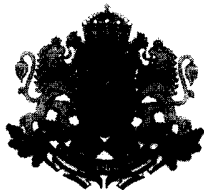


РЕПУБЛИКА БЪЛГАРИЯ



(19) BG

ЗАЯВКА ЗА ПАТЕНТ

ЗА

ИЗОБРЕТЕНИЕ

(11) 100575A

(51) C07D265/06

C07D319/06

A01N 43/86

ПАТЕНТНО ВЕДОМСТВО

(21) Заявителски № 100575

(22) Заявено на 07.05.1996

(24) Начало на действие
на патента от:

Приоритетни данни

(31) 257218 (32) 14.10.1993 (33) JP

(41) Публикувана заявка в
бюлетин № 3 | 31.03.1997

(45) Отпечатано на

(46) Публикувано в бюлетин №
на

(56) Информационни източници:

(62) Разделена заявка от рег. №

(71) Заявител(и):

RHONE-POULENC AGROCHIMIE , . ,
692009 LYON CEDEX , 14-20, RUE PIERRE
BAIZET (FR) ;

(72) Изобретател(и):

GO , Atsushi . , 300-1 Ushiku-shi, Ibaraki-
ken (JP) ; HIGURASHI , RIKI . , IBARAKI (JP) ;
KOMINE , MIKI . , IBARAKI (JP) ;
TSUTSUMI , YOSHIMI . , IBARAKI (JP) ;
USUI , Yoshihiro . , 301 Ibaraki-ken (JP) ;

(74) Представител по индустриална
собственост:

Георги Цветанов Перев , 1124 София , ул.
"Леонардо да Винчи" 3

(86) № на PCT заявка:

PCT/ EP94/0 / 3310 , 06.10.1994

(87) № и дата на PCT публикация:

95/105 / 10 , 20.04.1995

(54) НОВИ 1,3-ОКСАЗИН-4-ОКСИПРОИЗВОДНИ, ХЕРБИЦИДИ, КОИТО ГИ
СЪДЪРЖАТ, И МЕЖДИННИ СЪЕДИНЕНИЯ ЗА ТЯХНОТО ПОЛУЧАВАНЕ

(57) Нови 1,3-оксазин-4-оксипроизводни с формула в която r1 до r5 означават
въглеродородни радикали, евентуално заместени, и хербициди, които ги съдържат
като активни компоненти. Производните могат да се получат чрез реакция на
заместени 1,3-диоксин-4-оксипроизводни и п-метиленазламин.

19 претенции 19 претенции , 0

BG 100575A

**НОВИ 1,3-ОКСАЗИН-4-ОНОВИ ПРОИЗВОДНИ, ХЕРБИЦИДИ,
КОИТО ГИ СЪДЪРЖАТ, И МЕЖДИННИ СЪЕДИНЕНИЯ ЗА
ТЯХНОТО ПОЛУЧАВАНЕ**

Това изобретение се отнася до нови 1,3-оксазин-4-онови производни, които не са докладвани в предишни публикации, до хербициди, които ги съдържат, и до метод и междинни съединения за тяхното получаване.

Някои видове от 4Н-2,3-дихидро-1,3-оксазин-4-онови производни са описани, напр. в Tetrahedron Lett., (33), 2905 (1976), Heterocycles, 17, 298 (1982), Chem. Pharm. Bull., 35 (5), 1871(1987), и т. н. и така те са известни.

Съединенията, описани в по-горните публикации, обаче се различават от съединенията на това изобретение, тъй като нито едно от тях няма третичен алкилов или арилалкилов заместител в 3-

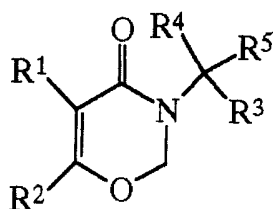
та позиция и нищо не е споменато за хербицидната им активност и регулиращата растежа на растенията активност.

Патент на U.S. 5,006,157 съобщава за 1-(1-метил-1-фенилетил)-3-фенил-1,2,5,6-тетрахидропиридин-2-онови производни и тяхното приложение като хербициди. В патентното описание, обаче, изобщо не са описани 4Н-2,3-дихидро-1,3-оксазин-4-онови производни и тяхната хербицидна активност.

Освен това, разкритите в патентното описание съединения нямат достатъчно добра хербицидна ефективност и селективност.

Настоящите изобретатели са открили, че определен тип 1,3-оксазин-4-онови производни проявяват хербицидна активност върху различни плевели при ниски дози, без да увреждат полезните растения.

Това изобретение предлага 1,3-оксазин-4-онови производни, характеризиращи се със следната обща формула I:



(I)

където R^1 е нисша алкилова група, нисша алкенилова група, нисша алкинилова група или арилова група, която може да бъде заместена, или аралкилова група, която може да бъде заместена;

R^2 е нисша халогеноалкилова група, нисша хидроксиалкилова група, нисша алкоксиалкилова група, нисша ацилоксиалкилова група, формилова група, хидроксииминометилова група, нисша алкоксииминометилова група, нисша ацилоксииминометилова група, цианова група, или нисша алкоксикарбонилова група;

R^3 е нисша алкилова група, арилова група, която може да бъде заместена, или арилалкилова група, която може да бъде заместена;

R^4 и R^5 , независимо един от друг са нисша алкилова група, или R^4 и R^5 взети заедно с въглеродния атом, с който са свързани образуват 3- до 8-членна карбоциклична група, която може да има разклонение от нисша алкилова група.

Друг предмет на това изобретение е да предложи хербицидни състави, съдържащи едно или повече съединения с формула I като активен компонент.

Някои примери от групите R^1 , R^2 , R^3 , R^4 и R^5 , определени в горната обща формула (I) ще бъдат обяснени както следва:

"Нисша алкилова група" може да бъде линейна или разклонена нисша алкилова група, която съдържа 1 до 6 въглеродни атоми и включва, например метил, етил, n-пропил, изопропил, n-бутил, изобутил, втор-бутил, трет-бутил, n-пентил, неопентил, трет-пентил, хексил и т. н.

"Нисша алкенилова група" означава нисша алкенилова група, която съдържа 2 до 6 въглеродни атоми и включва например алкил, 2-метил-2-пропенил, 2-бутенил, 3-бутенил, 3-метил-2-бутенил и т. н.

"Нисша алкинилова група" означава нисша алкинилова група, която съдържа 2 до 6 въглеродни атоми и включва например 2-пропинил, 1-метил-2-пропинил, 2-бутинил, 3-бутинил и т. н.

"Нисша халогеноалкилова група" означава нисша халогеноалкилова група, която съдържа 1 до 4 въглеродни атоми и включва например бромометил, дихлорометил, трифлуорометил, 1-хлороетил, 2-йодоетил, 3-хлоропропил, 2-метил-2-хлоропропил, 2,2,2-трифлуороетил и т. н.

"Нисша хидроксиалкилова група" означава нисша хидроксиалкилова група, която съдържа 1 до 4 въглеродни атоми и включва например хидроксиметил, 2-хидроксиетил и т. н.

"Нисша алкоксиалкилова или нисша ацилоксиалкилова група" означава нисша алкилова група, която съдържа 1 до 4 въглеродни атоми и е заместена с нисша алкоксигрупа, която съдържа 1 до 4 въглеродни атоми, или с нисша ацилова група, която съдържа 2 до 5 въглеродни атоми, и включва например метоксиметил, етоксиметил, ацетилоксиметил и т. н.

"Нисша алкоксииминометилова или нисша ацилоксииминометилова група" означава иминометилова група, заместена с нисша алкоксигрупа, която има 1 до 4 въглеродни атоми или с нисша ацилова група, която има 2 до 5 въглеродни атоми и включва например метоксииминометил, етоксииминометил, ацетилоксииминометил и т. н.

"Нисша алкоксикарбонилова група" означава нисша алкоксикарбонилова група, която съдържа от 2 до 6 въглеродни атоми и включва например метоксикарбонил, етоксикарбонил, изопропоксикарбонил и т. н.

"Арилова група, която може да бъде заместена" означава арилова група като например фенолова група, нафтилова група и т. н., която може да бъде заместена с халогенен атом, нисша алкилова група, нисша алкокси група, нисша халогеноалкилова група, нисша халогеноалкоксигрупа, нитрогрупа и т. н. и включва например фенол, 2-нафтил, 2-флуорофенил, 2-толил, 3-нитрофенил, 4-хлоро-2-нафтил, 3,5-дихлорофенил, 3,5-диметоксифенил, 3,5-бис(дифлуорометокси)-фенил, 3,5-дихлоро-4-метилфенил и т. н.

"Аралкилова група, която може да бъде заместена" означава аралкилова група, която има "арилова група, която може да бъде заместена", споменато по-горе при ариловата група и включва например бензил, (2-хлорофенил)метил, 1-(3-хлорофенил)етил, 2-фенилетил, 1-метил-1-фенилетил, 1-метил-2-фенилетил, 1-етил-2-(3-

трифлуорометилфенил)етил, (2-дифлуорометоксифенил)метил, 3-фенилпропил и т. н.

"3 до 8-членна карбоциклична група, която може да има разклонение от нисша алкилова група" включва циклопропан, циклобутан, циклопентан, циклохексан, циклохептан, циклооктан, 2,2'-диметилциклопропан, 3,5-диетилциклохексан и т. н.

Понятията халогенен атом, нисша алкоксигрупа, нисша халогеноалкилова група, нисша халогеноалкоксигрупа и нисша ацилова група ще бъдат обяснени както следва:

"Халогенен атом" означава флуор, хлор, бром или йод.

"Нисша алкоксигрупа" означава нисша алкоксигрупа, която има нисша алкилова група, спомената по-горе при алкиловата група и включва, например метокси, етокси, пропокси, изопропокси, бутокси, пентокси и т. н.

"Нисша халогеноалкилова група" означава нисша халогеноалкилова група, в която един или повече водородни атоми са заместени с а) халогенен атом(и) и включва, например бромометил, дихлорометил, трифлуорометил, 1-хлороетил, 2-йодоетил, 3-хлоропропил, 2-метил-2-хлоропропил, 2,2,2-трифлуороетил и т. н.

"Нисша халогеноалкоксигрупа" означава нисша халогеноалкоксигрупа, която има халогеноалкилова група, спомената по-горе, при алкиловата група и включва, например трифлуорометокси, дифлуорометокси, хлородифлуорометокси, 2-хлороетокси, 1,1,2,2-тетрафлуороетокси, 3-хлоропропокси, 2,2,3,3,3-пентафлуоропропокси и т. н.

"Нисша ацилова група" означава нисша ацилова група като например ацетил, пропионил, бутирил, изобутирил и т. н.

Групи, които не са описани по-горе, могат да се подберат от вече описаните атоми или групи чрез свободна комбинация или добре известен конвенционален начин.

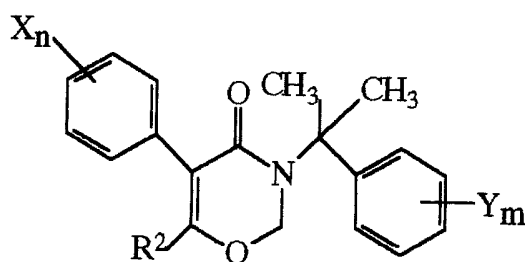
От съединенията на това изобретение с обща формула (I), могат да се изберат някои предпочитани съединения, както следва:

R^1 е разклонена алкилова група като например изобутилова или изопропилова група; или фенилова група, която не е заместена или е заместена с халогенен атом или нисша алкилова група;

R^3 е фенилова или 2-нафтилова група, която не е заместена или е заместена с един или два халогенни атома, нисша халогено-алкилова група или нисша халогеноалкоксигрупа;

R^4 и R^5 независимо един от друг означават метилова група.

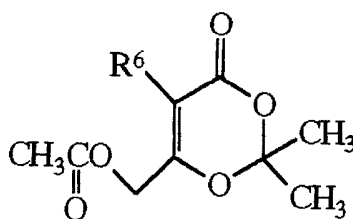
Предпочитат се съединенията със следната обща формула (I-1):



(I-1)

където R^2 има значението, дадено по-горе, X е халогенен атом или нисша алкилова група; Y е халогенен атом или нисша халогеноалкилова група; n е 0 или 1; m е 0, 1 или 2.

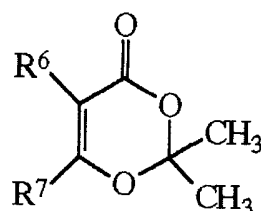
Според изследванията на настоящите изобретатели, съединенията със следната обща формула (II-2), които могат да бъдат междинно съединение за съединенията в това изобретение, където R^1 е арилова група, която може да бъде заместена; R^2 е ацетилоксиметилова група



(II-2)

където R^6 е арилова група, която може да бъде заместена,

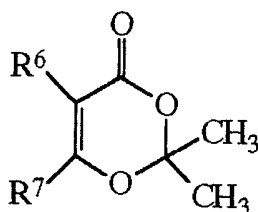
и съединенията със следната обща формула (II-1), които могат да се образуват от съединенията с обща формула (II-2):



(II-1)

където R^6 е арилова група, която може да бъде заместена; R^7 е хидроксиметилова група или формилова група, са нови съединения и следователно могат да се включат в това изобретение.

Така, изобретението може да осигури 1,3-диоксин-4-онови производни със следната обща формула (II):



(II)

където R^6 е арилова група, която може да бъде заместена; R^7 е хидроксиметилова, ацетилоксиметилова или формилова група.

В горната обща формула (II),

" R^6 = арилова група, която може да бъде заместена" означава арилова група, като фенилова или нафтилова група, или такава арилова група, която е заместена с халогенен атом, нисша алкилова група, нисша алкоксигрупа, нисша халогеноалкилова група, нитрогрупа и т. н. От тези замествания се предпочита фенилова група, заместена във 2-ра позиция.

В споменатата по-горе обща формула (II), примерите за групи, дефинирани под R^6 са същите, както описаните преди това.

Примери за съединения от това изобретение с обща формула (I), са показани в таблица 1, а тези с обща формула (II) - в таблица 2.

Съкращенията в таблиците са следните:

Me = метилова група

Et = етилова група

Pr = пропилова група

iPr = изо-пропилова група

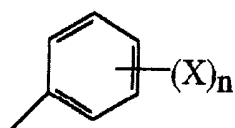
Bu = бутилова група

tBu = трет-бутилова група

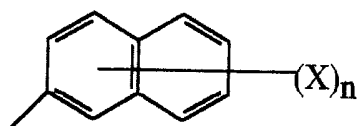
Ac = ацетилова група

- = без заместване

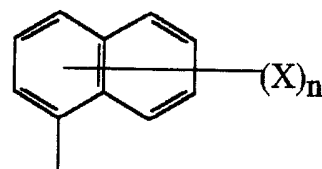
(A)



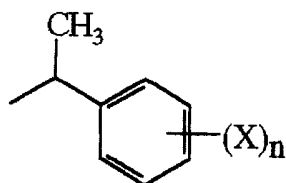
(B)



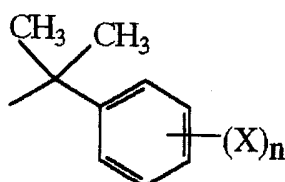
(C)



(E)



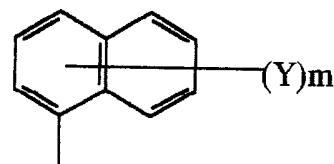
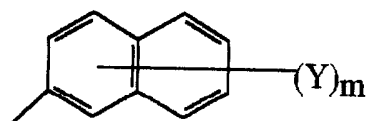
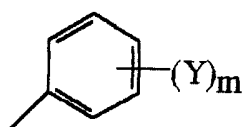
(F)



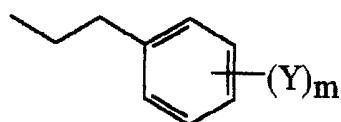
(a)

(b)

(c)

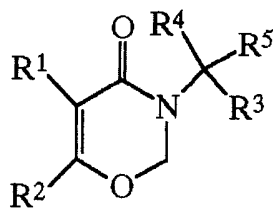


(d)



07.05.98

Таблица 1



Съед.	R ¹		R ²	R ³		R ⁴	R ⁵
No		(X) _n			(Y) _m		
1.	(A)	-	CH ₂ F	(a)	-	Me	Me
2.	(A)	-	CH ₂ F	(a)	3-F	Me	Me
3.	(A)	-	CH ₂ F	(a)	3-Cl	Me	Me
4.	(A)	-	CH ₂ F	(a)	3-Cl, 5-Cl	Me	Me
5.	(A)	-	CH ₂ F	(a)	3-Me	Me	Me
6.	(A)	-	CH ₂ F	(a)	3-CF ₃	Me	Me
7.	(A)	2-F	CH ₂ F	(a)	-	Me	Me
8.	(A)	2-F	CH ₂ F	(a)	3-Cl, 5-Cl	Me	Me
9.	(A)	2-Cl	CH ₂ F	(a)	-	Me	Me
10.	(A)	2-Cl	CH ₂ F	(a)	3-Cl, 5-Cl	Me	Me
11.	(A)	2-Me	CH ₂ F	(a)	-	Me	Me
12.	(A)	3-Me	CH ₂ F	(a)	-	Me	Me
13.	(A)	2-CF ₃	CH ₂ F	(a)	-	Me	Me
14.	(A)	-	CH ₂ F	(b)	-	Me	Me
15.	(A)	-	CH ₂ F	(b)	4-Cl	Me	Me
16.	(A)	-	CH ₂ F	(c)	-	Me	Me
17.	(B)	-	CH ₂ F	(a)	-	Me	Me
18.	(B)	-	CH ₂ F	(a)	3-Cl	Me	Me
19.	(B)	-	CH ₂ F	(a)	3-Cl, 5-Cl	Me	Me
20.	(C)	-	CH ₂ F	(a)	-	Me	Me
21.	(C)	-	CH ₂ F	(a)	3-Cl	Me	Me

Таблица 1 (продължение)

Съед. No	R ¹	(X) _n	R ²	R ³	(Y) _m	R ⁴	R ⁵
22.	(A)	-	CH ₂ F		Me	Me	Me
23.	(A)	-	CH ₂ F		Et	Me	Me
24.	(A)	-	CH ₂ F		Pr	Me	Me
25.	(A)	-	CH ₂ F		tBu	Me	Me
26.		Me	CH ₂ F	(a)	-	Me	Me
27.		Me	CH ₂ F	(a)	3-Cl, 5-Cl	Me	Me
28.		Et	CH ₂ F	(a)	-	Me	Me
29.		Et	CH ₂ F	(a)	3-Cl, 5-Cl	Me	Me
30.		iPr	CH ₂ F	(a)	-	Me	Me
31.		iPr	CH ₂ F	(a)	3-Cl, 5-Cl	Me	Me
32.		Bu	CH ₂ F	(a)	-	Me	Me
33.		Bu	CH ₂ F	(a)	3-Cl, 5-Cl	Me	Me
34.	(A)	-	CH ₂ F	(a)	-	Me	Me
35.	(A)	-	CH ₂ F	(a)	3-Cl	Me	Me
36.	(A)	-	CH ₂ F	(a)	3-Cl, 5-Cl	Me	Me
37.	(A)	2-F	CH ₂ F	(a)	-	Me	Me
38.	(A)	2-Cl	CH ₂ F	(a)	-	Me	Me
39.	(A)	2-Me	CH ₂ F	(a)	-	Me	Me
40.	(A)	-	CH ₂ F	(b)	-	Me	Me
41.	(A)	-	CH ₂ F	(c)	-	Me	Me
42.	(B)	-	CH ₂ F	(a)	-	Me	Me
43.	(C)	-	CH ₂ F	(a)	-	Me	Me
44.	(A)	-	CH ₂ F		Me	Me	Me
45.	(A)	-	CH ₂ F		Et	Me	Me
46.		Me	CH ₂ F	(a)	-	Me	Me

Таблица 1 (продължение)

Съед.	R ¹		R ²	R ³		R ⁴	R ⁵
No		(X) _n			(Y) _m		
47.		Me	CHF ₂	(a)	3-Cl, 5-Cl	Me	Me
48.	(A)	-	CF ₃	(a)	-	Me	Me
49.	(A)	-	CF ₃	(a)	3-Cl, 5-Cl	Me	Me
50.	(A)	-	CF ₃	(b)	-	Me	Me
51.	(A)	-	CF ₃	(c)	-	Me	Me
52.	(A)	-	CF ₃		Me	Me	Me
53.	(A)	-	CH ₂ OH	(a)	-	Me	Me
54.	(A)	-	CH ₂ OH	(a)	3-Cl	Me	Me
55.	(A)	-	CH ₂ OH	(a)	3-Cl, 5-Cl	Me	Me
56.	(A)	-	CH ₂ OH	(b)	-	Me	Me
57.	(A)	-	CH ₂ OH	(c)	-	Me	Me
58.	(B)	-	CH ₂ OH	(a)	-	Me	Me
59.	(C)	-	CH ₂ OH	(a)	-	Me	Me
60.	(A)	-	CH ₂ OH		Me	Me	Me
61.	(A)	-	CH ₂ OH		Et	Me	Me
62.		Me	CH ₂ OH	(a)	-	Me	Me
63.		Et	CH ₂ OH	(a)	-	Me	Me
64.		iPr	CH ₂ OH	(a)	-	Me	Me
65.		Bu	CH ₂ OH	(a)	-	Me	Me
66.	(A)	-	CH ₂ OAc	(a)	-	Me	Me
67.	(A)	-	CH ₂ OAc	(a)	3-F	Me	Me
68.	(A)	-	CH ₂ OAc	(a)	3-Cl	Me	Me
69.	(A)	-	CH ₂ OAc	(a)	3-Cl, 5-Cl	Me	Me
70.	(A)	-	CH ₂ OAc	(a)	3-Me	Me	Me
71.	(A)	-	CH ₂ OAc	(a)	3-CF ₃	Me	Me

Таблица 1 (продължение)

Съед.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵
No	(X) _n	(Y) _m			
72.	(A)	-	CH ₂ OAc (a)	3-OMe	Me Me
73.	(A)	2-F	CH ₂ OAc (a)	-	Me Me
74.	(A)	2-F	CH ₂ OAc (a)	3-Cl, 5-Cl	Me Me
75.	(A)	2-Cl	CH ₂ OAc (a)	-	Me Me
76.	(A)	2-Cl	CH ₂ OAc (a)	3-Cl, 5-Cl	Me Me
77.	(A)	3-Cl	CH ₂ OAc (a)	-	Me Me
78.	(A)	3-Cl	CH ₂ OAc (a)	3-Cl, 5-Cl	Me Me
79.	(A)	2-Me	CH ₂ OAc (a)	-	Me Me
80.	(A)	2-Me	CH ₂ OAc (a)	3-Cl, 5-Cl	Me Me
81.	(A)	3-Me	CH ₂ OAc (a)	-	Me Me
82.	(A)	3-Me	CH ₂ OAc (a)	3-Cl, 5-Cl	Me Me
83.	(A)	-	CH ₂ OAc (b)	-	Me Me
84.	(A)	-	CH ₂ OAc (b)	4-Cl	Me Me
85.	(A)	-	CH ₂ OAc (c)	-	Me Me
86.	(A)	-	CH ₂ OAc (c)	3-Cl	Me Me
87.	(A)	-	CH ₂ OAc (d)	-	Me Me
88.	(A)	-	CH ₂ OAc (d)	2-Cl	Me Me
89.	(A)	-	CH ₂ OAc (d)	2-Me	Me Me
90.	(B)	-	CH ₂ OAc (a)	-	Me Me
91.	(B)	-	CH ₂ OAc (a)	3-Cl, 5-Cl	Me Me
92.	(C)	-	CH ₂ OAc (a)	-	Me Me
93.	(C)	-	CH ₂ OAc (a)	3-Cl, 5-Cl	Me Me
94.	(E)	-	CH ₂ OAc (a)	-	Me Me
95.	(E)	-	CH ₂ OAc (a)	3-Cl, 5-Cl	Me Me
96.	(F)	-	CH ₂ OAc (a)	-	Me Me

Таблица 1 (продължение)

Съед.	R ¹		R ²	R ³		R ⁴	R ⁵
No		(X) _n			(Y) _m		
97.	(F)	-	CH ₂ OAc	(a)	3-Cl, 5-Cl	Me	Me
98.	(A)	-	CH ₂ OAc		Me	Me	Me
99.	(A)	-	CH ₂ OAc		Et	Me	Me
100.	(A)	-	CH ₂ OAc		Pr	Me	Me
101.	(A)	-	CH ₂ OAc		iPr	Me	Me
102.	(A)	-	CH ₂ OAc		Bu	Me	Me
103.	(A)	-	CH ₂ OAc		tBu	Me	Me
104.	Me		CH ₂ OAc	(a)	-	Me	Me
105.	Me		CH ₂ OAc	(a)	3-Cl, 5-Cl	Me	Me
106.	Et		CH ₂ OAc	(a)	-	Me	Me
107.	Et		CH ₂ OAc	(a)	3-Cl, 5-Cl	Me	Me
108.	CH=CH ₂		CH ₂ OAc	(a)	-	Me	Me
109.	CH=CH ₂		CH ₂ OAc	(a)	3-Cl, 5-Cl	Me	Me
110.	CH ₂ CH=CH ₂		CH ₂ OAc	(a)	-	Me	Me
111.	CH ₂ CH=CH ₂		CH ₂ OAc	(a)	3-Cl, 5-Cl	Me	Me
112.	C≡CH		CH ₂ OAc	(a)	-	Me	Me
113.	C≡CH		CH ₂ OAc	(a)	3-Cl, 5-Cl	Me	Me
114.	(A)	-	CH ₂ OAc	(a)	-	Me	Me
115.	(A)	-	CH ₂ OAc	(a)	3-Cl	Me	Me
116.	(A)	-	CH ₂ OAc	(a)	3-Cl, 5-Cl	Me	Me
117.	(A)	-	CH ₂ OAc	(b)	-	Me	Me
118.	(A)	-	CH ₂ OAc	(c)	-	Me	Me
119.	(A)	-	CH ₂ OAc		Me	Me	Me
120.	(A)	-	CH ₂ OAc		Et	Me	Me

Таблица 1 (продължение)

Съед. No	R ¹	(X) _n	R ²	R ³	(Y) _m	R ⁴	R ⁵
121.	(A)	-	CHO	(a)	-	Me	Me
122.	(A)	-	CHO	(a)	3-Cl, 5-Cl	Me	Me
123.	(A)	-	CHO	(b)	-	Me	Me
124.	(A)	-	CHO	(c)	-	Me	Me
125.	(A)	-	CHO	(d)	-	Me	Me
126.	(B)	-	CHO	(a)	-	Me	Me
127.	(B)	-	CHO	(a)	3-Cl, 5-Cl	Me	Me
128.	(C)	-	CHO	(a)	-	Me	Me
129.	(A)	-	CHO		Me	Me	Me
130.	(A)	-	CHO		Et	Me	Me
131.	(A)	-	CHO		Pr	Me	Me
132.		Me	CHO	(a)	-	Me	Me
133.		Et	CHO	(a)	-	Me	Me
134.	(A)	-	CH=NOH	(a)	-	Me	Me
135.	(A)	-	CH=NOH	(a)	3-Cl, 5-Cl	Me	Me
136.	(A)	-	CH=NOH	(b)	-	Me	Me
137.	(A)	-	CH=NOH	(c)	-	Me	Me
138.	(B)	-	CH=NOH	(a)	-	Me	Me
139.	(C)	-	CH=NOH	(a)	-	Me	Me
140.	(A)	-	CH=NOH		Me	Me	Me
141.	(A)	-	CH=NOH		Et	Me	Me
142.	(A)	-	CH=NOH		Pr	Me	Me
143.	(A)	-	CH=NOH		iPr	Me	Me
144.		Me	CH=NOH	(a)	-	Me	Me
145.	(A)	-	CH=NOAc	(a)	-	Me	Me
146.	(A)	-	CH=NOAc	(a)	3-Cl	Me	Me
147.	(A)	-	CH=NOAc	(a)	3-Cl, 5-Cl	Me	Me

Таблица 1 (продължение)

Съед. No	R ¹	(X) _n	R ²	R ³	(Y) _m	R ⁴	R ⁵
148.	(A)	2-F	CH=NOAc	(a)	-	Me	Me
149.	(A)	2-F	CH=NOAc	(a)	3-Cl, 5-Cl	Me	Me
150.	(A)	2-Cl	CH=NOAc	(a)	-	Me	Me
151.	(A)	2-Cl	CH=NOAc	(a)	3-Cl, 5-Cl	Me	Me
152.	(A)	2-Me	CH=NOAc	(a)	-	Me	Me
153.	(A)	2-Me	CH=NOAc	(a)	3-Cl, 5-Cl	Me	Me
154.	(A)	-	CH=NOAc	(b)	-	Me	Me
155.	(A)	-	CH=NOAc	(c)	-	Me	Me
156.	(A)	-	CH=NOAc		Me	Me	Me
157.	(A)	-	CH=NOAc		Et	Me	Me
158.	(A)	-	CH=NOMe	(a)	-	Me	Me
159.	(A)	-	CH=NOMe	(a)	3-Cl	Me	Me
160.	(A)	-	CH=NOMe	(a)	3-Cl, 5-Cl	Me	Me
161.	(A)	-	CH=NOMe	(b)	-	Me	Me
162.	(A)	-	CH=NOMe		Me	Me	Me
163.	(A)	-	CH=NOMe		Et	Me	Me
164.	(A)	-	CN	(a)	-	Me	Me
165.	(A)	-	CN	(a)	3-F	Me	Me
166.	(A)	-	CN	(a)	3-Cl	Me	Me
167.	(A)	-	CN	(a)	3-Cl, 5-Cl	Me	Me
168.	(A)	-	CN	(a)	3-Me	Me	Me
169.	(A)	-	CN	(a)	3-CF ₃	Me	Me
170.	(A)	-	CN	(b)	-	Me	Me
171.	(A)	-	CN	(c)	-	Me	Me
172.	(B)	-	CN	(a)	-	Me	Me
173.	(B)	-	CN	(a)	3-Cl, 5-Cl	Me	Me
174.	(A)	-	CN		Me	Me	Me

Таблица 1 (продължение)

Съед.	R ¹		R ²	R ³		R ⁴	R ⁵
No		(X) _n			(Y) _m		
175.	(A)	-	CN		Et	Me	Me
176.	(A)	-	COOMe	(a)	-	Me	Me
177.	(A)	-	COOMe	(a)	3-Cl, 5-Cl	Me	Me
178.	(A)	-	COOMe	(b)	-	Me	Me
179.	(A)	-	COOMe		Me	Me	Me
180.	(A)	-	COOMe		Et	Me	Me
181.	(A)	-	COOEt	(a)	-	Me	Me
182.	(A)	-	COOEt	(a)	3-Cl, 5-Cl	Me	Me
183.	(A)	-	COOEt	(b)	-	Me	Me
184.	(A)	-	COOEt		Me	Me	Me
185.	(A)	-	COOEt		Et	Me	Me
186.	(A)	-	CH ₂ F	(a)	-	Me	Et
187.	(A)	-	CHF ₂	(a)	-	Me	Et
188.	(A)	-	CF ₃	(a)	-	Me	Et
189.	(A)	-	CH ₂ OH	(a)	-	Me	Et
190.	(A)	-	CH ₂ OH	(a)	3-Cl	Me	Et
191.	(A)	-	CH ₂ OH	(a)	3-Cl, 5-Cl	Me	Et
192.	(A)	-	CH ₂ OAc	(a)	-	Me	Et
193.	(A)	-	CH ₂ OMe	(a)	-	Me	Et
194.	(A)	-	CHO	(a)	-	Me	Et
195.	(A)	-	CHO	(a)	3-Cl	Me	Et
196.	(A)	-	CHO	(a)	3-Cl, 5-Cl	Me	Et
197.	(A)	-	CH=NOH	(a)	-	Me	Et
198.	(A)	-	CH=NOAc	(a)	-	Me	Et
199.	(A)	-	CH=NOMe	(a)	-	Me	Et

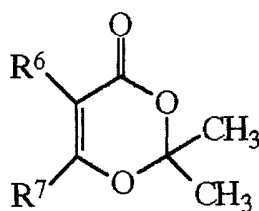
Таблица 1 (продължение)

Съед.	R ¹		R ²	R ³		R ⁴	R ⁵
No		(X) _n			(Y) _m		
200.	(A)	-	CN	(a)	-	Me	Et
201.	(A)	-	COOMe	(a)	-	Me	Et
202.	(A)	-	CH ₂ F	(a)	-	-CH ₂ CH ₂ -	
203.	(A)	-	CHF ₂	(a)	-	-CH ₂ CH ₂ -	
204.	(A)	-	CF ₃	(a)	-	-CH ₂ CH ₂ -	
205.	(A)	-	CH ₂ OH	(a)	-	-CH ₂ CH ₂ -	
206.	(A)	-	CH ₂ OAc	(a)	-	-CH ₂ CH ₂ -	
207.	(A)	-	CHO	(a)	-	-CH ₂ CH ₂ -	
208.	(A)	-	CN	(a)	-	-CH ₂ CH ₂ -	
209.	(A)	-	CH ₂ F	(a)	-	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ -	
210.	(A)	-	CHF ₂	(a)	-	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ -	
211.	(A)	-	CF ₃	(a)	-	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ -	
212.	(A)	-	CH ₂ OH	(a)	-	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ -	
213.	(A)	-	CH ₂ OAc	(a)	-	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ -	
214.	(A)	-	CHO	(a)	-	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ -	
215.	(A)	-	CN	(a)	-	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ -	
216.	(A)	-	CH ₂ F	(a)	-	-CH ₂ (CH ₂) ₂ CH ₂ -	
217.	(A)	-	CHF ₂	(a)	-	-CH ₂ (CH ₂) ₂ CH ₂ -	
218.	(A)	-	CF ₃	(a)	-	-CH ₂ (CH ₂) ₂ CH ₂ -	
219.	(A)	-	CH ₂ OH	(a)	-	-CH ₂ (CH ₂) ₂ CH ₂ -	
220.	(A)	-	CH ₂ OH	(a)	3-Cl	-CH ₂ (CH ₂) ₂ CH ₂ -	
221.	(A)	-	CH ₂ OAc	(a)	-	-CH ₂ (CH ₂) ₂ CH ₂ -	
222.	(A)	-	CH ₂ OAc	(a)	3-Cl	-CH ₂ (CH ₂) ₂ CH ₂ -	
223.	(A)	-	CHO	(a)	-	-CH ₂ (CH ₂) ₂ CH ₂ -	

Таблица 1 (продължение)

Съед.	R ¹		R ²	R ³		R ⁴	R ⁵
No		(X) _n			(Y) _m		
224.	(A)	-	CHO	(a)	3-Cl	-CH ₂ (CH ₂) ₂ CH ₂ -	
225.	(A)	-	CN	(a)	-	-CH ₂ (CH ₂) ₂ CH ₂ -	
226.	(A)	-	CH ₂ F	(a)	-	-CH ₂ (CH ₂) ₃ CH ₂ -	
227.	(A)	-	CHF ₂	(a)	-	-CH ₂ (CH ₂) ₃ CH ₂ -	
228.	(A)	-	CF ₃	(a)	-	-CH ₂ (CH ₂) ₃ CH ₂ -	
229.	(A)	-	CH ₂ OH	(a)	-	-CH ₂ (CH ₂) ₃ CH ₂ -	
230.	(A)	-	CH ₂ OH	(a)	3-Cl	-CH ₂ (CH ₂) ₃ CH ₂ -	
231.	(A)	-	CH ₂ OAc	(a)	-	-CH ₂ (CH ₂) ₃ CH ₂ -	
232.	(A)	-	CH ₂ OAc	(a)	3-Cl	-CH ₂ (CH ₂) ₃ CH ₂ -	
233.	(A)	-	CHO	(a)	-	-CH ₂ (CH ₂) ₃ CH ₂ -	
234.	(A)	-	CHO	(a)	3-Cl	-CH ₂ (CH ₂) ₃ CH ₂ -	
235.	(A)	-	CN	(a)	-	-CH ₂ (CH ₂) ₃ CH ₂ -	

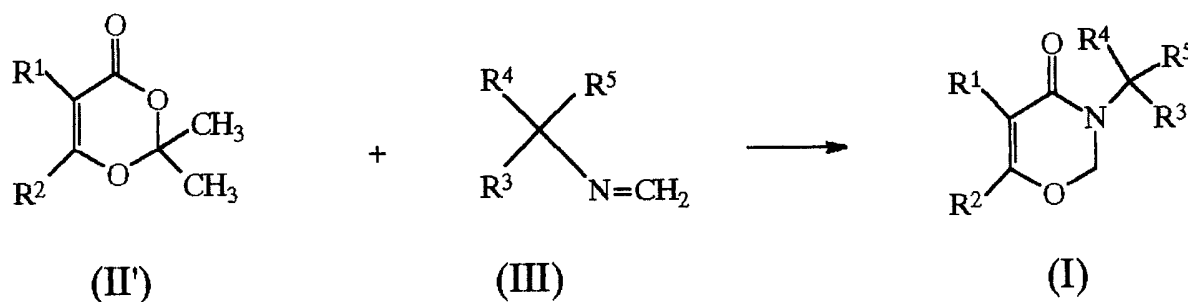
Таблица 2



Съед. No	R ⁶	(X) _n	R ⁷
236.	(A)	-	CH ₂ OH
237.	(A)	2-F	CH ₂ OH
238.	(A)	2-Cl	CH ₂ OH
239.	(A)	2-Me	CH ₂ OH
240.	(B)	-	CH ₂ OH
241.	(A)	-	CH ₂ OAc
242.	(A)	2-F	CH ₂ OAc
243.	(A)	2-Cl	CH ₂ OAc
244.	(A)	2-Me	CH ₂ OAc
245.	(B)	-	CH ₂ OAc
246.	(A)	-	CHO
247.	(A)	2-F	CHO

Съединенията на това изобретение с обща формула (I) могат да се получат по следния начин, но изобретението не се ограничава с този пример.

Метод А:



Съединенията (I) на това изобретение могат да се получат чрез взаимодействие на съединенията с формула (II') със съединенията с формула (III) в подходящ разтворител или без разтворител.

Оптималната реакционна температура е между 90 и 160°C или в областта на точката на кипене на разтворителя, който се използва.

Няма ограничение по отношение на разтворителя и може да се използва всеки един, доколкото е инертен. Но от гледна точка на реакционната температура се предпочитат разтворители с висока точка на кипене като толуен, ксилен, мезитилен и т. н.

Също така и реакционното време варира в зависимост от реакционните условия, реакцията може да приключи за 1 до 120 минути.

Освен това няма ограничения по отношение на съотношението на съединенията с формула (III) към съединенията с формула (II'), но е подходящо съединенията с формула (III) да се използват в количества обикновено от 0.5 до 2 mol и особено от 0.9 до 1.1 mol на mol съединение с формула (II').

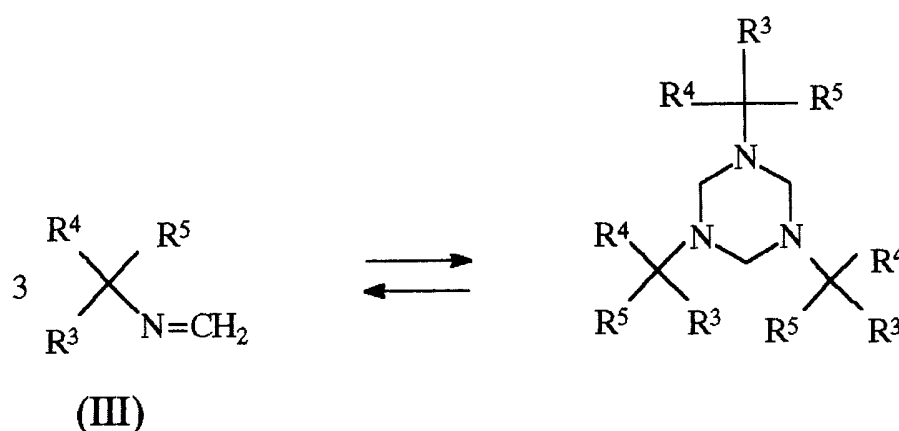
Разделяне и пречистване на получените съединения с формула (I) може да се извърши по известни методи като прекристализация и колонна хроматография.

Съединенията с формула (II'), които се използват като изходни вещества за горната реакция, могат да се получат по същите методи както съединенията с формула (II) на това изобретение. Методите за получаване на съединенията с формула (II) ще бъдат описани подробно по-късно.

Съединенията с формула (III), които се използват като изходни вещества за горната реакция, могат да се получат по

известни методи, например по методите, описани в патент на U.S. 2,582,128 или по подобни методи.

Беше открито, че съединенията с формула (III) са обикновено в равновесие с примери, представени с формула по-долу, при стайна температура и понякога съществуват като смеси с тях или могат да съществуват в някои случаи като самостоятелни примери, макар че това донякъде е различно при различните замествания.

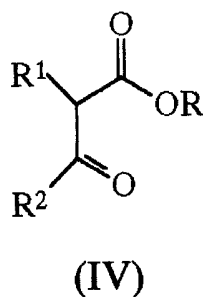


където R^3 , R^4 и R^5 имат значенията, дадени под обща формула (I) описана преди това.

Следователно, въпреки че съединенията с формула (III) включват не само мономери, но и смеси от по-горе описаните примери и мономерите, те са представени тук за простота със структурните формули и имената на мономерите.

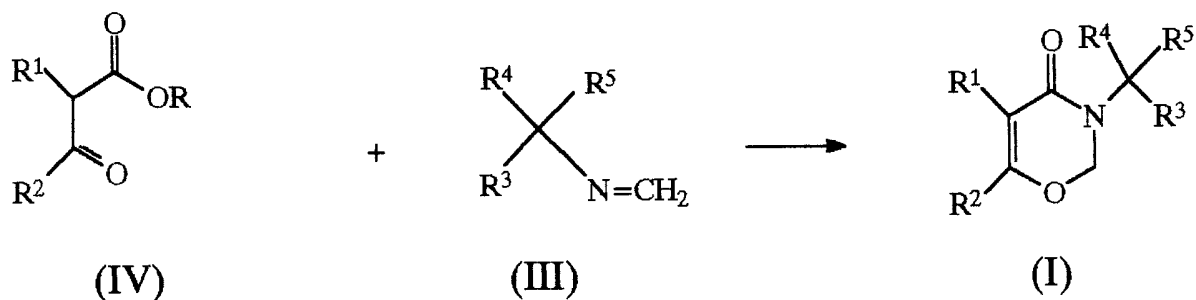
Метод В:

Като заместител на съединенията с формула (II') могат да се използват съединенията с формула (IV)



където R^1 и R^2 имат значенията, дадени под обща формула (I) описана преди това; R е нисша алкилова група.

Съединенията с формула (I) от това изобретение могат да се получат по следния начин:



където R^1 , R^2 , R^3 , R^4 и R^5 имат значенията, дадени под обща формула (I) описана преди това; R е нисша алкилова група.

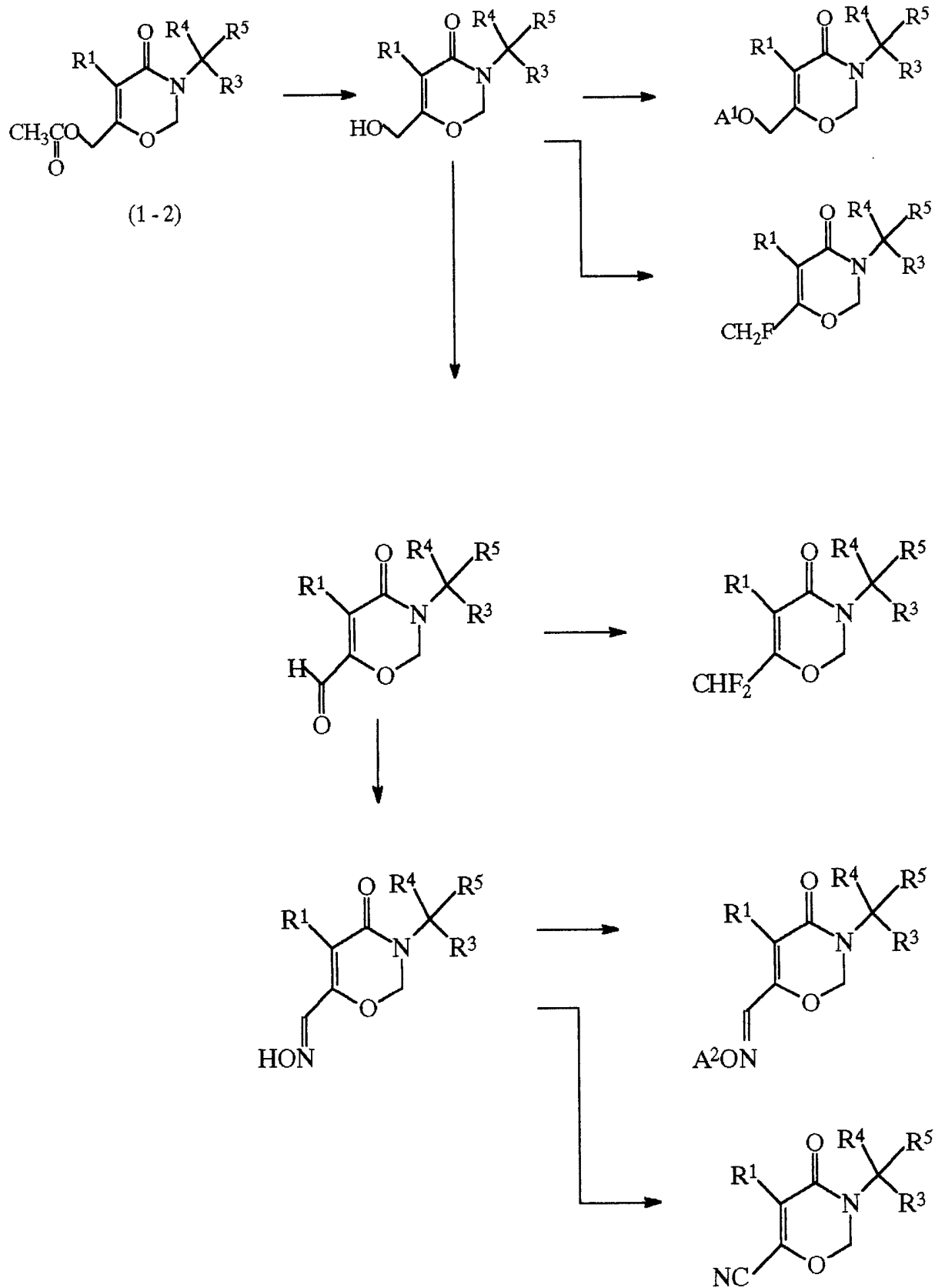
Съединенията с формула (I) от това изобретение могат да се получат чрез взаимодействие на съединения с формула (IV) със съединенията с формула (III) в подходящ разтворител или без разтворител. Реакцията е същата, както получаването на съединенията с формула (I) по метод А с разликата, че съединенията с формула (II') от метод А се заместват със съединенията с формула (IV).

Съединенията с формула (IV) могат да се получат по известни методи или близки до тях.

Метод С:

Освен това има и друг метод за получаване на съединенията с формула (I) на това изобретение. Една ацетилоксиметилова група на съединенията от това изобретение с обща формула (1-2) се превръща поетапно, както се вижда от метод С по-долу.

07.05.98
23

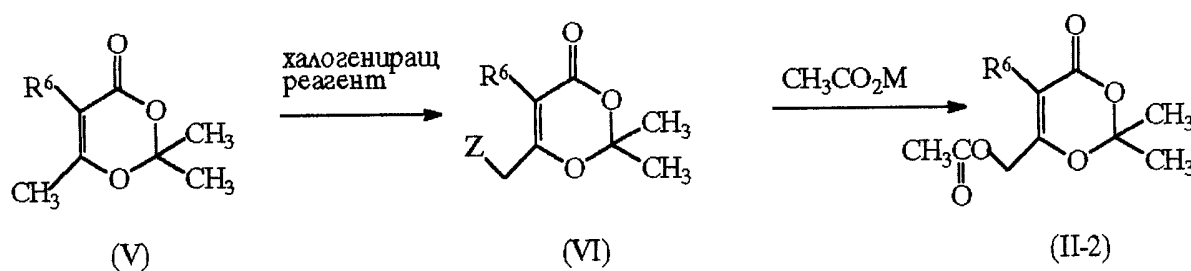


където R^1 , R^3 , R^4 и R^5 имат значенията, дадени под обща формула (I) описана по-горе; A^1 е нисша алкилова група; A^2 е нисша алкилова или нисша ацилова група.

Съединенията с формула (I-2) могат да се получат, например чрез описания по-горе метод А, от съединенията с формула (II-2) на това изобретение.

По-долу ще бъдат описани методите за получаване на съединенията с формула (II). Изобретението обаче не се ограничава от тези методи на получаване.

Измежду съединенията с формула (II) съединенията с формула (II-2) могат да се получат, например по следния метод:



където R^6 е арилова група, която може да бъде заместена; Z е халогенен атом; M е алкален метал.

Съединенията с формула (VI) могат да се получат чрез взаимодействие на съединенията с формула (V) с халогениращ реагент в подходящ разтворител или без разтворител. Оптималната реакционна температура е в областта от температурата на охлаждане с лед до точката на кипене на използвания разтворител.

Реакционното време също може да варира в зависимост от реакционните условия, обикновено реакцията може да приключи за 1 до 24 часа.

Като халогениращ реагент може да се използва, например, хлор, бром, N-хлорсукцинимид или N-бромсукцинимид.

Няма ограничение по отношение на разтворителя и може да се използва всеки един, доколкото е инертен. Например, може да се използва тетрахлорометан, хлороформ или оцетна киселина.

Няма строго ограничение за пропорциите на халогениращия реагент спрямо съединенията с формула (V), но е подходящо халогениращият реагент да се използва в количество от 0.5 до 2 mol на mol от съединенията с формула (V).

Също така е възможно да се ускори химичната реакция чрез прибавяне на катализатор или чрез осветяване.

Съединението с формула (V) може да се изолира от реакционната смес и да се пречисти чрез известни методи като прекристализация и колонна хроматография.

След това съединенията с формула (II-2) на това изобретение могат да се получат чрез взаимодействие на съединенията с формула (VI), получени по-горе, със сол на оцетната киселина с алкален метал, като натриев ацетат, в подходящ разтворител. Оптималната реакционна температура е в областта от стайна температура до точката на кипене на използвания разтворител.

Реакционното време също може да варира в зависимост от реакционните условия, обикновено реакцията може да приключи за 1 до 12 часа.

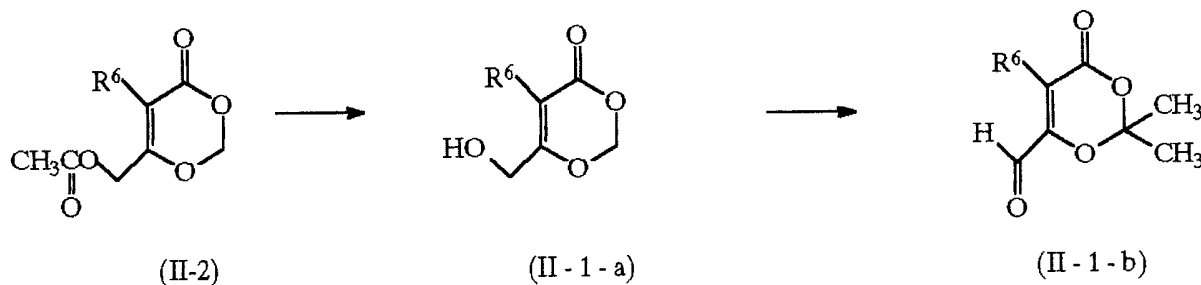
Няма ограничение по отношение на разтворителя, доколкото той е инертен по време на горната химична реакция.

Няма строго ограничение за пропорциите на алкалната сол на оцетната киселина спрямо съединенията с формула (VI), но е подходящо алкалната сол на оцетната киселина да се използва в количество от 0.5 до 5 mol на mol от съединенията с формула (VI).

Съединенията с формула (II-2) могат да се изолират от реакционната смес чрез известни методи и да се пречистят чрез прекристализация и колонна хроматография.

Съединенията с формула (V), които се използват като изходни вещества, могат да се получат чрез вече известни методи, например публикуваните в Chem.Pharm.Bull., 31 (6), 1895 (1983).

Измежду съединенията с формула (II) съединенията с формула (II-1), споменати по-горе, могат да се получат чрез последователно превръщане на ацетилоксиметила вта група на съединенията с формула (II-2) в хидроксиметилова група и след това във формилова група чрез вече известни методи.



където R⁶ е арилова група, която може да бъде заместена.

Съединенията с формула (II-1-a) могат да се получат от съединенията с формула (II-2) чрез реакция в подходящ разтворител или без разтворител - например, хидролиза в присъствие на основа или заместване на естера с нисш алкохол.

След това съединенията с формула (II-1-b) могат да се получат от съединенията с формула (II-1-a) например чрез взаимодействие с окисляващ реагент в подходящ разтворител и с катализатор, ако е необходимо.

Като окисляващ реагент може да се използва например хромен оксид, хромат, дихромат, манганов диоксид, кислород, диметилсулфоксид.

Новите съединения с формула (I) на това изобретение имат хербицидно действие, следователно могат да се осигурят нови хербициди, съдържащи съединенията с формула (I) като активни компоненти.

Когато съединенията на това изобретение се използват като хербициди, те се смесват с носители, разредители, добавки и спомагателни вещества по известни методи и се формулират във форма, която е приемлива като обичайните селскостопански химикали, например прахове, гранули, умокрящи се прахове, емулгиращи се концентрати, разтворими прахове, течности и т. н. Те могат да се използват в смес или в комбинация с други селскостопански химикали, например фунгициди, инсектициди, акарициди, хербициди, регулатори на растежа, торове, почвopодобрители и т. н.

По-специално, приложението на съединенията на това изобретение в смеси с други хербициди може да доведе не само до намаляване на дозата, намаляване на работната сила, но и до разширяване на хербицидният спектър, дължащо се на съвместното действие, и други положителни ефекти, дължащи се на синергичното действие на двата реагента.

Обикновено за формулировките се използват течни или твърди носители или разредители.

Примери за твърди носители или разредители са глинни, които се представят чрез каолинити, монтморилонити, илити, полигроскити и т.н., по-специално пирофилит, атапулгит, сепиолит, каолинит, бентонит, вермикулит, сяода, талк, т.н.; и други неорганични вещества като гипс, калциев карбонат, доломит, гуатомит, магнезиева вар, фосфорна вар, зеолит, анхидрид на силициевата киселина, синтетичен калциев силикат и т.н.; органични вещества от растителен произход като соево брашно, тютюнево брашно, орехово брашно, пшеничено брашно, гървени трици, нишесте, кристалинна целулоза и т.н.; синтетични или естествени полимери като кумаронова смола, нефтена смола, алкидна смола, поливинилхлорид, полиалкиленгликол, кетонна смола,

естерна смола, копалова смола, дамарова смола и т.н.; восъци като карнаубски восък, пчелен восък и т.н.; или карбамид и др.

Примери за подходящи течни носители са парафин или нафтенвъглеродороди като керосин, минерално масло, вретенно масло, рафинирано масло и т.н.; ароматни въглеродороди като ксилен, етилбензен, кумен, метилнафтаден и т.н.; хлорирани въглеродороди като трихлоретилен, моноклоробензен, о-хлоротолуен и т.н.; етери като диоксан, тетрахидрофуран и т.н.; кетони като ацетон, метилетилкетон, диизобутилкетон, циклохексанон, ацетофенон, изофорон и т.н.; естери като етилацетат, амилацетат, етиленгликолацетат, диетиленгликолацетат, дибутилмалеат, диетилсукцинат и т.н.; алкохоли като напр. метанол, п-хексанол, етиленгликол, диетиленгликол, циклохексанол, бензилалкохол и т.н.; етерни алкохоли като етиленгликолетилетер, диетиленгликол-бутилетер и т.н.; полярни разтворители като диметилформамид, диметилсулфоксид и т.н. или вода.

Освен това могат да се използват повърхностноактивни вещества и други спомагателни вещества със съединенията от това изобретение за различни цели като емулгиране, диспергиране, овлажняване, нанасяне, разделяне, свързване, подобрене на течливостта, предотвратяване на корозия, предотвратяване на замръзване и т.н.

Като повърхностноактивно вещество може да се използва един от видовете неионни, анионни, катионни и амфотерни повърхностно активни вещества. Обикновено се използват неионни и/или анионни повърхностно активни вещества.

Като подходящи неионни повърхностно активни вещества могат да се споменат например продукти на присъединителна полимеризация на етиленоксид с висши алкохоли като лаурилов

алкохол, стеарилов алкохол, олеилов алкохол и т.н.; продукти на присъединителна полимеризация на етиленоксид с алкилнафтоли като бутилнафтол, октилнафтол и т.н.; продукти на присъединителна полимеризация на етиленоксид с висши мастни киселини като палмитинова, стеаринова, олеинова киселина и т.н.; естери на висши мастни киселини и многоатомни алкохоли като сорбитан и продукти на присъединителна полимеризация на етиленоксид с тях.

Като подходящи анионни повърхностно активни вещества могат да се споменат например алкилсулфатни соли като натриев лаурилсулфат, аминосоли на естери на сярна киселина и олеилалкохол и т.н. алкилсулфонатни соли като натриев диоктилсулфосукцинат, натриев 2-етилхексенсулфонат и т.н. арилсулфонатни соли като натриев изопропилнафтагенсулфонат, натриев метиленбиснафтаген-сулфонат и т.н.

Освен това за подобряване качествата на формулировките, засилване на действието и т.н., хербицидите от това изобретение могат да се използват в комбинация с полимери и други помощни средства като например казеин, желатин, албумин, тюткал, натриев алгинат, карбоксиметилцелулоза, метилцелулоза, хидрокси-етилцелулоза, поли(винилалкохол) и т. н.

Описаните по-горе носители или различните помощни вещества се използват самостоятелно или в комбинация с други в зависимост от целите, като се отчитат, например формите на формулировките, условията на приложение и т. н.

Съдържанието на активни вещества в различните формулировки от това изобретение може да варира в зависимост от формите на формулировките, като подходящото съдържание е в границите от 0.1 до 99 тегловни % и предимно от 1 до 80 тегловни %.

В случай когато формулировките са умокряеми прахове, готовата формулировка съдържа активни вещества в границите от 25 до 90 %, а останалата част е от твърди носители и средства умокрящи дисперсията. Ако е необходимо могат да се добавят колоидни защитни средства, обезпенители и т. н.

В случай когато формулировките са под форма на гранули, формулировката съдържа активни вещества обикновено в границите от 1 до 35 тегловни %, а останалата част може да бъде от твърди носители и повърхностно активни вещества. Активните вещества могат да се смесят равномерно с твърдите носители, да се фиксират към тях или да се адсорбират равномерно на повърхността на твърдите носители. Предпочита се диаметърът на гранулите да бъде в границите от около 0.2 до 1.5 mm.

В случай когато формулировката представлява емулгируем концентрат, формулировката съдържа обикновено активни вещества в границите от 5 до 30 тегловни %, освен това около 5 до 20 тегловни % емулгатори, а останалата част е от течни носители. Ако е необходимо, могат да се добавят средства за нанасяне и антикорозионни средства.

В случай когато формулировката е течна, формулировката съдържа обикновено активни вещества в границите от 5 до 50 тегловни %, а останалата част е вода. Ако е необходимо могат да се добавят колоидни защитни средства, консерванти, обезпенители и т. н.

Съединенията съгласно изобретението могат да се използват самостоятелно като хербициди или под каквато и да е форма на формулировка, описана по-горе.

Хербицидите съгласно изобретението могат да се прилагат в ефективни количества към различни почви за да ги защитят,

например към земеделски земи като оризови полета и планински полета, или към неземеделски земи, преди поникване на плевели или към плевели в различен етап на растеж от преди поникване до порастване.

Дозата като количество активни съставки обикновено е от 0.1 до 10,000 g/ha, предимно от 1 до 5,000 g/ha. Дозите на приложение могат да варират в зависимост от вида на плевелите и от техния етап на растеж, мястото на приложение, времето и т. н.

Получаване на 6-ацетилоксиметил-3-[1-метил-1-(3,5-дихлорофенил)етил]-5-фенил-2,3-дихидро-4H-1,3-оксазин-4-он (Съединение No. 69)

6-Ацетилоксиметил-2,2-диметил-5-фенил-2H, 4H-1,3-диоксин-4-он (съединение No. 241, 17.1 g) се смесва с N-метилен-1-метил-1-(3,5-дихлорофенил)етиламин (14.7 g) и към тях се добавя ксилен (120 ml). След загряване под обратен хладник в продължение на 1 час разтворителят се отстранява чрез изпаряване и суровото вещество се прекристализира от смес на хексан и етилацетат, при което се получава заглавното съединение (22.83 g, добив 85%).

Получаване на 6-флуорометил-3-[1-метил-1-(3,5-дихлорофенил)етил]-5-фенил-2,3-дихидро-4H-1,3-оксазин-4-он (Съединение No. 4)

Диетиламиносулфат трифлуорид (0.60 g) се разтваря в дихлорометан (3 ml) и при -63°C се прибавя на капки дихлорометанов разтвор (7 ml) на 6-хидроксиметил-3-[1-метил-1-(3,5-дихлорофенил)етил]-5-фенил-2,3-дихидро-4H-1,3-оксазин-4-он (съединение No. 55, 1.40 g).

След загряване до стайна температура при бъркане в продължение на 30 минути, реакционната смес се разделя и органичната фаза се промива с вода и се суши с магнезиев сулфонат. След отстраняване на разтворителя чрез изпарение, суровото

вещество се пречиства чрез хроматография върху силикагел, при което се получава заглавното съединение (0.99 g, добив 70%).

Получаване на 6-ацетилоксииминометил-3-[1-метил-1-(3,5-дихлорофенил)етил]-5-фенил-2,3-дихидро-4Н-1,3-оксазин-4-он
(Съединение No. 147)

Сместа от 6-хидроксииминометил-3-[1-метил-1-(3,5-дихлорофенил)етил]-5-фенил-2,3-дихидро-4Н-1,3-оксазин-4-он (съединение No. 135, 0.60 g) и безводна оцетна киселина (2 ml) се бърка при стайна температура в продължение на 4 часа. Реакционната смес се изсипва във вода и се екстрахира с етилацетат. Органичната фаза се помива с наситен солев разтвор и се суши с магнезиев сулфонат. След отстраняване на разтворителя чрез изпарение, суровото вещество се пречиства чрез хроматография върху силикагел, при което се получава заглавното съединение (0.54 g, добив 94%).

Получаване на 6-циано-3-[1-метил-1-(3,5-дихлорофенил)етил]-5-фенил-2,3-дихидро-4Н-1,3-оксазин-4-он (Съединение No. 167)

6-хидроксииминометил-3-[1-метил-1-(3,5-дихлорофенил)етил]-5-фенил-2,3-дихидро-4Н-1,3-оксазин-4-он (съединение No. 135, 0.50 g), трифенилфосфин (0.33 g), тетрачлорометан (0.19 g) и триетиламин (0.13 g) се смесват и към тях се прибавя дихлорометан (5 ml). Сместа се загрява 2.5 часа под обратен хладник. След като реакционната смес се промие с вода и се изсуши с магнезиев сулфонат, разтворителят се отстранява чрез изпаряване и суровото вещество се пречиства чрез хроматография върху силикагел, при което се получава заглавното съединение (0.39 g, добив 82%).

Получаване на 6-трифлуорометил-3-[1-метил-1-(3,5-дихлорофенил)етил]-5-фенил-2,3-дихидро-4Н-1,3-оксазин-4-он (Съединение No. 49) (Метод В)

Етилов 2-трифлуороацетил-2-фенилацетат (1.30 g) и N-метилен-1-метил-1-(3,5-дихлорофенил)етиламин (1.19 g) се смесват и към тях се прибавя ксилен (10 ml). Сместа се оставя да реагира под обратен хладник в продължение на 30 минути. След отстраняване на разтворителя чрез изпарение, суровото вещество се прекристализира от смес на хексан и етилацетат, при което се получава заглавното съединение (1.80 g, добив 84%).

Получаване на 6-хидроксиметил-2,2-диметил-5-фенил-2H,4H-1,3-диоксин-4-он (Съединение No. 236)

6-Ацетилоксиметил-2,2-диметил-5-фенил-2H,4H-1,3-диоксин-4-он (съединение No. 241, 7.46 g) се разтваря в метанол (108 ml), охлажда се с лед и към него бавно се прибавя воден разтвор (27 ml) на калиев карбонат (2.42 g).

След 30 минути бъркане метанолът се отстранява чрез изпаряване, остатъкът се подкислява с 2N солна киселина и се филтрува. Суровото вещество се прекристализира от смес на хексан и етилацетат, при което се получава заглавното съединение (3.84 g, добив 61%).

Получаване на 6-формил-2,2-диметил-5-фенил-2H,4H-1,3-диоксин-4-он (Съединение No. 246)

Пиридиниев хлорохромат (1.29 g) се суспендира в дихлорометан (8 ml) и при стайна температура се добавя дихлорометанова суспензия (3 ml) на 6-хидроксиметил-2,2-диметил-5-фенил-2H,4H-1,3-диоксин-4-он (съединение No. 236, 0.70 g). След 5 часа бъркане се добавя голямо количество етер и се екстрахира чрез отдекантиране. Органичната фаза се суши с магнезиев сулфонат, разтворителят се изпарява и суровото вещество се пречиства чрез хроматография върху силикагел, при което се получава заглавното съединение (0.43g, добив 67%).

Точките на топене и δ -стойности на $^1\text{H-NMR}$ на съединенията, получени в по-горните примери и съединенията, получени по подобни методи, са показани в таблица 3.

Таблица 3

Съед. No.	$^1\text{H-NMR}$ δ (ppm) разтворител CDCl_3 TMS=0 ppm	Т. на топене ($^{\circ}\text{C}$)
1	1.84 (s, 6H), 4.81 (d, 2H), 5.18 (s, 2H), 7.23-7.44 (m, 10H)	82.4-85.0
4	1.75 (s, 6H), 4.84 (d, 2H), 5.37 (s, 2H), 7.20 - 7.38 (m, 10H)	96.1-99.5
34	1.84 (s, 6H), 5.24 (s, 2H), 6.01 (t, 1H), 7.22 - 7.43 (m, 10H)	78.3-80.3
36	1.76 (s, 6H), 5.43 (s, 2H), 6.03 (t, 1H), 7.20 - 7.39 (m, 8H)	112.5-115.8
48	1.85 (s, 6H), 5.21 (s, 2H), 7.23 - 7.43 (m, 10H)	маслоподоб- но β - β o
49	1.76 (s, 6H), 5.42 (s, 2H), 7.20 - 7.25 (m, 5H), 7.32 - 7.38 (m, 10H)	121.6-123.9
53	1.84 (s, 6H), 4.17 (d, 2H), 5.15 (s, 2H), 7.21 - 7.44 (m, 10H)	156.5-159.5
55	1.74 (s, 6H), 4.19 (s, 2H), 5.34 (s, 2H), 7.19 - 7.36 (m, 8H)	132.4-136.7
66	1.83 (s, 6H), 2.03 (s, 3H), 4.61 (s, 2H), 5.14 (s, 2H), 7.21 - 7.43 (m, 10H)	маслоподоб- но β - β o
69	1.74 (s, 6H), 3.33 (s, 3H), 3.98 (s, 2H), 5.35 (s, 2H), 7.19 - 7.36 (m, 8H)	115.0-117.0
114	1.83 (s, 6H), 3.30 (s, 3H), 3.95 (s, 2H), 5.17 (s, 2H), 7.20 - 7.43 (m, 10H)	маслоподоб- но β - β o

Таблица 3 (продължение)

Съед. No.	$^1\text{H-NMR}$ δ (ppm) TMS=0 ppm	разтворител CDCl_3	Т. на топене ($^{\circ}\text{C}$)
116	1.74 (s, 6H), 3.33 (s, 3H), 3.98 (s, 2H), 5.36 (s, 2H), 7.20 - 7.36 (m, 8H)		маслоподоб- но в-во
121	1.85 (s, 6H), 5.23 (s, 2H), 7.22 - 7.46 (m, 10H), 9.36 (s, 1H)		94.0-97.7
122	1.77 (s, 6H), 5.40 (s, 2H), 7.22 (s, 3H), 7.41 (s, 5H), 9.38 (s, 1H)		98.9-102.0
134	1.85 (s, 6H), 5.23 (s, 2H), 7.21 - 7.43 (m, 10H), 7.55 (s, 1H), 8.06 (s, 1H)		176.0-181.5 (разлагане)
135	1.76 (s, 6H), 5.41 (s, 2H), 7.20-7.38 (m, 8H), 7.57 (s, 1H), 8.15 (s, 1H)		187.0-197.0 (разлагане)
147	1.76 (s, 6H), 2.16 (s, 3H), 5.45 (s, 2H), 7.20-7.40 (m, 8H), 7.78 (s, 1H)		177.7-180.0
160	1.75 (s, 6H), 4.00 (s, 3H), 5.43 (s, 2H), 7.20-7.35 (m, 8H), 7.51 (s, 1H)		129.5-132.5
164	1.84 (s, 6H), 5.20 (s, 2H), 7.26 - 7.47 (m, 10H)		141.5-145.2
167	1.76 (s, 6H), 5.38 (s, 2H), 7.22 (s, 3H), 7.41 (s, 5H)		123.3-127.5
236	1.82 (s, 6H), 1.89 (t, 1H), 4.20 (d, 2H), 7.28-7.43 (m, 5H)		94.0-96.5
241	1.79 (s, 6H), 2.05 (s, 3H), 4.62 (s, 2H), 7.25-7.42 (m, 5H)		маслоподоб- но в-во
246	1.84 (s, 6H), 7.40-7.50 (m, 5H), 9.46 (s, 1H)		78.0-80.8

По-долу са показани няколко варианта на формулировки, в които се използват съединенията от това изобретение. В следващите формулировки всички "части" са тегловни.

Пример 1 за формулировка (емулгируем концентрат)

съединение No. 147	20 части
ксилен	50 части
циклохексен	20 части
калциев додецилбензенсулфонат	5 части
полиоксиетиленстирилфенилестер	5 части

Горните вещества се смесват и разтварят равномерно за да се получат 100 части от емулгируема формулировка.

Пример 2 за формулировка (умокряем прах)

съединение No. 147	20 части
глина	70 части
калциев лизинсулфонат	7 части
кондензат от алкилнафтален-сулфонова киселина и формалдехид	3 части

Горните вещества се смесват и пулверизират като се използва струйна мелница за да се получат 100 части от умокряемата формулировка.

Пример 3 за формулировка (течна)

съединение No. 147	20 части
натриев ди-(2-етилхексил)-сулфосукцинат	2 части
полиоксиетиленнонифенилестер	2 части
противопенител	0.5 части
пропиленгликол	5 части
вода	70.5 части

Горните вещества се смесват и пулверизират равномерно, като се използва тонкова мелница, за да се получат 100 части течна формулировка.

Хербициди, съдържащи съединенията от това изобретение, могат да се формулират както е описано в горните примери или по подобни методи за формулировки.

По-долу с помощта на примери за изследване ще бъдат обяснени хербицидните действия на съединенията от това изобретение.

Пример 1 (оризово поле, почвено приложение)

Подходящо количество вода и химически тор се прибавят към почвата за отглеждане на ориз. Тя се поставя в пластмасови саксии с размер 130 cm^2 и се смесва добре за да бъде готова за засаждане на присад от оризово растение (разновидност: Koshihikari), състоящ се от двойка стръкчета, отгледан предварително в парник до двулистен стадий, като във всяка саксия се засажда по един присад. Освен това във всяка саксия са засадени определено количество семена от Nobie (*Echinochloa orizicola*), Konagi (*Monochoria vaginalis* var. *plantaginea*), Azena (*Lindernia procumbens*) и Hotarui (*Scirpus juncoides* var. *hotarui*) респективно и се долива вода до дълбочина от 3 cm. На следващия ден се приготвят формулировки от умокряем прах по метода, описан в пример 2 и се разрежда с подходящо количество вода до концентрация на активното вещество от 5 до 1 kg на хектар. Разредената формулировка се прилага чрез изкапване с пипета.

След 21 дни от приложението на химикалите се прави оценка на хербицидното действие върху всеки плевел и на фитотоксичността върху оризовите растения съгласно следните критерии. Получените резултати са показани в таблица 4.

Критерии за оценка

скала	хербицидно действие: съотношение на унищожени плевели спрямо контрола (%)	Фитотоксичност към реколтата: съотношение на увредени растения спрямо контрола (%)
0	0	както лявата колона
1	над 0 до 10	
2	над 10 до 20	
3	над 20 до 30	
4	над 30 до 40	
5	над 40 до 50	
6	над 50 до 60	
7	над 60 до 70	
8	над 70 до 80	
9	над 80 до 90	
10	над 90 до 100	

Таблица 4

Съед. No.	Активно в-во доза g/хектар	Хербицидно действие				Фито- токсичност оризово растение
		Nobie	Konagi	Azena	Hotaru i	
4	1000	10	10	10	10	2
	5000	10	10	10	10	10
34	1000	10	10	10	10	0
	5000	10	10	10	10	2
49	1000	10	10	10	10	0
	5000	10	10	10	10	0
69	1000	10	10	10	10	10
	5000	10	10	10	10	10
147	1000	10	10	10	10	6
	5000	10	10	10	10	7

Заб.: Nobie: Echinochloa orizicola

Konagi: Monochoria vaginalis var. plantaginea

Azena: Lindernia procumbens

Hotarui: Scirpus juncoides var. hotarui

Пример 2 (оризово поле лустно приложение)

Почва за отглеждане на ориз се поставя в пластмасови саксии с размер 130 cm^2 , към нея се добавят подходящо количество вода и химически торове и се размесва, за да бъде готова за засаждане на присад от оризово растение (разновидност: Koshihikari), състоящ се от двойка стръкчета, отгледан предварително в парник до двулустен стадий, като във всяка саксия се засажда по един присад. Освен това във всяка саксия са засадени определено количество семена от Nobie (*Echinochloa orizicola*), Konagi (*Monochoria vaginalis* var. *plantaginea*), Azena (*Lindernia procumbens*) и Hotarui (*Scirpus juncoides* var. *hotarui*) респективно и се долива вода до дълбочина от 3 cm.

След отглеждане на растенията в парник до етап от 1.5 листа на Nobie (*Echinochloa orizicola*), се приготвят формулировки от умокряем прах по метода, описан в пример 2 и се разрежда с подходящо количество вода до концентрация на активното вещество от 5 до 1 kg на хектар. Разредената формулировка се прилага чрез изкапване с пипета.

След 21 дни от приложението на химикалите се прави оценка на хербицидното действие върху всеки плевел и на фитотоксичността върху оризовите растения съгласно критериите, описани в пример 1. Получените резултати са показани в таблица 5.

Таблица 5

Съед. No.	Активно в-во доза g/хектар	Хербицидно действие				Фито- токсичност оризово растение
		Nobie	Konagi	Azena	Hotaru i	
4	1000	10	10	10	9	3
	5000	10	10	10	9	8
34	1000	9	9	10	10	0
	5000	10	10	10	10	0
49	1000	10	4	10	10	0
	5000	10	9	10	10	0
69	1000	10	10	10	10	10
	5000	10	10	10	10	10
147	1000	10	10	10	10	3
	5000	10	10	10	10	8

Заб.: Nobie: Echinochloa orizicola

Konagi: Monochoria vaginalis var. plantaginea

Azena: Lindernia procumbens

Hotarui: Scripus juncoides var. hotarui

Пример 3 (приложение върху планинска почва)

Планинска почва се поставя в пластмасови саксии с размер 130 cm², в които са засадени определени количества семена от Nobie (*Echinochloa crus-galli*), Mehishiba (*Digitaria ciliaris*) и Enokorogusa (*Setaria viridis*) респективно и отгоре се поставя слой почва от 1 cm.

На следващия ден след посяването се приготвят формулировки от умокряем прах по метода, описан в пример 2 и се разрежда с подходящо количество вода до концентрация на активното

вещество от 5 до 1 kg на хектар. Разредената формулировка се разпръсква равномерно върху повърхността на почвата.

След 21 дни от приложението на химикалите се прави оценка на хербицидно действие върху всеки плевел съгласно критериите, описани в пример 1. Получените резултати са показани в таблица 6.

Таблица 6

Съед. No.	Активно в-во гоза g/хектар	Хербицидно действие		
		Nobie	Mehishiba	Enokorogusa
4	1000	10	10	9
	5000	10	10	10
34	5000	10	10	10
49	5000	8	10	10
69	1000	10	10	10
	5000	10	10	10
147	1000	10	10	10
	5000	10	10	10

Заб.: Nobie: Echinochloa crus-galli

Mehishiba: Digitaria ciliaris

Enokorogusa: Setaria viridis

Съединенията съгласно това изобретение с обща формула (I) показват сходно хербицидно действие при много ниски дози в широк обхват от покълване до порастване на едногодишни плевели в оризови полета kamo Hie (*Echinochloa orizicola*), Tamagayatsuri (*Cyperus difformis*), Konagi (*Monochoria vaginalis* var. *plantaginea*), Kikashigusa (*Rotala indica* var. *uliginosa*), Azena (*Lindernia procumbens*), Abunome (*Dopatrium junceum*) и т. н. и на многогодишни плевели kamo Hotarui (*Scirpus juncoides* var. *hotarui*), Matsubai (*Eleocharis acicularis* var. *longiseta*), Heraomodaka (*Alisma canaliculatum*),

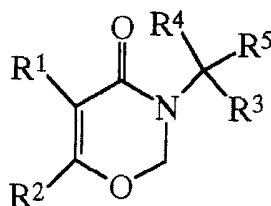
Mizugayatsuri (*Cyperus serotinus*) и т. н. и показват също така висока безопасност за присадени и директно засадени оризови растения както в оризища, така и в планински полета.

Освен това те проявяват силно хербицидно действие при почвено или листно приложение върху различни планински широколистни плевели като Tade (*Persicaria longiseta*), Aobiyu (*Amaranthus viridis*), Shiroza (*Chenopodium album*) и т. н., върху едногодишни и многогодишни *Cyperus* плевели като Hamasuge (*Cyperus rotundus*), Kihamasuge (*Cyperus esculantus*), Himekugu (*Cyperus brevifolius* var. *leiolepis*), Kayatsurigusa (*Cyperus microiria*), Kogomegayatsuri (*Cyperus iria*) и т. н. и върху планински тревни плевели като Hie (*Echinochloa crus-galli*), Mehishiba (*Digitaria ciliaris*), Enokorogusa (*Setaria viridis*), Suzumenokatabira (*Poa annua*), Johnsongrass (*Sorghum halepense*), guв овес (*Avena sativa*), Suzumenoteppo (*Alopecurus aequalis* var. *amurensis*), и т. н. и също така показват висока безопасност към култури като соя, памук, захарно цвекло, рапица, слънчоглед, царевица, планински ориз, пшеница и т. н.

Съединенията съгласно изобретението могат да се използват не само в оризища и планински полета, но и в овощни градини, черничеви полета, тревни площи и нефермерски терени. Освен това при смесване на съединенията съгласно изобретението с вече известни съединения, те показват пълно хербицидно действие върху плевели, които се контролират трудно от съединенията, приложени самостоятелно и контролират ефективно различни плевели вследствие на синергични хербицидни ефекти при дози, при които само съединение би се справило трудно. В допълнение съединенията съгласно изобретението показват висока безопасност към култури като соя, памук, захарно цвекло, рапица, слънчоглед, царевица, планински ориз, пшеница и т. н., следователно те могат да осигурят хербициди, които се много полезни в селското стопанство.

ПАТЕНТНИ ПРЕТЕНЦИИ

1. 1,3-Оксазин-4-онови производни, характеризиращи се със следната обща формула (I):



(I)

където R^1 е нисша алкилова група, нисша алкенилова група, нисша алкинилова група или арилова група, която може да бъде заместена, или аралкилова група, която може да бъде заместена;

R^2 е нисша халогеноалкилова група, нисша хидроксиалкилова група, нисша алкоксиалкилова група, нисша ацилоксиалкилова група, формилова група, хидроксииминометилова група, нисша алкоксииминометилова група, нисша ацилоксииминометилова група, цианова група, или нисша алкоксикарбонилова група;

R^3 е нисша алкилова група, арилова група, която може да бъде заместена, или аралкилова група, която може да бъде заместена;

R^4 и R^5 независимо един от друг са нисша алкилова група или R^4 и R^5 взети заедно с въглеродния атом, към който са свързани, образуват 3- до 8-членна карбоциклична група, която може да има разклонение от нисша алкилова група.

2. 1,3-Оксазин-4-онови производни съгласно претенция 1, където

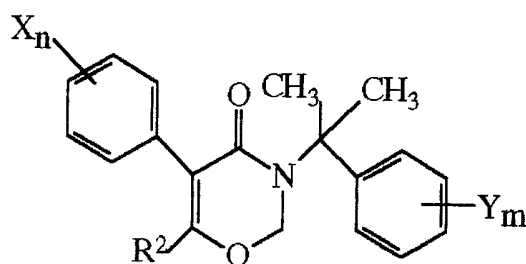
R^1 е разклонена алкилова група, като например изобутилова или изопропилова група; или фенилова група, която не е заместена или е заместена с халогенен атом или нисша алкилова група;

R^2 има значението, дадено в претенция 1;

R^3 е фенолова или 2-нафтилова група, която не е заместена или е заместена с един или два халогенни атома, нисша халогеноалкилова група или нисша халогеноалкоксигрупа;

R^4 и R^5 независимо един от друг означават метилова група.

3. Съединения съгласно претенция 2, характеризиращи се с общата формула (I-1):

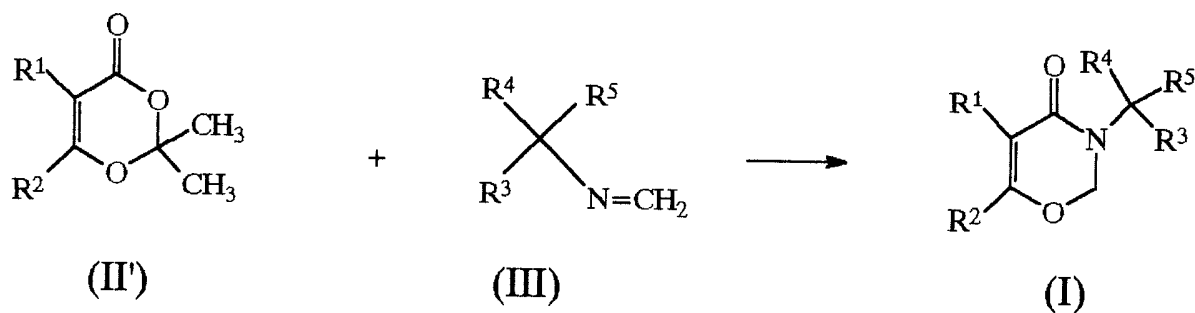


(I-1)

където R^2 има значението, дадено в претенция 2, X е халогенен атом или нисша алкилова група; Y е халогенен атом или нисша халогеноалкилова група; n е 0 или 1; m е 0, 1 или 2.

4. Метод за получаване на съединение с обща формула (I), описана в претенция 1, характеризиращ се с това, че съединение (I) се получава чрез взаимодействие на съединение с формула (II') със съединение с формула (III):

Метод А:



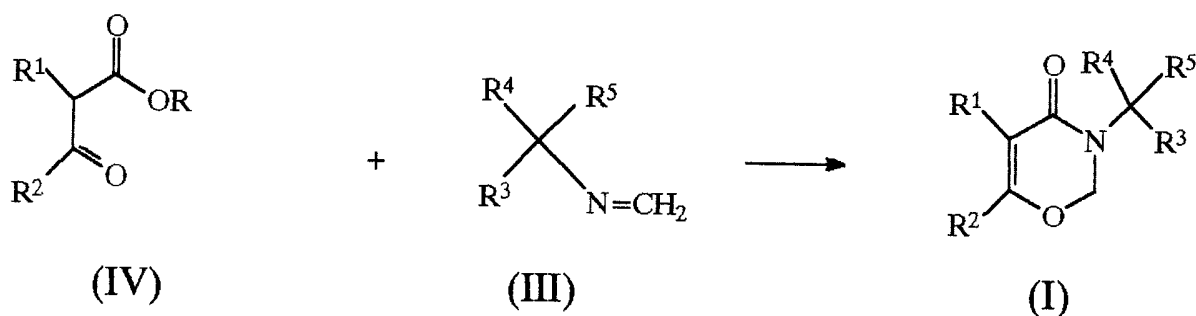
R^1 и R^5 имат значението, дадено в претенция 1.

5. Метод съгласно претенция 4, характеризиращ се с това, че количеството на съединения с формула (III) е от 0.5 до 2 mol, предимно от 0.9 до 1.1 mol на mol от съединения с формула (II').

07.05.98
3

6. Метод за получаване на съединение с обща формула (I), описана в претенция 1, характеризиращ се с това, че съединение с формула (I) се получава чрез взаимодействие на съединение с формула (IV) със съединение с формула (III):

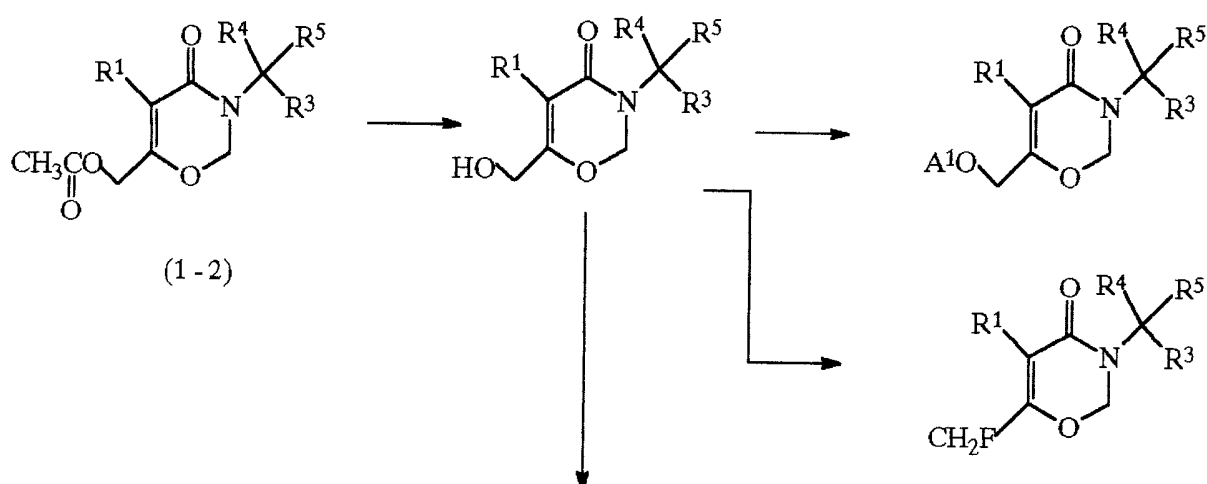
Метод B



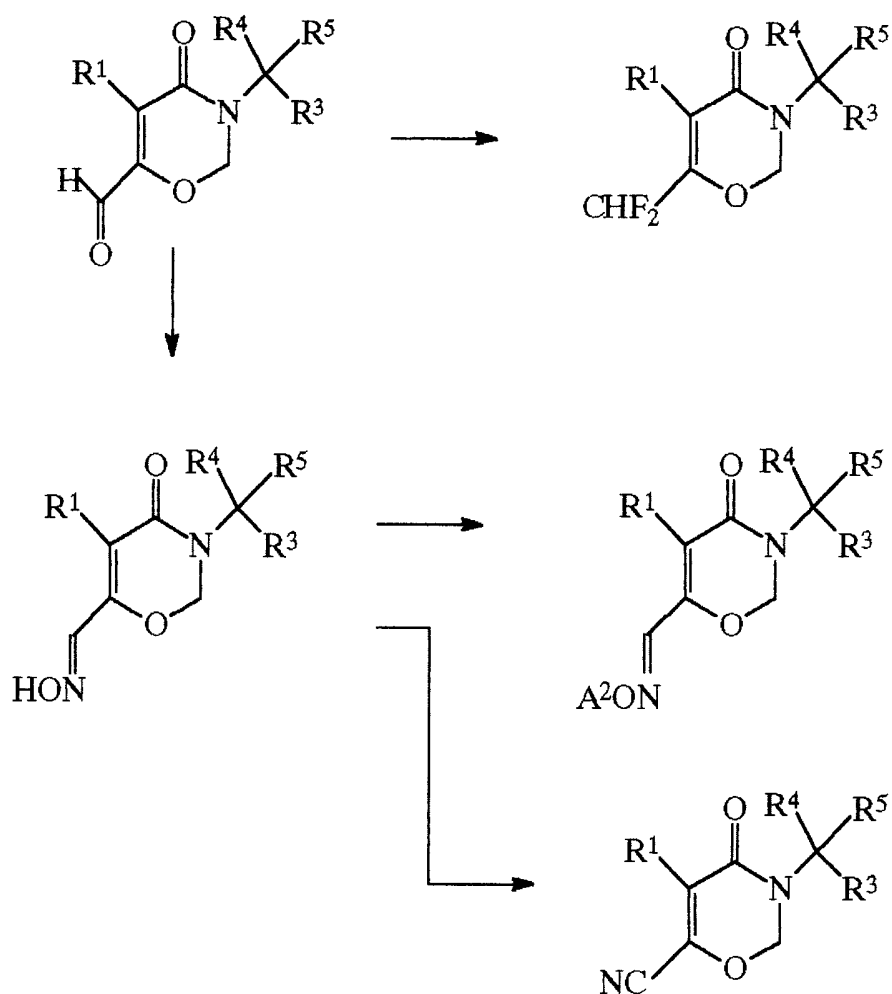
R^1 и R^5 имат значенията, дадени в претенция 1.

7. Метод за получаване на съединение с обща формула (I), описана в претенция 1, характеризиращ се с това, че съединение с формула (I-2), което е съединение с формула (I), в която R^2 е ацетилметоксигрупа, се превръща в друго съединение с формула (I):

Метод C

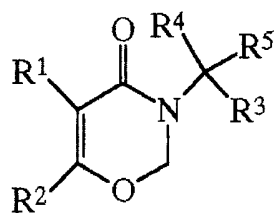


07.05.98
4



R^1 и R^3 до R^5 имат значенията, дадени в претенция 1, A^1 е нисша алкилова група и A^2 е нисша алкилова или нисша ацилова група.

8. Хербициден състав, характеризиращ се с това, че като активен компонент съдържа поне едно 1,3-оксазин-4-оново производно, характеризиращо се със следната обща формула I:



(I)

където R^1 е нисша алкилова група, нисша алкенилова група, нисша алкинилова група или арилова група, която може да бъде заместена, или аралкилова група, която може да бъде заместена;

R^2 е нисша халогеноалкилова група, нисша хидроксиалкилова група, нисша алкоксиалкилова група, нисша ацилоксиалкилова група, формилова група, хидроксииминометилова група, нисша алкоксииминометилова група, нисша ацилоксииминометилова група, цианова група, или нисша алкоксикарбонилова група;

R^3 е нисша алкилова група, арилова група, която може да бъде заместена, или аралкилова група, която може да бъде заместена;

R^4 и R^5 независимо един от друг са нисша алкилова група или R^4 и R^5 взети заедно с въглеродния атом, към който са свързани, образуват 3- до 8-членна карбоциклична група, която може да има разклонение от нисша алкилова група, с приемливи за земеделието добавки.

9. Състав съгласно претенция 8, характеризиращ се с това, че съдържанието на съединение (I) е от 0.1 до 99 тегловни %, предимно между 1 и 80 тегловни %.

10. Състав съгласно претенция 9, който е умокряем прах, характеризиращ се с това, че количеството на активния компонент (I) е от 25 до 90 тегловни %, а остатъкът представлява твърди носители и средства за умокряне на дисперсията.

11. Състав съгласно претенция 9, който е гранулат, характеризиращ се с това, че количеството на активния компонент (I) е от 1 до 35 тегловни %, а остатъкът представлява твърди носители и повърхностно активни вещества.

12. Състав съгласно претенция 9, който е емулгируем концентрат, характеризиращ се с това, че количеството на активния компонент (I) е от 5 до 30 тегловни %, който състав освен това съдържа 5 до

20 тегловни % емулгатори, а остатъкът представлява твърди носители.

13. Състав съгласно претенция 9, който е течност, характеризиращ се с това, че количеството на активния компонент (I) е от 5 до 50 тегловни %, който състав освен това съдържа 3 до 10 тегловни % средства за умокряне на дисперсията, а остатъкът е вода.

14. Метод за контрол на плевели, състоящ се в прилагане на ефективни количества от съединение съгласно претенции 1 до 3 или на състав съгласно претенции 8 до 13 за защита на различни почви, които включват земеделски почви като оризови полета или планински полета или неземеделски почви.

15. Метод съгласно претенция 14, при който прилагането се извършва преди покълване на плевелите или към плевели в различен стадий на растеж от покълване до израстване.

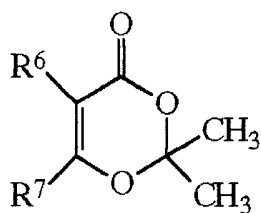
16. Метод съгласно претенция 14 или 15, при който прилаганото количество от съединение (I) е 0.1 до 10,000 g на хектар, предимно между 1 и 5,000 g на хектар.

17. Метод съгласно една от претенциите 14 до 16, при който културите, в които трябва да се унищожават плевели, са ориз, соя, памук, захарно цвекло, рапица, слънчоглед, царевица, планински ориз, пшеница и т. н.

18. Метод съгласно една от претенциите 14 до 16, при който земите, в които трябва да се унищожават плевели са овощни градини, черничеви полета, тревни площи и неземеделски земи.

19. Междинни 1,3-диоксин-4-онови производни, характеризирани се със следната обща формула (II)

07.05.98
7



(II)

където R^6 е арилова група, която може да бъде заместена;

R^7 е хидроксиметилова, ацетилоксиметилова или формилова група.