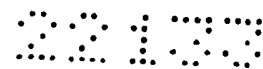


A
**KÖZZÉTÉTELI
PÉLDÁNY**



177/95

59.980/PA

70582

K I V O N A T

3-Aril-uracil-származékok és a vegyületek herbicidként való alkalmazása

CIBA-GEIGY AG, BÁZEL, SVÁJC

Nemzetközi

Bejelentés napja: 1994. 04. 11.

Elsőbbsége: 1993. 04. 21. (1207/93-O),

SVÁJC

A nemzetközi bejelentés száma: PCT/EP94/01109

A nemzetközi közzététel száma: WO 94/24128

A találmány (I) általános képletű vegyületekre, a képletben

W (a) vagy (b) általános képletű csoport, amely a gyűrű nitrogénatomjához szénatomon keresztül kapcsolódik;

R₁ hidrogénatom, ~~1-4 szénatomos~~ alkilcsoport, ~~1-4 szénatomos~~ halogén-alkil-csoport, ~~3 vagy 4 szénatomos~~ alkenilcsoport vagy ~~3 vagy 4 szénatomos~~ alkinilcsoport;

R₂ halogénatom vagy cianocsoport;

R₃ hidrogénatom vagy fluoratom;

- R₄ hidrogénatom, halogénatom vagy ~~1-4 szénatomos~~ alkilcsoport;
- R₅ ~~1-4 szénatomos~~ alkilcsoport vagy ~~1-4 szénatomos~~ halogén-alkil-csoport;
- R₆ és R₇ ~~egymástól függetlenül~~ hidrogénatom, ~~1-8 szénatomos~~ alkilcsoport, ~~3-6 szénatomos~~ alkenilcsoport, ~~3-6 szénatomos~~ alkinilcsoport, ~~3-8 szénatomos~~ cikloalkilcsoport, ~~1-6 szénatomos~~ halogén-alkil-csoport, ~~(1-6 szénatomos (alkoxi))-(1-6 szénatomos (alkil)-~~ csoport, ~~(1-6 szénatomos (alkil-tio))-(1-6 szénatomos (alkil)-~~ csoport, arilcsoport, aril-~~(1-4 szénatomos~~ alkil-~~csoport~~, heteroarilcsoport vagy heteroaril-~~1-4 szénatomos~~ alkil-~~csoport~~; vagy
- R₆ és R₇ együtt a szénatommal, amelyhez kapcsolódnak 3-, 4-, 5- vagy 6-tagú gyűrűt képez, amely ^{adott esetben} helyettesítetlen vagy ~~1-4 szénatomos~~ alkilcsoporttal ~~egyszeresen~~ vagy ~~többszörösen~~ helyettesített és amely -O-, -S- vagy -N(R₁₀)- heteroatomot tartalmazhat;
- R₈ ~~1-6 szénatomos~~ alkilcsoport, ciano-~~(1-6 szénatomos~~ (alkil)-csoport, nitro-~~1-6 szénatomos~~ (alkil)-csoport, ~~3-6 szénatomos~~ alkenilcsoport, ~~3-6 szénatomos~~ alkinilcsoport, ~~1-6 szénatomos~~ halogén-alkil-csoport, ~~3-6 szénatomos~~ halogén-alkenil-csoport, ~~3-6 szénatomos~~ cikloalkilcsoport, ~~(3-6~~

~~szénatomos cikloalkil~~ ~~(1-6 szénatomos)~~ (alkil-
 csoport, arilcsoport, aril-~~(1-4 szénatomos)~~ (alkil)-
 csoport, heteroarilcsoport, heteroaril-~~(1-4 szén-~~
~~atomos~~ alkil-~~csoport,~~ (1-6 szénatomos) (alkil-
 karbonil)-~~(1-6 szénatomos)~~ alkil-~~csoport,~~ ~~(1-6~~
~~szénatomos~~ alkoxi-~~(1-6 szénatomos)~~ (alkil)-csoport,
~~(1-6 szénatomos)~~ (alkoxi-~~karbonil)~~ ~~(1-6 szénatomos)~~
 (alkil)-csoport, (3-6 szénatomos) (alkenil-oxi-~~karbonil)~~-~~(1-6 szénatomos)~~ (alkil)-csoport, ~~(1-6~~
~~szénatomos)~~ (alkil-tio)-~~(1-6 szénatomos)~~ (alkil)-
 csoport, ~~(1-6 szénatomos)~~(dialkil-amino)-~~(2-6 szén-~~
~~atomos)~~ (alkil)-csoport, oxetanilcsoport vagy ~~(1-6~~
~~szénatomos)~~(izoalkilidén-amino-oxi)-~~(1-4 szénatomos)~~
 (alkil)-csoport;

R₉ ~~(1-4 szénatomos)~~ alkilcsoport, ~~3 vagy 4 szénatomos~~
 alkenilcsoport vagy ~~3 vagy 4 szénatomos~~ alkinil-
 csoport; és

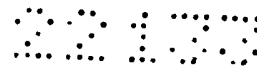
R₁₀ hidrogénatom vagy ~~(1-4 szénatomos)~~ alkilcsoport;
 vagy, amikor R₁ jelentése hidrogénatom, az (I) általános
 képletű vegyületek agrokémiaailag elfogadható sóira
 vonatkozik.

A találmány szerinti vegyületek gyomirtó készítmények
 hatóanyagaiként használhatók.

PK.

177/95

A
**KÖZZÉTETELI
PÉLDÁNY**



59.980/PA

S.B.G. & K.
Nemzetközi
Szabadalmi Iroda
H-1062 Budapest, Andrásy út 113.
Telefon: 34-24-950, Fax: 34-24-323

3-Aril-uracil-származékok és a vegyületek herbicidként való alkalmazása

CIBA-GEIGY AG, BÁZEL, SVÁJC

Feltalálók: WENGER, Jean, WALLBACH, SVÁJC

A bejelentés napja: 1994. 04. 11.

Elsőbbsége: 1993. 04. 21. (1207/93-O),

SVÁJC

A nemzetközi bejelentés száma: PCT/EP94/01109

A nemzetközi közzététel száma: WO 94/24128

A találmány új, herbicid szerként hatásos 3-aril-uracil-származékokra, az előállításukra alkalmas eljárásokra, a vegyületeket tartalmazó készítményekre és azok gyomok

- különösen haszonnövények termesztési területein történő -
írtására vagy növénynövekedés gátlására való alkalmazására
vonatkozik.

Herbicide hatású 3-aril-uracilok ismertek és például a
WO 91/00278 számú nemzetközi szabadalmi közzétételi iratban
és az EP-A-0 195 346 számú szabadalmi iratban kerültek
publikálásra.

Olyan új 3-aril-uracil-származékokat találtunk, amelyek
herbicide és növekedésgátló tulajdonsággal rendelkeznek.

A találmány ennek megfelelően (I) általános képletű
vegyületekre, a képletben

- W (a) vagy (b) általános képletű csoport, amely a
gyűrű nitrogénatomjához szénatomon keresztül
kapcsolódik;
- R₁ hidrogénatom, 1-4 szénatomos alkilcsoport, 1-4
szénatomos halogén-alkil-csoport, 3 vagy 4 szén-
atomos alkenilcsoport vagy 3 vagy 4 szénatomos
alkinilcsoport;
- R₂ halogénatom vagy cianocsoport;
- R₃ hidrogénatom vagy fluoratom;
- R₄ hidrogénatom, halogénatom vagy 1-4 szénatomos
alkilcsoport;
- R₅ 1-4 szénatomos alkilcsoport vagy 1-4 szénatomos
halogén-alkil-csoport;
- R₆ és R₇ egymástól függetlenül hidrogénatom, 1-8 szénatomos
alkilcsoport, 3-6 szénatomos alkenilcsoport, 3-6
szénatomos alkinilcsoport, 3-8 szénatomos ciklo-
alkilcsoport, 1-6 szénatomos halogén-alkil-csoport,

(1-6 szénatomos alkoxi)-(1-6 szénatomos alkil)-csoport, (1-6 szénatomos alkil-tio)-(1-6 szénatomos alkil)-csoport, arilcsoport, aril-(1-4 szénatomos alkil)-csoport, heteroarilcsoport vagy heteroaril-(1-4 szénatomos alkil)-csoport; vagy

R₆ és R₇ együtt a szénatommal, amelyhez kapcsolódnak 3-, 4-, 5- vagy 6-tagú gyűrűt képez, amely helyettesítetlen vagy 1-4 szénatomos alkilcsoporttal egyszeresen vagy többszörösen helyettesített és amely -O-, -S- vagy -N(R₁₀)- heteroatomot tartalmazhat;

R₈ 1-6 szénatomos alkilcsoport, ciano-(1-6 szénatomos alkil)-csoport, nitro-(1-6 szénatomos alkil)-csoport, 3-6 szénatomos alkenilcsoport, 3-6 szénatomos alkinilcsoport, 1-6 szénatomos halogén-alkil-csoport, 3-6 szénatomos halogén-alkenil-csoport, 3-6 szénatomos cikloalkilcsoport, (3-6 szénatomos cikloalkil)-(1-6 szénatomos alkil)-csoport, arilcsoport, aril-(1-4 szénatomos alkil)-csoport, heteroarilcsoport, heteroaril-(1-4 szénatomos alkil)-csoport, (1-6 szénatomos alkil)-karbonil-(1-6 szénatomos alkil)-csoport, (1-6 szénatomos alkoxi)-(1-6 szénatomos alkil)-csoport, (1-6 szénatomos alkoxi)-karbonil-(1-6 szénatomos alkil)-csoport, (3-6 szénatomos alkenil-oxi)-karbonil-(1-6 szénatomos alkil)-csoport, (1-6 szénatomos alkil-tio)-(1-6 szénatomos alkil)-csoport, (1-6 szénatomos dialkil-amino)-(2-6 szénatomos alkil)-csoport, oxetanilcsoport vagy (1-6

szénatomos izoalkilidén-amino-oxi)-(1-4 szénatomos alkil)-csoport;

R₉ 1-4 szénatomos alkilcsoport, 3 vagy 4 szénatomos alkenilcsoport vagy 3 vagy 4 szénatomos alkinilcsoport; és

R₁₀ hidrogénatom vagy 1-4 szénatomos alkilcsoport;

és, amikor R₁ jelentése hidrogénatom, az (I) általános képletű vegyületek agrokémiaailag elfogadható sóira vonatkozik.

A találmány szerinti 3-aril-uracil vegyületek (I) általános képletében a halogénatom az R₂ és R₄ helyettesítők jelentésében fluoratom, klóratom, brómatom vagy jódatom, előnyösen fluoratom, klóratom és brómatom.

Az R₁ és R₄-R₁₀ helyettesítőkben az alkil-, alkenil- és alkinilcsoportok egyenes- vagy elágazóláncúak lehetnek, és ez vonatkozik a halogén-alkil-, cikloalkil-alkil-, alkoxi-alkil-, (alkoxi-karbonil)-alkil-, (alkenil-oxi-karbonil)-alkil-, aril-alkil-, heteroaril-alkil-, alkil-tio-alkil-, (dialkil-amino)-alkil-, nitro- és ciano-alkil-csoportok alkilrészére is. Az ilyen alkilcsoportokra példaként a metil-, etil-, n-propil-, izopropil-, n-butyl-, izobutyl-, szek-butyl- és terc-butyl-csoportokat, előnyösen az 1, 2 vagy 3 szénatomos csoportokat említjük; az alkenilcsoportok közül az allil-, 1-metil-allil-, metallil- vagy but-2-én-1-il-csoportokat, előnyösen a 3 vagy 4 szénatomos alkenilcsoportokat; és az alkinilcsoportok közül a propargil-, but-2-in-1-il-, 2-metil-butin-2-il-, but-3-in-2-il- és a pent-4-in-1-il-csoportokat, előnyösen a 3 vagy 4 szénatomos alkinilcsoportokat emeljük ki.

Az R_6 , R_7 és R_8 helyettesítők jelentésében a cikloalkilcsoport például ciklopropil-, ciklobutil-, ciklopentil-, ciklohexil-, cikloheptil- vagy ciklooktilcsoport lehet.

A halogén-alkil-csoportok egyszeresen vagy többszörösen, különösen egy-háromszorosan azonos vagy eltérő halogénatommal helyettesített alkilcsoportok, ahol a halogénatom jódatom és különösen fluoratom, klóratom és brómatom, ilyen csoport például a trifluor-metil-, 2,2,2-trifluor-etil- vagy a 2-klór- vagy 2-bróm-etil-csoport.

Az R_6 , R_7 és R_8 helyettesítőkben az alkoxi-alkilcsoport például metoxi-metil-, metoxi-etil-, etoxi-metil-, etoxi-etil-, metoxi-propil- vagy etoxi-propil-csoport.

Az R_6 , R_7 és R_8 jelentésében az arilcsoport α - vagy β -naftil-, különösen fenilcsoport; az aromás gyűrűk egy vagy több azonos vagy különböző csoporttal, például halogénatommal, különösen fluoratommal vagy klóratommal, 1-3 szénatomos alkilcsoporttal, különösen metilcsoporttal, 1-3 szénatomos alkoxics csoporttal, különösen metoxics csoporttal, trifluor-metil-csoporttal, nitro- és/vagy cianocsoporttal helyettesítettek lehetnek.

Az R_6 , R_7 és R_8 csoportokban a heteroarilcsoport különösen öt- vagy hattagú aromás heterogyűrű, például 2-, 3- vagy 4-piridil-, pirimidil-, pirazinil-, furanil-, tienil-, oxazolil- vagy izoxazolilcsoport, előnyösen 2- vagy 3-piridil-, 2- vagy 3-furanil- és 2-tienil-csoport.

Az alkil-tio-alkil-csoportok az R_6 , R_7 és R_8 helyettesítőkben például metil-tio-etil-, etil-tio-etil- vagy metil-tio-propil-csoportot jelentenek.

A dialkil-amino-alkil-csoport például N,N-dimetil-amino-etil- vagy N,N-dietyl-amino-etyl-, előnyösen N,N-dimetil-amino-etyl-csoport.

R₈ jelentésében a halogén-alkenil-csoportok olyan alkenilcsoportok, amelyek halogénatommal egyszeresen vagy többszörösen helyettesítettek, a halogénatom brómatom, jódatom és különösen fluoratom és klóratom, ilyen csoport például a 3-fluor-propenil-, 3-klór-propenil-, 3-bróm-propenil-, 2,3,3-trifluor-propenil-, 2,3,3-triklór-propenil- és a 4,4,4-trifluor-but-2-én-1-il-csoport. A halogénatommal egyszeresen, kétszeresen vagy háromszorosan helyettesített 3-6 szénatomos alkenilcsoportok közül a 3 vagy 4 szénatomos csoportok az előnyösek.

Az R₆ és R₇ helyettesítők által alkotott 3-6-tagú heterogyűrűs csoportok a pirrolidino-, piperidino-, N-metil-piperidino-, oxetano-, tietano-, tetrahidrofurano- vagy tetrahidropiranocsoportok, előnyösek az oxetano-, tietano-, tetrahidrofurano- és a tetrahidropiranocsoportok.

Az (I) általános képletű vegyületek sói különösen alkálifémsók, például nátrium- és káliumsók; alkáliföldfém-sók, például kalcium- és magnéziumsók; ammóniumsók, azaz helyettesítetlen ammóniumsók és egyszeresen vagy többszörösen helyettesített ammóniumsók, valamint más szerves nitrogénbázisokkal képezett sók.

Ennek megfelelően alkalmas sóképző szerek az alkáli- és alkáliföldfém-hidroxidok, különösen a lítium-, nátrium-, kálium-, magnézium- vagy kalcium-hidroxidok, ezen belül a nátrium- és a kálium-hidroxidok különös jelentőséggel

bírnak.

Az ammóniumsó képzésére alkalmas aminok többek között az ammónia és a primer, szekunder és terciér 1-18 szénatomos alkil-aminok, az 1-4 szénatomos hidroxil-alkil-aminok és a 2-4 szénatomos alkoxi-alkil-aminok, például a metil-amin, etil-amin, n-propil-amin, izopropil-amin, a négy butil-amin izomer, n-amil-amin, izoamil-amin, hexil-amin, heptil-amin, oktil-amin, nonil-amin, decil-amin, pentadecil-amin, hexadecil-amin, heptadecil-amin, oktadecil-amin, metil-etil-amin, metil-izopropil-amin, metil-hexil-amin, metil-nonil-amin, metil-pentadecil-amin, metil-oktadecil-amin, etil-butil-amin, etil-heptil-amin, etil-oktil-amin, hexil-heptil-amin, hexil-oktil-amin, dimetil-amin, dietil-amin, di(n-propil)-amin, diizopropil-amin, di(n-butil)-amin, di(n-amil)-amin, diizoamil-amin, dihexil-amin, diheptil-amin, dioktil-amin, etanolamin, n-propanol-amin, izopropanol-amin, N,N-dietanol-amin, N-etil-propanol-amin, N-butil-etanol-amin, allil-amin, n-butenil-2-amin, n-pentenil-2-amin, 2,3-dimetil-butenil-2-amin, dibutenil-2-amin, n-hexenil-2-amin, propilén-diamin, trimetil-amin, trietil-amin, tri(n-propil)-amin, triizopropil-amin, tri(n-butil)-amin, triizobutil-amin, tri(szek-butil)-amin, tri(n-amil)-amin, metoxi-etil-amin és etoxi-etil-amin; heterogyűrűs aminok, például a piridin, kinolin, izokinolin, morfolin, N-metil-morfolin, tiomorfolin, piperidin, pirrolidin, indolin, kinuklidin és az azepin; primer aril-aminok, például anilinek, metoxi-anilinek, etoxi-anilinek, o-, m-, p-toluidinek, fenilén-diaminok, benzidinek, naftil-

aminok és o-, m-, p-klór-anilinek; de különösen a trietil-amin, izopropil-amin és a diizopropil-amin.

Amennyiben az (I) általános képletű vegyületekben legalább egy aszimmetriás szénatom van a telített heterogyűrű karbonilcsoportjához viszonyított α -helyzetben, amikor R_6 és R_7 jelentése eltérő és/vagy az ortoésztercsoportot hordozó benzil-szénatomon, a vegyületek optikailag aktív egyedi izomerek vagy racém elegyek formájában lehetnek. A jelen találmány szerinti (I) általános képletű vegyületek magukba foglalják mind a tiszta optikai antipódokat, mind a racemátokat vagy diasztereoizomereket. Ha egy alifás C=C kettős kötés van jelen, geometriai izoméria léphet fel.

Azokban az (I) általános képletű vegyületekben, amelyekben R_1 hidrogénatom, az $-NH-C(=O)-$ \rightleftharpoons $-N=C(OH)-$ keto-enol tautoméria lehetősége nincs kizárva.

Az (I) általános képlet minden lehetséges izomert és izomerelegyet magába foglal.

Előnyösek azok az (I) általános képletű 3-aryl-uracil-származékok, amelyekben R_2 klóratom, brómatom vagy cianocsoport.

Előnyösek továbbá azok az (I) általános képletű vegyületek is, amelyekben R_4 hidrogénatom, fluoratom, klóratom, brómatom vagy metilcsoport. Azok a vegyületek, amelyekben R_4 hidrogénatom, fluoratom vagy metilcsoport különösen előnyösek.

Az R_5 helyén metil-, trifluor-metil- vagy pentafluor-etil-csoportot tartalmazó (I) általános képletű 3-aryl-uracil-származékokat szintén előnyben részesítjük.

Hasonlóképpen előnyösek azok az (I) általános képletű vegyületek, amelyekben R_6 és R_7 egymástól függetlenül 1-8 szénatomos alkilcsoport, 3-6 szénatomos alkenilcsoport, 3-6 szénatomos alkinilcsoport, 1-6 szénatomos halogén-alkil-csoport, fenilcsoport, furilcsoport, tienilcsoport vagy piridilcsoport; vagy R_6 és R_7 együtt a szénatommal, amelyhez kapcsolódnak, 3-, 4-, 5- vagy 6-tagú helyettesítetlen gyűrűt alkot, amely -O-, -S- vagy -N(R_{10})-heteroatomot tartalmazhat.

Az (I) általános képletű vegyületek közül különösen előnyösek azok, amelyekben R_6 és R_7 egymástól függetlenül 1-6 szénatomos alkilcsoport, 3 vagy 4 szénatomos alkenilcsoport, 3 vagy 4 szénatomos alkinilcsoport, 1-6 szénatomos halogén-alkil-csoport vagy fenilcsoport; vagy R_6 és R_7 együtt a szénatommal, amelyhez kapcsolódnak, 3-, 4-, 5- vagy 6-tagú helyettesítetlen gyűrűt alkot, amely -O- vagy -S- heteroatomot tartalmazhat. Ezek közül rendkívül előnyösek azok a vegyületek, amelyekben R_6 és R_7 egymástól függetlenül 1-6 szénatomos alkilcsoport vagy 1-6 szénatomos halogén-alkil-csoport; vagy R_6 és R_7 együtt a szénatommal, amelyhez kapcsolódnak, 3-, 4-, 5- vagy 6-tagú helyettesítetlen gyűrűt alkot.

Fontosak azok az (I) általános képletű vegyületek is, amelyekben R_8 1-6 szénatomos alkilcsoport, 3-6 szénatomos alkenilcsoport, 3-6 szénatomos alkinilcsoport, 1-6 szénatomos halogén-alkil-csoport vagy (1-6 szénatomos alkoxi)-(1-6 szénatomos alkil)-csoport. Különös figyelmet érdemelnek azok az (I) általános képletű vegyületek,

amelyekben R_8 1 vagy 2 szénatomos alkilcsoport, 3 vagy 4 szénatomos alkenilcsoport, 3 vagy 4 szénatomos alkinilcsoport, 1 vagy 2 szénatomos halogén-alkil-csoport vagy (1-2 szénatomos alkoxi)-(1-2 szénatomos alkil)-csoport.

Különösen fontosak azok az (I) általános képletű 3-uracil-származékok, amelyekben a W helyettesítő jelentése az (I) általános képletre megadott; R_2 klóratom, brómatom vagy cianocsoport; R_3 hidrogénatom vagy fluoratom; R_4 hidrogénatom, fluoratom, klóratom, brómatom vagy metilcsoport; R_5 metilcsoport, trifluor-metil-csoport vagy pentafluor-etil-csoport; R_6 és R_7 egymástól függetlenül 1-8 szénatomos alkilcsoport, 3 vagy 4 szénatomos alkenilcsoport, 3 vagy 4 szénatomos alkinilcsoport, 1-3 szénatomos halogén-alkil-csoport, fenilcsoport, furilcsoport, tienilcsoport vagy piridilcsoport; vagy R_6 és R_7 együtt a szénatommal, amelyhez kapcsolódnak 3-, 4-, 5- vagy 6-tagú helyettesítetlen gyűrűt alkot, amely további heteroatomként -O- vagy -S-atomot tartalmazhat; és R_8 1-4 szénatomos alkilcsoport, 3 vagy 4 szénatomos alkenilcsoport, 3 vagy 4 szénatomos alkinilcsoport, 1-3 szénatomos halogén-alkil-csoport, (1-3 szénatomos alkoxi)-(1-3 szénatomos alkil)-csoport, (1-2 szénatomos alkil-tio)-(2 szénatomos alkil)-csoport, (1 vagy 2 szénatomos dialkil-amino)-(2 szénatomos alkil)-csoport, fenil-(1-3 szénatomos alkil)-csoport, 2- vagy 3-piridil)-(1-2 szénatomos alkil)-csoport, (2- vagy 3-furil)-(1-2 szénatomos alkil)-csoport vagy (2-tienil)-(1 szénatomos alkil)-csoport.

Különösen megfelelőek azok az (I) általános képletű 3-

aril-uracil-származékok, amelyekben W jelentése (a) általános képletű csoport; R_1 hidrogénatom, 1-4 szénatomos alkilcsoport, 1-4 szénatomos halogén-alkil-csoport, 3 vagy 4 szénatomos alkenilcsoport vagy 3 vagy 4 szénatomos alkinil-csoport; R_5 trifluor-metil-csoport; és R_6 és R_7 egymástól függetlenül 1-6 szénatomos alkilcsoport vagy 1-3 szénatomos halogén-alkil-csoport; vagy R_6 és R_7 együtt a szénatommal, amelyhez kapcsolódnak 4-, 5- vagy 6-tagú helyettesítetlen gyűrűt alkot.

Szintén különösen megfelelőek azok az (I) általános képletű 3-aril-uracil-származékok, amelyekben W jelentése (b) általános képletű csoport; R_9 1-4 szénatomos alkilcsoport, 3 vagy 4 szénatomos alkenilcsoport vagy 3 vagy 4 szénatomos alkinilcsoport; R_6 és R_7 egymástól függetlenül 1-6 szénatomos alkilcsoport vagy 1-3 szénatomos halogén-alkil-csoport; vagy R_6 és R_7 együtt a szénatommal, amelyhez kapcsolódnak, 4-, 5- vagy 6-tagú helyettesítetlen gyűrűt alkot.

Különös fontossággal bírnak az (Ia) általános képletű 3-aril-uracil-származékok, a képletben

R_6 metil- vagy etilcsoport;

R_7 1-8 szénatomos alkilcsoport, allilcsoport, propargilcsoport, trifluor-metil-csoport, fenilcsoport, 2-furil-csoport, 2-tienil-csoport vagy 2- vagy 3-piridil-csoport; vagy

R_6 és R_7 együtt a szénatommal, amelyhez kapcsolódnak 3-, 4-, 5- vagy 6-tagú helyettesítetlen aliciklusos gyűrűt, oxetán-, tetrahydrofuran-, tetrahidropirán- vagy

tietányűrút alkot;

R₈ 1-4 szénatomos alkilcsoport, 3-4 szénatomos alkenilcsoport, 3-4 szénatomos alkinilcsoport, (1 szénatomos alkoxi)-(2 szénatomos alkil)-csoport, (1 szénatomos alkil-tio)-(2 szénatomos alkil)-csoport, dimetil-amino-(2 szénatomos alkil)-csoport, 2-bróm- vagy 2-klór-(2 szénatomos alkil)-csoport, 2,2,2-trifluor-(2 szénatomos alkil)-csoport, fenilcsoport, fenil-(1-2 szénatomos alkil)-csoport, (2- vagy 3-piridil)-(1 szénatomos alkil)-csoport, (2- vagy 3-furil)-(1 szénatomos alkil)-csoport, (2-tienil)-(1 szénatomos alkil)-csoport, 3-oxetanilcsoport vagy $-\text{CH}_2\text{CH}_2-\text{O}-\text{N}=\text{C}(\text{CH}_3)_2$ csoport.

Ezen vegyületek közül különösen fontosak azok, amelyekben R₆ és R₇ egymástól függetlenül metil- vagy etilcsoport; és R₈ 1-3 szénatomos alkilcsoport, allilcsoport, propargilcsoport vagy fenilcsoport.

Nagyon fontosak az (Ib) általános képletű vegyületek, amelyekben R₂ klóratom, brómatom vagy cianocsoport; R₃ hidrogénatom vagy fluoratom; R₄ hidrogénatom, fluoratom, klóratom, brómatom vagy metilcsoport; R₆ metilcsoport vagy etilcsoport; és R₇ és R₈ egymástól függetlenül 1-3 szénatomos alkilcsoport.

Különös fontossággal bírnak az (Ic) általános képletű vegyületek, amelyekben R₆ és R₇ egymástól függetlenül metil- vagy etilcsoport; és R₈ 1-3 szénatomos alkilcsoport, allilcsoport vagy fenilcsoport.

Rendkívül fontosak azok az (Id) általános képletű

vegyületek, amelyekben R_6 metil- vagy etilcsoport; és R_7 , R_8 és R_9 egymástól függetlenül 1-3 szénatomos alkilcsoport.

Nagyon fontosak az (Ie) általános képletű vegyületek is, amelyekben R_1 metilcsoport vagy difluor-metil-csoport; R_3 hidrogénatom vagy fluoratom; R_6 és R_7 egymástól függetlenül metil- vagy etilcsoport; és R_8 3 szénatomos alkilcsoport.

Az (I) általános képletű vegyületeket a találmány szerint ismert eljárásokhoz hasonló módon állítjuk elő:

(I) általános képletű 3-aril-uracil-származékok előállítására egy (II) általános képletű vegyületet, a képletben W és R_2 - R_5 jelentése az (I) általános képletre megadott és Z_1 kilépőcsoport, például halogénatom, előnyösen fluoratom vagy klóratom vagy imidazolid-, triazolid- vagy N-hidroxi-ftálimid, egy (III) általános képletű vegyülettel reagáltatunk, a képletben R_6 és R_7 jelentése az (I) általános képletre megadott és R_{11} hidrogénatom vagy védőcsoport, például allil-, benzil- vagy p-metoxi-benzil-csoport, így (IV) általános képletű vegyületet kapunk, és ha R_{11} védőcsoport, akkor ezt a védőcsoportot eltávolítjuk, és a kapott (V) általános képletű karbonsavat egy (VIII) általános képletű vegyülettel reagáltatjuk, a képletben Z_2 kilépőcsoport, különösen halogénatom és $Q-S(O)Cl$, $-C(O)Cl$, $-PCl_4$, $-C(O)Cl-C(O)-$ csoport, (c) vagy (d) képletű csoport, így (VI) általános képletű vegyületet kapunk, amelyben W , Z_2 és R_2 - R_7 jelentése a fenti, és végül ezt a vegyületet a szokásos körülmények között egy (VII) általános képletű alkohollal visszük reakcióba, a képletben R_8 jelentése az

(I) általános képletre megadott, így (I) általános képletű vegyületet kapunk.

Az (I) általános képletű vegyületek előállítására az 1. reakcióvázlaton látható módon történik.

A (II) általános képletű kiindulási vegyületet például a WO 91/00278 számon közzétett nemzetközi szabadalmi bejelentésben leírtak szerint állítjuk elő.

A (II) általános képletű 3-aril-uacil-származékot, amelyben Z_1 jelentése a fenti, egy (III) általános képletű alkohollal előnyösen az alábbi irodalmi helyeken ismertett módszerekhez hasonlóan észterezzük: S. Patai, "The Chemistry of Carboxylic Acids and Esters", Interscience Publishers, London, 1969; Houben-Weyl, VIII. kötet, 508. oldal; Synthesis 1981, 333; J. Med. Chem. 17, 337 (1974); Synth. Communic. 1984, 353; és Chemistry Lett. 1985, 123.

Az R_{11} helyettesítőt a (IV) általános képletű vegyületből, amikor R_{11} védőcsoportot jelent, például hidrogenolízissel vagy savas hidrolízissel távolítjuk el, ahogy azt a "Protective Groups in Organic Synthesis" (Ed. T. Green, A. Wiley-Interscience Publication, 1991) című összefoglaló munkában leírják.

Az 1. reakcióvázlaton szereplő (V) általános képletű karbonsavat úgy is megkaphatjuk, hogy egy (II) általános képletű vegyületet egy (IIIa) általános képletű α -hidroxikarbonsavval közvetlenül észterezzünk, a képletben R_6 és R_7 jelentése az (I) általános képletre megadott.

Olyan (VI) általános képletű aktívált karbonsavszármazékok előállítására, amelyekben Z_2 kilépőcsoport,

például halogénatom, előnyösen fluoratom vagy brómatom, és különösen klóratom, hogy például előnyösen halogénezőszert, így tionil-halogenideket, például tionil-kloridot vagy -bromidot; foszforsav-halogenideket vagy foszfor-oxi-halogenideket, például foszfor-pentakloridot vagy foszfor-oxi-kloridot, foszfor-pentabromidot vagy foszforil-bromidot; oxalil-halogenideket, például oxalil-kloridot vagy foszfént használunk. A reakciót, amennyiben alkalmas, közömbös szerves oldószerben, például n-hexánban, benzolban, toluolban, xilolokban, metilén-dikloridban, kloroformban, 1,2-diklór-etánban vagy klór-benzolban -20°C és a reakcióelegy forráspontja közötti, előnyösen 40 és 110°C közötti hőmérsékleten katalitikus mennyiségű N,N-dimetil-formamid jelenlétében végezzük. Az ilyen reakciók ismertek és a Z_2 kilépőcsoportra tekintettel számos variációt írnak le az irodalomban.

A (VI) általános képletű vegyületnek a kívánt (I) általános képletű vegyületté való ciklizálását előnyösen (VII) általános képletű alkohol jelenlétében, közömbös aprotikus szerves oldószerben, például kloroformban, metilén-dikloridban, 1,2-diklór-etánban, ciklohexánban, toluolban, dietil-éterben, terc-butil-metil-éterben, etil-acetátban, acetonitrilben, N,N-dimetil-formamidban vagy dimetil-szulfoxidban -50°C és az adott reakcióelegy forráspontja közötti, előnyösen 0 és 20°C közötti hőmérsékleten valósítjuk meg például a Chem. Ber. 108, 3224-3242 (1975) irodalmi helyen leírt módon.

Az irodalomban megadott adatoktól eltérően a (VI)

általános képletű vegyületnek a kívánt (I) általános képletű vegyületté történő ciklizálását bázis, így nátrium-hidrogén-karbonát, kálium-hidrogén-karbonát, nátrium-karbonát, kálium-karbonát, kalcium-karbonát vagy lítium-karbonát jelenlétében, vagy egy savmegkötő, például epoxi-alkil, így epoxi-bután, epoxi-ciklohexán vagy etilén-oxid jelenlétében, vagy egy alumínium-szilikát jelenlétében is végezhetjük a fentebb leírt körülmények között.

Az (I) általános képletű végterméket a szokásos módon betöményítéssel és/vagy az oldószer lepárlásával különíthetjük el, és átkristályosítással vagy a szilárd maradék olyan oldószerekkel való eldolgozásával, amelyekben nem nagyon oldódnak, ilyenek az éterek, alkánok, aromás szénhidrogének vagy klórozott szénhidrogének, vagy kromatográfiásan, szilikagél oszlopon tisztíthatjuk.

Az (V) általános képletű közbenső termék új vegyület. Kifejezetten a találmány szerinti (I) általános képletű vegyületek előállítása céljára szintetizáltuk és a jelen találmány ezekre a vegyületekre is kiterjed.

Az (I) általános képletű vegyületek vagy a vegyületeket tartalmazó készítmények találmány szerinti alkalmazására a mezőgazdaságban szokásos minden alkalmazási módszer szóbajön, így például a kikelés előtti, a kikelés utáni alkalmazás és a magcsávázás, és különféle módszerek és technikák, például a hatóanyag szabályzott felszabadítása. Erre a célra a hatóanyag oldatát szemcsés ásványi hordozókra vagy polimerizált granulátumra (karbamid/formaldehid) visszük fel és megszáritjuk. Szükséges esetben bevonóanyagot

is alkalmazhatunk (bevont granulátum), amely lehetővé teszi, hogy a hatóanyag meghatározott mennyiségei adott idő alatt kerüljenek leadásra.

Az (I) általános képletű vegyületeket felhasználhatjuk módosítatlan formában, azaz ahogy a szintézissel előállítjuk, de előnyösen a szokásos módon, a formálási technológiában általánosan alkalmazott adjuvánsokkal például emulgeálható koncentrátumokká, közvetlenül permetezhető vagy hígítható oldatokká, híg emulziókká, nedvesíthető porokká, oldható porokká, porozószerekké, granulátummá vagy mikrokapszulákká formáljuk. Amint a készítmény természetét, az alkalmazási módszereket, így a permetezést, porlasztást, porozást, nedvesítést, szórást vagy öntést is a célnak és az uralkodó körülményeknek megfelelően választjuk meg.

A formált alakokat, azaz az (I) általános képletű vegyületet (hatóanyagot) és ahol alkalmas egy vagy több szilárd vagy folyékony adjuvánst tartalmazó készítményeket, preparátumokat vagy keverékeket ismert módon, például homogén keveréssel és/vagy a hatóanyagok és az adjuvánsok, például oldószerek vagy szilárd hordozók együtt való őrlésével állítjuk elő. Felületaktív vegyületeket is alkalmazhatunk a formált alakok előállításánál.

Megfelelő oldószerek az aromás szénhidrogének, előnyösen a 8-12 szénatomot tartalmazó frakciók, így alkilbenzolok elegyei, például xilolelegyek vagy alkilezett naftalinok; alifás és cikloalifás szénhidrogének, így paraffinok, ciklohexán vagy tetrahidronaftalin; alkoholok, így az etanol, propanol vagy butanol; glikolok és étereik és

észterek, így a propilénglikol vagy dipropilénglikol-éter; ketonok, így a ciklohexanon, izoforon vagy diaceton-alkohol; erősen poláros oldószerek, így az N-metil-2-pirrolidon, dimetil-szulfoxid vagy víz; növényi olajok és észterek, így repceolaj, ricinusolaj vagy szójaolaj; és, ahol alkalmas, a szilikon-olajok is.

A szilárd hordozók például a porózók és diszpergálható porok esetében általában a természetes ásványi töltőanyagok, így a kalcit, talkum, kaolin, montmorillonit vagy attapulgit. A fizikai tulajdonságok javítása céljából nagy diszperzitású kovasavat vagy nagy diszperzitású abszorbens polimereket is alkalmazhatunk. A megfelelő granulált adszorpciós hordozók porózus típusúak, ilyen például a horzsakő, téglapor, szepiolit vagy bentonit, és megfelelő nemszorbens hordozó, például a kalcit és a homok. Emellett számos szervetlen vagy szerves eredetű előre granulált anyagot, például dolomitot vagy porított növényi maradékot is használhatunk.

A formálódó (I) általános képletű vegyület természetétől függően alkalmas felületaktív vegyületek a nemionos, kationos és/vagy anionos felületaktív anyagok, amelyek jó emulgeáló, diszpergáló és nedvesítő tulajdonsággal rendelkeznek. A "felületaktív anyagok" kifejezés a felületaktív anyagok keverékét is magában foglalja.

Mind az úgynevezett vízoldható szappanok mind a vízoldható szintetikus felületaktív vegyületek alkalmas anionos felületaktív anyagok.

Alkalmas szappanok a több (10-22) szénatomos zsírsavak

alkálifémsói, alkáliföldfém-sói vagy helyettesítetlen vagy helyettesített ammóniumsói, például az olajsav vagy sztearinsav vagy például a kókuszolajból vagy tallolajból kapható természetes zsírsavak keverékeinek nátrium- vagy káliumsói. Megemlíthetjük még a zsírsavak metil-aurin-sóit is.

Gyakrabban azonban az úgynevezett szintetikus felület-aktív anyagokat, különösen a zsíralkohol-szulfonátokat, zsíralkohol-szulfátokat, szulfonált benzimidazolszármazékokat vagy alkil-aril-szulfonátokat alkalmazzuk.

A zsíralkohol-szulfonátok vagy -szulfátok általában alkálifémsók, alkáliföldfémsók vagy helyettesítetlen vagy helyettesített ammóniumsók formájában vannak és egy 8-22 szénatomos alkilcsoportot tartalmaznak, amely magában foglalja az acilcsoport alkilrészét, ilyen például a lignoszulfonsav, a dodecil-szulfát vagy a természetes zsírsavakból kapható zsíralkoholszulfátok keverékeinek nátrium- vagy kalciumsója. Ezek a vegyületek szulfatált és szulfonált zsíralkohol/etilén-oxid adduktumok sóit is tartalmazzák. A szulfonált benzimidazol-származékok előnyösen két szulfonsavcsoportot és egy 8-22 szénatomos zsírsavcsoportot tartalmaznak. Az ilyen alkil-arilszulfonátokra példaként a dodecil-benzolszulfonsav, dibutil-naftalinszulfonsav vagy a naftalinszulfonsav és formaldehid kondenzátumának a nátrium-, kálium- vagy trietanol-amin-sóját említhetjük.

A megfelelő foszfátok, így egy p-nonil-fenol és 4-14 mol etilén-oxid adduktuma foszforsavészterének sói vagy

foszfolipidek is alkalmasak a találmány szerinti felhasználásra.

Nemionos felületaktív anyagok előnyösen az alifás vagy cikloalifás alkoholok, telített vagy telítetlen zsírsavak és alkil-fenolok poliglikoléterszármazékai, ezek a származékok 3-30 glikolétercsoportot, az alifás szénhidrogénrészben 8-20 szénatomot és az alkil-fenolok alkilrészében 6-18 szénatomot tartalmaznak.

További alkalmas nemionos felületaktív anyagok a polietilén-oxid és polipropilénglikol, etilén-diamino-polipropilénglikol és alkil-polipropilénglikol vízzoldható adduktumai, amelyek az alkilláncban 1-10 szénatomot tartalmaznak; ezek az adduktumok 20-250 etilénglikol-éter csoportot és 10-100 propilénglikol-éter csoportot foglalnak magukban. Ezek a vegyületek általában propilénglikol egységenként 1-5 etilénglikol egységet tartalmaznak.

Nemionos felületaktív anyagokra példaként a nonil-fenol-polietoxi-etanolokat, a ricinusolaj-poliglikol-étereket, a polipropilén/polietilén-oxid adduktumokat, tributil-fenoxi-polietoxi-etanolot, a polietilén-glikolt és az oktil-fenoxi-polietoxi-etanolot említjük.

A polioxi-etilén-szorbitán zsírsavészterei, például a polioxi-etilén-szorbitán-trioleát szintén megfelelő nemionos felületaktív anyag.

A kationos felületaktív anyagok előnyösen kvaterner ammóniumsók, amelyek a nitrogénatomon helyettesítőként legalább egy 8-22 szénatomos alkilcsoportot és további helyettesítőként helyettesítetlen vagy halogénezett kevés

szénatomos alkilcsoportot, benzilcsoportot vagy hidroxil- (kevés szénatomos)alkil-csoportot tartalmaznak. A sók előnyösen halogenidek, metil-szulfátok vagy etil-szulfátok formájában vannak, ilyen például a sztearil-trimetil-ammónium-klorid vagy a benzil-di(2-klór-etil)-etil-ammónium-bromid.

A formálási technológiában általánosan alkalmazott és a találmány szerinti készítményekben is használható felületaktív anyagokat többek között az alábbi irodalmi helyeken ismertetik:

- "Mc Cutcheon's Detergents and Emulsifiers Annual", Mc Publishing Corp., Glen Rock, New Jersey, 1988.
- M. and J. Ash, "Encyclopedia of Surfactants", Vol. I-III, Chemical Publishing Co., New York, 1980-1981.
- Dr. Helmut Stache "Tensid-Taschenbuch" (Surfactant Handbook), Carl Hanser Verlag, Munich/Vienna 1981.

A herbicid készítmények általában 0,1-99%, előnyösen 0,1-95% (I) általános képletű vegyületet, 1-99% szilárd vagy folyékony formálási adjuvánst és 0-25%, előnyösen 0,1-25% felületaktív anyagot tartalmaznak.

Míg a kereskedelmi termékek előnyösen koncentrátumok formájában készülnek, addig a felhasználók általában híg készítményeket alkalmaznak.

A készítmények további segédanyagokat, így stabilizátorokat, például növényi olajokat vagy epoxidált növényi olajokat (epoxidált kókuszdióolajat, repceolajat vagy szójaolajat) habzástgátlókat, például szilikonolajat, tartósítószerket, viszkozitás-szabályzókat, kötőanyagokat,

tapadást elősegítő anyagokat, valamint műtrágyákat vagy más hatóanyagokat is tartalmazhatnak speciális célok elérése érdekében.

Előnyös készítmények különösen az alábbi összetételűek (a %-ok tömeg%-ot jelentenek):

Emulgeálható koncentrátumok:

| | |
|---------------------|--------------------------|
| hatóanyag: | 1-90%, előnyösen 5-50% |
| felületaktív anyag: | 5-30%, előnyösen 10-20% |
| oldószer: | 15-94%, előnyösen 70-85% |

Porozószerrek:

| | |
|------------------|------------------------------|
| hatóanyag: | 0,1-50%, előnyösen 0,1-1% |
| szilárd hordozó: | 99,9-90%, előnyösen 99,9-99% |

Szuszpenzió koncentrátumok:

| | |
|---------------------|--------------------------|
| hatóanyag: | 5-75%, előnyösen 10-50% |
| víz: | 94-24%, előnyösen 88-30% |
| felületaktív anyag: | 1-40%, előnyösen 2-30% |

Nedvesíthető porok:

| | |
|--------------------|--------------------------|
| hatóanyag: | 0,5-90%, előnyösen 1-80% |
| felületaktív anyag | 0,5-20%, előnyösen 1-15% |
| szilárd hordozó: | 5-95%, előnyösen 15-90% |

Granulátum:

| | |
|------------------|-----------------------------|
| hatóanyag: | 0,1-30%, előnyösen 0,1-15% |
| szilárd hordozó: | 99,5-70%, előnyösen 97-85%. |

Az (I) általános képletű vegyületek általában sikeresen használhatók 0,001-2 kg/ha, különösen 0,005-1 kg/ha alkalmazási arány mellett. A kívánt hatás eléréséhez szükséges koncentráció kísérletileg meghatározható. Ez a hatás típusától, a termesztett növény fejlődési stádiumától és a gyomtól, valamint az alkalmazástól (hely, idő, módszer) függ, és tág határok között változhat.

Az (I) általános képletű vegyületeknek kiválóak a növekedésgátló és herbicid tulajdonságai, és ezek rendkívül alkalmassá teszik a haszonnövények, különösen gabonafélék esetében, a gyapot-, szója-, repce-, kukorica-, rizstáblákon és -ültetvényeken való alkalmazásra. A vegyületek kiégetőszerekként, például burgonya esetében és defóliánsként is használhatók.

A termesztett növényeken azokat is értjük, amelyeket a szokásos nemesítési vagy genetikai módszerekkel herbicideket vagy a herbicidek egy csoportját elviselővé tettek.

A következő példák a találmány további bemutatására szolgálnak, de a találmányt nem korlátozzák.

Előállítási példák

1. példa

[Karboxi-(1-metil-etil)]-2-klór-5-[3,6-dihidro-3-metil-2,6-dioxo-4-(trifluor-metil)-1(2H)-pirimidinil]-benzoát előállítás

82,0 g 2-klór-5-[3,6-dioxo-3-metil-4-(trifluor-metil)-1(2H)-pirimidinil]-benzoesav és 83,3 g tionil-klorid elegyét 700 ml toluolban 2 órán át visszafolytatás közben forraljuk.

Az elegyet ezután szárazra pároljuk, és a maradékot 600 ml 1,2-dimetoxi-etánban feloldjuk. Ezt az oldatot 10 és 15°C közötti hőmérsékleten 28,3 g trietil-amin, 0,5 g 4-(dimetil-amino)-piridin és 29,15 g α -hidroxi-izovajsav 200 ml 1,2-dimetoxi-etánnal készült oldatához csepegtetjük, majd a reakcióelegyet 1 órán át 55°C-on keverjük. A reakcióelegyet ezután 1000 ml vízzel, majd 350 ml etil-acetáttal extraháljuk. A szerves fázist egy alkalommal 350 ml vízzel mossuk és bepároljuk. A maradékot etil-acetát és n-hexán elegyéből kristályosítjuk. A kívánt termék, a [karboxi-(1-metil-etil)]-2-klór-5-[3,6-dihidro-3-metil-2,6-dioxo-4-(trifluor-metil)-1(2H)-pirimidinil]-benzoát 202-203,5°C-on olvad.

$^1\text{H-NMR}$ ($\text{D}_6\text{-DMSO}$, 200 MHz): 13,1 ppm (s, 1H); 7,79 ppm (d, 1H); 7,74 ppm (d, 1H); 7,53 ppm (dxd, 1H); 6,56 ppm (s, 1H); 3,40 ppm (s, 3H); 1,60 ppm (s, 6H).

Hasonlóképpen állítjuk elő a [karboxi-(1-etil-propil)]-2-klór-5-[3,6-dihidro-3-metil-2,6-dioxo-4-(trifluor-metil)-1(2H)-pirimidinil]-benzoátot, amely 162°C-on olvad.

2. példa

[1-(Klór-karbonil)-1-metil-etil]-2-klór-5-[3,6-dihidro-3-metil-2,6-dioxo-4-(trifluor-metil)-1(2H)-pirimidinil]-benzoát előállítás

63,0 g [karboxi-(1-metil-etil)]-2-klór-5-[3,6-dihidro-3-metil-2,6-dioxo-4-(trifluor-metil)-1(2H)-pirimidinil]-benzoát, 43,12 g tionil-klorid és 0,5 ml N,N-dimetil-formamid 600 ml toluollal készült elegyét 4 órán át visszafolyatás és keverés közben forraljuk. A tionil-klorid feleslegét ezután

kb. 200 ml toluollal együtt ledesztilláljuk, és a maradékot 0°C-ra hűtjük. A termék kikristályosodik, kiszűrjük és két alkalommal 200-200 ml petroléterrel mossuk. A megszáritott termék 175°C-on olvad.

Hasonlóképpen állítjuk elő az [1-(klór-karbonil)-1-etil-propil]-2-klór-5-[3,6-dihidro-3-metil-2,6-dioxo-4-(trifluor-metil)-1(2H)-pirimidinil]-benzoátot is.

3. példa

Az 1.001 számú vegyület előállítás

6,8 g [1-(klór-karbonil)-1-metil-etil]-2-klór-5-[3,6-dihidro-3-metil-2,6-dioxo-4-(trifluor-metil)-1(2H)-pirimidinil]-benzoátot 20 ml kloroformban feloldunk, és az oldathoz 0,88 g etanolt adunk. A reakcióelegybe 0-5°C-on élénk nitrogénáramot vezetünk 4 órán át. Ezután a reakcióoldatot bepároljuk, és a maradékot 100 g szilikagélen kromatografáljuk, eluálószerként toluol és etil-acetát 15:1 térfogatarányú elegyét használjuk. A frakciókat bepároljuk, a maradékhoz 20 ml petroléter:toluol = 5:1 térfogatarányú elegyet adunk, és a keletkezett terméket kiszűrjük és szárítjuk. A kívánt termék 55-57°C-on olvad.

4. példa

Az 1.001 számú vegyület előállítás

6,8 g [1-(klór-karbonil)-1-metil-etil]-2-klór-5-[3,6-dihidro-3-metil-2,6-dioxo-4-(trifluor-metil)-1(2H)-pirimidinil]-benzoátot 20 ml metilén-dikloridban feloldunk, és az oldathoz 0,88 g etanolt és 2,5 g nátrium-hidrogén-karbonátot

adunk 0°C-on. A reakcióelegyet 4 órán át 0°C-on keverjük, majd szűrjük és a szűrletet bepároljuk. A maradékot dietiléter és petroléter elegyből átkristályosítjuk. A kívánt termék 55-57°C-on olvad.

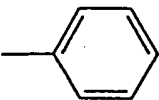
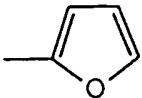
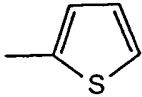
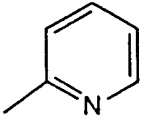
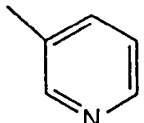
A 3. és 4. példához hasonlóan állítjuk elő az 1.021 számú vegyületet, amely 123-124°C-on olvad, és az 1.022 számú vegyületet;

$^1\text{H-NMR}$ (300 MHz; CDCl_3): 7,57 ppm (d, 1H); 7,21 ppm (d, 1H); 7,21 ppm (dxd, 1H); 6,35 ppm (s, 1H); 5,91 ppm (m, 1H); 5,32 ppm (d, 1H); 5,19 ppm (d, 1H); 4,17 ppm (m, 2H); 3,54 ppm (s, 3H); 1,60 ppm (s, 3H); 1,40 ppm (s, 3H).

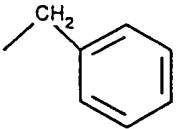
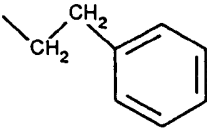
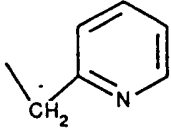
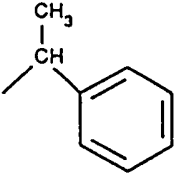
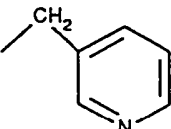
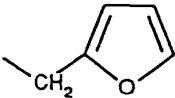
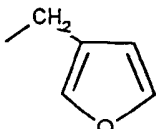
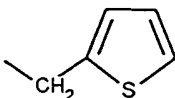
A következő, 1-5. táblázatokban felsorolt vegyületeket hasonló módon állíthatjuk elő.

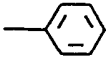
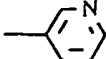
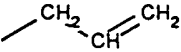
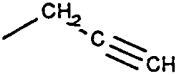
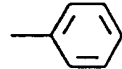
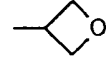
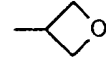
1. Táblázat

(Ia) általános képletű vegyületek

| A vegyület száma | R ₆ | R ₇ | R ₈ | Fizikai adatok |
|------------------|-----------------|-------------------------------------------------------------------------------------|-------------------------------|----------------|
| 1.001 | CH ₃ | CH ₃ | C ₂ H ₅ | op. 55-57°C |
| 1.002 | CH ₃ | C ₂ H ₅ | CH ₃ | op. 137-139°C |
| 1.003 | CH ₃ | n-C ₃ H ₇ | CH ₃ | |
| 1.004 | CH ₃ | n-C ₃ H ₇ | CH ₃ | |
| 1.005 | CH ₃ | n-C ₄ H ₉ | CH ₃ | |
| 1.006 | CH ₃ | isoC ₄ H ₉ | CH ₃ | |
| 1.007 | CH ₃ | sec-C ₄ H ₉ | CH ₃ | |
| 1.008 | CH ₃ | n-C ₅ H ₁₁ | CH ₃ | |
| 1.009 | CH ₃ | n-C ₆ H ₁₃ | CH ₃ | |
| 1.010 | CH ₃ | n-C ₇ H ₁₅ | CH ₃ | |
| 1.011 | CH ₃ | n-C ₈ H ₁₇ | CH ₃ | |
| 1.012 | CH ₃ |  | CH ₃ | |
| 1.013 | CH ₃ |  | CH ₃ | |
| 1.014 | CH ₃ |  | CH ₃ | |
| 1.015 | CH ₃ |  | CH ₃ | |
| 1.016 | CH ₃ |  | CH ₃ | |

| A vegyület száma | R ₆ | R ₇ | R ₈ | Fizikai adatok |
|------------------|-------------------------------|-------------------------------|-------------------------------|------------------------------|
| 1.017 | CH ₃ | | CH ₃ | |
| 1.018 | CH ₃ | | CH ₃ | |
| 1.019 | CH ₃ | CF ₃ | CH ₃ | |
| 1.020 | C ₂ H ₅ | C ₂ H ₅ | CH ₃ | op. 148-149°C |
| 1.021 | C ₂ H ₅ | C ₂ H ₅ | C ₂ H ₅ | op. 123-124°C |
| 1.022 | CH ₃ | CH ₃ | | gyanta ¹ H-NMR |
| 1.023 | C ₂ H ₅ | C ₂ H ₅ | | |
| 1.024 | CH ₃ | CH ₃ | | |
| 1.025 | CH ₃ | CH ₃ | | |
| 1.026 | CH ₃ | CH ₃ | | |
| 1.027 | CH ₃ | CH ₃ | | gyanta |
| 1.028 | CH ₃ | CH ₃ | | |
| 1.029 | CH ₃ | CH ₃ | | |
| 1.030 | CH ₃ | CH ₃ | | |
| 1.031 | CH ₃ | CH ₃ | | |
| 1.032 | CH ₃ | CH ₃ | | |
| 1.033 | CH ₃ | CH ₃ | | |

| A vegyület száma | R ₆ | R ₇ | R ₈ | Fizikai adatok |
|------------------|-----------------|------------------------------------|--------------------------------------------------------------------------------------|----------------|
| 1.034 | CH ₃ | CH ₃ |  | |
| 1.035 | CH ₃ | CH ₃ |  | |
| 1.036 | CH ₃ | CH ₃ |  | |
| 1.037 | CH ₃ | CH ₃ |  | |
| 1.038 | CH ₃ | CH ₃ |  | |
| 1.039 | CH ₃ | CH ₃ |  | |
| 1.040 | CH ₃ | CH ₃ |  | |
| 1.041 | CH ₃ | CH ₃ |  | |
| 1.042 | | -(CH ₂) ₂ - | CH ₃ | |
| 1.043 | | -(CH ₂) ₂ - | C ₂ H ₅ | |
| 1.044 | | -(CH ₂) ₃ - | CH ₃ | |
| 1.045 | | -(CH ₂) ₃ - | C ₂ H ₅ | |
| 1.046 | | -(CH ₂) ₄ - | CH ₃ | |
| 1.047 | | -(CH ₂) ₄ - | C ₂ H ₅ | gyanta |
| 1.048 | | -(CH ₂) ₅ - | CH ₃ | |

| A vegyi- let száma | R ₆ | R ₇ | R ₈ | Fizikai adatok |
|-----------------------|-------------------------------|-----------------------------------------------------------------------|--------------------------------------------------------------------------------------|-------------------|
| 1.049 | | -(CH ₂) ₅ - | C ₂ H ₅ | |
| 1.050 | | -CH ₂ -O-CH ₂ - | CH ₃ | |
| 1.051 | | -(CH ₂) ₃ -O- | CH ₃ | |
| 1.052 | | -(CH ₂) ₄ -O- | CH ₃ | |
| 1.053 | | -CH ₂ -S-CH ₂ - | CH ₃ | |
| 1.054 | CH ₃ | CH ₃ |  | |
| 1.055 | CH ₃ | CH ₃ |  | |
| 1.056 | C ₂ H ₅ | C ₂ H ₅ |  | op. 114-116°C |
| 1.057 | C ₂ H ₅ | C ₂ H ₅ | C ₃ H ₇ (n) | op. 94-97°C |
| 1.058 | C ₂ H ₅ | C ₂ H ₅ | C ₃ H ₇ (iso) | op. 132-133°C |
| 1.059 | CH ₃ | CH ₃ | C ₃ H ₇ (n) | gyanta |
| 1.060 | CH ₃ | CH ₃ | C ₃ H ₇ (iso) | op. 71-72°C |
| 1.061 | CH ₃ | CH ₃ |  | gyanta |
| 1.062 | CH ₃ | CH ₃ | CH ₃ | gyanta |
| 1.063 | C ₂ H ₅ | C ₂ H ₅ |  | gyanta |
| 1.064 | C ₂ H ₅ | C ₂ H ₅ | -CH(CH ₃)CH ₂ CH ₃ | |
| 1.065 | | -(CH ₂) ₃ - | C ₃ H ₇ (iso) | |
| 1.066 | | -(CH ₂) ₄ - | C ₃ H ₇ (iso) | |
| 1.067 | | -(CH ₂) ₅ - | C ₃ H ₇ (iso) | |
| 1.068 | | -(CH ₂) ₂ -O-(CH ₂) ₂ - | C ₃ H ₇ (iso) | |
| 1.069 | CH ₃ | CH ₃ |  | |
| 1.070 | C ₂ H ₅ | C ₂ H ₅ |  | |
| 1.071 | C ₂ H ₅ | C ₂ H ₅ | -(CH ₂) ₂ O-N=C(CH ₃) ₂ | |
| 1.072 | C ₂ H ₅ | C ₂ H ₅ | -CH ₂ COOCH ₃ | op. 116-118°C |

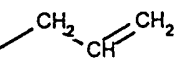
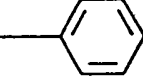
2. Táblázat

(Ib) általános képletű vegyületek

| A vegyület száma | R ₂ | R ₃ | R ₄ | R ₆ | R ₇ | R ₈ | Fizikai adatok |
|------------------|----------------|----------------|-----------------|-------------------------------|-------------------------------|-------------------------------------|----------------|
| 2.001 | Br | H | H | CH ₃ | CH ₃ | CH ₃ | |
| 2.002 | CN | H | H | CH ₃ | CH ₃ | CH ₃ | |
| 2.003 | CN | F | H | CH ₃ | CH ₃ | CH ₃ | |
| 2.004 | Cl | F | Cl | CH ₃ | CH ₃ | CH ₃ | |
| 2.005 | Cl | F | CH ₃ | CH ₃ | CH ₃ | CH ₃ | |
| 2.006 | Cl | F | F | CH ₃ | CH ₃ | C ₂ H ₅ | |
| 2.007 | Br | F | Br | CH ₃ | C ₂ H ₅ | C ₂ H ₅ | |
| 2.008 | Br | H | H | C ₂ H ₅ | C ₂ H ₅ | C ₃ H ₇ (izo) | |
| 2.009 | Cl | H | H | C ₂ H ₅ | C ₂ H ₅ | C ₃ H ₇ (izo) | |
| 2.010 | Cl | H | H | CH ₃ | C ₂ H ₅ | C ₃ H ₇ (izo) | |

3. Táblázat

(Ic) általános képletű vegyületek

| A vegyület száma | R ₆ | R ₇ | R ₈ | Fizikai adatok |
|------------------|-------------------------------|-------------------------------|-------------------------------------------------------------------------------------|----------------|
| 3.001 | CH ₃ | CH ₃ | CH ₃ | gyanta |
| 3.002 | C ₂ H ₅ | CH ₃ | CH ₃ | |
| 3.003 | C ₂ H ₅ | C ₂ H ₅ | C ₂ H ₅ | |
| 3.004 | CH ₃ | CH ₃ | C ₂ H ₅ | gyanta |
| 3.005 | CH ₃ | CH ₃ |  | |
| 3.006 | C ₂ H ₅ | C ₂ H ₅ |  | gyanta |
| 3.007 | C ₂ H ₅ | C ₂ H ₅ | C ₃ H ₇ (izo) | |
| 3.008 | CH ₃ | CH ₃ | C ₃ H ₇ (izo) | |

4. Táblázat

(Id) általános képletű vegyületek

| A vegyület száma | R ₆ | R ₇ | R ₈ | R ₉ | Fizikai adatok |
|------------------|-------------------------------|-------------------------------|-------------------------------------|-------------------------------|----------------|
| 4.001 | CH ₃ | CH ₃ | CH ₃ | CH ₃ | |
| 4.002 | CH ₃ | C ₂ H ₅ | CH ₃ | CH ₃ | |
| 4.003 | CH ₃ | C ₂ H ₅ | C ₂ H ₅ | CH ₃ | |
| 4.004 | CH ₃ | CH ₃ | CH ₃ | C ₂ H ₅ | |
| 4.005 | C ₂ H ₅ | C ₂ H ₅ | C ₃ H ₇ (izo) | CH ₃ | |
| 4.006 | CH ₃ | CH ₃ | C ₃ H ₇ (izo) | CH ₃ | |

5. Táblázat

(Ie) általános képletű vegyületek

| A vegyület száma | R ₁ | R ₃ | R ₆ | R ₇ | R ₈ | Fizikai adatok |
|------------------|------------------|----------------|-------------------------------|-------------------------------|-------------------------------------|----------------|
| 5.001 | CH ₃ | H | C ₂ H ₅ | C ₂ H ₅ | C ₃ H ₇ (izo) | |
| 5.002 | CH ₃ | F | C ₂ H ₅ | C ₂ H ₅ | C ₃ H ₇ (izo) | |
| 5.003 | CH ₃ | H | CH ₃ | CH ₃ | C ₃ H ₇ (izo) | |
| 5.004 | CHF ₂ | H | CH ₃ | CH ₃ | C ₃ H ₇ (izo) | |
| 5.005 | CHF ₂ | F | CH ₃ | CH ₃ | C ₃ H ₇ (izo) | |

Formálási példák, ahol a hatóanyag (I) általános képletű vegyület (a % mindenütt tömeg%-ot jelent)

| <u>F1. Emulgeálható koncentrátumok</u> | a) | b) | c) | d) |
|------------------------------------------------------|-----|-----|-----|-----|
| egy az 1-5. táblázatok szerinti vegyület | 5% | 10% | 25% | 50% |
| kalcium-dodecil-benzolszulfonát | 6% | 8% | 6% | 8% |
| ricinusolaj-poliglikol-éter (36 mol etilén-oxid) | 4% | - | 4% | 4% |
| oktil-fenol-poliglikol-éter (7-8 mol etilén-oxid) | - | 4% | - | 2% |
| ciklohexanon | - | - | 10% | 20% |
| aromás szénhidrogénelegy (9-12 szénatomos) | 85% | 78% | 55% | 16% |

Ezekből a koncentrátumokból vízzel való hígítással bármilyen kívánt koncentrációjú emulzió előállítható.

| <u>F2. Oldatok</u> | a) | b) | c) | d) |
|-----------------------------------------------|-----|-----|-----|-----|
| egy az 1-5. táblázatok szerinti vegyület | 5% | 10% | 50% | 90% |
| dipropilénglikol-metil-éter | - | 20% | 20% | - |
| polietilénglikol (móltömeg 400) | 20% | 10% | - | - |
| N-metil-2-pirrolidon | - | - | 30% | 10% |
| aromás szénhidrogénelegy (9-12 szénatomos) | 75% | 60% | - | - |

Az oldatok mikrocseppek formájában való alkalmazásra is megfelelőek.

| <u>F3. Nedvesíthető porok</u> | a) | b) | c) | d) |
|------------------------------------------------------|-----|-----|-----|-----|
| egy az 1-5. táblázatok szerinti vegyület | 5% | 25% | 50% | 80% |
| nátrium-lignoszulfonát | 4% | - | 3% | - |
| nátrium-lauril-szulfát | 2% | 3% | - | 4% |
| nátrium-diizobutil-naftalinszulfonát | - | 6% | 5% | 6% |
| oktil-fenol-poliglikol-éter (7-8 mol etilén-oxid) | - | 1% | 2% | - |
| nagydiszperzitásfokú kovasav | 1% | 3% | 5% | 10% |
| kaolin | 88% | 62% | 35% | - |

A hatóanyagot az adjuvánsokkal alaposan összekeverjük, és a keveréket megfelelő malomban alaposan megőröljük, így olyan nedvesíthető porokat kapunk, amelyeket vízzel hígítva bármilyen kívánt koncentrációjú szuszpenziót előállíthatunk.

| <u>F4. Bevont granulátum</u> | a) | b) | c) |
|----------------------------------------------------------------------------------------|-------|-----|-----|
| egy az 1-5. táblázatok szerinti vegyület | 0,1% | 5% | 15% |
| nagydiszperzitásfokú kovasav | 0,9% | 2% | 2% |
| szervetlen hordozó (átmérő: 0,1-1 mm) példul CaCO_3 vagy SiO_2 | 99,0% | 93% | 83% |

A hatóanyagot metilén-dikloridban oldjuk, az oldatot a hordozóra permetezzük, és azután az oldószert vákuumban eltávolítjuk.



| <u>F5. Bevont granulátum</u> | a) | b) | c) |
|--------------------------------------------------------------------------------------------|-------|-----|-----|
| egy az 1-5. táblázatok szerinti vegyület | 0,1% | 5% | 15% |
| polietilén-glikol (móltömeg 200) | 1,0% | 2% | 3% |
| nagydiszperzitásfokú kovasav | 0,9% | 1% | 2% |
| szervetlen hordozó (átmérő: 0,1-1 mm) példul CaCO ₃ vagy SiO ₂ | 98,0% | 92% | 80% |

A finoman elporított hatóanyagot egy keverőben egyenletesen felvisszük a polietilén-glikollal megnedvesített hordozóra. Ilyen módon nemporos bevont granulátumokat kapunk.

| <u>F6. Extrudált granulátum</u> | a) | b) | c) | d) |
|------------------------------------------|-------|-----|-----|-----|
| egy az 1-5. táblázatok szerinti vegyület | 0,1% | 3% | 5% | 15% |
| nátrium-lignoszulfonát | 1,5% | 2% | 3% | 4% |
| karboxi-metil-cellulóz | 1,4% | 2% | 2% | 2% |
| kaolin | 97,0% | 93% | 90% | 79% |

A hatóanyagot az adjuvánsokkal összekeverjük és megőröljük, majd a keveréket vízzel megnedvesítjük, extrudáljuk és azután levegőáramban megszárítjuk.

| <u>F7. Porozószer</u> | a) | b) | c) |
|------------------------------------------|-------|-----|-----|
| egy az 1-5. táblázatok szerinti vegyület | 0,1% | 1% | 5% |
| talkum | 39,9% | 49% | 35% |
| kaolin | 60,0% | 50% | 60% |

A hatóanyagot a hordozókkal összekeverjük, a keveréket alkalmas malomban megőröljük, így felhasználásra kész porozószeret kapunk.

| <u>F8. Szuszpenzió koncentrátumok</u> | a) | b) | c) | d) |
|--------------------------------------------------|------|------|------|------|
| egy az 1-5. táblázatok szerinti vegyület | 3% | 10% | 25% | 50% |
| nonil-fenol-poliglikol-éter (15 mol etilén-oxid) | - | 1% | 2% | - |
| nátrium-lignoszulfonát | 3% | 3% | 4% | 5% |
| karboxi-metil-cellulóz | 1% | 1% | 1% | 1% |
| 37%-os vizes formaldehid-oldat | 0,2% | 0,2% | 0,2% | 0,2% |
| szilikonolaj emulzió | 0,8% | 0,8% | 0,8% | 0,8% |
| víz | 87% | 79% | 62% | 38% |

A finomra őrölt hatóanyagot az adjuvánsokkal bensőségesen összekeverjük, így olyan szuszpenzió koncentrátumot kapunk, amelyből vízzel való hígítással bármilyen kívánt koncentrációjú szuszpenziót előállíthatunk.

Biológiai példák

1. Kikelés előtti herbicid hatás

Egyszíki és kétsziki vizsgálandó növényeket ültettünk műanyag cserepekben levő standard talajba. Közvetlenül az ültetés után a vizsgálandó (I) általános képletű vegyületek vizes szuszpenzióit, amelyeket az F3.b) példa szerinti 25%-os nedvesíthető por készítményből állítottunk elő, 2 kg hatóanyag/ha (500 liter víz/ha) mennyiségben vittük fel. A vizsgálandó növényeket azután üvegházban, optimális

körülmények között termesztettük. 3 hét eltelte után a kísérletet egy 9 fokozatú skála segítségével (1 = teljes irtás, 9 = nincs hatás) értékeltük. Az 1 és 4 közötti, különösen az 1 és 3 közötti érték jó - nagyon jó herbicid hatásra utal.

B1. táblázat

Kikelés előtti hatás

| Vizsgálandó növény: | Avena | Setaria | Sinapis | Stellaria |
|---------------------|-------|---------|---------|-----------|
| A vegyület száma: | | | | |
| 1.001 | 1 | 1 | 1 | 1 |
| 1.021 | 1 | 1 | 1 | 1 |
| 1.022 | 1 | 1 | 1 | 1 |

Ugyanezt az eredményt kaptuk az F1, F2 és F4-F8 példák szerint formált (I) általános képletű vegyületekkel is.

B2. példa

Kikelés utáni herbicid hatás (kontakt herbicid)

Üvegházban egyszíki és kétsziki vizsgálandó növényeket neveltünk műanyag cserepekben, standard talajban, és 4-6 leveles állapotban a vizsgálandó (I) általános képletű vegyületek vizes szuszpenzióit, amelyeket az F3.b) példa szerinti 25%-os nedvesíthető por készítményből állítottunk elő, 2000 g hatóanyag/ha (500 liter víz/ha) mennyiségben permeteztük a növényekre. A vizsgálandó növényeket azután üvegházban, optimális körülmények között termesztettük. 18

nap eltelte után a kísérletet egy 9 fokozatú skála segítségével (1 = teljes irtás, 9 = nincs hatás) értékeltük. Az 1 és 4 közötti, különösen az 1 és 3 közötti érték jó - nagyon jó herbicid hatásra utal.

B2. táblázat

Kikelés utáni hatás

| Vizsgálendő növény: | Avena | Setaria | Sinapis | Stellaria |
|---------------------|-------|---------|---------|-----------|
| A vegyület száma: | | | | |
| 1.001 | 1 | 1 | 1 | 1 |
| 1.021 | 1 | 1 | 1 | 1 |
| 1.022 | 1 | 1 | 1 | 1 |

Ugyanezt az eredményt kaptuk az F1, F2 és F4-F8 példák szerint formált (I) általános képletű vegyületekkel is.

SZABADALMI IGÉNYPONTOK

1. (I) általános képletű vegyület, a képletben
- W (a) vagy (b) általános képletű csoport, amely a gyűrű nitrogénatomjához szénatomon keresztül kapcsolódik;
- R₁ hidrogénatom, 1-4 szénatomos alkilcsoport, 1-4 szénatomos halogén-alkil-csoport, 3 vagy 4 szénatomos alkenilcsoport vagy 3 vagy 4 szénatomos alkinilcsoport;
- R₂ halogénatom vagy cianocsoport;
- R₃ hidrogénatom vagy fluoratom;
- R₄ hidrogénatom, halogénatom vagy 1-4 szénatomos alkilcsoport;
- R₅ 1-4 szénatomos alkilcsoport vagy 1-4 szénatomos halogén-alkil-csoport;
- R₆ és R₇ egymástól függetlenül hidrogénatom, 1-8 szénatomos alkilcsoport, 3-6 szénatomos alkenilcsoport, 3-6 szénatomos alkinilcsoport, 3-8 szénatomos cikloalkilcsoport, 1-6 szénatomos halogén-alkil-csoport, (1-6 szénatomos alkoxi)-(1-6 szénatomos alkil)-csoport, (1-6 szénatomos alkil-tio)-(1-6 szénatomos alkil)-csoport, arilcsoport, aril-(1-4 szénatomos alkil)-csoport, heteroarilcsoport vagy heteroaril-(1-4 szénatomos alkil)-csoport; vagy

- R_6 és R_7 együtt a szénatommal, amelyhez kapcsolódnak 3-, 4-, 5- vagy 6-tagú gyűrűt képez, amely helyettesítetlen vagy 1-4 szénatomos alkilcsoporttal egyszeresen vagy többszörösen helyettesített és amely -O-, -S- vagy -N(R_{10})- heteroatomot tartalmazhat;
- R_8 1-6 szénatomos alkilcsoport, ciano-(1-6 szénatomos alkil)-csoport, nitro-(1-6 szénatomos alkil)-csoport, 3-6 szénatomos alkenilcsoport, 3-6 szénatomos alkinilcsoport, 1-6 szénatomos halogén-alkil-csoport, 3-6 szénatomos halogén-alkenil-csoport, 3-6 szénatomos cikloalkilcsoport, (3-6 szénatomos cikloalkil)-(1-6 szénatomos alkil)-csoport, arilcsoport, aril-(1-4 szénatomos alkil)-csoport, heteroarilcsoport, heteroaril-(1-4 szénatomos alkil)-csoport, (1-6 szénatomos alkil)-karbonil-(1-6 szénatomos alkil)-csoport, (1-6 szénatomos alkoxi)-(1-6 szénatomos alkil)-csoport, (1-6 szénatomos alkoxi)-karbonil-(1-6 szénatomos alkil)-csoport, (3-6 szénatomos alkenil-oxi)-karbonil-(1-6 szénatomos alkil)-csoport, (1-6 szénatomos alkil-tio)-(1-6 szénatomos alkil)-csoport, (1-6 szénatomos dialkil-amino)-(2-6 szénatomos alkil)-csoport, oxetanilcsoport vagy (1-6 szénatomos izoalkilidén-amino-oxi)-(1-4 szénatomos alkil)-csoport;
- R_9 1-4 szénatomos alkilcsoport, 3 vagy 4 szénatomos alkenilcsoport vagy 3 vagy 4 szénatomos alkinil-csoport; és

R_{10} hidrogénatom vagy 1-4 szénatomos alkilcsoport;
vagy, amikor R_1 jelentése hidrogénatom, az (I) általános
képletű vegyület agrokémiaailag elfogadható sói.

2. Az 1. igénypont szerinti olyan vegyület, amelyben R_2
jelentése klóratom, brómatom vagy cianocsoport.

3. Az 1. igénypont szerinti olyan vegyület, amelyben R_4
jelentése hidrogénatom, fluoratom, klóratom, brómatom vagy
metilcsoport.

4. A 3. igénypont szerinti olyan vegyület, amelyben R_4
jelentése hidrogénatom, fluoratom vagy metilcsoport.

5. Az 1. igénypont szerinti olyan vegyület, amelyben R_5
jelentése metil-, trifluor-metil- vagy pentafluor-etil-
csoport.

6. Az 1. igénypont szerinti olyan vegyület, amelyben R_6
és R_7 egymástól függetlenül 1-8 szénatomos alkilcsoport, 3-6
szénatomos alkenilcsoport, 3-6 szénatomos alkinilcsoport,
1-6 szénatomos halogén-alkil-csoport, fenilcsoport, furil-
csoport, tienilcsoport vagy piridilcsoport; vagy R_6 és R_7
együtt a szénatommal, amelyhez kapcsolódnak, 3-, 4-, 5- vagy
6-tagú helyettesítetlen gyűrűt alkot, amely -O-, -S- vagy
-N(R_{10})- heteroatomot tartalmazhat.

7. A 6. igénypont szerinti vegyület, amelyben R_6 és R_7 egymástól függetlenül 1-6 szénatomos alkilcsoport, 3- vagy 4 szénatomos alkenilcsoport vagy 3 vagy 4 szénatomos alkinilcsoport, 1-6 szénatomos halogén-alkil-csoport vagy fenilcsoport; vagy R_6 és R_7 a szénatommal együtt, amelyhez kapcsolódnak, 3-, 4-, 5- vagy 6-tagú helyettesítetlen gyűrűt alkot, amely -O- vagy -S- heteroatomot tartalmazhat.

8. Az 1. igénypont szerinti olyan vegyület, amelyben R_6 és R_7 egymástól függetlenül 1-6 szénatomos alkilcsoport vagy 1-6 szénatomos halogén-alkil-csoport; vagy R_6 és R_7 együtt a szénatommal, amelyhez kapcsolódnak, 3-, 4-, 5- vagy 6-tagú helyettesítetlen gyűrűt alkot.

9. Az 1. igénypont szerinti olyan vegyület, amelyben R_8 1-6 szénatomos alkilcsoport, 3-6 szénatomos alkenilcsoport, 3-6 szénatomos alkinilcsoport, 1-6 szénatomos halogén-alkil-csoport vagy (1-6 szénatomos alkoxi)-(1-6 szénatomos alkil)-csoport.

10. A 9. igénypont szerinti olyan vegyület, amelyben R_8 1-2 szénatomos alkilcsoport, 3-4 szénatomos alkenilcsoport, 3-4 szénatomos alkinilcsoport, 1-2 szénatomos halogén-alkil-csoport vagy (1-2 szénatomos alkoxi)-(1-2 szénatomos alkil)-csoport.

11. Az 1. igénypont szerinti olyan vegyület, amelyben
W jelentése az 1. igénypontban meghatározott;

- R₂ klóratom, brómatom vagy cianocsoport;
- R₃ hidrogénatom vagy fluoratom;
- R₄ hidrogénatom, fluoratom, klóratom, brómatom vagy metilcsoport;
- R₅ metilcsoport, trifluor-metil-csoport vagy pentafluor-etil-csoport;
- R₆ és R₇ egymástól függetlenül 1-8 szénatomos alkilcsoport, 3-4 szénatomos alkenilcsoport, 3-4 szénatomos alkinilcsoport, 1-3 szénatomos halogén-alkil-csoport, fenilcsoport, furilcsoport, tienilcsoport vagy piridilcsoport; vagy
- R₆ és R₇ együtt a szénatommal, amelyhez kapcsolódnak, egy 3-, 4-, 5- vagy 6-tagú helyettesítetlen gyűrűt alkot, amely további heteroatomként -O- vagy -S- atomot tartalmazhat; és
- R₈ 1-4 szénatomos alkilcsoport, 3-4 szénatomos alkenilcsoport, 3-4 szénatomos alkinilcsoport, 1-3 szénatomos halogén-alkil-csoport, (1-3 szénatomos alkoxi)-(1-3 szénatomos alkil)-csoport, (1-2 szénatomos alkil-tio)-(2 szénatomos alkil)-csoport, (1-2 szénatomos dialkil-amino)-(2 szénatomos alkil)-csoport, fenil(1-3 szénatomos alkil)-csoport, (2- vagy 3-piridil)-(1-2 szénatomos alkil)-csoport, (2- vagy 3-furil)-(1-2 szénatomos alkil)-csoport vagy (2-tienil)-(1 szénatomos alkil)-csoport.

12. A 11. igénypont szerinti olyan vegyület, amelyben

W jelentése (a) általános képletű csoport;

R₁ hidrogénatom, 1-4 szénatomos alkilcsoport, 1-4 szénatomos halogén-alkil-csoport, 3-4 szénatomos alkenilcsoport vagy 3-4 szénatomos alkinilcsoport;

R₅ trifluor-metil-csoport; és

R₆ és R₇ egymástól függetlenül 1-6 szénatomos alkilcsoport vagy 1-3 szénatomos halogén-alkil-csoport; vagy

R₆ és R₇ együtt a szénatommal, amelyhez kapcsolódnak, egy 4-, 5- vagy 6-tagú helyettesítetlen gyűrűt alkot.

13. A 11. igénypont szerinti olyan vegyület, amelyben

W jelentése (b) általános képletű csoport;

R⁹ 1-4 szénatomos alkilcsoport, 3-4 szénatomos alkenilcsoport vagy 3-4 szénatomos alkinilcsoport;

R₆ és R₇ egymástól függetlenül 1-6 szénatomos alkilcsoport vagy 1-3 szénatomos halogén-alkil-csoport; vagy

R₆ és R₇ együtt a szénatommal, amelyhez kapcsolódnak, egy 4-, 5- vagy 6-tagú helyettesítetlen gyűrűt alkot.

14. A 11. igénypont szerinti (Ia) általános képletű vegyület, a képletben

R₆ metil- vagy etilcsoport;

R₇ 1-8 szénatomos alkilcsoport, allilcsoport, propargilcsoport, trifluor-metil-csoport, fenilcsoport, 2-furil-csoport, 2-tienil-csoport vagy 2- vagy 3-piridil-csoport; vagy

R₆ és R₇ együtt a szénatommal, amelyhez kapcsolódnak 3-, 4-, 5- vagy 6-tagú helyettesítetlen aliciklusos gyűrűt,

oxetán-, tetrahydrofuran-, tetrahydropyran- vagy
tietángyűrűt alkot; és

R₈ 1-4 szénatomos alkilcsoport, 3-4 szénatomos alke-
nilcsoport, 3-4 szénatomos alkinilcsoport, (1 szén-
atomos alkoxi)-(2 szénatomos alkil)-csoport, (1
szénatomos alkil-tio)-(2 szénatomos alkil)-csoport,
dimetil-amino-(2 szénatomos alkil)-csoport, 2-bróm-
vagy 2-klór-(2 szénatomos alkil)-csoport, 2,2,2-
-trifluor-(2 szénatomos alkil)-csoport, fenil-
csoport, fenil-(1-2 szénatomos alkil)-csoport, (2-
vagy 3-piridil)-(1 szénatomos alkil)-csoport, (2-
vagy 3-furil)-(1 szénatomos alkil)-csoport, (2-
tienil)-(1 szénatomos alkil)-csoport, 3-oxetanil-
csoport vagy -CH₂CH₂-O-N=C(CH₃)₂ csoport.

15. A 14. igénypont szerinti olyan vegyület, amelyben
R₆ és R₇ egymástól függetlenül metil- vagy etilcsoport; és
R₈ 1-3 szénatomos alkilcsoport, allilcsoport, propargil-
csoport vagy fenilcsoport.

16. A 11. igénypont szerinti (Ib) általános képletű
vegyület, a képletben

R₂ klóratom, brómatom vagy cianocsoport;

R₃ hidrogénatom vagy fluoratom;

R₄ hidrogénatom, fluoratom, klóratom, brómatom vagy
metilcsoport;

R₆ metilcsoport vagy etilcsoport; és

R₇ és R₈ egymástól függetlenül 1-3 szénatomos alkilcsoport.

17. A 11. igénypont szerinti (Ic) általános képletű vegyület, a képletben
 R_6 és R_7 egymástól függetlenül metil- vagy etilcsoport; és
 R_8 1-3 szénatomos alkilcsoport, allilcsoport vagy fenilcsoport.

18. A 11. igénypont szerinti (Id) általános képletű vegyület, a képletben
 R_6 metil- vagy etilcsoport; és
 R_7 , R_8 és R_9 egymástól függetlenül 1-3 szénatomos alkilcsoport.

19. A 11. igénypont szerinti (Ie) általános képletű vegyület, a képletben
 R_1 metilcsoport vagy difluor-metil-csoport;
 R_3 hidrogénatom vagy fluoratom;
 R_6 és R_7 egymástól függetlenül metil- vagy etilcsoport; és
 R_8 3 szénatomos alkilcsoport.

20. Eljárás az 1. igénypont szerinti (I) általános képletű vegyület előállítására, amely abban áll, hogy egy (II) általános képletű vegyületet, a képletben W és R_2 - R_5 jelentése az 1. igénypontban megadott és Z_1 kilépőcsoport, egy (III) általános képletű vegyülettel reagáltatunk, a képletben R_6 és R_7 jelentése az 1. igénypontban megadott és R_{11} hidrogénatom vagy védőcsoport, így (IV) általános képletű vegyületet kapunk, és ha R_{11} védőcsoport, akkor ezt

a védőcsoportot eltávolítjuk, és a kapott (V) általános képletű karbonsavat egy (VIII) általános képletű vegyülettel reagáltatjuk, a képletben Z_2 kilépőcsoport, különösen halogénatom és $Q-S(O)Cl$, $-C(O)Cl$, $-PCl_4$, $-C(O)Cl-C(O)-$ csoport, (c) vagy (d) képletű csoport, így (VI) általános képletű vegyületet kapunk, amelyben W, Z_2 és R_2-R_7 jelentése a fenti, és végül ezt a vegyületet a szokásos körülmények között egy (VII) általános képletű alkohollal visszük reakcióba, a képletben R_8 jelentése az 1. igénypontban megadott, így (I) általános képletű vegyületet kapunk.

21. Herbicid és növénynövekedést gátló készítmény, amely egy vagy több 1. igénypont szerinti (I) általános képletű vegyületet tartalmaz.

22. A 21. igénypont szerinti készítmény, amely 0,1-95 tömeg% 1. igénypont szerinti (I) általános képletű vegyületet tartalmaz.

23. Eljárás nemkivéant növények növekedésének gátlására, amely abban áll, hogy a gyomokkal szemben védendő haszonnövényt és/vagy a gyomot egy 1. igénypont szerinti (I) általános képletű vegyülettel vagy a 22. igénypont szerinti, ilyen vegyületet tartalmazó készítménnyel kezeljük.

24. A 23. igénypont szerinti eljárás, amely abban áll, hogy az (I) általános képletű vegyületet 0,001-2 kg/ha mennyiségben alkalmazzuk.

6 oldal vizzal

1995. 08. 15
JK.

A meghatalmazott:

Parragh Gáborné dr.

Parragh Gáborné dr.
szabadalmi ügyvivő
az S.H.G. & T. Nemzetközi
Szabadalmi Iroda tagja
H-1062 Budapest, Andrássy út 113.
Telefon: 34-24-950, Fax: 34-24-323

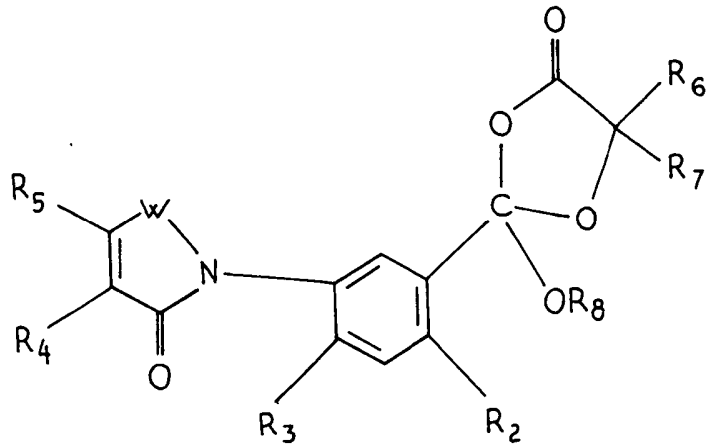
177/95

A
KÖZZÉTETELI
PÉLDÁNY

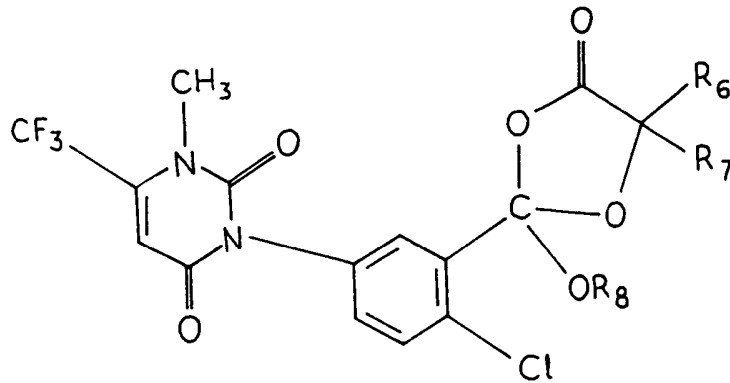
22133

70582

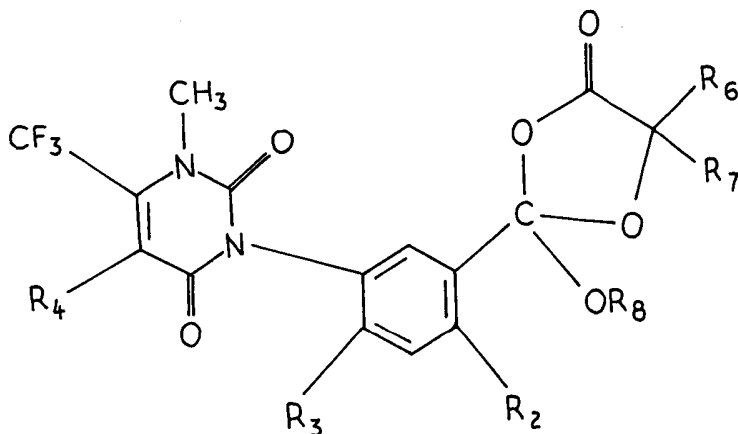
6/1



(I)



(Ia)

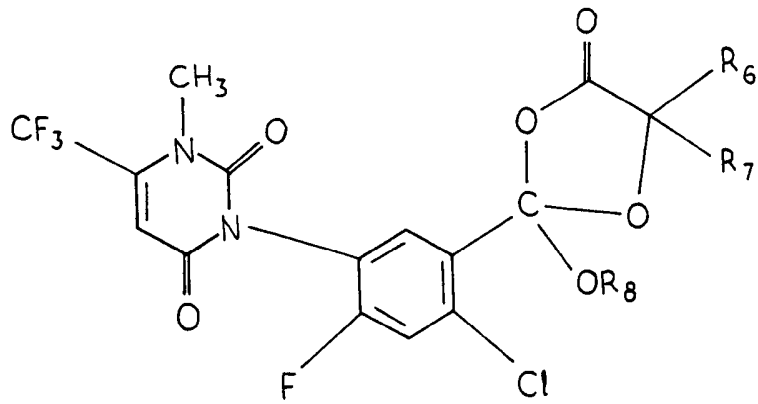


(Ib)

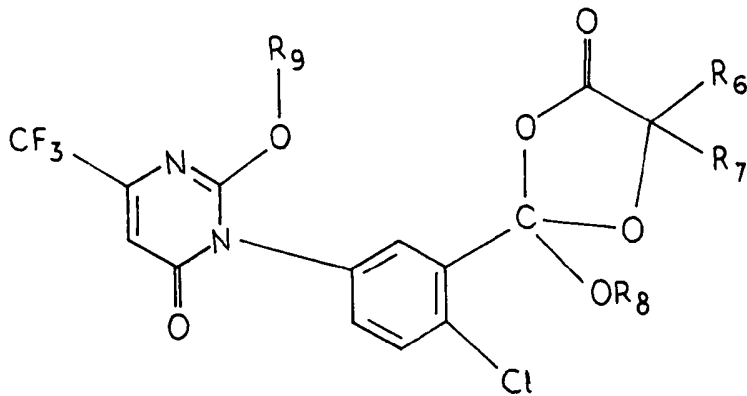
Parragh Gábor
Parragh Gábor dr.

szabadalmi ügyvivő
az S.B.G. & K. Nemzetközi
Szabadalmi Iroda tagja

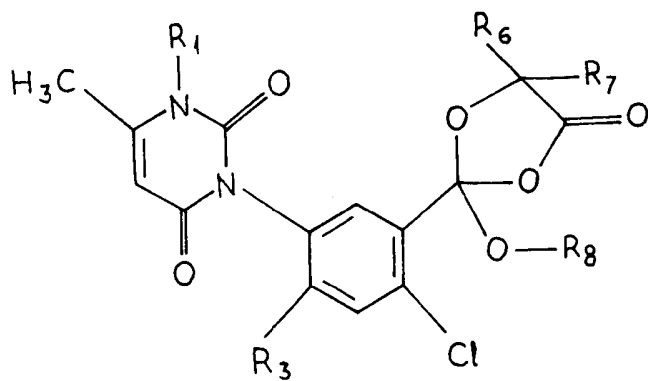
H-1062 Budapest, Andrássy út 113.
Telefon: 34-24-950, Fax: 34-24-323



(1c)

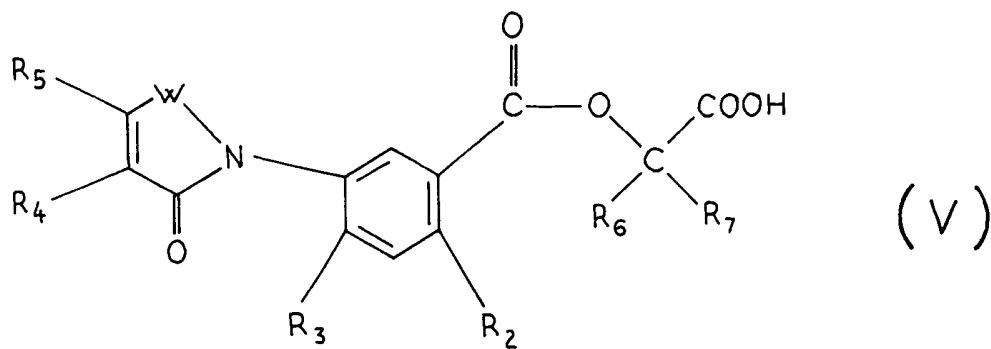
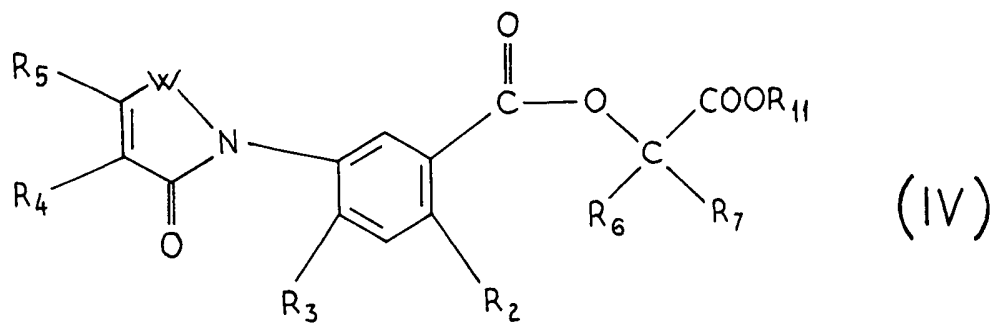
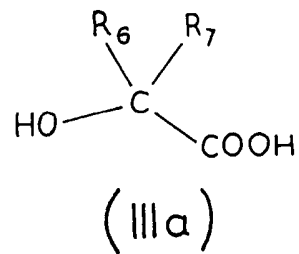
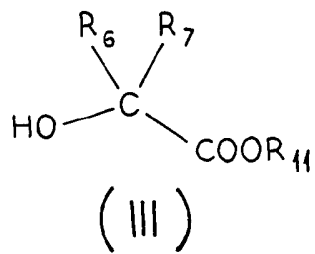
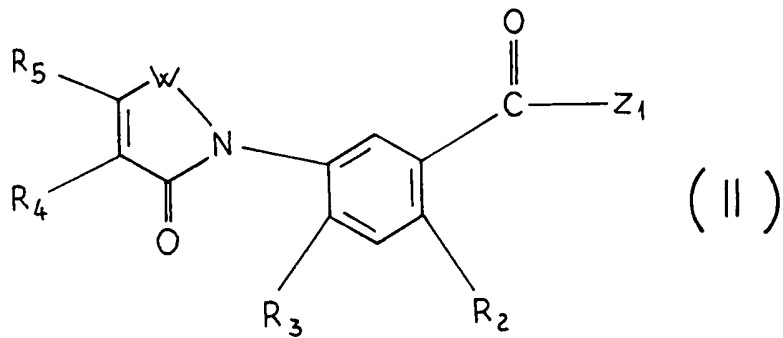


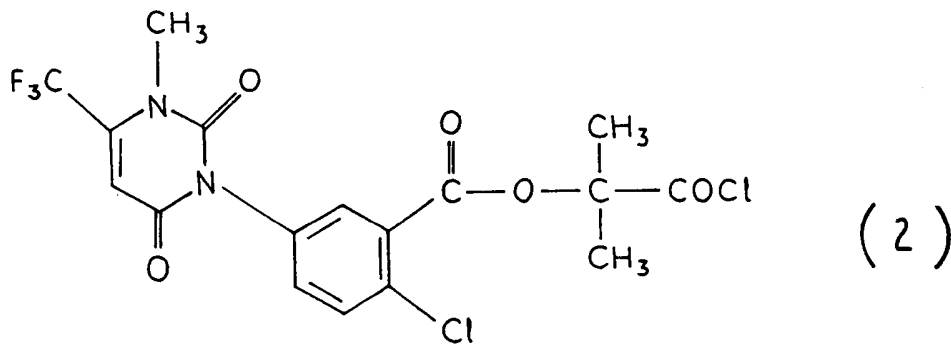
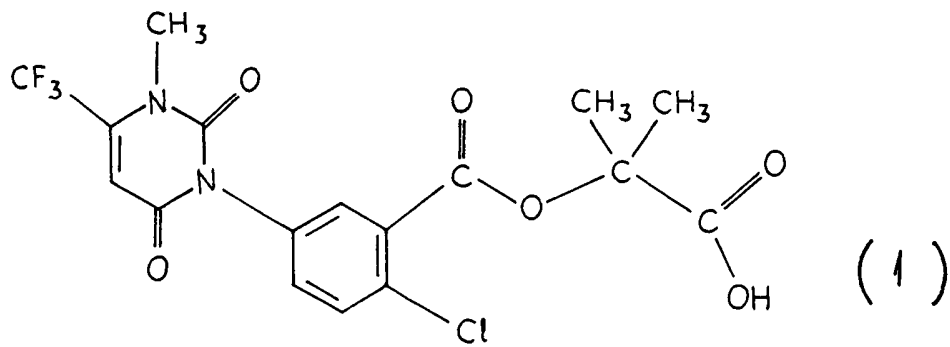
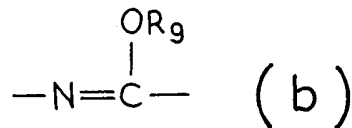
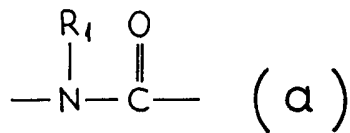
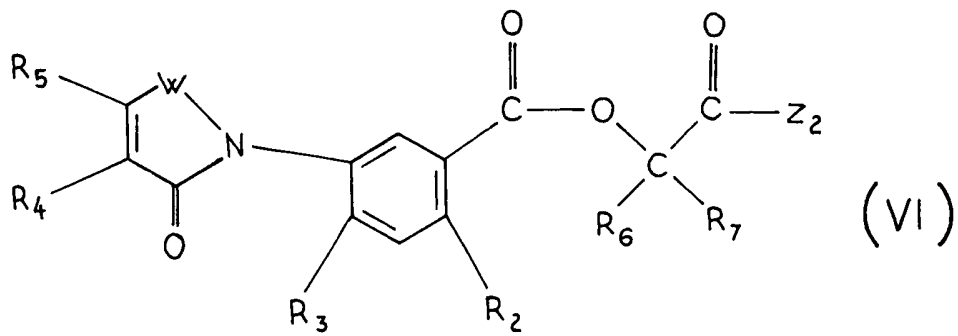
(1d)

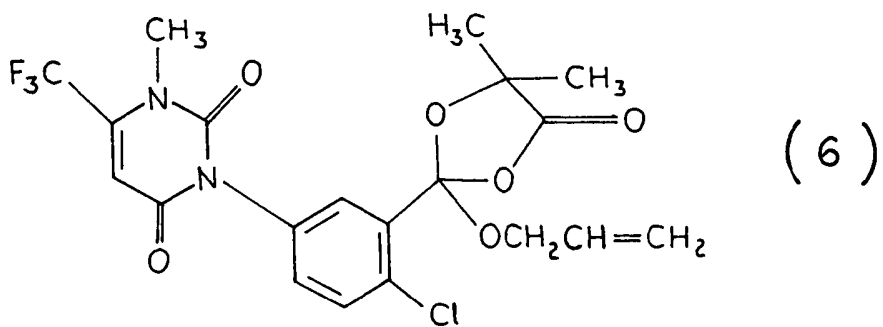
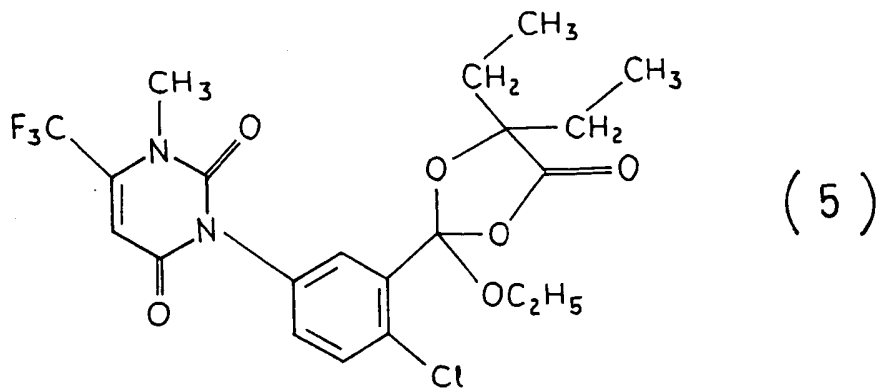
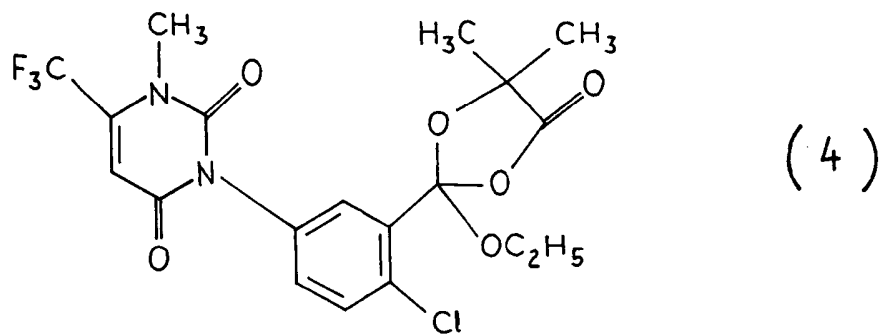
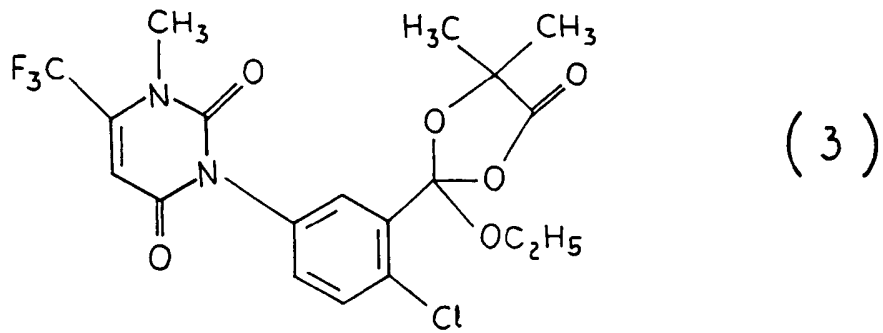


(1e)

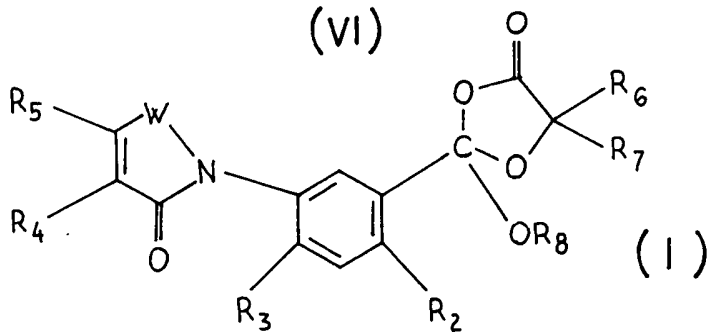
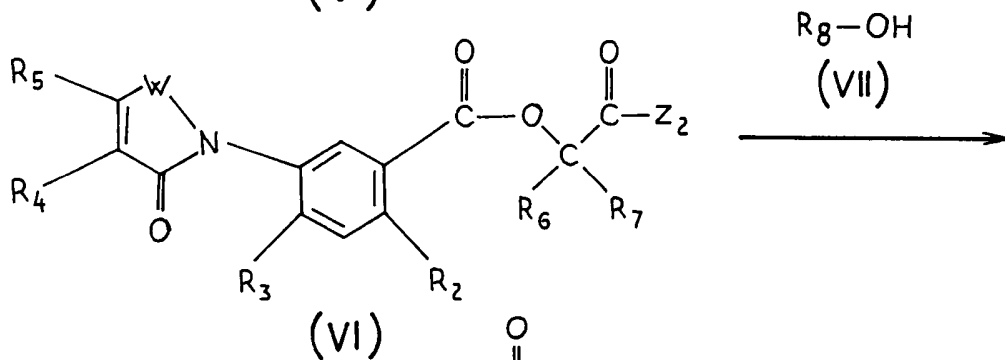
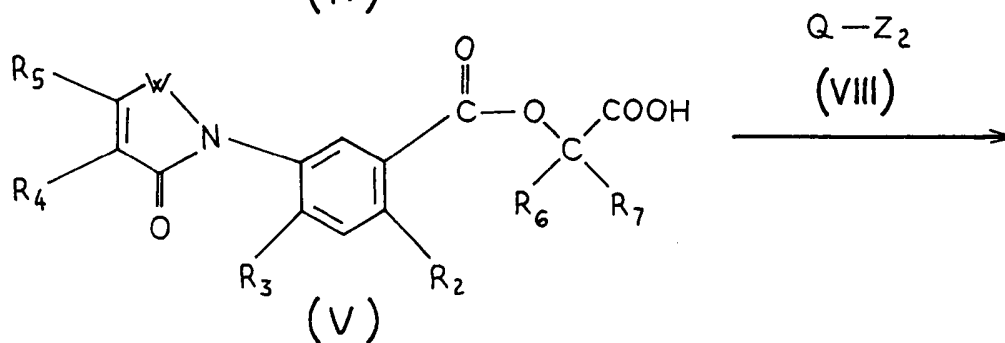
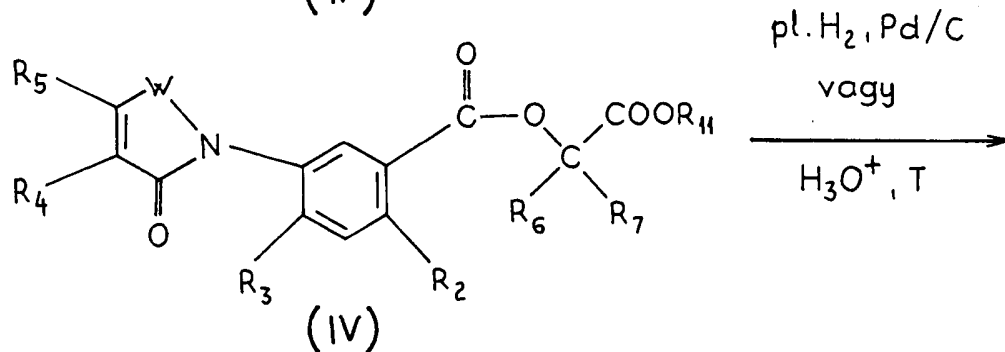
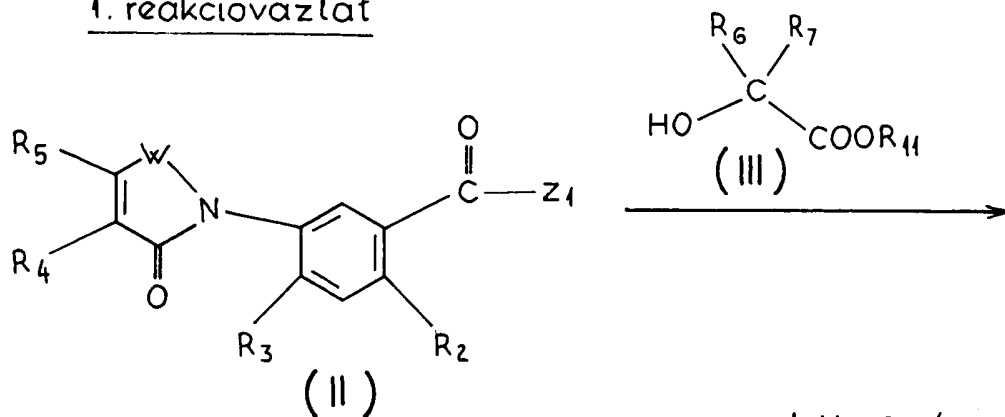
Parragh Gáborné dr.
Parragh Gáborné dr.
 szabadalmi ügyvivő
 az S.B.Ö. & K. Nonprofit Kft.
 Székhely: Irada tágja
 H-1067 Budapest, Andrássy út 113.
 Telefon: 34-24-950, Fax: 34-24-323







1. reakcióvázlat



Parragh Gábor
Parragh Gábor dr.
 szabadalmi ügyvivő
 az M.H.F. & K. Iroda Kft.-ben
 Széchenyi István utca
 H-1062 Budapest, Árpád utca 113.
 Telefon: 34-24-950, Fax: 34-24-113