-fluornaphth-1-yl)-3-oxo-4-(3-trifluormethylphenyl)-5-amino-2,3-dihydrofuran;
 2-(2-Trifluormethyl-3-methyl-8-methoxy-naphth-1-yl)-3-oxo-4-(3-trifluormethylphenyl)-5-amino-2,3-dihydrofuran;
 2-Inden-1-yl-3-oxo-4-(3-trifluormethylphenyl)-5-amino-2,3-dihydrofuran; und
 2-(2-Fluorinden-1-yl)-3-oxo-4-(3-trifluormethylphenyl)-5-amino-2,3-dihydrofuran.

15 **Vorschrift 3:****2-Methyl-3-oxo-4-(3-trifluormethylphenyl)-5-amino-2,3-dihydrofuran**

Ein trockener, 500 ml fassender, dreihalsiger Rundkolben mit mechanischem Rührer, Einfülltrichter und Rückflußkondensator wurde mit 100 ml Äthanol gefüllt. Dem Lösungsmittel wurden unter Rühen 3,5 g Natrium beigemengt. Nach Auflösung des ganzen Metalls wurde dem Reaktionsgemisch eine Lösung aus 13,0 g Äthyl-L-(+)-lactat und 18,5 m-Trifluormethylphenylacetonitril in 30 ml Äthanol tropfenweise beigegeben. Das Gemisch verfärbte sich dunkelrot und wurde nach vollständiger Beigabe über Nacht (etwa 18 Stunden) im Rückfluß erwärmt. Hierauf wurde das Gemisch auf Raumtemperatur abgekühlt und 300 ml Wasser beigemengt, worauf das erhaltene Gemisch mit 10%iger Salzsäure angesäuert wurde (pH-Wert von etwa 1). Das Gemisch wurde sodann mit Äther extrahiert (drei Mal), und die organischen Extrakte wurden (zwei Mal) mit gesättigtem wäßrigen Natriumbicarbonat gewaschen, über Magnesiumsulfat getrocknet und unter Vakuum zu einem dicken Öl konzentriert. Dieses Öl wurde in einem Äther/Petroläther-Gemisch aufgenommen und die gewünschte Verbindung als gelbes Pulver auskristallisiert. Eine zweimalige Kristallausbeute erbrachte insgesamt 4,7 g der o. a. Verbindung.

In ähnlicher Weise konnten nach Abwandlung des obigen Verfahrens durch Verwendung der entsprechend substituierten Ausgangsstoffe folgende Verbindungen gewonnen werden:

- 30 2-Äthyl-3-oxo-4-(3-trifluormethylphenyl)-5-amino-2,3-dihydrofuran;
 2-Äthyl-3-oxo-4-(5-chlor-3-trifluormethylphenyl)-5-amino-2,3-dihydrofuran;
 2-Cyclopentyl-3-oxo-4-(3-trifluormethylphenyl)-5-amino-2,3-dihydrofuran;
 2-Vinyl-3-oxo-4-(3-trifluormethylphenyl)-5-amino-2,3-dihydrofuran;
 35 2-Allyl-3-oxo-4-(3-trifluormethylphenyl)-5-amino-2,3-dihydrofuran;
 2-Allyl-3-oxo-4-(2-methoxy-3-trifluormethylphenyl)-5-amino-2,3-dihydrofuran;
 2-Trifluormethyl-3-oxo-4-(3-trifluormethylphenyl)-5-amino-2,3-dihydrofuran;
 2-Methyl-3-oxo-4-(3-difluormethoxyphenyl)-5-amino-2,3-dihydrofuran;
 2-Methyl-3-oxo-4-(3-trifluormethylphenyl)-5-amino-2,3-dihydrofuran;
 40 2-(2-Chlorovinyl)-3-oxo-4-(3-trifluormethylphenyl)-5-amino-2,3-dihydrofuran;
 2-(2-Chlorovinyl)-3-oxo-4-(5-propoxy-3-trifluormethylphenyl)-5-amino-2,3-dihydrofuran;
 2-Methyl-3-oxo-4-(2-methoxy-3-chlorphenyl)-5-amino-2,3-dihydrofuran;
 2-Äthyl-3-oxo-4-(2-chlor-3-fluorphenyl)-5-amino-2,3-dihydrofuran;
 2-Vinyl-3-oxo-4-(3-methyl-4-methoxyphenyl)-5-amino-2,3-dihydrofuran;
 45 2-Allyl-3-oxo-4-(3,6-dimethylphenyl)-5-amino-2,3-dihydrofuran;
 2-Trifluormethyl-3-oxo-4-(3-trifluormethyl-4-bromophenyl)-5-amino-2,3-dihydrofuran;
 2-(2-Chlorovinyl)-3-oxo-4-(3-nitro-4-methylphenyl)-5-amino-2,3-dihydrofuran;
 2-Methyl-3-oxo-4-(3-methoxyphenyl)-5-amino-2,3-dihydrofuran;
 50 2-Methyl-3-oxo-4-(3-difluormethylthiophenyl)-5-amino-2,3-dihydrofuran;
 2-Methyl-3-oxo-4-(3-trifluormethylthiophenyl)-5-amino-2,3-dihydrofuran;
 2-Äthyl-3-oxo-4-(3-chlorophenyl)-5-amino-2,3-dihydrofuran;
 2-Vinyl-3-oxo-4-(3-methylphenyl)-5-amino-2,3-dihydrofuran;
 2-Allyl-3-oxo-4-[3,5-di(trifluormethyl)-phenyl]-5-amino-2,3-dihydrofuran;
 55 2-Trifluormethyl-3-oxo-4-(4-fluorphenyl)-5-amino-2,3-dihydrofuran;
 2-(2-Chlorovinyl)-3-oxo-4-(2-bromophenyl)-3-oxo-5-amino-2,3-dihydrofuran;
 2-Propyl-3-oxo-4-(2-methoxy-3-chlorphenyl)-5-amino-2,3-dihydrofuran;
 2-Butyl-3-oxo-4-(2-chlor-3-fluorphenyl)-5-amino-2,3-dihydrofuran;

2-Vinyl-3-oxo-4-(3-chlor-4-methoxyphenyl)-5-amino-2,3-dihydrofuran;
 2-Allyl-3-oxo-4-(3,5-dimethylphenyl)-5-amino-2,3-dihydrofuran;
 2-(Trifluormethyl)-3-oxo-4-(3-trifluormethyl-5-bromophenyl)-5-amino-2,3-dihydrofuran;
 2-(2-Chlorvinyl)-3-oxo-4-(3-fluor-4-methylphenyl)-3-oxo-5-amino-2,3-dihydrofuran;
 5 2-Phenyl-3-oxo-4-(3-methoxyphenyl)-5-amino-2,3-dihydrofuran;
 2-Methyl-3-oxo-4-(3,5-difluorophenyl)-5-amino-2,3-dihydrofuran;
 2-Vinyl-3-oxo-4-(3,5-diäthylphenyl)-5-amino-2,3-dihydrofuran;
 2-Allyl-3-oxo-4-(3-propoxypyhenyl)-5-amino-2,3-dihydrofuran;
 10 2-Trifluormethyl-3-oxo-4-(3-fluorophenyl)-5-amino-2,3-dihydrofuran;
 2-Propyl-3-oxo-4-(3-bromophenyl)-3-oxo-5-amino-2,3-dihydrofuran;
 2-Phenyl-3-oxo-4-(2-jod-3-fluorophenyl)-5-amino-2,3-dihydrofuran;
 2-Benzyl-3-oxo-4-(2-isopropoxy-3-trifluormethylphenyl)-5-amino-2,3-dihydrofuran;
 15 2-(3-Chlorophenyl)-3-oxo-4-(2,3-dimethylphenyl)-5-amino-2,3-dihydrofuran;
 2-Naphth-1-yl-3-oxo-4-(3-trifluormethyl-4-bromophenyl)-5-amino-2,3-dihydrofuran;
 2-(3-Methylphenyl)-3-oxo-4-(3-butyl-4-methylphenyl)-3-oxo-5-amino-2,3-dihydrofuran;
 2-(3-Fluorophenyl)-3-oxo-4-(3-chlorophenyl)-5-amino-2,3-dihydrofuran;
 20 2-(2,3,5-Trifluorophenyl)-3-oxo-4-(3-trifluormethylphenyl)-5-amino-2,3-dihydrofuran;
 2-(3-Methylnaphth-1-yl)-3-oxo-4-(3-trifluormethylphenyl)-5-amino-2,3-dihydrofuran;
 2-(1-chlorvinyl)-3-oxo-4-(3-trifluormethylphenyl)-5-amino-2,3-dihydrofuran;
 2-Fluormethyl-3-oxo-4-(3-trifluormethylphenyl)-5-amino-2,3-dihydrofuran;
 2-Methoxymethylen-3-oxo-4-(3-trifluormethylphenyl)-5-amino-2,3-dihydrofuran;
 25 2-Propoxymethylen-3-oxo-4-(3-trifluormethylphenyl)-5-amino-2,3-dihydrofuran;
 2-Äthoxymethylen-3-oxo-4-(3-trifluormethylphenyl)-5-amino-2,3-dihydrofuran;
 2-(2-Methoxypropyl)-3-oxo-4-(3-trifluormethylphenyl)-5-amino-2,3-dihydrofuran;
 2-Methylthiomethylen-3-oxo-4-(3-trifluormethylphenyl)-5-amino-2,3-dihydrofuran;
 2-(1-Propylthioäthyl)-3-oxo-4-(3-trifluormethylphenyl)-5-amino-2,3-dihydrofuran;

Vorschrift 4:(3-Trifluormethylphenyl)methoxyacetyl-acetonitril

30 5,6 g metallisches Natrium wurden bei Raumtemperatur unter Stickstoffatmosphäre 120 ml wasserfreien Äthanol unter Wasserstoffentwicklung beigegeben. Nachdem die Wasserstoffentwicklung abgeschlossen war, wurde ein Gemisch aus 30 g (3-Trifluormethylphenyl)-acetonitril und 18,5 g Methylmethoxyacetat in wasserfreiem Äthanol beigemengt und das erhaltene Gemisch 3 bis 4 Stunden im Rückfluß behandelt. Hierauf wurde das Gemisch 300 ml Wasser beigegeben, worauf drei Mal mit Petroläther extrahiert wurde. Die verbleibende wässrige Phase wurde mit wässriger 10%iger Salzsäure bis zu einem pH-Wert von etwa 1 angesäuert und dreimal mit Äthyläther extrahiert. Die Äthylätherextrakte wurden zusammengegeben, zweimal mit gesättigtem wässrigen Natriumbicarbonat gewaschen, über Magnesiumsulfat getrocknet und eingedampft. Das Konzentrat wurde unter hohem Vakuum zu einem Öl eingedampft, das mit Äthyläther fein vermischt wurde. Aus diesem Gemisch wurden dann die Feststoffe ausfiltriert, worauf das Filtrat unter Vakuum eingedampft wurde. Man erhielt 36,9 g der o. a. Verbindung in Form eines braunen Feststoffes.

40 In ähnlicher Weise kann das oben beschriebene Verfahren dahingehend abgewandelt werden, daß anstelle von (3-Trifluormethylphenyl)acetonitril andere (substituierte und disubstituierte Phenyl)acetonitrile verwendet werden, wodurch man die entsprechenden substituierten und disubstituierten Phenylanaloga der o. a. Verbindung erhält.

Vorschrift 5:(3-Trifluormethylphenyl)-2-methoxyisovalerylacetonitril

45 10 g (3-Trifluormethylphenyl)-methoxyacetyl-acetonitril wurden tropfenweise einer Aufschämmung aus 1,87 g Natriumhydrid in 20 ml Tetrahydrofuran bei etwa 0 °C unter einer Stickstoffatmosphäre beigegeben, wobei sich Wasserstoff entwickelte. Nachdem keine Wasserstoffentwicklung mehr beobachtet wurde, wurde das Gemisch auf etwa -78 °C gekühlt und 24,3 ml 1,6 M n-Butyllithium in Hexan tropfenweise beigegeben. Das Gemisch wurde 1 1/2 Stunden bei -78 °C und dann bei etwa 0-4 °C zwanzig Minuten verrührt. Sodann wurden 3,9 ml (etwa 6,64 g) 2-Jodopropan tropfenweise beigefügt und das Gemisch über Nacht (etwa 14-16 Stunden) gerührt. Dem Gemisch wurde dann Wasser beigemengt, mit wässriger 10%iger Salzsäure angesäuert und dreimal mit Äthyläther extrahiert. Die Extrakte wurden zusammengegeben, über Magnesiumsulfat getrocknet und unter Vakuum konzentriert. Man erhielt 11,4 g der o. a. Verbindung in Form eines Öles.

55 In ähnlicher Weise kann das eben beschriebene Verfahren dahingehend abgewandelt werden, daß das entsprechende Alkyl-, Aryl- oder substituiertes Aryl-Jodid, Bromid oder Chlorid anstelle von Jodopropan verwendet wird, wodurch

folgende Verbindungen hergestellt werden können:

- 5 (3-Trifluormethylphenyl)-(2-methoxy-3-phenylpropionyl)acetonitril;
 (3-Trifluormethylphenyl)-[2-methoxy-3-(2-fluorophenyl)propionyl]acetonitril;
 (3-Trifluormethylphenyl)-[2-methoxy-3-(3-methylphenyl)propionyl]acetonitril;
 (3-Trifluormethylphenyl)-[2-methoxy-3-(2-äthoxyphenyl)propionyl]acetonitril;
 (3-Trifluormethylphenyl)-[2-methoxy-3-(3-nitrophenyl)propionyl]acetonitril;
 (3-Trifluormethylphenyl)-[2-methoxy-3-(2-trifluormethylphenyl)propionyl]acetonitril;
 (3-Trifluormethylphenyl)-[2-methoxy-3-(2-chloro-3-propylphenyl)propionyl]acetonitril;
 10 (3-Trifluormethylphenyl)-[2-methoxy-3-(2-nitro-3-methoxyphenyl)propionyl]acetonitril;
 (3-Trifluormethylphenyl)-[2-methoxy-3-(2-fluor-3-2'-2'-dichloräthylphenyl)propionyl]acetonitril;
 (3-Trifluormethylphenyl)-[2-methoxy-3-(2,3-dichlor-6-methylphenyl)propionyl]acetonitril;
 (3-Trifluormethylphenyl)-(2-methoxy-4-phenylbutyryl)acetonitril;
 (3-Trifluormethylphenyl)-(2-methoxy-5-(2-bromophenyl)valeryl)acetonitril;
 15 (3-Trifluormethylphenyl)-(2-methoxy-3-methyl-4-phenylbutyryl)acetonitril;
 (3-Trifluormethyl)-(2-methoxy-3-naphth-1-ylpropionyl)acetonitril;
 (3-Trifluormethyl)-[2-methoxy-3-(2-fluornaphth-1-yl)propionyl]acetonitril;
 (3-Trifluormethyl)-[2-methoxy-3-(3-butylnaphth-1-yl)propionyl]acetonitril;
 (3-Trifluormethyl)-[2-methoxy-3-(5-methoxynaphth-1-yl)propionyl]acetonitril;
 20 (3-Trifluormethyl)-[2-methoxy-3-(6-nitronaphth-1-yl)propionyl]acetonitril;
 (3-Trifluormethyl)-[2-methoxy-3-(7-trifluormethylnaphth-1-yl)propionyl]acetonitril;
 (3-Trifluormethyl)-[2-methoxy-3-(2-chlor-8-methylnaphth-1-yl)propionyl]acetonitril;
 (3-Trifluormethyl)-[2-methoxy-3-(3-methoxy-5-nitro-7-fluormethylnaphth-1-yl)propionyl]acetonitril;
 (3-Trifluormethyl)-(2-methoxy-4-naphth-1-ylbutyryl)acetonitril;
 25 (3-Trifluormethyl)-[2-methoxy-5-(8-fluoronaphth-1-yl)valeryl]acetonitril;
 (3-Trifluormethyl)-[2-methoxy-3-methyl-3-(7-methoxynaphth-1-yl)propionyl]acetonitril;
 (3-Trifluormethylphenyl)-(2-methoxy-3-inden-1-ylpropionyl)acetonitril; und
 (3-Trifluormethylphenyl)-[2-methoxy-3-(2-fluorinden-1-yl)propionyl]acetonitril;

30 In ähnlicher Weise können durch Abwandlung des obigen Verfahrens dahingehend, daß andere (mono- oder disubstituierte Phenyl)-(methoxyacetyl)acetonitrile anstelle von (3-Trifluormethylphenyl)-(2-methoxyacetyl)acetonitril verwendet werden, die entsprechenden mono- oder disubstituierten Phenylderivate der o. a. Verbindungen hergestellt werden.

35 **Vorschrift 6:**

2-Isopropyl-3-oxo-4-(3-trifluormethylphenyl)-5-amino-2,3-dihydrofuran

Ein Gemisch aus 11,4 g (3-Trifluormethylphenyl)-(2-methoxyisovaleryl)acetonitril und 7,8 g konzentrierter Schwefelsäure in 50 ml Essigsäure wurde 30 Minuten im Rückfluß erwärmt und dann unter Vakuum eingedampft. Das Konzentrat wurde mit Diäthyläther vermengt, dreimal mit 1N wäßrigem Natriumhydroxid gewaschen, über Magnesiumsulfat getrocknet und zu einem Öl eingedampft. Dieses Öl wurde in 20 Vol.% Äthylacetat:80 % Petroläther trituriert und über Nacht (14-16 Stunden) stehen gelassen. Die Feststoffe wurden ausfiltriert und dreimal mit 20 % (Vol.) Äthylacetat:80 % Petroleumäthyl gewaschen. Man erhielt 2,9 g der eingangs angegebenen Verbindung.

40 In ähnlicher Weise kann das obige Verfahren dahingehend abgewandelt werden, daß 3-Trifluormethylphenyl-dimethoxyacetylacetonitril, das nach dem in Beispiel 1 beschriebenen Verfahren gewonnen werden kann, sowie die anderen in Beispiel 5 angegebenen Verbindungen verwendet werden, wodurch die folgenden Verbindungen hergestellt werden können:

- 45 2-Methoxy-3-oxo-4-(3-trifluormethylphenyl)-5-amino-2,3-dihydrofuran;
 2-Benzyl-3-oxo-4-(3-trifluormethylphenyl)-5-amino-2,3-dihydrofuran;
 50 2-(2-Fluorbenzyl)-3-oxo-4-(3-trifluormethylphenyl)-5-amino-2,3-dihydrofuran;
 2-(3-Methylbenzyl)-3-oxo-4-(3-trifluormethylphenyl)-5-amino-2,3-dihydrofuran;
 2-(2-Äthoxybenzyl)-3-oxo-4-(3-trifluormethylphenyl)-5-amino-2,3-dihydrofuran;
 2-(3-Nitrobenzyl)-3-oxo-4-(3-trifluormethylphenyl)-5-amino-2,3-dihydrofuran;
 2-(4-Fluorbenzyl)-3-oxo-4-(3-trifluormethylphenyl)-5-amino-2,3-dihydrofuran;
 55 2-(2-Trifluormethylbenzyl)-3-oxo-4-(3-trifluormethylphenyl)-5-amino-2,3-dihydrofuran;
 2-(2-Chlor-3-propylphenyl)-3-oxo-4-(3-trifluormethylphenyl)-5-amino-2,3-dihydrofuran;
 2-(2-Nitro-3-methoxyphenyl)-3-oxo-4-(3-trifluormethylphenyl)-5-amino-2,3-dihydrofuran;

- 2-(2-Fluor-3-2',2'-dichloräthylbenzyl)-3-oxo-4-(3-trifluormethylphenyl)-5-amino-2,3-dihydrofuran;
 2-(2,3-Dichlor-6-methylbenzyl)-3-oxo-4-(3-trifluormethylphenyl)-5-amino-2,3-dihydrofuran;
 2-(Beta-phenäthyl)-3-oxo-4-(3-trifluormethylphenyl)-5-amino-2,3-dihydrofuran;
 2-[3-(2-Bromophenyl)propyl]-3-oxo-4-(3-trifluormethylphenyl)-5-amino-2,3-dihydrofuran;
 5 2-[1-Methyl-2-(phenyl)äthyl]-3-oxo-4-(3-trifluormethylphenyl)-5-amino-2,3-dihydrofuran;
 2-Naphth-1-ylmethylen-3-oxo-4-(3-trifluormethylphenyl)-5-amino-2,3-dihydrofuran;
 2-(2-Fluornaphth-1-ylmethylen)-3-oxo-4-(3-trifluormethylphenyl)-5-amino-2,3-dihydrofuran;
 2-(3-Butylnaphth-1-ylmethylen)-3-oxo-4-(3-trifluormethylphenyl)-5-amino-2,3-dihydrofuran;
 10 2-(5-Methoxynaphth-1-ylmethylen)-3-oxo-4-(3-trifluormethylphenyl)-5-amino-2,3-dihydrofuran;
 2-(6-Nitronaphth-1-ylmethylen)-3-oxo-4-(3-trifluormethylphenyl)-5-amino-2,3-dihydrofuran;
 2-(7-Trifluormethylnaphth-1-ylmethylen)-3-oxo-4-(3-trifluormethylphenyl)-5-amino-2,3-dihydrofuran;
 2-(2-Chlor-8-methylnaphth-1-ylmethylen)-3-oxo-4-(3-trifluormethylphenyl)-5-amino-2,3-dihydrofuran;
 2-(3-Methoxy-5-nitro-7-fluormethylnaphth-1-yl)-3-oxo-4-(3-trifluormethylphenyl)-5-amino-2,3-dihydrofuran;
 15 2-(Beta-naphth-1-ylethyl)-3-oxo-4-(3-trifluormethylphenyl)-5-amino-2,3-dihydrofuran;
 2-[Beta-(8-fluornaphth-1-yl)thyl]-3-oxo-4-(3-trifluormethylphenyl)-5-amino-2,3-dihydrofuran;
 2-[1-(7-Methoxynaphth-1-yl)äthyl]-3-oxo-4-(3-trifluormethylphenyl)-5-amino-2,3-dihydrofuran;
 2-Inden-1-ylmethylen-3-oxo-4-(3-trifluormethylphenyl)-5-amino-2,3-dihydrofuran; und
 2-(2-Fluorinden-1-ylmethylen)-3-oxo-4-(3-trifluormethylphenyl)-5-amino-2,3-dihydrofuran.

20 In ähnlicher Weise kann das obige Verfahren dahingehend abgewandelt werden, daß die entsprechenden mono- und disubstituierten Analoga des Ausgangsstoffes für die obigen Verbindungen verwendet werden, sodaß man die entsprechenden 4-(3-Methylphenyl)-; 4-(3-Beta-fluoräthoxyphenyl)-; 4-(3-Difluormethylenthienophenyl)-; 4-(3-Chlorophenyl)-; 4-(2-Bromo-3-trifluormethylphenyl)- und 4-(2-Methyl-3-difluormethylenthienophenyl)-Analoga der o. a. Verbindungen erhält.

25 **Vorschrift 7:**
2-Phenyl-3-oxo-4-(3-trifluormethylphenyl)-5-methylamino-2,3-dihydrofuran
 Bei diesem Beispiel wurde etwa 1 g festes Natriumhydroxid in 4,0 ml Wasser einem Gemisch aus 3 g 2-Phenyl-3-oxo-4-(3-trifluormethylphenyl)-5-amino-2,3-dihydrofuran in 50 ml Methylchlorid bei Raumtemperatur beigefügt, 30 worauf 1,19 g Dimethylsulfat und 0,21 g Benzyltriäthylammoniumchlorid zugesetzt wurden. Das entstandene Zweiphasengemisch wurde bei Raumtemperatur etwa zwei Stunden gerührt und dann dreimal mit Wasser gewaschen, über Magnesiumsulfat getrocknet und dann unter Vakuum durch Eindampfen konzentriert. Der Rückstand wurde dann durch Chromatographie über Silicagel gereinigt, wobei Mischungen aus Tetrahydrofuran und Chloroform als Eluant verwendet wurden, wodurch man die in der Überschrift genannte Verbindung erhielt.

35 In ähnlicher Weise können als Ausgangsstoffe die in den Beispielen 2, 3 und 6 aufgezählten Produkte verwendet werden, wodurch man die entsprechenden 5-Methylaminohomologe derselben erhält, beispielsweise:

- 2-Phenyl-3-oxo-4-(5-chloro-3-trifluormethylphenyl)-5-methylamino-2,3-dihydrofuran;
 40 2-Phenyl-3-oxo-4-(4-chlor-3-trifluormethylphenyl)-5-methylamino-2,3-dihydrofuran;
 2-Phenyl-3-oxo-4-(2-bromo-3-trifluormethylphenyl)-5-methylamino-2,3-dihydrofuran;
 2-Phenyl-3-oxo-4-(6-fluor-3-trifluormethylphenyl)-5-methylamino-2,3-dihydrofuran;
 2-Phenyl-3-oxo-4-(4-methyl-3-trifluormethylphenyl)-5-methylamino-2,3-dihydrofuran;
 45 2-Phenyl-3-oxo-4-(5-methoxy-3-trifluormethylphenyl)-5-methylamino-2,3-dihydrofuran;
 2-Phenyl-3-oxo-4-(6-methyl-3-trifluormethylphenyl)-5-methylamino-2,3-dihydrofuran;
 2-Phenyl-3-oxo-4-(3,5-di-trifluormethylphenyl)-5-methylamino-2,3-dihydrofuran;
 2-Phenyl-3-oxo-4-(3-difluormethoxyphenyl)-5-methylamino-2,3-dihydrofuran;
 45 2-Phenyl-3-oxo-4-(3-trifluormethoxyphenyl)-5-methylamino-2,3-dihydrofuran;
 2-Phenyl-3-oxo-4-(3-trifluormethylthienophenyl)-5-methylamino-2,3-dihydrofuran;
 2-(4-Fluorphenyl)-3-oxo-4-(3-trifluormethylphenyl)-5-methylamino-2,3-dihydrofuran;
 50 2-(1-Naphthyl)-3-oxo-4-(3-trifluormethylphenyl)-5-methylamino-2,3-dihydrofuran;
 2-Phenyl-3-oxo-4-(2-chlor-3-methylphenyl)-5-methylamino-2,3-dihydrofuran;
 2-Phenyl-3-oxo-4-(4-äthyl-3-methylphenyl)-5-methylamino-2,3-dihydrofuran;
 2-Phenyl-3-oxo-4-(5-methoxy-3-chlorphenyl)-5-methylamino-2,3-dihydrofuran;
 55 2-Phenyl-3-oxo-4-(3-jodophenyl)-5-methylamino-2,3-dihydrofuran;
 2-Phenyl-3-oxo-4-(3-difluormethylthienophenyl)-5-methylamino-2,3-dihydrofuran;
 2-Phenyl-3-oxo-4-(3-trifluormethylthienophenyl)-5-methylamino-2,3-dihydrofuran;
 2-Phenyl-3-oxo-4-(3,5-diäthoxyphenyl)-5-methylamino-2,3-dihydrofuran;

- 2-(2-Nitrophenyl)-3-oxo-4-(3-bromophenyl)-5-methylamino-2,3-dihydrofuran;
 2-Phenyl-3-oxo-4-(2-chlor-3-methylphenyl)-5-methylamino-2,3-dihydrofuran;
 2-(1-Naphthyl)-3-oxo-4-(3-bromo-2-äthylphenyl)-5-methylamino-2,3-dihydrofuran;
 2-(1-Naphthyl)-3-oxo-4-(2,3-dimethylphenyl)-5-methylamino-2,3-dihydrofuran;
 5 2-Phenyl-3-oxo-4-(3-chlorphenyl)-5-methylamino-2,3-dihydrofuran;
 2-Phenyl-3-oxo-4-(3-methylphenyl)-5-methylamino-2,3-dihydrofuran;
 2-Phenyl-3-oxo-4-(3-butoxyphenyl)-5-methylamino-2,3-dihydrofuran;
 2-Phenyl-3-oxo-4-(2-propylphenyl)-5-methylamino-2,3-dihydrofuran;
 2-Phenyl-3-oxo-4-(3-bromophenyl)-5-methylamino-2,3-dihydrofuran;
 10 2-(3-Nitrophenyl)-3-oxo-4-(3-jodophenyl)-5-methylamino-2,3-dihydrofuran;
 2-(2,3-Dichlorbenzyl)-3-oxo-4-(2-trifluormethylphenyl)-5-methylamino-2,3-dihydrofuran;
 2-(1-Naphthyl)-3-oxo-4-(3-methoxyphenyl)-5-methylamino-2,3-dihydrofuran;
 2-(3-Chlor-8-fluornaphth-1-yl)-3-oxo-4-(3-trifluormethylphenyl)-5-methylamino-2,3-dihydrofuran;
 15 2-(2-Trifluormethyl-3-methyl-8-methoxynaphth-1-yl)-3-oxo-4-(3-trifluormethylphenyl)-5-methylamino-2,3-dihydrofuran;
 2-Inden-1-yl-3-oxo-4-(3-trifluormethylphenyl)-5-methylamino-2,3-dihydrofuran;
 2-(2-Fluorinden-1-yl)-3-oxo-4-(3-trifluormethylphenyl)-5-methylamino-2,3-dihydrofuran;
 2-Methyl-3-oxo-4-(3-trifluormethylphenyl)-5-methylamino-2,3-dihydrofuran;
 2-Äthyl-3-oxo-4-(3-trifluormethylphenyl)-5-methylamino-2,3-dihydrofuran;
 20 2-Äthyl-3-oxo-4-(5-chloro-3-trifluormethylphenyl)-5-methylamino-2,3-dihydrofuran;
 2-Cyclopentyl-3-oxo-4-(3-trifluormethylphenyl)-5-methylamino-2,3-dihydrofuran;
 2-Vinyl-3-oxo-4-(3-trifluormethylphenyl)-5-methylamino-2,3-dihydrofuran;
 2-Allyl-3-oxo-4-(3-trifluormethylphenyl)-5-methylamino-2,3-dihydrofuran;
 25 2-Allyl-3-oxo-4-(2-methoxy-3-trifluormethylphenyl)-5-methylamino-2,3-dihydrofuran;
 2-Trifluormethyl-3-oxo-4-(3-trifluormethylphenyl)-5-methylamino-2,3-dihydrofuran;
 2-Methyl-3-oxo-4-(3-difluormethoxyphenyl)-5-methylamino-2,3-dihydrofuran;
 2-Methyl-3-oxo-4-(3-trifluormethylphenyl)-5-methylamino-2,3-dihydrofuran;
 2-(2-Chlorovinyl)-3-oxo-4-(3-trifluormethylphenyl)-5-methylamino-2,3-dihydrofuran;
 30 2-(2-Chlorovinyl)-3-oxo-4-(5-nitro-3-trifluormethylphenyl)-5-methylamino-2,3-dihydrofuran;
 2-Methyl-3-oxo-4-(2-methoxy-3-chlorphenyl)-5-methylamino-2,3-dihydrofuran;
 2-Äthyl-3-oxo-4-(2-chlor-3-fluorphenyl)-5-methylamino-2,3-dihydrofuran;
 2-Vinyl-3-oxo-4-(3-methyl-4-methoxyphenyl)-5-methylamino-2,3-dihydrofuran;
 2-Allyl-3-oxo-4-(3,6-dimethylphenyl)-5-methylamino-2,3-dihydrofuran;
 35 2-Trifluormethyl-3-oxo-4-(3-trifluormethyl-4-bromophenyl)-5-methylamino-2,3-dihydrofuran;
 2-(2-Chlorovinyl)-3-oxo-4-(3-nitro-4-methylphenyl)-3-oxo-5-methylamino-2,3-dihydrofuran;
 2-Methyl-3-oxo-4-(3-methoxyphenyl)-5-methylamino-2,3-dihydrofuran;
 2-Methyl-3-oxo-4-(3-difluormethylthiophenyl)-5-methylamino-2,3-dihydrofuran;
 2-Methyl-3-oxo-4-(3-trifluormethylthiophenyl)-5-methylamino-2,3-dihydrofuran;
 40 2-Äthyl-3-oxo-4-(3-chlorphenyl)-5-methylamino-2,3-dihydrofuran;
 2-Vinyl-3-oxo-4-(3-methylphenyl)-5-methylamino-2,3-dihydrofuran;
 2-Allyl-3-oxo-4-[3,5-di(trifluormethyl)phenyl]-5-methylamino-2,3-dihydrofuran;
 2-Trifluormethyl-3-oxo-4-(4-fluorphenyl)-5-methylamino-2,3-dihydrofuran;
 2-(2-Chlorovinyl)-3-oxo-4-(2-bromophenyl)-3-oxo-5-methylamino-2,3-dihydrofuran;
 45 2-Propyl-3-oxo-4-(2-methoxy-3-chlorphenyl)-5-methylamino-2,3-dihydrofuran;
 2-Butyl-3-oxo-4-(2-chlor-3-fluorphenyl)-5-methylamino-2,3-dihydrofuran;
 2-Vinyl-3-oxo-4-(3-chlor-4-methoxyphenyl)-5-methylamino-2,3-dihydrofuran;
 2-Allyl-3-oxo-4-(3,6-dimethylphenyl)-5-methylamino-2,3-dihydrofuran;
 2-Trifluormethyl-3-oxo-4-(3-trifluormethyl-5-bromophenyl)-5-methylamino-2,3-dihydrofuran;
 50 2-(2-Chlorovinyl)-3-oxo-4-(3-fluor-4-methylphenyl)-3-oxo-5-methylamino-2,3-dihydrofuran;
 2-Phenyl-3-oxo-4-(3-methoxyphenyl)-5-methylamino-2,3-dihydrofuran;
 2-Methyl-3-oxo-4-(3,5-difluorphenyl)-5-methylamino-2,3-dihydrofuran;
 2-Vinyl-3-oxo-4-(3,5-diäthylphenyl)-5-methylamino-2,3-dihydrofuran;
 2-Allyl-3-oxo-4-(3-propoxyphenyl)-5-methylamino-2,3-dihydrofuran;
 2-Trifluormethyl-3-oxo-4-(3-fluorphenyl)-5-methylamino-2,3-dihydrofuran;
 55 2-Propyl-3-oxo-4-(2-bromophenyl)-3-oxo-5-methylamino-2,3-dihydrofuran;
 2-Phenyl-3-oxo-4-(2-jodo-3-fluorphenyl)-5-methylamino-2,3-dihydrofuran;
 2-Benzyl-3-oxo-4-(2-isopropoxy-3-trifluormethylphenyl)-5-methylamino-2,3-dihydrofuran;

2-(3-Chlorphenyl)-3-oxo-4-(2,3-dimethylphenyl)-5-methylamino-2,3-dihydrofuran;
 2-Naphth-1-yl-3-oxo-4-(3-trifluormethyl-4-bromophenyl)-5-methylamino-2,3-dihydrofuran;
 2-(3-Methylphenyl)-3-oxo-4-(3-butyl-4-methylphenyl)-3-oxo-5-methylamino-2,3-dihydrofuran;
 2-(3-Fluorophenyl)-3-oxo-4-(3-chlorphenyl)-5-methylamino-2,3-dihydrofuran;
 5 2-(2,3,5-Trifluorophenyl)-3-oxo-4-(3-trifluormethylphenyl)-5-methylamino-2,3-dihydrofuran; und
 2-(3-Methylnaphth-1-yl)-3-oxo-4-(3-trifluormethylphenyl)-5-methylamino-2,3-dihydrofuran;
 2-Chlorovinyl-3-oxo-4-(3-trifluormethylphenyl)-5-methylamino-2,3-dihydrofuran;
 2-Fluormethyl-3-oxo-4-(3-trifluormethylphenyl)-5-methylamino-2,3-dihydrofuran;
 2-Methoxymethylen-3-oxo-4-(3-trifluormethylphenyl)-5-methylamino-2,3-dihydrofuran;
 10 2-Propoxymethylen-3-oxo-4-(3-trifluormethylphenyl)-5-methylamino-2,3-dihydrofuran;
 2-Äthoxymethylen-3-oxo-4-(3-trifluormethylphenyl)-5-methylamino-2,3-dihydrofuran;
 2-(2-Methoxypropyl)-3-oxo-4-(3-trifluormethylphenyl)-5-methylamino-2,3-dihydrofuran;
 2-Methylthiomethylen-3-oxo-4-(3-trifluormethylphenyl)-5-methylamino-2,3-dihydrofuran; und
 15 2-(1-propylthioäthyl)-3-oxo-4-(3-trifluormethylphenyl)-5-methylamino-2,3-dihydrofuran;
 2-Benzyl-3-oxo-4-(3-trifluormethylphenyl)-5-methylamino-2,3-dihydrofuran;
 2-(2-Fluorbenzyl)-3-oxo-4-(3-trifluormethylphenyl)-5-methylamino-2,3-dihydrofuran;
 2-(3-Methylbenzyl)-3-oxo-4-(3-trifluormethylphenyl)-5-methylamino-2,3-dihydrofuran;
 2-(2-Äthoxybenzyl)-3-oxo-4-(3-trifluormethylphenyl)-5-methylamino-2,3-dihydrofuran;
 20 2-(3-Nitrobenzyl)-3-oxo-4-(3-trifluormethylphenyl)-5-methylamino-2,3-dihydrofuran;
 2-(4-Fluorbenzyl)-3-oxo-4-(3-trifluormethylphenyl)-5-methylamino-2,3-dihydrofuran;
 2-(2-Trifluormethylbenzyl)-3-oxo-4-(3-trifluormethylphenyl)-5-methylamino-2,3-dihydrofuran;
 2-(Chlor-3-propylphenyl)-3-oxo-4-(3-trifluormethylphenyl)-5-methylamino-2,3-dihydrofuran;
 2-(2-Nitro-3-methoxyphenyl)-3-oxo-4-(3-trifluormethylphenyl)-5-methylamino-2,3-dihydrofuran;
 25 2-(2-Fluor-3-2',2'-dichloräthylbenzyl)-3-oxo-4-(3-trifluormethylphenyl)-5-methylamino-2,3-dihydrofuran;
 2-(2,3-Dichlor-6-methylbenzyl)-3-oxo-4-(3-trifluormethylphenyl)-5-methylamino-2,3-dihydrofuran;
 2-(Beta-phenäthyl)-3-oxo-4-(3-trifluormethylphenyl)-5-methylamino-2,3-dihydrofuran;
 2-[3-(2-Bromophenyl)propyl]-3-oxo-4-(3-trifluormethylphenyl)-5-methylamino-2,3-dihydrofuran;
 2-[1-Methyl-2-(phenyl)äthyl]-3-oxo-4-(3-trifluormethylphenyl)-5-methylamino-2,3-dihydrofuran;
 30 2-Naphth-1-ylmethylen-3-oxo-4-(3-trifluormethylphenyl)-5-methylamino-2,3-dihydrofuran;
 2-(2-Fluornaphth-1-ylmethylen)-3-oxo-4-(3-trifluormethylphenyl)-5-methylamino-2,3-dihydrofuran;
 2-(3-Butylnaphth-1-ylmethylen)-3-oxo-4-(3-trifluormethylphenyl)-5-methylamino-2,3-dihydrofuran;
 2-(5-Methoxynaphth-1-ylmethylen)-3-oxo-4-(3-trifluormethylphenyl)-5-methylamino-2,3-dihydrofuran;
 2-(6-Nitronaphth-1-ylmethylen)-3-oxo-4-(3-trifluormethylphenyl)-5-methylamino-2,3-dihydrofuran;
 35 2-(7-Trifluormethylnaphth-1-ylmethylen)-3-oxo-4-(3-trifluormethylphenyl)-5-methylamino-2,3-dihydrofuran;
 2-(2-Chlor-8-methylnaphth-1-ylmethylen)-3-oxo-4-(3-trifluormethylphenyl)-5-methylamino-2,3-dihydrofuran;
 2-(3-Methoxy-5-nitro-7-fluormethylnaphth-1-yl)-3-oxo-4-(3-trifluormethylphenyl)-5-methylamino-2,3-dihydrofuran;
 2-Methoxy-3-oxo-4-(3-trifluoromethylphenyl)-5-methylamino-2,3-dihydrofuran;
 40 2-(Beta-naphth-1-yläthyl)-3-oxo-4-(3-trifluormethylphenyl)-5-methylamino-2,3-dihydrofuran;
 2-[Beta-(8-fluornaphth-1-yl)äthyl]-3-oxo-4-(3-trifluormethylphenyl)-5-methylamino-2,3-dihydrofuran;
 2-[1-(7-Methoxynaphth-1-yl)äthyl]-3-oxo-4-(3-trifluormethylphenyl)-5-methylamino-2,3-dihydrofuran;
 2-Inden-1-ylmethylen-3-oxo-4-(3-trifluormethylphenyl)-5-methylamino-2,3-dihydrofuran; und
 2-(2-Fluorinden-1-ylmethylen)-3-oxo-4-(3-trifluormethylphenyl)-5-methylamino-2,3-dihydrofuran.

45 In ähnlicher Weise können durch Verwendung etwa der doppelten Menge Dimethylsulfat und Verlängerung der Reaktionszeit die entsprechenden 5-Dimethylamino-Homologe der oben aufgezählten Verbindungen hergestellt werden. Ähnlich können durch Verwendung von Diäthylsulfat anstelle von Dimethylsulfat die entsprechenden 5-Äthylamino- und 5-Diäthylamino-Homologe der obigen Verbindungen hergestellt werden.

50 **Vorschrift 8:**

2-(2-Fluorphenyl)-3-oxo-4-(3-trifluormethylphenyl)-5-allylamino-2,3-dihydrofuran

Ein Gramm Natriumhydroxid in 4,0 ml Wasser wurde einem Gemisch aus 4,0 g 2-(2-Fluorphenyl)3-oxo-4-(3-trifluormethylphenyl)-5-amino-2,3-dihydrofuran in 80 ml Methylenchlorid bei Raumtemperatur beigelegt, worauf 1,44 g Allylbromid und 0,27 g Benzyltriäthylammoniumchlorid beigelegt wurden. Das erhaltene Zweiphasen-Gemisch wurde etwa 18 Stunden bei Raumtemperatur gerührt, worauf es dreimal mit Wasser gewaschen, über Magnesiumsulfat getrocknet und unter Vakuum konzentriert wurde. Der Rückstand wurde durch Chromatographie über Silicagel und mit Chloroform als Eluanten gereinigt, sodaß man 2,5 g der eingangs zitierten Verbindung erhielt.

In ähnlicher Weise können durch Anwendung dieses Verfahrens auf die in den Beispielen 2, 3 und 6 aufgezählten Produkte die entsprechenden 5-Allylamino-Analoga derselben gewonnen werden. Ebenso können durch Verwendung etwa der doppelten Menge Allylbromid und Natriumhydroxid die entsprechenden 5-Diallylaminoanaloge derselben hergestellt werden.

5 Ebenso können durch Verwendung von Äthylbromid anstelle von Allylbromid die entsprechenden 5-Äthylamino- und 5-Diäthylamino-Analoga hergestellt werden.

Ähnlich können nach dem gleichen Verfahren jedoch unter Verwendung von Methoxymethylbromid, Äthylthiomethylbromid, Methylbromacetat, Methyl 2-brombutyrat, 1,5-Dibromopentan bzw. cis-1,4-Dibrombut-1,3-dien anstelle von Alkylbromid die entsprechenden 5-Methoxymethylamino-, 5-Äthylthiomethylamino-, 5-Methoxycarbonylmethylamino-, 5-(1-Methoxycarbonylpropylamino)-, 5-Piperidin-1-yl- und 5-Pyrrol-1-yl-Analoga der in den Beispielen 2, 3 und 6 aufgezählten Produkte gewonnen werden, wie z. B.

15 2-Phenyl-3-oxo-4-(3-trifluormethylphenyl)-5-methoxymethylamino-2,3-dihydrofuran;
2-Methyl-3-oxo-4-(3-trifluormethylphenyl)-5-methoxymethylamino-2,3-dihydrofuran;
2-Äthyl-3-oxo-4-(3-trifluormethylphenyl)-5-methoxymethylamino-2,3-dihydrofuran;
2-Phenyl-3-oxo-4-(3-trifluormethylphenyl)-5-äthylthiomethylamino-2,3-dihydrofuran;
2-Methoxy-3-oxo-4-(3-trifluormethylphenyl)-5-äthylthiomethylamino-2,3-dihydrofuran;
2-Methyl-3-oxo-4-(3-trifluormethylphenyl)-5-äthylthiomethylamino-2,3-dihydrofuran;
20 2-Äthoxymethylen-3-oxo-4-(3-trifluormethylphenyl)-5-äthylthiomethylamino-2,3-dihydrofuran;
2-Äthyl-3-oxo-4-(3-trifluormethylphenyl)-5-äthylthiomethylamino-2,3-dihydrofuran;
2-Phenyl-3-oxo-4-(3-trifluormethylphenyl)-5-methoxycarbonylmethylamino-2,3-dihydrofuran;
2-Methyl-3-oxo-4-(3-trifluormethylphenyl)-5-methoxycarbonylmethylamino-2,3-dihydrofuran;
2-Methylthiomethylen-3-oxo-4-(3-trifluormethylphenyl)-5-methoxycarbonylmethylamino-2,3-dihydrofuran;
2-Äthyl-3-oxo-4-(3-trifluormethylphenyl)-5-methoxycarbonylmethylamino-2,3-dihydrofuran;
25 2-Phenyl-3-oxo-4-(3-trifluormethylphenyl)-5-(1-methoxycarbonylprop-1-yl)amino-2,3-dihydrofuran;
2-Methyl-3-oxo-4-(3-trifluormethylphenyl)-5-(1-methoxycarbonylprop-1-yl)amino-2,3-dihydrofuran;
2-Fluor-3-oxo-4-(3-trifluormethylphenyl)-5-(1-methoxycarbonylprop-1-yl)amino-2,3-dihydrofuran;
2-Äthyl-3-oxo-4-(3-trifluormethylphenyl)-5-(1-methoxycarbonylprop-1-yl)amino-2,3-dihydrofuran;
2-Naphth-1-yl-3-oxo-4-(3-trifluormethylphenyl)-5-(1-methoxycarbonylprop-1-yl)amino-2,3-dihydrofuran;
30 2-Inden-1-yl-3-oxo-4-(3-trifluormethylphenyl)-5-(1-methoxycarbonylprop-1-yl)amino-2,3-dihydrofuran;
2-Phenyl-3-oxo-4-(3-trifluormethylphenyl)-5-piperidin-1-yl-2,3-dihydrofuran; und
2-Phenyl-3-oxo-4-(3-trifluormethylphenyl)-5-pyrrol-1-yl-2,3-dihydrofuran, etc.

Ähnlich können nach den oben beschriebenen Verfahren unter Verwendung der 5-Methylaminoprodukte aus Beispiel 7 als Ausgangsstoffe die entsprechenden 5-(N-Methyl-N-allylamino)-, 5-(N-Methyl-N-äthylamino)-, 5-(N-Methyl-N-methoxymethylamino)-, 5-(N-Methyl-N-äthylthiomethylamino)-, 5-(N-Methyl-N-methoxycarbonylmethylamino)- und 5-(N-Methyl-N-1'-methoxycarbonylpropylamino)-Analoga hergestellt werden.

Vorschrift 9:

40 Lithiumsalz von 2-Phenyl-3-oxo-4-(3-trifluormethylphenyl)-5-methylamino-2,3-dihydrofuran (R¹ = -CH₃, R² = Li)

5,4 ml 1,6 M n-Butyllithium in Hexan wurden tropfenweise unter Rühren einer Lösung aus 2,86 g 2-Phenyl-3-oxo-4-(3-trifluormethylphenyl)-5-amino-2,3-dihydrofuran in 25 ml Tetrahydrofuran bei -30 °C beigefügt. Das erhaltene Gemisch wurde 20 Minuten verrührt und dann unter Vakuum konzentriert, sodaß man 2,8 g der oben zitierten Verbindung in Form eines hellbraunen Feststoffes erhielt.

Elementaranalyse: berechnet: C-63,74; H-3,84; N-4,13;
gefunden: C-61,82; H-4,90; N-3,48.

Ähnlich können durch entsprechende Abwandlung der obigen Verfahren die entsprechenden Lithiumsalze der Verbindungen aus Beispielen 2-5 hergestellt werden.

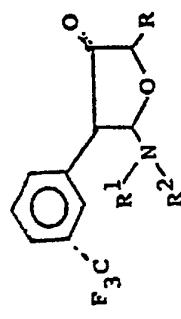
Vorschrift 10:

Die in der nachfolgenden Tabelle A aufgezählten Verbindungen wurden unter Verwendung der entsprechenden Ausgangsstoffe und unter Anwendung der in den vorhergehenden Beispielen beschriebenen Verfahren gewonnen.

55

QUERTABELLEN
(8 Seiten)

Tabelle A



5

10

No.	R ¹	R ²	R	Kohlenstoff		Elementaranalyse Wasserstoff ber. gef.	Stickstoff ber. gef.	Schmelz- punkt °C
				ber.	gef.			
15	1	H	H	63.95	64.66	3.76	4.19	4.78
	2	CH ₃	H	64.86	64.22	4.20	4.65	3.79
	3	CH ₃	CH ₃	65.71	65.63	4.61	4.83	4.03
	4	CH ₂ CH ₃	H	65.71	66.55	4.61	5.12	4.03
	5	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	67.20	67.76	5.33	5.63	3.73
	6	H	H	60.53	59.66	3.26	3.47	3.77
	7	CH ₃	H	61.54	61.22	3.70	3.62	4.12
	8	CH ₃	CH ₃	62.47	62.95	4.11	4.38	3.99
	9	CH ₂ CH ₃	H	62.47	60.36	4.11	4.11	4.45
	10	(CH ₂) ₂ CH ₃	H	63.32	63.6	4.49	4.7	4.12
	11	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	64.12	63.41	4.83	4.93	3.56
	12	CH ₃	H	58.78	58.52	3.54	3.63	3.85

* = Zersetzung

∅** = Phenyl, z. B.

, 2-Cl∅ = 2-Chlorphenyl

35

Tabelle A (Forts.)

5	No.	R ¹	R ²	R	Kohlenstoff ber.	Kohlenstoff gef.	Elementaranalyse Wasserstoff ber.	Stickstoff ber.	Stickstoff gef.	Schmelz- punkt °C
10	13	CH ₃	CH ₃	2-CIØ*	59.77	59.67	3.93	4.05	3.67	116-119
	14	CH ₂ CH ₃	H	2-CIØ	59.77	60.5	3.93	4.05	3.67	131-137
	15	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	2-CIØ	61.55	61.72	4.64	4.79	3.42	113-114
	16	H	H	2-CH ₃ Ø	64.86	65.02	4.20	4.43	4.20	179-181*
15	17	H	H	3-CH ₃ Ø	64.86	62.54	4.20	4.27	4.20	148-151
	18	H	H	4-CH ₃ Ø	64.86	65.86	4.20	4.25	4.20	208-211*
	19	H	H	2-CF ₃ Ø	55.81	55.58	2.84	3.05	3.62	68-75
	20	H	H	3-CF ₃ Ø	55.81	55.37	2.84	3.09	3.62	60-63
20	21	H	H	2,6-DiFØ	57.46	57.45	2.82	3.14	3.94	4.16
	22	CH ₃	H	2,6-DiFØ	58.54	59.3	3.25	3.45	3.79	3.84
	23	CH ₂ CH ₃	H	2,6-DiFØ	59.53	60.11	3.66	4.00	3.66	3.71
	24	-CH ₂ CH=CH ₂	H	2-FØ	63.66	62.4	3.98	4.31	3.71	63-65
- 15 -	25	H	CH ₃	CH ₃	56.03	56.54	3.89	4.22	5.45	129-130
	26	-CH ₂ Cl(C)=CH ₂	H	Ø	61.0	57.9	3.8	3.9	3.55	3.2
	27	-CH ₂ CH=C(C)CH ₃	H	Ø	61.8	61.3	4.2	4.7	3.4	3.1
	28	-CH(CH ₃)COOC ₂ H ₅	H	Ø	63.0	61.5	4.8	5.0	3.3	3.2
25	29	Li	-CH ₃	Ø	63.74	61.82	3.84	4.9	4.13	3.48
	30	H	H	1-Naphthyl	68.3	65.8	3.8	4.1	3.8	123-126
	31	CH ₃	H	1-Naphthyl	68.9	65.7	4.18	4.4	3.7	174-179
	32	CH ₃	CH ₃	1-Naphthyl	69.5	69.2	4.5	4.7	3.5	139-143

Ø* = Phenyl, z. B. , 2,6-DiFØ = 2,6-Difluorphenyl

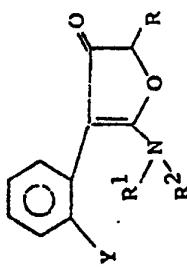
* = Zersetzung

Tabelle A (Fort.s.)

5	No.	R ¹	R ²	R	Kohlenstoff ber.	Kohlenstoff gef.	Elementaranalyse Wasserstoff ber.	Elementaranalyse Wasserstoff gef.	Stickstoff ber.	Stickstoff gef.	Schmelz- punkt °C
10	33	H	H	H	54.32	54.91	3.29	3.54	5.76	5.42	145-146*
	34	CH ₃	H	H	56.03	55.75	3.89	4.04	5.45	5.39	158-159
	35	CH ₃	H	CH ₃	57.56	58.87	4.43	4.66	5.17	5.32	116-118
	36	CH ₂ CH ₃	H	CH ₃	58.95	59.35	4.91	5.04	4.91	5.34	141-142
	37	H	H	CH ₂ CH ₃	57.56	60.08	4.43	4.91	5.17	5.47	173-174
15	38	CH ₃	H	CH ₂ CH ₃	58.95	59.59	4.91	5.12	4.91	5.17	138-139
	39	H	H	(CH ₂) ₂ CH ₃	58.95	60.26	4.91	5.19	4.91	5.08	165-168
	40	CH ₃	H	(CH ₂) ₂ CH ₃	60.20	61.2	5.35	5.84	4.68	4.56	Öl
	41	CH ₃	CH ₃	(CH ₂) ₂ CH ₃	61.34	61.82	5.75	6.11	4.47	4.46	Öl
	42	H	H	CH(CH ₃) ₂	58.95	58.79	4.91	5.23	4.91	5.0	155-156
	20	CH ₃	H	CH(CH ₃) ₂	60.20	60.80	5.35	5.36	4.68	4.85	121-122
	44	H	H	(CH ₂) ₃ CH ₃	60.20	61.42	5.35	5.68	4.68	4.9	137-138*
	45	CH ₃	H	(CH ₂) ₃ CH ₃	61.34	62.84	5.75	6.17	4.47	5.03	90
	46	CH ₃	H	Cyclohexyl	63.72	64.41	5.90	6.18	4.13	3.6	143-145
	47	CH ₂ CH ₃	H	Cyclohexyl	64.59	64.94	6.23	6.87	3.97	4.11	142-143
25											

* = Zersetzung

Tabelle B



15	No.	R ¹	R ²	R	Y	ber.	Kohlenstoff		Stickstoff ber. gef.	Schmelz- punkt °C
							Elementaranalyse Wasserstoff	ber. gef.		
	48	H	H	H	2-CH ₃ Ø	68.11	68.64	4.67	4.67	4.96
	49	H	H	H	2-FØ	63.26	62.3	3.8	4.61	4.17
	50	CH ₃	H	H	2-ClØ	61.08	62.21	3.87	4.06	4.33
	51	CH ₃	H	H	H	59.07	59.1	4.48	4.95	6.24
	52	CH ₂ CH ₃	H	H	H	60.64	61.11	5.05	5.52	5.90
	53	H	H	CH ₃	CH ₃	59.07	57.16	4.48	4.5	6.27
	54	CH ₃	H	CH ₃	CH ₃	66.64	62.11	5.05	5.42	5.90
	55	H	H	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	60.64	58.69	5.09	5.46	5.89
	56	CH ₃	H	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	62.03	63.34	5.61	5.83	5.56
	57	CH ₃	CH ₃	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	63.28	62.48	6.07	6.86	5.27
	58	CH ₂ CH ₂	H	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	63.28	63.82	6.7	6.52	5.27
	59	H	H	(CH ₂) ₂ CH ₃	(CH ₂) ₂ CH ₃	62.03	62.13	5.61	5.76	5.56
	60	CH ₃	H	(CH ₂) ₂ CH ₃	Cl	63.28	63.58	6.07	6.49	5.27
	30									oil

* = Zersetzung

Tabelle B (Forts.)

5	No.	R ¹	R ²	R	Y	ber.	Kohlenstoff gef.	Elementaranalyse		Stickstoff ber.	gef.	Schnellz- punkt °C
								Wassersstoff ber.	gef.			
10	61	CH ₂ CH ₃	H	(CH ₂) ₂ CH ₃	Cl	64.40	65.34	6.49	7.11	5.01	5.33	104-106
	62	CH ₃	CH ₃	(CH ₂) ₂ CH ₃	Cl	64.40	64.14	6.49	6.65	5.01	4.67	0
	63	H	H	CH ₂ (CH ₃) ₂	Cl	62.04	63.69	5.57	6.05	5.57	6.37	156-157
	64	CH ₃	H	CH ₂ (CH ₃) ₂	Cl	63.29	63.03	6.03	6.72	5.27	5.62	85-91
	65	CH ₂ CH ₃	H	CH ₂ (CH ₃) ₂	Cl	64.41	65.66	6.44	6.83	5.01	5.47	130-131
	66	H	H	∅	Br	58.20	54.8	3.64	3.79	4.24	3.97	177-178*
15	67	CH ₃	H	∅	Br	59.32	60.79	4.07	4.36	4.07	3.93	181-185
	68	CH ₂ CH ₃	H	∅	Br	60.35	61.01	4.47	4.74	3.91	3.53	161-163
	69	H	H	2-Cl∅	Br	52.69	54.59	3.02	3.26	3.84	4.14	202-204
	70	CH ₃	H	2-Cl∅	Br	53.91	53.77	3.44	3.47	3.70	3.69	205-207
	71	CH ₂ CH ₃	H	2-Cl∅	Br	55.05	55.3	3.82	3.97	3.57	3.51	144-147
	72	H	H	2-F∅	Br	55.19	55.14	3.16	3.57	4.02	3.94	190-191.5
20	73	CH ₃	H	2-F∅	Br	56.37	58.0	3.59	3.41	3.87	4.51	172-173
	74	CH ₂ CH ₃	H	2-F∅	Br	57.46	57.59	3.99	4.31	3.72	3.57	157-159
	75	H	H	2-CH ₃ ∅	Br	59.32	58.48	4.07	4.22	4.07	4.03	165-167
	76	CH ₃	H	2-CH ₃ ∅	Br	60.35	60.36	4.47	4.68	3.91	3.96	208-210
	77	CH ₂ CH ₃	H	2-CH ₃ ∅	Br	61.31	62.98	4.84	5.16	3.76	4.24	140-142
	78	CH ₃	H	H	Br	49.21	48.01	3.73	4.41	5.23	5.06	109-118
25	79	CH ₂ CH ₃	H	H	Br	51.08	50.35	4.26	4.28	4.97	4.86	172-175*
	80	H	H	∅	CH ₃	77.0	76.3	5.7	5.9	5.3	5.1	137-141

* = Zersetzung

Tabelle B (Forts.)

5 No.	R ¹	R ²	R	Y	Kohlenstoff ber. gef.	Elementaranalyse Wasserstoff ber. gef.	Stickstoff ber. gef.	Schmelz- punkt °C
								AT 395 507 B
10	81	CH ₃	H	Ø	CH ₃	77.4	77.1	5.0
	82	H	H	Ø	OCH ₃	72.6	73.7	5.1
	83	CH ₃	H	Ø	OCH ₃	73.2	72.5	5.0
	84	CH ₃	H	Ø	OCH(CH ₃) ²	74.30	70.02	4.7
	85	CH ₂ CH ₃	H	Ø	OCH(CH ₃) ²	74.25	75.88	4.33
	86	H	2-CH ₃ Ø	OCH(CH ₃) ²	74.28	73.58	4.15	185-188*
15	87	CH ₃	H	2-CH ₃ Ø	OCH(CH ₃) ²	74.75	74.35	3.6
	88	CH ₂ CH ₃	H	2-CH ₃ Ø	OCH(CH ₃) ²	75.19	73.63	4.21
	89	H	2-FØ	OCH(CH ₃) ²	69.71	70.7	4.19	111-113
	90	CH ₃	H	2-FØ	OCH(CH ₃) ²	70.37	69.66	4.23
	91	H	H	2-ClØ	OCH(CH ₃) ²	66.38	68.29	4.17
	92	H	H	CH ₃	OCH(CH ₃) ²	68.0	65.75	149-151
20	93	CH ₃	H	CH ₃	OCH(CH ₃) ²	68.97	68.69	3.83
	94	H	H	Ø	-Ø	76.95	76.3	134-135
	95	CH ₃	H	Ø	-Ø	77.3	73.9	134-136
	96 ¹	CH ₃	CH ₃	Ø	Y=Cl, X=Cl	62.1	62.9	4.0
	97	-CH ₂ (CH ₂) ₂ CH ₂ -	Ø	-CF ₃	67.55	72.4	4.7	133-137
						4.85	5.1	105-111
- 19 -								

96¹ ist 2-Phenyl-3-oxo-4-(3,4-dichlorophenyl)-5-dimethylamino-2,3-dihydrofuran

* = Zersetzung

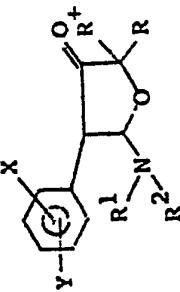


Tabelle C
Vergleichsverbindungen

(wenn nicht anders angegeben
X=H and R⁺=H)

No.	R ¹	R ²	R	Y	Kohlenstoff		Stickstoff ber.	Stickstoff gef.	Schmelz- punkt °C	
					ber.	gef.				
20	C-1	CH ₃	CH ₃	Ø	H	77.42	75.64	6.39	5.02	5.03
	C-2	H	H	H	H	68.57	68.99	5.14	5.78	7.87
	C-3	H	H	H	3-Cl	57.29	51.6	6.68	5.67	3.82
	C-4	H	H	H	4-Cl	57.29	53.46	6.68	5.52	3.7
25	C-5	CH ₃	CH ₃	H	4-Cl	59.07	59.34	4.48	5.03	3.82
	C-6	CH ₃	CH ₃	H	4-Cl	60.64	58.61	5.05	5.24	6.02
	C-7	CH ₃	H	Ø	4-Cl	68.1	64.4	4.7	5.3	4.11
	C-8	H	H	H	4-CH ₃	69.84	67.98	5.82	5.63	6.27
30	C-9	CH ₃	H	H	4-CH ₃	70.94	70.85	6.4	6.63	6.02

* = Zersetzung

Tabelle C (Forts.)

5 No.	R ¹	R ²	R	Y	Y	Elementaranalyse		Stickstoff- ber. gef.	Schmelz- punkt °C
						Kohlenstoff ber. gef.	Wasserstoff ber. gef.		
10	C-10	H	H	Ø	4-CH ₃	77.0	76.2	5.7	5.3
	C-11	CH ₃	H	Ø	4-CH ₃	77.4	75.49	6.1	6.14
	C-12	H	H	Ø	4-OCH ₃	72.6	70.5	5.4	5.0
	C-13	CH ₃	CH ₃	Ø	4-OCH ₃	73.8	72.9	6.2	6.0
	C-14	**	H	Ø	3-CF ₃	62.7	62.4	3.4	4.5
	C-15	CH ₃	CH ₃	R=Ø, R ⁺ =Cl	3-CF ₃	59.76	57.9	3.93	4.06
15	C-16 ²	H	H	Ø	Y=3-Cl, X=4-Cl	60.0	60.1	3.5	3.67
								3.7	3.56
								4.4	4.8

C-16² ist 2-Phenyl-3-oxo-4-(3,4-dichlorophenyl)-5-amino-2,3-dihydrofuran

* = Zersetzung
** = 4-NO₂Ø-

Beispiel:

Die Verbindungen der Tabelle A wurden nach den nachfolgend beschriebenen Verfahren jeweils auf ihre vor- und nachemergente Wirksamkeit gegen eine Vielzahl von Gräsern und breitblättrigen Pflanzen, einschließlich einer Getreidepflanze und einer breitblättrigen Nutzpflanze, untersucht. Die Testverbindungen werden hierbei jeweils mit den Nummern der Verbindungen aus Tabelle A bezeichnet.

Untersuchung der präemergenten Herbicidwirkung:

Lösungen der jeweils untersuchten Verbindungen wurden wie folgt hergestellt:

355,5 mg Testverbindung wurden in 15 ml Aceton gelöst. Die Lösung wurden 110 mg eines nicht-ionischen oberflächenaktiven Stoffes in 2ml Aceton beigegeben. 12 ml dieser Stammlösung wurden dann zu 47,7 ml Wasser hinzugegeben, das den gleichen nicht-ionischen oberflächenaktiven Stoff in einer Konzentration von 625 mg/l enthielt.

Samen der Testpflanze wurden in einen Topf Erde gepflanzt, worauf die Oberfläche gleichmäßig mit der Testlösung in einer Dosierungsmenge von $27,5 \mu\text{g}/\text{cm}^2$ oder, wenn dies in der Tabelle bei manchen Verbindungen speziell angegeben ist, in einer geringeren Dosierungsmenge von $15,6 \mu\text{g}/\text{cm}^2$ besprüht wurde. Der Topf wurde gegossen und in ein Gewächshaus gestellt. Er wurde immer wieder gegossen und 3 Wochen lang auf Sämlingsbildung, Gesundheit der Sämlinge, etc. untersucht. Nach Ablauf dieser Periode wurde die herbicide Wirksamkeit der Verbindung anhand der physiologischen Beobachtungen bewertet. Man verwendete dazu eine 0 - 100 Skala, wobei „0“ keine Phytotoxizität und „100“ vollständiges Absterben bedeutete. Das Ergebnis dieser Tests ist in Tabelle 1 zusammengefaßt.

Untersuchung der postemergenten Herbicidwirkung:

Die Zubereitung der Testverbindung erfolgte in gleicher Weise wie vorhin beschrieben. Die so erhaltene Testlösung wurde gleichmäßig auf 2 ähnliche Töpfe mit ca. 5 bis 8 cm hohen Pflänzchen (mit Ausnahme von Hafergras, Sojabohne und Paspalum, die schon ca. 8 bis 10 cm hoch waren) (etwa 15 bis 25 Pflanzen je Topf) in einer Dosierungsmenge von $27,5 \mu\text{g}/\text{cm}^2$ aufgesprüht. Sobald die Pflanzen trocken waren, wurden sie in ein Gewächshaus gestellt und dann nach Bedarf grundtief gegossen. Die Pflanzen wurden in regelmäßigen Abständen auf phytotoxische Auswirkungen sowie physiologische und morphologische Reaktionen auf die Behandlung beobachtet. Nach 3 Wochen wurde die herbicide Wirksamkeit der Testverbindung anhand dieser Beobachtungen ausgewertet. Wieder wurde eine 0 - 100-Skala verwendet, wobei „0“ keine Phytotoxizität und „100“ vollständiges Absterben bedeutete. Das Ergebnis dieser Testreihe ist in Tabelle 2 zusammengefaßt.

QUERTABELLEN

(10 Seiten)

35

40

45

50

55

5 Dosisierungsmenge: 27,5 Mikrogramm/cm², wenn nicht anders angegeben
voremergente Herbizidwirkung

Tabelle 1

10	Verbindung Nr.	breitblättrige Pflanzen				Gräser			
		weißer Gänsefuß	% Phytoxizität Senf	Fuchsschwanz	Soja	Fingergras	Paspalum	Haferschlag	Reis
	1	94	100	95		100	100	100	93
	2	100	100	100		100	100	100	100
	3 ^a	98	100	60		100	80	100	60
	4 ^a	95	100	98		100	100	100	75
15	5	100	80	20		100	70	100	20
	6	100	100	85		100	100	100	85
	7 ^a	100	100	100		100	100	100	100
	8 ^a	98	100	100		100	100	100	70
	9 ^a	100	100	100		100	100	100	100
	10	100	100	90		100	100	100	90
	11 ^a	90	50	100	60	100	50	60	20
	12 ^a	100	100	100	90	100	100	100	95
	13 ^a	100	100	100	100	100	100	100	95
	14 ^a	100	100	100	70	100	100	100	95
	15 ^a	95	90	100	20	100	50	70	0
	16	100	100	100	85	100	100	100	95
	17	99	83	98	55	100	70	63	55
	18	0	0	0	0	0	0	0	0
	19 ^a	100	80	100	20	98	100	100	90
	20	100	100	100	75	98	65	85	50
	21	95	90	25	40	100	100	100	80
	22	100	100	100	100	100	100	100	100
	23	100	100	100	70	100	100	100	95
	24 ^a	98	90	100	65	100	95	70	55
	25	90	98	85	90	100	88	80	65
	26	95	75	100	30	100	95	0	30

a = getestet bei 15,6 Mikrogramm/cm²

Tabelle 1 (Forts.)

5	Verbindung Nr.	breitblättrige Pflanzen % Phytotoxizität	weißer Gänsefuß Senf	Fuchsschwanz	Soja	Fingergras	Paspalum	Hafgras	Reis
10	27	0	0	0	0	0	0	0	0
	28	99	98	100	45	99	48	67	45
	29	98	97	100	98	100	100	90	100
	30	98	55	100	25	78	55	55	15
	31	100	100	100	80	100	100	95	80
	32	95	80	100	25	100	80	60	75
	33	95	100	70	78	98	80	90	78
	34	100	100	100	100	100	100	100	100
	35	100	100	100	100	100	100	100	100
	36	100	100	100	100	100	100	100	100
15	37	100	100	100	85	98	98	98	70
	38	100	100	100	100	100	100	100	100
	39	100	100	100	70	100	100	100	88
	40	100	100	100	100	100	100	100	100
	41	100	100	100	50	100	100	100	65
	42	95	100	100	25	35	88	10	0
	43	100	100	100	100	100	100	100	100
	44	90	100	100	15	98	99	75	10
	45	100	100	100	93	100	100	100	100
	46	100	100	100	70	100	100	90	70
25	47	100	55	60	30	100	95	70	93
	48	60	65	30	75	25	25	25	25
	49	100	100	100	100	100	100	100	100
	50	100	100	100	100	100	100	100	100
	51	100	100	100	98	100	100	100	95
	52	100	100	100	100	100	100	100	100
	53	60	65	50	35	0	15	0	0

Tabelle 1 (Forts.)

5	Verbindung Nr.	breitblättrige Pflanzen				Gräser				
		weißer Gänsefuß	Senf	% Phytoxizität	Fuchsschwanz	Soja	Fingergras	Paspalum	% Phytoxizität	Haferschrot
10	54	100	100	93	100	100	100	100	100	97
	55	55	50	25	73	20	0	0	0	0
	56	100	100	100	100	100	100	100	100	80
	57	98	100	45	100	65	30	40	40	
	58	100	100	75	90	100	100	85	90	
	59	50	45	0	0	60	15	0	0	
15	60	100	100	99	100	100	100	100	100	97
	61	100	100	85	93	100	100	80	80	93
	62	100	100	45	100	94	50	30	30	
	63	25	45	0	0	20	20	0	0	
	64	98	100	93	100	100	95	60	60	
	65	100	100	90	100	100	100	85	85	
20	66	100	100	70	100	95	98	90	90	
	67	100	100	100	100	100	100	100	100	100
	68	100	100	100	100	100	100	100	100	100
	69	100	98	99	75	100	100	99	99	85
	70	100	95	90	90	100	100	100	100	95
	71	100	95	97	70	100	100	100	100	93
25	72	100	100	99	85	100	100	100	100	99
	73	100	100	100	100	100	100	100	100	100
	74	100	100	80	93	100	100	100	100	98
	75	100	99	100	50	100	100	100	100	95
	76	100	93	85	90	100	100	100	100	93
	77	100	99	98	85	100	100	100	100	93
30	78	100	98	70	90	100	100	100	100	98
	79	100	100	100	100	100	100	100	100	100

Tabelle 1 (Forts.)

5	Verbindung Nr.	breitblättrige Pflanzen				Gräser			
		weißer Gänsefuß	% Phytoxizität Senf	Fuchsschwanz	Soja	Fingergras	Paspalum	Hafergras	Reis
10	80	25	20	0	0	95	25	10	0
	81	100	100	100	100	100	100	100	0
	82	80	55	20	45	98	25	20	0
	83	100	100	100	70	100	100	100	0
	84	99	95	100	98	100	100	100	97
	85	100	97	100	97	100	100	99	97
	86	100	100	100	85	100	100	90	75
	87	100	95	100	95	99	100	98	80
	88	100	100	100	90	100	100	98	90
	89	100	100	100	99	100	100	100	100
15	90	100	100	100	100	100	100	99	99
	91	99	100	100	97	100	100	95	97
	92	20	20	0	25	0	0	0	0
	93	100	100	100	100	100	100	100	93
	94	75	55	98	0	90	30	0	0
	95	100	100	100	55	100	100	75	40
	96	93	50	100	0	100	60	30	0
	97	100	100	100	70	100	100	99	80
	25								

Tabelle 1A

Vergleichsverbindungen voremergente Herbicidwirkung

Dosierungsmenge: 27.5 Microgramm/cm², wenn nicht anders angegeben

6

Tabelle 2
nachemergente Herbizidwirkung

Dosierungsmenge: 27,5 Mikrogramm/cm², wenn nicht anders angegeben

Verbindung Nr.	breitblättrige Pflanzen % Phytotoxizität	Gräser % Phytotoxizität				Reis		
		Senf	Fuchsschwanz	Soja	Fingergras	Paspalum	Hafergras	
10	1	60	100	50	40	33	45	20
	2	85	100	92	58	60	60	42
	3a	70	90	75	0	0	0	0
	4a	60	95	75	50	65	65	45
	5	80	90	70	30	30	30	0
15	6	60	80	60	45	60	60	20
	7a	95	100	98	80	80	90	80
	8a	65	100	65	40	65	65	20
	9a	80	95	90	70	90	90	60
	10	90	100	90	30	0	30	0
20	11a	90	90	80	30	20	20	20
	12a	100	100	90	90	40	50	20
	13a	90	100	90	30	50	0	0
	14a	80	90	90	50	80	90	40
	15a	80	90	80	20	0	0	0
25	16	65	95	60	70	80	75	20
	17	35	73	35	0	0	0	0
	18	0	0	0	0	0	0	0
	19a	55	45	45	55	45	40	0
	20	43	80	45	33	0	0	0
30	21	50	30	60	50	30	0	0
	22	80	80	70	70	60	90	0
	23	85	100	90	80	70	100	30
	24a	85	80	75	65	40	35	0
	25	25	50	N.T.*	50	0	0	0
35								

N.T.* = nicht getestet

a = getestet bei 15,6 Mikrogramm/cm²

Tabelle 2 (Forts.)

5	Verbindung Nr.	breitblättrige Pflanzen			Gräser			% Phytoxischität		
		weißer Gänsefuß	Senf	Fuchsschwanz	Soja	Fingergras	Paspalum	Hafegras	Reis	
	26	40	55	60	45	0	0	0	0	0
	27	50	30	35	0	0	0	0	0	0
	28	35	40	0	0	0	0	0	0	0
10	29	75	100	80	70	70	85	65	52	
	30	30	45	45	45	10	30	20	0	
	31	70	80	80	70	30	40	20	0	
	32	40	40	35	35	0	0	0	0	
	33	70	65	42	50	35	40	60	45	
	34	85	100	85	85	80	92	89	60	
	35	100	100	100	100	100	90	98	75	
	36	75	98	70	70	65	80	65	35	
	37	50	50	45	40	0	0	0	0	
	38	85	100	100	70	75	75	75	65	
	39	47	60	40	0	0	0	0	0	
	40	95	100	98	80	95	95	95	95	
	41	90	100	90	90	45	75	75	30	
	42	11	0	10	25	0	0	0	0	
	43	80	100	75	95	90	80	90	45	
	44	25	25	25	20	0	0	0	0	
	45	75	95	90	90	55	75	65	0	
	46	50	50	50	40	20	25	0	0	
	47	70	70	85	70	40	30	35	15	
	48	60	65	30	30	25	25	25	0	
	49	75	90	80	40	60	60	30	75	
30	50	85	90	65	80	85	80	80	55	
	51	50	50	40	60	30	25	25	0	
	52	95	100	95	85	60	0	0	25	
	53	30	15	0	33	0	75	0	0	
35										

AT 395 507 B

Tabelle 2 (Forts.)

5	Verbindung Nr.	breitblättrige Pflanzen				Gräser			
		weißer Gänsefuß	% Phytotoxizität Senf	Fuchsschwanz	Soja	Fingergras	Paspalum	Hafergras	Reis
10	54	60	87	75	73	35	40	0	0
	55	0	0	0	0	0	0	0	0
	56	55	93	70	90	0	0	0	0
	57	30	45	85	70	0	0	0	0
	58	45	50	30	65	0	0	0	0
	59	0	0	0	0	0	0	0	0
	60	75	98	80	80	20	20	0	0
	61	75	85	80	90	30	25	10	10
	62	45	60	60	70	0	0	30	0
	63	0	0	0	0	0	0	0	0
15	64	70	80	65	75	0	0	0	0
	65	55	60	40	55	0	0	0	0
	66	50	65	50	45	0	0	0	0
	67	95	100	95	95	93	90	90	70
	68	93	98	85	75	75	70	75	20
	69	75	93	75	70	0	0	0	0
	70	95	95	90	85	25	20	20	10
	71	80	93	55	80	25	20	10	10
	72	45	93	50	30	30	35	35	20
	73	93	100	70	93	30	55	45	25
25	74	N.T.*	-	-	-	-	-	-	-
	75	65	75	70	55	25	30	30	20
	76	90	85	85	80	25	20	20	0
	77	85	100	90	75	25	20	20	20
	78	90	98	85	75	20	20	20	0

N.T.* = nicht getestet

Tabelle 2 (Forts.)

5	Verbindung Nr.	breitblättrige Pflanzen			Gräser				
		weißer Gänsefuß	% Phytotoxizität Senf	Fuchsschwanz	Soja	Fingergras	Paspalum	Hafersgras	Reis
	79	90	60	80	93	60	70	70	25
	80	0	20	0	20	0	0	0	0
	81	70	98	85	80	35	65	65	25
10	82	20	25	35	30	0	0	0	0
	83	75	100	75	85	35	20	55	0
	84	60	30	45	40	63	55	40	30
	85	75	40	45	90	45	45	35	0
	86	40	65	35	30	0	0	0	0
	87	90	90	90	90	65	70	70	25
	88	80	65	55	85	20	20	10	10
	89	85	98	90	88	0	65	90	0
	90	85	70	50	83	55	65	70	30
	91	83	98	85	75	25	60	78	10
	92	0	0	0	0	0	0	0	0
	93	70	80	65	80	30	35	25	0
	94	25	20	20	20	0	0	0	0
	95	65	65	65	40	25	20	0	0
	96	65	70	70	55	0	0	0	0
	97				55				
20									
	30								
	35								

Tabelle 2A

Vergleichsverbindungen

nachemergente Herbicidverbindungen
Dosierungsmenge: 27.5 Microgramm/cm², wenn nicht anders angegeben

10	Verbindung Nr.	breitblättrige Pflanzen			Gräser				
		weißer Gänsefuß	% Phytotoxizität Senf	Fuchsschwanz	Soja	Fingergras	% Phytotoxizität Paspalum	Hafgras	Reis
15	C-1	20	0	0	25	0	0	0	0
	C-2	0	0	0	0	0	0	0	0
	C-3	0	0	0	0	0	0	0	0
	C-4	0	0	0	0	0	0	0	0
	C-5	0	0	0	0	0	0	0	0
	C-6	0	0	0	0	0	0	0	0
	C-7	0	0	0	0	0	0	0	0
	C-8	25	20	25	30	0	0	0	0
	C-9	20	20	10	25	0	0	0	0
	C-10	0	0	0	0	0	0	0	0
20	C-11	20	0	0	20	0	0	0	0
	C-12	0	0	0	0	0	0	0	0
	C-13	0	0	0	0	0	0	0	0
	C-14	0	0	0	0	0	0	0	0
	C-15	25	0	0	30	25	10	45	0
	C-16	0	0	0	0	0	0	0	0
25									
30									

Wie aus Tabelle 1 ersichtlich ist, zeigen die erfundungsgemäßen Verbindungen im allgemeinen eine hervorragende phytotoxische Wirkung vor Pflanzenaustrieb, besonders die Verbindungen Nr. 2, 4, 7, 9, 12, 14, 16 und 22. Wie weiters aus Tabelle 2 ersichtlich ist, zeigen die Verbindungen im allgemeinen auch nachemergente phytotoxische Wirksamkeit gegen breitblättrige Pflanzen und teilweise auch gegen Gräser, besonders die Verbindung Nr. 7, 9, 12, 14, 16, 22 und 23. Weiters ist aus den Tabellen ersichtlich, daß die entsprechenden Vergleichsverbindungen eine viel schwächere Wirkung zeigten als die entsprechenden Verbindungen der vorliegenden Erfindung.

Es ist offensichtlich, daß auch viele Modifikationen und Abwandlungen der vorliegend beschriebenen Erfindung möglich sind, ohne daß dadurch das Wese bzw. der Rahmen der Erfindung eingeschränkt würde.

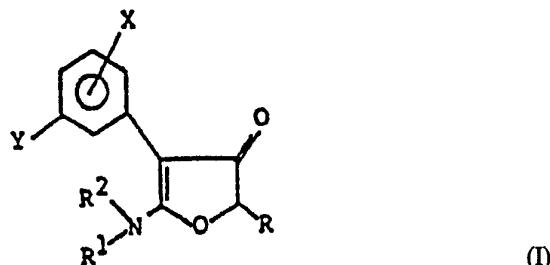
10

PATENTANSPRÜCHE

15

1. Unkrautvernichtungsmittel, dadurch gekennzeichnet, daß es einen geeigneten Trägerstoff und eine herbizid wirksame Menge einer Verbindung der Formel

20

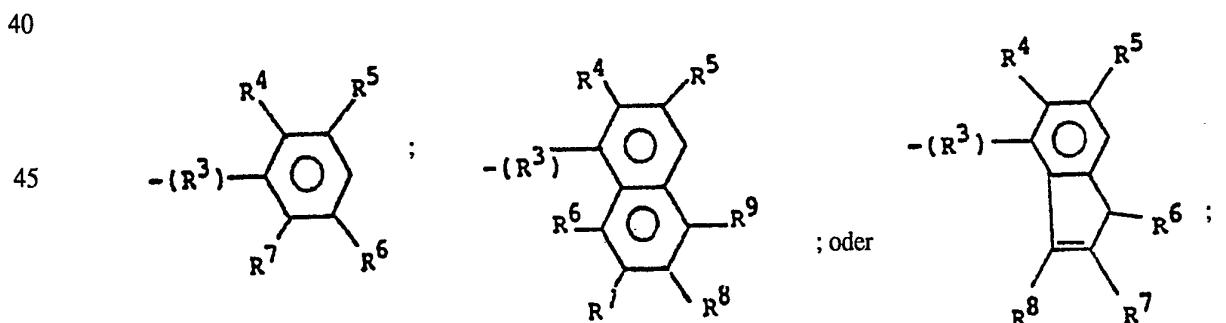


25

enthält, in welcher R niederes Alkyl, Cycloalkyl mit 3 bis 7 Kohlenstoffatomen, niederes Alkenyl, Haloalkyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen und 1 bis 3 Halogenatomen aus jeweils einem Element der Gruppe Fluor, Chlor, Brom oder Jod; Haloalkenyl mit 2 bis 4 Kohlenstoffatomen und 1 bis 3 Halogenatomen aus jeweils einem Element der Gruppe Fluor, Chlor, Brom oder Jod; niederes Alkoxy; niederes Alkylthio; niederes Alkoxyalkyl, dessen Alkyl- und Alkoxykomponenten unabhängig voneinander 1 bis 3 Kohlenstoffatome aufweisen; Alkylthioalkyl, dessen Alkylkomponenten jeweils 1 bis 3 Kohlenstoffatome aufweisen; Phenyl, Naphth-1-yl, Inden-1-yl; 4-Fluorphenyl; Arylalkylen mit 1 bis 3 Kohlenstoffatomen in der Alkylenkomponente, wobei die Arylkomponente Phenyl, Naphth-1-yl oder Inden-1-yl ist; oder ein substituiertes Aryl oder substituiertes Arylalkylen aus der Gruppe der Formeln

30

35



50

ist, worin einer, zwei oder drei der Substituenten R⁴, R⁵, R⁶, R⁷, R⁸ und R⁹ jeweils ein Element aus der Gruppe niederes Alkyl, niederes Alkoxy, Halogen, Nitro oder Haloalkyl mit 1 bis 3 Kohlenstoffatomen und 1 bis 3 Halogenatomen, die gleich oder verschieden sein können, und der Rest Wasserstoff ist und worin R³ eine Einfachbindung oder Alkylen mit 1 bis 3 Kohlenstoffatomen ist; R¹ Wasserstoff oder Alkyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen; R² Wasserstoff, Alkyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen, Alkenyl mit 3 oder 4 Kohlenstoffatomen, niede-

resAlkoxycarbonylalkyl, niederes Alkoxyalkyl oder niederes Alkylthioalkyl ist; R¹ und R² zusammen mit dem Stickstoffatom, mit dem sie verbunden sind, einen gesättigten oder ungesättigten Stickstoff-Heterozyklus mit 3 bis 6 Ringatomen, von denen eines Stickstoff und die übrigen Kohlenstoffatome sind, bilden; X Wasserstoff, niederes Alkyl, niederes Alkoxy, Halogen oder Trifluormethyl ist und an jeder beliebigen Stelle des Phenylringes stehen kann, und Y niederes Alkyl, niederes Alkoxy, Halogen, niederes Haloalkyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen und 1 bis 3 Halogenatomen, die gleich oder verschieden sein können, niederes Haloalkyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen und 1 bis 3 Halogenatomen, die gleich oder verschieden sein können, oder niederes Haloalkylthio mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen und 1 bis 3 Halogenatomen, die gleich oder verschieden sein können, ist, vorausgesetzt, daß, wenn Y Halogen ist, R, R¹ und R² nicht alle Wasserstoff sind, und weiters vorausgesetzt, daß, wenn Y nicht Trifluormethyl und X nicht Wasserstoff ist und R¹ und R² jeweils Wasserstoff sind, R Methyl, Äthyl, Propyl, 2-Halophenyl, 2-Niederalkyl-phenyl oder 4-Fluorphenyl ist, sowie geeignete Salze derselben oder Mischungen dieser Verbindungen mit dem Trägerstoff enthält.

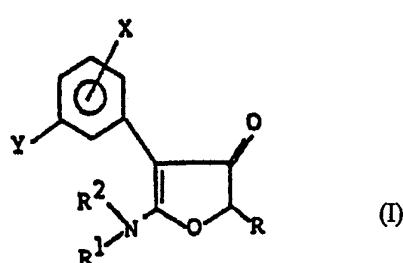
2. Unkrautvernichtungsmittel nach Anspruch 1, dadurch gekennzeichnet, daß R Phenyl ist.

3. Unkrautvernichtungsmittel nach Anspruch 2, dadurch gekennzeichnet, daß einer der Substituenten R¹ oder R² Wasserstoff und der andere Wasserstoff, Methyl oder Äthyl ist.

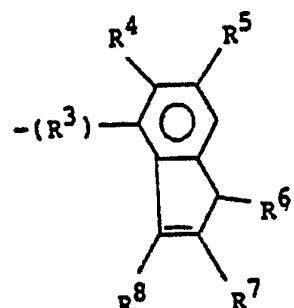
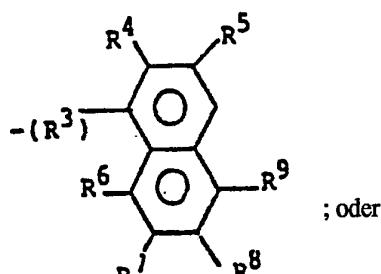
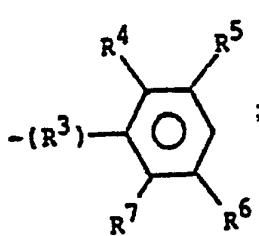
4. Unkrautvernichtungsmittel nach Anspruch 2 oder 3, dadurch gekennzeichnet, daß X Wasserstoff ist.

5. Verfahren zur Vernichtung von Pflanzen vor oder nach dem Austrieb, dadurch gekennzeichnet, daß Unkrautvernichtungsmittel gemäß einem der Ansprüche 1 bis 4 auf die Blätter bzw. das voraussichtliche Wachstumsmedium dieser Pflanzen aufgebracht wird.

6. Pflanzenwuchsregulans, dadurch gekennzeichnet, daß es eine den Wachstumsverlauf der Pflanzen verändernde Wirkstoffmenge einer Verbindung der Formel



enthält, in welcher R niederes Alkyl, Cycloalkyl mit 3 bis 7 Kohlenstoffatomen, niederes Alkenyl, Haloalkyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen und 1 bis 3 Halogenatomen aus jeweils einem Element der Gruppe Fluor, Chlor, Brom oder Jod; Haloalkenyl mit 2 bis 4 Kohlenstoffatomen und 1 bis 3 Halogenatomen aus jeweils einem Element der Gruppe Fluor, Chlor, Brom oder Jod; niederes Alkoxy; niederes Alkylthio; niederes Alkoxyalkyl, dessen Alkyl- und Alkoxykomponenten unabhängig voneinander 1 bis 3 Kohlenstoffatome aufweisen; Alkylthioalkyl, dessen Alkylkomponenten jeweils 1 bis 3 Kohlenstoffatome aufweisen; Phenyl, Naphth-1-yl, Inden-1-yl; 4-Fluorphenyl; Arylalkylen mit 1 bis 3 Kohlenstoffatomen in der Alkylenkomponente, wobei die Arylkomponente Phenyl, Naphth-1-yl oder Inden-1-yl ist; oder ein substituiertes Aryl oder substituiertes Arylalkylen aus der Gruppe der Formeln



AT 395 507 B

ist, worin einer, zwei oder drei der Substituenten R⁴, R⁵, R⁶, R⁷, R⁸ und R⁹ jeweils ein Element aus der Gruppe niederes Alkyl, niederes Alkoxy, Halogen, Nitro oder Haloalkyl mit 1 bis 3 Kohlenstoffatomen und 1 bis 3 Halogenatomen, die gleich oder verschieden sein können, und der Rest Wasserstoff ist und worin R³ eine Einfachbindung oder Alkylen mit 1 bis 3 Kohlenstoffatomen ist; R¹ Wasserstoff oder Alkyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen; R² Wasserstoff, Alkyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen, Alkenyl mit 3 oder 4 Kohlenstoffatomen, niederes Alkoxy carbonylalkyl, niederes Alkoxyalkyl oder niederes Alkylthioalkyl ist; R¹ und R² zusammen mit dem Stickstoffatom, mit dem sie verbunden sind, einen gesättigten oder ungesättigten Stickstoff-Heterozyklus mit 3 bis 6 Ringatomen, von denen eines Stickstoff und die übrigen Kohlenstoffatome sind, bilden; X Wasserstoff, niederes Alkyl, niederes Alkoxy, Halogen oder Trifluormethyl ist und an jeder beliebigen Stelle des Phenylringes stehen kann, und Y niederes Alkyl, niederes Alkoxy, Halogen, niederes Haloalkyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen und 1 bis 3 Halogenatomen, die gleich oder verschieden sein können, niederes Haloalkyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen und 1 bis 3 Halogenatomen, die gleich oder verschieden sein können, oder niederes Haloalkylthio mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen und 1 bis 3 Halogenatomen, die gleich oder verschieden sein können, ist, vorausgesetzt, daß, wenn Y Halogen ist, R, R¹ und R² nicht alle Wasserstoff sind, und weiters vorausgesetzt, daß, wenn Y nicht Trifluormethyl und X nicht Wasserstoff ist und R¹ und R² jeweils Wasserstoff sind, R Methyl, Äthyl, Propyl, 2-Halophenyl, 2-Niederalkylphenyl oder 4-Fluorphenyl ist, sowie geeignete Salze derselben, bzw. eine Mischung aus diesen Verbindungen enthält.

7. Verfahren zur Regulierung des Pflanzenwachstums, dadurch gekennzeichnet, daß ein Pflanzenwuchsregulans gemäß Anspruch 6 auf die Blätter bzw. das Wachstumsmedium der Pflanzen in das Wachstum der Pflanzen verändernder Menge aufgebracht wird.

25

30

35

40

45

50

55