

(19) Országkód:

HU



**MAGYAR
KÖZTÁRSASÁG**

**MAGYAR
SZABADALMI
HIVATAL**

SZABADALMI LEÍRÁS

(11) Lajstromszám:

212 625 B

(21) A bejelentés ügyszáma: P 92 02328

(22) A bejelentés napja: 1992. 07. 15.

(30) Elsőbbségi adatok:

P 41 23 525.8

1991. 07. 16. DE

(51) Int. Cl.⁶

A 01 N 43/54

C 07 D 239/48

C 07 D 405/12

C 07 D 413/12

C 07 D 409/12

C 07 D 403/12

C 07 D 417/12

(40) A közzététel napja: 1993. 06. 28.

(45) A megadás meghirdetésének dátuma a Szabadalmi
Közlönyben: 1996. 09. 30.

(72) Feltalálók:

dr. Ditrich, Klaus, Bad Dürkheim (DE)
dr. Gerber, Matthias, Mutterstadt (DE)
dr. Hamprecht, Gerhard, Weinheim (DE)
dr. Walter, Helmut, Obrigheim (DE)
dr. Westphalen, Karl-Otto, Speyer (DE)

(73) Szabadalmas:

BASF AG, Ludwigshafen/Rhein (DE)

(74) Képviselő:

S.B.G. & K. Budapesti Nemzetközi Szabadalmi
Iroda, Budapest

**(54) Hatóanyagként szubsztituált pirimidinszármazékot tartalmazó gyomirtó
készítmény és eljárás a hatóanyagok előállítására, valamint gyomirtási eljárás**

(57) KIVONAT

A találmány szerinti készítmény hatóanyagának (I) általános képletében

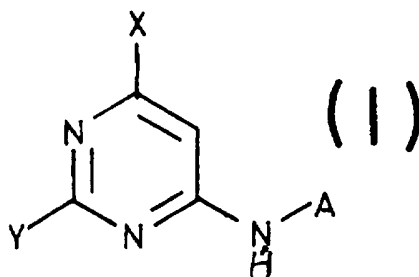
A jelentése 7–12 szénatomos bi- vagy tricikloalkil-csoport, amelyben egy hattagú részgyűrű aromás is lehet, továbbá adott esetben 1–4 szénatomos alkil-csoporttal szubsztituált, vagy 1–4 szénatomos alkoxicsoporttal szubsztituált fenilcsoport vagy $-CR^2R^3R^4$ általános képletű csoport, amelyben R^2 és R^3 egymástól függetlenül hidrogénatomot vagy 1–4 szénatomos alkilcsoportot jelentenek, és R^4 jelentése 1- vagy 2-naftil-csoport, 4–8 szénatomos cikloalkilcsoport, 7–9 szénatomos bicikloalkilcsoport, olyan telített vagy telítetlen 5-6-tagú, heterociklusos csoport, amely heteroatomként egy vagy két oxigénatomot vagy egy nitrogén- vagy

kénatomot vagy egy oxigén- és egy nitrogénatomot tartalmaz és adott esetben kondenzált, továbbá adott esetben 1–4 szénatomos alkilcsoporttal szubsztituált, ciklopropilcsoport, ha Y aminocsoport és X jelentése trifluor-metil-csoporttól eltérő, adott esetben halogénatommal szubsztituált fenilcsoport, 2–5 szénatomos alkinilcsoport,

X jelentése halogénatom, 1–3 szénatomos halogén-alkil- vagy 1–3 szénatomos halogén-alkoxi-csoport, és

Y jelentése $-NHR^5$ általános képletű csoport, amelyben

R^5 jelentése hidrogénatom, 1–6 szénatomos alkil- vagy 1–4 szénatomos alkoxicsoport.



A találmány tárgya az (I) általános képletű új pirimidin-származékokat, valamint szerves vagy szervetlen savakkal képzett addíciós sókat hatóanyagként tartalmazó gyomirtó készítmények, valamint eljárás a hatóanyagok előállítására és alkalmazására.

Az (I) általános képletben

A jelentése 7–12 szénatomos bi- vagy tricikloalkil-csoport, amelyben egy hattagú részgyűrű aromás is lehet, továbbá adott esetben 1–4 szénatomos alkil-csoporttal szubsztituált, vagy 1–4 szénatomos alkoxi-csoporttal szubsztituált fenilcsoport vagy $-CR^2R^3R^4$ általános képletű csoport, amelyben R^2 és R^3 egymástól függetlenül hidrogénatomot vagy 1–4 szénatomos alkilcsoportot jelentenek, és R^4 jelentése 1- vagy 2-naftil-csoport, 3–8 szénatomos cikloalkilcsoport, 7–9 szénatomos bicikloalkil-csoport, olyan telített vagy telítetlen 5–6-tagú, heterociklusos csoport, amely heteroatomként egy vagy két oxigénatomot tartalmaz és adott esetben benzolgyűrűvel kondenzált vagy 5–6-tagú, heteroatomként egy nitrogén- vagy kénatomot vagy egy oxigén- és egy nitrogénatomot tartalmazó heteroaromás csoport, és e heterociklusos csoportok adott esetben 1–4 szénatomos alkilcsoporttal szubsztituáltak; a 2-furil-, 2-tienil-, 2-pirrolil-, N-metil-2-pirrolil-, 2- és 3-piridil-csoport kivételével, ha R^2 és R^3 hidrogénatomot jelent és Y jelentése 1–4 szénatomos alkoxi-amino-csoporttól eltérő, ciklopropilcsoport, ha Y aminocsoport és X jelentése trifluor-metil-csoporttól eltérő, adott esetben halogénatommal szubsztituált fenilcsoport, ha Y aminocsoport és X 1–3 szénatomos halogén-alkil- vagy 1–3 szénatomos halogén-alkoxi-csoport vagy ha Y 1–6 szénatomos alkil-amino-csoport és X 1–3 szénatomos halogén-alkoxi-csoport, 2–5 szénatomos alkinilcsoport, ha Y 1–4 szénatomos alkoxi-amino-csoport és X klóratom vagy 1–3 szénatomos halogén-alkil-csoport,

X jelentése halogénatom, 1–3 szénatomos halogén-alkil- vagy 1–3 szénatomos halogén-alkoxi-csoport, és

Y jelentése $-NHR^5$ általános képletű csoport, amelyben R^5 jelentése hidrogénatom, 1–6 szénatomos alkil- vagy 1–4 szénatomos alkoxi-csoport, kivéve a metoxi-csoportot, ha R^4 fenilcsoport.

A találmány tárgya továbbá eljárás az (I) általános képletű pirimidinszármazékok előállítására, valamint eljárás a találmány szerinti gyomirtó készítményekkel a gyomnövények irtására.

Gyomirtó hatású pirimidinszármazékok egész sora ismert a szakirodalomban. A DE-A 20 65 629 és a DE-A 20 06 145 olyan gyomirtó hatású 2-amino-6-klór-pirimidin-származékokat ismertet, amelyek képletében a 4-es helyzetben alkil-, allil- vagy ciklohexilcsoport van.

További gyomirtó hatású pirimidin-származékokat ismertetnek: DE-A 26 30 140, DE-A 36 01 800, EP-A 254 183, EP-A 332 963, DE-A 37 17 480 valamint a következő japán nyilvánossághozataltal iratok: JO 1-250-363 (1988. 12. 27.) és J6 3-313-777 (1987. 06.

17.) Ezek a vegyületek azonban a gyomnövényekkel szemben mutatott nem kielégítő szelektivitásuk miatt hagynak még kívánnivalót.

Feladatunk az volt, hogy a szubsztituált pirimidin-származékok csoportjából olyan új vegyületeket találjunk, amelyeknek jobb gyomirtó hatása van. Azt találtuk, hogy a fent definiált pirimidin-származékok ennek a feladatnak megfelelnek.

Továbbá azt találtuk, hogy az (I) általános képletű vegyületeknek valamint sóiknak jó szelektivitásuk van a gyomnövényekkel szemben a gabonában és a kukoricában.

Addíciós sóik alatt a következő szervetlen vagy szerves savakkal képzett sókat kell érteni: hidrogén-halogenidek, így a hidrogén-klorid és a hidrogén-bromid, foszforsav, kénsav, hidrogén-bór-tetrafluorid, perklórsav, az alkil-kénsavak, így a metil- és az etil-kénsav, naftoesavak, benzoessav, a halogén-benzoessavak, ecetsav, a halogén-ecetsavak, így a triklór-ecetsav, aminosav, propionsav, a halogén-propionsavak, vajsav, tejsav, sztearinsav, az alifás dikarbonsavak, így az oxálsav, borkősav, maleinsav, az aromás szulfonsavak, így a p-toluolszulfonsav stb.

Optikailag aktív (I) általános képletű vegyületek esetén a találmány tárgya felöleli mind a racémátokat, mind pedig a lehetséges összes enantiomert.

Különösen előnyösek azok az (I) általános képletű pirimidin-származékok, amelyek képletében a szubsztituensek a következő jelentésűek:

30 X = klóratom,

Y = aminocsoport,

A = $-CHR^3R^4$ általános képletű csoport, a képletben

R^3 = hidrogénatom, 1–4 szénatomos alkilcsoport,

R^4 = 2-naftil-, 3–8 szénatomos cikloalkil-, biciklo-[2.2.1]hept-2-il-, 2-benzofuril-, 3-tienil-, 2-tetrahidrofuril-, 2-indanil-, 2-tetrahidroindanil-, 3-benzopiranyilcsoport;

továbbá

X = klóratom,

40 Y = 1–4 szénatomos alkoxi-amino-csoport,

A = $-CHR^3R^4$ általános képletű csoport, a képletben

R^3 = hidrogénatom, 1–4 szénatomos alkilcsoport,

R^4 = 1-naftil-, 3–8 szénatomos cikloalkil-, fenil-, 3-klór-fenil-, 2-furil-, 3-izopropil-izoxazol-5-il-, 3-tienil-, 3-tetrahidrofuril-, 2-tetrahidroindanil-csoport;

továbbá

X = trifluor-metoxi-csoport,

Y = aminocsoport,

50 A = $-CHR^3R^4$ általános képletű csoport, a képletben

R^3 = hidrogénatom, 1–4 szénatomos alkilcsoport,

R^4 = 1-naftil-, 3–8 szénatomos cikloalkil-, fenil-, 3-tienil-, 2-benzofuranil-csoport,

továbbá

55 X = trifluor-metil-csoport,

Y = aminocsoport,

A = $-CHR^3R^4$ általános képletű csoport, a képletben

R^3 = hidrogénatom, 1–4 szénatomos alkilcsoport,

R^4 = 1-naftil-, 3–8 szénatomos cikloalkil-, fenil-, 3-tienil-, 2-tetrahidrofuril-, 1-indanil-csoport.

A találmány tárgya továbbá eljárás a hatóanyagok előállítására, valamint gyomirtó készítmények, amelyek hatóanyagként legalább egy (I) általános képletű vegyületet tartalmaznak, a képletben a szubsztituensek a fenti jelentésűek.

A találmány szerinti (I) általános képletű pirimidin-származékokat különböző szintézisutakon állíthatjuk elő; ezeket például a következő eljárásokkal nyerhetjük:

1.) (II) általános képletű pirimidin-származékot – a képletben X és Y a fentiekben megadott jelentésűek, és Z nukleofil eliminálódó csoportot, így halogénatomot, előnyösen fluor-, klór- vagy brómatomot jelent – (III) általános képletű aminnal reagáltatunk, a képletben A a fentiekben megadott jelentésű.

A reakciót célszerűen úgy hajtjuk végre, hogy a (II) általános képletű pirimidin-származéknak közömbös szerves oldószerrel készült oldatához hozzáadjuk a (III) általános képletű amin és valamelyik szerves bázis elegyét, majd a reakciót emelt hőmérsékleten a befejeződéséig folytatjuk.

A reakcióelegyet a szokásos módon dolgozhatjuk fel, például vizes extrakcióval, a bázis-hidroklorid eltávolítására, a termék leszívásával vagy szerves oldószeres extrakcióval, és a szerves oldószer lehajtásával.

A reakcióhoz célszerűen oldószert használunk, így halogénezett szénhidrogéneket, például tetraklór-etánt, diklór-metánt, kloroformot, diklór-etánt, klór-benzolt és o-diklór-benzolt; étereket, például dietil-étert, metil-terc-butil-étert, dimetoxi-etánt, dietilén-glikol-dietil-étert, tetrahidrofuránt vagy dioxánt; poláros aprotikus oldószereket, például acetonitrilt, dimetil-formamidot, dimetil-acetamidot, dimetil-szulfoxidot, N-metil-pirrolidont, 1,3-dimetil-tetrahidro-2(1H)-pirimidinont, 1,3-dimetil-imidazolin-2-ont; aromás vegyületeket, például benzolt, toluolt, xilolt, piridint és kinolint; ketonokat, például acetont, metil-etil-ketont, alkoholokat, pl. etanolt, propanolt, izopropanolt vagy ezek megfelelő elegyeit.

A reakció hőmérséklete 50 °C-tól a mindenkori oldószert, illetve reakcióelegyet refluxhőmérsékletéig, előnyösen azonban 70 °C-tól 150 °C-ig terjedő érték.

A kiindulási vegyületek moláris aránya, azaz a (III) általános képletű aminnak, illetve a szerves bázisnak a (II) általános képletű pirimidin-származékra vonatkoztatott molaránya (0,9:1)-től (1,3:1)-ig terjedő érték. A reakcióban azonban a 2 mól (III) általános képletű amin/1 mól (II) általános képletű pirimidin-származék molarányt is alkalmazhatjuk.

A kiindulási vegyületeknek az oldószerben illetve a reakcióelegyben való koncentrációja általában 0,1–5, előnyösen azonban 0,2–2 mól/l.

2.) Az (I) általános képletű vegyületek előállítására egy további eljárás abban áll, hogy (IV) általános képletű pirimidin-származékot – a képletben X a fentiekben megadott jelentésű és Z halogénatomot jelent – előbb (V) általános képletű nukleofil vegyülettel reagáltatunk – a képletben Y a fenti oxigén- vagy nitrogénatomhoz kötődő csoportot jelent – majd az így kapott (II) általános képletű vegyületet (III) általános

képletű aminnal reagáltatva nyerjük a megfelelő (I) általános képletű terméket.

A reakcióhoz célszerűen oldószert használunk, így halogénezett szénhidrogéneket, például tetraklór-etánt, diklór-metánt, kloroformot, klór-benzolt és o-diklór-benzolt; étereket, így dietil-étert, metil-terc-butil-étert, dimetoxi-etánt, dietilén-glikol-dimetil-étert, tetrahidrofuránt és dioxánt; poláros aprotikus oldószereket, például acetonitrilt, dimetil-formamidot, dimetil-acetamidot, dimetil-szulfoxidot, N-metil-pirrolidont, 1,3-dimetil-tetrahidro-2(1H)-pirimidinont és 1,3-dimetil-imidazolin-2-ont; aromás vegyületeket, például benzolt, toluolt, xilolt, piridint és kinolint; ketonokat, például acetont, metil-etil-ketont, alkoholokat, például etanolt, propanolt, izopropanolt vagy ezek megfelelő elegyeit.

Hasznos lehet, ha az első reakciólépést savmegkötő szer jelenlétében hajtjuk végre. A reakcióban savmegkötő szerként használhatjuk előnyösen az aromás nitrogénbázisokat, így a piridint, a 4-(dimetil-amino)-piridint és a kinolint; a tercier alifás aminokat, így a trietil-amint, N-etil-N,N-diizopropil-amint és az N-metil-morfolint; a bi- és triciklusos aminokat, így a diazabicykloheptánt (DABCO) és a diaza-bicykloheptánt (BBU); vagy az alkálifémek vagy alkáliföldfémek karbonátjait illetve hidrogén-karbonátjait, például nátrium-karbonátot, kálium-karbonátot, nátrium-hidrogén-karbonátot és kálium-hidrogén-karbonátot. Hasznos lehet a reakcióhoz a fenti bázisok kombinációit használni.

Az (V) általános képletű nukleofil vegyület és a savmegkötő szer molaránya általában (1:0,5)-től (1:5)-ig terjedő érték.

A reakciót az első reakciólépésben –80 °C-tól 150 °C-ig, előnyösen –80 °C-tól 60 °C-ig terjedő hőmérsékleten hajtjuk végre, a második reakciólépést pedig az 1. eljárásnak megfelelően végezzük el.

A moláris arány, amellyel a kiindulási vegyületeket egymással reagáltatjuk, általában 0,9–1,2 mól (V) általános képletű vegyület/1 mól (IV) általános képletű pirimidin-származék.

A kiindulási vegyületeknek az oldószerben illetve a reakcióelegyben való koncentrációja általában 0,1–5, előnyösen 0,2–2 mól/l.

A reakció befejeződése után az első reakciólépés reakcióelegyét vízzel mossuk, szárítjuk és bepároljuk.

3.) További eljárás az (Ia) általános képletű vegyületek – a képletben X, Y, R², R³ a fentiekben megadott jelentésűek, és R⁴ öt-tagú, egy nitrogén- és oxigénatomot tartalmazó heteroaromás csoportot jelent – előállítására abban áll, hogy (VI) általános képletű alkin-vegyületet (az 1. vagy 2. eljárással előállítható) – a képletben X, Y, R² és R³ a fentiekben megadott jelentésűek és R⁵ hidrogénatomot vagy 1–4 szénatomos alkilcsoportot jelent – 1,3-dipólusos vegyülettel cikloaddíciós reakcióban reagáltatunk. Az 1,3-dipólusos vegyületeket ismert eljárásokkal (lásd A. Padwa, „1,3-Dipolar Cycloaddition Chemistry”, Wiley, New York 1984) állíthatjuk elő és reagáltathatjuk.

Példásképpen hozzuk fel az (Ib) általános képletű vegyületek előállítására szolgáló eljárást, a képletben

X, Y, R², R³ és R⁵, a fentiekben megadott jelentésűek és R⁶ hidrogénatomot vagy 1–4 szénatomos alkilcsoportot jelent.

Az eljárás során úgy járunk el, hogy (VI) általános képletű alkinvegyületet – a képletben a szubsztituensek a fenti jelentésűek – (VIII) általános képletű hidroxánsav-kloriddal – a képletben R⁶ a fenti jelentésű – nitrogénbázis jelenlétében reagáltatunk.

Az eljárás során célszerűen úgy járunk el, hogy a (VI) általános képletű alkinvegyületnek közömbös szerves oldószerrel készült oldatához hozzáadjuk a (VIII) általános képletű hidroxámsav-kloridnak moláris mennyiségét, majd ebbe a reakcióelegybe becsepegtetjük a bázisnak molárisan kétszeres mennyiségét. A reakcióelegyet a szokásos módon dolgozzuk fel, például vizes hidrolízissel, a termék leszívásával vagy szerves oldószeres extrakciójával.

A reakcióhoz oldószerként használhatunk célszerűen halogénezett szénhidrogéneket, így diklór-etánt, klór-benzolt, o-diklór-benzolt, tetraklór-etánt, diklórmetánt és kloroformot; étereket, így dietil-étert, metil-terc-butil-étert, dimetoxi-etánt, dietilenglikol-dimetil-étert, tetrahidrofuránt és dioxánt vagy aromás vegyületeket, így benzolt, toluolt, xilot vagy ezek elegyeit.

A reakciót –10 °C-tól 50 °C-ig, előnyösen 0 °C-tól 30 °C-ig terjedő hőmérsékleten hajthatjuk végre.

A reakcióban bázisként célszerűen nitrogénbázisok, így 2, 3-, 4-pikolin, N,N-dimetil-anilin, N,N-dimetil-ciklohexil-amin, trietil-amin, piridin és 1,8-diaza-biciklo(5.4.0)undec-7-én szerepelhetnek.

A reakciópartnereket főleg 1:1 molarányban reagaltatjuk egymással, és a reakcióelegyhez a nitrogénbázist kétszeres-háromszoros moláris mennyiségben adjuk hozzá.

A reakcióelegyben a kiindulási vegyületek koncentrációja általában 0,1–5, előnyösen azonban 0,2–2 mol/l.

Az (I) általános képletű pirimidin-származékokat, illetve az ezeket hatóanyagként tartalmazó gyomirtó készítményeket alkalmazhatjuk például közvetlenül permetezhető oldatok, porok, szuszpenziók, magas százalékos tartalmú vizes, olajos vagy más szuszpenziók vagy diszperziók, emulziók, olajdiszperziók, paszták, porozószerke, szórószerke vagy granulátumok formájában, permetezéssel, porlasztással, porozással, szórással vagy locsolással. Az alkalmazási formák a felhasználás céljához igazodnak; ezeknek minden esetben a találmány szerinti hatóanyagok lehető legegyszerűsebb eloszlását kell biztosítaniuk.

Az (I) általános képletű vegyületek általában alkalmasak közvetlenül permetezhető oldatok, emulziók, paszták vagy olajdiszperziók előállítására. A készítményekben közömbös adalékanyagokként szerepelhetnek a közepes-magas forráspontú ásványolajfrakciók, így a kerozin vagy a dízelolaj, továbbá a szénkátrányolajok, valamint a növényi vagy állati eredetű olajok, az alifás, gyűrűs és aromás szénhidrogének, például a toluol, xilol, paraffin, tetrahidronaftalin, az alkilezett naftalinok vagy ezek származékai, metanol, etanol, propanol, butanol, ciklohexanol, ciklohexanon, klór-benzol, izo-

foron vagy az erősen poláros oldószerke, így az N,N-dimetil-formamid, dimetil-szulfoxid, N-metil-pirroli-don vagy a víz.

Vizes készítményeket emulziókoncentrátumokból, diszperziókból, pasztákból, nedvesíthető porokból vagy vízzel diszpergálható granulátumokból víz hozzáadásával készítünk. Emulziók, paszták vagy olajdiszperziók előállítására a hatóanyagokat magukban vagy olajban vagy oldószerben oldva, nedvesítő-, tapadást elősegítő-, diszpergáló- vagy emulgeálószerkekel vízben homogenizáljuk. A hatóanyagokból, nedvesítő-, tapadást elősegítő- diszpergáló- vagy emulgeálószerkekből és adott esetben oldószerből vagy olajból vízzel hígítható koncentrátumokat is készíthetünk.

Felületaktív adalékokként szerepelhetnek az aromás szulfonsavak, például a lignin-, fenol-, naftalin- és dibutil-naftalinszulfonsavak valamint a zsírsavak alkálifém-, alkáliföldfém- és ammóniumsói, az alkil- és az alkil-aril-szulfonátok, az alkil-, lauril-éter- és zsíralkohol-szulfátok, a szulfatózott hexa-, hepta- és oktadekanolok valamint a zsíralkohol-glikol-éterek sói, a szulfonált naftalinnak és származékainak formaldehiddel képzett kondenzációs termékei, a naftalinnak illetve a naftalinszulfonsavaknak fenollal és formaldehiddel képzett kondenzációs termékei, poli(oxi-etilén)-oktil-fenil-éterek, etoxilezett izooktil-, oktil- vagy nonil-fenil-, alkil-fenil-, tributil-fenil-poliglikol-éter, alkil-aril-poliéter-alkoholok, izotridecetil-alkohol, zsíralkoholoknak etilén-oxiddal képzett kondenzációs termékei, etoxilezett ricinusolaj, poli(oxi-etilén)-alkil-éterek, poli(oxi-propilén)-alkil-éterek, lauril-alkohol-poliglikol-éter-acetát, szorbitészter, lignin-szulfitszenylyűgok vagy a metil-cellulóz.

Porokat, porozó- vagy szórószerkeket a hatóanyag-nak szilárd hordozóanyaggal való összekeverésével vagy összeőrlésével állíthatunk elő.

Granulátumokat, például bevont-, impregnált- vagy homogéngranulátumokat, a hatóanyag-nak szilárd hordozóanyagon való megkötésével állíthatunk elő. Szilárd hordozóanyagok az ásványi termékek, így a kvasavak, kvasavgélek, szilikátok, talkum, kaolin, mészkő, mész, kréta, bólusz, lősz, agyag, dolomit, diatómaföld, a kalcium- és magnézium-szulfát, magnézium-oxid, őrlött műanyagok, műtrágyák, így az ammónium-szulfát, -foszfát és -nitrát, karbamid, a növényi termékek, így a gabonaliszt, a fahéj-, fa- és csonthéjőrlemények, a cellulózpor vagy más szilárd hordozóanyagok.

A készítmények 0,02–95, előnyösen 0,5–90 tömegszázalék hatóanyagot tartalmaznak. A készítményekben a hatóanyagok tisztasága 90–100, előnyösen 95–100%-os (NMR-spektrum alapján).

A találmány szerinti készítményeket például a következőképp állíthatjuk elő:

1. példa

90 tömegrész 1.19. sz. hatóanyagot összekeverünk 10 tömegrész N-metil- α -pirrolidonnal, és így olyan oldatot kapunk, amely a legfinomabb cseppekre eloszlátva alkalmazható.

II. példa

20 tömegrész 1.10. sz. hatóanyagot feloldunk 80 tömegrész xiloból, 8–10 mól etilén-oxidnak és 1 mól olajsav-N-monoetanol-amidnak 10 tömegrésznyi reakciótermékéből, 5 tömegrész dodecil-benzolszulfonsav-kalciumsóból és 40 mól etilén-oxidnak és 1 mól ricinusolajnak 5 tömegrésznyi reakciótermékéből álló elegyben. A kapott oldatot 100 000 tömegrész vízbe öntve és finoman eloszlatva 0,02 tömegszázalékos hatóanyagtartalmú vizes diszperziót nyerünk.

III. példa

20 tömegrész 1.20. sz. hatóanyagot feloldunk 40 tömegrész ciklohexanonból, 30 tömegrész izobutanoból, 7 mól etilén-oxidnak és 1 mól izooktil-fenolnak 20 tömegrésznyi reakciótermékéből és 40 mól etilén-oxidnak és 1 mól ricinusolajnak 1 tömegrésznyi reakciótermékéből álló elegyben. A kapott oldatot 100 000 tömegrésznyi vízbe öntve és finoman eloszlatva 0,02 tömegszázalékos hatóanyagtartalmú vizes diszperziót nyerünk.

IV. példa

20 tömegrész 1.13. sz. hatóanyagot feloldunk 25 tömegrész ciklohexanonból, 65 tömegrész 210–280 °C forrástartományú ásványolajfrakcióból és 40 mól etilén-oxidnak és 1 mól ricinusolajnak 10 tömegrésznyi reakciótermékéből álló elegyben. A kapott oldatot 100 000 tömegrész vízbe öntve és finoman eloszlatva 0,02 tömegszázalékos hatóanyagtartalmú vizes diszperziót nyerünk.

V. példa

20 tömegrész 1.19. sz. hatóanyagot 3 tömegrész diizobutil-naftalin- α -nátriumsóval, szulfitszennylúgból származó 17 tömegrész ligninszulfonsav-nátriumsóval és 60 tömegrész porított kovasavgéllel jól összekeverünk és kalapácsos malomban összeőrölünk. A kapott keveréket 20 000 tömegrész vízben finoman eloszlatva 0,1 tömegszázalékos hatóanyagtartalmú permetlét nyerünk.

VI. példa

3 tömegrész 1.10. sz. hatóanyagot 97 tömegrész finomszemcsés kaolinnal összekeverve 3 tömegszázalékos hatóanyagtartalmú porózószeret nyerünk.

VII. példa

92 tömegrész porított kovasavgél felületére ráporlasztunk 8 tömegrész paraffinolajat, és az így kapott elegyet alaposan elkeverjük 30 tömegrész 1.20. sz. hatóanyaggal. Így jó tapadóképeségű készítményt nyerünk.

VIII. példa

20 tömegrész 1.13. sz. hatóanyagot 2 tömegrész dodecil-benzolszulfonsav-kalciumsóval, 8 tömegrész zsíralkohol-poliglikol-éterrel, 2 tömegrész fenol/karbamid/formaldehid kondenzátum nátriumsóval és 68 tömegrész paraffinos jellegű ásványolajjal alaposan összekeverve stabil olajos diszperziót nyerünk.

A hatóanyagok illetve a gyomirtó készítmények alkalmazása történhet a haszonnövények kikelése előtt vagy utána is. Ha bizonyos haszonnövények a hatóanyagokat kevésbé tűrik, úgy olyan kijuttatási technikát alkalmazhatunk, amelynél a permetező készülékkel a gyomirtó készítményt úgy permetezzük ki, hogy a permet az érzékeny haszonnövény leveleit lehetőleg ne érje, miközben a hatóanyagok az alul növekedő gyomok leveleire vagy a pusztta talajra jutnak (post-directed, lay-by).

A hatóanyagok felhasznált mennyisége évszaktól, a célbavett növények fajtájától és fejlődési fokozatuktól függően 0,001–5, előnyösen 0,01–2 kg/ha.

A gyomnövények leküzdésében elérhető hatásspektrumra, a haszonnövények tűrőképességére vagy fejlődésük szabályozni kívánt befolyásolására való tekintettel, valamint figyelembe véve az alkalmazási módok sokféleségét, a találmány szerinti vegyületeket számos haszonnövényenél fel lehet használni, így például a következőkben felsorolt haszonnövényeknél:

Allium cepa (vöröshagyma), Ananas comosus (ananasz), Arachis hypogaea (földimogyoró), Asparagus officinalis (spárga), Beta vulgaris spp. altissima (cukorrépa), Beta vulgaris spp. rapa (takarmányrépa), Brassica napus var. napus (repce), Brassica napus var. napobrassica (karórépa), Brassica rapa var. silvestris (réparepce), Camellia sinensis (teacserje), Carthamus tinctorius (kerti pórsáfrány), Carya illinoensis (hikori), Citrus limon (citrom), Citrus sinensis (narancs), Coffea arabica, -canephora, -liberica (kávécsesze), Cucumis sativus (uborka), Cynodon dactylon (csillagpázsit), Daucus carota (sárgarépa), Elaeis guineensis (olajpálma), Fragaria vesca (szamóca), Glycine max (szójabab), Gossypium hirsutum, -arborescens, -herbaceum, -vitifolium (gyapotcsesze), Helianthus annuus (napraforgó), Helianthus tuberosus (csicsóka), Hevea brasiliensis (kaucsukfa), Hordeum vulgare (árpa), Humulus lupulus (komló), Ipomoea batatas (édesburgonya), Juglans regia (diófa), Lens culinaris (lencse), Linum usitatissimum (rostlen), Lysopersicon lycopersicum (paradicsom), Malus spp. (alma), Manihot esculenta (manióka), Medicago sativa (lucerna), Musa spp. (banán), Nicotiana tabacum, -rustica (dohány), Olea europaea (olajfa), Oryza sativa (rizs), Phaseolus lunatus (holdbab), Phaseolus vulgaris (bokorbab), Picea abies (vörös lucfenyő), Pinus spp. (erdei fenyő), Pisum sativum (vetőborsó), Prunus avium (csersznye), Prunus dulcis (mandula), Prunus persica (őszibarack), Pyrus communis (körte), Ribes sylvestre (piros ribiszke), Ricinus communis (ricinus), Saccharum officinarum (cukornád), Secale cereale (rozs), Solanum tuberosum (burgonya), Sorghum bicolor, -vulgare (sperőcirok), Theobroma cacao (kakaócsesze), Trifolium pratense (vöröshere), Triticum aestivum (búza), Triticum durum (durumbúza), Vicia faba (lóbab), Vitis vinifera (szőlő), Zea mays (kukorica).

A hatásspektrum szélesítése és hatásfokozódás elérése céljából az (I) általános képletű pirimidin-származékokat mind egymással mind pedig más gyomirtó- vagy növényi fejlődést szabályzó hatóanyaggal össze-

lehet keverni és együtt kijuttatni. Keverékpártnerként szerepelhetnek például a diazinok, 4H-3,1-benzoxazin-származékok, benzotiadiazinok, 2,6-dinitro-anilin-származékok, N-fenil-karbamátok, tiolkarbamátok, halogén-karbonsavak, triazinok, amidok, karbamidszármazékok, difenil-éterszármazékok, triazinonok, uracilok, benzofuránszármazékok, kinolinkarbonsavak, szulfonyl-karbamid-származékok, ciklohexán-1,3-dion-származékok, (hetero)aril-oxi-fenoxi-propionsavak, ezek sói, észterei és amidjai valamint más vegyületek.

Ezenkívül hasznos lehet az (I) általános képletű pirimidin-származékokat, illetve az ezeket hatóanyagként tartalmazó gyomirtó készítményeket magukban vagy más gyomirtókkal vagy akár további növényvédőszerrel, például a kártevők vagy a fitopatogén gombák illetve -baktériumok leküzdésére szolgáló szerrel összekeverve együtt kijuttatni. Fontos továbbá az ásványi sóoldatokkal való keverhetőség, amelyeket a táp- és nyomelemhiány megszüntetésére használhatunk fel. A készítményekhez akár nem fitotoxikus olajok vagy olajkoncentrátumokat is hozzáadhatunk.

Példák az (I) általános képletű hatóanyagok előállítására:

1. példa

S(+)-2-Amino-4-klór-6-(1-ciklohexil-etil-amino)-pirimidin

17,0 g S(+)-1-ciklohexil-etil-amint és 13,5 g trietil-amint hozzáadunk 20 g 2-amino-4,6-diklór-pirimidin és 250 ml n-propanol elegyéhez, és a reakcióelegyet keverés közben visszafolyató hűtő alatt 7 óra hosszan forraljuk. A reakcióelegyet vákuumban bepároljuk, és a bepárlási maradékot etil-acetát/víz kétfázisú elegyében feloldjuk. A vizes fázist etil-acetáttal extraháljuk, majd az egyesített szerves fázist vízzel egyszer mossuk, magnézium-szulfáttal megszáritjuk, majd 90 °C-on 0,3 mbar nyomáson bepároljuk. Így 28,6 g cím szerinti vegyületet (1.01 sz. hatóanyagot) nyerünk.

Olvadáspontja: 59–63 °C.

Fajlagos optikai forgatóképessége: $[\alpha]_D^{20} = +3,741^\circ$ (diklór-metán)

2. példa

4-Klór-6-[(2-furil)-metil-amino]-2-(metoxi-amino)-pirimidin

a.) 100 g (0,44 mól) 4,6-diklór-2-(metil-szulfonil)-pirimidinnek 400 ml N,N-dimetil-formamiddal készült oldatához hozzáadunk 40 g (0,48 mól) O-metil-hidroxil-amin-hidrokloridot és 66 g (0,48 mól) kálium-karbonátot, és ennek a reakcióelegynek a hőmérsékletét

10 óra hosszan 90 °C-on tartjuk. A reakcióelegyet lehűlése után bepároljuk, a bepárlási maradékot 10%-os vizes sósav és diklór-metán elegyével felvesszük, és a fázisokat szétválasztjuk. A szerves fázist megszáritjuk és rotációs készülékben bepároljuk. A melléktermékként kapott 4-klór-6-(metoxi-amino)-2-(metil-szulfonil)-pirimidint Kieselgél tölteten végzett kromatográfiával különítjük el (eluálószer: ciklohexán/etil-acetát). Így fehér kristályos vegyületként 39 g 4,6-diklór-2-(metoxi-amino)-pirimidint nyerünk (kitermelés: 45%).

Olvadáspontja: 135 °C

b.) 1,5 g (7,7 mmól) 4,6-diklór-2-(metoxi-amino)-pirimidinnek 10 ml n-propanollal készült oldatához hozzáadunk 1,14 g (8,5 mmól) furfuril-amin-hidrokloridot majd 1,6 g (16 mmól) trietil-amint. A reakcióelegyet visszafolyató hűtő alatt 8 óra hosszan forraljuk, bepároljuk, a bepárlási maradékot víz és diklór-metán kétfázisú elegyével felvesszük, és az elegyet 10%-os sósavval semlegesítjük. A fázisokat szétválasztjuk, a vizes fázist diklór-metánnal kétszer extraháljuk, és az egyesített extraktumot megszáritjuk és bepároljuk. Bepárlási maradékként nyerünk 1,8 g cím szerinti vegyületet (1.02 sz. hatóanyag), mint barna olajat (kitermelés: 92%).

¹H-NMR spektruma (CDCl₃; 250 MHz) δ = 3,85 (s; 3H), 4,50 (s; 2H), 6,00 (s; 1H), 6,20–6,35 (m; 2H), 7,35 (d; 1H), 8,20 (s, széles; 1H)

3. példa

2-Amino-4-klór-6-[(3-izopropil-izoxazol-5-il)-metil-amino]-pirimidin

8,0 g (44 mmól) 2-amino-4-klór-6-[(3-propinil)-amino]-pirimidin és 5 ml tetrahidrofuran elegyét 0 °C-osra hűtjük le, és a reakcióelegyhez előbb hozzáadunk 5,3 g (44 mmól) izobutiril-hidroxámsavkloridot majd 8,9 g (88 mmól) trietil-amint. A reakcióelegyet szobahőmérsékleten 14 óra hosszan keverjük, bepároljuk, és a bepárlási maradékot víz és diklór-metán kétfázisú elegyével felvesszük. A fázisokat elválasztjuk, a szerves fázist megszáritjuk és bepároljuk. A bepárlási maradékot Kieselgél tölteten kromatográfiásan tisztítva (eluálószer: ciklohexán/etil-acetát) 6,8 g cím szerinti vegyületet (1.27 sz. hatóanyag) nyerünk, mint nagyon viszkózus olajat (kitermelés: 58%).

¹H-NMR spektruma (CDCl₃; 250 MHz) δ = 1,25 (d; 6H), 3,05 (sept; 1H), 4,65 (d; 2H), 5,15 (s, széles; 2H), 5,45 (s, széles; 1H), 5,85 (s; 1H), 6,05 (s; 1H).

Az 1.–3. példákban ismertetett eljárásoknak megfelelően állítjuk elő az alábbi 1.–3. táblázatban felsorolt (I) általános képletű pirimidin-származékokat.

1. táblázat

Olyan (I) általános képletű vegyületek, amelyek képletében X klóratomot jelent.

Szám	A	Y	O.p. [°C], ¹ H-NMR (CDCl ₃) [ppm]
1.04		NH ₂	105–108
1.05		NH ₂	98–100
1.06		C ₂ H ₅ NH	50–52
1.07		NH ₂	166–168

Szám	A	Y	O.p. [°C], ¹ H-NMR (CDCl ₃) [ppm]
1.08		NH ₂	156–158
1.09		NH ₂	170–173
1.10		NH ₂	166–169
1.11		C ₂ H ₅ NH	87–90
1.12		NH ₂	145
1.13		NH ₂	184–187
1.14		NH ₂	80–86
1.15		NH ₂	168 [α] _D ²⁰ –4,740° [CH ₂ Cl ₂]
1.16		NH ₂	96–104
1.17		NH ₂	113–116
1.18		NH ₂	102–108
1.19		NH ₂	gyanta ¹ H-NMR [d ₆ DMSO] CH ₃ 1,1 ppm-nél d; 3H
1.20		NH ₂	143–146
1.21		NH ₂	134–137
1.22	–CH ₂ –C≡CH	NHOCH ₃	100–102
1.23		NHOCH ₃	93–95
1.24		NHOCH ₃	92
1.25		NHOCH ₃	3,85 ppm (s, 3H) OCH ₃
1.26		NHOCH ₃	1,15 (d, 3H) CH ₃
1.27		NH ₂	3,05 (s, 1H) CH(CH ₃) ₂
1.28		NH ₂	110–117
1.29		NH ₂	105
1.30		NH ₂	129–132
1.31		NHOCH ₃	1,6 (d, 3H); 3,8 (s, 3H); 4,8–5,1 (m, 1H); 5,25–5,55 (m, 1H); 5,9 (s, 1H); 7,05 (d, 1H); 7,15 (d, 1H); 7,35 (dd, 1H); 7,5 (s, sz, 1H)
1.32		NHOCH ₃	1,8–2,15 (m, 4H); 3,0–4,2 (m, 6H); 3,90 (s, 3H); 6,15 (s, 1H); 9,15 (s, sz, 1H)
1.33		NHOCH ₃	1,10–2,10 (15H); 2,9–3,35 (m, 3H); 3,80 (s, 3H); 5,90 (s, 1H); 7,9 (s, sz, 1H)
1.34		NHOCH ₃	114–116
1.35		NH ₂	1,37–1,42 (d/3H) 6,4 (s/2H; NH ₂) 7,65–7,7 (d/1H; NH)

2. táblázat

Olyan (I) általános képletű vegyületek, amelyek képletében X trifluor-metoxi-csoportot jelent.

Szám	A	Y	O.p. [°C], ¹ H-NM (CDCl ₃) [ppm]
2.01		NH ₂	gyanta 5,35 ppm (s/1H) NH 5,25 ppm (s/1H) Pir–CH 4,95 ppm s/2H) NH ₂ 1,55 ppm (d/3H) CH ₃
2.02		NH ₂	gyanta 5,31 (s/1H) Pir–CH 5,15 (s/1H) NH 4,88 (s/2H) NH ₂ 1,50 (d/3H) CH ₃

Szám	A	Y	O.p. [°C], ¹ H-NM (CDCl ₃) [ppm]
2.03		NH ₂	gyanta 6,52 (s/1H) Fur-CH 5,4 (s/1H) Pir-CH 5,34 (s/1H) NH 5,05 (s/2H) NH ₂ 1,60 (d/3H) CH ₃
2.04		NH ₂	80–82

3. táblázat

Olyan (I) általános képletű vegyületek, amelyek képletében X trifluor-metil-csoportot jelent.

Szám	A	Y	O.p. [°C], ¹ H-NM (CDCl ₃) [ppm]
3.01		NH ₂	1,65 (d, 3H); 4,95 (s, 1H); 5,05–5,35 (m, 1H); 6,0 (s, 1H); 7,2–7,4 (m, 5H)
3.02		NH ₂	1,55 (d, 3H); 3,55–3,7 (m, 1H); 5,35 (s, sz. 3H); 7,05 (d, 1H); 7,15 (d, 1H); 7,3 (dd, 1H)
3.03		NH ₂	191–193
3.04		NH ₂	177–179
3.05		NH ₂	0,15–0,4 (m, 2H); 0,45–0,6 (m, 2H); 0,8–1,0 (m, 1H); 3,25–3,55 (m, 1H); 5,0–5,6 (s, sz. 3H); 6,05 (s, 1H)
3.06		NH ₂	159–162
3.07		NH ₂	226–228
3.08		NH ₂	252–253

Hatástani példák

Az (I) általános képletű pirimidin-származékok herbicid hatását a következő üvegházi kísérletek mutatják:

A növények tenyészedeiként műanyag virágcserepek szolgáltak, amelyekben szubsztrátumként 3,0% humuszt tartalmazó agyagos homok volt. A vizsgált növények magjait fajtánként elválasztva vetették el.

Kikelés előtti alkalmazásnál a vízben szuszpendált vagy emulgeált hatóanyagokat közvetlenül a vetés után juttattuk ki, finoman porlasztó permetezőkészülékkel. Ezután a tenyészedeiket enyhén megöntöztük, hogy a növények csírázását és fejlődését biztosítsuk, majd átlátszó műanyag burával fedtük le, amíg a növények fel nem nőttek. A műanyag burával való lefedés a vizsgált növények egyenletes csírázását biztosította, amennyiben ezt a hatóanyagok nem befolyásolták.

Kikelés utáni kezelés céljából a vizsgált növényeket, fajtájuktól függően csak 3–15 cm-es magasságig hagytuk megnőni, és ezután kezeltük őket a vízben szuszpendált vagy emulgeált hatóanyagokkal. Ebből a célból a kísérleti növényeket vagy ugyanabban a tenyészében neveltük fel, amelyekben elvetették, vagy pedig csíranövényekként elválasztva neveltük fel, és a kezelés előtt néhány nappal a kísérleti tenyészé- nyekbe átültettük őket.

A növényeket fajtájuktól függően 10–25 °C illetve

20–35 °C hőmérsékleten tartottuk. A kísérlet időtartama 2–4 hét volt. Ezalatt az idő alatt a növényeket gondoztuk, és az egyedi kezelésekre adott reakcióikat kiértékeljük.

A kiértékelés 0–100 beosztású skála alapján történt. Ennél a 100 azt jelenti, hogy a növény nem kelt ki, illetve, hogy legalább a föld feletti részei teljesen elpusztultak; a 0 pedig azt jelenti, hogy a növény egyáltalán nem károsodott és, hogy fejlődése teljesen normális volt.

Az üvegházi kísérletekhez a következő növényfajtákat használtuk: *Alopecurus myosuroides* (parlagi ecsetpázsit), *Avena fatua* (héla zab), *Abutilon theophrasti* (selyemmályva), *Amaranthus retroflexus* (szőrös disznóparéj), *Cassia tora*, *Sinapis alba* (fehér mustár).

Az 1.19 számú hatóanyagot 0,75 kg hatóanyag/ha mennyiségben, kikelés után alkalmazva, a hatóanyag nagyon jól leküzdi a széles levelű gyomnövényeket és a káros fűféléket.

Az alábbi összehasonlító kísérletekből következik, hogy a találmány szerinti pirimidin-származékoknak az ismert pirimidin-származékokkal, például az A vegyülettel, azaz a 2-amino-4-klór-6-[(1-fenil-etil)-amino]-pirimidinnel (lásd DE-A 37 17 480, 63. példa) és a B vegyülettel, azaz a 2-amino-4-klór-6-(ciklohexil-amino)-pirimidinnel (lásd DE-A 20 65 629, 5. példa) szemben erősebb gyomirtó hatásuk van, és, hogy a

találmány szerinti pirimidin-származékokat a haszon-növények jobban tűrik.

I. táblázat

Példák az üvegházi kísérletek során a széles levelű gyomnövények leküzdésére és a példa szerinti haszon-növény tűrőképességére, a hatóanyagot kikelés után 0,375 illetve 0,19 kg hatóanyag/ha mennyiségben alkalmazva.

Vizsgált növények		% -os károsodás	
1.13 sz. hatóanyag		A vegyület	
0,375		0,19	
kg/ha		kg/ha	
Hordeum vulgare (tavaszi árpa)	20	0	80
Amaranthus retroflexus (szőrös disznóparéj)	100	100	100
Polygonum persicaria (baracklevelű keserűfű)	100	100	100
Viola arvensis (mezai árvácska)	70	70	40

II. táblázat

Példák az üvegházi kísérletek során a széles levelű gyomnövények leküzdésére és a példa szerinti haszon-növény tűrőképességére, a hatóanyagot kikelés után 0,375 illetve 0,19 kg hatóanyag/ha mennyiségben alkalmazva.

Vizsgált növények		% -os károsodás	
1.20 sz. hatóanyag		A vegyület	
0,375		0,19	
kg/ha		kg/ha	
Arachis hypogea (földi mogyoró)	20	10	40
Amaranthus retroflexus (szőrös disznóparéj)	100	100	100
Cassia tora	100	100	90
Chrysanthemum (koronás margitvirág)	100	100	70

III. táblázat

Példák az üvegházi kísérletek során a széles levelű gyomnövények leküzdésére, a hatóanyagot kikelés után 0,5 illetve 0,25 kg hatóanyag/ha mennyiségben alkalmazva.

Vizsgált növények		% -os károsodás	
1.10 sz. hatóanyag		B vegyület	
0,5		0,25	
kg/ha		kg/ha	
Abutilon theophrasti (selyem-mályva)	100	100	0
Chenopodium album (fehér libatop)	100	100	100
Ipomoea spp. (hajnalka-félék)	100	100	50

SZABADALMI IGÉNYPONTOK

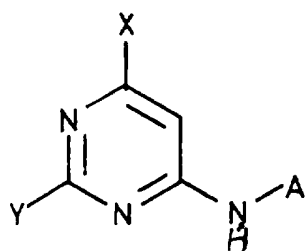
1. Gyomirtó készítmény, *azzal jellemezve*, hogy hatóanyagként 0,02–95 tömeg% (I) általános képletű pirimidin-származékot – a képletben

A jelentése 7–12 szénatomos bi- vagy tricikloalkil-csoport, amelyben egy hattagú részgyűrű aromás is lehet, továbbá adott esetben 1–4 szénatomos alkil-csoporttal szubsztituált, vagy 1–4 szénatomos alkoxycsoporttal szubsztituált fenilcsoport vagy $-CR^2R^3R^4$ általános képletű csoport, amelyben R^2 és R^3 egymástól függetlenül hidrogénatomot vagy 1–4 szénatomos alkilcsoportot jelentenek, és R^4 jelentése 1- vagy 2-naftil-csoport, 3–8 szénatomos cikloalkilcsoport, 7–9 szénatomos bicikloalkil-csoport, olyan telített vagy telítetlen 5–6-tagú, heterociklusos csoport, amely heteroatomként egy vagy két oxigénatomot tartalmaz és adott esetben benzolgyűrűvel kondenzált vagy 5–6-tagú, heteroatomként egy nitrogén- vagy kénatomot vagy egy oxigén- és egy nitrogénatomot tartalmazó heteroaromás csoport, és e heterociklusos csoportok adott esetben 1–4 szénatomos alkilcsoporttal szubsztituáltak; a 2-furil-, 2-tienil-, 2-pirrolil-, N-metil-2-pirrolil-, 2- és 3-piridil-csoport kivételével, ha R^2 és R^3 hidrogénatomot jelent és Y jelentése 1–4 szénatomos alkoxi-amino-csoporttól eltérő, ciklopropilcsoport, ha Y aminocsoport és X jelentése trifluor-metil-csoporttól eltérő, adott esetben halogénatommal szubsztituált fenilcsoport, ha Y aminocsoport és X 1–3 szénatomos halogén-alkil- vagy 1–3 szénatomos halogén-alkoxi-csoport vagy ha Y 1–6 szénatomos alkil-amino-csoport és X 1–3 szénatomos halogén-alkoxi-csoport, 2–5 szénatomos alkinilcsoport, ha Y 1–4 szén-

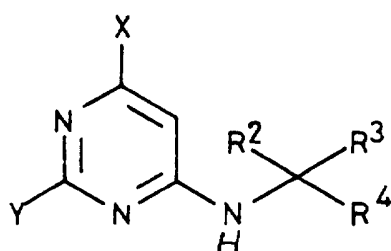
- atomos alkoxi-amino-csoport és X klóratom vagy 1–3 szénatomos halogén-alkil-csoport,
- X jelentése halogénatom, 1–3 szénatomos halogén-alkil- vagy 1–3 szénatomos halogén-alkoxi-csoport, és
- Y jelentése -NHR^5 általános képletű csoport, amelyben
- R^5 jelentése hidrogénatom, 1–6 szénatomos alkil- vagy 1–4 szénatomos alkoxicsopót, kivéve a metoxicsopót, ha R^4 fenilcsoport –
- vagy mezőgazdaságilag alkalmazható savaddíciós sóját tartalmazza a gyomirtó készítmények szokásos adalékanyagaival együtt.
2. Az 1. igénypont szerinti gyomirtó készítmény, *azzal jellemezve*, hogy olyan (I) általános képletű hatóanyagot vagy savaddíciós sóját tartalmazza, amelynek képletében – az 1. igénypontbeli megkötésekkel –
- A jelentése 6-indanil-, 2- vagy 3-norpinanil-, 7-triciklo[5.2.1.0^{2,6}]dec-2⁶-enil-csoport, 1–3 szénatomos alkoxicsopóttal szubsztituált fenilcsoport vagy $\text{-CR}^2\text{R}^3\text{R}^4$ általános képletű csoport, amelyben R^2 és R^3 hidrogénatom vagy 1–4 szénatomos alkil-csoport, és
- R^4 1- vagy 2-naftil-csoport, 3–8 szénatomos cikloalkilcsoport, 2-benzofuranil-, 3-tienil-, 2-tetrahidrofuril-, 1-indanil-, 1- vagy 2-tetrahidroindanil-, 3-dihidrobenzopiranil-, 4-piridinil-5-oxazolil-, 1,3-dioxolan-5-il-, 6-dihidropiranil-, metil-6-dihidropiranil-, 2-furil-, metil-6-tetrahidropiranil-csoport, 2–5 szénatomos alkinilcsoport vagy biciklo[2.2.1]heptilcsoport
- X jelentése halogénatom és
- Y az 1. igénypontban meghatározott.
3. Az 1. igénypont szerinti gyomirtó készítmény, *azzal jellemezve*, hogy olyan (I) általános képletű hatóanyagot vagy savaddíciós sóját tartalmazza, amelynek képletében – az 1. igénypontbeli megkötésekkel –
- X jelentése klóratom,
- Y jelentése aminocsoport,
- A jelentése $\text{-CHR}^3\text{R}^4$ általános képletű csoport, amelyben
- R^3 jelentése hidrogénatom vagy 1–4 szénatomos alkilcsoport, és
- R^4 jelentése 2-naftil-csoport, 3–8 szénatomos cikloalkil-, biciklo[2.2.1]hept-2-il-, 2-benzofuril-, 3-tienil-, 2-tetrahidrofuril-, 1-indanil-, 2-tetrahidroindanil- vagy 3-dihidrobenzopiranil-csoport.
4. Az 1. igénypont szerinti gyomirtó készítmény, *azzal jellemezve*, hogy olyan (I) általános képletű hatóanyagot vagy savaddíciós sóját tartalmazza, amelynek képletében – az 1. igénypontbeli megkötésekkel –
- X jelentése klóratom,
- Y jelentése 1–4 szénatomos alkoxi-amino-csoport,
- A $\text{-CR}^2\text{R}^3\text{R}^4$ általános képletű csoport, amelyben
- R^3 jelentése hidrogénatom vagy 1–4 szénatomos alkilcsoport, és
- R^4 jelentése 1-naftil-, 3–8 szénatomos cikloalkil-,

fenil-, 3-klór-fenil-, 2-furil-, 3-izopropil-5-izoxazolil-, 3-tienil-, 3-tetrahidrofuril- vagy 2-tetrahidroindanil-csoport.

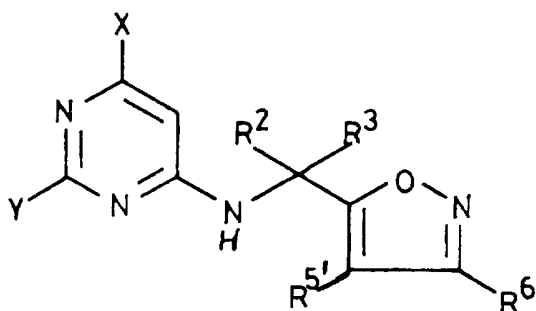
5. Az 1. igénypont szerinti gyomirtó készítmény, *azzal jellemezve*, hogy olyan (I) általános képletű hatóanyagot vagy savaddíciós sóját tartalmazza, amelynek képletében – az 1. igénypontbeli megkötésekkel –
- X jelentése trifluor-metoxi-csoport,
- Y jelentése aminocsoport,
- 10 A jelentése $\text{-CHR}^3\text{R}^4$ általános képletű csoport, amelyben
- R^3 jelentése hidrogénatom vagy 1–4 szénatomos alkilcsoport, és
- R^4 jelentése 1-naftil-, 3–8 szénatomos cikloalkil-, fenil-, 3-tienil- vagy 2-benzofuranil-csoport.
- 15 6. Az 1. igénypont szerinti gyomirtó készítmény, *azzal jellemezve*, hogy olyan (I) általános képletű hatóanyagot vagy savaddíciós sóját tartalmazza, amelynek képletében – az 1. igénypontbeli megkötésekkel –
- 20 X jelentése trifluor-metil-csoport,
- Y jelentése aminocsoport,
- A jelentése $\text{-CHR}^3\text{R}^4$ általános képletű csoport, amelyben
- R^3 hidrogénatom vagy 1–4 szénatomos alkilcsoport, és
- 25 R^4 jelentése 1-naftil-, 3–8 szénatomos cikloalkil-, fenil-, 3-tienil-, 2-tetrahidrofuril- vagy 1-indanil-csoport.
7. Eljárás (I) általános képletű pirimidin-származékok – a képletben A, X és Y az 1. igénypontban megadott jelentésűek – és savaddíciós sóik előállítására, *azzal jellemezve*, hogy
- a) egy (II) általános képletű pirimidin-származékot – a képletben X és Y a fenti jelentésűek, és Z nukleofil eliminálódó csoportot, előnyösen halogénatomot jelent – egy (III) általános képletű aminnal – a képletben A a fenti jelentésű – reagáltatunk, vagy
- b) az (Ia) általános képletű vegyületek előállítására, amelyek képletében X, Y, R^2 és R^3 a fenti jelentésűek, és R^4 a fenti meghatározásán belül 5-tagú heterociklusos csoportot jelent, amely egy oxigén- és egy kénatomot tartalmaz és adott esetben 1–4 szénatomos alkilcsoporttal szubsztituált, egy (VI) általános képletű alkinvegyületet – a képletben X, Y, R^2 és R^3 a fenti jelentésűek és $\text{R}^{5'}$ jelentése hidrogénatom vagy 1–4 szénatomos alkilcsoport – egy (VIII) általános képletű hidroxámsav-kloriddal – a képletben R^6 hidrogénatom vagy 1–4 szénatomos alkilcsoport – nitrogéntartalmú bázis jelenlétében reagáltatunk,
- és kívánt esetben a kapott (I) általános képletű vegyületet ismert módon savaddíciós sójává átalakítjuk.
8. Eljárás gyomok irtására, *azzal jellemezve*, hogy a gyomnövényeket és/vagy életterüket legalább 0,001 kg/ha hatóanyagnak megfelelő mennyiségű (I) általános képletű vegyületet vagy mezőgazdaságilag alkalmazható savaddíciós sóját tartalmazó gyomirtó készítménnyel kezeljük.



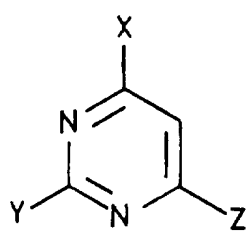
(I)



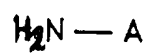
(Ia)



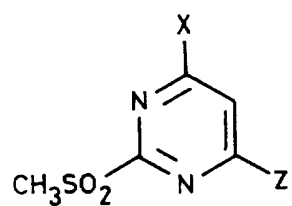
(Ib)



(II)



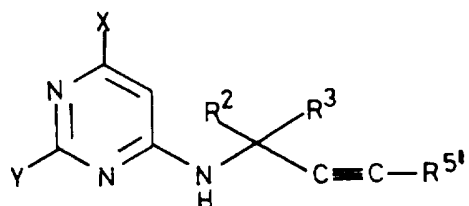
(III)



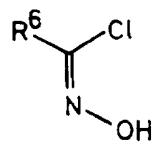
(IV)

YH

(V)



(VI)



(VIII)