

(19) Országkód:

HU



MAGYAR
KÖZTÁRSASÁG

ORSZÁGOS
TALÁLMÁNYI
HIVATAL

SZABADALMI LEÍRÁS

(11) Lajstromszám:

206 249 B

(21) A bejelentés száma: 3672/89
(22) A bejelentés napja: 1989. 07. 19.
(30) Elsőbbségi adatok:
P 38 24 520 1988. 07. 20. DE

(51) Int. Cl.⁵

A 01 N 43/78

A 01 N 43/34

A 01 N 43/56

A 01 N 43/50

A 01 N 43/653

A 01 N 43/84

C 07 D 277/58

C 07 D 417/04

(40) A közzététel napja: 1990. 03. 28.
(45) A megadás meghirdetésének dátuma a Szabadalmi
Közlönyben: 1992. 10. 28. SZKV 92/10

(72) Feltalálók:

dr. Beck, Gunther, Leverkusen (DE)
dr. Brandes, Wilhelm, Leichlingen (DE)
dr. Dutzmann, Stefan, Düsseldorf (DE)
dr. Paulus, Wilfried, Krefeld (DE)

(73) Szabadalmaz:

Bayer AG., Leverkusen (DE)

(54) **Hatóanyagként 4-halogén-5-nitro-tiazol-származékokat tartalmazó
gomba- és baktériumölő hatású készítmények
és eljárás a hatóanyagok előállítására**

(57) KIVONAT

A találmány szerinti készítmény hatóanyagának (I)
általános képletében

Hal jelentése halogénatom,

A jelentése oxigén-, kénatom, szulfín-, szulfonil-
csoport vagy

R¹

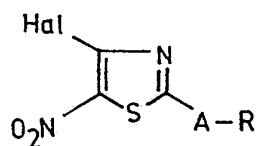
|

–N– képletű csoport, amelyben

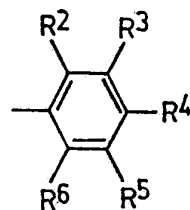
R¹ jelentése hidrogénatom, 1–4 szénatomos alkil-,
3–6 szénatomos alkenil-, ciano-(1–4 szénatomos
alkil)-, fenil-(1–4 szénatomos alkil)- vagy fenil-
csoport,

R jelentése 1–7 szénatomos alkil-, 3–6 szénatomos
alkenil-, 1–4 szénatomos halogén-alkil-, 2–6
szénatomos alkoxi-alkil-, ciano-(1–4 szénatomos
alkil)-, a fenilrészen adott esetben szubsztituált
fenil-(1–4 szénatomos alkil)-, adott esetben
szubsztituált 3–8 szénatomos cikloalkilcsoport,
naftilcsoport vagy (c) általános képletű csoport,
vagy

R és R¹ a kapcsolódó nitrogénatommal együtt képez-
het – egy vagy két 1–4 szénatomos alkilcsoporttal
adott esetben szubsztituált – pirrolil-, pirazolil-, imid-
azolil-, triazolil-, pirrolidinil-, piperidinil-, perhidro-
azephinil- vagy morfolinilcsoportot.



(I)



(C)

A találmány tárgyát hatóanyagként új 4-halogén-5-nitro-tiazol-származékokat tartalmazó gomba- és baktériumölő hatású készítmények, valamint a hatóanyagok előállítási eljárása képezi.

Ismert, hogy a tiazolszármazékokat, így például a 5 hidroxifenoxi-csoporttal helyettesített vegyületeket a gyógyászatban tumorok kezelésére alkalmazzák (88/00944 számú nemzetközi bejelentés).

Ismert továbbá, hogy a 2,4-diklór-5-nitro-tiazol mikrobicid, különösen fungicid hatású és alkalmazzák a növényvédelemben (3518520 számú német szövetségi köztársaságbeli közrebocsátási irat).

Ismertek olyan tiazolszármazékok is, így például a 4,5-diklór-2-(propinil-oxi)-tiazol, amely peszticid (3030661 számú német szövetségi köztársaságbeli közrebocsátási irat).

Ismert az is, hogy bizonyos helyettesített tiazolszármazékok, így például a 4-benzimidazol-2-il-tiazol (tiazol-2-yl) fungicid szerként alkalmazható az anyagvédelemben (például R. Wegler „Chemie der Pflanzenschutz- und Schädlingsbekämpfungsmittel”, 2. kötet, 124. oldal és 3. kötet 292. oldal; Springer Verlag, Berlin, Heidelberg, N. Y. 1970).

Az említett ismert vegyületeknek a hatása azonban nem teljesen kielégítő és nem minden területen megfelelő.

A találmány szerinti készítmények hatóanyagát az új (I) általános képletű 4-halogén-5-nitro-tiazol-származékok képezik, a képletben

Hal jelentése halogénatom,

A jelentése oxigén-, kénatom, szulfinil-, szulfonilcsoport, vagy

R^1

|

–N– képletű csoport, amelyben

R^1 jelentése hidrogénatom, 1–4 szénatomos alkil-, 3–6 szénatomos alkenil-, ciano-(1–4 szénatomos alkil)-, fenil-(1–4 szénatomos alkil)- vagy fenilcsoport,

R jelentése 1–7 szénatomos alkil-, 3–6 szénatomos alkenil-, 1–4 szénatomos halogén-alkil-, 2–6 szénatomos alkoxi-alkil-, ciano-(1–4 szénatomos alkil)-, a fenilrészben egy halogénatommal adott esetben szubsztituált fenil-(1–4 szénatomos alkil)-, egy 1–4 szénatomos alkilcsoporttal adott esetben szubsztituált 3–8 szénatomos cikloalkilcsoport, naftilcsoport vagy (c) általános képletű csoport, ebben a képletben

R^2 jelentése hidrogén-, halogénatom, 1–4 szénatomos alkil-, 1–3 szénatomos perfluor-alkil-, 3–6 szénatomos alkenil-, 1–4 szénatomos alkoxi-, nitro-, ciano-, 1–3 szénatomos perfluor-alkil-tio-, fenoxi-, (1–4 szénatomos alkil)-karbonil- vagy N-(1–4 szénatomos alkil)-N-(1–4 szénatomos alkil-szulfonil)-amino-csoport,

R^3 jelentése hidrogén-, halogénatom, 1–4 szénatomos alkil-, 1–3 szénatomos perfluor-alkil-, 1–4 szénatomos alkoxi-, formil-amino-, nitro-, ciano-, 1–3 szénatomos perfluor-alkil-tio-, (1–4 szénatomos alkoxi)-karbonil- vagy di(1–4 szénatomos alkil)-amino-csoport,

R^4 jelentése hidrogén-, halogénatom, 1–12 szénatomos alkil-, 1–3 szénatomos perfluor-alkil-, 1–4 szénatomos alkoxi-, 1–3 szénatomos perfluor-alkoxi-, 1–4 szénatomos alkil-tio-, 1–3 szénatomos perfluor-alkil-tio-, 1–4 szénatomos alkil-szulfonil-, amino-szulfonil-, egy vagy két cianocsoporttal adott esetben szubsztituált 2–6 szénatomos alkenil-, fenil-, 3–8 szénatomos cikloalkilcsoport, karbamoil-, (1–4 szénatomos alkil)-karbamoil-, (1–4 szénatomos alkil)-karbonil-, (1–4 szénatomos alkoxi)-karbonil-, nitro-, cianocsoport vagy

R^7

/

–N általános képletű csoport, amelyben

\

R^8

R^7 jelentése 1–4 szénatomos alkil-, (1–4 szénatomos alkil)-karbonil-, formil- vagy 1–4 szénatomos alkil-szulfonil-csoport,

R^8 jelentése hidrogénatom vagy 1–4 szénatomos alkilcsoport,

R^5 jelentése hidrogén-, halogénatom, 1–4 szénatomos alkil-, 1–3 szénatomos perfluor-alkil-, 1–4 szénatomos alkoxi- vagy (1–4 szénatomos alkoxi)-karbonil-csoport,

R^6 jelentése hidrogén-, halogénatom, 1–4 szénatomos alkil-, 1–4 szénatomos alkoxi- vagy (1–4 szénatomos alkoxi)-karbonil-csoport, vagy

30 R és R^1 a kapcsolódó nitrogénatommal együtt képezhet – egy vagy két 1–4 szénatomos alkilcsoporttal adott esetben szubsztituált – pirrolil-, pirazolil-, imidazolil-, triazolil-, pirrolidinil-, piperidinil-, perhidroazepinil- vagy morfolinilcsoportot.

35 Az új (I) általános képletű 4-halogén-5-nitro-tiazol-származékokat – a képletben

Hal jelentése halogénatom,

A jelentése oxigén-, kénatom, szulfinil-, szulfonilcsoport, vagy

R^1

|

–N– képletű csoport, amelyben

R^1 jelentése hidrogénatom, 1–4 szénatomos alkil-, 3–6 szénatomos alkenil-, ciano-(1–4 szénatomos alkil)-, fenil-(1–4 szénatomos alkil)- vagy fenilcsoport,

R jelentése 1–7 szénatomos alkil-, 3–6 szénatomos alkenil-, 1–4 szénatomos halogén-alkil-, 2–6 szénatomos alkoxi-alkil-, ciano-(1–4 szénatomos alkil)-, a fenilrészben egy halogénatommal adott esetben szubsztituált fenil-(1–4 szénatomos alkil)-, egy 1–4 szénatomos alkilcsoporttal adott esetben szubsztituált 3–8 szénatomos cikloalkilcsoport, naftilcsoport vagy (c) általános képletű csoport, ebben a képletben

R^2 jelentése hidrogén-, halogénatom, 1–4 szénatomos alkil-, 1–3 szénatomos perfluor-alkil-, 3–6 szénatomos alkenil-, 1–4 szénatomos alkoxi-, nitro-, ciano-, 1–3 szénatomos perfluor-alkil-tio-, fenoxi-, (1–4 szénatomos alkil)- karbonil-

- vagy N-(1-4 szénatomos alkil)-N-(1-4 szénatomos alkil-szulfonil)-amino-csoport,
- R³** jelentése hidrogén-, halogénatom, 1-4 szénatomos alkil-, 1-3 szénatomos perfluor-alkil-, 1-4 szénatomos alkoxi-, formil-amino-, nitro-, ciano-, 1-3 szénatomos perfluor-alkil-tio-, (1-4 szénatomos alkoxi)-karbonil- vagy di(1-4 szénatomos alkil)- amino-csoport,
- R⁴** jelentése hidrogén-, halogénatom, 1-12 szénatomos alkil-, 1-3 szénatomos perfluor-alkil-, 1-4 szénatomos alkoxi-, 1-3 szénatomos perfluor-alkoxi-, 1-4 szénatomos alkil-tio-, 1-3 szénatomos perfluor-alkil-tio-, 1-4 szénatomos alkil-szulfonil-, amino-szulfonil-, egy vagy két cianocsoporttal adott esetben szubsztituált 2-6 szénatomos alkenil-, fenil-, 3-8 szénatomos cikloalkilcsoport, karbamoil-, (1-4 szénatomos alkil)-karbamoil-, (1-4 szénatomos alkil)-karbonil-, (1-4 szénatomos alkoxi)-karbonil-, nitro-, cianocsoport vagy
- R⁷**
/
-N általános képletű csoport, amelyben
\
R⁸
- R⁷** jelentése 1-4 szénatomos alkil-, (1-4 szénatomos alkil)-karbonil-, formil- vagy 1-4 szénatomos alkil-szulfonil-csoport,
- R⁸** jelentése hidrogénatom vagy 1-4 szénatomos alkilcsoport,
- R⁵** jelentése hidrogén-, halogénatom, 1-4 szénatomos alkil-, 1-3 szénatomos perfluor-alkil-, 1-4 szénatomos alkoxi- vagy (1-4 szénatomos alkoxi)-karbonil-csoport,
- R⁶** jelentése hidrogén-, halogénatom, 1-4 szénatomos alkil-, 1-4 szénatomos alkoxi- vagy (1-4 szénatomos alkoxi)-karbonil-csoport, vagy
- R és R¹** a kapcsolódó nitrogénatommal együtt képezhet – egy vagy két 1-4 szénatomos alkilcsoporttal adott esetben szubsztituált – pirrolil-, pirazolil-, imidazolil-, triazolil-, pirrolidinil-, piperidinil-, perhidroazepinil- vagy morfolinilcsoportot, úgy állítjuk elő, hogy
- a) az A helyén oxigénatomot, kénatomot, SO₂ képletű csoportot vagy NR¹ általános képletű csoportot tartalmazó vegyületek előállítására a (II) általános képletű 2,4-dihalogén-5-nitro-tiazol-származékot – a képletben Hal és Hal¹ jelentése azonos vagy különböző halogénatom – a (III) általános képletű nukleofil vegyülettel – a képletben R jelentése a megadott és
- A'** jelentése oxigénatom, kénatom, SO₂ képletű csoport vagy NR¹ általános képletű csoport – a képletben R¹ jelentése a megadott –
- vagy fémsóval képzett származékával reagáltatjuk savmegkötőszer jelenlétében, valamint hígítószer jelenlétében, vagy
- b) az olyan (I) általános képletű vegyületek előállítására, amelyeknek képletében az A-R molekuláris jelentése (a) általános képletű csoport, a (II) általános képletű 2,4-dihalogén-5-nitro-tiazol-származékot a
- (IV) általános képletű N,N-dimetil-aril-aminnal – a képletben Aril jelentése az R jelentésénél megadott arilcsoportok – reagáltatjuk hígítószer jelenlétében, vagy
- 5 c) az A helyén SO₂ vagy SO képletű csoportot tartalmazó vegyületek előállítására az (V) általános képletű 4-halogén-5-nitro-tiazolil-szulfidot – a képletben Hal és R jelentése a megadott –
- α) legalább 2 mól oxidálószerrel reagáltatjuk a reakciókörülmények között inert hígítószer jelenlétében, illetve
- β) 1 mól oxidálószerrel reagáltatjuk a reakciókörülmények között inert hígítószer jelenlétében.
- Azt tapasztaltuk, hogy az új (I) általános képletű 4-halogén-5-nitro-tiazol-származékok erős hatásúak a növényvédelemben előforduló gombákkal és a műszaki anyagoknál előforduló mikrobákkal szemben.
- Meglepő módon a találmányunk szerinti (I) általános képletű 4-halogén-5-nitro-tiazol-származékok többek között lényegesen jobb fungicid hatásúak a növényvédelemben, mint a technika állása szerint ismert kereskedelmi termék a kaptán [N-(triklór-metil-tio)-tetrahidroftálimid] és az euparen [N,N-dimetil-N'-fenil-N'-(fluor-diklór-metil-tio)-szulfamid] vagy a kurzát [2-ciano-N-(etil-amino-karbonil)-2-(metoximino)-acetamid], amelyek hatás szempontjából a találmány szerinti vegyületekhez közeleső vegyületek; ezenkívül a találmány szerinti vegyületek lényegesen jobb mikrobicid hatásúak az anyagvédelemben, mint az ismert 4-benzimidazol-2-il-tiazol.
- A találmányunk értelmében az egyes szubsztituensek jelentését a következőkben pontosítjuk:
- A halogénatom, amennyiben másként nem adjuk meg, fluor-, klór-, bróm- vagy jódatomot jelent.
- Az alkilcsoport R jelentésében egyenes vagy elágazó szénláncú. Példaként megemlítjük a metil-, az etil-, a propil-, az izopropil-, a butil-, az izobutil-, a terc-butil-, a pentil-, az izopentil-, a hexil-, az izohexilcsoportot.
- Az alkenilcsoportot R jelentésében egyenes vagy elágazó szénláncú, 3-6 szénatomos csoport, és egy kettőskötést tartalmaz. Példaként megemlítjük az allil-, a propenil-, az izopropenil-, a butenil-, az izobutenil-, a pentenil-, az izopentenil-, a hexenilcsoportot.
- A cikloalkilcsoport R jelentésében 3-8 szénatomos. Előnyös a ciklopropil-, a ciklopentil- és a ciklohexilcsoport. Példaként megemlítjük a ciklopropil-, a ciklopentil-, a ciklohexil-, a cikloheptil- és a ciklooktilcsoportot.
- A halogén-alkil-csoport R jelentésében egyenes vagy elágazó szénláncú, 1-4 szénatomos alkilcsoportot és egy vagy több halogénatomot tartalmaz. Példaként megemlítjük a következőket: fluor-metil-, klór-metil-, bróm-metil-, fluor-etil-, klór-etil-, bróm-etil-, fluor-propil-, klór-propil-, bróm-propil-, fluor-butil-, klór-butil-, bróm-butil-, fluor-izopropil-, klór-izopropil-, bróm-izopropil-, difluor-metil-, trifluor-metil-, diklór-metil-, triklór-metil-, difluor-etil-, diklór-etil-, trifluor-etil-, tetrafluor-etil-, pentafluor-etil-, triklór-etil-, trifluor-propil-csoport. Különösen előnyös a trifluor-metil-, a difluor-metil-, a klór-metil- és a trifluor-etil-csoport.

Az alkoxi-alkil-csoportok alkilrészenként 1–4 szénatomos egyenes vagy elágazó szénláncú szénhidrogén-csoportok, amelyek összesen legfeljebb 6 szénatomot tartalmaznak. Példaként megemlítjük a következőket: metoxi-metil-, metoxi-etil-, metoxi-propil-, metoxi-butil-, etoxi-metil-, etoxi-etil-, etoxi-propil-, etoxi-butil-, propoxi-metil-, propoxi-etil-, propoxi-propil-, butoxi-metil-, butoxi-etil-csoport.

A találmány szerinti 4-halogén-5-nitro-tiazol-származékokat az (I) általános képlet ábrázolja. Előnyösek azok az (I) általános képletű vegyületek, amelyeknek képletében

Hal jelentése fluor-, klór-, bróm- vagy jódatom,

A jelentése oxigénatom, kénatom, SO, SO₂ képletű csoport, vagy NR¹ általános képletű csoport – a képletben

R¹ jelentése hidrogénatom, 1–4 szénatomos alkil-, 3–5 szénatomos alkenil-, az alkilrészben 1–2 szénatomos ciano-alkil- vagy fenilcsoport – és

R jelentése 1–6 szénatomos alkil-, 3–6 szénatomos alkenil-, legfeljebb 4 szénatomos és 1–10 azonos vagy különböző halogénatomot tartalmazó halogén-alkil-, alkilrészenként 1–4 szénatomos, összesen legfeljebb 6 szénatomot tartalmazó alkoxi-alkil-, ciano-(1–4 szénatomos-alkil)-csoport, 3–8 szénatomos cikloalkilcsoport, vagy a megadott módon helyettesített (c) általános képletű fenilcsoport, vagy R és R^{1a} közbezárt nitrogénatommal együtt pirrolil-, pirazolil-, imidazolil-, triazolil-, pirrolidinil-, piperidinil-, perhidroazepinil- vagy morfolinilcsoport, amely adott esetben egyszeresen vagy kétszeresen 1–4 szénatomos alkilcsoporttal lehet helyettesítve. Különösen előnyösek azok az (I) általános képletű vegyületek, amelyeknek képletében

Hal jelentése klór-, bróm- vagy jódatom,

A jelentése oxigén- vagy kénatom, SO, SO₂ képletű csoport, vagy NR¹ általános képletű csoport – a képletben

R¹ jelentése hidrogénatom, 1–4 szénatomos alkil- vagy fenilcsoport, és

R jelentése 1–4 szénatomos alkil-, 3–6 szénatomos alkenil-, az alkilrészben 1–3 szénatomos ciano-alkil-, 3–6 szénatomos cikloalkilcsoport vagy a megadott módon helyettesített (c) általános képletű fenilcsoport, vagy

R és R¹ jelentése nitrogénatommal együtt adott esetben egyszeresen vagy kétszeresen, 1–2 szénatomos alkilcsoporttal helyettesített pirrolidinil-, piperidinil-, morfolinil-, pirrolil-, pirazolil- vagy imidazolil-csoportot alkot.

Rendkívül előnyösek azok az (I) általános képletű vegyületek, amelyeknek (I) általános képletében

Hal jelentése halogénatom és az

A–R képletű molekularész jelentése SR általános képletű csoport – a képletben

R jelentése 1–6 szénatomos alkil-, 3–6 szénatomos alkenil- vagy 3–8 szénatomos cikloalkilcsoport, vagy a megadott módon helyettesített (c) általános képletű fenilcsoport,

vagy az A–R képletű molekularész jelentése SO_nR általános képletű csoport – a képletben

n értéke 1 vagy 2 és

R jelentése 1–6 szénatomos alkil-, 3–6 szénatomos alkenil- vagy 3–8 szénatomos cikloalkilcsoport, vagy a megadott módon helyettesített (c) általános képletű fenilcsoport,

vagy az A–R képletű molekularész jelentése NH–R általános képletű csoport – a képletben

R jelentése 1–6 szénatomos alkil-, 3–6 szénatomos alkenil- vagy 3–8 szénatomos cikloalkilcsoport, vagy a megadott módon helyettesített (c) általános képletű fenilcsoport.

A találmány szerinti a) eljárásban kiindulási vegyületeként 2,4-diklór-5-nitro-tiazolt és anilint alkalmazunk, a reakció az a) reakcióvázlat szerint megy végbe.

A találmány szerinti b) eljárásban kiindulási vegyületeként 2,4-diklór-5-nitro-tiazolt és N,N-dimetil-anilint alkalmazunk, a reakció a b) reakcióvázlat szerint megy végbe.

A találmány szerinti c) eljárás α) változatában kiindulási vegyületeként 4-klór-2-(4-metil-fenil-merkaptó)-5-nitro-tiazolt és 2 mól 3-klór-peroxi-benzoetsavat alkalmazunk, a reakció a c₁) reakcióvázlat szerint megy végbe.

A találmány szerinti c) eljárás β) változata szerint kiindulási vegyületeként 4-klór-2-(4-metil-fenil-merkaptó)-5-nitro-tiazolt és 1 mól 3-klór-peroxi-benzoetsavat alkalmazunk oxidálószerként, a reakció a c₂) reakcióvázlat szerint megy végbe.

A találmány szerinti a) eljárásban kiindulási vegyületeként alkalmazott 2,4-dihalogén-5-nitro-tiazol-származékokat a (II) általános képlet ábrázolja. A vegyületek részben ismertek, például az olyan (II) általános képletű vegyületek, amelyeknek képletében

Hal = Hal¹ = brómatom, ismertek a Chem. Abst. 61: 3087 f irodalmi helyről és az olyan vegyületeknek, amelyeknek képletében

Hal = Hal¹ = klóratom, ismertek a 3518520 számú német szövetségi köztársaságbeli közrebozsítási iratból.

Mindkét említett vegyületet előállíthatjuk például a megfelelő 2,4-dihalogén-tiazol-származéknak a nitrálásával.

A (IIA) általános képletű vegyületek, amelyeknek képletében Hal¹ és Hal¹ egymástól függetlenül klór-, jód- vagy fluoratomot jelent, azzal a kikötéssel, hogy a két halogén szubsztituens egyszerre nem jelenthet klóratomot, újak. Megfelelő felhasználási mennyiségnél ezek a vegyületek is mikrobicid hatásúak.

Azok a (IIA) általános képletű vegyületek, amelyek képletében

Hal¹ = Hal¹ = jódatom, vagy

Hal¹ = klóratom és Hal¹ = jódatom, vagy

Hal¹ = jódatom és Hal¹ = klóratom vagy

Hal¹ = klóratom és Hal¹ = fluoratom

például újak. A jódvegyületeket előállíthatjuk a 2,4-diklór-5-nitro-tiazolból fém-jodidokkal, különösen nátrium-jodiddal, rövid szénláncú alifás ketonokban, különösen acetonban, mint oldószerben a d₁) és a d₂) reakcióvázlat szerint.

A reakcióban mindkét izomer klór-jód-nitro-tiazol keletkezik és ezeket frakcionált kristályosítással és/vagy kromatográfiával választhatjuk el egymástól. A reakcióhőmérséklet általában 0 °C és 130 °C, előnyösen 10 °C és 90 °C közötti.

Azok a (IIA) általános képletű vegyületek, amelyeknek képletében a két halogénatom közül legalább az egyik fluoratom, például Hal' = fluor és Hal' = klór, azaz a 4-klór-2-fluor-5-nitro-tiazol-származékok, úgy állíthatók elő, hogy a 2,4-diklór-5-nitro-tiazolt fém-fluoridokkal, különösen nátrium-fluoriddal vagy kálium-fluoriddal reagáltatjuk rövid szénláncú alifás nitrilben, különösen acetonnitrilben vagy propionitrilben, mint oldószerben, katalitikus mennyiségű koronaéretté, különösen [18] Krone-6 (1, 4, 7, 10, 13, 16-hexaoxaciklo-oktadecán jelenlétében. A reakcióhőmérséklet 0 °C és 50 °C, előnyösen 10 °C és 30 °C közötti. Általában 2–15 mól fém-fluoridot, előnyösen 3,12 mól fém-fluoridot használunk 1 mól 2,4-diklór-5-nitro-tiazolra számítva.

A találmány szerinti a) eljárásban szintén kiindulási vegyületeként alkalmazott nukleofil vegyületeket a (III) általános képlet ábrázolja. Ha nem speciális vegyületekről van szó, ismert módon állíthatók elő.

A találmány szerinti a) eljárásban a következő oldószereket alkalmazhatjuk: alifás nitrilek, különösen acetonnitril, alifás karbonsavaknak nyílt szénláncú vagy ciklusos dialkil-amid-származékai, így dimetil-formamid, N,N-dimetil-acetamid, továbbá N-metil-2-pirrolidinon, N-metil-kaprolaktám, tetrametil-karbamid, N,N-dimetil-1,3-imidazolin-2-on, hexametil-foszfoszav-triszamid, dimetil-szulfoxid, dimetil-szulfon, tetrametilen-szulfon (= szulfolán), tetrahidrofuran, dioxán, valamint rövid szénláncú alifás alkoholok, különösen fémsóik, különösen alkálifémsóik formájában.

Előnyösen ciklusos étereket, így dioxánt alkalmazunk és mindenekelőtt aprotikus, poláros oldószereket, így dimetilformamidot és N-metil-2-pirrolidinont, valamint acetonnitrilt használunk.

Az oldószert a (III) általános képletű nukleofil vegyület természetétől függően választjuk meg. Ha a nukleofil vegyületet vagy fémsóját előnyösen alkálifémsóját vizes oldatként (így például nátrium-hidroxid-oldatban vagy metil-aminban) alkalmazzuk, használhatunk vízből és a felsorolt oldószerek egyikéből álló vegyes rendszert.

A gyengén bázisos aminokat, így például a pirrolt, pirazolt, difenil-amint vagy negatív szubsztituenssel, így például nitro- vagy trifluor-metil-csoporttal helyettesített anilin-származékokat különösen előnyösen aprotikus, poláros oldószerekkel, így dimetil-formamiddal vagy N-metil-2-pirrolidinonnal reagáltathatjuk, míg az erős bázisokat, így például az alifás aminokat, így például a dietil-amint vagy a morfolint dioxánban, illetve acetonnitrilben is gyorsan átalakíthatjuk.

A találmány szerinti a) eljárásban a reakcióhőmérséklet széles határok között változhat. Általában –50 °C és +150 °C, előnyösen –20 °C és 100 °C közötti hőmérsékleten dolgozunk.

Az erős nukleofil vegyületek már a megadott hőmérséklettartomány alsó határértékénél is gyorsan reagálnak, míg a gyenge nukleofil vegyületek magasabb hőmérsékletet és hosszabb reakcióidőt kívánnak meg.

A reakciókat általában normál nyomáson folytatjuk le, dolgozhatunk azonban zárt edényben is, ebben az esetben az oldószertől és az alkalmazott hőmérséklettől függően magasabb hőmérsékletet is alkalmazhatunk.

A találmány szerinti a) eljárásban a reakcióvázlatnak megfelelően képződő hidrogén-halogenidek megkötésére általában savmegkötőszert szükséges. Ilyenek például az alkálifém-hidroxidok, -karbonátok és -hidrogén-karbonátok.

A savmegkötőszerek helyett alkalmazhatjuk közvetlenül a megfelelő (III) általános képletű nukleofil vegyület fémsóját, előnyösen alkálifémsóját is. A sókat vagy sókként visszük be, vagy pedig alkálifém-hidridekkel, előnyösen nátrium-hidriddel in situ állítjuk elő.

Ha a bevitt nukleofil vegyületek erősen bázisos aminok, így például dietil-amin, megfelelő feleslegben alkalmazhatjuk a nukleofil vegyületet is savmegkötőszerként. Gyengén bázisos aminok esetén, így például anilinnél, amelyek aprotikus, erősen poláros oldószerben, így dimetil-formamidban vagy N-metil-2-pirrolidinonban reagáltatunk, savmegkötőszert nélkül vagy a nukleofil vegyület feleslege nélkül is jó kitermeléssel kapjuk az (I) általános képletű vegyületet.

A nagyon gyenge (III) általános képletű nukleofil vegyületeket, például a kétszeresen vagy többszörösen negatív szubsztituenssel helyettesített anilin-származékokat, különösen azokat, amelyek az aminocsoporthoz képest orthohelyzetben tartalmazzák a negatív szubsztituenszt, célszerűen éterekben, különösen ciklusos éterekben, így például tetrahidrofuranban vagy dioxánban reagáltatjuk fém-hidridek, előnyösen nátrium-hidrid adagolásával és így képezzük in situ a sókat.

A reakciópartnereket általában sztöchiometrikusan ekvimoláris mennyiségben alkalmazzuk erősen bázisos aminok esetén, amelyek egyidejűleg savmegkötőszerként is szolgálnak, kétszeres moláris mennyiséget alkalmazunk.

Olyan (II) általános képletű 2,4-dihalogén-5-nitro-tiazol-származékok esetén, amelyek a 4-es helyzetben egy második halogénatomot is tartalmaznak – ha ez lényegesen kevésbé reakcióképes is – általában célszerű, ha a (III) általános képletű nukleofil vegyületet nem alkalmazzuk feleslegben. Bizonyos esetekben előnyös azonban, ha a (II) általános képletű 2,4-dihalogén-5-nitro-tiazol-származékot feleslegben alkalmazzuk, amely 20-tól 100 mól%-ig terjedhet. Gyengén nukleofil (III) általános képletű vegyületeknél, amelyek a tiazolgyűrű 2-es helyzetében lévő lényegesen reakcióképesebb halogénatommal csak viszonylag lassan reagálnak, ezzel szemben a (III) általános képletű nukleofil vegyületet feleslegben alkalmazzuk, amely 100 mól%-ig is terjedhet.

A találmány szerinti a) eljárásban a (II) általános képletű 2,4-dihalogén-5-nitro-tiazol-származékot előnyösen a megadott oldószerek egyikébe visszük, majd adott esetben hozzáadjuk a savmegkötőszert. Ezután

szobahőmérsékleten vagy ennél alacsonyabb hőmérsékleten, előnyösen -15°C -ig terjedő hőmérsékleten, lassan, kis részletekben, például oldatban vagy hígító-szerben beadagoljuk a (III) általános képletű nukleofil vegyületet. Ezzel a lassú beadagolással elkerüljük a (II) általános képletű 2,4-dihalogén-5-nitro-tiazol-származékkal végbemenő reakció során a (III) általános képletű nukleofil vegyület feleslegét és így gyakorlatilag kizárjuk a nem kívánt, kétszeresen helyettesített termékek keletkezésének a lehetőségét.

Ha a reakcióban a végső reakcióhőmérséklet szobahőmérséklet feletti kell legyen, a reakcióelegyet melegítjük.

A reakciótermékeket ismert módon izoláljuk. A legegyszerűbb esetben a reakcióelegyből az oldószert részben vagy teljesen ledesztilláljuk vákuumban, majd a reakcióhőmérsékletnél alacsonyabb hőmérsékleten a visszamaradó anyagot feleslegben alkalmazott jeges vízbe, mintegy az alkalmazott oldószernak megfelelő 5–10-szeres megfelelő térfogattal mennyiségű jeges vízbe keverjük be, szűrjük, vízzel mossuk és szárítjuk. Ha a 2,4-dihalogén-5-nitro-tiazolt feleslegben alkalmazzuk, ezt a szárított nyerstermékből szobahőmérsékleten olyan oldószereken való elkeveréssel oldjuk ki, amely gyakorlatilag csak a (II) általános képletű 2,4-dihalogén-5-nitro-tiazol-származékot oldja, és adott esetben ezt a későbbiekben ismét felhasználjuk. A 2,4-diklór-5-nitro-tiazol-származékok esetén például különösen jól alkalmazható ilyen célra a petroléter. Ha a reakció terméke, amely még tartalmazza a feleslegben lévő (II) általános képletű 2,4-dihalogén-5-nitro-tiazol-származékot, maga is jól oldódik szobahőmérsékleten petroléterben, akkor a (II) általános képletű 2,4-dihalogén-5-nitro-tiazol-származékot például vákuumban, mintegy 0,1 mbar nyomáson frakcionáltan kiszublimáljuk, illetve ledesztilláljuk az általában lényegesen kevésbé illékony reakcióterméktől. A 2,4-diklór-5-nitro-tiazol-származék esetén ez például mintegy 70°C hőmérsékleten és 0,1 mbar nyomáson lehetséges. A reakciótermék további tisztítását végezhetjük például átkristályosítással vagy kromatográfián.

Ha a reakció terméke a feleslegben alkalmazott jeges vízzel való eldörzsölés következtében olajként válik ki, ezt az olajat egy szokásos, vízzel nem elegyedő oldószernel, például metilén-kloriddal való kirázással izoláljuk, a szerves fázist elválasztjuk, adott esetben vízzel mossuk, például dimetil-formamid vagy N-metil-2-pirrolidinon reakcióelegy esetén vákuumban szárítjuk.

A találmány szerinti b) eljárásban kiindulási vegyületként alkalmazott (IV) általános képletű N,N-dimetil-aril-aminok lényegében ismertek. Ha még egyes vegyületeket nem írtak le, ezek is ismert eljárások szerint állíthatók elő.

A (IV) általános képletben Aril jelentése azonos az (I) általános képletű vegyületek R szubsztituensnél megadott arilszubsztituensekkel.

A találmány szerinti b) eljárásban oldószerként a következőket alkalmazzuk: alifás vagy aromás nitrilek, például acetonitril, propionitril, benzonitril, különösen

acetonitril, éterek, különösen ciklusos éterek, így dioxán, tetrahidrofurán, különösen dioxán.

A találmány szerinti b) eljárásban a reakcióhőmérséklet széles határok között változhat. Általában 50°C és 200°C , előnyösen 60°C és 150°C közötti hőmérsékleten dolgozunk.

A reakciót általában normál nyomáson folytatjuk le, dolgozhatunk azonban zárt edényben is, ilyen esetekben az oldószertől és a hőmérséklettől függően megfelelően magasabb nyomáson is dolgozhatunk.

A reakciópartnereket általában előnyösen sztöchiometrikusan ekvimoláris mennyiségben reagáltatjuk egymással.

A találmány szerinti b) eljárásban a (II) általános képletű 2,4-dihalogén-5-nitro-tiazol-származékot előnyösen az említett oldószerekben oldjuk, előnyösen hozzáadjuk az N,N-dimetil-aril-amin mintegy ekvimoláris mennyiségét és addig melegítjük előnyösen visszafolytatás közben, míg a reakció gyakorlatilag befejeződik. Ezután az oldószert előnyösen vákuumban ledesztilláljuk és kívánt esetben a terméket például átkristályosítással tisztítjuk.

A találmány szerinti c) eljárásban kiindulási vegyületként alkalmazott találmány szerinti 4-halogén-5-nitro-tiazol-szulfidokat az (V) általános képlet ábrázolja. Ebben a képletben Hal és R előnyösen az (I) általános képletből megadott előnyös szubsztituenseket jelenti.

A találmány szerinti c) eljárásban oxidálószerként a szokásos reagenseket alkalmazzuk. Előnyösek az alifás és aromás perkarbonsavak, így például perecetsav, a perpropionsav, a 3-klór-perbenzoesav. Különösen előnyösen 3-klór-perbenzoesavat alkalmazunk.

A találmány szerinti c) eljárásban oldószerként a szokásos inert, szerves oldószereket alkalmazzuk. Előnyösen diklór-metánt, triklór-metánt és széntetrakloridot használunk.

A találmány szerinti c) eljárásban a reakcióhőmérséklet széles határok között változhat. Általában 0°C és 100°C , előnyösen 20°C és 80°C közötti hőmérsékleten dolgozunk.

A találmány szerinti c) eljárás α) változata szerint az (V) általános képletű 4-halogén-5-nitro-tiazolil-szulfidot a felsorolt oldószerek egyikében oldjuk és legalább 2 mól oxidálószerrel, előnyösen a felsorolt perkarbonsavak egyikével elegyítjük, ennek során előnyösen legfeljebb 5 mól oxidálószerrel használunk 1 mól (V) általános képletű vegyületre számítva, és a reakcióelegyet keverjük és például vékonyrétegekromatográfián követjük addig, míg a kívánt átalakulás befejeződik. A reakció meggyorsítása céljából előnyösen visszafolytatási körülmények között dolgozunk.

A találmány szerinti c) eljárás β) változata szerint az (V) általános képletű 4-halogén-5-nitro-tiazolil-szulfidot az említett oldószerek egyikében oldjuk és a nem kívánt szulfonképződés elkerülése céljából a reakcióhőmérséklet alsó határánál, például szobahőmérsékleten kis részletekben elegyítjük az oxidálószerrel, előnyösen perkarbonsavval és a reakciót vékonyrétegekromatográfián követjük. Az oxidálószernek, például a perkarbonsavnak az összmennyisége előnyö-

sen 1–1,5 mól 1 mól (V) általános képletű vegyületre számítva. Mivel a reakció alacsonyabb hőmérsékleten, például szobahőmérsékleten természetesen viszonylag lassabban megy végbe, a vékonyrétegekromatográfiás követés segítségével több mint 1 mól perkarbonsavnak 1 mól (V) általános képletű vegyületre számított alkalmazása esetén a reakciót leállíthatjuk azelőtt, mielőtt lényeges mennyiségű nem kívánt szulfon keletkezne.

A szulfonokat, illetve a szulfoxidokat ismert módon izoláljuk. Az oldószert vákuumban eltávolítjuk, a visszamaradó anyagot például a (per)karbonsav eltávolítása céljából szobahőmérsékleten feleslegben alkalmazott mennyiségű vizes nátrium-hidrogén-karbonát-oldattal keverjük el, a reakcióelegyet szűrjük, vízzel mossuk, szárítjuk és adott esetben például fémhidrogénekből, így hexánból átkristályosítjuk.

A találmány szerinti (I) általános képletű hatóanyagok erős hatásúak a kártevőkkel szemben és alkalmazhatók a nem kívánt káros organizmusok leküzdésére a gyakorlatban. A hatóanyagok alkalmazhatók a növényvédelemben, mindenekelőtt fungicid készítményekben, ezenkívül alkalmazhatók műszaki anyagok védelmére mikrobák, például gombák, baktériumok és nyákorganizmusok esetén.

A fungicid készítményeket a növényvédelemben a Plasmodiophoromycetes, Oomycetes, Chytridimycetes, Zygomycetes, Ascomycetes, Basidiomycetes, Deuteromycetes ellen alkalmazhatjuk.

A baktericid készítményeket a növényvédelemben a Pseudomonadaceae, Rhizobiaceae, Enterobacteriaceae, Corynebacteriaceae és Streptomycetaceae ellen alkalmazzuk.

Példaként, de nem korlátozó értelemben megemlítjük az előzőekben felsorolt meghatározások alá eső, gombás és bakteriális fertőzéseket okozó kórokozókat: *Xanthomonas*-fajták, így például *Xanthomonas Camperstris* pv. *oryzae*;

Pseudomonas-fajták, így például *Pseudomonas syringae* pv. *lachrymans*;

Erwinia-fajták, így például *Erwinia amylovora*;

Pythium-fajták, így például *Pythium ultimum*;

Phytophthora-fajták, így például *Phytophthora infestans*;

Pseudoperonospora-fajták, így például *Pseudoperonospora humuli* vagy *Pseudoperonospora cubensis*;

Plasmopara-fajták, így például *Plasmopara viticola*;

Peronospora-fajták, így például *Peronospora pisi* vagy *P. brassicae*;

Erysiphe-fajták, így például *Erysiphe graminis*;

Sphaerotheca-fajták, így például *Sphaerotheca fuliginea*;

Podosphaera-fajták, így például *Podosphaera leucotricha*;

Venturia-fajták, így például *Venturia inaequalis*;

Pyrenophora-fajták, így például *Pyrenophora teres* vagy *P. graminea*, (Konídium-forma; Drechslera, Szin; Helminthosporium);

Cochliobolus-fajták, így például *Cochliobolus sativus* (Konídiumforma; Drechslera, Szin; Helminthosporium);

Cochliobolus-fajták, így például *Cochliobolus sativus*,

(Konídiumforma; Drechslera, Szin; Helminthosporium);

Uromyces-fajták, így például *Uromyces appendiculatus*;

5 *Puccinia*-fajták, így például *Puccinia recondita*;

Tilletia-fajták, így például *Tilletia caries*;

Ustilago-fajták, így például *Ustilago nuda* vagy *Ustilago avenae*;

Pellicularia-fajták, így például *Pellicularia sasakii*;

10 *Pyricularia*-fajták, így például *Pyricularia oryzae*;

Fusarium-fajták, így például *Fusarium culmorum*;

Botrytis-fajták, így például *Botrytis cinerea*;

Septoria-fajták, így például *Septoria nodorum*;

15 *Leptosphaeria*-fajták, így például *Leptosphaeria nodorum*;

Cercospora-fajták, így például *Cercospora canescens*;

Alternaria-fajták, így például *Alternaria brassicae*;

Pseudocercospora-fajták, így például *Pseudocercospora herpotrichoides*.

20 A hatóanyagokat a növények a növényi fertőzések leküzdéséhez szükséges koncentrációban jól elviselik és így kezelhetők a hatóanyagokkal a föld feletti növényi részek, a növényi magvak, a vetőmagvak és a talaj is.

25 A találmány szerinti hatóanyagok különösen jó hatással alkalmazhatók a növények, zöldségek és gabonák fertőzéseinek, így például az almafavarasodás kórokozója (*Venturia inaequalis*) ellen, a paradicsom barna rothadásának kórokozója (*Phytophthora infestans*) kórokozója ellen, a szőlő megbetegedéseinek a kórokozója (*Plasmopara viticola*) ellen és a gabonák fertőzéseinek a kórokozói ellen, így például a *Leptosphaeria nodorum*, a *Fusarium nivale* és a *Pyrenophora teres* esetén. Megemlítjük még a rizsfoltosodás kórokozójával (*Pyricularis oryzae*) szembeni hatást és a széles in vitro hatást. Megfelelő felhasználási koncentráció esetén sok találmány szerinti hatóanyag baktericid hatású is.

40 A hatóanyagokat a szokásos készítményekké formálhatjuk. Ilyenek az oldatok; az emulziók, a szuszpenziók, a porok, a habok, a paszták, a granulátumok, az aeroszolok, valamint polimer anyagokba és vetőmagoknál alkalmazott anyagokba ágyazott kapszulázott készítmények, továbbá az ULV-készítmények.

45 A készítményeket ismert módon állítjuk elő, például úgy, hogy a hatóanyagokat kötőanyagokkal, azaz folyékony oldószerekkel, nyomás alatt cseppfolyósított gázokkal és/vagy szilárd hordozóanyagokkal keverjük össze, adott esetben felületaktív anyagok, azaz emulgeálószeres és/vagy diszpergálószeres és/vagy habképzőszeres egyidejű alkalmazásával.

Ha kötőanyagként vizet használunk, segédoldószerként például szerves oldószereket alkalmazunk.

55 A folyékony oldószerek a következők lehetnek; aromás szénhidrogének – így xilol, toluol vagy alkil-naftalinok –, klórozott aromás vagy alifás szénhidrogének – így klór-benzol, klór-etilén, metilén-klorid –, alifás szénhidrogének – így ciklohexán vagy paraffinok, például ásványi olaj frakciók, ásványi vagy növényi olajok –, alkoholok – így butanol vagy glikol –, valamint

ezek étereí és észtereí, ketonok – így acetón, metil-etil-keton, metil-izobutil-keton vagy ciklohexanon –, erősen poláros oldószerek – így dimetil-formamid vagy dimetil-szulfoxid –, valamint víz.

A cseppfolyósított gáz hígítószerke vagy hordozóanyagok olyan folyadékok, amelyek normál nyomáson és hőmérsékleten gázhalmazállapotúak, így például a halogénezett szénhidrogének, valamint a bután, a propán, a nitrogén és a szén-dioxid.

A szilárd hordozóanyagok például a következők lehetnek; természetes közetlisztek – így kaolin, agyag, talkum, kréta, kvarc, attapulgit, montmorillonit vagy diatomaföld –, szintetikus lisztfinomságú őrlt anyagok – így nagydiszperzitású kovásv, alumínium-oxid és szilikátok. Granulátumoknál alkalmazott szilárd hordozóanyagok lehetnek a következők; őrlt és osztályozott természetes anyagokból készült lisztek – így kalcit, márvány, horzsakő, szepiolit, dolomit –, valamint szerves és szerves lisztfinomságú őrlt anyagokból készített szintetikus granulátumok, valamint szerves anyagokból – így kukoricaszárból, kókuszdióhéjból vagy dohányzárból – készített granulátumok.

Az emulgeálószerke és/vagy habképzőszerke a következők lehetnek; nem-ionos és anionos emulgeátorok – így poli(oxi-etilén)-zsírsav-észterek, poli(oxi-etilén)-zsíralkohol-éterek, például alkil-aril-poliglikol-éterek, alkil-szulfonátok, alkil-szulfátok, aril-szulfonátok, valamint fehérje-hidrolizátumok.

A diszpergálószere például lignin-szulfít-szennylűg és metil-cellulóz lehet.

A készítmények tartalmazhatnak tapadást fokozó szert is, így például karboxi-metil-cellulózt, természetes vagy szintetikus por alakú, szemcsés vagy latex-formájú polimereket, például gumiarábikumot, poli(vinil-alkohol)-t, poli(vinil-acetát)-ot, valamint természetes foszfolipideket, így például kefalint, lecitint és szintetikus foszfolipideket.

További adalékanyagok lehetnek az ásványi vagy növényi olajok.

Ugyancsak alkalmazhatunk színezékeket, így szerves pigmenteket – például vas-oxidot, titán-oxidot, vas-cian-kéket – és szerves színezékeket – így alizarint, azo- vagy fém-ftalocianin-színezékeket – és nyomokban jelenlévő tápanyagokat – így vas-, mangán-, bór-, réz-, kobalt-, molibdén- vagy cink-sókat.

A készítmények 0,1–95 tömeg%, előnyösen 0,5–90 tömeg% hatóanyagot tartalmaznak.

A találmány szerinti hatóanyagokat a kereskedelmi készítményekben vagy az ezekből készített felhasználásra kész formában kombinálhatjuk más ismert hatóanyagokkal is, így például fungicid, inszekticid, akaricid és herbicid hatóanyagokkal, valamint kombinálhatjuk a hatóanyagokat trágyákkal és egyéb növényi növekedésszabályozó hatóanyagokkal is.

A készítményeket alkalmazhatjuk készítményekként vagy pedig az ezekből előállított felhasználási formákként. Ilyen felhasználási formák a felhasználásra kész oldatok, az emulziós koncentrátumok, az emulziók, a habok, a szuszpenziók, a porozószerke, a paszták, az oldható porok, a granulátumok. A készítményeket a szokásos

módon, például öntéssel, szórással, permetezéssel, habosítással, bekenéssel alkalmazhatjuk. A hatóanyagokat alkalmazhatjuk az Ultra-Low-Volume eljárásban is, vagy pedig a hatóanyag-készítményt vagy pedig magát a hatóanyagot a talajba injektálhatjuk. A készítményekkel kezelhetjük a növények vetőmagvait is.

A növényi részek kezelésénél a hatóanyag-koncentráció a felhasználási formákban széles határok között változhat. Általában 1 és 0,0001 tömeg%, előnyösen 0,5 és 0,001 tömeg%.

A vetőmagvak kezelésénél a hatóanyag mennyisége 0,001–50 g/kg vetőmag, előnyösen 0,01–10 g/kg vetőmag.

A talaj kezelésénél a hatóanyag-koncentráció 0,00001–0,1 tömeg%, előnyösen 0,0001–0,02 tömeg% a hatás helyén.

A találmány szerinti (I) általános képletű hatóanyagok széles hatásspektrumuk alapján műszaki anyagok védelmére is alkalmasak.

Mivel a műszaki anyagokat nagyon sok és különböző mikróbafajta támadhatja meg és károsíthatja, szükség van olyan anyagvédelemre, amely széles hatásspektrumú és sokféle alkalmazásra megfelelő.

A műszaki anyagok a találmány értelmében nem élő anyagok, amelyek a műszaki életben kerülnek alkalmazásra. Ilyen műszaki anyagok, amelyeket a találmány szerinti hatóanyagokkal a mikrobás fertőzésekkel szemben védeni tudunk, például a ragasztók, az enyvek, a papírok, a textiliák, a bőr, a fa, a bevonóanyagok, a műanyagok, a hűtő-kenőfolyadékok és más olyan anyagok, amelyeket mikroorganizmusok támadhatnak meg és bonthatnak le. A találmányunk értelmében a műszaki anyagok közé tartoznak az egyes termelőberendezések részei, például hűtőkörök, amelyekben a mikroorganizmusok szaporodása kárt okozhat. A találmányunk értelmében a műszaki anyagok előnyösen a ragasztók, az enyvek, a papírok és a kartonok, továbbá a bőrök, a fa, a bevonóanyagok, a hűtő-kenőanyagok, és a hűtőfolyadékok.

A műszaki anyagokban lebomlást, illetve változást okozó mikroorganizmusok például lehetnek baktériumok, gombák, élesztők, algák és nyákorganizmusok. A találmány szerinti hatóanyagok előnyösen a gombák, különösen a penészgombák, a fát elszínező és lebontó gombák (Basidiomyceten), valamint a nyákorganizmusok és az algák ellen hatásosak.

Példaként megemlítjük a következő fajokba tartozó mikroorganizmusokat:

Alternaria, így Alternaria tenuis,
Aspergillus, így Aspergillus niger,
Chaetomium, így Chaetomium globosum,
Coniophora, így Coniophora puteana,
Lentinus, így Lentinus tigrinus,
Penicillium, így Penicillium glaucum,
Polyporus, így Polyporus versicolor,
Aureobasidium, így Aureobasidium pullulans,
Sclerophoma, így Sclerophoma pityophila,
Trichoderma, így Trichoderma viride,
Escherichia, így Escherichia coli,
Pseudomonas, így Pseudomonas aeruginosa,
Staphylococcus, így Staphylococcus aureus.

Az alkalmazási területtől függően a találmány szerinti hatóanyagok a szokásos készítményekké, így oldatokká, emulziókká, szuszpenziókká, porokká, pasztákká és granulátumokká alakíthatók.

A készítményeket ismert módon állítjuk elő, például a hatóanyagot kötőanyagokkal, amelyek lehetnek oldószeres és/vagy szilárd hordozóanyagok, való összekeverésével adott esetben felületaktív anyagok, így emulgeátorok és/vagy diszpergálószeres egyidejű alkalmazásával és abban az esetben, ha vizet alkalmazunk kötőanyagként, szerves oldószert, így alkoholt is használunk segédoldószerként.

A hatóanyagoknál alkalmazható folyékony oldószeres lehetnek például a víz, az alkoholok, így a rövid szénláncú alifás alkoholok, előnyösen az etanol és az izopropanol vagy a benzil-alkohol, vagy a ketonok, így az acetone és a metil-etil-keton, a folyékony szénhidrogének, így a benzin frakciók, a halogénezett szénhidrogének, így az 1,2-diklór-etán.

A mikrobicid készítmények a hatóanyagot általában 1–95 tömeg%, előnyösen 10–75 tömeg% mennyiségben tartalmazzák.

A találmány szerinti hatóanyagok felhasználási koncentrációja függ a mikroorganizmustól, valamint annak az anyagnak az összetételétől, amelyet védeni kívánunk.

Az optimális mennyiséget vizsgálatsorozattal határozhatjuk meg. A felhasználási koncentráció általában 0,001–5 tömeg%, előnyösen 0,05–1,0 tömeg%, a védelemre kerülő anyagra vonatkoztatva.

A találmány szerinti hatóanyagokat alkalmazhatjuk más, ismert hatóanyagokkal együtt. Példaként megemlíthetjük a következő hatóanyagokat: benzil-alkohol-mono-(poli)-hemiformál és egyéb formaldehidet lehasító vegyületek, benzimidazolil-metil-karbamátok, tetrametil-tiurám-diszulfid, dialkil-ditiokarbamátok cink-sói, 2,4,5,6-tetraklór-izoftalonitril, tiazolil-benzimidazol, merkaptó-benzitiazol, 2-(tiocianato-metil-tio)-benzitiazol, metilén-bisztiocianát, fenol-származékok, így 2-fenil-fenol, (2,2'-dihidrox-5,5'-diklór)-difenil-metán és 3-metil-4-klór-fenol, szerves ónvegyületek.

Előállítási példák

1. példa

(1) képletű vegyület

(51. számú vegyület) előállítása

12,0 g (0,06 mól) 2,4-diklór-5-nitro-tiazolnak 100 ml dimetil-formamidban készített oldatához 0–5 °C hőmérsékleten mintegy 2 óra alatt hozzáadunk 8,6 g (0,05 mól) 3-bróm-anilinnel 100 ml dimetil-formamidban készített oldatát és a reakcióelegyet a megadott hőmérsékleten keverjük 4 órán át. A kapott reakcióelegyet 1000 ml jeges vízbe keverjük be, a csapadékot kiszűrjük, vízzel mossuk és szárítjuk. A feleslegben lévő 2,4-diklór-5-nitro-tiazol eltávolítására a reakcióelegyet szobahőmérsékleten bekeverjük 80 ml petroléterbe, szűrjük, a petroléterrel mossuk és szárítjuk. Így 16,0 g (95,7%) 2-(3-bróm-fenil-amino)-4-klór-5-nitro-tiazolt kapunk, op.: 191–192 °C (bomlás).

2. példa

(2) képletű vegyület

(52. számú vegyület) előállítása

72,0 g (0,36 mól) 2,4-diklór-5-nitro-tiazolnak 300 ml acetonitrilben készített oldatához hozzáadunk 42 g (0,036 mól) vízmentes kálium-karbonátot. Ezután a reakcióelegyhez 15–20 °C hőmérsékleten mintegy 1,5 óra alatt hozzáadunk 28,2 g (0,3 mól) fenolnak 300 ml acetonitrilben készített oldatát és a reakcióelegyet 0,5 órán át keverjük a megadott hőmérsékleten. A reakcióelegyet ezután 15 percig visszafolyatás közben forraljuk, lehűtjük szobahőmérsékletre, bekeverjük 3 liter jeges vízbe, a csapadékot kiszűrjük, vízzel mossuk és szárítjuk. A feleslegben lévő 2,4-diklór-5-nitro-tiazol eltávolítására a reakcióelegyet mintegy 20 °C hőmérsékleten elkeverjük 500 ml petroléterrel, szűrjük, petroléterrel mossuk és szárítjuk. Így 75,4 g (98,0%) 4-klór-5-nitro-2-fenoxi-tiazolt kapunk, op.: 96 °C (petroléterből).

3. példa

(3) képletű vegyület

(1. sz. vegyület) előállítása

199 g (1 mól) 2,4-diklór-5-nitro-tiazolnak 1 liter di-oxánban készített oldatához 20–30 °C hőmérsékleten mintegy 2 óra alatt hozzáadunk 146 g (2 mól) dietil-amint. A reakcióelegyet 1 éjszakán át hagyjuk szobahőmérsékleten állni, majd bekeverjük 8 liter jeges vízbe, a csapadékot kiszűrjük, vízzel mossuk és szárítjuk. Így 216 g (91,7%) 2-(dietil-amino)-4-klór-5-nitro-tiazolt kapunk, op.: 85 °C (ciklohexánból).

4. példa

(4) képletű vegyület

(5. számú vegyület) előállítása

360 g (1,8 mól) 2,4-diklór-5-nitro-tiazolnak 1,5 liter acetonitrilben készített oldatát 252 g (3,0 mól) nátrium-hidrogén-karbonáttal elegyítjük. A reakcióelegyhez ezután –10 és –15 °C hőmérséklet között mintegy 4,5 óra alatt hozzáadunk 139,5 g (1,5 mól) anilinnel és 1500 ml acetonitrilnek az elegyét és a reakcióelegyet 4 órán át keverjük a megadott hőmérsékleten. A kapott reakcióelegyet 15 liter jeges vízbe keverjük be, a csapadékot leszűrjük, vízzel mossuk és szárítjuk. A felesleges mennyiségű 2,4-diklór-5-nitro-tiazol eltávolítására a reakcióelegyet szobahőmérsékleten elkeverjük 2,4 liter petroléterrel, szűrjük, petroléterrel mossuk és szárítjuk. Így 361,7 g (94,4%) 2-anilino-4-klór-5-nitro-tiazolt kapunk, op.: 186–187 °C (bomlás).

5. példa

(5) képletű vegyület

(3. számú vegyület) előállítása

19,9 g (0,1 mól) 2,4-diklór-5-nitro-tiazolnak 200 ml acetonitrilben készített oldatát keverés közben 10,1 g (0,105 mól) ammónium-karbonáttal elegyítjük és 2 napig szobahőmérsékleten keverjük. A kapott reakcióelegyet bekeverjük 1 liter jeges vízbe, a csapadékot kiszűrjük, vízzel mossuk és szárítjuk. A reagálatlan 2,4-diklór-5-nitro-tiazol eltávolítására a reakcióelegyet

szobahőmérsékleten mintegy 100 ml petroléterrel elkeverjük, szűrjük, petroléterrel mossuk és szárítjuk. Így 12,2 g (68%) 2-amino-4-klór-5-nitro-tiazolt kapunk, op.: 180 °C (bomlás).

6. példa

(6) képletű vegyület

(11. számú vegyület) előállítás

5,0 g (0,025 mól) 2,4-diklór-5-nitro-tiazolnak 50 ml N-metil-2-pirrolidinonban készített oldatát szobahőmérsékleten 4,1 g (0,05 mól) 3-metil-pirazollal elegyítjük. A reakcióelegyet 4 napig hagyjuk szobahőmérsékleten állni, majd bekeverjük 500 ml jeges vízbe, a csapadékot szűrjük, vízzel mossuk és szárítjuk. Így 5,8 g (94,9%) 4-klór-2-(3-metil-1-pirazolil)-5-nitro-tiazolt kapunk, op.: 153 °C.

7. példa

(7) és (8) képletű vegyület

(17. számú vegyület) előállítás

19,9 g (0,1 mól) 2,4-diklór-5-nitro-tiazolnak 200 ml dioxánban készített oldatához 20–25 °C hőmérsékleten lassan hozzácepegtetünk 200 ml (0,2 mól) 1 n vizes nátrium-hidroxid-oldatot. A reakcióelegyet 1 éjszakán át keverjük szobahőmérsékleten, majd 0–5 °C hőmérsékleten tömény sósav-oldattal megsavanyítjuk. A kapott szuszpenziót vákuumban szobahőmérsékleten mintegy 1/4 térfogatára pároljuk be és így összesen 13,3 g (73,7%) 4-klór-2-hidroxi-5-nitro-tiazolt, illetve a képletnek megfelelő dezmotrop keto-alakot kapjuk, op.: 136 °C (bomlás).

8. példa

(9) képletű vegyület

(18. számú vegyület) előállítás

12,0 g (0,06 mól) 2,4-diklór-5-nitro-tiazolnak 50 ml acetonitrilben készített oldatához hozzáadunk 7,0 g (0,051 mól) vízmentes kálium-karbonátot. A reakcióelegyhez ezután 15–20 °C hőmérsékleten mintegy 1/2 óra alatt hozzácepegtetjük 5,35 g (0,05 mól) benzil-ammónium és 50 ml acetonitrilnek az elegyét és a kapott reakcióelegyet 1 órán át keverjük szobahőmérsékleten. Az így kapott reakcióelegyet 15 percig visszafolyatás közben forraljuk, lehűtjük szobahőmérsékletre, bekeverjük mintegy 500 ml jeges vízbe, a csapadékot kiszűrjük, vízzel mossuk és szárítjuk. A felesleges mennyiségű 2,4-diklór-5-nitro-tiazol eltávolítására a reakcióelegyet szobahőmérsékleten 80 ml petroléterbe keverjük be, szűrjük, petroléterrel mossuk és szárítjuk. Így 12,9 g (95,7%) 2-(benzil-amino)-4-klór-5-nitro-tiazolt kapunk, op.: 195–196 °C (bomlás).

9. példa

(10) képletű vegyület

(45. számú vegyület) előállítás

19,9 g (0,1 mól) 2,4-diklór-5-nitro-tiazolnak 100 ml metanolban készített oldatához 0–5 °C hőmérsékleten 1,5 óra alatt hozzácepegtetjük 28,8 g (0,16 mól) 30 t%-os, metanolos nátrium-metanolát-oldatnak és 40 ml metanolnak az elegyét és a reakcióelegyet még

mintegy 1 órán át keverjük szobahőmérsékleten. Az oldószert szobahőmérsékleten vákuumban eltávolítjuk és a visszamaradó anyagot 180 ml 1 n sósav-oldat és 90 ml víz elegyével keverjük el, a csapadékot kiszűrjük, vízzel mossuk és szárítjuk. Így 9,9 g (50,9%) 4-klór-2-metoxi-5-nitro-tiazolt kapunk, op.: 52 °C (petroléterből).

10. példa

(11) képletű vegyület

(67. számú vegyület) előállítás

10,0 g (0,05 mól) 2,4-diklór-5-nitro-tiazolnak 100 ml N-metil-2-pirrolidinonban készített oldatát szobahőmérsékleten 6,7 g (0,1 mól) pirrollal elegyítjük. A kapott reakcióelegyet 5 órán át 70 °C hőmérsékleten melegítjük, majd lehűtjük szobahőmérsékletre és bekeverjük 1 liter jeges vízbe. A keletkező csapadékot kiszűrjük, vízzel mossuk és szárítjuk. Így 8,25 g (72%) 4-klór-5-nitro-2-(1-pirrolil)-tiazolt kapunk, op.: 138–139 °C (sárga tűkristályok toluolból).

11. példa

(12) képletű vegyület

(18. számú vegyület) előállítás

99,5 g (0,5 mól) 2,4-diklór-5-nitro-tiazolnak 1000 ml acetonitrilben készített oldatához –10 °C és 0 °C közötti hőmérsékleten lassan hozzácepegtetünk 48,6 g (0,5 mól) 31,9 t%-os vizes metil-amin-oldatot, ekkor csapadék válik ki. A reakcióelegyet 1 éjszakán át szobahőmérsékleten keverjük, majd bekeverjük 5 liter jeges vízbe, a csapadékot kiszűrjük, vízzel mossuk és szárítjuk. A kapott anyagot elkeverjük mintegy 500 ml petroléterrel szobahőmérsékleten, majd szűrjük, petroléterrel mossuk és szárítjuk. Így 46,9 g (48,5%) a 2,4-diklór-5-nitro-tiazolra, illetve 97% a metil-aminra vonatkoztatva 4-klór-2-(metil-amino)-5-nitro-tiazolt kapunk, op.: 212 °C (bomlás). A vegyületet metanolból átkristályosítjuk, így 140 °C hőmérsékleten 0,1 mbar nyomáson szublimál.

12. példa

(13) képletű vegyület

(66. számú vegyület) előállítás

19,9 g (0,1 mól) 2,4-diklór-5-nitro-tiazolnak 500 ml dimetil-formamidban készített oldatához 0–5 °C hőmérsékleten lassan hozzácepegtetjük 8,9 g (0,05 mól) (14) képletű vegyületnek melegítés közben 50 ml dimetil-formamidban készített oldatát, ekkor csapadék válik ki. A reakcióelegyet 0–5 °C hőmérsékleten 6 órán át keverjük, 5 liter jeges vízbe bekeverjük, szűrjük, vízzel mossuk és szárítjuk. Így 9,5 g (59,7%) 4-klór-2-(4-metil-fenil-szulfonil)-5-nitro-tiazolt kapunk. A vegyületet ciklohexánból átkristályosítjuk, így 140 °C hőmérsékleten 0,1 mbar nyomáson szublimál. Op.: 153–153,5 °C.

13. példa

(13) képletű vegyület

(66. számú vegyület) előállítás

5,73 g (0,02 mól) 4-klór-2-(4-metil-fenil-tio)-5-nit-

ro-tiazolnak (57. számú találmány szerinti vegyület) 200 ml diklór-metánban készített oldatát 15,65 g (0,09 mól) 3-klór-peroxibenzoesavval elegyítjük és 8 órán át visszafolytatás közben keverjük. Lehűlés után a kiváló 3-klór-benzoesavat kiszűrjük. A szűrletet szobahőmérsékleten vákuumban szárazra pároljuk és a visszamaradó anyagot feleslegben alkalmazott vizes nátrium-hidrogén-karbonát-oldattal erőlyesen elkeverjük, szűrjük, vízzel mossuk és szárítjuk. Így 6,2 g (97,3%) 4-klór-2-(4-metil-fenil-szulfonil)-5-nitro-tiazolt kapunk, amely minden tulajdonságában azonos a 12. példa szerinti vegyülettel.

14. példa

(16) képletű vegyület

(73. számú vegyület) előállítása

5,2 g (0,018 mól) 4-klór-2-(4-metil-fenil-tio)-5-nitro-tiazolnak (57. számú találmány szerinti vegyület) 200 ml diklórmetánban készített oldatát szobahőmérsékleten mintegy 50 perc alatt részletekben (mintegy 8 részletben) összesen 4,35 g (0,025 mól) 3-klór-peroxibenzoesavval elegyítjük. A reakcióelegyet szobahőmérsékleten vákuumban szárazra pároljuk, a visszamaradó anyagot feleslegben alkalmazott mennyiségű vizes nátrium-hidrogén-karbonát-oldattal erőlyesen elkeverjük, szűrjük, vízzel mossuk és szárítjuk. Így a 4-klór-2-(4-metil-fenil-szulfonil)-5-nitro-tiazolt kapjuk, op.: 112 °C (ciklohexánból).

15. példa

(17) képletű vegyület

(107. számú vegyület) előállítása

A 107. számú vegyületet a 2. példában leírtak szerint állítjuk elő 2,4-diklór-5-nitro-tiazolból és terc-butilmerkaptánból. A felesleges mennyiségű jeges vízbe való bekeverés után keletkező olajat felvesszük diklórmetánban, a diklór-metános fázist elválasztjuk, vízmentes nátrium-szulfáttal szárítjuk és vákuumban bepároljuk. A felesleges mennyiségű 2,4-diklór-5-nitro-tiazolt erős vákuumban bepárlóberendezésben 70 °C hőmérsékletig terjedő fürdőhőmérsékleten 0,1 mbar nyomáson távolítjuk el, majd mindegy 80 °C fürdőhőmérséklet mellett 0,1 mbar-on desztilláljuk a tiszta 2-(terc-butil-tio)-4-klór-5-nitro-tiazolt.

16. példa

(18) képletű vegyület

(13. számú vegyület) előállítása

19,9 g (0,1 mól) 2,4-diklór-5-nitro-tiazolnak 250 ml acetonnitrilben készített oldatát 12,7 g (0,105 mól) N,N-dimetil-anilinnel elegyítjük és a reakcióelegyet 75 órán át visszafolytatás közben keverjük. Ezután az oldószert vákuumban eltávolítjuk, a visszamaradó szilárd anyagot bekeverjük vízbe, szűrjük, vízzel mossuk és szárítjuk. Így 25,8 g (95,7%) 4-klór-2-(N-metil-N-fenil-amino)-5-nitro-tiazolt kapunk. A vegyületet ciklohexánból átkristályosítjuk, így mintegy 110–120 °C hőmérsékleten, 0,1 mbar nyomáson szublimál, op.: 136–137 °C.

A 13. számú vegyületet a 2. példa szerint is előállíthatjuk.

Az irodalomból nem ismert kiindulási vegyületek előállítása

A1 példa

(19) képletű vegyület előállítása

19,9 g (0,1 mól) 2,4-diklór-5-nitro-tiazolt 500 ml acetonban oldunk és 150 g (1 mól) nátrium-jodid hozzáadagolása után mintegy 60 órán át visszafolytatás közben keverünk. Ekkor a reakcióelegyben a 2,4-dijód-5-nitro-tiazol mennyisége a gázkromatográfiás analízis alapján 95% feletti. Az oldószert vákuumban eltávolítjuk, a visszamaradó anyagot vízbe keverjük, szűrjük, vízzel mossuk és szárítjuk. Így 33,9 g (89%) 2,4-dijód-5-nitro-tiazolt kapunk, op.: ciklohexánból való átkristályosítás után 135 °C.

A2 példa

(20) és (21) képletű vegyületek előállítása

39,8 g (0,2 mól) 2,4-diklór-5-nitro-tiazolt 500 ml acetonban oldunk és 90 g (0,6 mól) nátrium-jodid hozzáadagolása után mintegy 6 napig keverjük szobahőmérsékleten, ennek során az átalakulást gázkromatográfiásan követjük. Az oldószert vákuumban eltávolítjuk, a visszamaradó anyagot bekeverjük vízbe, szűrjük, vízzel mossuk és szárítjuk. Így egy olyan termékelegyet kapunk, amely a gázkromatográfiás analízis alapján 71,5% 2-jód-4-klór-5-nitro-tiazolt és 25,8% 2-klór-4-jód-5-nitro-tiazolt tartalmaz. Nagynyomású folyadékromatográfiás elválasztással a tiszta anyagokat kapjuk: 2-jód-4-klór-5-nitro-tiazol: op.: 80–81 °C, 2-klór-4-jód-5-nitro-tiazol: op.: 108–109,5 °C.

A3 példa

(22) képletű vegyület előállítása

19,9 g (0,1 mól) 2,4-diklór-5-nitro-tiazolt 60 ml acetonnitrilben oldunk és 24 g (0,4 mól) lehűtött kálium-fluoridnak és 0,5 g [18]Krone-6-nek a beadagolása után mintegy egy hétig szobahőmérsékleten keverjük, ennek során a reakció előrehaladását gázkromatográfiásan követjük. A nyers reakcióelegyet 0,1–0,5 mbar nyomáson, 20–25 °C hőmérsékleten desztilláljuk, ekkor az illékony komponenseket metanol/száraz jéggel hűtött berendezésben fogjuk fel. Az acetonnitrilt a szokásos nyomáson ledesztilláljuk, ekkor a 4-klór-2-fluor-5-nitro-tiazolnak és a 2,4-diklór-5-nitro-tiazolnak mintegy azonos arányú elegye marad vissza. Az elegyből a 4-klór-2-fluor-5-nitro-tiazolt például frakcionált desztillálással választjuk el.

¹⁹F-NMR (CDCl₃) (CF₃-COOH belső standard) δ = -17,5 ppm.

MS: 182 (37%) = M⁺ = C₃ClFN₂O₂S

124 (34%)

91 (60%)

63 (100%)

Mellékkomponensként a 4-klór-2-fluor-5-nitro-tiazolra számítva 1 és 5% közötti relatív részarányban kapjuk az izomer-2-klór-4-fluor-5-nitro-tiazolt, ennek mennyiségét gázkromatográfiásan határoztuk meg.

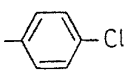
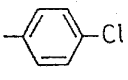
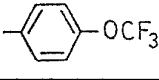
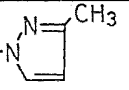
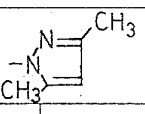
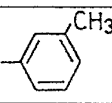
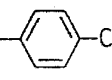
¹⁹F-NMR (CDCl₃) (CF₃-COOH belső standard) δ = 22,7 ppm

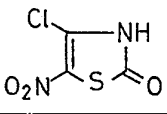
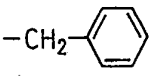
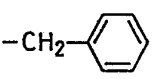
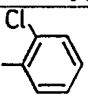
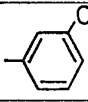
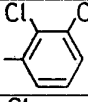
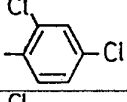
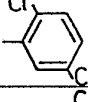
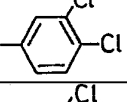
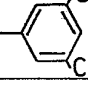
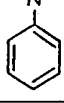
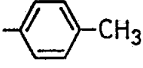
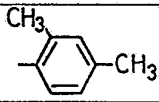
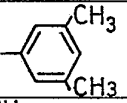
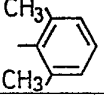
MS: 182 (83%) = M⁺ = C₃ClFN₂O₂S

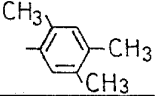
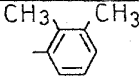
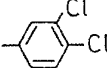
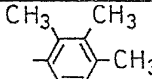
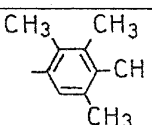
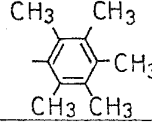
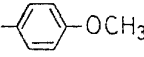
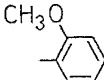
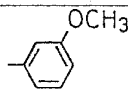
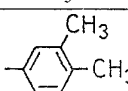
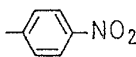
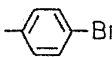
136 (32%)
91 (43%)
75 (100%)

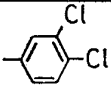
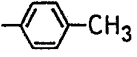
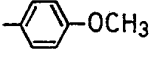
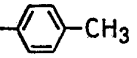
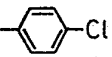
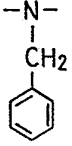
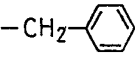
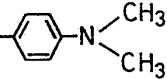
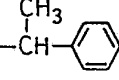
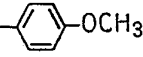
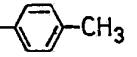
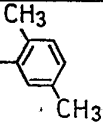
A leírtakkal analóg módon állítjuk elő a következő
(I) általános képletű 4-halogén-5-nitro-tiazol-származékokat.

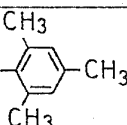
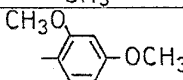
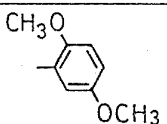
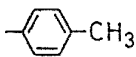
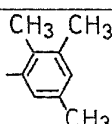
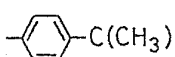
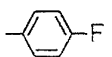
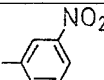
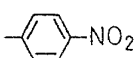
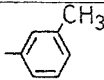
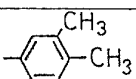
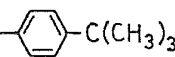
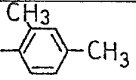
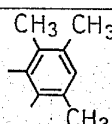
(I) általános képletű vegyületek

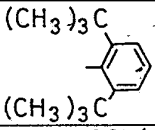
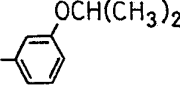
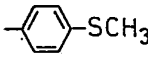
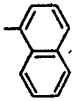
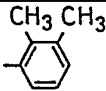
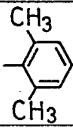
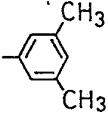
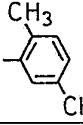
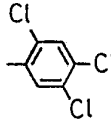
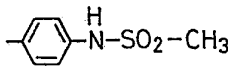
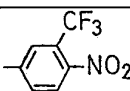
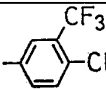
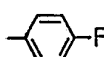
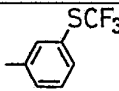
A példa száma	Hal	-A-	-R	Op. (°C) az átkristályosítás oldószere	Előállítás
1	Cl	$\begin{array}{c} \text{--N--} \\ \\ \text{C}_2\text{H}_5 \end{array}$	$\text{--C}_2\text{H}_5$	85 (ciklohexán)	3. példa
2	Cl	$\text{--A--R = } \text{--N--}$ 		135 (etanol)	3. példa szerint
3	Cl	--NH--	H	180 (bomlás)	5. példa
4	Cl	$\text{--A--R = } \text{--N--}$ 		122 (ciklohexán)	6. példa szerint
5	Cl	--NH--		190–1 (bomlás)	1. példa szerint és 4. példa
6	Cl	$\text{--A--R = } \text{--N--}$ 		147 (ciklohexán)	6. példa szerint
7	Cl	$\text{--A--R = } \text{--N--}$ 		150 (bomlás)	6. példa szerint
8	Cl	--NH--		207 (bomlás)	4. példa szerint
9	Cl	--O--		94 (metanol)	4. példa szerint
10	Cl	--NH--		121 (bomlás)	1. (bomlás)
11	Cl	$\text{--A--R = } \text{--N--}$ 		153	6. példa
12	Cl	$\text{--A--R = } \text{--N--}$ 		205	6. példa szerint
13	Cl	$\begin{array}{c} \text{--N--} \\ \\ \text{CH}_3 \end{array}$		136 – 7 (ciklohexán)	2. példa szerint és 16. példa
14	Cl	$\begin{array}{c} \text{--N--} \\ \\ \text{C}_2\text{H}_5 \end{array}$		93–4 (ciklohexán)	2. példa szerint
15	Cl	$\begin{array}{c} \text{--N--} \\ \\ \text{C}_2\text{H}_5 \end{array}$		81	2. példa szerint
16	Cl	$\begin{array}{c} \text{--N--} \\ \\ \text{CH}_3 \end{array}$		118–20	1. példa szerint

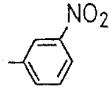
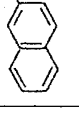
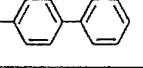
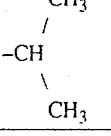
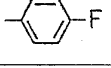
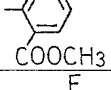
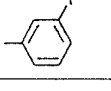
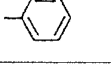
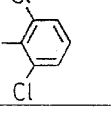
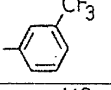
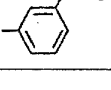
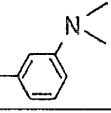
A példa száma	Hal	-A-	-R	Op. (°C) az átkristályosítás oldószere	Előállítás
17	Cl	-O-	H	136 (bomlás)	7. példa  -ként kapjuk
18	Cl	-NH-		195-6 (bomlás)	8. példa
19	Cl	-NH-		130-1 (ciklohexán)	2. példa szerint
20	Cl			112-3 (ciklohexán)	2. példa szerint
21	Cl	-NH-	-C(CH ₃) ₃	175-6 (acetonitril)	2. példa szerint
22	Cl	-NH-		151 (bomlás)	1. példa szerint
23	Cl	-NH-		197 (bomlás)	1. példa szerint
24	Cl	-NH-		108-11	1. példa szerint
25	Cl	-NH-		188-9 (bomlás)	1. példa szerint
26	Cl	-NH-		136-8 (bomlás)	1. példa szerint
27	Cl	-NH-		214-5 (bomlás)	1. példa szerint
28	Cl	-NH-		142-4 (bomlás)	1. példa szerint
29	Cl			171-3 (bomlás)	10. példa szerint
30	Cl	-NH-		194 (bomlás)	1. példa szerint
31	Cl	-NH-		175 (bomlás)	1. példa szerint
32	Cl	-NH-		177-8 (bomlás)	1. példa szerint
33	Cl	-NH-		179-80 (bomlás)	1. példa szerint
34	Cl	-NH-		215-6 (bomlás)	1. példa szerint

A példa száma	Hal	- A -	- R	Op. (°C) az átkristályosítás oldószere	Előállítás
35	Cl	-NH-		183-5 (bomlás)	1. példa szerint
36	Cl	-NH-		202 (bomlás)	1. példa szerint
37	Cl	-N- CH ₃		123-4	1. példa szerint
38	Cl	-NH-		216-7 (bomlás)	1. példa szerint
39	Cl	-NH-		170 (bomlás)	1. példa szerint
40	Cl	-NH-		243-4 (bomlás)	1. példa szerint
41	Cl	-NH-		193 (bomlás)	4. példa szerint
42	I	-NH-		168-9 (bomlás) (ciklohexán)	1. példa szerint 2,4-dijód-5-nitro-tiazolból
43	Cl	-NH-		185-6 (bomlás)	1. példa szerint
44	Cl	-NH-		175-6 (bomlás)	1. példa szerint
45	Cl	-O-	-CH ₃	52 (petroléter)	9. példa
46	Cl	-NH-		178-9 (bomlás)	1. példa szerint
47	Cl	-NH-		262-3 (bomlás)	1. példa szerint
48	Cl	-N- C ₂ H ₅		olaj	1. példa szerint
49	Cl	-NH-		180-1 (bomlás)	1. példa szerint
50	Cl	-NH-		208 (bomlás)	1. példa szerint
51	Cl	-NH-		191-2 (bomlás)	1. példa szerint
52	Cl	-O-		96 (petroléter)	2. példa szerint

A példa száma	Hal	-A-	-R	Op. (°C) az átkristályosítás oldószere	Előállítás
53	Cl	-O-		83-4	2. példa szerint
54	Cl	-O-		94-6	2. példa szerint
55	Cl	-O-		107-8	2. példa szerint
56	Cl	-S-		87-9	2. példa szerint
57	Cl	-S-		83-5	2. példa szerint
58	Cl	-S-		93	2. példa szerint
59	Cl			94 (ciklohexán)	2. példa szerint
60	Cl			240 (bomlás)	2. példa szerint
61	Cl	-NH-		178-9 (bomlás)	1. példa szerint
62	Cl	-NH-		> 260	1. példa szerint
63	Cl	-NH-		108 (ciklohexán)	4. példa szerint
64	Cl	-S-		62-5	2. példa szerint
65	Cl		-CH ₃	182,5	3. példa szerint
66	Cl	-SO ₂ -		153-153,5 (ciklohexán)	12. és 13. példa szerint
67	Cl	-A-R = 		138-9 (toluol)	10. példa
68	Cl	-NH-	-CH ₃	212 (metanol)	11. példa
69	Cl	-NH-		186-7 (bomlás)	1. példa szerint

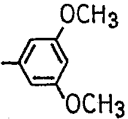
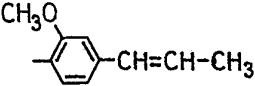
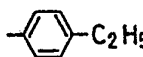
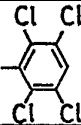
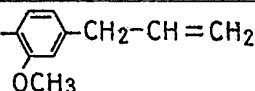
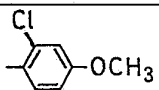
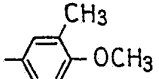
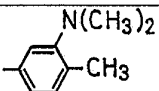
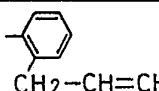
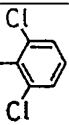
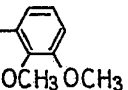
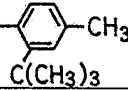
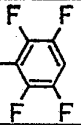
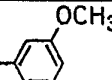
A példa száma	Hal	- A -	- R	Op. (°C) az átkristályosítás oldószere	Előállítás
70	Cl	-NH-		214-5 (bomlás)	1. példa szerint
71	Cl	-NH-		167-9 (bomlás)	1. példa szerint
72	Cl	-NH-		153-4 (bomlás)	1. példa szerint
73	Cl	-SO-		112	14. példa
74	Cl	-NH-		208-9 (bomlás)	1. példa szerint
75	Cl	-O-		87-8	2. példa szerint
76	Cl	-O-		103-4	2. példa szerint
77	Cl	-O-		79-80	2. példa szerint
78	Cl	-O-		43	2. példa szerint
79	Cl	-O-		106-7	2. példa szerint
80	Cl	-O-		olaj	2. példa szerint
81	Cl	-O-		147-8	2. példa szerint
82	Cl	-O-		44-5	2. példa szerint
83	Cl	-O-		76-7	2. példa szerint
84	Cl	-S-		olaj	2. példa szerint
85	Cl	-O-		54	2. példa szerint
86	Cl	-O-		98	2. példa szerint

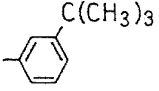
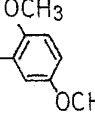
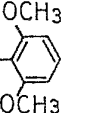
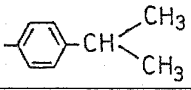
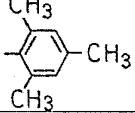
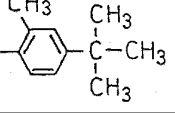
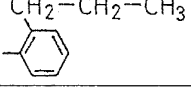
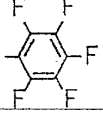
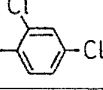
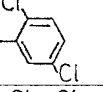
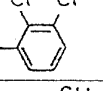
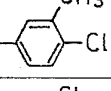
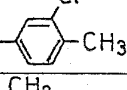
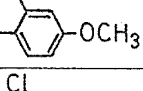
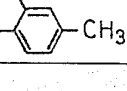
A példa száma	Hal	-A-	-R	Op. (°C) az átkristályosítás oldószere	Előállítás
87	Cl	-O-		188-9	2. példa szerint
88	Cl	-NH-		48-9	1. példa szerint
89	Cl	-O-		96	2. példa szerint
90	Cl	-O-		51-2	2. példa szerint
91	Cl	-O-		45	2. példa szerint
92	Cl	-O-		olaj	2. példa szerint
93	Cl	-O-		57	2. példa szerint
94	Cl	-O-		61	2. példa szerint
95	Cl	-NH-		191-2 (bomlás)	1. példa szerint
96	Cl	-NH-		203 (bomlás)	1. példa szerint
97	Cl	-NH-		226-7 (bomlás)	1. példa szerint
98	Cl	-NH-		124-5 (bomlás)	1. példa szerint
99	Cl	-NH-		157-8 (bomlás)	1. példa szerint
100	Cl	-NH-		112-3 (bomlás)	1. példa szerint
101	Cl	-NH-		77-8	1. példa szerint
102	Cl	-NH-		158-9 (bomlás)	1. példa szerint

A példa száma	Hal	- A -	- R	Op. (°C) az átkristályosítás oldószere	Előállítás
103	Cl	-NH-		163-4 (bomlás)	1. példa szerint
104	Cl	-O-		128	2. példa szerint
105	Cl	-O-		187	2. példa szerint
106	Cl	-S-		olaj	15. példa szerint
107	Cl	-S-	-C(CH ₃) ₃	olaj	15. példa
108	Cl	-S-		95	2. példa szerint
109	Cl	-O-		56	2. példa szerint
110	Cl	-O-		67	2. példa szerint
111	I	-N- CH ₃		86-8 (bomlás)	2. példa szerint 2-klór-4-jód-5-nitro-tiazolból
112	Br	-N- CH ₃		102-4 (bomlás)	1. példa szerint
113	Cl	-N- H	-CH ₂ -CH=CH ₂	130	1. példa szerint
114	Cl	-N- H		141 (petroléter)	tetrahydrofuranban nátrium-hidrid adagolásával
115	Cl	-N- CH ₂ CH=CH ₂	-CH ₂ -CH=CH ₂	olaj IR spektrum: 15/13 rajzlapon	1. példa szerint
116	Cl	-N- H		121-2	1. példa szerint
117	Cl	-N- C ₂ H ₅		157-8 (bomlás)	1. példa szerint
118	Cl	-N- H		169-70 (bomlás)	1. példa szerint

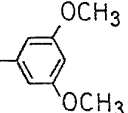
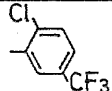
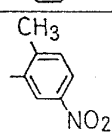
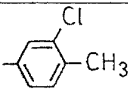
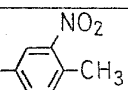
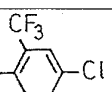
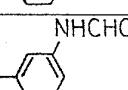
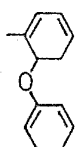
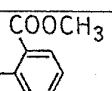
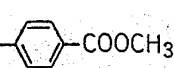
A példa száma	Hal	-A-	-R	Op. (°C) az átkristályosítás oldószere	Előállítás
119	Cl	$\begin{array}{c} -N- \\ \\ H \end{array}$	$\begin{array}{c} -CH_3 \\ \\ -C- \text{benzene ring} \\ \\ -CH_3 \end{array}$	71-2 (bomlás)	2. példa szerint
120	Cl	$\begin{array}{c} -N- \\ \\ H \end{array}$	$\text{benzene ring}-CONH_2$	259 (bomlás)	1. példa szerint
121	Cl	$\begin{array}{c} -N- \\ \\ H \end{array}$	$\text{benzene ring}-\overset{\overset{O}{\parallel}}{C}-CH_3$	262-3 (bomlás)	1. példa szerint
122	Cl	$\begin{array}{c} -N- \\ \\ H \end{array}$	$\text{benzene ring}-SO_2NH_2$	>280	1. példa szerint
123	Cl	$\begin{array}{c} -N- \\ \\ H \end{array}$	$\text{benzene ring}-CN$	266-7 (bomlás)	1. példa szerint
124	Cl	$\begin{array}{c} -N- \\ \\ H \end{array}$	$\text{benzene ring}-CF_3$	202-3 (bomlás)	1. példa szerint
125	Cl	$\begin{array}{c} -N- \\ \\ H \end{array}$	$\begin{array}{c} CH_3 \\ \\ -C-CN \\ \\ CH_3 \end{array}$	127-8	1. példa szerint
126	Cl	$\begin{array}{c} -N- \\ \\ CH_2 \\ \\ CN \end{array}$	$-CH_2-CH_2-CN$	176 (bomlás)	1. példa szerint
127	Cl	$\begin{array}{c} -N- \\ \\ H \end{array}$	$\text{benzene ring}-O-C_4H_9$	154-5 (bomlás)	1. példa szerint
128	Cl	$\begin{array}{c} -N- \\ \\ H \end{array}$	$\text{benzene ring}-CH \begin{array}{l} \nearrow CH_3 \\ \searrow CH_3 \end{array}$	161-2 (bomlás)	1. példa szerint
129	Cl	-O-	$\text{benzene ring}-COOCH_3$	124-5	2. példa szerint
130	Cl	-O-	$\text{benzene ring}-COOC_2H_5$	111-2	2. példa szerint
131	Cl	$\begin{array}{c} -N- \\ \\ H \end{array}$	$\text{benzene ring}-\text{cyclohexane ring}$	185-6 (bomlás)	1. példa szerint
132	Cl	$\begin{array}{c} -N- \\ \\ H \end{array}$	$\text{benzene ring}-C_2H_5$	174-5 (bomlás)	1. példa szerint
133	Cl	$\begin{array}{c} -N- \\ \\ H \end{array}$	$\text{benzene ring}-SO_2-CH_3$	268-9 (bomlás)	1. példa szerint

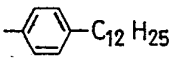
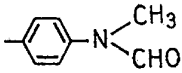
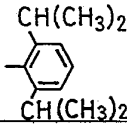
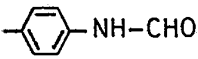
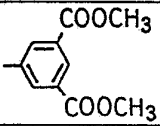
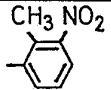
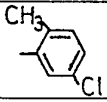
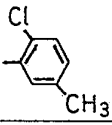
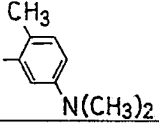
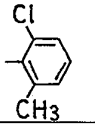
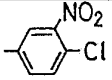
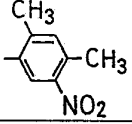
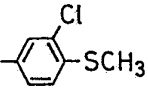
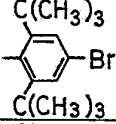
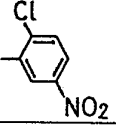
A példa száma	Hal	- A -	- R	Op. (°C) az átkristályosítás oldószere	Előállítás
134	Cl	$\begin{array}{c} -N- \\ \\ H \end{array}$		189-90 (bomlás)	1. példa szerint
135	Cl	$-O-$		80	2. példa szerint
136	Cl	$\begin{array}{c} -N- \\ \\ H \end{array}$		151-2 (bomlás)	1. példa szerint
137	Cl	$\begin{array}{c} -N- \\ \\ H \end{array}$		165-6 (bomlás)	1. példa szerint
138	Cl	$\begin{array}{c} -N- \\ \\ H \end{array}$		226-7 (bomlás)	1. példa szerint
139	Cl	$\begin{array}{c} -N- \\ \\ H \end{array}$		157-8 (bomlás)	1. példa szerint
140	Cl	$-S-$		154-5 (bomlás) (acetonitril)	2. példa szerint
141	Cl	$\begin{array}{c} -N- \\ \\ H \end{array}$		olaj	1. példa szerint
142	Cl	$-S-$		95	2. példa szerint
143	Cl	$-S-$		52-3	2. példa szerint
144	Cl	$-S-$		80-1	2. példa szerint
145	Cl	$-O-$		123-4	2. példa szerint
146	Cl	$-O-$		134-5	2. példa szerint
147	Cl	$-O-$		75-6	2. példa szerint
148	Cl	$-S-$		117-8	2. példa szerint

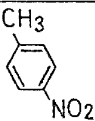
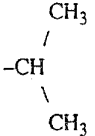
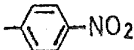
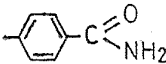
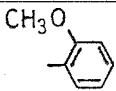
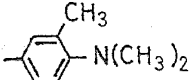
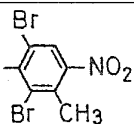
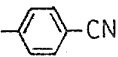
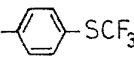
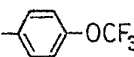
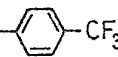
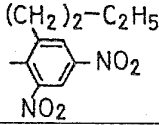
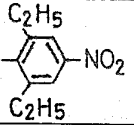
A példa száma	Hal	- A -	- R	Op. (°C) az átkristályosítás oldószere	Előállítás
149	Cl	-S-		96-7	2. példa szerint
150	Cl	-O-		olaj	2. példa szerint
151	Cl	-O-		57	2. példa szerint
152	Cl	-O-		58-9	2. példa szerint
153	Cl	-O-		208-9	2. példa szerint
154	Cl	-O-		olaj	2. példa szerint
155	Cl	-O-		98	2. példa szerint
156	Cl	-O-		83	2. példa szerint
157	Cl	-O-		96	2. példa szerint
158	Cl	-NH-		106-7 (bomlás)	1. példa szerint
159	Cl	-O-		olaj IR spektrum: 15/14 rajzlapon	2. példa szerint
160	Cl	-O-		97	2. példa szerint
161	Cl	-O-		106	2. példa szerint
162	Cl	-O-		116	2. példa szerint
163	Cl	-O-		olaj	2. példa szerint
164	Cl	-O-		68	2. példa szerint
165	Cl	-O-		78	2. példa szerint

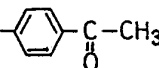
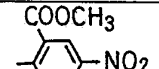
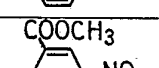
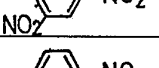
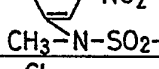
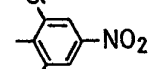
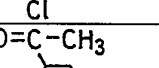
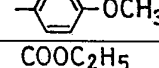
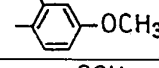
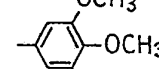
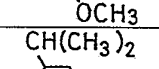
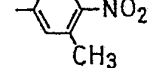
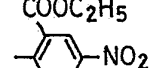
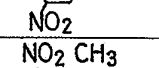
A példa száma	Hal	- A -	- R	Op. (°C) az átkristályosítás oldószere	Előállítás
166	Cl	-O-		68	2. példa szerint
167	Cl	-O-		115	2. példa szerint
168	Cl	-O-		152	2. példa szerint
169	Cl	-O-		86	2. példa szerint
170	Cl	-O-		olaj	2. példa szerint
171	Cl	-O-		olaj	2. példa szerint
172	Cl	-O-		olaj	2. példa szerint
173	Cl	-O-		52	2. példa szerint
174	Cl	-SO2-		125 (bomlás)	13. példa szerint
175	Cl	-O-		olaj	2. példa szerint
176	Cl	-O-		122	2. példa szerint
177	Cl	-O-		113	2. példa szerint
178	Cl	-O-		86	2. példa szerint
179	Cl	-O-		olaj	2. példa szerint
180	Cl	H -N-		144 (bomlás)	1. példa szerint
181	Cl	H -N-		162-3 (bomlás)	1. példa szerint

A példa száma	Hal	-A-	-R	Op. (°C) az átkristályosítás oldószere	Előállítás
182	Cl	$\begin{array}{c} \text{H} \\ \\ -\text{N}- \end{array}$		148 (bomlás)	1. példa szerint
183	Cl	$\begin{array}{c} \text{H} \\ \\ -\text{N}- \end{array}$		201-2 (bomlás)	1. példa szerint
184	Cl	$\begin{array}{c} \text{H} \\ \\ -\text{N}- \end{array}$		205-6 (bomlás)	1. példa szerint
185	Cl	$\begin{array}{c} \text{H} \\ \\ -\text{N}- \end{array}$		168-9 (bomlás)	1. példa szerint
186	Cl	$\begin{array}{c} \text{H} \\ \\ -\text{N}- \end{array}$		126 (bomlás)	1. példa szerint
187	Cl	$\begin{array}{c} \text{H} \\ \\ -\text{N}- \end{array}$		117 (bomlás)	1. példa szerint
188	Cl	$\begin{array}{c} -\text{N}- \\ \\ \text{CH}_3 \end{array}$		140-1 (bomlás)	1. példa szerint
189	Cl	$\begin{array}{c} \text{H} \\ \\ -\text{N}- \end{array}$		127-7 (bomlás)	1. példa szerint
190	Cl	$\begin{array}{c} -\text{N}- \\ \\ \text{CH}_3 \end{array}$		179-80 (bomlás)	1. példa szerint
191	Cl	$\begin{array}{c} \text{H} \\ \\ -\text{N}- \end{array}$		olaj	1. példa szerint
192	Cl	$\begin{array}{c} \text{H} \\ \\ -\text{N}- \end{array}$		221 (bomlás)	1. példa szerint
193	Cl	$\begin{array}{c} \text{H} \\ \\ -\text{N}- \end{array}$		177-8 (bomlás)	1. példa szerint
194	Cl	$\begin{array}{c} \text{H} \\ \\ -\text{N}- \end{array}$		201 (bomlás)	1. példa szerint
195	Cl	$\begin{array}{c} \text{CH}_3 \\ \\ -\text{N}- \end{array}$		94-5	1. példa szerint
196	Cl	$\begin{array}{c} \text{C}_2\text{H}_5 \\ \\ -\text{N}- \end{array}$		87-8	1. példa szerint
197	Cl	$\begin{array}{c} \text{C}_2\text{H}_5 \\ \\ -\text{N}- \end{array}$		71	1. példa szerint
198	Cl	$\begin{array}{c} \text{CH}_3 \\ \\ -\text{N}- \end{array}$		141 (bomlás)	1. példa szerint

A példa száma	Hal	-A-	-R	Op. (°C) az átkristályosítás oldószere	Előállítás
199	Cl	$\begin{array}{c} \text{C}_2\text{H}_5 \\ \\ -\text{N}- \end{array}$		144 (bomlás)	1. példa szerint
200	Cl	$\begin{array}{c} \text{H} \\ \\ -\text{N}- \end{array}$		97-8 (bomlás)	1. példa szerint
201	Cl	$\begin{array}{c} \text{H} \\ \\ -\text{N}- \end{array}$		161-2 (bomlás)	1. példa szerint
202	Cl	$\begin{array}{c} \text{H} \\ \\ -\text{N}- \end{array}$		224-5 (bomlás)	1. példa szerint
203	Cl	$\begin{array}{c} \text{H} \\ \\ -\text{N}- \end{array}$		159-60 (bomlás)	1. példa szerint
204	Cl	$\begin{array}{c} \text{H} \\ \\ -\text{N}- \end{array}$		204-5 (bomlás)	1. példa szerint
205	Cl	$\begin{array}{c} \text{H} \\ \\ -\text{N}- \end{array}$		213-4 (bomlás)	1. példa szerint
206	Cl	$\begin{array}{c} \text{H} \\ \\ -\text{N}- \end{array}$		161-2 (bomlás)	1. példa szerint
207	Cl	$\begin{array}{c} \text{H} \\ \\ -\text{N}- \end{array}$		209 (bomlás)	1. példa szerint
208	Cl	-A-R= -N- 		162-3 (bomlás)	3. példa szerint
209	Cl	-A-R= -N- 		91-2	3. példa szerint
210	Cl	-A-R= -N- 		113 (bomlás)	3. példa szerint
211	Cl	$\begin{array}{c} \text{H} \\ \\ -\text{N}- \end{array}$		167-8 (bomlás)	1. példa szerint
212	Cl	$\begin{array}{c} \text{H} \\ \\ -\text{N}- \end{array}$		256 (bomlás)	1. példa szerint
213	Cl	$\begin{array}{c} \text{H} \\ \\ -\text{N}- \end{array}$		83	1. példa szerint
214	Cl	$\begin{array}{c} -\text{N}- \\ \\ \text{CH}_3 \end{array}$		112-3	1. példa szerint
215	Cl	$\begin{array}{c} \text{H} \\ \\ -\text{N}- \end{array}$		254 (bomlás)	1. példa szerint

A példa száma	Hal	-A-	-R	Op. (°C) az átkristályosítás oldószere	Előállítás
216	Cl	H -N-		olaj IR spektrum: 15/15 rajzlapon	1. példa szerint
217	Cl	H -N-		221 (bomlás)	1. példa szerint
218	Cl	H -N-		228 (bomlás)	1. példa szerint
219	Cl	H -N-		168-9 (bomlás)	1. példa szerint
220	Cl	H -N-		117-8 (bomlás)	1. példa szerint
221	Cl	H -N-		156-7 (bomlás)	1. példa szerint
222	Cl	H -N-		202 (bomlás)	1. példa szerint
223	Cl	H -N-		186-7 (bomlás)	1. példa szerint
224	Cl	H -N-		163-4 (bomlás)	1. példa szerint
225	Cl	H -N-		156-7 (bomlás)	1. példa szerint
226	Cl	H -N-		148-9 (bomlás)	1. példa szerint
227	Cl	H -N-		230 (bomlás)	1. példa szerint
228	Cl	H -N-		159-60 (bomlás)	1. példa szerint
229	Cl	-O-		247	2. példa szerint
230	Cl	H -N-		198-9 (bomlás)	1. példa szerint

A példa száma	Hal	-A-	-R	Op. (°C) az átkristályosítás oldószere	Előállítás
231	Cl	$\begin{array}{c} \text{C}_2\text{H}_5 \\ \\ -\text{N}- \end{array}$		149–50 (bomlás)	1. példa szerint
232	Cl	$\begin{array}{c} \text{H} \\ \\ -\text{N}- \end{array}$	$-\text{C}_2\text{H}_5$	167–8 (bomlás)	11. példa szerint
233	Cl	$\begin{array}{c} \text{H} \\ \\ -\text{N}- \end{array}$	$-\text{CH}_2-\text{C}_2\text{H}_5$	106 (bomlás)	11. példa szerint
234	Cl	$\begin{array}{c} \text{H} \\ \\ -\text{N}- \end{array}$		125–7 (bomlás)	11. példa szerint
235	Cl	$\begin{array}{c} \text{H} \\ \\ -\text{N}- \end{array}$	$-\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{OCH}_3$	124–8	11. példa szerint
236	Cl	$\begin{array}{c} \text{H} \\ \\ -\text{N}- \end{array}$	$-\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{Cl}$	143–4 (bomlás)	11. példa szerint
237	Cl	$-\text{S}-$		97–8 (bomlás)	2. példa szerint
238	Cl	$-\text{O}-$		136–7 (bomlás)	2. példa szerint
239	Cl	$-\text{O}-$		186–7 (bomlás)	2. példa szerint
240	Cl	$-\text{O}-$		82	2. példa szerint
241	Cl	$-\text{O}-$		142	2. példa szerint
242	Cl	$-\text{O}-$		103–4	2. példa szerint
243	Cl	$-\text{O}-$		71	2. példa szerint
244	Cl	$-\text{O}-$		48	2. példa szerint
245	Cl	$-\text{O}-$		77	2. példa szerint
246	Cl	$-\text{O}-$		olaj	2. példa szerint
247	Cl	$-\text{O}-$		142 (bomlás)	2. példa szerint

A példa száma	Hal	-A-	-R	Op. (°C) az átkristályosítás oldószere	Előállítás
248	Cl	-O-		108	2. példa szerint
249	Cl	-O-		102-3	2. példa szerint
250	Cl	-O-		104	2. példa szerint
251	Cl	-O-		159	2. példa szerint
252	Cl	-O-		145	2. példa szerint
253	Cl	-O-		112	2. példa szerint
254	Cl	-O-		102	2. példa szerint
255	Cl	-O-		141	2. példa szerint
256	Cl	-O-		104	2. példa szerint
257	Cl	-O-		101	2. példa szerint
258	Cl	-O-		137	2. példa szerint
259	Cl	-O-		129-30	2. példa szerint
260	Cl	-O-		149	2. példa szerint
261	Cl	-O-		128-9	2. példa szerint

Alkalmazástechnikai példák

A következő alkalmazástechnikai példákban összehasonlító vegyületként az (A) képletű N-(triklór-metil-tio)-tetrahydroftálimidet (2553 770 számú amerikai egyesült államokbeli szabadalmi leírás), a (B) képletű N,N-dimetil-N'-fenil-N'-(fluor-diklór-metil-tio)-szulfamidot (1 193 498 számú német szövetségi köztársaságbeli köz-

zételési irat) és a (C) képletű 2-ciano-N-(etil-amino-karbonil)-2-metoximino-acetamidot (3957 847 számú amerikai egyesült államokbeli szabadalmi leírás és a (D) képletű 4-(benzimidazol-2-il)-tiazolt (R. Wegler „Chemie der Pflanzenschutz- und Schädlingsbekämpfungsmittel”, 2. kötet, 124. oldal, Springer-Verlag, Berlin, Heidelberg, N. Y. 1970) alkalmazzuk.

A példa

Venturia vizsgálat (alma)/védőhatás

Az oldószer: 4,7 tömegrész aceton

Az emulgeátor: 0,3 tömegrész alkil-aril-poliglikol-éter

Célszerű hatóanyag-készítmény előállításához összekeverünk 1 tömegrész hatóanyagot a megadott mennyiségű oldószerrel és emulgeátorral és a koncentrátumot vízzel a kívánt koncentrációra hígítjuk.

A protektív hatásosság vizsgálatához fiatal növényeket csuromvizesre permetezünk a hatóanyag-készítménnyel. A felvitt anyag megszáradása után a növényeket az almafavarasodás kórokozójának (*Venturia inaequalis*) a konidium-szuszpenziójával oltjuk be és a növényeket ezután 1 napig 20 °C hőmérsékletű és 100% relatív nedvességtartalmú inkubációs kamrában tartjuk.

Ezután a növényeket 20 °C hőmérsékletű és mintegy 70% relatív nedvességtartalmú üvegházba visszük. A beoltás után 12 nappal végezzük a kiértékelést. Például 5 ppm hatóanyag-koncentrációnál számos találmány szerinti vegyület hatásfoka a kezeletlen kontrollhoz viszonyítva 80–85% közötti. Az eredményeket az A táblázat tartalmazza.

B példa

Plasmopara-vizsgálat (szőlő)/védőhatás

Az oldószer: 4,7 tömegrész aceton

Az emulgeátor: 0,3 tömegrész alkil-aril-poliglikol-éter

Célszerű hatóanyag-készítmény előállításához összekeverünk 1 tömegrész hatóanyagot a megadott mennyiségű oldószerrel és emulgeátorral és a koncentrátumot vízzel a kívánt koncentrációra hígítjuk.

A protektív hatásosság vizsgálatához fiatal növényeket csuromvizesre permetezünk a hatóanyag-készítménnyel. A felvitt anyag megszáradása után a növényeket *Plasmopara viticola* spóra-szuszpenziójával oltjuk be és 1 napig 20–22 °C hőmérsékletű és 100% relatív nedvességtartalmú nedves kamrában tartjuk. Ezután a növényeket 5 napig üvegházban tartjuk 22 °C hőmérsékleten és mintegy 80% relatív nedvességtartalom mellett.

A növényeket ezt követően 1 napig nedves kamrában tartjuk.

A kiértékelést a beoltás után 7 nappal végezzük.

A vizsgálatban számos találmány szerinti vegyület hatóanyag-koncentrációnál kezeletlen kontrollhoz viszonyítva 80–90%-os hatásfokot mutat. Az eredményeket a B táblázat mutatja.

C példa

Phytophthora vizsgálat (paradicsom)/védőhatás

Az oldószer: 4,7 tömegrész aceton

Az emulgeátor: 0,3 tömegrész alkil-aril-poliglikol-éter

Célszerű hatóanyag-készítmény előállítására összekeverünk 1 tömegrész hatóanyagot a megadott mennyiségű oldószerrel és emulgeátorral és a koncentrátumot vízzel a kívánt koncentrációra hígítjuk.

A protektív hatásosság vizsgálatához fiatal növényeket csuromvizesre permetezünk a hatóanyag-készítménnyel. A felvitt anyag megszáradása után a növényeket *Phytophthora infestans* vizes spóra-szuszpenziójával oltjuk be.

A növényeket 100% relatív nedvességtartalmú és mintegy 20 °C hőmérsékletű inkubációs kamrában tartjuk.

3 nappal a beoltás után végezzük a kiértékelést. 10 ppm hatóanyag-koncentrációnál számos találmány szerinti vegyület 80–90% hatásfokot mutat a kezeletlen kontrollhoz viszonyítva. Az eredményeket a C táblázat mutatja.

D példa

Leptosphaeria nodorum vizsgálat (búza)/védőhatás

Az oldószer: 100 tömegrész dimetil-formamid

Az emulgeátor: 0,25 tömegrész alkil-aril-poliglikol-éter

Célszerű hatóanyag-készítmény előállításához összekeverünk 1 tömegrész hatóanyagot a megadott mennyiségű oldószerrel és emulgeátorral és a koncentrátumot vízzel a kívánt koncentrációra hígítjuk.

A protektív hatásosság vizsgálatához fiatal növényeket harmatnedvesre permetezünk a hatóanyag-készítménnyel. A felvitt anyag megszáradása után a növényeket *Leptosphaeria nodorum* konidium-szuszpenziójával szórjuk be, 48 órán 20 °C hőmérsékletű és 100% relatív nedvességtartalmú inkubációs kamrában tartjuk.

A növényeket ezután üvegházba visszük, amelynek hőmérséklete mintegy 15 °C és relatív nedvességtartalma mintegy 80%.

A beoltás után 10 nappal végezzük a kiértékelést.

0,025 tömeg% permetlé koncentrációnál a b számú találmány szerinti vegyület a kezeletlen kontrollhoz képest 100%-os hatásfokot mutat. Az eredményt a D táblázat tartalmazza.

E példa

Műszaki anyagoknál a gombákkal szembeni hatás bizonyításához a találmány szerinti vegyületek minimális gátló koncentrációját (MHK) határozzuk meg.

Sörcefréből és peptonból előállított agart a találmány szerinti hatóanyagokkal elegyítünk 0,1 mg/liter és 5000 mg/liter közötti koncentrációkban. Az agar megdermedése után a tiszta tenyészeteket a táblázatban felsorolt vizsgálati organizmusokkal szennyezzük. A tenyészeteket 2 hétig tároljuk 28 °C hőmérsékleten és 60–70% relatív nedvességtartalom mellett és meghatározzuk az MHK értékeket. Az MHK érték az a legalacsonyabb hatóanyag-koncentráció, amelynél az alkalmazott mikrobafajta egyáltalán nem növekszik.

Így például a 3, 6, 7, 9, 11, 45, 52, 53, 54, 55, 56, 64, 80, 77, 78. és 92. számú vegyületek jó hatásúak és széles hatásspektrumúak, például a következő organizmusokkal szemben:

Alternaria tenuis
Aspergillus niger
Aureobasidium pullulans
Chaetomium globosum
Cladosporium cladosporioides
Lentinus tigrinus
Penicillium glaucum
Sclerophoma pityophila
Trichoderma viride.

Az eredményeket az E táblázat tartalmazza.

F példa

Baktériumokkal szembeni hatás műszaki anyagoknál

Húsleves táptalajt tartalmazó agart a találmány szerinti hatóanyagokkal elegyítünk 1 és 5000 ppm közötti koncentrációkban. Ezután a táptalajt a táblázatban megadott vizsgálati organizmusokkal oltjuk be és a beoltott közeget 2 hétig 28 °C hőmérsékletű és 60–70 relatív nedvességtartalmú térben tartjuk. Az MHK érték az a legalacsonyabb hatóanyag-koncentráció, amelynél az alkalmazott mikrobafajta nem növekszik.

Táblázat

Escherichia coli

Staphylococcus aureus

Ezeknél az organizmusoknál például a 3, 6, 9, 53, 77, 78. számú vegyületek lényegesen jobb hatásúak, mint az összehasonlító (B) képletű vegyület. Az eredményeket az F táblázat mutatja.

A táblázat

Venturia vizsgálat (alma)/védőhatás

A hatóanyag képlete, illetve a vegyület száma	Hatásfok a kezeletlen kontrollhoz viszonyítva (%) 5 ppm hatóanyag-koncentrációnál
(B) képletű vegyület (ismert) találmány szerinti	60
5	82
27	85
22	85
114	84
13	95
16	96
55	95
57	100
58	99
76	94
81	93
108	97
139	84
160	85
162	97
165	85
198	85
240	83
255	93
(23) képletű vegyület	98
53	98
130	83
137	94
145	88
155	98

A hatóanyag képlete, illetve a vegyület száma	Hatásfok a kezeletlen kontrollhoz viszonyítva (%) 5 ppm hatóanyag-koncentrációnál
156	100
166	100
168	90
169	98
177	100
178	98
190	87
206	95
252	86
(28) képletű vegyület	92
(29) képletű vegyület	95
(30) képletű vegyület	83
(31) képletű vegyület	93

B táblázat

Plasmopara-vizsgálat (szőlő)/védőhatás

A hatóanyag képlete, illetve a vegyület száma	Hatásfok a kezeletlen kontrollhoz viszonyítva (%) 10 ppm hatóanyag-koncentrációnál
(C) képletű vegyület találmány szerinti	71
5	92
9	83
34	94
22	92
42	84
13	98
55	99
81	95
99	91
108	98
162	98
240	96
255	96
(24) képletű vegyület	91
69*	96
70*	100
74*	91
95*	97
130*	93
137*	88
145*	100
155*	86
206*	90

A hatóanyag képlete, illetve a vegyület száma	Hatásfok a kezeletlen kontrollhoz viszonyítva (%) 10 ppm hatóanyag-koncentrációnál
253*	100
254*	96
(26)* képletű vegyület	93
(27)* képletű vegyület	81

* A növényeket 21 °C hőmérsékletű és 90% légnedvesség-tartalmú üvegházban tartottuk 5 napig; a kiértékelést a beoltás után 6 nappal végeztük.

C táblázat

Phytophthora vizsgálat (paradicsom)/védőhatás

A hatóanyag képlete, illetve a vegyület száma	Hatásfok a kezeletlen kontrollhoz viszonyítva (%) 10 ppm hatóanyag-koncentrációnál
(C) képletű vegyület találmány szerinti	77
5	82
9	94

5

10

15

20

A hatóanyag képlete, illetve a vegyület száma	Hatásfok a kezeletlen kontrollhoz viszonyítva (%) 10 ppm hatóanyag-koncentrációnál
34	90
13	93
76	91
99	92
162	93
165	98
(25) képletű vegyület	93

D táblázat

Leptosphaeria nodorum vizsgálat (búza)/védőhatás

A hatóanyag képlete, illetve a vegyület száma	A hatóanyag koncentrációja a permetlében (tömeg%)	Hatásosság a kezeletlen kontrollhoz viszonyítva (%)
(A) képletű vegyület találmány szerinti	0,025	27
6	0,025	100

E táblázat

A találmány szerinti vegyületek hatásossága gombákkal szemben műszaki anyagokon vizsgálva
MHK (minimális gátló koncentráció) értékek mg/ml-ben

A vizsgált organizmus	A vegyület száma			
	6	11	7	4
Alternaria tenuis	20	35	10	5
Aspergillus niger	50	50	150	100
Aureobasidium pullulans	20	20	20	20
Chaetomium globosum	50	20	350	100
Cladosporium cladosporioides	20	35	20	10
Lentinus tigrinus	2	5	3,5	2
Penicillium glaucum	50	20	50	20
Sclerophom Pityophila	10	10	10	5
Trichoderma viride	100		200	200

E táblázat (folytatás)

A vizsgált organizmus	A vegyület száma				
	45	52	77	78	9
Alternaria tenuis	15	35	50	50	100
Aspergillus niger	20	50	50	50	20
Aureobasidium pullulans	20	50	50	50	75
Chaetomium globosum	10	10	50	50	20
Cladosporium cladosporioides	10	10	20	10	7,5
Lentinus tigrinus	7,5	5	5	5	5
Penicillium glaucum	20	20	50	35	10
Sclerophom pityophila	7,5	15	20	20	35
Trichoderma viride	200	100	200	150	200

E táblázat (folytatás)

A vizsgált organizmus	A vegyület száma				
	53	80	54	55	92
<i>Alternaria tenuis</i>	50	50	100	100	20
<i>Aspergillus niger</i>	50	50	50	100	50
<i>Aureobasidium pullulans</i>	50	50	50	50	35
<i>Chaetomium globosum</i>	50	50	50	50	50
<i>Cladosporium cladosporioides</i>	10	15	20	50	20
<i>Lentinus tigrinus</i>	5	10	5	10	20
<i>Penicillium glaucum</i>	< 20	50	20	20	50
<i>Sclerophom pityophila</i>	50	10	20	50	20
<i>Trichoderma viride</i>	200	200	200	500	200

E táblázat (folytatás)

A vizsgált organizmus	A vegyület száma	
	56	64
<i>Alternaria tenuis</i>	150	350
<i>Aspergillus niger</i>	20	500
<i>Aureobasidium pullulans</i>	50	200
<i>Chaetomium globosum</i>	5	10
<i>Cladosporium cladosporioides</i>	5	10
<i>Lentinus tigrinus</i>	3,5	5
<i>Penicillium glaucum</i>	10	50
<i>Sclerophom pityophila</i>	15	75
<i>Trichoderma viride</i>	200	1000

F táblázat

A találmány szerinti vegyületek hatásossága baktériumokkal szemben ipari anyagokon vizsgálva
MHK (minimális gátló koncentráció) értékek mg/ml-ben

A vizsgált organizmus	Összehasonlító vegyület (D)	A vegyület száma					
		6	4	77	78	9	53
<i>Aerobacter aerogenes</i>							200
<i>Aeromonas punctata</i>							200
<i>Bacillus mycoides</i>							200
<i>Bacillus subtilis</i>							100
<i>Escherichia coli</i>	> 5000	750	500	1000	1000	1000	100
<i>Leuconostoc mesenteroides</i>							200
<i>Proteus mirabilis</i>							500
<i>Pseudomonas aeruginosa</i>	> 5000						> 1000
<i>Pseudomonas fluorescens</i>							1000
<i>Staphylococcus aureus</i>		500	500	200	200	150	100

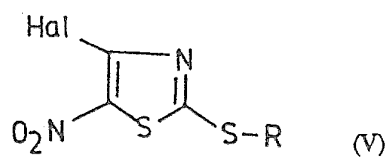
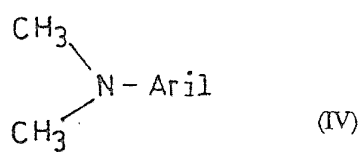
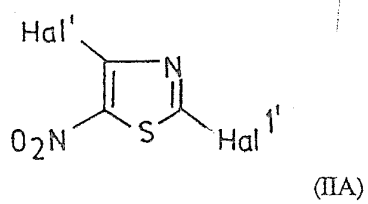
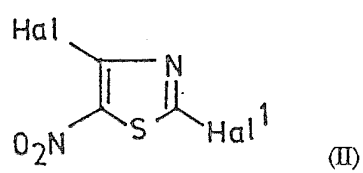
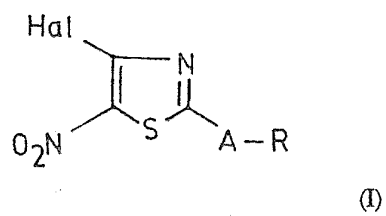
SZABADALMI IGÉNYPONTOK

1. Gomba- és baktériumölő hatású készítmények, azzal jellemezve, hogy hatóanyagként 0,1–95 tömeg% mennyiségben (I) általános képletű 4-halogén-5-nitro-tiazol-származékot – a képletben

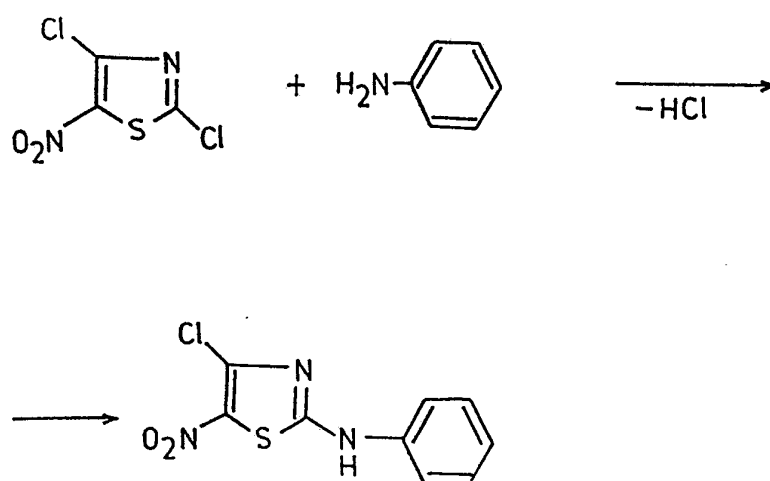
55 Hal jelentése halogénatom,
A jelentése oxigén-, kénatom, szulfonil-, szulfonilcsoport vagy
R¹
|
–N– képletű csoport, amelyben

- R¹ jelentése hidrogénatom, 1–4 szénatomos alkil-, 3–6 szénatomos alkenil-, ciano-(1–4 szénatomos alkil)-, fenil-(1–4 szénatomos alkil)- vagy fenilcsoport,
- R jelentése 1–7 szénatomos alkil-, 3–6 szénatomos alkenil-, 1–4 szénatomos halogén-alkil-, 2–6 szénatomos alkoxi-alkil-, ciano-(1–4 szénatomos alkil)-, a fenilrészben egy halogénatommal adott esetben szubsztituált fenil-(1–4 szénatomos alkil)-, egy 1–4 szénatomos alkilcsoporttal adott esetben szubsztituált 3–8 szénatomos cikloalkilcsoport, naftilcsoport vagy (c) általános képletű csoport, ebben a képletben
- R² jelentése hidrogén-, halogénatom, 1–4 szénatomos alkil-, 1–3 szénatomos perfluor-alkil-, 3–6 szénatomos alkenil-, 1–4 szénatomos alkoxi-, nitro-, ciano-, 1–3 szénatomos perfluor-alkil-tio-, fenoxi-, (1–4 szénatomos alkil)- karbonil- vagy N-(1–4 szénatomos alkil)-N-(1–4 szénatomos alkil-szulfonil)-amino-csoport,
- R³ jelentése hidrogén-, halogénatom, 1–4 szénatomos alkil-, 1–3 szénatomos perfluor-alkil-, 1–4 szénatomos alkoxi-, formil-amino-, nitro-, ciano-, 1–3 szénatomos perfluor-alkil-tio-, (1–4 szénatomos alkoxi)-karbonil- vagy di(1–4 szénatomos alkil)-amino-csoport,
- R⁴ jelentése hidrogén-, halogénatom, 1–12 szénatomos alkil-, 1–3 szénatomos perfluor-alkil-, 1–4 szénatomos alkoxi-, 1–3 szénatomos perfluor-alkoxi-, 1–4 szénatomos alkil-tio-, 1–3 szénatomos perfluor-alkil-tio-, 1–4 szénatomos alkil-szulfonil-, amino-szulfonil-, egy vagy két cianocsoporttal adott esetben szubsztituált 2–6 szénatomos alkenil-, fenil-, 3–8 szénatomos cikloalkilcsoport, karbamoil-, (1–4 szénatomos alkil)-karbamoil-, (1–4 szénatomos alkil)-karbonil-, (1–4 szénatomos alkoxi)-karbonil-, nitro-, cianocsoport vagy
- R⁷
/
-N általános képletű csoport, amelyben
\
R⁸
- R⁷ jelentése 1–4 szénatomos alkil-, (1–4 szénatomos alkil)-karbonil-, formil- vagy 1–4 szénatomos alkil-szulfonil-csoport,
- R⁸ jelentése hidrogénatom vagy 1–4 szénatomos alkilcsoport,
- R⁵ jelentése hidrogén-, halogénatom, 1–4 szénatomos alkil-, 1–3 szénatomos perfluor-alkil-, 1–4 szénatomos alkoxi- vagy (1–4 szénatomos alkoxi)-karbonil-csoport,
- R⁶ jelentése hidrogén-, halogénatom, 1–4 szénatomos alkil-, 1–4 szénatomos alkoxi- vagy (1–4 szénatomos alkoxi)-karbonil-csoport, vagy
- R és R¹ a kapcsolódó nitrogénatommal együtt képezhet – egy vagy két 1–4 szénatomos alkilcsoporttal adott esetben szubsztituált – pirrolil-, pirazolil-, imidazolil-, tirazolil-, pirrolidinil-, piperidinil-, perhidroazepinil- vagy morfolinilcsoportot, tartalmaznak szilárd hodrozóanyagokkal – célszerűen természetes vagy szintetikus közetlisztekkel – és/vagy folyékony hígítószerrel – célszerűen szerves oldószerekkel, így adott esetben halogénezett szénhidrogénekkel, rövid szénláncú dialkil-formamidokkal vagy dimetil-szulfoxiddal – és adott esetben felületaktív anyagokkal – célszerűen emulgeálószerrel, így poli(oxi-etilén)-zsírsav-észterekkel, poli(oxi-etilén)-zsíralkohol-éterekkel, alkil-szulfonátokkal, alkil-szulfátokkal, aril-szulfonátokkal, alkil-szulfátokkal, aril-szulfonátokkal, valamint fehérje-hidrolizátumokkal és/vagy diszpergálószerrel, így ligninnel, szulfitszennylúggal vagy metil-cellulózzal – összekeverve.
2. Eljárás (I) általános képletű 4-halogén-5-nitro-tiazol-származékok – a képletben
- Hal jelentése halogénatom,
- A jelentése oxigén-, kénatom, szulfonil-, szulfonilcsoport
- R¹
|
vagy -N- képletű csoport, amelyben
- R¹ jelentése hidrogénatom, 1–4 szénatomos alkil-, 3–6 szénatomos alkenil-, ciano-(1–4 szénatomos alkil)-, fenil-(1–4 szénatomos alkil)- vagy fenilcsoport,
- R jelentése 1–6 szénatomos alkil-, 3–6 szénatomos alkenil-, 1–4 szénatomos halogén-alkil-, 2–6 szénatomos alkoxi-alkil-, ciano-(1–4 szénatomos alkil)-, a fenilrészben egy halogénatommal adott esetben szubsztituált fenil-(1–4 szénatomos alkil)-, egy 1–4 szénatomos alkilcsoporttal adott esetben szubsztituált 3–8 szénatomos cikloalkilcsoport, naftilcsoport vagy (c) általános képletű csoport, ebben a képletben
- R² jelentése hidrogén-, halogénatom, 1–4 szénatomos alkil-, 1–3 szénatomos perfluor-alkil-, 3–6 szénatomos alkenil-, 1–4 szénatomos alkoxi-, nitro-, ciano-, 1–3 szénatomos perfluor-alkil-tio-, fenoxi-, (1–4 szénatomos alkil)- karbonil- vagy N-(1–4 szénatomos alkil)-N-(1–4 szénatomos alkil-szulfonil)-amino-csoport,
- R³ jelentése hidrogén-, halogénatom, 1–4 szénatomos alkil-, 1–3 szénatomos perfluor-alkil-, 1–4 szénatomos alkoxi-, formil-amino-, nitro-, ciano-, 1–3 szénatomos perfluor-alkil-tio-, (1–4 szénatomos alkoxi)-karbonil- vagy di(1–4 szénatomos alkil)-amino-csoport,
- R⁴ jelentése hidrogén-, halogénatom, 1–12 szénatomos alkil-, 1–3 szénatomos perfluor-alkil-, 1–4 szénatomos alkoxi-, 1–3 szénatomos perfluor-alkoxi-, 1–4 szénatomos alkil-tio-, 1–3 szénatomos perfluor-alkil-tio-, 1–4 szénatomos alkil-szulfonil-, amino-szulfonil-, egy vagy két cianocsoporttal adott esetben szubsztituált 2–6 szénatomos alkenil-, fenil-, 3–8 szénatomos cikloalkilcsoport, karbamoil-, (1–4 szénatomos alkil)-karbamoil-, (1–4 szénatomos alkil)-karbonil-, (1–4 szénatomos alkoxi)-karbonil-, nitro-, cianocsoport vagy

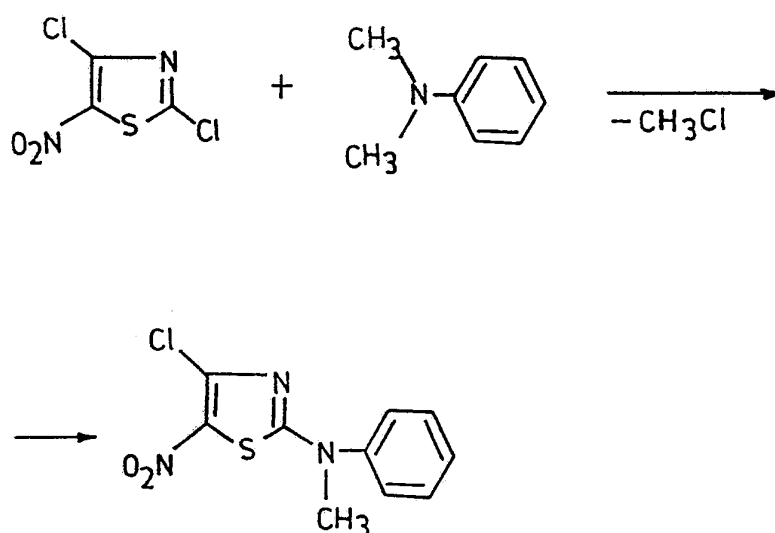
- R^7
 $\diagup$
 $-N$ általános képletű csoport, amelyben
 $\diagdown$
 R^8
- R^7 jelentése 1–4 szénatomos alkil-, (1–4 szénatomos alkil)-karbonil-, formil- vagy 1–4 szénatomos alkil-szulfonil-csoport,
 R^8 jelentése hidrogénatom vagy 1–4 szénatomos alkilcsoport,
 R^5 jelentése hidrogén-, halogénatom, 1–4 szénatomos alkil-, 1–3 szénatomos perfluor-alkil-, 1–4 szénatomos alkoxi- vagy (1–4 szénatomos alkoxi)-karbonil-csoport,
 R^6 jelentése hidrogén-, halogénatom, 1–4 szénatomos alkil-, 1–4 szénatomos alkoxi- vagy (1–4 szénatomos alkoxi)-karbonil-csoport, vagy
 R és R^1 a kapcsolódó nitrogénatommal együtt képezhet – egy vagy két 1–4 szénatomos alkilcsoporttal adott esetben szubsztituált – pirrolil-, pirazolil-, imidazolil-, triazolil-, pirrolidinil-, piperidinil-, perhidrozepinil- vagy morfolinilcsoportot, előállítására, *azzal jellemezve*, hogy
a) az A helyén oxigénatomot, kénatomot, SO_2 képletű csoportot vagy NR^1 általános képletű csoportot tartalmazó vegyületek előállítására a (II) általános képletű 2,4-dihalogén-5-nitro-tiazol-származékot – a képletben
- Hal és Hal^1 jelentése azonos vagy különböző halogénatom – a (III) általános képletű nukleofil vegyülettel – a képletben
 R jelentése a megadott és
5 A' jelentése oxigénatom, kénatom, SO_2 képletű csoport vagy NR^1 általános képletű csoport – a képletben
 R^1 jelentése a megadott –
vagy fémsóval képzett származékával reagáltatjuk savmegkötőszer jelenlétében, valamint hígítószer jelenlétében, vagy
10 b) az olyan (I) általános képletű vegyületek előállítására, amelyeknek képletében az A–R molekularész jelentése (a) általános képletű csoport, a (II) általános képletű 2,4-dihalogén-5-nitro-tiazol-származékot a (IV) általános képletű N,N-dimetil-aril-aminnal – a képletben
15 Aril jelentése az R jelentésénél megadott arilcsoportok – reagáltatjuk hígítószer jelenlétében, vagy
20 c) az A helyén SO_2 vagy SO képletű csoportot tartalmazó vegyületek előállítására az (V) általános képletű 4-halogén-5-nitro-tiazolil-szulfidot – a képletben Hal és R jelentése a megadott –
 α) legalább 2 mól oxidálószerrel reagáltatjuk a reakciókörülmények között inert hígítószer jelenlétében, illetve
25 β) 1 mól oxidálószerrel reagáltatjuk a reakciókörülmények között inert hígítószer jelenlétében.



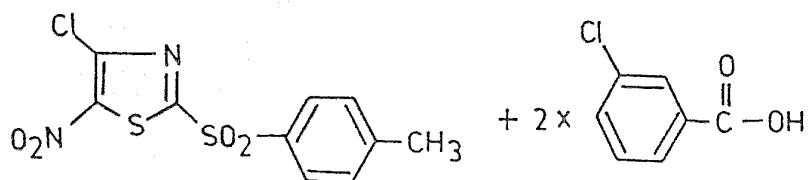
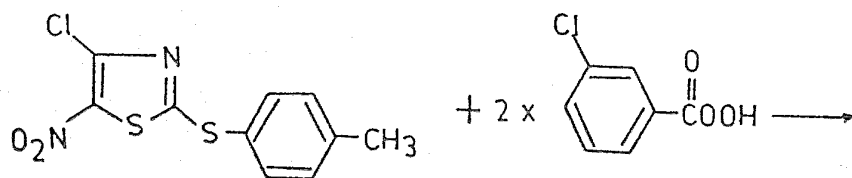
a) reakcióvázlat



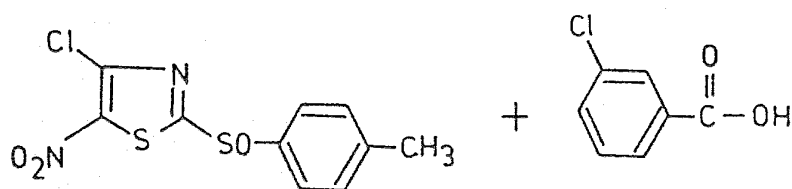
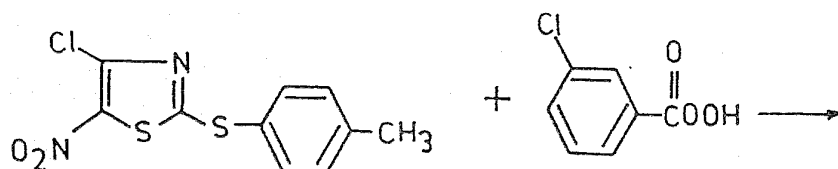
b) reakcióvázlat



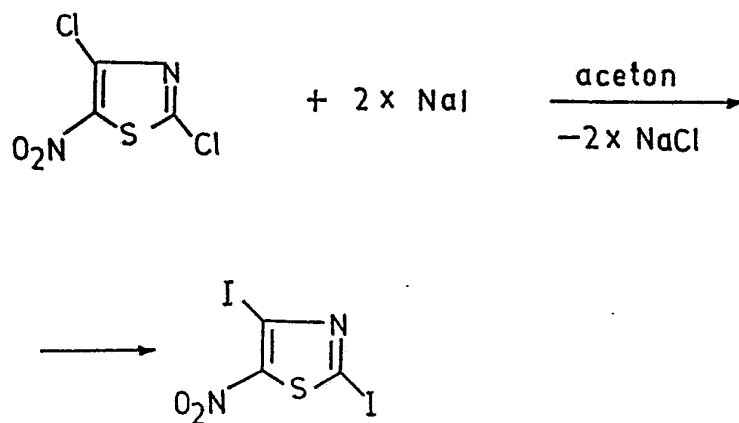
c₁) reakcióvázlat



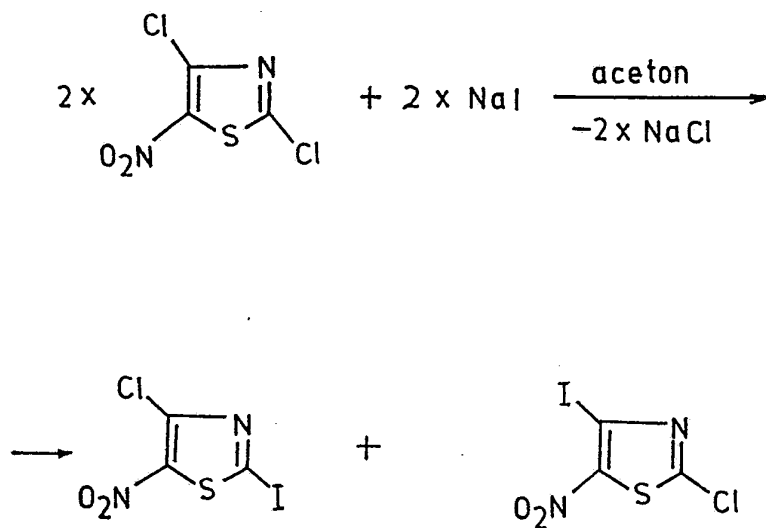
c₂) reakcióvázlat

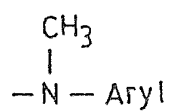


d₁) reakcióvázlat

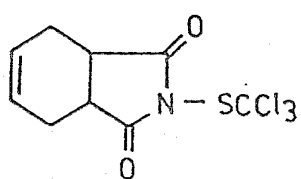


d₂) reakcióvázlat

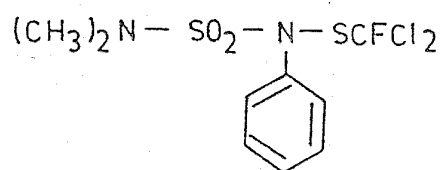




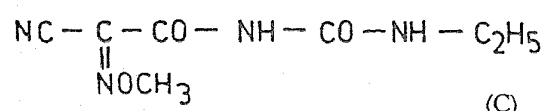
(a)



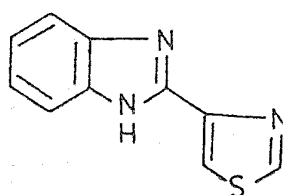
(A)



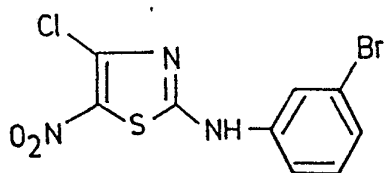
(B)



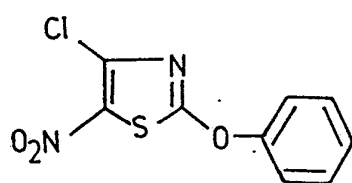
(C)



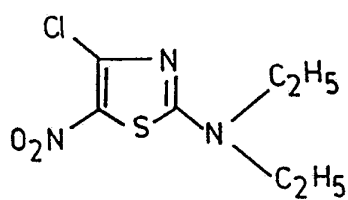
(D)



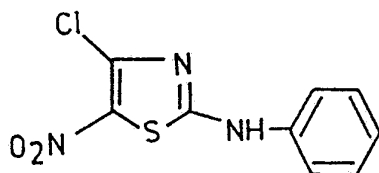
(1)



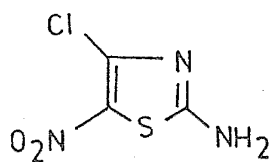
(2)



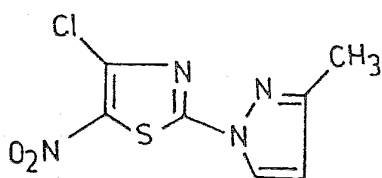
(3)



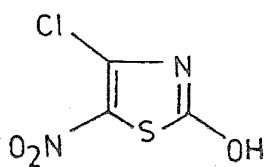
(4)



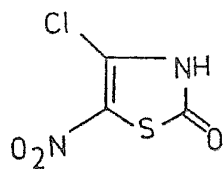
(5)



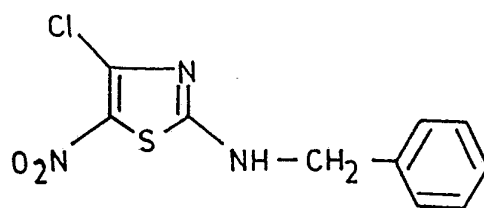
(6)



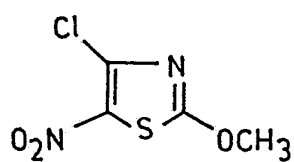
(7)



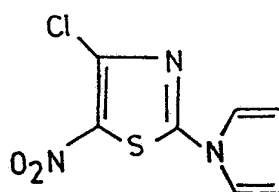
(8)



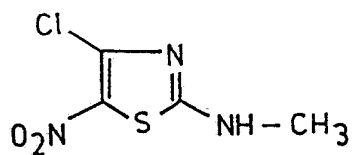
(9)



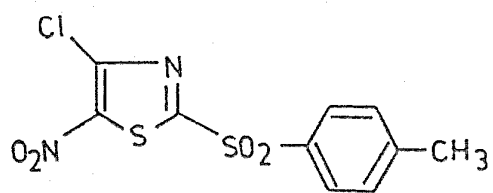
(10)



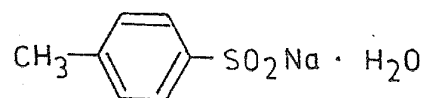
(11)



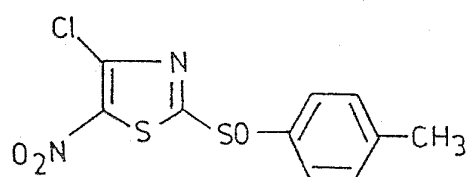
(12)



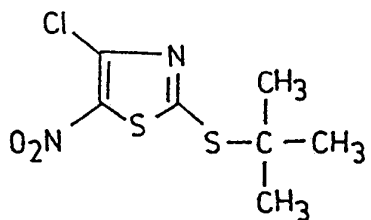
(13)



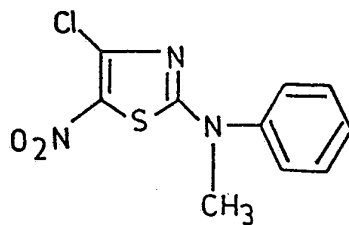
(14)



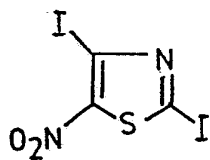
(16)



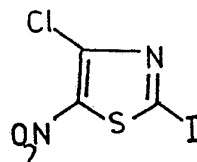
(17)



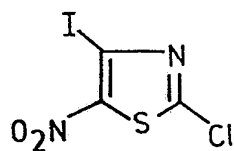
(18)



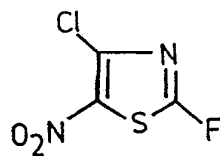
(19)



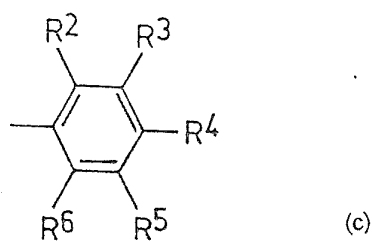
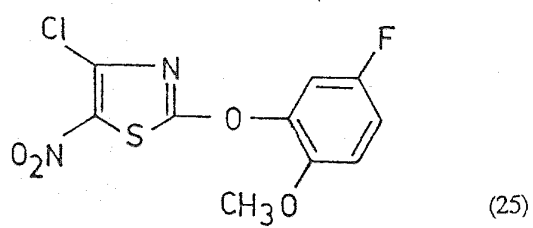
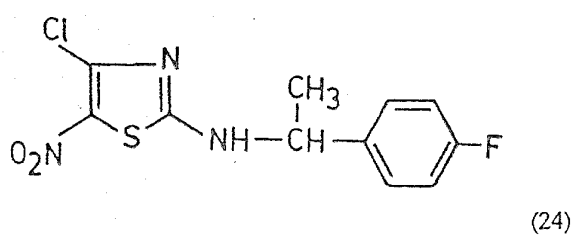
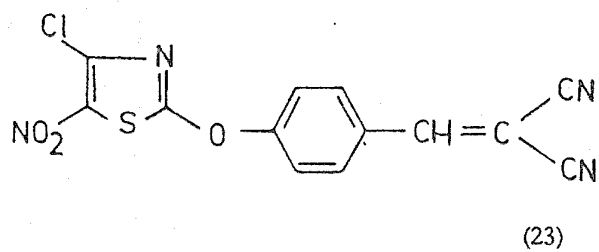
(20)

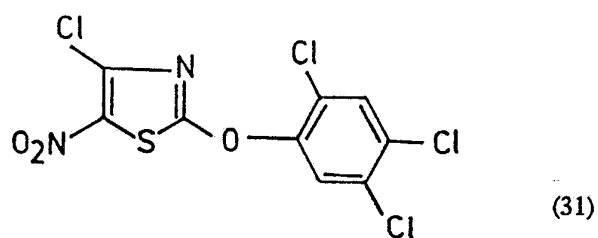
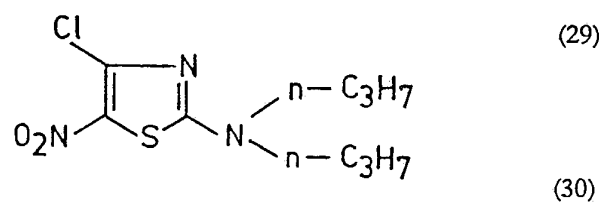
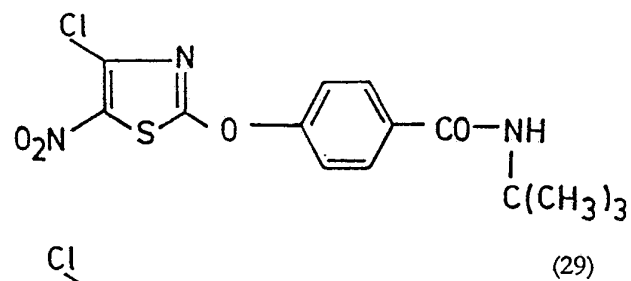
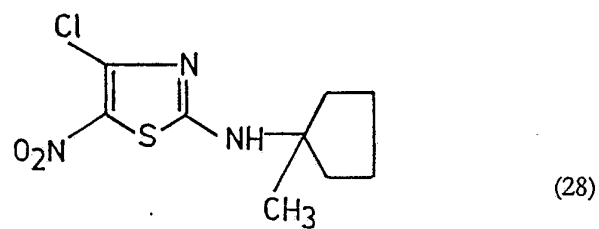
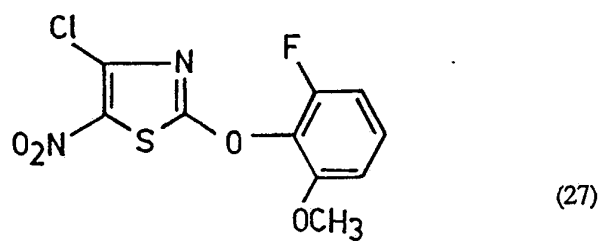
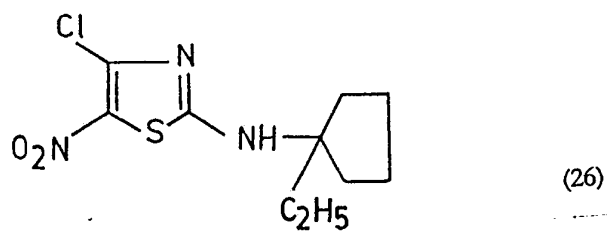


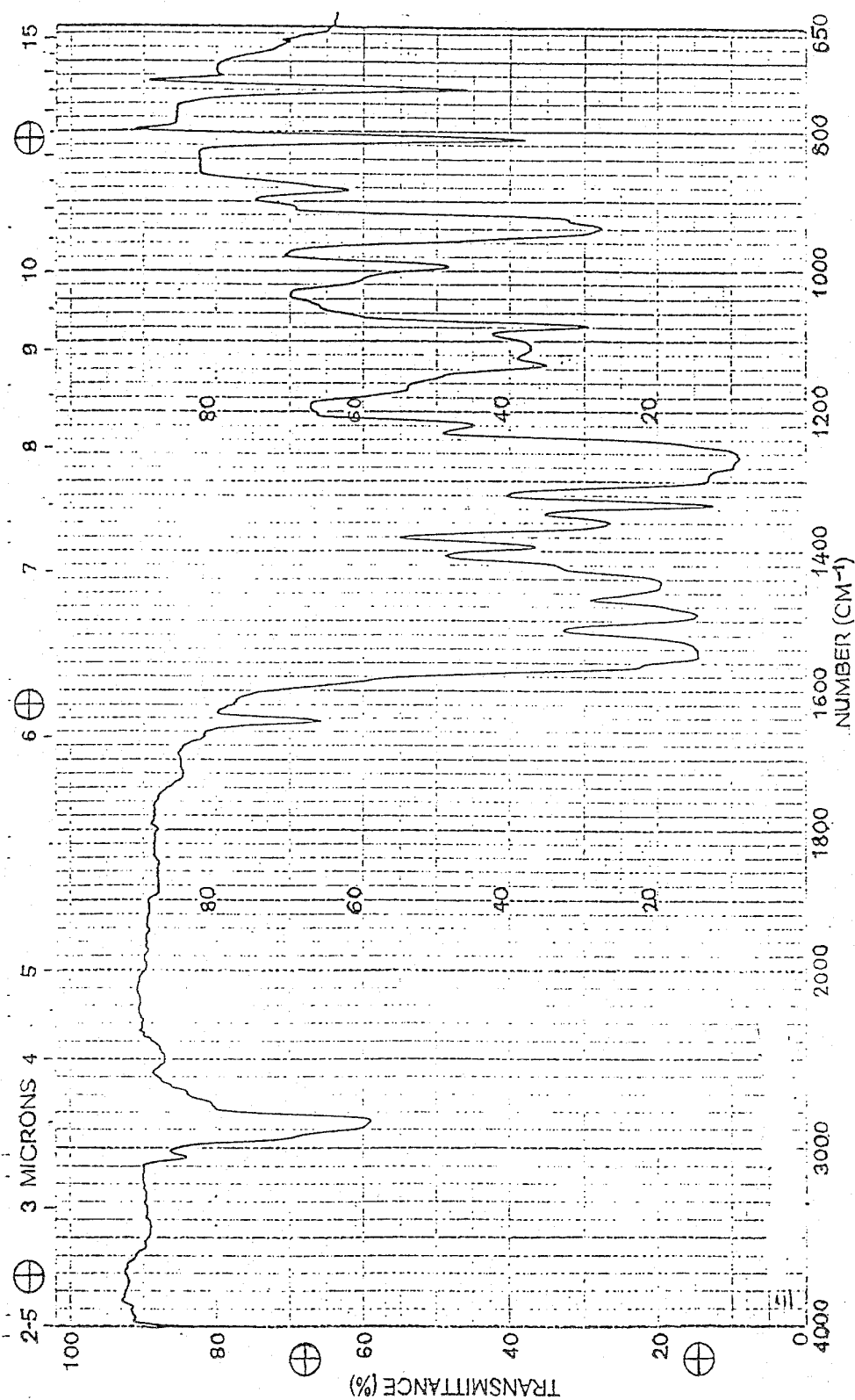
(21)

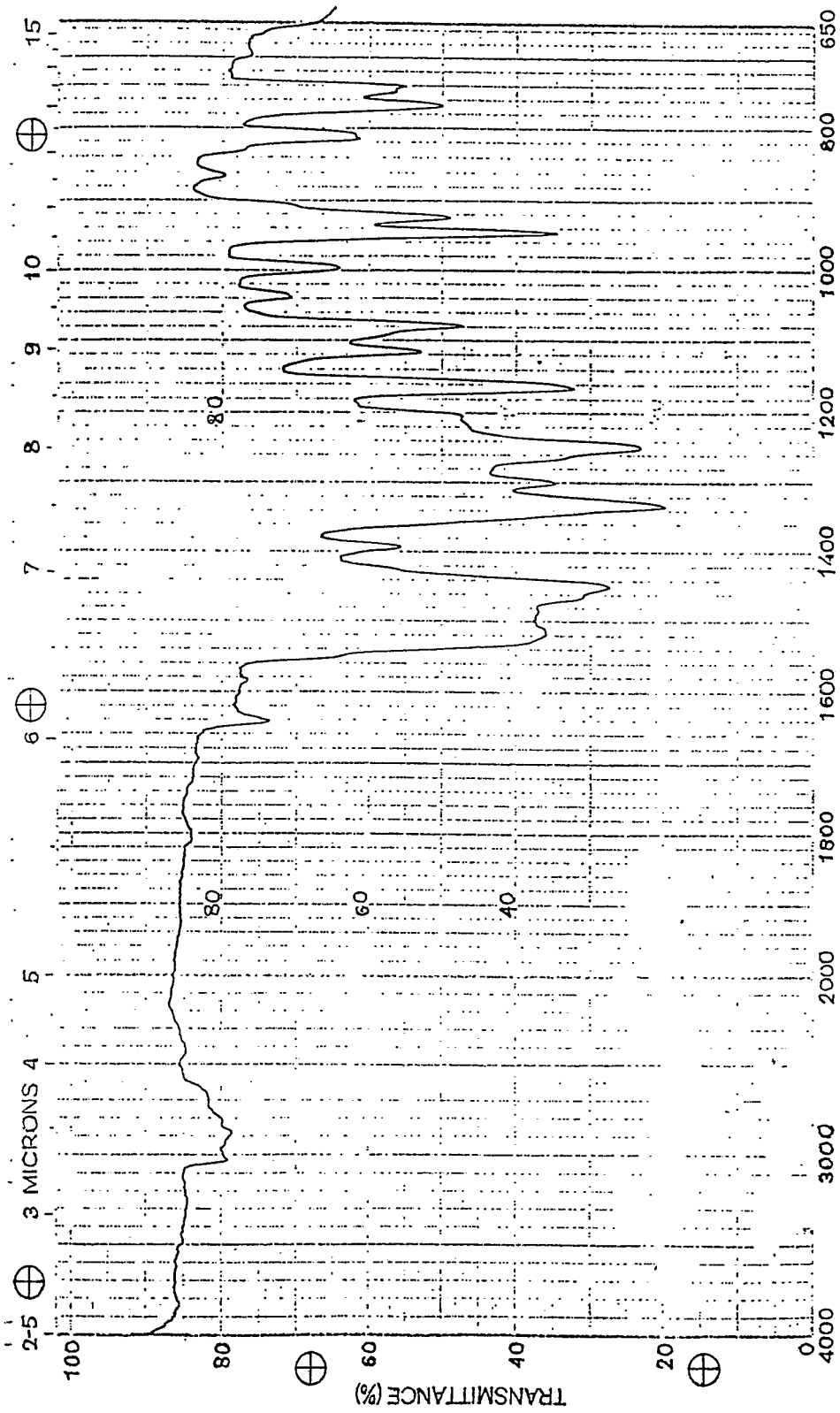


(22)

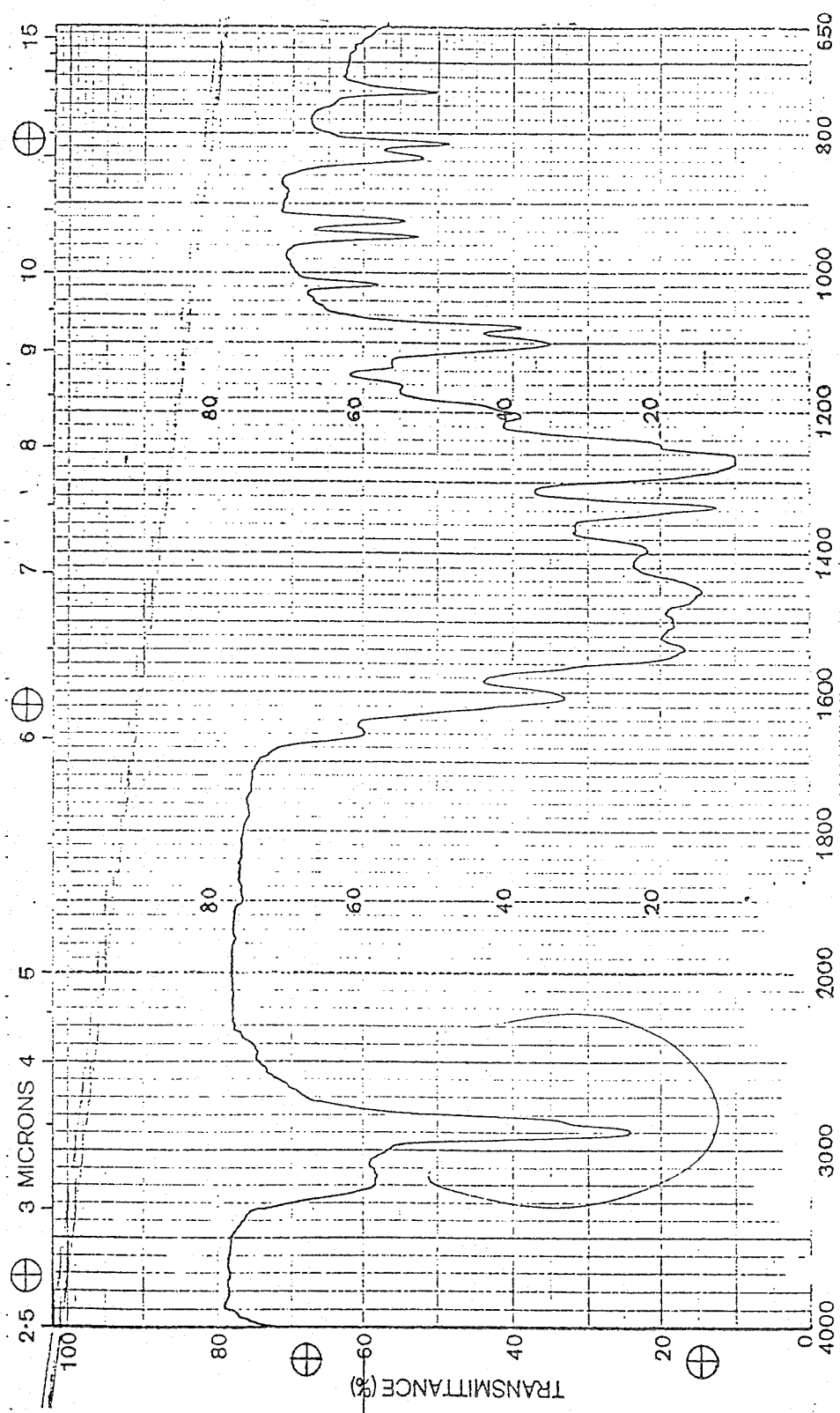








HU 206 249 B
Int.Cl.⁵: A 01 N 43/78



Kiadja az Országos Találmányi Hivatal, Budapest
A kiadásért felel: dr. Szvoboda Gabriella osztályvezető
ARCANUM Bt. - BUDAPEST