



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.

(56) Entgegenhaltungen:

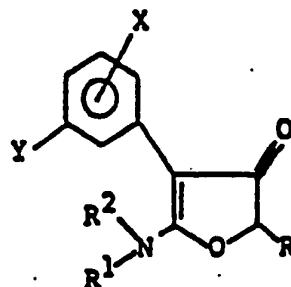
US-A-4441910

(73) Patentinhaber:

CHEVRON RESEARCH COMPANY
SAN FRANCISCO (US).

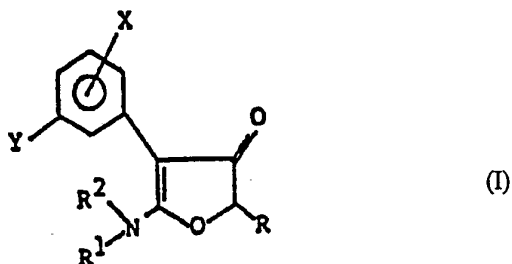
(54) UNKRAUTVERNICHTUNGSMITTEL

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

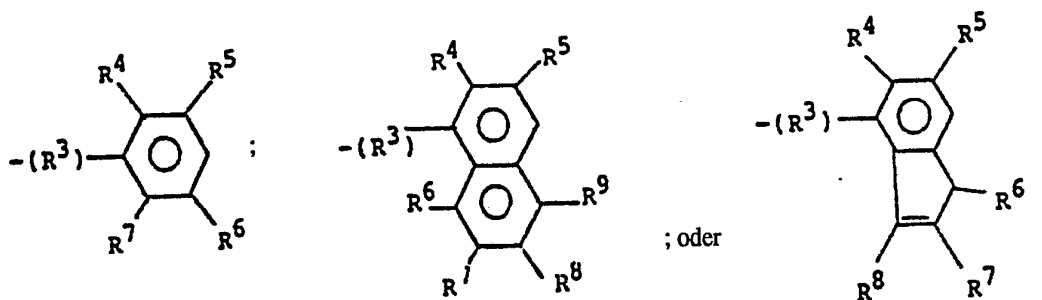


AT 395 507 B

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



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



ist, worin einer, zwei oder drei der Substituenten R^4 , R^5 , R^6 , R^7 , R^8 und R^9 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 R^3 eine Einfachbindung oder Alkylen mit 1 bis 3 Kohlenstoffatomen ist; R^1 Wasserstoff oder Alkyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen; R^2 Wasserstoff, Alkyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen, Alkenyl mit 3 oder 4 Kohlenstoffatomen, niederes Alkoxycarbonylalkyl, niederes Alkoxyalkyl oder niederes Alkylthioalkyl ist; R^1 und R^2 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 Phenylrings 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 , R^1 und R^2 nicht alle Wasserstoff sind, und weiter vorausgesetzt, daß, wenn Y nicht Trifluormethyl und X nicht Wasserstoff ist und R^1 und R^2 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 verzweigtkettige Alkylengruppen, wie z. B. $-\text{CH}_2-$; $-\text{CH}_2\text{CH}_2-$;

25
$$\begin{array}{c} \text{CH}_3 \\ | \\ -\text{CH}_2\text{CH}_2- \text{ und dgl.} \end{array}$$

„Niederes Alkoxy“ bezieht sich im vorliegenden Text auf die Gruppe $-\text{OR}'$, worin R' niederes Alkyl ist.

„Niederes Alkylthio“ bezieht sich auf die Gruppe $-\text{SR}'$, worin R' niederes Alkyl ist.

„Niederes Alkoxyalkyl“ bezieht sich auf die Gruppe $\text{R}'\text{OR}''$, worin R' und R'' unabhängig voneinander gerad- oder verzweigtkettige Alkylgruppen mit 1 bis 3 Kohlenstoffatomen sind.

30 Der Ausdruck „niederes Alkylthioalkyl“ bezieht sich auf die Gruppe $\text{R}'\text{SR}''$, worin R' und R'' jedes für sich gerad- oder verzweigtkettige Alkylgruppen mit 1 bis 3 Kohlenstoffatomen sind.

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

35
$$\begin{array}{c} \text{O} \\ || \\ \text{R}'\text{OCR}''- \end{array}$$

40 worin R' niederes Alkyl und R'' Alkylen mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen ist, die gerad- oder verzweigtkettig sein können. Typische Alkoxy-carbonylalkylgruppen sind beispielsweise $-\text{CH}_2\text{C}(\text{O})\text{OCH}_3$; $-\text{CH}(\text{CH}_3)\text{C}(\text{O})\text{CC}_2\text{H}_5$ und dgl.

„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.

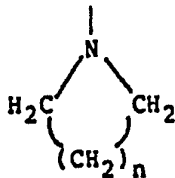
„Aryl“ bezieht sich auf Arylgruppen mit 6 bis 10 Kohlenstoffatomen, beispielsweise Phenyl, Naphthyl, Indenyl. In charakteristischer Weise wird als Arylgruppe Phenyl oder Naphthyl verwendet werden, da Verbindungen mit solchen Gruppen viel leichter im Handel erhältlich sind als andere Arylverbindungen.

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-methylphenyl; 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 ArR^3 , worin Ar Aryl und R^3 Alkylen mit 1 bis 3 Kohlenstoffatomen ist, und umfaßt sowohl gerad- als auch verzweigtkettige Alkylene wie z. B. Methylen, Äthyl, 1-Methyläthyl und Propyl.

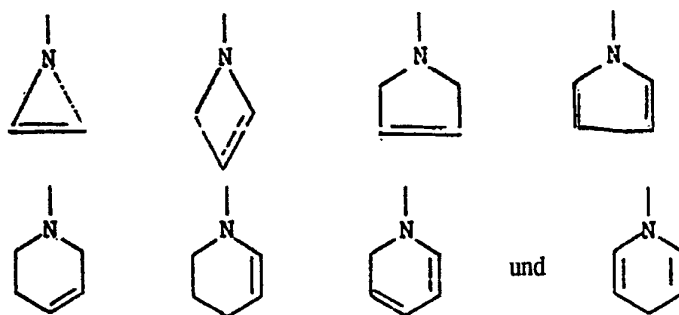
Der Ausdruck „(substituiertes Aryl)alkylen“ oder „Ring-substituiertes Arylalkylen“ bezieht sich auf die Gruppe $\text{Ar}'\text{R}^3$ -, worin Ar' substituiertes Aryl und R^3 Alkylen gemäß der Definition für „Arylalkylen“ ist.

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



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



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, aurenäre Ammoniumsake, 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 Pflanzenwachses, 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 Dosierungsmenge 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.), Talkum, Pyrophyllit, Kieselgur, synthetischer Kiesel sand, Kalziumaluminiumsilikat, 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 Aerosol-trägerstoffe, 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 Pflanzenwuchsregulanten 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 Pflanzenwuchsregulanten 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, sofern 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), Doppeldubletts (dd), Triplets (t), Doppeltriplets (dt), Quartetts (q) und Multiplets (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 beigegeben 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;
 (3-Bromo-2-äthylphenyl)-naphth-1-ylmethylen-carbonyl-acetonitril;
 10 (2,3-Dimethylphenyl)-beta-naphth-1-ylmethyl-carbonyl-acetonitril;
 (3-Chlorphenyl)-benzylcarbonyl-acetonitril;
 (3-Methylphenyl)-benzylcarbonyl-acetonitril;
 (3-t-Butoxyphenyl)-benzylcarbonyl-acetonitril;
 (3-Propylphenyl)-benzylcarbonyl-acetonitril;
 15 (3-Bromophenyl)-benzylcarbonyl-acetonitril;
 (3-Jodophenyl)-(3-nitrobenzylcarbonyl)-acetonitril;
 (3-Trifluormethylphenyl)-(2,3-dichlorbenzyl-carbonyl)-acetonitril;
 (3-Methoxyphenyl)-1-naphthylmethylen carbonylacetonitril;
 (3-Trifluormethyl)-(3-chlor-8-fluornaphth-1-ylmethylen-carbonyl)-acetonitril;
 20 (3-Trifluormethyl)-[(2-trifluormethyl-3-methyl-8-methoxy-naph-1-yl)methylencarbonyl]-acetonitril;
 (3-Trifluormethyl)-(inden-1-ylmethylen-carbonyl)-acetonitril; und
 (3-Trifluormethyl)-(2-fluorinden-1-yl-methylencarbonyl)-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:

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;
 2-Phenyl-3-oxo-4-(3-trifluormethoxyphenyl)-5-amino-2,3-dihydrofuran;
 45 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;
 2-Phenyl-3-oxo-4-(5-methoxy-3-chlorphenyl)-5-amino-2,3-dihydrofuran;
 50 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;
 2-(2-Nitrophenyl)-3-oxo-4-(3-bromophenyl)-5-amino-2,3-dihydrofuran;
 55 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-Dichlorphenyl)-3-oxo-4-(3-trifluormethylphenyl)-5-amino-2,3-dihydrofuran;
 2-(1-Naphthyl)-3-oxo-4-(3-methoxyphenyl)-5-amino-2,3-dihydrofuran;
 2-(3-Chlor-8-fluornaphth-1-yl)-3-oxo-4-(3-trifluormethylphenyl)-5-amino-2,3-dihydrofuran;
 10 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 befüllt. Dem Lösungsmittel wurden unter Rühren 3,5 g Natrium beigemischt. Nach Auflösung des ganzen Metalls wurde dem Reaktionsgemisch eine Lösung aus 13,0 g Äthyl-L-(+)-lactat und 18,5 m-Trifluormethylphenylacetnitril 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 beigemischt, 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;
 2-Methyl-3-oxo-4-(3-difluormethylthiophenyl)-5-amino-2,3-dihydrofuran;
 50 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;
 2-Trifluormethyl-3-oxo-4-(4-fluorphenyl)-5-amino-2,3-dihydrofuran;
 55 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-Putyl-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-bromphenyl)-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-difluorphenyl)-5-amino-2,3-dihydrofuran;
 2-Vinyl-3-oxo-4-(3,5-diäthylphenyl)-5-amino-2,3-dihydrofuran;
 2-Allyl-3-oxo-4-(3-propoxyphenyl)-5-amino-2,3-dihydrofuran;
 2-Trifluormethyl-3-oxo-4-(3-fluorphenyl)-5-amino-2,3-dihydrofuran;
 10 2-Propyl-3-oxo-4-(3-bromophenyl)-3-oxo-5-amino-2,3-dihydrofuran;
 2-Phenyl-3-oxo-4-(2-jod-3-fluorphenyl)-5-amino-2,3-dihydrofuran;
 2-Benzyl-3-oxo-4-(2-isopropoxy-3-trifluormethylphenyl)-5-amino-2,3-dihydrofuran;
 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;
 15 2-(3-Methylphenyl)-3-oxo-4-(3-butyl-4-methylphenyl)-3-oxo-5-amino-2,3-dihydrofuran;
 2-(3-Fluorphenyl)-3-oxo-4-(3-chlorophenyl)-5-amino-2,3-dihydrofuran;
 2-(2,3,5-Trifluorphenyl)-3-oxo-4-(3-trifluormethylphenyl)-5-amino-2,3-dihydrofuran;
 2-(3-Methylnaph-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;
 20 2-Fluormethyl-3-oxo-4-(3-trifluormethylphenyl)-5-amino-2,3-dihydrofuran;
 2-Methoxymethylen-3-oxo-4-(3-trifluormethylphenyl)-5-amino-2,3-dihydrofuran;
 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;
 25 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 beigegeben 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
 35 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
 40 Feststoffes.

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

10 g (3-Trifluormethylphenyl)-methoxyacetyl-acetonitril wurden tropfenweise einer Aufschlammung 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
 50 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 beigegeben und das Gemisch über Nacht (etwa 14-16 Stunden) gerührt. Dem Gemisch wurde dann Wasser beigegeben, 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-fluorphenyl)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;
 10 (3-Trifluormethylphenyl)-[2-methoxy-3-(2-chloro-3-propylphenyl)propionyl]acetonitril;
 (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 disubstituiertes 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 40 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.

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 45 anderen in Beispiel 5 angegebenen Verbindungen verwendet werden, wodurch die folgenden Verbindungen hergestellt werden können:

- 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-ylmethylene-3-oxo-4-(3-trifluormethylphenyl)-5-amino-2,3-dihydrofuran;
 2-(2-Fluornaphth-1-ylmethylene)-3-oxo-4-(3-trifluormethylphenyl)-5-amino-2,3-dihydrofuran;
 2-(3-Butylnaphth-1-ylmethylene)-3-oxo-4-(3-trifluormethylphenyl)-5-amino-2,3-dihydrofuran;
 2-(5-Methoxynaphth-1-ylmethylene)-3-oxo-4-(3-trifluormethylphenyl)-5-amino-2,3-dihydrofuran;
 10 2-(6-Nitronaphth-1-ylmethylene)-3-oxo-4-(3-trifluormethylphenyl)-5-amino-2,3-dihydrofuran;
 2-(7-Trifluormethylnaphth-1-ylmethylene)-3-oxo-4-(3-trifluormethylphenyl)-5-amino-2,3-dihydrofuran;
 2-(2-Chlor-8-methylnaphth-1-ylmethylene)-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;
 2-(Beta-naphth-1-ylethyl)-3-oxo-4-(3-trifluormethylphenyl)-5-amino-2,3-dihydrofuran;
 15 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-ylmethylene-3-oxo-4-(3-trifluormethylphenyl)-5-amino-2,3-dihydrofuran; und
 2-(2-Fluorinden-1-ylmethylene)-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-Difluormethylthiophenyl)-; 4-(3-Chlorophenyl)-; 4-(2-Bromo-3-trifluormethylphenyl)- und 4-(2-Methyl-3-difluormethylthiophenyl)-Analoga der o. a. Verbindungen erhält.

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 Methylenchlorid bei Raumtemperatur beigelegt, 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;
 2-Phenyl-3-oxo-4-(4-chlor-3-trifluormethylphenyl)-5-methylamino-2,3-dihydrofuran;
 40 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;
 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;
 45 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;
 2-Phenyl-3-oxo-4-(3-trifluormethoxyphenyl)-5-methylamino-2,3-dihydrofuran;
 2-Phenyl-3-oxo-4-(3-trifluormethylthiophenyl)-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;
 2-Phenyl-3-oxo-4-(3-jodophenyl)-5-methylamino-2,3-dihydrofuran;
 55 2-Phenyl-3-oxo-4-(3-difluormethylthiophenyl)-5-methylamino-2,3-dihydrofuran;
 2-Phenyl-3-oxo-4-(3-trifluormethylthiophenyl)-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-chlorophenyl)-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;
 2-(2-Trifluormethyl-3-methyl-8-methoxynaphth-1-yl)-3-oxo-4-(3-trifluormethylphenyl)-5-methylamino-2,3-
 15 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;
 2-Allyl-3-oxo-4-(2-methoxy-3-trifluormethylphenyl)-5-methylamino-2,3-dihydrofuran;
 25 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;
 2-(2-Chlorovinyl)-3-oxo-4-(5-nitro-3-trifluormethylphenyl)-5-methylamino-2,3-dihydrofuran;
 30 2-Methyl-3-oxo-4-(2-methoxy-3-chlorophenyl)-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;
 2-Trifluormethyl-3-oxo-4-(3-trifluormethyl-4-bromophenyl)-5-methylamino-2,3-dihydrofuran;
 35 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;
 2-Äthyl-3-oxo-4-(3-chlorophenyl)-5-methylamino-2,3-dihydrofuran;
 40 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;
 2-Propyl-3-oxo-4-(2-methoxy-3-chlorophenyl)-5-methylamino-2,3-dihydrofuran;
 45 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;
 2-(2-Chlorovinyl)-3-oxo-4-(3-fluor-4-methylphenyl)-3-oxo-5-methylamino-2,3-dihydrofuran;
 50 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-Fluorphenyl)-3-oxo-4-(3-chlorphenyl)-5-methylamino-2,3-dihydrofuran;
 5 2-(2,3,5-Trifluorphenyl)-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
 2-(1-propylthioäthyl)-3-oxo-4-(3-trifluormethylphenyl)-5-methylamino-2,3-dihydrofuran;
 15 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;
 2-(3-Nitrobenzyl)-3-oxo-4-(3-trifluormethylphenyl)-5-methylamino-2,3-dihydrofuran;
 20 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;
 2-(2-Fluor-3-2',2'-dichloräthylbenzyl)-3-oxo-4-(3-trifluormethylphenyl)-5-methylamino-2,3-dihydrofuran;
 25 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;
 2-Naphth-1-ylmethylen-3-oxo-4-(3-trifluormethylphenyl)-5-methylamino-2,3-dihydrofuran;
 30 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;
 2-(7-Trifluormethylnaphth-1-ylmethylen)-3-oxo-4-(3-trifluormethylphenyl)-5-methylamino-2,3-dihydrofuran;
 35 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-trifluormethylphenyl)-5-methylamino-2,3-dihydrofuran;
 2-(Beta-naphth-1-yläthyl)-3-oxo-4-(3-trifluormethylphenyl)-5-methylamino-2,3-dihydrofuran;
 40 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-
 55 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-Analoge 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-Analoge 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-Analoge 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;
2-Äthoxymethylen-3-oxo-4-(3-trifluormethylphenyl)-5-äthylthiomethylamino-2,3-dihydrofuran;
20 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.

35 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-methoxymethyl-amino)-, 5-(N-Methyl-N-äthylthiomethylamino)-, 5-(N-Methyl-N-methoxycarbonylmethylamino)- und 5-(N-Methyl-N-1'-methoxycarbonylpropylamino)-Analoge hergestellt werden.

Vorschrift 9:

40 Lithiumsalz von 2-Phenyl-3-oxo-4-(3-trifluormethylphenyl)-5-methylamino-2,3-dihydrofuran ($R^1 = -CH_2$, $R^2 = Li$)

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 beigelegt. 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.

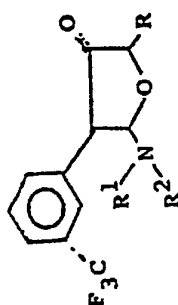
50 Ähnlich können durch entsprechende Abwandlung der obigen Verfahren die entsprechenden Lithiumsalze der Verbindungen aus Beispielen 2-5 hergestellt werden.

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.

QUERTABELLEN (8 Seiten)

Tabelle A



No.	R ¹	R ²	R	Kohlenstoff		Elementaranalyse		Stickstoff		Schmelzpunkt °C
				ber.	gef.	ber.	gef.	ber.	gef.	
1	H	H	Ø**	63.95	64.66	3.76	4.19	4.33	4.78	182-184*
2	CH ₃	H	Ø	64.86	64.22	4.20	4.65	4.20	3.79	154-155
3	CH ₃	CH ₃	Ø	65.71	65.63	4.61	4.83	4.03	4.12	102-106
4	CH ₂ CH ₃	H	Ø	65.71	66.55	4.61	5.12	4.03	3.98	143-145
5	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	Ø	67.20	67.76	5.33	5.63	3.73	3.77	115-120
6	H	H	4-FØ	60.53	59.66	3.26	3.47	4.15	4.12	136-138
7	CH ₃	H	2-FØ	61.54	61.22	3.70	3.62	3.99	4.45	151-156
8	CH ₃	CH ₃	2-FØ	62.47	62.95	4.11	4.38	3.84	4.08	91-93
9	CH ₂ CH ₃	H	2-FØ	62.47	60.36	4.11	4.11	3.84	4.02	136-138
10	(CH ₂) ₂ CH ₃	H	2-FØ	63.32	63.6	4.49	4.7	3.69	3.71	53-60
11	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	2-FØ	64.12	63.41	4.83	4.93	3.56	3.85	
12	CH ₃	H	2-ClØ	58.78	58.52	3.54	3.63	3.81	4.05	201-204*

* = Zersetzung

Ø** = Phenyl, z. B. , 2-ClØ = 2-Chlorphenyl

Tabelle A (Forts.)

No.	R ¹	R ²	R	Kohlenstoff		Elementaranalyse Wasserstoff		Stickstoff		Schmelz- punkt °C
				ber.	gef.	ber.	gef.	ber.	gef.	
13	CH ₃	CH ₃	2-ClØ*	59.77	59.67	3.93	4.05	3.67	3.72	116-119
14	CH ₂ CH ₃	H	2-ClØ	59.77	60.5	3.93	4.05	3.67	3.89	131-137
15	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	2-ClØ	61.55	61.72	4.64	4.79	3.42	3.77	113-114
16	H	H	2-CH ₃ Ø	64.86	65.02	4.20	4.43	4.20	4.28	179-181*
17	H	H	3-CH ₃ Ø	64.86	62.54	4.20	4.27	4.20	3.82	148-151
18	H	H	4-CH ₃ Ø	64.86	65.86	4.20	4.25	4.20	4.34	208-211*
19	H	H	2-CF ₃ Ø	55.81	55.58	2.84	3.05	3.62	3.69	68-75
20	H	H	3-CF ₃ Ø	55.81	55.37	2.84	3.09	3.62	3.40	60-63
21	H	H	2,6-DiFØ	57.46	57.45	2.82	3.14	3.94	4.16	225-227*
22	CH ₃	H	2,6-DiFØ	58.54	59.3	3.25	3.45	3.79	3.84	191-193*
23	CH ₂ CH ₃	H	2,6-DiFØ	59.53	60.11	3.66	4.00	3.66	3.71	63-65
24	-CH ₂ CH=CH ₂	H	2-FØ	63.66	62.4	3.98	4.31	3.71	4.27	Øl
25	H	H	CH ₃	56.03	56.54	3.89	4.22	5.45	5.52	129-130
26	-CH ₂ Cl(Cl)=CH ₂	H	Ø	61.0	57.9	3.8	3.9	3.55	3.2	Øl
27	-CH ₂ CH=C(Cl)CH ₃	H	Ø	61.8	61.3	4.2	4.7	3.4	3.1	134-138
28	-CH(CH ₃)COOC ₂ H ₅	H	Ø	63.0	61.5	4.8	5.0	3.3	3.2	Øl
29	Li	-CH ₃	Ø	63.74	61.82	3.84	4.9	4.13	3.48	120*
30	H	H	1-Naphthyl	68.3	65.8	3.8	4.1	3.8	3.8	123-126
31	CH ₃	H	1-Naphthyl	68.9	65.7	4.18	4.4	3.7	3.55	174-179
32	CH ₃	CH ₃	1-Naphthyl	69.5	69.2	4.5	4.7	3.5	3.6	139-143

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

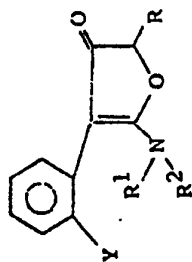
* = Zersetzung

Tabelle A (Forts.)

No.	R ¹	R ²	R	Kohlenstoff		Elementaranalyse Wasserstoff		Stickstoff		Schmelz- punkt °C
				ber.	gef.	ber.	gef.	ber.	gef.	
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
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
43	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

* = Zersetzung

Tabelle B



No.	R ¹	R ²	R	Y	Elementaranalyse		Stickstoff		Schmelzpunkt °C
					Kohlenstoff	Wasserstoff	ber.	gef.	
48	H	H	2-CH ₃ Ø	Cl	68.11	4.67	4.67	4.96	175-177
49	H	H	2-FØ	Cl	63.26	3.62	4.61	4.17	178-180*
50	CH ₃	H	2-ClØ	Cl	61.08	3.87	4.19	4.33	185-193*
51	CH ₃	H	H	Cl	59.07	4.48	6.27	6.24	117-120*
52	CH ₂ CH ₃	H	H	Cl	60.64	5.05	5.90	6.03	177-178
53	H	H	CH ₃	Cl	59.07	4.48	6.27	5.73	158-159
54	CH ₃	H	CH ₃	Cl	66.64	5.05	5.90	6.05	119-122
55	H	H	CH ₂ CH ₃	Cl	60.64	5.09	5.89	5.67	152-155
56	CH ₃	H	CH ₂ CH ₃	Cl	62.03	5.61	5.56	5.96	95-97
57	CH ₃	CH ₃	CH ₂ CH ₃	Cl	63.28	6.07	5.27	5.93	Øl
58	CH ₂ CH ₂	H	CH ₂ CH ₃	Cl	63.28	6.7	5.27	5.89	120-123
59	H	H	(CH ₂) ₂ CH ₃	Cl	62.03	5.61	5.56	5.63	152-154
60	CH ₃	H	(CH ₂) ₂ CH ₃	Cl	63.28	6.07	5.27	5.86	oil

* = Zersetzung

Tabelle B (Forts.)

No.	R ¹	R ²	R	Y	Elementaranalyse		Stickstoff		Schmelzpunkt °C
					Kohlenstoff	Wasserstoff	ber.	gef.	
61	CH ₂ CH ₃	H	(CH ₂) ₂ CH ₃	Cl	64.40	65.34	6.49	7.11	5.01
62	CH ₃	CH ₃	(CH ₂) ₂ CH ₃	Cl	64.40	64.14	6.49	6.65	5.01
63	H	H	CH ₂ (CH ₃) ₂	Cl	62.04	63.69	5.57	6.05	5.57
64	CH ₃	H	CH ₂ (CH ₃) ₂	Cl	63.29	63.03	6.03	6.72	5.27
65	CH ₂ CH ₃	H	CH ₂ (CH ₃) ₂	Cl	64.41	65.66	6.44	6.83	5.01
66	H	H	Ø	Br	58.20	54.8	3.64	3.79	4.24
67	CH ₃	H	Ø	Br	59.32	60.79	4.07	4.36	4.07
68	CH ₂ CH ₃	H	Ø	Br	60.35	61.01	4.47	4.74	3.91
69	H	H	2-ClØ	Br	52.69	54.59	3.02	3.26	3.84
70	CH ₃	H	2-ClØ	Br	53.91	53.77	3.44	3.47	3.70
71	CH ₂ CH ₃	H	2-ClØ	Br	55.05	55.3	3.82	3.97	3.57
72	H	H	2-FØ	Br	55.19	55.14	3.16	3.57	4.02
73	CH ₃	H	2-FØ	Br	56.37	58.0	3.59	3.41	3.87
74	CH ₂ CH ₃	H	2-FØ	Br	57.46	57.59	3.99	4.31	3.72
75	H	H	2-CH ₃ Ø	Br	59.32	58.48	4.07	4.22	4.07
76	CH ₃	H	2-CH ₃ Ø	Br	60.35	60.36	4.47	4.68	3.91
77	CH ₂ CH ₃	H	2-CH ₃ Ø	Br	61.31	62.98	4.84	5.16	3.76
78	CH ₃	H	H	Br	49.21	48.01	3.73	4.41	5.23
79	CH ₂ CH ₃	H	H	Br	51.08	50.35	4.26	4.28	4.97
80	H	H	Ø	CH ₃	77.0	76.3	5.7	5.9	5.3

* = Zersetzung

Tabelle B. (Forts.)

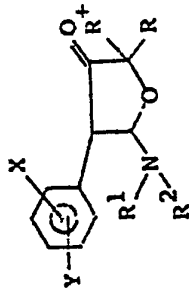
5	No.	R ¹	R ²	R	Y	Kohlenstoff		Elementaranalyse		Stickstoff		Schmelzpunkt °C
						ber.	gef.	ber.	gef.	ber.	gef.	
10	81	CH ₃	H	Ø	CH ₃	77.4	77.1	6.1	6.4	5.0	5.1	150-152
	82	H	H	Ø	OCH ₃	72.6	73.7	5.4	6.6	5.0	5.1	141-144
	83	CH ₃	H	Ø	OCH ₃	73.2	72.5	5.8	5.9	4.7	3.6	128-133
	84	CH ₃	H	Ø	OCH(CH ₃) ₂	74.30	70.02	6.5	6.47	4.33	4.21	185-188*
	85	CH ₂ CH ₃	H	Ø	OCH(CH ₃) ₂	74.25	75.88	6.87	7.23	4.15	4.23	111-113
15	86	H	H	2-CH ₃ Ø	OCH(CH ₃) ₂	74.28	73.58	6.55	6.85	4.33	4.17	149-151
	87	CH ₃	H	2-CH ₃ Ø	OCH(CH ₃) ₂	74.75	74.35	6.82	6.95	4.15	3.83	134-135
	88	CH ₂ CH ₃	H	2-CH ₃ Ø	OCH(CH ₃) ₂	75.19	73.63	7.17	7.27	3.99	4.19	134-136
	89	H	H	2-FØ	OCH(CH ₃) ₂	69.71	70.7	5.54	5.74	4.28	4.25	150-151
	90	CH ₃	H	2-FØ	OCH(CH ₃) ₂	70.37	69.66	5.91	6.1	4.10	4.25	191-193
20	91	H	H	2-ClØ	OCH(CH ₃) ₂	66.38	68.29	4.07	4.36	5.28	5.48	171-173
	92	H	H	CH ₃	OCH(CH ₃) ₂	68.0	65.75	6.9	6.6	5.7	5.6	151-155
	93	CH ₃	H	CH ₃	OCH(CH ₃) ₂	68.97	68.69	7.28	8.01	5.36	6.15	114-115
	94	H	H	Ø	-OØ	76.95	76.3	5.0	6.0	4.1	3.0	73-78
	95	CH ₃	H	Ø	-OØ	77.3	73.9	5.3	5.6	3.9	4.1	163-167
25	96 ¹	CH ₃	CH ₃	Ø	Y=Cl, X=Cl	62.1	62.9	4.3	4.7	4.0	4.0	133-137
	97	-CH ₂ (CH ₂) ₂ CH ₂ -	CH ₃	Ø	-CF ₃	67.55	72.4	4.85	5.1	3.75	3.8	105-111

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)				Schmelzpunkt °C		
No.	R ¹	R ²	R	Y	Kohlenstoff		Elementaranalyse Wasserstoff			Stickstoff	
					ber.	gef.	ber.	gef.		ber.	gef.
C-1	CH ₃	CH ₃	Ø	H	77.42	75.64	6.09	6.39	5.02	5.03	111-115
C-2	H	H	H	H	68.57	68.99	5.14	5.78	8.0	7.87	221-223*
C-3	H	H	H	3-Cl	57.29	51.6	6.68	5.67	3.82	3.7	214-216*
C-4	H	H	H	4-Cl	57.29	53.46	6.68	5.52	3.82	4.11	169-170*
C-5	CH ₃	H	H	4-Cl	59.07	59.34	4.48	5.03	6.27	6.02	133-137*
C-6	CH ₃	CH ₃	H	4-Cl	60.64	58.61	5.05	5.24	5.90	5.76	161-163
C-7	CH ₃	H	Ø	4-Cl	68.1	64.4	4.7	5.3	4.7	4.5	Øl
C-8	H	H	H	4-CH ₃	69.84	67.98	5.82	5.63	7.41	6.7	189-191*
C-9	CH ₃	H	H	4-CH ₃	70.94	70.85	6.4	6.63	6.9	6.96	151-156*

* = Zersetzung

No.	R ¹	R ²	R	Y	Kohlenstoff		Elementaranalyse		Stickstoff		Schmelzpunkt °C
					ber.	gef.	Wasserstoff	ber.	gef.	ber.	
5	C-10	H	Ø	4-CH ₃	77.0	76.2	5.7	5.9	5.3	5.05	142-146
	C-11	CH ₃	Ø	4-CH ₃	77.4	75.49	6.1	6.14	5.0	4.89	148-154
	C-12	H	Ø	4-OCH ₃	72.6	70.5	5.4	6.0	5.0	4.8	138-141
	C-13	CH ₃	Ø	4-OCH ₃	73.8	72.9	6.2	6.7	4.5	4.7	140-143
	C-14	**	H	Ø	3-CF ₃	62.7	62.4	3.4	4.5	6.35	Öl
10	C-15	CH ₃	R=Ø, R ⁺ =Cl	3-CF ₃	59.76	57.9	3.93	4.06	3.67	3.56	Öl
	C-16 ²	H	Ø	Y=3-Cl, X=4-Cl	60.0	60.1	3.5	3.7	4.4	4.8	179-182

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. Der Lösung wurden 110 mg eines nicht-ionischen oberflächenaktiven Stoffes in 2ml Aceton beigelegt. 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)

Tabelle 1

voremergente Herbizidwirkung

Verbindung Nr.	Dosierungsmenge: 27,5 Mikrogramm/cm ² , wenn nicht anders angegeben									
	breitblättrige Pflanzen					Gräser				
	weißer Gänsefuß	Senf	Fuchsschwanz	Soja	Fingergras	Paspalum	% Phytotoxizität	Hafergras	Reis	
1	94	100	100	95	100	100	100	100	93	
2	100	100	100	100	100	100	100	100	100	
3 ^a	98	100	100	60	100	80	100	100	60	
4 ^a	95	100	100	98	100	100	100	100	75	
5	100	80	100	20	100	70	100	100	20	
6	100	100	100	85	100	100	100	100	85	
7 ^a	100	100	100	100	100	100	100	100	100	
8 ^a	98	100	100	100	100	100	100	100	70	
9 ^a	100	100	100	100	100	100	100	100	100	
10	100	100	100	90	100	100	100	100	90	
11 ^a	90	50	100	60	100	50	100	60	20	
12 ^a	100	100	100	90	100	100	100	100	95	
13 ^a	100	100	100	100	100	100	100	100	95	
14 ^a	100	100	100	70	100	100	100	100	95	
15 ^a	95	90	100	20	100	50	100	70	0	
16	100	100	100	85	100	100	100	100	95	
17	99	83	98	55	100	70	63	55	55	
18	0	0	0	0	0	0	0	0	0	
19 ^a	100	80	100	20	98	100	100	100	90	
20	100	100	100	75	98	65	85	50	50	
21	95	90	25	40	100	100	100	100	80	
22	100	100	100	100	100	100	100	100	100	
23	100	100	100	70	100	100	100	100	95	
24 ^a	98	90	100	65	100	95	70	55	55	
25	90	98	85	90	100	88	80	65	65	
26	95	75	100	30	0	95	0	30	30	

a = getestet bei 15,6 Mikrogramm/cm²

Tabelle 1 (Forts.)

Verbindung Nr.	breitblättrige Pflanzen % Phytotoxizität				Gräser % Phytotoxizität			
	weißer Gänsefuß	Senf	Fuchsschwanz	Soja	Fingergras	Paspalum	Hafergras	Reis
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
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
47	100	55	60	30	100	95	70	
48	60	65	30	75	25	25	25	93
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.)

Verbindung Nr.	breitblättrige Pflanzen % Phytotoxizität				Gräser % Phytotoxizität			
	weißer Gänsefuß	Senf	Fuchsschwanz	Soja	Fingergras	Paspalum	Hafergras	Reis
5								
10								
15								
20								
25								
30								
35								

Tabelle 1 (Forts.)

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

Tabelle 1A

Vergleichsverbindungen
voremmergente Herbicidwirkung

Dosierungsmenge: 27.5 Microgramm/cm², wenn nicht anders angegeben

Verbindung Nr.	breitblättrige Pflanzen % Phytotoxizität			Gräser % Phytotoxizität		
	weißer Gänsefuß	Senf	Fuchsschwanz	Soja	Fingergras	Reis
C-1	40	25	40	0	75	0
C-2	0	0	0	0	0	0
C-3	0	0	0	0	0	0
C-4	0	0	0	0	0	0
C-5	0	0	0	0	0	0
C-6	0	0	0	0	0	0
C-7	0	0	0	0	0	0
C-8	30	25	0	40	0	0
C-9	0	0	0	0	0	0
C-10	0	0	0	0	0	0
C-11	0	0	0	0	30	0
C-12	0	0	0	0	0	0
C-13	0	0	0	0	0	0
C-14	0	0	0	0	45	0
C-15	0	0	0	0	0	0
C-16	0	0	0	0	0	0

Tabelle 2
nachemergente Herbizidwirkung

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

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

N.T.* = nicht getestet

a = getestet bei 15,6 Mikrogramm/cm²

Tabelle 2 (Forts.)

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

Tabelle 2 (Forts.)

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

N.T.* = nicht getestet

Tabelle 2 (Forts.)

Verbindung Nr.	5	breitblättrige Pflanzen % Phytotoxizität					Gräser % Phytotoxizität				Reis
		weißer Gänsefuß	Senf	Fuchsschwanz	Soja	Fingergras	Paspalum	Hafergras			
79	10	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		
82		20	25	35	30	0	0	0	0		
83		75	100	75	85	35	20	55	0		
84	15	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	20	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	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		70	80	65	55	0	0	0	0		

Tabelle 2A

Vergleichsverbindungen

nachemergente Herbizidverbindungen

Dosierungsmenge: 27.5 Microgramm/cm², wenn nicht anders angegeben

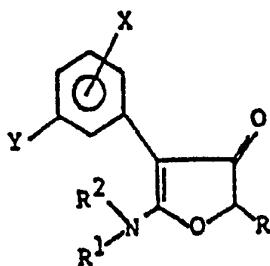
Verbindung Nr.	breitblättrige Pflanzen % Phytotoxizität			Soja	Gräser % Phytotoxizität			Reis
	weißer Gänsefuß	Senf	Fuchsschwanz		Fingergras	Paspalum	Hafergras	
C-1	20	20	0	25	0	0	0	0
C-2	0	0	0	0	0	0	0	0
C-3	0	0	0	0	0	0	0	0
C-4	0	0	0	0	0	0	0	0
C-5	0	0	0	0	0	0	0	0
C-6	0	0	0	0	0	0	0	0
C-7	0	0	0	0	0	0	0	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
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	25	0	30	25	10	45	45
C-16	0	0	0	0	0	0	0	0

Wie aus Tabelle 1 ersichtlich ist, zeigen die erfindungsgemäßen 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 Wesen bzw. der Rahmen der Erfindung eingeschränkt würde.

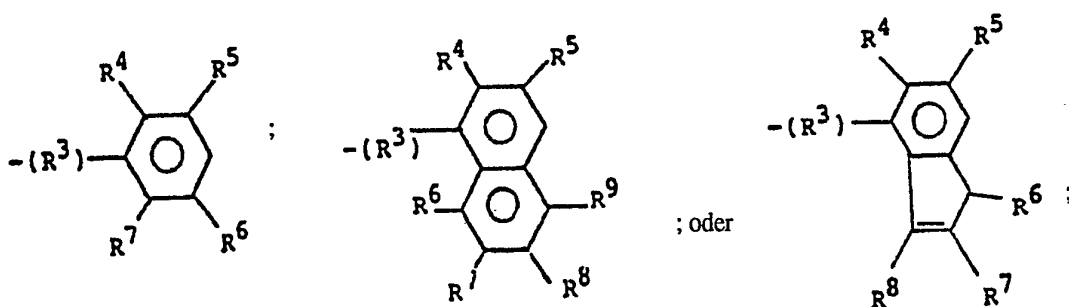
PATENTANSPRÜCHE

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



(I)

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



ist, worin einer, zwei oder drei der Substituenten R^4 , R^5 , R^6 , R^7 , R^8 und R^9 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 R^3 eine Einfachbindung oder Alkylen mit 1 bis 3 Kohlenstoffatomen ist; R^1 Wasserstoff oder Alkyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen; R^2 Wasserstoff, Alkyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen, Alkenyl mit 3 oder 4 Kohlenstoffatomen, niedere-

res Alkoxy-carbonylalkyl, niederes Alkoxyalkyl oder niederes Alkylthioalkyl ist; R^1 und R^2 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 , R^1 und R^2 nicht alle Wasserstoff sind, und weiters vorausgesetzt, daß, wenn Y nicht Trifluormethyl und X nicht Wasserstoff ist und R^1 und R^2 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.

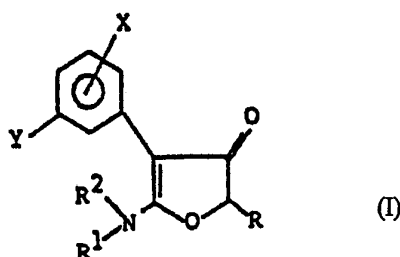
2. Unkrautvernichtungsmittel nach Anspruch 1, dadurch gekennzeichnet, daß R Phenyl ist.

3. Unkrautvernichtungsmittel nach Anspruch 2, dadurch gekennzeichnet, daß einer der Substituenten R^1 oder R^2 Wasserstoff und der andere Wasserstoff, Methyl oder Äthyl ist.

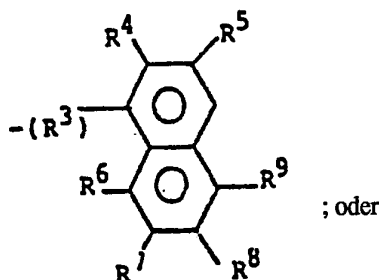
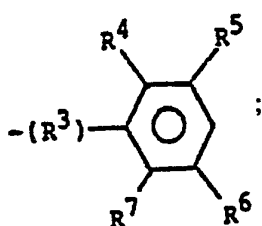
4. Unkrautvernichtungsmittel nach Anspruch 2 oder 3, dadurch gekennzeichnet, daß X Wasserstoff ist.

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.

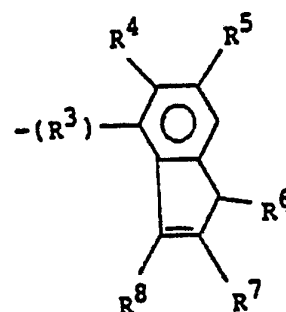
6. Pflanzenwuchsregulans, dadurch gekennzeichnet, daß es eine den Wachstumsverlauf der Pflanzen verändernde Wirkstoffmenge einer Verbindung der Formel



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



; oder



ist, worin einer, zwei oder drei der Substituenten R^4 , R^5 , R^6 , R^7 , R^8 und R^9 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 R^3 eine Einfachbindung oder Alkyl mit 1 bis 3 Kohlenstoffatomen ist; R^1 Wasserstoff oder Alkyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen; R^2 Wasserstoff, Alkyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen, Alkenyl mit 3 oder 4 Kohlenstoffatomen, niederes Alkoxy-carbonylalkyl, niederes Alkoxyalkyl oder niederes Alkylthioalkyl ist; R^1 und R^2 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, R^1 und R^2 nicht alle Wasserstoff sind, und weiters vorausgesetzt, daß, wenn Y nicht Trifluormethyl und X nicht Wasserstoff ist und R^1 und R^2 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.