

1482/02

KÖZZÉTÉTELI
PÉLDÁNY



A-2

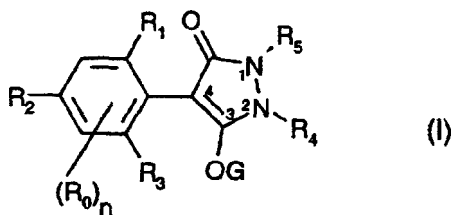
73.769/PA

Herbicid hatású

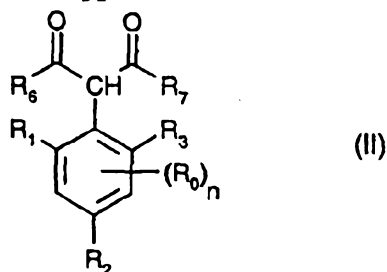
3-hidroxi-4-aryl-5-oxo-pirazolinszármazékok, inter-
medierek előállításuk

KIVONAT

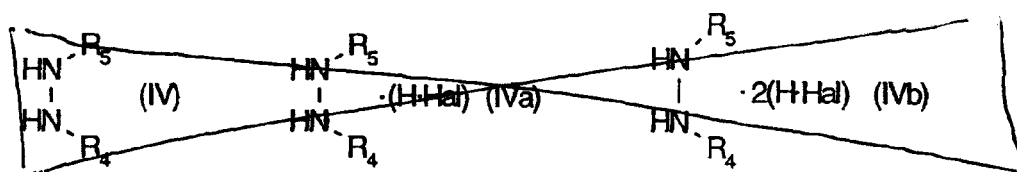
A találmány szerinti (I) általános képletű vegyü-
letek



— amelyek képletében G jelentése hidrogénatom, egy fémion-ek-
vivalens vagy egy ammónium-, szulfónium- vagy foszfónium-kat-
ion, R_0 , R_1 , R_2 , R_3 , R_4 és R_5 a szerves kémiában szokásosan al-
kalmazott és a leírásban részletezett csoportokat jelent, vala-
mint n értéke 0, 1 vagy 2 — előállításuk során egy
(II) általános képletű vegyületet



— amelynek képletében R_6 jelentése R_8R_9N- általános képletű
csoport; R_7 jelentése $R_{10}R_{11}N-$ vagy $R_{12}O-$ általános képletű
csoport — inert szerves oldószerben, adott esetben bázis je-
lenlétében egy megfelelő hidrazinszármazékkal



reagáltatnak, és adott esetben az így nyert (I) általános kép-

1492/02

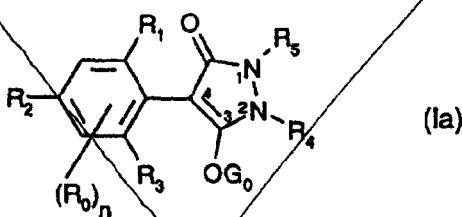
- 2 -

9404

letű vegyületet, amelyben G egy fémion-ekvivalenst vagy egy amónium-kationt jelent, sókonverzióval átalakítják a megfelelő olyan (I) általános képletű vegyületté, amelyben G egy szulfónium- vagy foszfónium-kationt jelent, vagy egy Brönsted-savval reagáltatva átalakítják a megfelelő olyan (I) általános képletű vegyületté, amelyben G jelentése hidrogénatom, ~~és kívánt esetben az így nyert (I) általános képletű vegyületeket adott esetben savmegkötő szer vagy katalizátor jelenlétében egy (XII) vagy (XIIId) általános képletű elektrofil~~



in situ reagáltatva átalakítják (Ia) általános képletű vegyületekké,



ahol a képletekben

G_0 jelentése $-C(O)-R_{30}$, $-C(X_1)-X_2-R_{31}$, $-C(X_3)-N(R_{32})-R_{33}$, $-SO_2-R_{34}$ vagy $-P(X_4)(R_{35})-R_{36}$ általános képletű csoport;

X_3 jelentése oxigén- vagy kénatom;

L jelentése kilépőcsoport,

R_{32} jelentése hidrogénatom, adott esetben szubsztituált alkil-, cikloalkil-, alkoxi-, alkenil-, alkoxi-alkil-, ~~fenil- vagy benzilcsoport.~~

Az előző képlet magában foglalja a (II) általános képletű
 és intermediereket is.

NR

jellező a (I) és (II) általános képlet
 /kivonatokban/

73.769/PA

S. J. G. & K.
Kermavakko
Penttiläntie 100
FI-00250, Helsinki, Andriessin katu 11
Telefon: 34 24-030, Fax: 34 24-323

KÖZZÉTÉTELI PÉLDÁNY

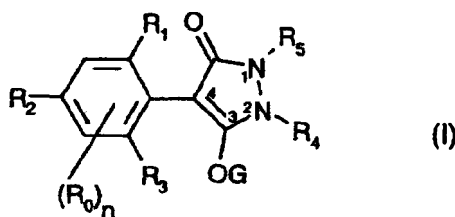
A-2

Herbiceid hatású 3-hidroxi-4-oxil-5-oxo-pira-
zolin-származékok, intermediatek és előállításuk

Herbicid aktivitással rendelkező 3-hidroxi-4-aril-5-oxo-pirazolinokat ismertetnek, valamint a vegyületek előállítási eljárásait ismertetik — egyebek mellett — például a következő dokumentumokban: WO 92/16510. számon közzétett nemzetközi szabadalmi bejelentés, 0 508 126. európai szabadalmi bejelentés, WO 95/01971., WO 96/21652., WO 96/25395., WO 97/02243. és WO 99/47525. számon közzétett nemzetközi szabadalmi bejelentés.

Meglepő módon azt találtuk, hogy szubsztituált 3-hidroxi-4-aril-5-oxo-pirazolin-származékokat nagy kitermeléssel és nagy tisztasággal egyszerűen előállíthatunk oly módon, hogy aril-malonamidokat (aril-malonsav-diamidokat) vagy aril-malonamidsavakat (aril-malonsav-monoamidokat) kondenzációs reakcióban hidrazinszármazékokkal reagáltatunk.

A jelen találmány tárgya tehát eljárás (I) általános kép-
letű vegyületek



— amelyek képletében

R₀ jelentése egymástól függetlenül halogénatom, 1-6 szénato-

mos alkilcsoport, 2-6 szénatomos alkenilcsoport, 2-6 szénatomos alkinilcsoport, 1-6 szénatomos halogén-alkil-csoport, ciano-(1-6 szénatomos alkil)-csoport, 2-6 szénatomos halogén-alkenil-csoport, ciano-(2-6 szénatomos alkenil)-csoport, 2-6 szénatomos halogén-alkinil-csoport, ciano-(2-6 szénatomos alkinil)-csoport, hidroxicssoport, 1-6 szénatomos hidroxi-alkil-csoport, 1-6 szénatomos alkoxicssoport, nitro-, aminocsoport, 1-6 szénatomos alkil-amino-csoport, di(1-6 szénatomos alkil)-amino-csoport, [(1-6 szénatomos alkil)-karbonil]-amino-csoport, [(1-6 szénatomos alkil)-szulfonil]-amino-csoport, [(1-6 szénatomos alkil)-amino]-szulfonil-csoport, (1-6 szénatomos alkil)-karbonil-csoport, [(1-6 szénatomos alkil)-karbonil]-(1-6 szénatomos alkil)-csoport, [(1-6 szénatomos alkoxi)-karbonil]-(1-6 szénatomos alkil)-csoport, [(1-6 szénatomos alkil)-karbonil]-(2-6 szénatomos alkenil)-csoport, [(1-6 szénatomos alkoxi)-karbonil]-(2-6 szénatomos alkenil)-csoport, [(1-6 szénatomos alkil)-karbonil]-(2-6 szénatomos alkinil)-csoport, [(1-6 szénatomos alkoxi)-karbonil]-(2-6 szénatomos alkinil)-csoport, (1-6 szénatomos alkoxi)-karbonil-csoport, ciano-, karboxilcsoport, fenilcsoport vagy aromás csoport, amely a nitrogén-, az oxigén- és a kénatom közül kiválasztott 1 vagy 2 heteroatomot tartalmaz, ahol az utóbbi két aromás csoport adott esetben 1-3 szénatomos alkilcsoporttal, 1-3 szénatomos halogén-alkil-csoporttal, 1-3 szénatomos alkoxicssoporttal, 1-3 szénatomos halogén-alkoxi-csoporttal, halogénatommal, ciano- vagy nitrocso-



porttal szubsztituált; vagy

R_0 a szomszédos R_1 , R_2 és R_3 szubsztituensekkel együtt egy telített vagy telítetlen 3-6 szénatomos szénhidrogénhidat képezhet, amelyet a nitrogén-, oxigén- és kénatom közül kiválasztott egy vagy két heteroatom szakíthat meg és/vagy amely 1-4 szénatomos alkilcsoporttal szubsztituált lehet;

R_1 , R_2 és R_3 mindegyikének jelentése egymástól függetlenül hidrogén-, halogénatom, 1-6 szénatomos alkilcsoport, 2-6 szénatomos alkenilcsoport, 2-6 szénatomos alkinilcsoport, 3-6 szénatomos cikloalkilcsoport, 1-6 szénatomos halogén-alkil-csoport, 2-6 szénatomos halogén-alkenil-csoport, [(1-6 szénatomos alkoxi)-karbonil]-(2-6 szénatomos alkenil)-csoport, [(1-6 szénatomos alkil)-karbonil]-(2-6 szénatomos alkenil)-csoport, ciano-(2-6 szénatomos alkenil)-csoport, nitro-(2-6 szénatomos alkenil)-csoport, 2-6 szénatomos halogén-alkinil-csoport, [(1-6 szénatomos alkoxi)-karbonil]-(2-6 szénatomos alkinil)-csoport, [(1-6 szénatomos alkil)-karbonil]-(2-6 szénatomos alkinil)-csoport, ciano-(2-6 szénatomos alkinil)-csoport, nitro-(2-6 szénatomos alkinil)-csoport, 3-6 szénatomos halogén-cikloalkil-csoport, hidroxil-(1-6 szénatomos alkil)-csoport, (1-6 szénatomos alkoxi)-(1-6 szénatomos alkil)-csoport, [(1-6 szénatomos alkil)-tio]-(1-6 szénatomos alkil)-csoport, cianocsoport, (1-4 szénatomos alkil)-karbonil-csoport, (1-6 szénatomos alkoxi)-karbonil-csoport, hidroxil-csoport, 1-10 szénatomos alkoxicssoport, 3-6 szénatomos alkenil-oxi-csoport, 3-6 szénatomos alkinil-oxi-csoport, 1-6



szénatomos halogén-alkoxi-csoport, 3-6 szénatomos (halogén-alkenil)-oxi-csoport, (1-6 szénatomos alkoxi)-(1-6 szénatomos alkoxi)-csoport, merkaptocsoport, 1-6 szénatomos alkil-tio-csoport, 1-6 szénatomos (halogén-alkil)-tio-csoport, 1-6 szénatomos alkil-szulfonil-csoport, 1-6 szénatomos alkil-szulfonil-csoport, nitro-, aminocsoport, 1-6 szénatomos alkil-amino-csoport, di(1-6 szénatomos alkil)-amino-csoport vagy fenoxicssoport, amelyben a fenilcsoport adott esetben 1-3 szénatomos alkilcsoporttal, 1-3 szénatomos halogén-alkil-csoporttal, 1-3 szénatomos alkoxicssoporttal, 1-3 szénatomos halogén-alkoxi-csoporttal, halogénatommal ciano- vagy nitrocssoporttal szubsztituált;

R₂ jelentése ezenkívül fenilcsoport, naftilcsoport vagy egy öt- vagy hattagú aromás csoport, amely a nitrogén-, oxigén- és kénatom közül kiválasztott egy vagy két heteroatomot tartalmazhat, ahol a fenilcsoport, a naftilcsoport és az öt- vagy hattagú aromás csoport adott esetben halogénatommal, 3-8 szénatomos cikloalkilcsoporttal, hidrox-, merkapt-, amino-, ciano-, nitro- vagy formilcsoporttal szubsztituált lehet; és/vagy

a fenilcsoport, a naftilcsoport és az öt- vagy hattagú aromás csoport adott esetben a következő csoportokkal szubsztituált lehet: 1-6 szénatomos alkilcsoport, 1-6 szénatomos alkoxicssoport, hidrox-(1-6 szénatomos alkil)-csoport, (1-6 szénatomos alkoxi)-(1-6 szénatomos alkil)-csoport, (1-6 szénatomos alkoxi)-(1-6 szénatomos alkoxi)-csoport, (1-6 szénatomos alkil)-karbonil-csoport, 1-6



szénatomos alkil-tio-csoport, 1-6 szénatomos alkil-szulfinil-csoport, 1-6 szénatomos alkil-szulfonil-csoport, mono-(1-6 szénatomos alkil)-amino-csoport, di(1-6 szénatomos alkil)-amino-csoport, [(1-6 szénatomos alkil)-karbonil]-amino-csoport, N-[(1-6 szénatomos alkil)-karbonil]-N-(1-6 szénatomos alkil)-amino-csoport, 2-6 szénatomos alkenil-csoport, (3-6 szénatomos alkenil)-oxi-csoport, hidroxii-(3-6 szénatomos alkenil)-csoport, (1-6 szénatomos alkoxi)-(2-6 szénatomos alkenil)-csoport, [(1-6 szénatomos alkoxi)-(3-6 szénatomos alkenil)]-oxi-csoport, (2-6 szénatomos alkenil)-karbonil-csoport, 2-6 szénatomos alkenil-tio-csoport, 2-6 szénatomos alkenil-szulfinil-csoport, 2-6 szénatomos alkenil-szulfonil-csoport, mono- vagy di(2-6 szénatomos alkenil)-amino-csoport, N-(1-6 szénatomos alkil)-N-(3-6 szénatomos alkenil)-amino-csoport, [(2-6 szénatomos alkenil)-karbonil]-amino-csoport, N-[(2-6 szénatomos alkenil)-karbonil]-N-(1-6 szénatomos alkil)-amino-csoport, 2-6 szénatomos alkinilcsoport, (3-6 szénatomos alkinil)-oxi-csoport, hidroxii-(3-6 szénatomos alkinil)-csoport, (1-6 szénatomos alkoxi)-(2-6 szénatomos alkinil)-csoport, [(1-6 szénatomos alkoxi)-(3-6 szénatomos alkinil)]-oxi-csoport, (2-6 szénatomos alkinil)-karbonil-csoport, 2-6 szénatomos alkinil-tio-csoport, 2-6 szénatomos alkinil-szulfinil-csoport, 2-6 szénatomos alkinil-szulfonil-csoport, mono- vagy di(2-6 szénatomos alkinil)-amino-csoport, N-(1-6 szénatomos alkil)-N-(3-6 szénatomos alkinil)-amino-csoport, [(2-6 szénatomos alkinil)-karbo-



nil]-amino-csoport vagy *N*-[(2-6 szénatomos alkinil)-karbo-
nil]-*N*-(1-6 szénatomos alkil)-amino-csoport; és/vagy
a fenilcsoport, a naftilcsoport és az öt- vagy hattagú
aromás csoport adott esetben a következő csoportokkal
szubsztituált lehet: halogén-szubsztituált 1-6 szénatomos
alkilcsoport, 1-6 szénatomos alkoxics csoport, hidroxil-(1-6
szénatomos alkil)-csoport, (1-6 szénatomos alkoxi)-(1-6
szénatomos alkil)-csoport, (1-6 szénatomos alkoxi)-(1-6
szénatomos alkoxi)-csoport, (1-6 szénatomos alkil)-karbo-
nil-csoport, 1-6 szénatomos alkil-tio-csoport, 1-6 szén-
atomos alkil-szulfinil-csoport, 1-6 szénatomos alkil-szul-
fonil-csoport, mono(1-6 szénatomos alkil)-amino-csoport,
di(1-6 szénatomos alkil)-amino-csoport, [(1-6 szénatomos
alkil)-karbonil]-amino-csoport, *N*-[(1-6 szénatomos alkil)-
-karbonil]-*N*-(1-6 szénatomos alkil)-amino-csoport, 2-6
szénatomos alkenilcsoport, (3-6 szénatomos alkenil)-oxi-
csoport, hidroxil-(3-6 szénatomos alkenil)-csoport, (1-6
szénatomos alkoxi)-(2-6 szénatomos alkenil)-csoport, [(1-6
szénatomos alkoxi)-(3-6 szénatomos alkenil)]-oxi-csoport,
(2-6 szénatomos alkenil)-karbonil-csoport, 2-6 szénatomos
alkenil-tio-csoport, 2-6 szénatomos alkenil-szulfinil-cso-
port, 2-6 szénatomos alkenil-szulfonil-csoport, mono- vagy
di(2-6 szénatomos alkenil)-amino-csoport, *N*-(1-6 szénato-
mos alkil)-*N*-(3-6 szénatomos alkenil)-amino-csoport, [(2-6
szénatomos alkenil)-karbonil]-amino-csoport, *N*-[(2-6 szén-
atomos alkenil)-karbonil]-*N*-(1-6 szénatomos alkil)-amino-
-csoport, 2-6 szénatomos alkinilcsoport, (3-6 szénatomos



alkinil)-oxi-csoport, hidroxil-(3-6 szénatomos alkinil)-
-csoport, (1-6 szénatomos alkoxi)-(2-6 szénatomos alki-
nil)-csoport, [(1-6 szénatomos alkoxi)-(3-6 szénatomos al-
kinil)]-oxi-csoport, (2-6 szénatomos alkinil)-karbonil-
-csoport, 2-6 szénatomos alkinil-tio-csoport, 2-6 szénato-
mos alkinil-szulfinil-csoport, 2-6 szénatomos alkinil-
-szulfonil-csoport, mono- vagy di(2-6 szénatomos alkinil)-
-amino-csoport, *N*-(1-6 szénatomos alkil)-*N*-(3-6 szénatomos
alkinil)-amino-csoport, [(2-6 szénatomos alkinil)-karbo-
nil]-amino-csoport vagy *N*-[(2-6 szénatomos alkinil)-karbo-
nil]-*N*-(1-6 szénatomos alkil)-amino-csoport; és/vagy
a fenilcsoport, a naftilcsoport és az öt- vagy hattagú
aromás csoport adott esetben a következő csoportokkal
szubsztituált lehet: $-\text{COOR}_{50}$, $-\text{CONR}_{51}$, $-\text{SO}_2\text{NR}_{53}\text{R}_{54}$ vagy
 $-\text{SO}_2\text{OR}_{55}$ általános képletű csoport, ahol

R_{50} , R_{51} , R_{52} , R_{53} , R_{54} és R_{55} mindegyikének jelentése
egymástól függetlenül 1-6 szénatomos alkilcso-
port, 2-6 szénatomos alkenilcsoport vagy 3-6
szénatomos alkinilcsoport, vagy halogénatommal,
hidroxil-, alkoxi-, merkaptó-, amino-, ciano-,
nitro-, alkil-tio-, alkil-szulfinil- vagy alkil-
-szulfonil-csoporttal szubsztituált 1-6 szénato-
mos alkilcsoport, 2-6 szénatomos alkenilcsoport
vagy 3-6 szénatomos alkinilcsoport;

n értéke 0, 1 vagy 2;

R_4 és R_5 mindegyikének jelentése egymástól függetlenül hidro-
génatom, 1-12 szénatomos alkilcsoport, 1-12 szénatomos ha-



logén-alkil-csoport, 2-8 szénatomos alkenilcsoport, 2-8 szénatomos alkinilcsoport, (1-10 szénatomos alkoxi)-(1-8 szénatomos alkil)-csoport, [poli(1-10 szénatomos alkoxi)]-(1-8 szénatomos alkil)-csoport, (1-10 szénatomos alkil-tio)-(1-8 szénatomos alkil)-csoport, 3-8 szénatomos cikloalkilcsoport, 3-8 szénatomos halogén-cikloalkil-csoport, 4-8 tagú heterociklusos csoport, fenilcsoport, α - vagy β -naftilcsoport, fenil-(1-6 szénatomos alkil)-csoport, α - vagy β -naftil-(1-6 szénatomos alkil)-csoport, öt- vagy hattagú heteroarilcsoport vagy öt- vagy hattagú heteroaril-(1-6 szénatomos alkil)-csoport, ahol az aromás és heteroaromás csoportok adott esetben halogénatommal, 1-6 szénatomos alkilcsoporttal, 1-6 szénatomos halogén-alkil-csoporttal, 1-6 szénatomos alkoxicssoporttal, 1-6 szénatomos halogén-alkoxi-csoporttal, nitro- vagy cianocsoporttal szubsztituáltak lehetnek; vagy

R₄ és R₅ azokkal a nitrogénatomokkal együtt, amelyekhez kötődnek, egy telített vagy telítetlen 5-8 tagú heterociklusos gyűrűt képeznek, amely

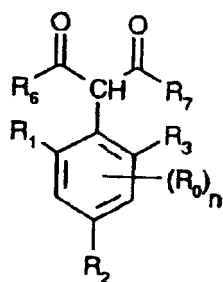
1) adott esetben oxigén-, kénatommal vagy >NR₁₄ általános képletű csoporttal van megszakítva és/vagy adott esetben halogénatommal, 1-10 szénatomos alkilcsoporttal, 1-10 szénatomos halogén-alkil-csoporttal, hidroxicssoporttal, 1-6 szénatomos alkoxicssoporttal, (1-6 szénatomos alkoxi)-(1-6 szénatomos alkoxi)-csoporttal, 1-6 szénatomos halogén-alkoxi-csoporttal, merkaptocsoporttal, 1-6 szénatomos alkil-tio-csoporttal, 3-7 szénatomos cikloalkilcsoporttal,

heteroarilcsoporttal, heteroaril-(1-6 szénatomos alkil)-csoporttal, fenilcsoporttal, fenil-(1-6 szénatomos alkil)-csoporttal vagy benzil-oxi-csoporttal szubsztituált, ahol az utóbbi három szubsztituens fenilcsoportja adott esetben halogénatommal, 1-6 szénatomos alkilcsoporttal, 1-6 szénatomos halogén-alkil-csoporttal, 1-6 szénatomos alkoxycsoporttal, 1-6 szénatomos halogén-alkoxi-csoporttal vagy nitrocsoporttal szubsztituált, és/vagy

2) egy kondenzált vagy spiro-kötött 2-6 szénatomos, adott esetben oxigén- vagy kénatommal megszakított alkilén- vagy alkenilénláncot tartalmazhat, vagy a telített vagy telítetlen heterociklusos gyűrű legalább egy gyűrűatomja köti össze az alkilén- vagy alkenilénláncot;

R_{14} jelentése hidrogénatom, 1-4 szénatomos alkilcsoport, (1-6 szénatomos alkil)-karbonil-csoport, 1-6 szénatomos alkil-szulfonil-csoport, 3-6 szénatomos alkenilcsoport vagy 3-6 szénatomos alkinilcsoport; és

G jelentése hidrogénatom, egy fémion-ekvivalens vagy egy amónium-, szulfónium- vagy foszfónium-kation — előállítására, amelynek során egy (II) általános képletű vegyületet



(II)

— amelynek képletében

R_0 , R_1 , R_2 és R_3 jelentése a fentiekben meghatározott;

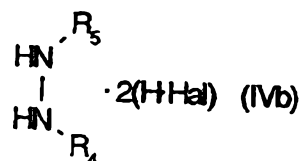
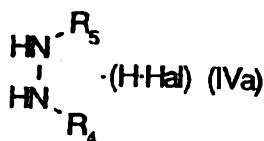
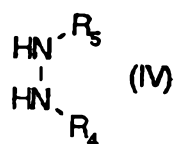
n értéke a fentiekben meghatározott;

R_6 jelentése R_8R_9N - általános képletű csoport;

R_7 jelentése $R_{10}R_{11}N$ - vagy $R_{12}O$ - általános képletű csoport;
valamint

R_8 , R_9 , R_{10} , R_{11} és R_{12} mindegyikének jelentése egymástól függetlenül hidrogénatom, 1-6 szénatomos alkilcsoport, 1-6 szénatomos halogén-alkil-csoport, 3-6 szénatomos alkenil-csoport vagy benzilcsoport, ahol a benzilcsoport fenilcsoportja adott esetben 1-4 szénatomos alkilcsoporttal, halogénatommal, 1-4 szénatomos halogén-alkil-csoporttal, 1-4 szénatomos alkoxicssoporttal vagy nitrocssoporttal szubsztituált lehet —

inert szerves oldószerben, adott esetben bázis jelenlétében egy (IV), (IVa) vagy (IVb) általános képletű vegyülettel



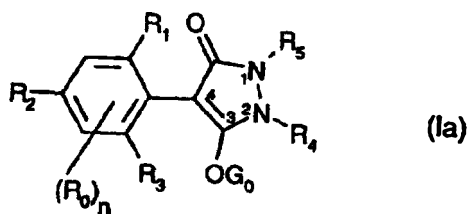
— amelynek képletében R_4 és R_5 jelentése a fentiekben meghatározott, és $\text{H} \cdot \text{Hal}$ egy hidrogén-halogenidet jelent —

reagáltatunk, és adott esetben az így nyert (I) általános képletű vegyületet, amelyben G egy fémion-ekvivalenst vagy egy ammónium-kationt jelent, sókonverzióval átalakítjuk a megfelelő olyan (I) általános képletű vegyületté, amelyben G egy szulfónium- vagy foszfónium-kationt jelent, vagy egy Brönsted-savval



reagáltatva átalakítjuk a megfelelő olyan (I) általános képletű vegyületté, amelyben G jelentése hidrogénatom.

A találmány tárgyát képezi továbbá egy egyedényes reakcióból álló közvetlen ("in situ") eljárás (I) általános képletű vegyületeknek (Ia) általános képletű vegyületekké



— amelyek képletében

R_0 , R_1 , R_2 , R_3 , R_4 és R_5 jelentése az (I) általános képletnél meghatározott;

n értéke az (I) általános képletnél meghatározott;

G_0 jelentése $-C(O)-R_{30}$, $-C(X_1)-X_2-R_{31}$, $-C(X_3)-N(R_{32})-R_{33}$, $-SO_2-R_{34}$ vagy $-P(X_4)(R_{35})-R_{36}$ általános képletű csoport;

X_1 , X_2 , X_3 és X_4 mindegyikének jelentése egymástól függetlenül oxigén- vagy kénatom;

R_{30} jelentése adott esetben halogénatommal szubsztituált 1-20 szénatomos alkilcsoport, 2-20 szénatomos alkenilcsoport, (1-8 szénatomos alkoxi)-(1-8 szénatomos alkil)-csoport, [(1-8 szénatomos alkil)-tio]-(1-8 szénatomos alkil)-csoport, [poli(1-10 szénatomos alkoxi)]-(1-8 szénatomos alkil)-csoport, vagy adott esetben halogénatommal, 1-6 szénatomos alkilcsoporttal vagy 1-6 szénatomos alkoxicssoporttal szubsztituált 3-8 szénatomos cikloalkilcsoport, amelyben adott esetben legalább egy gyűrűtagot oxigén- és/vagy



kénatom helyettesít, (3-6 szénatomos cikloalkil)-(1-6 szénatomos alkil)-csoport, heterociklil-(1-6 szénatomos alkil)-csoport, heteroaril-(1-6 szénatomos alkil)-csoport, adott esetben halogénatommal, ciano-, nitrocsoporttal, 1-6 szénatomos alkilcsoporttal, 1-6 szénatomos alkoxi-csoporttal, 1-6 szénatomos halogén-alkil-csoporttal, 1-6 szénatomos halogén-alkoxi-csoporttal, 1-6 szénatomos alkil-tio-csoporttal vagy 1-6 szénatomos alkil-szulfonil-csoporttal szubsztituált fenilcsoport, adott esetben halogénatommal, ciano-, nitrocsoporttal, 1-6 szénatomos alkilcsoporttal, 1-6 szénatomos alkoxicssoporttal, 1-6 szénatomos halogén-alkil-csoporttal vagy 1-6 szénatomos halogén-alkoxi-csoporttal szubsztituált fenil-(1-6 szénatomos alkil)-csoport, adott esetben halogénatommal vagy 1-6 szénatomos alkilcsoporttal szubsztituált heteroarilcsoport, adott esetben halogénatommal vagy 1-6 szénatomos alkilcsoporttal szubsztituált fenoxi-(1-6 szénatomos alkil)-csoport, vagy adott esetben halogénatommal, aminocsoporttal vagy 1-6 szénatomos alkilcsoporttal szubsztituált (heteroaril-oxi)-(1-6 szénatomos alkil)-csoport;

R₃₁ jelentése adott esetben halogénatommal szubsztituált 1-20 szénatomos alkilcsoport, 2-20 szénatomos alkenilcsoport, (1-8 szénatomos alkoxi)-(2-8 szénatomos alkil)-csoport, [poli(1-8 szénatomos alkoxi)]-(2-8 szénatomos alkil)-csoport, vagy adott esetben halogénatommal, 1-6 szénatomos alkilcsoporttal vagy 1-6 szénatomos alkoxicssoporttal szubsztituált 3-8 szénatomos cikloalkilcsoport, (3-6 szé-

atomos cikloalkil)-(1-6 szénatomos alkil)-csoport, hetero-
ciklil-(1-6 szénatomos alkil)-csoport, heteroaril-(1-6
szénatomos alkil)-csoport, adott esetben halogénatommal,
ciano-, nitrocsoporttal, 1-6 szénatomos alkilcsoporttal,
1-6 szénatomos alkoxicsoporttal, 1-6 szénatomos halogén-
alkil-csoporttal vagy 1-6 szénatomos halogén-alkoxi-cso-
porttal szubsztituált fenil- vagy benzilcsoport;

R₃₂ és R₃₃ mindegyikének jelentése egymástól függetlenül hidro-
génatom, adott esetben halogénatommal szubsztituált 1-8
szénatomos alkilcsoport, 3-6 szénatomos cikloalkilcsoport,
1-8 szénatomos alkoxicsoport, 3-8 szénatomos alkenilcso-
port, (1-8 szénatomos alkoxi)-(1-8 szénatomos alkil)-cso-
port, vagy adott esetben halogénatommal, 1-8 szénatomos
halogén-alkil-csoporttal, 1-8 szénatomos alkilcsoporttal
vagy 1-8 szénatomos alkoxicsoporttal szubsztituált fenil-
vagy benzilcsoport; vagy

R₃₂ és R₃₃ együtt egy 3-6 szénatomos alkilénláncot képez,
amelyben adott esetben egy szénatomot oxigén- vagy kénatom
helyettesít;

R₃₄ jelentése adott esetben halogénatommal szubsztituált 1-8
szénatomos alkilcsoport, 3-8 szénatomos alkenilcsoport,
3-8 szénatomos halogén-alkenil-csoport, 3-8 szénatomos al-
kinilcsoport, 3-8 szénatomos halogén-alkinil-csoport, vagy
adott esetben halogénatommal, 1-6 szénatomos alkilcso-
porttal, 1-6 szénatomos alkoxicsoporttal, 1-4 szénatomos
halogén-alkil-csoporttal, 1-4 szénatomos halogén-alkoxi-
-csoporttal, ciano- vagy nitrocsoporttal szubsztituált fe-



nil- vagy benzilcsoport;

R₃₅ és R₃₆ mindegyikének jelentése egymástól függetlenül adott esetben halogénatommal szubsztituált 1-8 szénatomos alkil-csoport, 1-8 szénatomos alkoxics csoport, 1-8 szénatomos alkil-amino-csoport, di(1-8 szénatomos alkil)-amino-csoport, 1-8 szénatomos alkil-tio-csoport, 2-8 szénatomos alkenil-tio-csoport, 3-7 szénatomos cikloalkil-tio-csoport, vagy adott esetben halogénatommal, nitro-, cianocsoporttal, 1-4 szénatomos alkoxics csoporttal, 1-4 szénatomos halogén-alkoxi-csoporttal, 1-4 szénatomos alkil-tio-csoporttal, 1-4 szénatomos (halogén-alkil)-tio-csoporttal, 1-4 szénatomos alkilcsoporttal vagy 1-4 szénatomos halogén-alkil-csoporttal szubsztituált fenil-, fenoxi- vagy fenil-tio-csoport —

történő átalakítására, amelynek során egy (I) általános képletű vegyületet adott esetben savmegkötő szer vagy katalizátor jelenlétében egy (XII) vagy (XIId) általános képletű elektrofil-
lel



— amelynek képletében G₀, R₃₂ és X₃ jelentése a fentiekben meghatározott, azzal az eltéréssel, hogy R₃₂ jelentése hidrogénatomtól eltérő, valamint L jelentése kilépőcsoport, például R₃₀C(O)O-, R₃₁X₂- általános képletű csoport vagy halogénatom, előnyösen klór-, bróm- vagy jódatom —
reagáltatunk.



Az R_0 - R_5 , G és G_0 szubsztituensektől függően az (I) és (Ia) általános képletű vegyületek geometriai és/vagy optikai izomerek vagy izomerkeverékek (atropizomerek) formájában lehetnek, és ha G hidrogénatomot, egy fémion-ekvivalenst vagy egy ammónium-, szulfónium- vagy foszfónium-kationt jelent, akkor a vegyületek tautomerek vagy tautomerkeverékek formájában is lehetnek.

Amennyiben az alkalmazott kiindulási vegyületek nem enantiomeresen tiszta formában vannak, a fentiekben ismertetett eljárások során kapott (I) és (Ia) általános képletű vegyületek általában racemátok vagy diasztereoizomer-keverékek formájában vannak, amelyeket kívánt esetben a fizikai-kémiai tulajdonságaikon alapuló ismert módszerekkel választhatunk el; ilyen módszer — egyebek mellett — például az optikailag tiszta bázisokkal, savakkal vagy fém-komplexekkel végzett sóképzést követő frakcionált kristályosítás, vagy a kromatográfiás elválasztás, például az acetil-cellulózon végzett nagynyomású folyadékkromatográfiás (HPLC) elválasztás.

A találmány szerinti megoldás értelmében az (I) és az (Ia) általános képletű vegyületek magukban foglalják a megfelelő enantiomerek dúsított vagy optikailag tiszta formáit, valamint a racemátokat és a diasztereoizomereket is. Amennyiben külön nem jelöljük az egyedi optikai izomereket, a leírásban megadott képlet a fentiekben említett előállítási eljárások során képződő racém keverékre vonatkozik. Ha egy alifás $C=C$ kettős kötés is jelen van, az előbbieken kívül geometriai izomerizáció is fellelhető.

A találmány kiterjed azokra a sókra is, amelyeket az (I) és az (Ia) általános képletű vegyületek savakkal képezhetnek. A savaddíciós sók kialakítására alkalmas szerves és szervetlen savak egyaránt lehetnek. Az ilyen savak példái közé tartoznak — egyebek mellett — a következők: hidrogén-klorid, hidrogén-bromid, salétromsav, foszforsav, kénsav, ecetsav, propionsav, vajsav, valeriánsav, oxálsav, malonsav, fumársav, szerves szulfonsavak, tejsav, borkősav, citromsav és szalicilsav.

Savas jellegük miatt azokat az (I) általános képletű vegyületeket, amelyekben G jelentése hidrogénatom, bázisok (protonakceptorok) jelenlétében egyszerűen átalakíthatjuk a megfelelő sókká, amelyekben G például egy fémion-ekvivalens vagy egy ammónium-kation (lásd például a 0 508 126. számú európai szabadalmi bejelentést). Bázisként bármilyen szokásosan alkalmazott protonakceptort felhasználhatunk. A sók — egyebek mellett — alkálifémsók, például nátrium- és káliumsók; alkáliföldfémsók, például kalcium- és magnéziumsók; ammóniumsók, azaz szubsztituált ammóniumsók és egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált ammóniumsók, például trietil-ammónium- vagy metil-ammónium-sók, valamint egyéb szerves bázisokkal vagy egyéb kationokkal, például szulfónium- vagy foszfónium-kationokkal képezett sók. A szulfónium-kationok körébe tartoznak — egyebek mellett — például a tri(1-4 szénatomos alkil)-szulfónium-kationok, amelyeket a megfelelő alkálifémsókból sókonverzióval, például egy kationcserélő alkalmazásával állíthatunk elő.

Az alkalmas sóképzők közé tartoznak az alkálifém- és alkáliföldfém-hidroxidok, különösen a lítium-, kálium-, magnézium-



vagy kalcium-hidroxid, amelyek közül különösen jelentős a nátrium-hidroxid és a kálium-hidroxid. Alkalmas sóképzőket ismeretnek például a WO 97/41112. számon közzétett nemzetközi szabadalmi bejelentésben.

Az ammóniumsók kialakítására alkalmas aminok körébe — egyebek mellett — például a következő vegyületek tartoznak: ammónia, valamint primer, szekunder és tercier 1-18 szénatomos alkil-aminok, 1-4 szénatomos (hidroxi-alkil)-aminok, valamint 2-4 szénatomos (alkoxi-alkil)-aminok, például metil-amin, etil-amin, propil-amin, izopropil-amin, a butil-aminok négy izomere, amil-amin, izoamil-amin, hexil-amin, heptil-amin, oktil-amin, nonil-amin, decil-amin, pentadecil-amin, hexadecil-amin, heptadecil-amin, oktadecil-amin, *N*-etil-*N*-metil-amin, *N*-izopropil-*N*-metil-amin, *N*-hexil-*N*-metil-amin, *N*-metil-*N*-nonil-amin, *N*-metil-*N*-pentadecil-amin, *N*-metil-*N*-oktadecil-amin, *N*-butil-*N*-etil-amin, *N*-etil-*N*-heptil-amin, *N*-etil-*N*-oktil-amin, *N*-heptil-*N*-hexil-amin, *N*-hexil-*N*-oktil-amin, dimetil-amin, dietil-amin, dipropil-amin, diizopropil-amin, dibutil-amin, diamil-amin, diizoamil-amin, dihexil-amin, diheptil-amin, dioktil-amin, (2-hidroxi-etil)-amin, (3-hidroxi-propil)-amin, (2-hidroxi-propil)-amin, *N,N*-bisz(2-hidroxi-etil)-amin, *N*-etil-*N*-(2-hidroxi-etil)-amin, *N*-butil-*N*-(2-hidroxi-etil)-amin, allil-amin, (2-butenil)-amin, (2-pentenil)-amin, (2,3-dimetil-2-butenil)-amin, di(2-butenil)-amin, (2-hexenil)-amin, propilén-di-amin, trimetil-amin, trietil-amin, tripropil-amin, triizopropil-amin, tributil-amin, triizobutil-amin, tri(szek-butil)-amin, triamil-amin, (2-metoxi-etil)-amin és (2-etoxi-etil)-

-amin; heterociklusos aminok, például piridin, kinolin, izokinolin, morfolin, *N*-metil-morfolin, tiomorfolin, piperidin, pirolidin, indolin, kinuklidin és azepin; primer aril-aminok, például anilinek, metoxi-anilinek, etoxi-anilinek, *orto*-, *meta*- és *p*-toluidinek, fenilén-diaminok, benzidinek, naftil-aminok, valamint *orto*-, *meta*- és *p*-klór-anilinek; de különösen előnyösen trietil-amin, izopropil-amin és diizopropil-amin.

A fenti definíciókban a halogénatom fluor-, klór-, bróm- vagy jódatomot, előnyösen fluor-, klór- vagy brómatomot jelöl.

A szubsztituensek fenti meghatározásaiban szereplő alkil-csoport kifejezés például metil-, etil-, propil-, izopropil-, butil-, szek-butil-, izobutil- vagy *terc*-butil-csoportra, valamint pentil-, hexil-, heptil-, oktil-, nonil-, decil-, undecil- és dodecil-izomerekre vonatkozik.

A halogén-alkil-csoportok előnyösen 1-6 szénatomos lánc-hosszúságúak. Halogén-alkil-csoportok például a következők: fluor-metil-, difluor-metil-, trifluor-metil-, klór-metil-, diklór-metil-, triklór-metil-, 2,2,2-trifluor-etil-, 2-fluor-etil-, 2-klór-etil-, pentafluor-etil-, 1,1-difluor-2,2,2-triklór-etil-, 2,2,3,3-tetrafluor-etil- és 2,2,2-triklór-etil-csoport; előnyösen triklór-metil-, difluor-klór-metil-, difluor-metil-, trifluor-metil- és diklór-fluor-metil-csoport.

Az alkoxics csoportok előnyösen 1-6 szénatomosak. Az alkoxics csoportok példái közé tartoznak — egyebek mellett — a következők: metoxi-, etoxi-, propoxi-, izopropoxi-, butoxi-, izobutoxi-, szek-butoxi- és *terc*-butoxi-csoport, valamint az izomer pentil-oxi- és hexil-oxi-csoportok; előnyösen metoxi-, etoxi-



és propoxicsoport.

A halogén-alkoxi-csoportok példái közé tartoznak — egyebek mellett — a következők: fluor-metoxi-, difluor-metoxi-, trifluor-metoxi-, 2,2,2-trifluor-etoxi-, 1,1,2,2-tetrafluor-etoxi-, 2-fluor-etoxi-, 2-klór-etoxi- vagy 2,2,2-triklór-etoxi-csoport.

Az alkenilcsoport kifejezés például vinil-, allil-, metallil-, 1-metil-vinil-, but-2-én-1-il-, pentenil- és 2-hexenilcsoportot jelöl. Az alkenilcsoportok előnyösen 3-6 szénatomos lánc hosszúságúak.

Az alkinilcsoport kifejezés például etinil-, propargil-, 1-metil-propargil-, 3-butinil-, but-2-in-1-il-, 2-metil-but-3-in-2-il-, but-3-in-2-il-, 1-pentinil-, pent-4-in-1-il- és 2-hexinil-csoportra vonatkozik. Az alkenilcsoportok előnyösen 3-6 szénatomos lánc hosszúságúak.

Alkalmas halogén-alkenil-csoportok azok az alkenilcsoportok, amelyek halogénatommal egyszeresen vagy többszörösen szubsztituáltak, ahol a halogénatom fluor-, klór-, bróm- vagy jódatom, különösen fluor- vagy klóratom, amilyenek — egyebek mellett — például a következő csoportok: 2- vagy 3-fluor-propenil-, 2- vagy 3-klór-propenil-, 2- vagy 3-bróm-propenil-, 2,2-difluor-1-metil-vinil-, 2,3,3-trifluor-propenil-, 3,3,3-trifluor-propenil-, 2,3,3-triklór-propenil-, 4,4,4-trifluor-2-butenil- és 4,4,4-triklór-2-butenil-csoport. A halogénatommal egyszeresen, kétszeresen vagy háromszorosan szubsztituált alkenilcsoportok közül előnyösek azok, amelyek 3-6 szénatomos lánc hosszúságúak. Az alkenilcsoportokat a halogénatomok a telített

vagy a telítetlen szénatomokon egyaránt szubsztituálhatják.

Alkalmas halogén-alkinil-csoportok azok az alkinilcsoportok, amelyek halogénatommal egyszeresen vagy többszörösen szubsztituáltak, ahol a halogénatom bróm- vagy jódatom, és különösen fluor- vagy klóratom, amilyenek — egyebek mellett — például a következő csoportok: 3-fluor-propinil-, 3-klór-propinil-, 3-bróm-propinil- és 4,4,4-trifluor-but-2-in-1-il-csoport.

Alkenil-oxi-csoport például az allil-oxi-, a metallil-oxi- és a (but-2-én-1-il)-oxi-csoport.

Alkinil-oxi-csoport például a propargil-oxi- és az (1-metil-propargil)-oxi-csoport.

Alkalmas halogén-alkenil-csoportok azok az alkenilcsoportok, amelyek halogénatommal egyszeresen vagy többszörösen szubsztituáltak, ahol a halogénatom fluor-, klór-, bróm- vagy jódatom, különösen fluor- vagy klóratom, amilyenek — egyebek mellett — például a következő csoportok: 2- vagy 3-fluor-propenil-, 2- vagy 3-klór-propenil-, 2- vagy 3-bróm-propenil-, 2,2-difluor-1-metil-vinil-, 2,3,3-trifluor-propenil-, 3,3,3-trifluor-propenil-, 2,3,3-triklór-propenil-, 4,4,4-trifluor-2-butenil- és 4,4,4-triklór-2-butenil-csoport.

Az alkoxi-alkil-csoportok előnyösen 1-6 szénatomosak. Az alkoxi-alkil-csoportok példái közé tartoznak — egyebek mellett — a következők: metoxi-metil-, metoxi-etil-, etoxi-metil-, etoxi-etil-, propoxi-metil-, propoxi-etil-, izopropoxi-metil- és izopropoxi-etil-csoport.

A halogén-alkoxi-csoportok példái közé tartoznak — egyebek mellett — a következők: fluor-metoxi-, difluor-metoxi-,



trifluor-metoxi-, 2,2,2-trifluor-etoxi-, 1,1,2,2-tetrafluor-etoxi-, 2-fluor-etoxi-, 2-klór-etoxi- vagy 2,2,2-triklór-etoxi-csoport.

Polialkoxi-alkil-csoportok — egyebek mellett — például a következők: (metoxi-metoxi)-metil-, (etoxi-metoxi)-metil-, (etoxi-etoxi)-metil-, (propoxi-etoxi)-metil-, (izopropoxi-etoxi)-metil-, (metoxi-metoxi)-etil-, (etoxi-metoxi)-etil-, (etoxi-etoxi)-etil-, (propoxi-etoxi)-etil-, (izopropoxi-etoxi)-etil- és trietoxi-etil-csoport.

A cikloalkilcsoportok alkalmasan 3-8 szénatomot tartalmaznak, amilyen például a ciklopropil-, a ciklobutil-, a ciklopentil-, a ciklohexil-, a cikloheptil- és a ciklooktilcsoport. Ezek a csoportok egy vagy több halogénatommal, előnyösen fluor-, klór- és/vagy brómatommal szubsztituáltak lehetnek.

Az alkil-karbonil-csoportok közül különösen jelentős az acetil- és a propionilcsoport.

Az alkoxi-karbonil-csoportok példái közé tartoznak — egyebek mellett — a következők: metoxi-karbonil-, etoxi-karbonil-, propoxi-karbonil-, izopropoxi-karbonil-, butoxi-karbonil-, izobutoxi-karbonil-, szek-butoxi-karbonil- vagy *terc*-butoxi-karbonil-csoport; valamint (pentil-oxi)-karbonil- és (hexil-oxi)-karbonil-izomerek; előnyösen metoxi-karbonil- vagy etoxi-karbonil-csoport.

A fenil-, fenoxi- és naftilcsoportok adott esetben szubsztituáltak lehetnek. Ezekben az esetekben a szubsztituensek az *orto*-, *meta*- és/vagy *para*-helyzetben, illetve a naftilcsoportok esetében az 5-ös, 6-os, 7-es és/vagy 8-as pozícióban lehetnek.



Előnyösen a szubsztituensek a gyűrű kapcsolódási pontjához viszonyítva orto- és para-helyzetűek. Ahol a fenil-, fenoxi- és naftilcsoportok szubsztituenseit konkrétan nem jelöljük meg, ott a szubsztituensek — egyebek mellett — például a következők lehetnek: 1-4 szénatomos alkilcsoport, halogénatom, 1-6 szénatomos halogén-alkil-csoport, 1-6 szénatomos alkoxics csoport, 1-6 szénatomos halogén-alkoxi-csoport, nitro-, ciano-, amino-csoport, 1-4 szénatomos alkil-amino-csoport vagy di(1-4 szénatomos alkil)-amino-csoport.

Az alkil-tio-csoportok előnyösen 1-6 szénatomos lánchosz-szúságúak. Az alkil-tio-csoportok példái közé tartoznak — egyebek mellett — a következők: metil-tio-, etil-tio-, propil-tio-, butil-tio-, pentil-tio- és hexil-tio-csoport, valamint elágazó izomereik, előnyösen metil-tio- és etil-tio-csoport.

A (halogén-alkil)-tio-csoportok körébe tartozik — egyebek mellett — például a (2,2,2-trifluor-etil)-tio- és a (2,2,2-triklór-etil)-tio-csoport.

Az alkil-szulfinil-csoportok példái közé tartoznak — egyebek mellett — a következők: metil-szulfinil-, etil-szulfinil-, propil-szulfinil-, izopropil-szulfinil-, butil-szulfinil-, izobutil-szulfinil-, szek-butil-szulfinil- vagy *terc*-butil-szulfinil-csoport, előnyösen metil-szulfinil- és etil-szulfinil-csoport.

Az alkil-szulfonil-csoportok példái közé tartoznak — egyebek mellett — a következők: metil-szulfonil-, etil-szulfonil-, propil-szulfonil-, izopropil-szulfonil-, butil-szulfonil-, izobutil-szulfonil-, szek-butil-szulfonil- vagy *terc*-bu-



til-szulfonil-csoport, előnyösen metil-szulfonil- és etil-szulfonil-csoport.

Az alkil-amino-csoportok példái közé tartoznak — egyebek mellett — a következők: metil-amino-, etil-amino-, propil-amino-, izopropil-amino-csoport, valamint az izomer butil-, pentil- és hexil-amino-csoportok.

A dialkil-amino-csoportok példái közé tartoznak — egyebek mellett — a következők: dimetil-amino-, *N*-etil-*N*-metil-amino-, dietil-amino-, *N*-metil-*N*-propil-amino-, dibutil-amino- és diizopropil-amino-csoport.

Az (alkil-tio)-alkil-csoportok példái közé tartoznak — egyebek mellett — a következők: (metil-tio)-metil-, (metil-tio)-etil-, (etil-tio)-metil-, (etil-tio)-etil-, (propil-tio)-metil-, (propil-tio)-etil-, (izopropil-tio)-metil-, (izopropil-tio)-etil-csoport.

A heterociklusos csoportok vagy heterociklilcsoportok előnyösen 4-8 tagúak és a nitrogén-, kén- és oxigénatom közül kiválasztott egy vagy két heteroatomot tartalmaznak. A heterociklusos csoportok előnyösen telítettek.

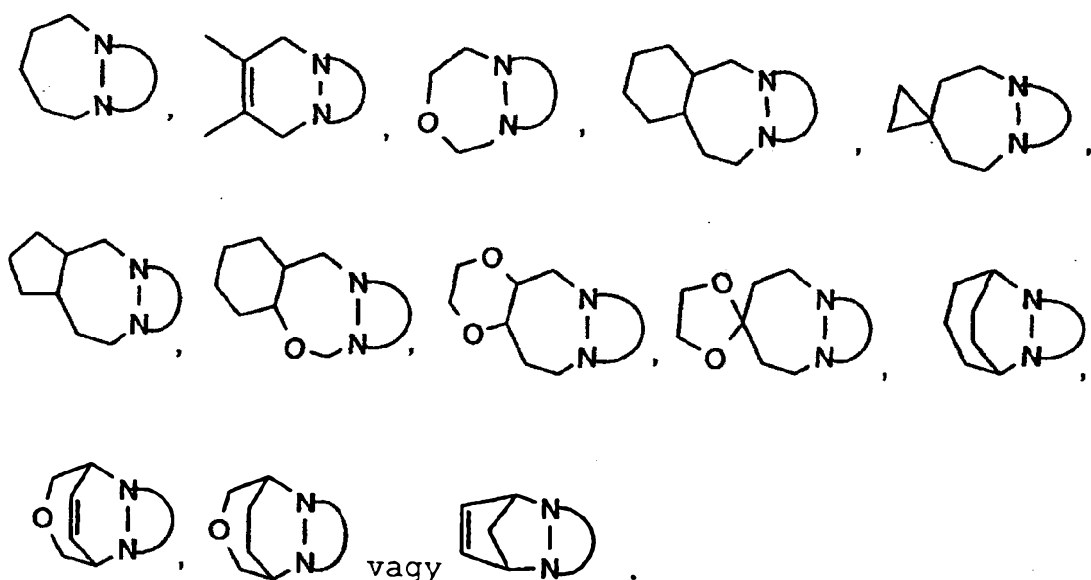
A heteroaril-csoportok szokásosan öt- vagy hattagú aromás heterociklusos csoportok, amelyek előnyösen 1-3 heteroatomot, például nitrogén-, kén- és/vagy oxigénatomot tartalmaznak. Az említett heterociklusos és heteroaromás csoportok alkalmasan — egyebek mellett — például a következő vegyületekből származnak: piridin, pirrolidin, piperidin, pirán, dioxán, azetidin, oxetán, pirimidin, triazin, tiazol, triazol, tiadiazol, imidazol, oxazol, izoxazol, pirazin, furán, tiofén, morfolin, pipe-



razin, pirazol, benzoxazol, benzotiazol, kinoxalin, indol és kinolin. Ezek a heterociklusos és heteroaromás csoportok adott esetben szubsztituáltak lehetnek; ahol nem tüntetünk fel konkrét helyettesítőt, a szubsztituensek például a következő atomok és/vagy csoportok közül kerülnek kiválasztásra: halogénatom, 1-6 szénatomos alkilcsoport, 1-6 szénatomos alkoxics csoport, 1-6 szénatomos halogén-alkil-csoport, 1-6 szénatomos halogén-alkoxi-csoport, 1-6 szénatomos alkil-tio-csoport, aminocsoport, 1-6 szénatomos alkil-amino-csoport, di(1-6 szénatomos alkil)-aminocsoport, fenil-, nitro- és cianocsoport.

Az "R₄ és R₅ azokkal a nitrogénatomokkal együtt, amelyekhez kötődnek, egy telített vagy telítetlen 5-8 tagú heterociklusos gyűrűt képeznek, amely 1) adott esetben oxigén-, kénatommal vagy >NR₁₄ általános képletű csoporttal van megszakítva és/vagy adott esetben halogénatommal, 1-10 szénatomos alkilcsoporttal, 1-10 szénatomos halogén-alkil-csoporttal, hidroxics csoporttal, 1-6 szénatomos alkoxics csoporttal, (1-6 szénatomos alkoxi)-(1-6 szénatomos alkoxi)-csoporttal, 1-6 szénatomos halogén-alkoxi-csoporttal, merkaptocsoporttal, 1-6 szénatomos alkil-tio-csoporttal, 3-7 szénatomos cikloalkilcsoporttal, heteroarilcsoporttal, heteroaril-(1-6 szénatomos alkil)-csoporttal, fenilcsoporttal, fenil-(1-6 szénatomos alkil)-csoporttal vagy benzil-oxi-csoporttal szubsztituált, ahol az utóbbi három szubsztituens fenilcsoportja adott esetben halogénatommal, 1-6 szénatomos alkilcsoporttal, 1-6 szénatomos halogén-alkil-csoporttal, 1-6 szénatomos alkoxics csoporttal, 1-6 szénatomos halogén-alkoxi-csoporttal vagy nitrocsoporttal szubsztituált, és/-

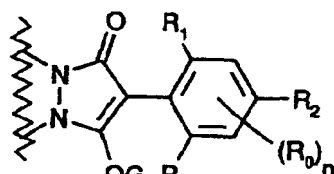
vagy 2) egy kondenzált vagy spiro-kötött 2-6 szénatomos, adott esetben oxigén- vagy kénatommal megszakított alkilén- vagy alkenilénláncot tartalmazhat, vagy a telített vagy telítetlen heterociklusos gyűrű legalább egy gyűrűatomja köti össze az alkilén- vagy alkenilénláncot" szubsztituens-meghatározás — egyebek mellett — például a következő heterociklusos gyűrűrendszereket foglalja magában:



Ezekben a policiklusos gyűrűrendszerekben a



egy-

szerűsített képlet a  általános képletű csoportot jelenti.

Az 5-8 tagú heterociklusos gyűrűk, amelyeket az R_4 és R_5 szubsztituensek együtt alkothatnak, és amelyek kondenzált vagy

spiro-kötött 2-6 szénatomos alkilén- vagy alkenilénláncot tartalmazhatnak, adott esetben egy vagy két heteroatommal, például oxigénatommal lehetnek megszakítva.

A fentiekben megadott jelentések az olyan összetett szubsztituensek meghatározására is kiterjednek, amilyenek — egyebek mellett — például a következők: alkoxi-alkoxi-, (alkil-szulfonil)-amino-, (alkil-amino)-szulfonil-, alkoxi-karbonil-, (alkil-karbonil)-amino-, fenil-alkil-, naftil-alkil- és heteroaril-alkil-csoport.

Az alkil-karbonil-, (alkil-karbonil)-amino- és alkoxi-karbonil-csoportok definícióiban a karbonilcsoport szénatomja nem szerepel a konkrét esetekben megadott alsó és felső határértékek által meghatározott szénatomszám-tartományban.

Az (Ia) általános képletben szereplő G_0 szubsztituensben lévő R_{30} , R_{31} és R_{34} csoportok esetén megadott összetett csoportok, például cikloalkil-tio-, cikloalkil-alkil-, heterociklil-alkil-, heteroaril-alkil-, fenil-alkil-, fenoxi-alkil- és (heteroaril-oxi)-alkil-csoportok a fentiekben említett megfelelő csoportokból származnak. A heterociklusos csoportok előnyösen egy vagy két, a nitrogén-, kén- és oxigénatom kiválasztott heteroatomot tartalmaznak. A heterociklusos csoportok általában telítettek.

A heteroarilcsoportok szokásosan aromás heterociklusos csoportok, amelyek előnyösen 1-3, a nitrogén-, kén- és oxigénatom kiválasztott heteroatomot tartalmaznak. A heterociklusos és heteroaromás csoportok további szubsztituenseket, például halogénatomokat, 1-4 szénatomos alkilcsoportokat és/vagy amino-

csoportokat hordozhatnak. Az R_{31} szubsztituens jelentésében szereplő 2-20 szénatomos alkenilcsoportok egyszeresen vagy többszörösen telítetlenek lehetnek. Az említett alkenilcsoportok előnyösen 2-12, különösen előnyösen 2-6 szénatomot tartalmaznak.

A (XII) általános képletnek megfelelő G-L elektrofil — egyebek mellett — például a következő vegyületek közül kerülhet kiválasztásra: $L-C(O)-R_{30}$ (XIIa), $L-C(X_1)-X_2-R_{31}$ (XIIb), $L-C(X_3)-N(R_{32})-R_{33}$ (XIIc), $R_{32}N=C=X_3$ (XIId), $L-SO_2-R_{34}$ (XIIe) és $L-P(X_4)(R_{35})-R_{36}$ (XIIf).

A (XII) általános képletű elektrofilben L jelentése kilépőcsoport, például $R_{30}C(O)O-$ vagy $R_{31}O-$ általános képletű csoport [amelyben R_{30} és R_{31} jelentése az (Ia) általános képletnél meghatározott], vagy halogénatom, előnyösen klór-, bróm- vagy jódatom.

A találmány szerinti eljárás különösen alkalmas az olyan (I) általános képletű vegyületek előállítására, amelyekben R_0 jelentése egymástól függetlenül halogénatom, 1-6 szénatomos alkilcsoport, 1-6 szénatomos halogén-alkil-csoport, hidroxicssoport, 1-6 szénatomos alkoxicssoport, nitro-, aminocsoport, 1-6 szénatomos alkil-amino-csoport, di(1-6 szénatomos alkil)-amino-csoport, [(1-6 szénatomos alkil)-karbonil]-amino-csoport, [(1-6 szénatomos alkil)-szulfonyl]-amino-csoport, [(1-6 szénatomos alkil)-amino]-szulfonyl-csoport, (1-4 szénatomos alkil)-karbonil-csoport, (1-6 szénatomos alkoxi)-karbonil-csoport vagy karboxilcsoport; valamint



R_1 , R_2 és R_3 mindegyikének jelentése egymástól függetlenül hidrogén-, halogénatom, 1-6 szénatomos alkilcsoport, 2-6 szénatomos alkenilcsoport, 2-6 szénatomos alkinilcsoport, 3-6 szénatomos cikloalkilcsoport, 1-6 szénatomos halogén-alkil-csoport, 2-6 szénatomos halogén-alkenil-csoport, 2-6 szénatomos halogén-alkinil-csoport, 3-6 szénatomos halogén-cikloalkil-csoport, (1-6 szénatomos alkoxi)-(1-6 szénatomos alkil)-csoport, [(1-6 szénatomos alkil)-tio]-(1-6 szénatomos alkil)-csoport, cianocsoport, (1-4 szénatomos alkil)-karbonil-csoport, (1-6 szénatomos alkoxi)-karbonil-csoport, hidroxics csoport, 1-10 szénatomos alkoxi-csoport, 3-6 szénatomos alkenil-oxi-csoport, 3-6 szénatomos alkinil-oxi-csoport, 1-6 szénatomos halogén-alkoxi-csoport, 3-6 szénatomos (halogén-alkenil)-oxi-csoport, (1-6 szénatomos alkoxi)-(1-6 szénatomos alkoxi)-csoport, merkaptocsoport, 1-6 szénatomos alkil-tio-csoport, 1-6 szénatomos (halogén-alkil)-tio-csoport, 1-6 szénatomos alkil-szulfinil-csoport, 1-6 szénatomos alkil-szulfonil-csoport, nitro-, aminocsoport, 1-4 szénatomos alkil-amino-csoport vagy di(1-6 szénatomos alkil)-amino-csoport.

A találmány szerinti eljárás különösen jól alkalmazható az olyan (I) általános képletű vegyületek előállítására, amelyekben

R_1 , R_2 és R_3 mindegyikének jelentése egymástól függetlenül hidrogén-, halogénatom, 1-4 szénatomos alkilcsoport, 2-4 szénatomos alkenilcsoport, 2-4 szénatomos alkinilcsoport, 1-4 szénatomos halogén-alkil-csoport, 3-4 szénatomos halo-



gén-alkenil-csoport, 3-6 szénatomos cikloalkilcsoport, (1-4 szénatomos alkil)-karbonil-csoport, (1-6 szénatomos alkoxi)-karbonil-csoport, hidroxicssoport, 1-4 szénatomos alkoxicssoport, 3-4 szénatomos alkenil-oxi-csoport, 3-4 szénatomos alkinil-oxi-csoport, 1-4 szénatomos halogén-alkoxi-csoport, nitro- vagy aminocsoport.

A találmány szerinti eljárás különösen jól alkalmazható továbbá az olyan (I) általános képletű vegyületek előállítására, amelyekben

R₄ és R₅ azokkal a nitrogénatomokkal együtt, amelyekhez kötődnek, egy telített vagy telítetlen hat- vagy héttagú heterociklusos gyűrűt képeznek, amely

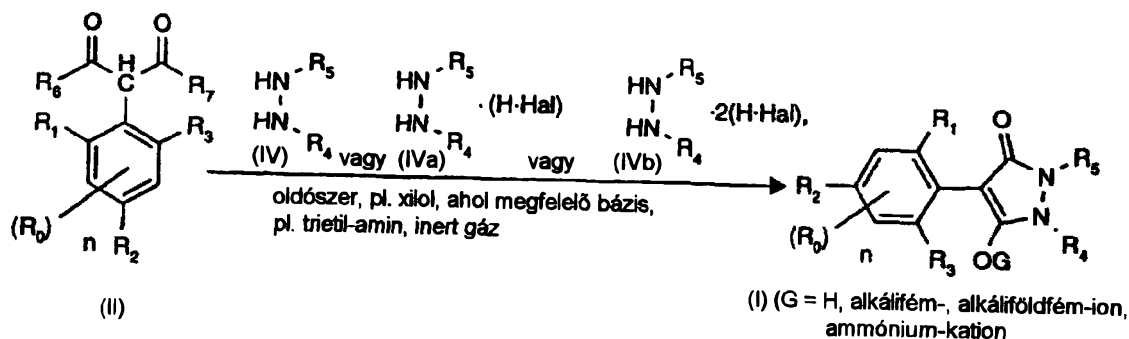
1) adott esetben oxigén- és/vagy kénatommal van megszakítva, és/vagy

2) egy kondenzált vagy spiro-kötött 2-5 szénatomos, adott esetben oxigén- vagy kénatommal egyszeresen vagy kétszeresen megszakított alkilénláncot tartalmazhat, vagy a telített vagy telítetlen heterociklusos gyűrű legalább egy gyűrűatomja köti össze az alkilénláncot.

A találmány szerinti eljárás egyik előnyös változatában előnyösen olyan (II) általános képletű vegyületeket alkalmazunk, amelyekben R₈, R₉, R₁₀, R₁₁ és R₁₂ jelentése hidrogénatom, 1-6 szénatomos alkilcsoport vagy benzilcsoport.

Az (I) és az (Ia) általános képletű vegyületek előállítását az alábbi reakcióvázlatokon keresztül mutatjuk be részletebben.

1. reakcióvázlat



A (II) és a (IV), (IVa) vagy (IVb) általános képletű vegyületeket ekvimoláris mennyiségben alkalmazhatjuk, de a (IV), (IVa) vagy (IVb) általános képletű vegyület 5-50 mol% feleslegben történő használata előnyös lehet.

A (II) és a (IV), (IVa) vagy (IVb) általános képletű vegyület közötti reakciót 0 °C és 200 °C, előnyösen 80 °C és 150 °C közötti hőmérséklet-tartományban hajtjuk végre.

A (II) és a (IV), (IVa) vagy (IVb) általános képletű vegyület közötti reakciót alkalmas inert szerves oldószerekben hajtjuk végre, amilyenek — egyebek mellett — például a következők: aromás, alifás és cikloalifás szénhidrogének, például benzol, toluol, xilol izomerek, például orto-, meta- és para-xilol, ciklohexán és metil-ciklohexán; halogénezett szénhidrogének, például klór-benzol és diklór-benzol izomerek, például 1,2-, 1,3- és 1,4-diklór-benzol; éterek, például dibutil-éter, terc-butil-metil-éter, 1,2-dimetoxi-etán (DME), etilén-glikol-dimetil-éter, dietilén-flikol-dimetil-éter, 1,3-dioxolán és dioxán; nitrilek, például acetonitril, propionitril és benzonitril; dialkil-szulfoxidok, például dimetil-szulfoxid (DMSO);

amidok és laktámok, például *N,N*-dimetil-formamid (DMF), *N,N*-di-
etil-formamid és *N*-metil-pirrolidon (NMP); alkoholok, glikolok
(diolok) és polialkoholok, például propanol, butanol, ciklohe-
xanol, etilénglikol és 2-etoxi-etanol, valamint általában kar-
bonsavak, például ecetsav és propionsav, továbbá az előbbi ol-
dószerek keverékei.

Előnyösek azok a szerves oldószerek, amelyek forráspontja
legalább 80 °C, még előnyösebbek, amelyek forráspontja legalább
100 °C.

Különösen előnyösek a következő oldószerek: toluol, xilol
izomerek, például orto-, meta- és para-xilol, ciklohexán és me-
til-ciklohexán, klór-benzol és diklór-benzol izomerek, például
1,2-, 1,3- és 1,4-diklór-benzol.

A találmány szerinti eljárás értelmében a reakciót előnyö-
sen inert gáz atmoszférában, például nitrogén- vagy argonat-
moszférában hajtjuk végre.

A (II) általános képletű vegyületek és a (IV) általános
képletű vegyületek közötti kondenzációs reakciót hozzáadott bá-
zissal vagy hozzáadott bázis nélkül hatjhatjuk végre. A [(IV)
általános képletű vegyület helyett] (IVa) vagy (IVb) általános
képletű vegyületekkel végzett ugyanezen kondenzációs reakciót
előnyösen bázis jelenlétében végezzük. Az utóbbi esetben alkal-
mas bázisok — egyebek mellett — például általában a nitrogén-
bázisok, így tercier aminok és piridinek, például tri(1-6 szén-
atomos alkil)-aminok, kinuklidin és 4-(dimetil-amino)-piridin.
Ugyancsak alkalmas bázisok például az alkálifém-alkoholátok,
például a nátrium- és a kálium-metanolát, a nátrium- és a káli-

um-etanolát, valamint nátrium- és a kálium-terc-butanolát. Szervetlen bázisok alkalmazására is lehetőség nyílik, amilyenek — egyebek mellett — például az alkálifém- és az alkáliföld-fém-hidridek, így a nátrium-, a kálium- vagy a kalcium-hidrid, hidroxidok, például nátrium- vagy kálium-hidroxid, karbonátok, például nátrium- vagy kálium-karbonát, valamint hidrogén-karbonátok, például nátrium- vagy kálium-hidrogén-karbonát, különösen alkohol oldatok formájában. Az említett bázisokat katalitikus mennyiségben vagy a (II) általános képletű vegyületre vonatkoztatva legfeljebb ötszörös moláris feleslegben alkalmazzuk.

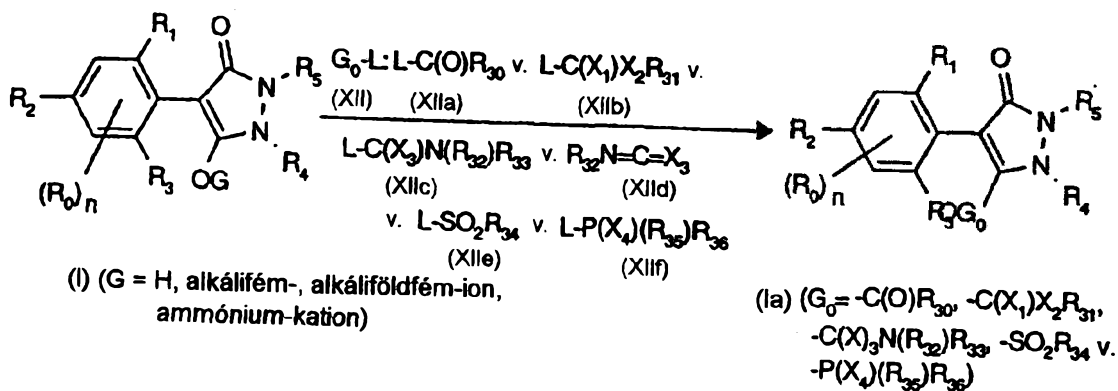
A találmány szerinti eljárás egyik előnyös megoldása értelmében reakcióközegként egy 80 °C-nál magasabb forráspontú aromás szénhidrogént, például xilolt alkalmazunk, amelyben feloldjuk a (II) és a (IV), (IVa) vagy (IVb) általános képletű reaktánst. A (II) általános képletű vegyületre vonatkoztatva a (IV), (IVa) vagy (IVb) általános képletű vegyületet előnyösen 5-20 mol% feleslegben használjuk. A reakciókeveréket inert gáz atmoszférában, a (IV) általános képletű vegyület hozzáadott bázis nélkül vagy hozzáadott bázis jelenlétében, illetve a (IVa) vagy (IVb) általános képletű vegyület esetében ekvimoláris mennyiségű vagy legfeljebb ötszörös feleslegben lévő szerves bázis, például trietil-amin jelenlétében 1-3 órán keresztül visszafolyató hűtő alatt forraljuk. Lehűlést követően a reakciókeverékhez híg savat adunk, ennek hatására a kívánt termék (G jelentése hidrogénatom) kristályos anyag formájában kicsapódik, amit közvetlenül kiszűrhetünk, majd alkalmas mosófolyadék-

kal, például vízzel és/vagy hexánnal moshatunk.

Azokat az (I) általános képletű vegyületeket, amelyekben R_0 , R_1 , R_2 , R_3 , R_4 és R_5 jelentése, valamint n értéke a fentiekben meghatározott, és G jelentése hidrogénatom, egy fémion-ekvivalens vagy egy ammónium-kation, egyszerűen átalakíthatjuk (Ia) általános képletű vegyületekké

- a találmány szerinti eljárásnak megfelelően közvetlenül a reakcióoldatban egy egyedényes ("one-pot") reakcióban, izolálás nélkül, vagy
- izolálás után egy következő reakciólépésben, amelyben az izolált vegyületet adott esetben savmegkötő szer vagy katalizátor jelenlétében egy (XII) általános képletű elektrofilrel reagáltatjuk, amelynek képletében G_0 jelentése a fentiekben meghatározott, és L jelentése kilépőcsoport, például $R_{30}C(O)O^-$ vagy $R_{31}O^-$ általános képletű csoport [amelyben R_{30} és R_{31} jelentése az (Ia) általános képletnél meghatározott], vagy halogénatom, előnyösen klór-, bróm- vagy jódatom. Ezt az átalakítási lépést a 2. reakcióvázlat mutatja be.

2. reakcióvázlat



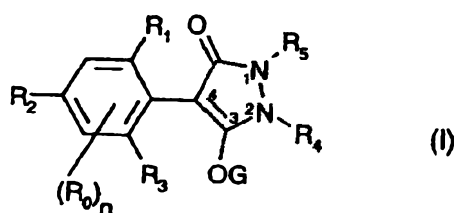
Az (I) általános képletű vegyületek és a (XII) általános képletű elektrofilek közötti reakció esetén alkalmazható savmegkötő szerek szokásos protonakceptorok lehetnek, amilyenek — egyebek mellett — például a következők: alkálifém-hidridek, alkálifém-alkoholátok, alkálifém- vagy alkáliföldfém-karbonátok vagy -hidrogén-karbonátok, vagy általában nitrogénbázisok, például trietil-amin, diizopropil-amin, piridin, kinolin, 1,5-diaza-biciklo[4.3.0]non-5-én (DBN) és 1,8-diaza-biciklo[5.4.0]undec-7-én (DBU). Az (I) általános képletű vegyületek és a (IIId) általános képletű elektrofilek közötti reakció esetén a reakciót gyorsító katalizátorokat is alkalmazhatunk, amilyenek bizonyos szerves ónvegyületek, például a dibutil-dilaurát.

Az alkalmazott oldószer bármely olyan oldószer lehet, amely a (XII) és (XIIa)-(XII f) általános képletű elektrofilekre nézve inert, amilyenek — egyebek mellett — például a következők: aromás szénhidrogének, például benzol, toluol vagy xilol izomerek; halogénezett szénhidrogének, például metilén-diklorid, kloroform, klór-benzol és diklór-benzol izomerek; amidok, például *N,N*-dimetil-formamid (DMF) és *N*-metil-2-pirrolidon (NMP); valamint éterek, például dibutil-éter, 1,2-dimetoxi-etán (DME), 1,3-dioxolán, tetrahydrofurán vagy dioxán.

A WO 97/02243. számon közzétett nemzetközi szabadalmi bejelentésben és a 0 508 126. számú európai szabadalmi bejelentésben további olyan, analóg reakciókat ismertetnek, amelyek felhasználhatók a fenti b) eljárásváltozatban az olyan (I) általános képletű vegyületek átalakítására, amelyekben G jelentése hidrogénatom.

A találmány szerinti megoldásnak megfelelően előállított olyan (I) általános képletű vegyületeket, amelyek képletében G jelentése hidrogénatom, egy fémion-ekvivalens vagy egy ammónium-, szulfónium- vagy foszfónium-kation, kiindulási vegyületekként alkalmazhatjuk olyan (Ia) általános képletű vegyületek *in situ* előállítására, amelyek képletében G_0 jelentése $-C(O)-R_{30}$, $-C(X_1)-X_2-R_{31}$, $-C(X_3)-N(R_{32})-R_{33}$, $-SO_2-R_{34}$ vagy $-P(X_4)(R_{35})-R_{36}$ általános képletű csoport; valamint R_{30} , R_{31} , R_{32} , R_{33} , R_{34} , R_{35} , R_{36} , X_1 , X_2 , X_3 és X_4 jelentése az (Ia) általános képlet-nél meghatározott.

Azok az (I) általános képletű vegyületek,



amelyek képletében

R_0 jelentése egymástól függetlenül halogénatom, 1-6 szénatomos alkilcsoport, 2-6 szénatomos alkenilcsoport, 2-6 szénatomos alkinilcsoport, 1-6 szénatomos halogén-alkil-csoport, ciano-(1-6 szénatomos alkil)-csoport, 2-6 szénatomos halogén-alkenil-csoport, ciano-(2-6 szénatomos alkenil)-csoport, 2-6 szénatomos halogén-alkinil-csoport, ciano-(2-6 szénatomos alkinil)-csoport, hidroxicssoport, 1-6 szénatomos hidroxi-alkil-csoport, 1-6 szénatomos alkoxi-csoport, nitro-, aminocsoport, 1-6 szénatomos alkil-amino-csoport, di(1-6 szénatomos alkil)-amino-csoport, [(1-6



szénatomos alkil)-karbonil]-amino-csoport, [(1-6 szénatomos alkil)-szulfonil]-amino-csoport, [(1-6 szénatomos alkil)-amino]-szulfonil-csoport, (1-6 szénatomos alkil)-karbonil-csoport, [(1-6 szénatomos alkil)-karbonil]-(1-6 szénatomos alkil)-csoport, [(1-6 szénatomos alkoxi)-karbonil]-(1-6 szénatomos alkil)-csoport, [(1-6 szénatomos alkil)-karbonil]-(2-6 szénatomos alkenil)-csoport, [(1-6 szénatomos alkoxi)-karbonil]-(2-6 szénatomos alkenil)-csoport, [(1-6 szénatomos alkil)-karbonil]-(2-6 szénatomos alkinil)-csoport, [(1-6 szénatomos alkoxi)-karbonil]-(2-6 szénatomos alkinil)-csoport, (1-6 szénatomos alkoxi)-karbonil-csoport, ciano-, karboxilcsoport, fenilcsoport vagy aromás csoport, amely a nitrogén-, az oxigén- és a kénatom közül kiválasztott 1 vagy 2 heteroatomot tartalmaz, ahol az utóbbi két aromás csoport adott esetben 1-3 szénatomos alkilcsoporttal, 1-3 szénatomos halogén-alkil-csoporttal, 1-3 szénatomos alkoxicssoporttal, 1-3 szénatomos halogén-alkoxi-csoporttal, halogénatommal, ciano- vagy nitrocsoporttal szubsztituált; vagy

R_0 a szomszédos R_1 , R_2 és R_3 szubsztituensekkel együtt egy telített vagy telítetlen 3-6 szénatomos szénhidrogénhidat képezhet, amelyet a nitrogén-, oxigén- és kénatom közül kiválasztott egy vagy két heteroatom szakíthat meg és/vagy amely 1-4 szénatomos alkilcsoporttal szubsztituált lehet;

R_1 , R_2 és R_3 mindegyikének jelentése egymástól függetlenül hidrogén-, halogénatom, 1-6 szénatomos alkilcsoport, 2-6 szénatomos alkenilcsoport, 2-6 szénatomos alkinilcsoport,

3-6 szénatomos cikloalkilcsoport, 1-6 szénatomos halogén-alkil-csoport, 2-6 szénatomos halogén-alkenil-csoport, [(1-6 szénatomos alkoxi)-karbonil]-(2-6 szénatomos alkenil)-csoport, [(1-6 szénatomos alkil)-karbonil]-(2-6 szénatomos alkenil)-csoport, ciano-(2-6 szénatomos alkenil)-csoport, nitro-(2-6 szénatomos alkenil)-csoport, 2-6 szénatomos halogén-alkinil-csoport, [(1-6 szénatomos alkoxi)-karbonil]-(2-6 szénatomos alkinil)-csoport, [(1-6 szénatomos alkil)-karbonil]-(2-6 szénatomos alkinil)-csoport, ciano-(2-6 szénatomos alkinil)-csoport, nitro-(2-6 szénatomos alkinil)-csoport, 3-6 szénatomos halogén-cikloalkil-csoport, hidroxil-(1-6 szénatomos alkil)-csoport, (1-6 szénatomos alkoxi)-(1-6 szénatomos alkil)-csoport, [(1-6 szénatomos alkil)-tio]-(1-6 szénatomos alkil)-csoport, cianocsoport, (1-4 szénatomos alkil)-karbonil-csoport, (1-6 szénatomos alkoxi)-karbonil-csoport, hidroxil-csoport, 1-10 szénatomos alkoxicssoport, 3-6 szénatomos alkenil-oxi-csoport, 3-6 szénatomos alkinil-oxi-csoport, 1-6 szénatomos halogén-alkoxi-csoport, 3-6 szénatomos (halogén-alkenil)-oxi-csoport, (1-6 szénatomos alkoxi)-(1-6 szénatomos alkoxi)-csoport, merkaptocsoport, 1-6 szénatomos alkil-tio-csoport, 1-6 szénatomos (halogén-alkil)-tio-csoport, 1-6 szénatomos alkil-szulfonil-csoport, 1-6 szénatomos alkil-szulfonil-csoport, nitro-, aminocsoport, 1-6 szénatomos alkil-amino-csoport, di(1-6 szénatomos alkil)-amino-csoport vagy fenoxicssoport, amelyben a fenil-csoport adott esetben 1-3 szénatomos alkilcsoporttal, 1-3

szénatomos halogén-alkil-csoporttal, 1-3 szénatomos alkoxicssoporttal, 1-3 szénatomos halogén-alkoxi-csoporttal, halogénatommal ciano- vagy nitrocssoporttal szubsztituált;

R₂ jelentése ezenkívül fenilcsoport, naftilcsoport vagy egy öt- vagy hattagú aromás csoport, amely a nitrogén-, oxigén- és kénatom közül kiválasztott egy vagy két heteroatomot tartalmazhat, ahol a fenilcsoport, a naftilcsoport és az öt- vagy hattagú aromás csoport adott esetben halogénatommal, 3-8 szénatomos cikloalkilcsoporttal, hidrox-, merkapto-, amino-, ciano-, nitro- vagy formilcsoporttal szubsztituált lehet; és/vagy

a fenilcsoport, a naftilcsoport és az öt- vagy hattagú aromás csoport adott esetben a következő csoportokkal szubsztituált lehet: 1-6 szénatomos alkilcsoport, 1-6 szénatomos alkoxicssoport, hidrox-(1-6 szénatomos alkil)-csoport, (1-6 szénatomos alkoxi)-(1-6 szénatomos alkil)-csoport, (1-6 szénatomos alkoxi)-(1-6 szénatomos alkoxi)-csoport, (1-6 szénatomos alkil)-karbonil-csoport, 1-6 szénatomos alkil-tio-csoport, 1-6 szénatomos alkil-szulfonil-csoport, 1-6 szénatomos alkil-szulfonil-csoport, mono-(1-6 szénatomos alkil)-amino-csoport, di(1-6 szénatomos alkil)-amino-csoport, [(1-6 szénatomos alkil)-karbonil]-amino-csoport, N-[(1-6 szénatomos alkil)-karbonil]-N-(1-6 szénatomos alkil)-amino-csoport, 2-6 szénatomos alkenilcsoport, (3-6 szénatomos alkenil)-oxi-csoport, hidrox-(3-6 szénatomos alkenil)-csoport, (1-6 szénatomos alkoxi)-(2-6 szénatomos alkenil)-csoport, [(1-6 szénatomos

alkoxi)-(3-6 szénatomos alkenil)]-oxi-csoport, (2-6 szénatomos alkenil)-karbonil-csoport, 2-6 szénatomos alkenil-tio-csoport, 2-6 szénatomos alkenil-szulfinil-csoport, 2-6 szénatomos alkenil-szulfonil-csoport, mono- vagy di(2-6 szénatomos alkenil)-amino-csoport, *N*-(1-6 szénatomos alkil)-*N*-(3-6 szénatomos alkenil)-amino-csoport, [(2-6 szénatomos alkenil)-karbonil]-amino-csoport, *N*-[(2-6 szénatomos alkenil)-karbonil]-*N*-(1-6 szénatomos alkil)-amino-csoport, 2-6 szénatomos alkinilcsoport, (3-6 szénatomos alkinil)-oxi-csoport, hidroxil-(3-6 szénatomos alkinil)-csoport, (1-6 szénatomos alkoxi)-(2-6 szénatomos alkinil)-csoport, [(1-6 szénatomos alkoxi)-(3-6 szénatomos alkinil)]-oxi-csoport, (2-6 szénatomos alkinil)-karbonil-csoport, 2-6 szénatomos alkinil-tio-csoport, 2-6 szénatomos alkinil-szulfinil-csoport, 2-6 szénatomos alkinil-szulfonil-csoport, mono- vagy di(2-6 szénatomos alkinil)-amino-csoport, *N*-(1-6 szénatomos alkil)-*N*-(3-6 szénatomos alkinil)-amino-csoport, [(2-6 szénatomos alkinil)-karbonil]-amino-csoport vagy *N*-[(2-6 szénatomos alkinil)-karbonil]-*N*-(1-6 szénatomos alkil)-amino-csoport; és/vagy a fenilcsoport, a naftilcsoport és az öt- vagy hattagú aromás csoport adott esetben a következő csoportokkal szubsztituált lehet: halogén-szubsztituált 1-6 szénatomos alkilcsoport, 1-6 szénatomos alkoxicssoport, hidroxil-(1-6 szénatomos alkil)-csoport, (1-6 szénatomos alkoxi)-(1-6 szénatomos alkil)-csoport, (1-6 szénatomos alkoxi)-(1-6 szénatomos alkoxi)-csoport, (1-6 szénatomos alkil)-karbo-

nil-csoport, 1-6 szénatomos alkil-tio-csoport, 1-6 szénatomos alkil-szulfinil-csoport, 1-6 szénatomos alkil-szulfonil-csoport, mono(1-6 szénatomos alkil)-amino-csoport, di(1-6 szénatomos alkil)-amino-csoport, [(1-6 szénatomos alkil)-karbonil]-amino-csoport, *N*-[(1-6 szénatomos alkil)-karbonil]-*N*-(1-6 szénatomos alkil)-amino-csoport, 2-6 szénatomos alkenilcsoport, (3-6 szénatomos alkenil)-oxi-csoport, hidroxil-(3-6 szénatomos alkenil)-csoport, (1-6 szénatomos alkoxi)-(2-6 szénatomos alkenil)-csoport, [(1-6 szénatomos alkoxi)-(3-6 szénatomos alkenil)]-oxi-csoport, (2-6 szénatomos alkenil)-karbonil-csoport, 2-6 szénatomos alkenil-tio-csoport, 2-6 szénatomos alkenil-szulfinil-csoport, 2-6 szénatomos alkenil-szulfonil-csoport, mono- vagy di(2-6 szénatomos alkenil)-amino-csoport, *N*-(1-6 szénatomos alkil)-*N*-(3-6 szénatomos alkenil)-amino-csoport, [(2-6 szénatomos alkenil)-karbonil]-amino-csoport, *N*-[(2-6 szénatomos alkenil)-karbonil]-*N*-(1-6 szénatomos alkil)-amino-csoport, 2-6 szénatomos alkinilcsoport, (3-6 szénatomos alkinil)-oxi-csoport, hidroxil-(3-6 szénatomos alkinil)-csoport, (1-6 szénatomos alkoxi)-(2-6 szénatomos alkinil)-csoport, [(1-6 szénatomos alkoxi)-(3-6 szénatomos alkinil)]-oxi-csoport, (2-6 szénatomos alkinil)-karbonil-csoport, 2-6 szénatomos alkinil-tio-csoport, 2-6 szénatomos alkinil-szulfinil-csoport, 2-6 szénatomos alkinil-szulfonil-csoport, mono- vagy di(2-6 szénatomos alkinil)-amino-csoport, *N*-(1-6 szénatomos alkil)-*N*-(3-6 szénatomos alkinil)-amino-csoport, [(2-6 szénatomos alkinil)-karbo-

nil]-amino-csoport vagy *N*-[(2-6 szénatomos alkinil)-karbonil]-*N*-(1-6 szénatomos alkil)-amino-csoport; és/vagy a fenilcsoport, a naftilcsoport és az öt- vagy hattagú aromás csoport adott esetben a következő csoportokkal szubsztituált lehet: -COOR₅₀, -CONR₅₁, -SO₂NR₅₃R₅₄ vagy -SO₂OR₅₅ általános képletű csoport, ahol

R₅₀, R₅₁, R₅₂, R₅₃, R₅₄ és R₅₅ mindegyikének jelentése egymástól függetlenül 1-6 szénatomos alkilcsoport, 2-6 szénatomos alkenilcsoport vagy 3-6 szénatomos alkinilcsoport, vagy halogénatommal, hidroxil-, alkoxil-, merkaptol-, aminos-, ciano-, nitro-, alkil-tiol-, alkil-szulfonil- vagy alkil-szulfonil-csoporttal szubsztituált 1-6 szénatomos alkilcsoport, 2-6 szénatomos alkenilcsoport vagy 3-6 szénatomos alkinilcsoport;

n értéke 1 vagy 2;

R₄ és R₅ azokkal a nitrogénatomokkal együtt, amelyekhez kötődnek, egy telített vagy telítetlen 5-8 tagú heterociklusos gyűrűt képeznek, amely

1) adott esetben oxigén-, kénatommal vagy >NR₁₄ általános képletű csoporttal van megszakítva és/vagy adott esetben halogénatommal, 1-10 szénatomos alkilcsoporttal, 1-10 szénatomos halogén-alkil-csoporttal, hidroxicssoporttal, 1-6 szénatomos alkoxicssoporttal, (1-6 szénatomos alkoxil)-(1-6 szénatomos alkoxil)-csoporttal, 1-6 szénatomos halogén-alkoxil-csoporttal, merkaptocsoporttal, 1-6 szénatomos alkil-tiol-csoporttal, 3-7 szénatomos cikloalkilcsoporttal,



heteroarilcsoporttal, heteroaril-(1-6 szénatomos alkil)-csoporttal, fenilcsoporttal, fenil-(1-6 szénatomos alkil)-csoporttal vagy benzil-oxi-csoporttal szubsztituált, ahol az utóbbi három szubsztituens fenilcsoportja adott esetben halogénatommal, 1-6 szénatomos alkilcsoporttal, 1-6 szénatomos halogén-alkil-csoporttal, 1-6 szénatomos alkoxycsoporttal, 1-6 szénatomos halogén-alkoxi-csoporttal vagy nitrocsoporttal szubsztituált, és/vagy

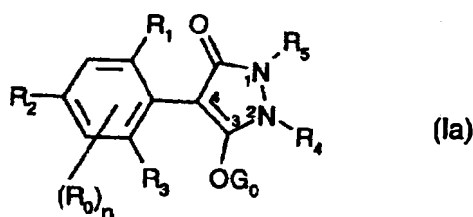
2) egy kondenzált vagy spiro-kötött 2-6 szénatomos, adott esetben oxigén- vagy kénatommal megszakított alkilén- vagy alkenilénláncot tartalmazhat, vagy a telített vagy telítetlen heterociklusos gyűrű legalább egy gyűrűatomja köti össze az alkilén- vagy alkenilénláncot;

R_{14} jelentése hidrogénatom, 1-4 szénatomos alkilcsoport, (1-6 szénatomos alkil)-karbonil-csoport, 1-6 szénatomos alkil-szulfonil-csoport, 3-6 szénatomos alkenilcsoport vagy 3-6 szénatomos alkinilcsoport; és

G jelentése hidrogénatom, egy fémion-ekvivalens vagy egy amónium-, szulfónium- vagy foszfónium-kation,

újak. A találmány tárgyát képezik ezek a vegyületek is.

Azok az (Ia) általános képletű vegyületek,



amelyek képletében

R_0 jelentése egymástól függetlenül halogénatom, 1-6 szénatomos alkilcsoport, 2-6 szénatomos alkenilcsoport, 2-6 szénatomos alkinilcsoport, 1-6 szénatomos halogén-alkil-csoport, ciano-(1-6 szénatomos alkil)-csoport, 2-6 szénatomos halogén-alkenil-csoport, ciano-(2-6 szénatomos alkenil)-csoport, 2-6 szénatomos halogén-alkinil-csoport, ciano-(2-6 szénatomos alkinil)-csoport, hidroxicssoport, 1-6 szénatomos hidroxil-alkil-csoport, 1-6 szénatomos alkoxil-csoport, nitro-, aminocsoport, 1-6 szénatomos alkil-amino-csoport, di(1-6 szénatomos alkil)-amino-csoport, [(1-6 szénatomos alkil)-karbonil]-amino-csoport, [(1-6 szénatomos alkil)-szulfonil]-amino-csoport, [(1-6 szénatomos alkil)-amino]-szulfonil-csoport, (1-6 szénatomos alkil)-karbonil-csoport, [(1-6 szénatomos alkil)-karbonil]-(1-6 szénatomos alkil)-csoport, [(1-6 szénatomos alkoxil)-karbonil]-(1-6 szénatomos alkil)-csoport, [(1-6 szénatomos alkil)-karbonil]-(2-6 szénatomos alkenil)-csoport, [(1-6 szénatomos alkoxil)-karbonil]-(2-6 szénatomos alkenil)-csoport, [(1-6 szénatomos alkil)-karbonil]-(2-6 szénatomos alkinil)-csoport, [(1-6 szénatomos alkoxil)-karbonil]-(2-6 szénatomos alkinil)-csoport, (1-6 szénatomos alkoxil)-karbonil-csoport, ciano-, karboxilcsoport, fenilcsoport vagy aromás csoport, amely a nitrogén-, az oxigén- és a kénatom közül kiválasztott 1 vagy 2 heteroatomot tartalmaz, ahol az utóbbi két aromás csoport adott esetben 1-3 szénatomos alkilcsoporttal, 1-3 szénatomos halogén-alkil-csoporttal,

1-3 szénatomos alkoxicsoporttal, 1-3 szénatomos halogén-alkoxi-csoporttal, halogénatommal, ciano- vagy nitrocsoporttal szubsztituált; vagy

R_0 a szomszédos R_1 , R_2 és R_3 szubsztituensekkel együtt egy telített vagy telítetlen 3-6 szénatomos szénhidrogénhidat képezhet, amelyet a nitrogén-, oxigén- és kénatom közül kiválasztott egy vagy két heteroatom szakíthat meg és/vagy amely 1-4 szénatomos alkilcsoporttal szubsztituált lehet;

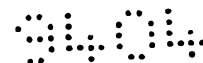
R_1 , R_2 és R_3 mindegyikének jelentése egymástól függetlenül hidrogén-, halogénatom, 1-6 szénatomos alkilcsoport, 2-6 szénatomos alkenilcsoport, 2-6 szénatomos alkinilcsoport, 3-6 szénatomos cikloalkilcsoport, 1-6 szénatomos halogén-alkil-csoport, 2-6 szénatomos halogén-alkenil-csoport, [(1-6 szénatomos alkoxi)-karbonil]-(2-6 szénatomos alkenil)-csoport, [(1-6 szénatomos alkil)-karbonil]-(2-6 szénatomos alkenil)-csoport, ciano-(2-6 szénatomos alkenil)-csoport, nitro-(2-6 szénatomos alkenil)-csoport, 2-6 szénatomos halogén-alkinil-csoport, [(1-6 szénatomos alkoxi)-karbonil]-(2-6 szénatomos alkinil)-csoport, [(1-6 szénatomos alkil)-karbonil]-(2-6 szénatomos alkinil)-csoport, ciano-(2-6 szénatomos alkinil)-csoport, nitro-(2-6 szénatomos alkinil)-csoport, 3-6 szénatomos halogén-cikloalkil-csoport, hidroxil-(1-6 szénatomos alkil)-csoport, (1-6 szénatomos alkoxi)-(1-6 szénatomos alkil)-csoport, [(1-6 szénatomos alkil)-tio]-(1-6 szénatomos alkil)-csoport, cianocsoport, (1-4 szénatomos alkil)-karbonil-csoport, (1-6 szénatomos alkoxi)-karbonil-csoport, hidroxil-



csoport, 1-10 szénatomos alkoxicsoport, 3-6 szénatomos alkenil-oxi-csoport, 3-6 szénatomos alkinil-oxi-csoport, 1-6 szénatomos halogén-alkoxi-csoport, 3-6 szénatomos (halogén-alkenil)-oxi-csoport, (1-6 szénatomos alkoxi)-(1-6 szénatomos alkoxi)-csoport, merkaptocsoport, 1-6 szénatomos alkil-tio-csoport, 1-6 szénatomos (halogén-alkil)-tio-csoport, 1-6 szénatomos alkil-szulfinil-csoport, 1-6 szénatomos alkil-szulfonil-csoport, nitro-, aminocsoport, 1-6 szénatomos alkil-amino-csoport, di(1-6 szénatomos alkil)-amino-csoport vagy fenoxicsoport, amelyben a fenil-csoport adott esetben 1-3 szénatomos alkilcsoporttal, 1-3 szénatomos halogén-alkil-csoporttal, 1-3 szénatomos alkoxicsoporttal, 1-3 szénatomos halogén-alkoxi-csoporttal, halogénatommal ciano- vagy nitrocsoporttal szubsztituált;

R₂ jelentése ezenkívül fenilcsoport, naftilcsoport vagy egy öt- vagy hattagú aromás csoport, amely a nitrogén-, oxigén- és kénatom közül kiválasztott egy vagy két heteroatomot tartalmazhat, ahol a fenilcsoport, a naftilcsoport és az öt- vagy hattagú aromás csoport adott esetben halogénatommal, 3-8 szénatomos cikloalkilcsoporttal, hidrox-, merkapt-, amino-, ciano-, nitro- vagy formilcsoporttal szubsztituált lehet; és/vagy

a fenilcsoport, a naftilcsoport és az öt- vagy hattagú aromás csoport adott esetben a következő csoportokkal szubsztituált lehet: 1-6 szénatomos alkilcsoport, 1-6 szénatomos alkoxicsoport, hidrox-(1-6 szénatomos alkil)-csoport, (1-6 szénatomos alkoxi)-(1-6 szénatomos alkil)-



-csoport, (1-6 szénatomos alkoxi)-(1-6 szénatomos alkoxi)-
-csoport, (1-6 szénatomos alkil)-karbonil-csoport, 1-6
szénatomos alkil-tio-csoport, 1-6 szénatomos alkil-szulfi-
nil-csoport, 1-6 szénatomos alkil-szulfonil-csoport, mono-
(1-6 szénatomos alkil)-amino-csoport, di(1-6 szénatomos
alkil)-amino-csoport, [(1-6 szénatomos alkil)-karbonil]-
-amino-csoport, N-[(1-6 szénatomos alkil)-karbonil]-N-(1-6
szénatomos alkil)-amino-csoport, 2-6 szénatomos alkenil-
csoport, (3-6 szénatomos alkenil)-oxi-csoport, hidrox-
i-(3-6 szénatomos alkenil)-csoport, (1-6 szénatomos alko-
xi)-(2-6 szénatomos alkenil)-csoport, [(1-6 szénatomos
alkoxi)-(3-6 szénatomos alkenil)]-oxi-csoport, (2-6 szén-
atomos alkenil)-karbonil-csoport, 2-6 szénatomos alkenil-
tio-csoport, 2-6 szénatomos alkenil-szulfinil-csoport,
2-6 szénatomos alkenil-szulfonil-csoport, mono- vagy di-
(2-6 szénatomos alkenil)-amino-csoport, N-(1-6 szénatomos
alkil)-N-(3-6 szénatomos alkenil)-amino-csoport, [(2-6
szénatomos alkenil)-karbonil]-amino-csoport, N-[(2-6 szén-
atomos alkenil)-karbonil]-N-(1-6 szénatomos alkil)-amino-
-csoport, 2-6 szénatomos alkinilcsoport, (3-6 szénatomos
alkinil)-oxi-csoport, hidrox- i-(3-6 szénatomos alkinil)-
-csoport, (1-6 szénatomos alkoxi)-(2-6 szénatomos alki-
nil)-csoport, [(1-6 szénatomos alkoxi)-(3-6 szénatomos al-
kinil)]-oxi-csoport, (2-6 szénatomos alkinil)-karbonil-
-csoport, 2-6 szénatomos alkinil-tio-csoport, 2-6 szénato-
mos alkinil-szulfinil-csoport, 2-6 szénatomos alkinil-
-szulfonil-csoport, mono- vagy di(2-6 szénatomos alkinil)-



-amino-csoport, *N*-(1-6 szénatomos alkil)-*N*-(3-6 szénatomos alkinil)-amino-csoport, [(2-6 szénatomos alkinil)-karbonil]-amino-csoport vagy *N*-[(2-6 szénatomos alkinil)-karbonil]-*N*-(1-6 szénatomos alkil)-amino-csoport; és/vagy a fenilcsoport, a naftilcsoport és az öt- vagy hattagú aromás csoport adott esetben a következő csoportokkal szubsztituált lehet: halogén-szubsztituált 1-6 szénatomos alkilcsoport, 1-6 szénatomos alkoxics csoport, hidrox-(1-6 szénatomos alkil)-csoport, (1-6 szénatomos alkoxi)-(1-6 szénatomos alkil)-csoport, (1-6 szénatomos alkoxi)-(1-6 szénatomos alkoxi)-csoport, (1-6 szénatomos alkil)-karbonil-csoport, 1-6 szénatomos alkil-tio-csoport, 1-6 szénatomos alkil-szulfonil-csoport, 1-6 szénatomos alkil-szulfonil-csoport, mono(1-6 szénatomos alkil)-amino-csoport, di(1-6 szénatomos alkil)-amino-csoport, [(1-6 szénatomos alkil)-karbonil]-amino-csoport, *N*-[(1-6 szénatomos alkil)-karbonil]-*N*-(1-6 szénatomos alkil)-amino-csoport, 2-6 szénatomos alkenilcsoport, (3-6 szénatomos alkenil)-oxi-csoport, hidrox-(3-6 szénatomos alkenil)-csoport, (1-6 szénatomos alkoxi)-(2-6 szénatomos alkenil)-csoport, [(1-6 szénatomos alkoxi)-(3-6 szénatomos alkenil)]-oxi-csoport, (2-6 szénatomos alkenil)-karbonil-csoport, 2-6 szénatomos alkenil-tio-csoport, 2-6 szénatomos alkenil-szulfonil-csoport, 2-6 szénatomos alkenil-szulfonil-csoport, mono- vagy di(2-6 szénatomos alkenil)-amino-csoport, *N*-(1-6 szénatomos alkil)-*N*-(3-6 szénatomos alkenil)-amino-csoport, [(2-6 szénatomos alkenil)-karbonil]-amino-csoport, *N*-[(2-6 szén-



atomos alkenil)-karbonil]-*N*-(1-6 szénatomos alkil)-amino-csoport, 2-6 szénatomos alkinilcsoport, (3-6 szénatomos alkinil)-oxi-csoport, hidrox-(3-6 szénatomos alkinil)-csoport, (1-6 szénatomos alkoxi)-(2-6 szénatomos alkinil)-csoport, [(1-6 szénatomos alkoxi)-(3-6 szénatomos alkinil)]-oxi-csoport, (2-6 szénatomos alkinil)-karbonil-csoport, 2-6 szénatomos alkinil-tio-csoport, 2-6 szénatomos alkinil-szulfinil-csoport, 2-6 szénatomos alkinil-szulfonil-csoport, mono- vagy di(2-6 szénatomos alkinil)-amino-csoport, *N*-(1-6 szénatomos alkil)-*N*-(3-6 szénatomos alkinil)-amino-csoport, [(2-6 szénatomos alkinil)-karbonil]-amino-csoport vagy *N*-[(2-6 szénatomos alkinil)-karbonil]-*N*-(1-6 szénatomos alkil)-amino-csoport; és/vagy a fenilcsoport, a naftilcsoport és az öt- vagy hattagú aromás csoport adott esetben a következő csoportokkal szubsztituált lehet: -COOR₅₀, -CONR₅₁, -SO₂NR₅₃R₅₄ vagy -SO₂OR₅₅ általános képletű csoport, ahol

R₅₀, R₅₁, R₅₂, R₅₃, R₅₄ és R₅₅ mindegyikének jelentése egymástól függetlenül 1-6 szénatomos alkilcsoport, 2-6 szénatomos alkenilcsoport vagy 3-6 szénatomos alkinilcsoport, vagy halogénatommal, hidrox-, alkox-, merkapt-, amino-, ciano-, nitro-, alkil-tio-, alkil-szulfinil- vagy alkil-szulfonil-csoporttal szubsztituált 1-6 szénatomos alkilcsoport, 2-6 szénatomos alkenilcsoport vagy 3-6 szénatomos alkinilcsoport;

n értéke 1 vagy 2;



R_4 és R_5 azokkal a nitrogénatomokkal együtt, amelyekhez kötődnek, egy telített vagy telítetlen 5-8 tagú heterociklusos gyűrűt képeznek, amely

- 1) adott esetben oxigén-, kénatommal vagy $>NR_{14}$ általános képletű csoporttal van megszakítva és/vagy adott esetben halogénatommal, 1-10 szénatomos alkilcsoporttal, 1-10 szénatomos halogén-alkil-csoporttal, hidroxics csoporttal, 1-6 szénatomos alkoxics csoporttal, (1-6 szénatomos alkoxi)-(1-6 szénatomos alkoxi)-csoporttal, 1-6 szénatomos halogén-alkoxi-csoporttal, merkaptocsoporttal, 1-6 szénatomos alkil-tio-csoporttal, 3-7 szénatomos cikloalkilcsoporttal, heteroarilcsoporttal, heteroaril-(1-6 szénatomos alkil)-csoporttal, fenilcsoporttal, fenil-(1-6 szénatomos alkil)-csoporttal vagy benzil-oxi-csoporttal szubsztituált, ahol az utóbbi három szubsztituens fenilcsoportja adott esetben halogénatommal, 1-6 szénatomos alkilcsoporttal, 1-6 szénatomos halogén-alkil-csoporttal, 1-6 szénatomos alkoxics csoporttal, 1-6 szénatomos halogén-alkoxi-csoporttal vagy nitrocsoporttal szubsztituált, és/vagy
- 2) egy kondenzált vagy spiro-kötött 2-6 szénatomos, adott esetben oxigén- vagy kénatommal megszakított alkilén- vagy alkenilénláncot tartalmazhat, vagy a telített vagy telítetlen heterociklusos gyűrű legalább egy gyűrűatomja köti össze az alkilén- vagy alkenilénláncot;

R_{14} jelentése hidrogénatom, 1-4 szénatomos alkilcsoport, (1-6 szénatomos alkil)-karbonil-csoport, 1-6 szénatomos alkil-szulfonil-csoport, 3-6

szénatomos alkenilcsoport vagy 3-6 szénatomos alkinilcsoport; és

G_0 jelentése $-C(O)-R_{30}$, $-C(X_1)-X_2-R_{31}$, $-C(X_3)-N(R_{32})-R_{33}$, $-SO_2-R_{34}$ vagy $-P(X_4)(R_{35})-R_{36}$ általános képletű csoport;

X_1 , X_2 , X_3 és X_4 mindegyikének jelentése egymástól függetlenül oxigén- vagy kénatom;

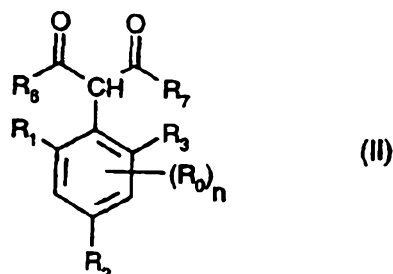
R_{30} jelentése adott esetben halogénatommal szubsztituált 1-20 szénatomos alkilcsoport, 2-20 szénatomos alkenilcsoport, (1-8 szénatomos alkoxi)-(1-8 szénatomos alkil)-csoport, [(1-8 szénatomos alkil)-tio]-(1-8 szénatomos alkil)-csoport, [poli(1-10 szénatomos alkoxi)]-(1-8 szénatomos alkil)-csoport, vagy adott esetben halogénatommal szubsztituált 3-8 szénatomos cikloalkilcsoport, (3-6 szénatomos cikloalkil)-(1-6 szénatomos alkil)-csoport, heterociklil-(1-6 szénatomos alkil)-csoport, heteroaril-(1-6 szénatomos alkil)-csoport, adott esetben halogénatommal, ciano-, nitrocsoporttal, 1-6 szénatomos alkilcsoporttal, 1-6 szénatomos alkoxicsoporttal, 1-6 szénatomos halogén-alkil-csoporttal, 1-6 szénatomos halogén-alkoxi-csoporttal, 1-6 szénatomos alkil-tio-csoporttal vagy 1-6 szénatomos alkil-szulfonil-csoporttal szubsztituált fenilcsoport, adott esetben halogénatommal, ciano-, nitrocsoporttal, 1-6 szénatomos alkilcsoporttal, 1-6 szénatomos alkoxicsoporttal, 1-6 szénatomos halogén-alkil-csoporttal vagy 1-6 szénatomos halogén-alkoxi-csoporttal szubsztituált fenil-(1-6 szénatomos alkil)-csoport, adott esetben halogénatommal vagy 1-6 szénatomos alkilcsoporttal szubsztituált hetero-



arilcsoport, adott esetben halogénatommal vagy 1-6 szénatomos alkilcsoporttal szubsztituált fenoxi-(1-6 szénatomos alkil)-csoport, vagy adott esetben halogénatommal, aminocsoporttal vagy 1-6 szénatomos alkilcsoporttal szubsztituált (heteroaril-oxi)-(1-6 szénatomos alkil)-csoport;

- R₃₁ jelentése adott esetben halogénatommal szubsztituált 1-20 szénatomos alkilcsoport, 2-20 szénatomos alkenilcsoport, (1-8 szénatomos alkoxi)-(2-8 szénatomos alkil)-csoport, [poli(1-8 szénatomos alkoxi)]-(2-8 szénatomos alkil)-csoport, vagy adott esetben halogénatommal vagy 1-6 szénatomos alkoxicssoporttal szubsztituált 3-8 szénatomos cikloalkilcsoport, (3-6 szénatomos cikloalkil)-(1-6 szénatomos alkil)-csoport, heterociklil-(1-6 szénatomos alkil)-csoport, heteroaril-(1-6 szénatomos alkil)-csoport, adott esetben halogénatommal, ciano-, nitrocsoporttal, 1-6 szénatomos alkilcsoporttal, 1-6 szénatomos alkoxicssoporttal, 1-6 szénatomos halogén-alkil-csoporttal vagy 1-6 szénatomos halogén-alkoxi-csoporttal szubsztituált fenil- vagy benzilcsoport; és
- R₃₄ jelentése adott esetben halogénatommal szubsztituált 1-8 szénatomos alkilcsoport, vagy adott esetben halogénatommal, 1-6 szénatomos alkilcsoporttal, 1-6 szénatomos alkoxicssoporttal, 1-4 szénatomos halogén-alkil-csoporttal, 1-4 szénatomos halogén-alkoxi-csoporttal, ciano- vagy nitrocsoporttal szubsztituált fenilcsoport,
- újak. A találmány tárgyát képezik ezek a vegyületek is.

Azok a (II) általános képletű vegyületek,



amelyek képletében R_0 , R_1 , R_2 , R_3 , R_6 és R_7 jelentése, valamint n értéke a fentiekben meghatározott, új vegyületek, amelyeket kifejezetten a találmány szerinti eljáráshoz fejlesztettünk ki. A találmány tárgyát képezik ezek a vegyületek is.

Előnyösek azok a (II) általános képletű vegyületek, amelyek képletében R_1 , R_2 és R_3 mindegyikének jelentése egymástól függetlenül hidrogén-, halogénatom, 1-4 szénatomos alkilcsoport, 1-4 szénatomos halogén-alkil-csoport, 2-4 szénatomos alkenilcsoport, 2-4 szénatomos halogén-alkenil-csoport, 2-4 szénatomos alkinilcsoport, 3-6 szénatomos cikloalkilcsoport, (1-4 szénatomos alkil)-karbonil-csoport, (1-6 szénatomos alkoxi)-karbonil-csoport, hidroxics csoport, 1-4 szénatomos alkoxicsoport, 3-4 szénatomos alkenil-oxi-csoport, 3-4 szénatomos alkinil-oxi-csoport, 1-4 szénatomos halogén-alkoxi-csoport, nitro- vagy aminocsoport.

Előnyösek azok a (II) általános képletű vegyületek is, amelyek képletében R_1 jelentése 2-6 szénatomos alkilcsoport.

Ugyancsak előnyösek azok a (II) általános képletű vegyületek, amelyek képletében n értéke 0.

Különösen előnyösek azok a (II) általános képletű vegyületek,

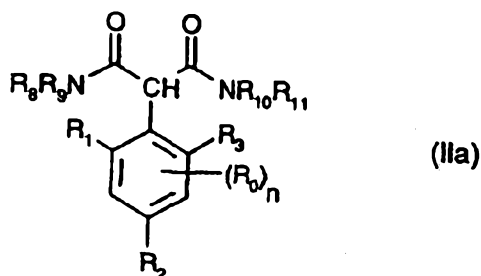


tek, amelyek képletében R_1 jelentése 2-4 szénatomos alkilcsoport, 1-4 szénatomos alkoxicsoport, 2-4 szénatomos alkinilcsoport vagy 3-6 szénatomos cikloalkilcsoport, és R_3 jelentése 1-4 szénatomos alkilcsoport, 1-4 szénatomos alkoxicsoport, 2-4 szénatomos alkinilcsoport vagy 3-6 szénatomos cikloalkilcsoport.

Hasonlóképpen előnyösek azok a (II) általános képletű vegyületek, amelyek képletében R_1 jelentése 2-6 szénatomos alkinilcsoport.

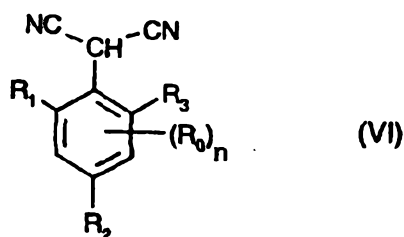
Előnyösek továbbá azok a (II) általános képletű vegyületek, amelyek képletében R_1 és R_3 mindegyikének jelentése egymástól függetlenül 2-6 szénatomos alkilcsoport, 2-6 szénatomos alkinilcsoport, 1-10 szénatomos alkoxicsoport vagy 3-6 szénatomos cikloalkilcsoport. Az előbbieik közül még előnyösebbek azok a vegyületek, amelyek képletében R_1 jelentése 2-6 szénatomos alkilcsoport, és R_3 jelentése 2-6 szénatomos alkilcsoport, 2-6 szénatomos alkinilcsoport vagy 1-10 szénatomos alkoxicsoport.

Azokat a (IIa) általános képletű vegyületeket,



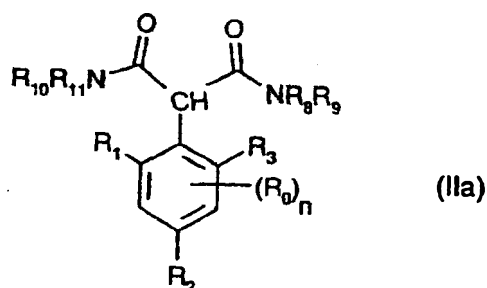
amelyek képletében R_0 , R_1 , R_2 és R_3 jelentése, valamint n értéke az (I) általános képletnél meghatározott, továbbá R_8 , R_9 , R_{10} és R_{11} jelentése hidrogénatom, közvetlenül előállíthatjuk

úgy, hogy a megfelelő (VI) általános képletű fenil-malonsav-di-nitrilt



— amelynek képletében R_0 , R_1 , R_2 és R_3 jelentése, valamint n értéke a fentiekben meghatározott — hidrolizáljuk. Hidrolizálószerként tömény ásványi savakat, például kénsavat vagy salétromsavat alkalmazhatunk, ahol szükséges, víz hozzáadásával.

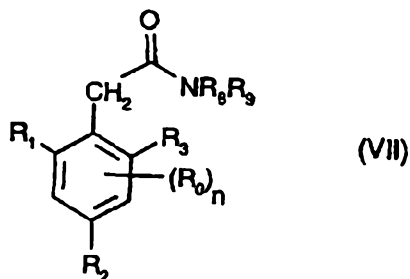
Azokat a (IIa) általános képletű vegyületeket,



amelyek képletében R_0 , R_1 , R_2 és R_3 jelentése, valamint n értéke az (I) általános képletnél meghatározott, továbbá R_8 , R_9 , R_{10} és R_{11} mindegyikének jelentése egymástól függetlenül hidrogénatom, 1-6 szénatomos alkilcsoport, 1-6 szénatomos halogén-alkil-csoport, 3-6 szénatomos alkenilcsoport vagy benzilcsoport, ahol a benzilcsoport fenilcsoportja adott esetben 1-4 szénatomos alkilcsoporttal, halogénatommal, 1-4 szénatomos halogén-alkil-csoporttal, 1-4 szénatomos alkoxicssoporttal vagy nitrocsoporttal szubsztituált, úgy állíthatjuk elő, hogy



- 1) egy (VII) általános képletű fenil-acetamidot



— amelynek képletében R_0 , R_1 , R_2 , R_3 , R_8 és R_9 jelentése, valamint n értéke a fentiekben meghatározott —

- a) az olyan (IIa) általános képletű vegyületek előállításához, amelyek képletében R_{11} jelentése hidrogén-atom, egy (XI) általános képletű izocianáttal



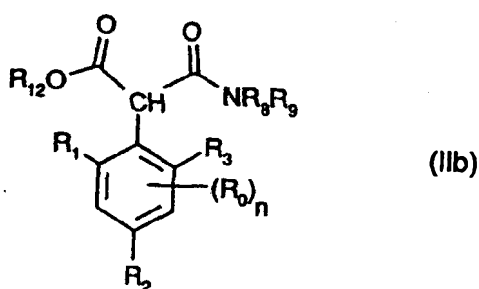
— amelynek képletében R_{10} jelentése a fentiekben meghatározott, azzal az eltéréssel, hogy R_{10} jelentése hidrogénatomtól eltérő — reagáltatunk, ahol a reakciót inert reakcióközegben és adott esetben bázis-katalizátor jelenlétében hajtjuk végre, vagy

- b) refluxhőmérsékleten egy (XIV) általános képletű karbonáttal



— amelynek képletében R_{12} jelentése 1-6 szénatomos alkilcsoport, 1-6 szénatomos halogén-alkil-csoport, 3-6 szénatomos alkenilcsoport vagy benzilcsoport,

ahol a benzilcsoport fenilcsoportja adott esetben 1-4 szénatomos alkilcsoporttal, halogénatommal, 1-4 szénatomos halogén-alkil-csoporttal, 1-4 szénatomos alko-
xicssoporttal vagy nitrocsoporttal szubsztituált —
reagáltatunk, majd az így nyert (IIb) általános kép-
letű vegyületet

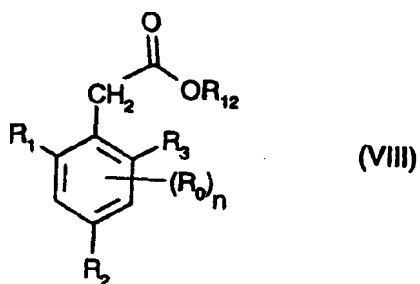


— amelynek képletében R_0 , R_1 , R_2 , R_3 , R_8 , R_9 és R_{12} jelentése, valamint n értéke a fentiekben meghatáro-
zott — inert oldószerben egy (X) általános képletű
aminnal



— amelynek képletében R_{10} és R_{11} jelentése a fenti-
ekben meghatározott — reagáltatjuk, vagy

2) egy (VIII) általános képletű (fenil-ecetsav)-észtert

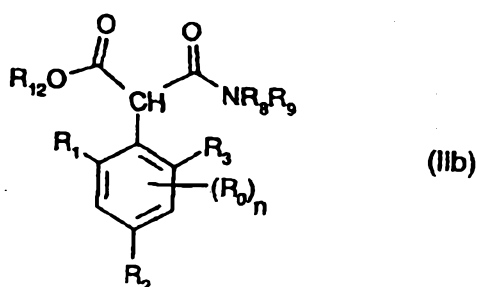


— amelynek képletében R_0 , R_1 , R_2 , R_3 és R_{12} jelentése, valamint n értéke a fentiekben meghatározott —

c) egy (XV) általános képletű izocianáttal



— amelynek képletében R_8 jelentése a fentiekben meghatározott, azzal az eltéréssel, hogy R_{10} jelentése hidrogénatomtól eltérő — reagáltatunk, ahol a reakciót inert reakcióközegben és adott esetben báziskatalizátor jelenlétében hajtjuk végre, majd az így nyert (IIb) általános képletű vegyületet

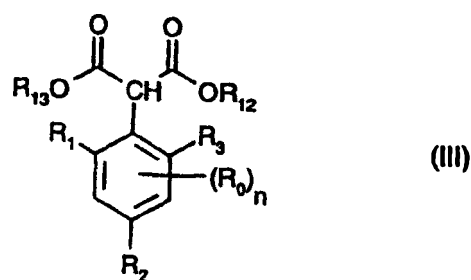


— amelynek képletében R_0 , R_1 , R_2 , R_3 , R_8 és R_{12} jelentése, valamint n értéke a fentiekben meghatározott, és R_9 jelentése hidrogénatom — inert oldószerben, az 1)b) lépésben ismertetett módon egy (X) általános képletű aminnal reagáltatjuk, vagy

d) emelt hőmérsékleten egy (XVI) általános képletű karbonáttal



— amelynek képletében R_{13} jelentése azonos R_{12} jelentésével — reagáltatunk, majd az így nyert (III) általános képletű fenil-malonsav-diésztert



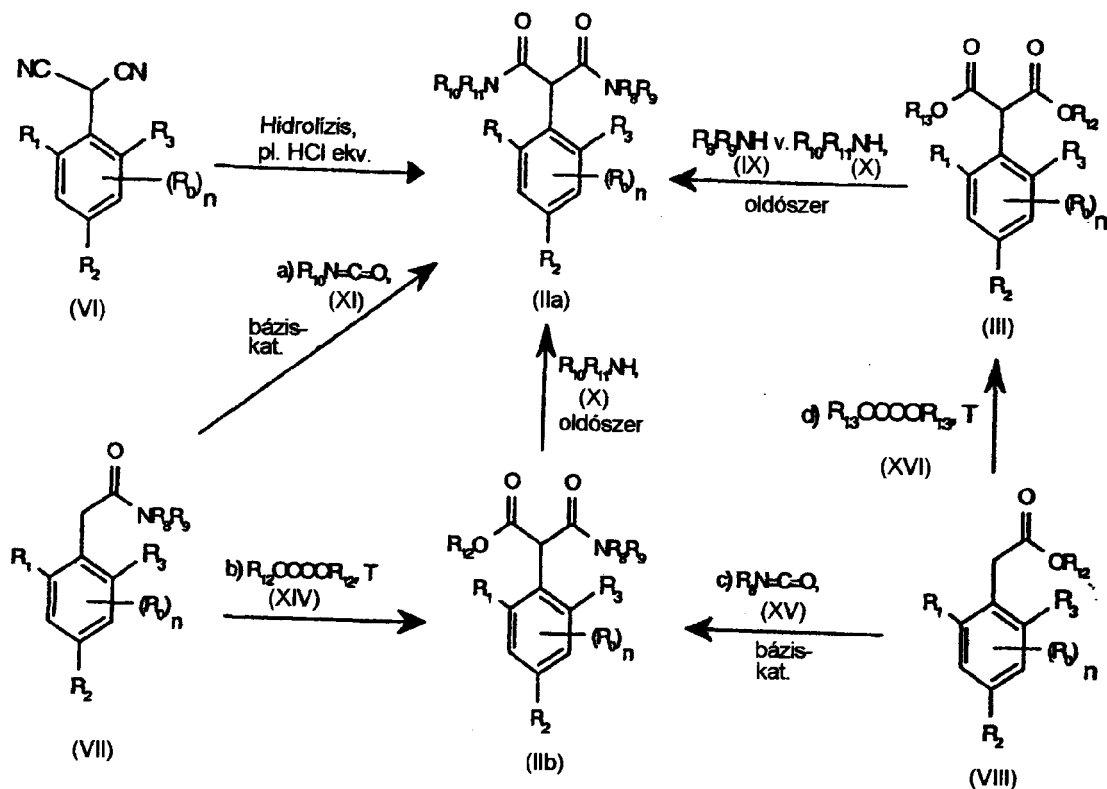
— amelynek képletében R_0 , R_1 , R_2 , R_3 , R_{12} és R_{13} jelentése, valamint n értéke a fentiekben meghatározott — inert oldószerben, az 1)b) lépésben ismertetett módon egy (IX) vagy (X) általános képletű aminnal



— ahol a képletekben R_8 , R_9 , R_{10} és R_{11} jelentése a fentiekben meghatározott — reagáltatjuk.

A fenti eljárásváltozatokat a következő 3. reakcióvázlaton mutatjuk be.

3. reakcióvázlat



A (IIa) általános képletű fenil-malonamidokat (fenil-malonsav-diamidokat) a 3. reakcióvázlat a) változat szerint ismert eljárásokkal (VII) általános képletű acetamidokból, (XI) általános képletű izocianátok alkalmazásával állíthatjuk elő, ahol a reakciót inert oldószerben és adott esetben báziskatalizátor jelenlétében hajtjuk végre.

A 3. reakcióvázlat b) változat értelmében a (IIa) általános képletű fenil-malonamidokat úgy is előállíthatjuk, hogy a (VII) általános képletű fenil-acetamidokat az oldószer szerepét is betöltő (XIV) általános képletű karbonátokkal több órán keresztül visszafolyató hűtő alatt forraljuk, majd az nyert (IIb) általános képletű vegyületeket az oldószer szerepét is betöltő

(X) általános képletű aminokkal amidáljuk. A fenil-ecetsav-észter-származékokkal és a (XVI) általános képletű karbonátokkal végzett analóg reakciókat a WO 97/02243. számon közzétett nemzetközi szabadalmi bejelentésben ismertették.

A (IIa) általános képletű fenil-malonamidok alternatív előállítási eljárásai (VIII) általános képletű fenil-ecetsav-észterekből indulnak ki. Amint az 3. reakcióvázlaton látható, a (VIII) általános képletű vegyületekből két úton állíthatjuk elő a (IIa) általános képletű vegyületeket: a c) eljárásváltozat szerint a (VIII) általános képletű vegyületeket először ismert módon [TETRAHEDRON LETTERS, 2427 (1974)] (XV) általános képletű izocianátokkal reagáltatjuk, ahol a reakciót inert oldószerben és báziskatalizátor jelenlétében hajtjuk végre, majd az így nyert (IIb) általános képletű vegyületet (amelyben R₉ jelentése hidrogénatom) inert oldószerben a b) eljárásváltozatnak megfelelően (X) általános képletű aminokkal amidáljuk; a d) eljárásváltozat értelmében a (VIII) általános képletű vegyületeket először refluxhőmérsékleten az oldószer szerepét is betöltő (XVI) általános képletű karbonátokkal reagáltatjuk, majd az így nyert (III) általános képletű fenil-malonsav-diésztereket oldószerben, (IX) vagy (X) általános képletű aminok alkalmazásával a b) eljárásváltozatnak megfelelően amidáljuk.

A (IV), (IVa) és (IVb) általános képletű vegyületek ismertek, illetve ismert eljárásokkal analóg módon egyszerűen előállíthatók. A (IV) általános képletű vegyületek előállítási eljárásait például a WO 95/00521. számon közzétett nemzetközi szabadalmi bejelentésben és a PCT/EP99/01593. számú nemzetközi

szabadalmi bejelentésben írják le.

A (VI) általános képletű fenil-malonsav-dinitril-származékok ismert vegyületek, vagy ismert eljárásokkal analóg módon egyszerűen előállíthatók [lásd például: CHEM. COMMUN., 932 (1984); vagy J. AM. CHEM. Soc., 121, 1473 (1999)].

A (VII) és (VIII) általános képletű fenil-acetamidok és fenil-ecetsav-észterek ismert vegyületek. (VIII) általános képletű fenil-ecetsav-észtereket például a WO 97/02243. számon közzétett nemzetközi szabadalmi bejelentésben ismertetnek.

Az 1., 2. és 3. reakcióvázlatban alkalmazott (IX), (X), (XI), (XII), (XIIa), (XIIb), (XIIc), (XIId), (XIIe), (XIIf), (XIV), (XV) és (XVI) általános képletű reagensek ismert vegyületek, illetve ismert eljárásokkal analóg módon egyszerűen előállíthatók.

A találmány szerinti eljárás megkülönböztető jellemzői — egyebek mellett — például a következők:

- a) a (II) általános képletű kiindulási vegyületek könnyen elérhetők,
- b) egyszerű reakciók és feldolgozás,
- c) általában nagy kitermelés,
- d) az (I) általános képletű vegyületek (Ia) általános képletű vegyületekké történő átalakítása (például a G szubsztituens G_0 szubsztituenssé történő konvertálása) véfrehajtható gazdaságos és környezetvédelmi szempontból előnyös egyedényes ("one-pot") eljárással,
- e) gazdasági és környezetvédelmi előnyöket biztosít az a tény, hogy az (Ia) általános képletű vegyületek előállításá-

sa esetén a (II) általános képletű vegyületek előállításából (3. reakcióvázlat), valamint a (II) általános képletű vegyületek (IV), (IVa) vagy (IVb) általános képletű vegyületekkel végzett reakciókból (1. reakcióvázlat), továbbá a (XII), (XIIa), (XIIb), (XIIc) vagy (XIId) általános képletű elektrofilekkel végzett reakciókból álló egyedi eljárási lépések folyamatos eljárásban is végrehajthatók.

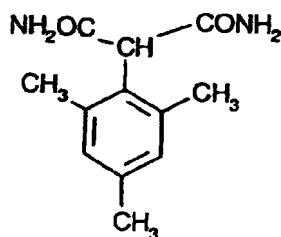
A találmány szerinti eljárás különösen alkalmas az (I) és (Ia) általános képletű 4-aril-5-oxo-pirazolin-származékok nagy mennyiségekben történő előállítására.

Az alábbi példák a találmány szerinti eljárás illusztrálására szolgálnak. A példák a találmány oltalmi körét, illetve terjedelmét nem korlátozzák.

Előállítási példák

P1. példa

A (2,4,6-trimetil-fenil)-malonamid előállítása

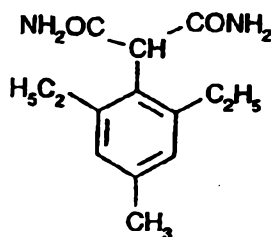


5 ml tömény (97 %) kénsav és 0,4 ml (0,022 mol) víz elegyéhez 2 perc alatt cseppenként hozzáadtuk 2,0 g (0,0109 mol) (2,4,6-trimetil-fenil)-malonsav-dinitril 5 ml metilén-dikloriddal készített oldatát. A reakciókeveréket 100 órán keresztül 20 °C-on kevertettük, ezt követően jégre öntöttük, majd a vizes

keveréket etil-acetáttal kétszer extraháltuk. A szerves oldatokat egyesítettük, telített, vizes nátrium-klorid-oldattal mostuk, vízmentes nátrium-szulfát felett szárítottuk, majd vákuumban 60 °C-on betöményítettük. Sárgás kristályok formájában és 2,0 g mennyiségben (83 %-os kitermeléssel) nyertük a kívánt címvegyületet. Olvadáspont: 177-179 °C.

P2. példa

A (2,6-dietil-4-metil-fenil)-malonamid előállítása



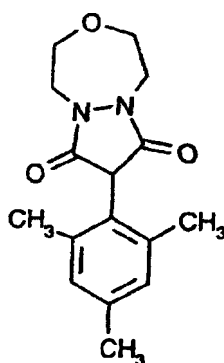
5 ml tömény (97 %) kénsav és 0,36 ml (0,0198 mol) víz elegyéhez hozzáadtunk 2,1 g (0,0099 mol) (2,6-dietil-4-metil-fenil)-malonsav-dinitrilt. A reakciókeveréket 5 percen keresztül 50 °C-on kevertettük, majd az így képződött homogén, vörös oldatot 5 órán át 50 °C-on tovább kevertettük. Ezt követően a reakciókeveréket 22 °C-ra hűtöttük, majd jeges vízre öntöttük. A vizes keveréket etil-acetáttal kétszer extraháltuk, ezt követően a szerves oldatokat egyesítettük, telített, vizes nátrium-klorid-oldattal mostuk, vízmentes nátrium-szulfát felett szárítottuk, majd vákuumban 60 °C-on betöményítettük. Sárgás kristályok formájában és 2,35 g mennyiségben (95,6 %-os kitermeléssel) nyertük a kívánt címvegyületet. Olvadáspont: 184-186 °C.

¹H-NMR (CDCl₃) δ: 7,19 ppm (széles s, 1H); 6,99 ppm (s, 2H);

5,78 ppm (széles s, 1H); 4,69 ppm (s, 1H); 2,55 ppm (q, 4H);
2,32 ppm (s, 3H); 1,21 ppm (t, 6H).

P3. példa

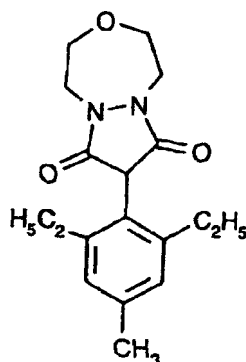
A 8-(2,4,6-trimetil-fenil)-tetrahidropirazolo[1,2-d][1,4,5]- oxadiazepin-7,9-dion előállítása



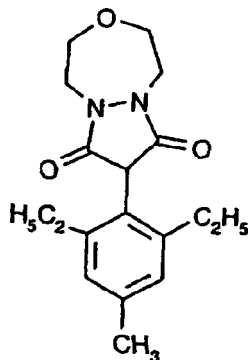
1,5 g (0,0068 mol) (2,4,6-trimetil-fenil)-malonamid, 2,16 g (0,0082 mol) 1,4,5-oxadiazepán-dihidrobromid és 2,93 g (0,029 mol) trietil-amin 50 ml xilollal készített oldatát nitrogénatmoszférában 2 órán keresztül visszafolyató hűtő alatt forraltuk. A képződött szuszpenziót 22 °C-ra hűtöttük, 1 M sósavoldattal kevertettük, majd szűrtük. A kiszűrt kristályos anyagot előbb vízzel, ezt követően dietil-éterrel mostuk, majd vákuumban 60 °C-on szárítottuk. A kívánt címvegyület 248-250 °C-os olvadáspontú.

P4. példa

A 8-(2,6-dietil-4-metil-fenil)-tetrahidropirazolo- [1,2-d][1,4,5]oxadiazepin-7,9-dion előállítása

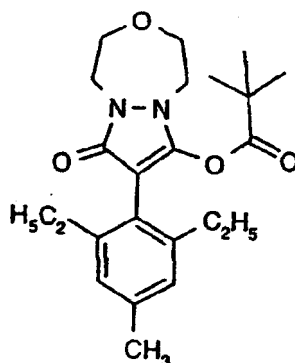


2,15 g (0,00866 mol) (2,6-diethyl-4-metil-fenil)-malonamid, 2,64 g (0,010 mol) 1,4,5-oxadiazepán-dihidrobromid és 3,54 g (0,035 mol) trietil-amin 50 ml xilollal készített oldatát nitrogénatmoszférában 2 órán keresztül visszafolyató hűtő alatt forraltuk. A képződött szuszpenziót 22 °C-ra hűtöttük, 1 M sósavoldatot adtunk hozzá, majd a keveréket 5 percen át kevertettük. Ezt követően 50 ml hexánt adtunk a keverékhez, a képződött szilárd anyagot kiszűrtük, kevés vízzel és hexánnal mostuk, majd vákuumban 80 °C-on szárítottuk. Színtelen, szilárd anyag formájában 2,15 g kívánt címvegyületet nyertünk. A szerves fázist vízmentes nátrium-szulfát felett szárítottuk, majd vákuumban 60 °C-on betöményítettük, amelynek eredményeként további 0,23 g kívánt címvegyületet nyertünk. Összesen 2,38 g mennyiségben (87 %-os kitermeléssel) izoláltuk a terméket. ^1H -NMR (CDCl_3) δ (ppm): 6,92 ppm (d, 2H); 4,72 ppm (s, 1H); 4,30 ppm (m, 2H); 3,98 ppm (m, 4H); 3,79 ppm (m, 2H); 2,80 ppm (s, 3H); 2,70 ppm (q, 2H); 2,27 ppm (q, 2H); 1,27 ppm (t, 3H); 1,20 ppm (t, 3H).

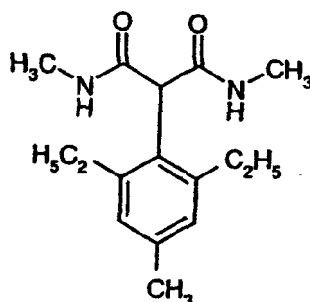
P5. példaA 8-(2,6-dietil-4-metil-fenil)-tetrahidropirazolo-
[1,2-d][1,4,5]oxadiazepin-7,9-dion előállítása

0,55 g (0,002 mol) *N,N'*-dimetil-2-(2,6-dietil-4-metil-fenil)-malonamid, 0,42 g (0,0024 mol) 1,4,5-oxadiazepán-dihidrobromid és 1,17 ml (0,0084 mol) trietil-amin 6 ml xilollal készített oldatát nitrogénatmoszférában 18 órán keresztül visszafolyatós hűtő alatt forraltuk. Ezt követően a reakciókeveréket vízre öntöttük, a keveréket 2 M sósavoldattal megsavanyítottuk, majd hexánt adtunk hozzá és kevertettük. A szilárd anyagot kiszűrtük, vízzel és hexánnal mostuk, majd vákuumban 50 °C-on szárítottuk. Bézsszínű kristályok formájában 0,33 g kívánt címvegyületet nyertünk. Olvadáspont: 192-193,5 °C.

P6. példaEgyedényes ("one-pot") eljárás a {8-(2,6-dietil-4-metil-fenil)-
-9-oxo-1,2,4,5-tetrahidro-9H-pirazolo[1,2-d][1,4,5]oxadiazepin-
-7-il}-2,2-dimetil-propionát előállítására



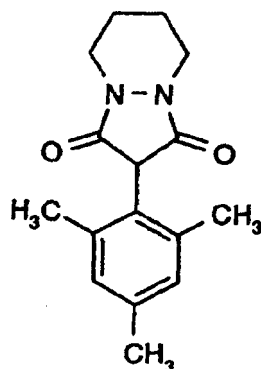
1,0 g (0,004 mol) (2,6-diethyl-4-metil-fenil)-malonamid, 0,84 g (0,0048 mol) 1,4,5-oxadiazepán-dihidrobromid és 1,62 g (0,016 mol) trietil-amin 25 ml xilollal készített oldatát nitrogénatmoszférában 2 órán keresztül visszafolyató hűtő alatt forraltuk. Ezt követően a reakciókeveréket szobahőmérsékletre hűtöttük, majd hozzáadtunk 0,87 g (0,0072 mol) pivaloil-kloridot. A reakciókeveréket további két órán át 22 °C-on kevertettük, ezt követően hozzáadtunk 25 ml 1 M sósavoldatot, folytattuk a keverést, majd a keveréket etil-acetáttal extraháltuk. A szerves oldatokat egyesítettük, telített, vizes nátrium-klorid-oldattal mostuk, vízmentes nátrium-szulfát felett szárítottuk és vákuumban 60 °C-on betöményítettük. Maradékként 2,3 g barna olajat nyertünk. A maradékot hexánból átkristályosítva szinte-len kristályok formájában és 1,0 g mennyiségben nyertük a kívánt címvegyületet. Olvadáspont: 120-122 °C. $^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ (ppm): 6,89 ppm (s, 2H); 4,29 ppm (m, 2H); 3,95 ppm (m, 2H); 3,87 ppm (m, 4H); 2,49 ppm (m, 4H); 2,30 ppm (s, 3H); 1,12 ppm (t, 6H); 1,04 ppm (s, 9H).

P7. példaAz *N,N'*-dimetil-2-(2,6-diethyl-4-methyl-phenyl)-malonamidelőállítása

4,18 g (0,015 mol) dimetil-2-(2,6-diethyl-4-methyl-phenyl)-malonáthoz 22 °C-on hozzáadtunk 30 ml 33 tömeg%-os etanolos metil-amin-oldatot. A reakciókeveréket 30 órán keresztül 75 °C-on kevertettük, majd vízre öntöttük. A vizes keveréket tömény sósavval megsavanyítottuk, majd dietil-éterrel extraháltuk. A szerves oldatokat egyesítettük, telített, vizes nátrium-klorid-oldattal mostuk, vízmentes magnézium-szulfát felett szárítottuk, majd vákuumban 60 °C-on betöményítettük. A maradékként kapott 4,0 g barna olajat hexánnal kevertettük, amelynek eredményként kristályos formában és 1,74 g mennyiségben izoláltuk a kívánt címvegyületet. Olvadáspont: 98-100 °C.

P8. példa

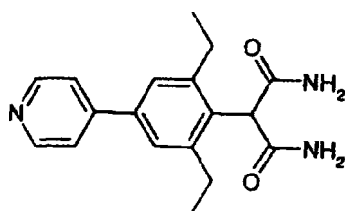
A 2-(2,4,6-trimetil-phenyl)-tetrahidropirazolo[1,2-a]piridazin-1,3-dion előállítása (bázis hozzáadása nélkül)



2,05 g (0,0093 mol) (2,4,6-trimetil-fenil)-malonamid és 0,95 g (0,0110 mol) hexahidropiridazin 50 ml xilollal készített oldatát nitrogénatmoszférában 2 órán keresztül visszafolyató hűtő alatt forraltuk. Ezt követően a reakciókeveréket 22 °C-ra hűtöttük, hozzáadtunk 50 ml 1 M sósavoldatot, majd folytattuk a keverést. A képződött szuszpenziót szűrtük, a kiszűrt kristályos anyagot először dietil-éterrel, majd vízzel mostuk, végül pedig vákuumban szárítottuk. Színtelen kristályok formájában 2,2 g kívánt címvegyületet nyertünk. Olvadáspont: 247-248 °C. $^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ (ppm): 6,93 ppm (s, 1H); 6,83 ppm (s, 1H); 4,65 ppm (s, 1H); 3,67 ppm (széles s, 4H); 2,40 ppm (s, 3H); 2,27 ppm (s, 3H); 2,04 ppm (s, 3H); 1,83 ppm (széles s, 4H).

P9. példa

A [2,6-dietil-4-(4-piridil)-fenil]-malonamid előállítása



0,5 ml 97 %-os kénsavhoz hozzáadtunk először 36 mg (0,002

mol) vizet, majd 360 mg (körülbelül 75 %-os tisztaságú, 0,001 mol) [(2,6-dietil-4-(4-piridil)-fenil]-malonsav-dinitrilt. A reakciókeveréket 5,5 órán keresztül 50 °C-on kevertettük, ezt követően lehűtöttük, majd telített, vizes nátrium-hidrogén-karbonát-oldattal semlegesítettük. A képződött csapadékot kiszűrtük, vízzel mostuk, ezt követően a kristályokat kevés dietil-éterben szuszpendáltuk, ismét kiszűrtük, majd szárítottuk. Ennek eredményeként 145 mg mennyiségben (47 %-os kitermeléssel) nyertük a kívánt címvegyületet. Olvadáspont: 184-186 °C. $^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ (ppm): 8,63 ppm (d, 2H); 7,48 ppm (d, 2H); 7,40 ppm (s, 2H); 7,20 ppm (széles szignál, 2H); 5,81 ppm (széles szignál, 2H); 4,80 ppm (s, 1H); 2,68 ppm (q, 4H); 1,30 ppm (t, 6H).

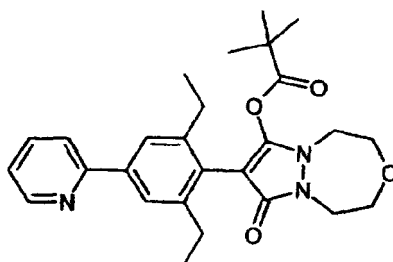
P10. példa

A [2,6-dietil-4-(2-piridil)-fenil]-malonamid előállítása

A címvegyületet a P9. példa szerinti eljárással analóg módon állítottuk elő. Olvadáspont: 230 °C (bomlik). $^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ (ppm): 8,68 ppm (d, 1H); 4,66-7,80 ppm (m, 4H); 7,23 ppm (m, 1H); 7,20 ppm (széles szignál, 2H); 5,67 ppm (széles szignál, 2H); 4,80 ppm (s, 1H); 2,67 ppm (q, 4H); 1,30 ppm (t, 6H).

P11. példa

A [8-[2,6-dietil-4-(2-piridil)-fenil]-9-oxo-1,2,4,5-tetrahidro-9H-pirazolo[1,2-d][1,4,5]oxadiazepin-7-il]-2,2-dimetil-propionát előállítása



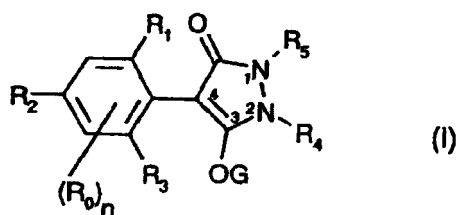
7 ml levegőmentesített xililhoz hozzáadtunk 290 mg (0,0011 mol) 1,4,5-oxadiazepán-dihidrobromidot és 0,56 ml (0,004 mol) trietil-amint, majd az így nyert keverékhez hozzáadtunk 311 mg (0,001 mol) [2,6-dietil-4-(2-piridil)-fenil]-malonamidot. A reakciókeveréket 4 órán keresztül 150 °C-on kevertettük, ezt követően egy éjszakán keresztül 20 °C-on állni hagytuk, majd 0-5 °C-ra hűtöttük. A lehűtött keverékhez cseppenként hozzáadtunk 0,135 ml (0,0011 mol) pivaloil-kloridot. A reakciókeveréket 3 órán keresztül 20 °C-on kevertettük, ezt követően bizre öntöttük, majd a vizes keveréket etil-acetáttal kétszer extraháltuk. A szerves oldatokat egyesítettük, vízzel és telített, vizes nátrium-klorid-oldattal mostuk, vízmentes nátrium-szulfát felett szárítottuk, majd betöményítettük. A maradékként 75 %-os kitermeléssel 345 mg mennyiségben kapott nyers terméket dietil-éterből kristályosítottuk. Ennek eredményeként 160 mg mennyiségben (35 %-os kitermeléssel) izoláltuk a kívánt címvegyületet. Olvadáspont: 146-147 °C. $^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ (ppm): 8,70 ppm (m, 1H); 7,72 ppm (m, 2H); 7,70 ppm (s, 2H); 7,22 ppm (m, 1H); 4,30 ppm (m, 2H); 3,97 ppm (m, 2H); 3,89 ppm (m, 4H); 2,62 ppm (m, 4H); 1,21 ppm (t, 6H); 1,03 ppm (s, 9H).

P12. példaA {8-[2,6-dietyl-4-(4-piridil)-fenil]-9-oxo-1,2,4,5-tetrahydro-
-9H-pirazolo[1,2-d][1,4,5]oxadiazepin-7-il}-2,2-dimetyl-
-propionát előállítás

A címvegyületet a P11. példa szerinti eljárással analóg módon állítottuk elő. $^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ (ppm): 8,19 ppm (széles szignál, 2H); 7,53 ppm (széles szignál, 2H); 7,35 ppm (s, 2H); 4,30 ppm (m, 2H); 3,96 ppm (m, 2H); 3,89 ppm (m, 4H); 2,62 ppm (m, 4H); 1,20 ppm (t, 6H); 1,05 ppm (s, 9H).

SZABADALMI IGÉNYPONTOK

1. Eljárás (I) általános képletű vegyületek



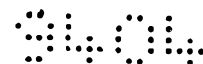
— amelyek képletében

R₀ jelentése egymástól függetlenül halogénatom, 1-6 szénatomos alkilcsoport, 2-6 szénatomos alkenilcsoport, 2-6 szénatomos alkinilcsoport, 1-6 szénatomos halogén-alkil-csoport, ciano-(1-6 szénatomos alkil)-csoport, 2-6 szénatomos halogén-alkenil-csoport, ciano-(2-6 szénatomos alkenil)-csoport, 2-6 szénatomos halogén-alkinil-csoport, ciano-(2-6 szénatomos alkinil)-csoport, hidroxicssoport, 1-6 szénatomos hidroxil-alkil-csoport, 1-6 szénatomos alkoxil-csoport, nitro-, aminocsoport, 1-6 szénatomos alkil-amino-csoport, di(1-6 szénatomos alkil)-amino-csoport, [(1-6 szénatomos alkil)-karbonil]-amino-csoport, [(1-6 szénatomos alkil)-szulfonil]-amino-csoport, [(1-6 szénatomos alkil)-amino]-szulfonil-csoport, (1-6 szénatomos alkil)-karbonil-csoport, [(1-6 szénatomos alkil)-karbonil]-(1-6 szénatomos alkil)-csoport, [(1-6 szénatomos alkoxi)-karbonil]-(1-6 szénatomos alkil)-csoport, [(1-6 szénatomos alkil)-karbonil]-(2-6 szénatomos alkenil)-csoport, [(1-6 szénatomos alkoxi)-karbonil]-(2-6 szénatomos alkenil)-cso-

port, [(1-6 szénatomos alkil)-karbonil]-(2-6 szénatomos alkinil)-csoport, [(1-6 szénatomos alkoxi)-karbonil]-(2-6 szénatomos alkinil)-csoport, (1-6 szénatomos alkoxi)-karbonil-csoport, ciano-, karboxilcsoport, fenilcsoport vagy aromás csoport, amely a nitrogén-, az oxigén- és a kénatom közül kiválasztott 1 vagy 2 heteroatomot tartalmaz, ahol az utóbbi két aromás csoport adott esetben 1-3 szénatomos alkilcsoporttal, 1-3 szénatomos halogén-alkil-csoporttal, 1-3 szénatomos alkoxicssoporttal, 1-3 szénatomos halogén-alkoxi-csoporttal, halogénatommal, ciano- vagy nitrocsoporttal szubsztituált; vagy

R_0 a szomszédos R_1 , R_2 és R_3 szubsztituensekkel együtt egy telített vagy telítetlen 3-6 szénatomos szénhidrogénhidat képezhet, amelyet a nitrogén-, oxigén- és kénatom közül kiválasztott egy vagy két heteroatom szakíthat meg és/vagy amely 1-4 szénatomos alkilcsoporttal szubsztituált lehet;

R_1 , R_2 és R_3 mindegyikének jelentése egymástól függetlenül hidrogén-, halogénatom, 1-6 szénatomos alkilcsoport, 2-6 szénatomos alkenilcsoport, 2-6 szénatomos alkinilcsoport, 3-6 szénatomos cikloalkilcsoport, 1-6 szénatomos halogén-alkil-csoport, 2-6 szénatomos halogén-alkenil-csoport, [(1-6 szénatomos alkoxi)-karbonil]-(2-6 szénatomos alkenil)-csoport, [(1-6 szénatomos alkil)-karbonil]-(2-6 szénatomos alkenil)-csoport, ciano-(2-6 szénatomos alkenil)-csoport, nitro-(2-6 szénatomos alkenil)-csoport, 2-6 szénatomos halogén-alkinil-csoport, [(1-6 szénatomos alkoxi)-karbonil]-(2-6 szénatomos alkinil)-csoport, [(1-6



szénatomos alkil)-karbonil]-(2-6 szénatomos alkinil)-csoport, ciano-(2-6 szénatomos alkinil)-csoport, nitro-(2-6 szénatomos alkinil)-csoport, 3-6 szénatomos halogén-cikloalkil-csoport, hidroxil-(1-6 szénatomos alkil)-csoport, (1-6 szénatomos alkoxi)-(1-6 szénatomos alkil)-csoport, [(1-6 szénatomos alkil)-tio]-(1-6 szénatomos alkil)-csoport, cianocsoport, (1-4 szénatomos alkil)-karbonil-csoport, (1-6 szénatomos alkoxi)-karbonil-csoport, hidroxil-csoport, 1-10 szénatomos alkoxics csoport, 3-6 szénatomos alkenil-oxi-csoport, 3-6 szénatomos alkinil-oxi-csoport, 1-6 szénatomos halogén-alkoxi-csoport, 3-6 szénatomos (halogén-alkenil)-oxi-csoport, (1-6 szénatomos alkoxi)-(1-6 szénatomos alkoxi)-csoport, merkaptocsoport, 1-6 szénatomos alkil-tio-csoport, 1-6 szénatomos (halogén-alkil)-tio-csoport, 1-6 szénatomos alkil-szulfonil-csoport, 1-6 szénatomos alkil-szulfonil-csoport, nitro-, aminocsoport, 1-6 szénatomos alkil-amino-csoport, di(1-6 szénatomos alkil)-amino-csoport vagy fenoxics csoport, amelyben a fenilcsoport adott esetben 1-3 szénatomos alkilcsoporttal, 1-3 szénatomos halogén-alkil-csoporttal, 1-3 szénatomos alkoxics csoporttal, 1-3 szénatomos halogén-alkoxi-csoporttal, halogénatommal ciano- vagy nitrocsoporttal szubsztituált;

R₂ jelentése ezenkívül fenilcsoport, naftilcsoport vagy egy öt- vagy hattagú aromás csoport, amely a nitrogén-, oxigén- és kénatom közül kiválasztott egy vagy két heteroatomot tartalmazhat, ahol a fenilcsoport, a naftilcsoport és az öt- vagy hattagú aromás csoport adott esetben halogén-



atommal, 3-8 szénatomos cikloalkilcsoporttal, hidrox-,
merkapt-, amino-, ciano-, nitro- vagy formilcsoporttal
szubsztituált lehet; és/vagy

a fenilcsoport, a naftilcsoport és az öt- vagy hattagú
aromás csoport adott esetben a következő csoportokkal
szubsztituált lehet: 1-6 szénatomos alkilcsoport, 1-6
szénatomos alkoxics csoport, hidrox-(1-6 szénatomos alkil)-
-csoport, (1-6 szénatomos alkoxi)-(1-6 szénatomos alkil)-
-csoport, (1-6 szénatomos alkoxi)-(1-6 szénatomos alkoxi)-
-csoport, (1-6 szénatomos alkil)-karbonil-csoport, 1-6
szénatomos alkil-tio-csoport, 1-6 szénatomos alkil-szulfi-
nil-csoport, 1-6 szénatomos alkil-szulfonil-csoport, mono-
(1-6 szénatomos alkil)-amino-csoport, di(1-6 szénatomos
alkil)-amino-csoport, [(1-6 szénatomos alkil)-karbonil]-
-amino-csoport, N-[(1-6 szénatomos alkil)-karbonil]-N-(1-6
szénatomos alkil)-amino-csoport, 2-6 szénatomos alkenil-
csoport, (3-6 szénatomos alkenil)-oxi-csoport, hidrox-
-(3-6 szénatomos alkenil)-csoport, (1-6 szénatomos alko-
xi)-(2-6 szénatomos alkenil)-csoport, [(1-6 szénatomos
alkoxi)-(3-6 szénatomos alkenil)]-oxi-csoport, (2-6 szén-
atomos alkenil)-karbonil-csoport, 2-6 szénatomos alkenil-
-tio-csoport, 2-6 szénatomos alkenil-szulfinil-csoport,
2-6 szénatomos alkenil-szulfonil-csoport, mono- vagy di-
(2-6 szénatomos alkenil)-amino-csoport, N-(1-6 szénatomos
alkil)-N-(3-6 szénatomos alkenil)-amino-csoport, [(2-6
szénatomos alkenil)-karbonil]-amino-csoport, N-[(2-6 szén-
atomos alkenil)-karbonil]-N-(1-6 szénatomos alkil)-amino-



-csoport, 2-6 szénatomos alkinilcsoport, (3-6 szénatomos alkinil)-oxi-csoport, hidroxil-(3-6 szénatomos alkinil)-csoport, (1-6 szénatomos alkoxi)-(2-6 szénatomos alkinil)-csoport, [(1-6 szénatomos alkoxi)-(3-6 szénatomos alkinil)]-oxi-csoport, (2-6 szénatomos alkinil)-karbonil-csoport, 2-6 szénatomos alkinil-tio-csoport, 2-6 szénatomos alkinil-szulfinil-csoport, 2-6 szénatomos alkinil-szulfonil-csoport, mono- vagy di(2-6 szénatomos alkinil)-amino-csoport, N-(1-6 szénatomos alkil)-N-(3-6 szénatomos alkinil)-amino-csoport, [(2-6 szénatomos alkinil)-karbonil]-amino-csoport vagy N-[(2-6 szénatomos alkinil)-karbonil]-N-(1-6 szénatomos alkil)-amino-csoport; és/vagy a fenilcsoport, a naftilcsoport és az öt- vagy hattagú aromás csoport adott esetben a következő csoportokkal szubsztituált lehet: halogén-szubsztituált 1-6 szénatomos alkilcsoport, 1-6 szénatomos alkoxics csoport, hidroxil-(1-6 szénatomos alkil)-csoport, (1-6 szénatomos alkoxi)-(1-6 szénatomos alkil)-csoport, (1-6 szénatomos alkoxi)-(1-6 szénatomos alkoxi)-csoport, (1-6 szénatomos alkil)-karbonil-csoport, 1-6 szénatomos alkil-tio-csoport, 1-6 szénatomos alkil-szulfinil-csoport, 1-6 szénatomos alkil-szulfonil-csoport, mono(1-6 szénatomos alkil)-amino-csoport, di(1-6 szénatomos alkil)-amino-csoport, [(1-6 szénatomos alkil)-karbonil]-amino-csoport, N-[(1-6 szénatomos alkil)-karbonil]-N-(1-6 szénatomos alkil)-amino-csoport, 2-6 szénatomos alkenilcsoport, (3-6 szénatomos alkenil)-oxi-csoport, hidroxil-(3-6 szénatomos alkenil)-csoport, (1-6



szénatomos alkoxi)-(2-6 szénatomos alkenil)-csoport, [(1-6 szénatomos alkoxi)-(3-6 szénatomos alkenil)]-oxi-csoport, (2-6 szénatomos alkenil)-karbonil-csoport, 2-6 szénatomos alkenil-tio-csoport, 2-6 szénatomos alkenil-szulfinil-csoport, 2-6 szénatomos alkenil-szulfonil-csoport, mono- vagy di(2-6 szénatomos alkenil)-amino-csoport, *N*-(1-6 szénatomos alkil)-*N*-(3-6 szénatomos alkenil)-amino-csoport, [(2-6 szénatomos alkenil)-karbonil]-amino-csoport, *N*-[(2-6 szénatomos alkenil)-karbonil]-*N*-(1-6 szénatomos alkil)-amino-csoport, 2-6 szénatomos alkinilcsoport, (3-6 szénatomos alkinil)-oxi-csoport, hidroxil-(3-6 szénatomos alkinil)-csoport, (1-6 szénatomos alkoxi)-(2-6 szénatomos alkinil)-csoport, [(1-6 szénatomos alkoxi)-(3-6 szénatomos alkinil)]-oxi-csoport, (2-6 szénatomos alkinil)-karbonil-csoport, 2-6 szénatomos alkinil-tio-csoport, 2-6 szénatomos alkinil-szulfinil-csoport, 2-6 szénatomos alkinil-szulfonil-csoport, mono- vagy di(2-6 szénatomos alkinil)-amino-csoport, *N*-(1-6 szénatomos alkil)-*N*-(3-6 szénatomos alkinil)-amino-csoport, [(2-6 szénatomos alkinil)-karbonil]-amino-csoport vagy *N*-[(2-6 szénatomos alkinil)-karbonil]-*N*-(1-6 szénatomos alkil)-amino-csoport; és/vagy a fenilcsoport, a naftilcsoport és az öt- vagy hattagú aromás csoport adott esetben a következő csoportokkal szubsztituált lehet: -COOR₅₀, -CONR₅₁, -SO₂NR₅₃R₅₄ vagy -SO₂OR₅₅ általános képletű csoport, ahol

R₅₀, R₅₁, R₅₂, R₅₃, R₅₄ és R₅₅ mindegyikének jelentése egymástól függetlenül 1-6 szénatomos alkilcso-

port, 2-6 szénatomos alkenilcsoport vagy 3-6 szénatomos alkinilcsoport, vagy halogénatommal, hidrox-, alkoxi-, merkapt-, amino-, ciano-, nitro-, alkil-tio-, alkil-szulfonil- vagy alkil-szulfonil-csoporttal szubsztituált 1-6 szénatomos alkilcsoport, 2-6 szénatomos alkenilcsoport vagy 3-6 szénatomos alkinilcsoport;

n értéke 0, 1 vagy 2;

R₄ és R₅ mindegyikének jelentése egymástól függetlenül hidrogénatom, 1-12 szénatomos alkilcsoport, 1-12 szénatomos halogén-alkil-csoport, 2-8 szénatomos alkenilcsoport, 2-8 szénatomos alkinilcsoport, (1-10 szénatomos alkoxi)-(1-8 szénatomos alkil)-csoport, [poli(1-10 szénatomos alkoxi)]-(1-8 szénatomos alkil)-csoport, (1-10 szénatomos alkil-tio)-(1-8 szénatomos alkil)-csoport, 3-8 szénatomos cikloalkilcsoport, 3-8 szénatomos halogén-cikloalkil-csoport, 4-8 tagú heterociklusos csoport, fenilcsoport, α - vagy β -naftilcsoport, fenil-(1-6 szénatomos alkil)-csoport, α - vagy β -naftil-(1-6 szénatomos alkil)-csoport, öt- vagy hattagú heteroarilcsoport vagy öt- vagy hattagú heteroaril-(1-6 szénatomos alkil)-csoport, ahol az aromás és heteroaromás csoportok adott esetben halogénatommal, 1-6 szénatomos alkilcsoporttal, 1-6 szénatomos halogén-alkil-csoporttal, 1-6 szénatomos alkoxicssoporttal, 1-6 szénatomos halogén-alkoxi-csoporttal, nitro- vagy cianocsoporttal szubsztituáltak lehetnek; vagy

R₄ és R₅ azokkal a nitrogénatomokkal együtt, amelyekhez kötőd-



nek, egy telített vagy telítetlen 5-8 tagú heterociklusos gyűrűt képeznek, amely

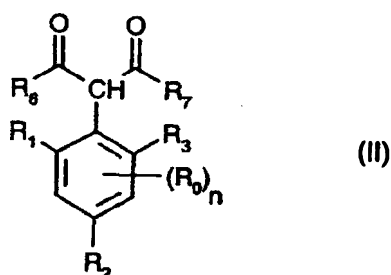
1) adott esetben oxigén-, kénatommal vagy $>NR_{14}$ általános képletű csoporttal van megszakítva és/vagy adott esetben halogénatommal, 1-10 szénatomos alkilcsoporttal, 1-10 szénatomos halogén-alkil-csoporttal, hidroxicssoporttal, 1-6 szénatomos alkoxicssoporttal, (1-6 szénatomos alkoxi)-(1-6 szénatomos alkoxi)-csoporttal, 1-6 szénatomos halogén-alkoxi-csoporttal, merkaptocsoporttal, 1-6 szénatomos alkil-tio-csoporttal, 3-7 szénatomos cikloalkilcsoporttal, heteroarilcsoporttal, heteroaril-(1-6 szénatomos alkil)-csoporttal, fenilcsoporttal, fenil-(1-6 szénatomos alkil)-csoporttal vagy benzil-oxi-csoporttal szubsztituált, ahol az utóbbi három szubsztituens fenilcsoportja adott esetben halogénatommal, 1-6 szénatomos alkilcsoporttal, 1-6 szénatomos halogén-alkil-csoporttal, 1-6 szénatomos alkoxicssoporttal, 1-6 szénatomos halogén-alkoxi-csoporttal vagy nitrocsoporttal szubsztituált, és/vagy

2) egy kondenzált vagy spiro-kötött 2-6 szénatomos, adott esetben oxigén- vagy kénatommal megszakított alkilén- vagy alkenilénláncot tartalmazhat, vagy a telített vagy telítetlen heterociklusos gyűrű legalább egy gyűrűatomja köti össze az alkilén- vagy alkenilénláncot;

R_{14} jelentése hidrogénatom, 1-4 szénatomos alkilcsoport, (1-6 szénatomos alkil)-karbonil-csoport, 1-6 szénatomos alkil-szulfonil-csoport, 3-6 szénatomos alkenilcsoport vagy 3-6 szénatomos

alkinilcsoport; és

G jelentése hidrogénatom, egy fémion-ekvivalens vagy egy amónium-, szulfónium- vagy foszfónium-kation — előállítására, **azzal jellemezve**, hogy egy (II) általános képletű vegyületet



— amelynek képletében

R_0 , R_1 , R_2 és R_3 jelentése a fentiekben meghatározott;

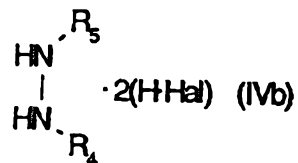
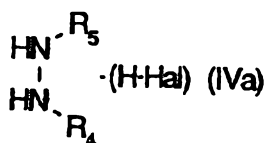
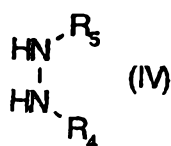
n értéke a fentiekben meghatározott;

R_6 jelentése R_8R_9N - általános képletű csoport;

R_7 jelentése $R_{10}R_{11}N$ - vagy $R_{12}O$ - általános képletű csoport; valamint

R_8 , R_9 , R_{10} , R_{11} és R_{12} mindegyikének jelentése egymástól függetlenül hidrogénatom, 1-6 szénatomos alkilcsoport, 1-6 szénatomos halogén-alkil-csoport, 3-6 szénatomos alkenilcsoport vagy benzilcsoport, ahol a benzilcsoport fenilcsoportja adott esetben 1-4 szénatomos alkilcsoporttal, halogénatommal, 1-4 szénatomos halogén-alkil-csoporttal, 1-4 szénatomos alkoxicssoporttal vagy nitrocsoporttal szubsztituált lehet —

inert szerves oldószerben, adott esetben bázis jelenlétében egy (IV), (IVa) vagy (IVb) általános képletű vegyülettel



— amelynek képletében R_4 és R_5 jelentése a fentiekben meghatározott, és $\text{H} \cdot \text{Hal}$ egy hidrogén-halogenidet jelent —
reagáltatunk, és adott esetben az így nyert (I) általános képletű vegyületet, amelyben G egy fémion-ekvivalenst vagy egy ammónium-kationt jelent, sókonverzióval átalakítjuk a megfelelő olyan (I) általános képletű vegyületté, amelyben G egy szulfónium- vagy foszfónium-kationt jelent, vagy egy Brönsted-savval reagáltatva átalakítjuk a megfelelő olyan (I) általános képletű vegyületté, amelyben G jelentése hidrogénatom.

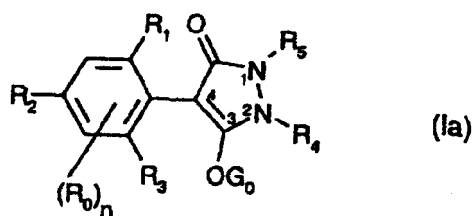
2. Az 1. igénypont szerinti eljárás (I) általános képletű vegyületek előállítására, **azzal jellemezve**, hogy

R_0 jelentése egymástól függetlenül halogénatom, 1-6 szénatomos alkilcsoport, 1-6 szénatomos halogén-alkil-csoport, hidroxics csoport, 1-6 szénatomos alkoxics csoport, nitro-, aminocsoport, 1-6 szénatomos alkil-amino-csoport, di(1-6 szénatomos alkil)-amino-csoport, [(1-6 szénatomos alkil)-karbonil]-amino-csoport, [(1-6 szénatomos alkil)-szulfonyl]-amino-csoport, [(1-6 szénatomos alkil)-amino]-szulfonyl-csoport, (1-4 szénatomos alkil)-karbonil-csoport, (1-6 szénatomos alkoxi)-karbonil-csoport vagy karboxilcsoport; valamint

R_1 , R_2 és R_3 mindegyikének jelentése egymástól függetlenül hidrogén-, halogénatom, 1-6 szénatomos alkilcsoport, 2-6 szénatomos alkenilcsoport, 2-6 szénatomos alkinilcsoport,

3-6 szénatomos cikloalkilcsoport, 1-6 szénatomos halogén-alkil-csoport, 2-6 szénatomos halogén-alkenil-csoport, 2-6 szénatomos halogén-alkinil-csoport, 3-6 szénatomos halogén-cikloalkil-csoport, (1-6 szénatomos alkoxi)-(1-6 szénatomos alkil)-csoport, [(1-6 szénatomos alkil)-tio]-(1-6 szénatomos alkil)-csoport, cianocsoport, (1-4 szénatomos alkil)-karbonil-csoport, (1-6 szénatomos alkoxi)-karbonil-csoport, hidroxics csoport, 1-10 szénatomos alkoxi-csoport, 3-6 szénatomos alkenil-oxi-csoport, 3-6 szénatomos alkinil-oxi-csoport, 1-6 szénatomos halogén-alkoxi-csoport, 3-6 szénatomos (halogén-alkenil)-oxi-csoport, (1-6 szénatomos alkoxi)-(1-6 szénatomos alkoxi)-csoport, merkaptocsoport, 1-6 szénatomos alkil-tio-csoport, 1-6 szénatomos (halogén-alkil)-tio-csoport, 1-6 szénatomos alkil-szulfinil-csoport, 1-6 szénatomos alkil-szulfonil-csoport, nitro-, aminocsoport, 1-4 szénatomos alkil-amino-csoport vagy di(1-6 szénatomos alkil)-amino-csoport.

3. Eljárás (Ia) általános képletű vegyületek



— amelyek képletében

R_0 , R_1 , R_2 , R_3 , R_4 és R_5 jelentése az (I) általános képletnél meghatározott;

n értéke az (I) általános képletnél meghatározott;

- G_0 jelentése $-C(O)-R_{30}$, $-C(X_1)-X_2-R_{31}$, $-C(X_3)-N(R_{32})-R_{33}$,
 $-SO_2-R_{34}$ vagy $-P(X_4)(R_{35})-R_{36}$ általános képletű csoport;
 X_1 , X_2 , X_3 és X_4 mindegyikének jelentése egymástól függetlenül
 oxigén- vagy kénatom;
- R_{30} jelentése adott esetben halogénatommal szubsztituált 1-20
 szénatomos alkilcsoport, 2-20 szénatomos alkenilcsoport,
 (1-8 szénatomos alkoxi)-(1-8 szénatomos alkil)-csoport,
 [(1-8 szénatomos alkil)-tio]-(1-8 szénatomos alkil)-cso-
 port, [poli(1-10 szénatomos alkoxi)]-(1-8 szénatomos al-
 kil)-csoport, vagy adott esetben halogénatommal, 1-6 szén-
 atomos alkilcsoporttal vagy 1-6 szénatomos alkoxicsoport-
 tal szubsztituált 3-8 szénatomos cikloalkilcsoport, amely-
 ben adott esetben legalább egy gyűrűtagot oxigén- és/vagy
 kénatom helyettesít, (3-6 szénatomos cikloalkil)-(1-6
 szénatomos alkil)-csoport, heterociklil-(1-6 szénatomos
 alkil)-csoport, heteroaril-(1-6 szénatomos alkil)-csoport,
 adott esetben halogénatommal, ciano-, nitrocsoporttal, 1-6
 szénatomos alkilcsoporttal, 1-6 szénatomos alkoxi-
 csoporttal, 1-6 szénatomos halogén-alkil-csoporttal, 1-6
 szénatomos halogén-alkoxi-csoporttal, 1-6 szénatomos
 alkil-tio-csoporttal vagy 1-6 szénatomos alkil-szulfonil-
 csoporttal szubsztituált fenilcsoport, adott esetben ha-
 logénatommal, ciano-, nitrocsoporttal, 1-6 szénatomos al-
 kilcsoporttal, 1-6 szénatomos alkoxicsoporttal, 1-6 szén-
 atomos halogén-alkil-csoporttal vagy 1-6 szénatomos halo-
 gén-alkoxi-csoporttal szubsztituált fenil-(1-6 szénatomos
 alkil)-csoport, adott esetben halogénatommal vagy 1-6

szénatomos alkilcsoporttal szubsztituált heteroarilcsoport, adott esetben halogénatommal vagy 1-6 szénatomos alkilcsoporttal szubsztituált fenoxi-(1-6 szénatomos alkil)-csoport, vagy adott esetben halogénatommal, aminocsoporttal vagy 1-6 szénatomos alkilcsoporttal szubsztituált (heteroaril-oxi)-(1-6 szénatomos alkil)-csoport;

R₃₁ jelentése adott esetben halogénatommal szubsztituált 1-20 szénatomos alkilcsoport, 2-20 szénatomos alkenilcsoport, (1-8 szénatomos alkoxi)-(2-8 szénatomos alkil)-csoport, [poli(1-8 szénatomos alkoxi)]-(2-8 szénatomos alkil)-csoport, vagy adott esetben halogénatommal, 1-6 szénatomos alkilcsoporttal vagy 1-6 szénatomos alkoxicssoporttal szubsztituált 3-8 szénatomos cikloalkilcsoport, (3-6 szénatomos cikloalkil)-(1-6 szénatomos alkil)-csoport, heterociklil-(1-6 szénatomos alkil)-csoport, heteroaril-(1-6 szénatomos alkil)-csoport, adott esetben halogénatommal, ciano-, nitrocssoporttal, 1-6 szénatomos alkilcsoporttal, 1-6 szénatomos alkoxicssoporttal, 1-6 szénatomos halogénalkil-csoporttal vagy 1-6 szénatomos halogén-alkoxi-csoporttal szubsztituált fenil- vagy benzilcsoport;

R₃₂ és R₃₃ mindegyikének jelentése egymástól függetlenül hidrogénatom, adott esetben halogénatommal szubsztituált 1-8 szénatomos alkilcsoport, 3-6 szénatomos cikloalkilcsoport, 1-8 szénatomos alkoxicssoport, 3-8 szénatomos alkenilcsoport, (1-8 szénatomos alkoxi)-(1-8 szénatomos alkil)-csoport, vagy adott esetben halogénatommal, 1-8 szénatomos halogénalkil-csoporttal, 1-8 szénatomos alkilcsoporttal

vagy 1-8 szénatomos alkoxicsoporttal szubsztituált fenil- vagy benzilcsoport; vagy

R₃₂ és R₃₃ együtt egy 3-6 szénatomos alkilénláncot képez, amelyben adott esetben egy szénatomot oxigén- vagy kénatom helyettesít;

R₃₄ jelentése adott esetben halogénatommal szubsztituált 1-8 szénatomos alkilcsoport, 3-8 szénatomos alkenilcsoport, 3-8 szénatomos halogén-alkenil-csoport, 3-8 szénatomos alkinilcsoport, 3-8 szénatomos halogén-alkinil-csoport, vagy adott esetben halogénatommal, 1-6 szénatomos alkilcsoporttal, 1-6 szénatomos alkoxicsoporttal, 1-4 szénatomos halogén-alkil-csoporttal, 1-4 szénatomos halogén-alkoxi-csoporttal, ciano- vagy nitrocsoporttal szubsztituált fenil- vagy benzilcsoport;

R₃₅ és R₃₆ mindegyikének jelentése egymástól függetlenül adott esetben halogénatommal szubsztituált 1-8 szénatomos alkilcsoport, 1-8 szénatomos alkoxicsoport, 1-8 szénatomos alkil-amino-csoport, di(1-8 szénatomos alkil)-amino-csoport, 1-8 szénatomos alkil-tio-csoport, 2-8 szénatomos alkenil-tio-csoport, 3-7 szénatomos cikloalkil-tio-csoport, vagy adott esetben halogénatommal, nitro-, cianocsoporttal, 1-4 szénatomos alkoxicsoporttal, 1-4 szénatomos halogén-alkoxi-csoporttal, 1-4 szénatomos alkil-tio-csoporttal, 1-4 szénatomos (halogén-alkil)-tio-csoporttal, 1-4 szénatomos alkilcsoporttal vagy 1-4 szénatomos halogén-alkil-csoporttal szubsztituált fenil-, fenoxi- vagy fenil-tio-csoport —

előállítására, **azzal jellemezve**, hogy egy 1. igénypont szerinti eljárással előállított (I) általános képletű vegyület izolálás nélkül, közvetlenül a reakcióoldatban egy egyedényes reakció során, adott esetben savmegkötő szer vagy katalizátor jelenlétében egy (XII) vagy (XIId) általános képletű elektrofilrel



— amelynek képletében G_0 , R_{32} és X_3 jelentése a fentiekben meghatározott, azzal az eltéréssel, hogy R_{32} jelentése hidrogénatomtól eltérő, valamint L jelentése kilépőcsoport — reagáltatunk.

4. A 2. igénypont szerinti eljárás, **azzal jellemezve**, hogy R_1 , R_2 és R_3 mindegyikének jelentése egymástól függetlenül hidrogén-, halogénatom, 1-4 szénatomos alkilcsoport, 2-4 szénatomos alkenilcsoport, 2-4 szénatomos alkinilcsoport, 1-4 szénatomos halogén-alkil-csoport, 3-4 szénatomos halogén-alkenil-csoport, 3-6 szénatomos cikloalkilcsoport, (1-4 szénatomos alkil)-karbonil-csoport, (1-6 szénatomos alkoxi)-karbonil-csoport, hidroxicssoport, 1-4 szénatomos alkoxicssoport, 3-4 szénatomos alkenil-oxi-csoport, 3-4 szénatomos alkinil-oxi-csoport, 1-4 szénatomos halogén-alkoxi-csoport, nitro- vagy aminos csoport.

5. Az 1. igénypont szerinti eljárás, **azzal jellemezve**, hogy

R_4 és R_5 azokkal a nitrogénatomokkal együtt, amelyekhez kötőd-

nek, egy telített vagy telítetlen hat- vagy héttagú heterociklusos gyűrűt képeznek, amely

1) adott esetben oxigén- és/vagy kénatommal van megszakítva, és/vagy

2) egy kondenzált vagy spiro-kötött 2-5 szénatomos, adott esetben oxigén- vagy kénatommal egyszeresen vagy kétszeresen megszakított alkilénláncot tartalmazhat, vagy a telített vagy telítetlen heterociklusos gyűrű legalább egy gyűrűatomja köti össze az alkilénláncot.

6. Az 1. igénypont szerinti eljárás, **azzal jellemezve**, hogy olyan (II) általános képletű vegyületeket alkalmazunk, amelyekben R_8 , R_9 , R_{10} , R_{11} és R_{12} jelentése hidrogénatom, 1-6 szénatomos alkilcsoport vagy benzilcsoport.

7. Az 1. igénypont szerinti eljárás, **azzal jellemezve**, hogy a (II) általános képletű vegyületre vonatkoztatva a (IV), (IVa) vagy (IVb) általános képletű vegyületet ekvivaláris mennyiségben vagy előnyösen 5-50 mol% feleslegben alkalmazzuk.

8. Az 1. igénypont szerinti eljárás, **azzal jellemezve**, hogy a reakciót 0 °C és 200 °C közötti hőmérséklet-tartományban hajtjuk végre.

9. Az 1. igénypont szerinti eljárás, **azzal jellemezve**, hogy a reakcióhoz inert szerves oldószerként aromás, alifás vagy cikloalifás szénhidrogéneket, halogénezett szénhidrogéneket, étereket, nitrileket, dialkil-szulfoxidokat, amidokat vagy laktámokat, alkoholokat, glikolokat vagy polialkoholokat, karbonsavakat vagy ilyen oldószerkeverékeket alkalmazunk.

10. A 9. igénypont szerinti eljárás, **azzal jellemezve**, hogy az oldószert a következő csoportból választjuk ki: toluol, xilol izomerek, például orto-, meta- és para-xilol, ciklohexán és metil-ciklohexán, klór-benzol és diklór-benzol izomerek, például 1,2-, 1,3- és 1,4-diklór-benzol.

11. Az 1. igénypont szerinti eljárás, **azzal jellemezve**, hogy a kondenzációs reakciót inert gáz atmoszférában hajtjuk végre.

12. Az 1. igénypont szerinti eljárás, **azzal jellemezve**, hogy a (II) általános képletű vegyületek és a (IVa) vagy (IVb) általános képletű vegyületek közötti reakciót bázis hozzáadása nélkül vagy bázis hozzáadásával hajtjuk végre.

13. Az 1. igénypont szerinti eljárás, **azzal jellemezve**, hogy a (II) általános képletű vegyületek és a (IVa) vagy (IVb) általános képletű vegyületek közötti reakciót bázis jelenlétében hajtjuk végre.

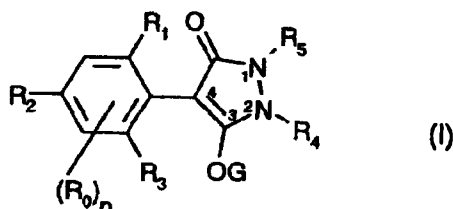
14. A 13. igénypont szerinti eljárás, **azzal jellemezve**, hogy bázisként tercier aminokat, piridint, alkálifém-alkoholátokat, alkálifém- vagy alkáliföldfém-hidrideket, -hidroxidokat, -karbonátokat vagy -hidrogén-karbonátokat alkalmazunk.

15. A 14. igénypont szerinti eljárás, **azzal jellemezve**, hogy a bázist katalitikus mennyiségben vagy a (II) általános képletű vegyületre vonatkoztatva legfeljebb ötszörös moláris feleslegben alkalmazzuk.

16. Az 1. igénypont szerinti eljárással előállított (I) általános képletű vegyületek — amelyek képletében G jelentése

hidrogénatom, egy fémion-ekvivalens vagy egy ammónium-, szulfónium- vagy foszfónium-kation — alkalmazása olyan (Ia) általános képletű vegyületek *in situ* előállítására, amelyek képletében G_0 jelentése $-C(O)-R_{30}$, $-C(X_1)-X_2-R_{31}$, $-C(X_3)-N(R_{32})-R_{33}$, $-SO_2-R_{34}$ vagy $-P(X_4)(R_{35})-R_{36}$ általános képletű csoport; valamint R_{30} , R_{31} , R_{32} , R_{33} , R_{34} , R_{35} , R_{36} , X_1 , X_2 , X_3 és X_4 jelentése a fentiekben meghatározott.

17. (I) általános képletű vegyületek,



amelyek képletében

R_0 jelentése egymástól függetlenül halogénatom, 1-6 szénatomos alkilcsoport, 2-6 szénatomos alkenilcsoport, 2-6 szénatomos alkinilcsoport, 1-6 szénatomos halogén-alkil-csoport, ciano-(1-6 szénatomos alkil)-csoport, 2-6 szénatomos halogén-alkenil-csoport, ciano-(2-6 szénatomos alkenil)-csoport, 2-6 szénatomos halogén-alkinil-csoport, ciano-(2-6 szénatomos alkinil)-csoport, hidroxicssoport, 1-6 szénatomos hidroxil-alkil-csoport, 1-6 szénatomos alkoxil-csoport, nitro-, aminocsoport, 1-6 szénatomos alkil-amino-csoport, di(1-6 szénatomos alkil)-amino-csoport, [(1-6 szénatomos alkil)-karbonil]-amino-csoport, [(1-6 szénatomos alkil)-szulfonil]-amino-csoport, [(1-6 szénatomos alkil)-amino]-szulfonil-csoport, (1-6 szénatomos alkil)-kar-

bonil-csoport, [(1-6 szénatomos alkil)-karbonil]-(1-6 szénatomos alkil)-csoport, [(1-6 szénatomos alkoxi)-karbonil]-(1-6 szénatomos alkil)-csoport, [(1-6 szénatomos alkil)-karbonil]-(2-6 szénatomos alkenil)-csoport, [(1-6 szénatomos alkoxi)-karbonil]-(2-6 szénatomos alkenil)-csoport, [(1-6 szénatomos alkil)-karbonil]-(2-6 szénatomos alkinil)-csoport, [(1-6 szénatomos alkoxi)-karbonil]-(2-6 szénatomos alkinil)-csoport, (1-6 szénatomos alkoxi)-karbonil-csoport, ciano-, karboxilcsoport, fenilcsoport vagy aromás csoport, amely a nitrogén-, az oxigén- és a kénatom közül kiválasztott 1 vagy 2 heteroatomot tartalmaz, ahol az utóbbi két aromás csoport adott esetben 1-3 szénatomos alkilcsoporttal, 1-3 szénatomos halogén-alkil-csoporttal, 1-3 szénatomos alkoxicssoporttal, 1-3 szénatomos halogén-alkoxi-csoporttal, halogénatommal, ciano- vagy nitrocsoporttal szubsztituált; vagy

R_0 a szomszédos R_1 , R_2 és R_3 szubsztituensekkel együtt egy telített vagy telítetlen 3-6 szénatomos szénhidrogénhidat képezhet, amelyet a nitrogén-, oxigén- és kénatom közül kiválasztott egy vagy két heteroatom szakíthat meg és/vagy amely 1-4 szénatomos alkilcsoporttal szubsztituált lehet;

R_1 , R_2 és R_3 mindegyikének jelentése egymástól függetlenül hidrogén-, halogénatom, 1-6 szénatomos alkilcsoport, 2-6 szénatomos alkenilcsoport, 2-6 szénatomos alkinilcsoport, 3-6 szénatomos cikloalkilcsoport, 1-6 szénatomos halogén-alkil-csoport, 2-6 szénatomos halogén-alkenil-csoport, [(1-6 szénatomos alkoxi)-karbonil]-(2-6 szénatomos alke-

nil)-csoport, [(1-6 szénatomos alkil)-karbonil]-(2-6 szénatomos alkenil)-csoport, ciano-(2-6 szénatomos alkenil)-csoport, nitro-(2-6 szénatomos alkenil)-csoport, 2-6 szénatomos halogén-alkinil-csoport, [(1-6 szénatomos alkoxi)-karbonil]-(2-6 szénatomos alkinil)-csoport, [(1-6 szénatomos alkil)-karbonil]-(2-6 szénatomos alkinil)-csoport, ciano-(2-6 szénatomos alkinil)-csoport, nitro-(2-6 szénatomos alkinil)-csoport, 3-6 szénatomos halogén-cikloalkil-csoport, hidroxil-(1-6 szénatomos alkil)-csoport, (1-6 szénatomos alkoxi)-(1-6 szénatomos alkil)-csoport, [(1-6 szénatomos alkil)-tio]-(1-6 szénatomos alkil)-csoport, cianocsoport, (1-4 szénatomos alkil)-karbonil-csoport, (1-6 szénatomos alkoxi)-karbonil-csoport, hidroxil-csoport, 1-10 szénatomos alkoxics csoport, 3-6 szénatomos alkenil-oxi-csoport, 3-6 szénatomos alkinil-oxi-csoport, 1-6 szénatomos halogén-alkoxi-csoport, 3-6 szénatomos (halogén-alkenil)-oxi-csoport, (1-6 szénatomos alkoxi)-(1-6 szénatomos alkoxi)-csoport, merkaptocsoport, 1-6 szénatomos alkil-tio-csoport, 1-6 szénatomos (halogén-alkil)-tio-csoport, 1-6 szénatomos alkil-szulfonil-csoport, 1-6 szénatomos alkil-szulfonil-csoport, nitro-, aminocsoport, 1-6 szénatomos alkil-amino-csoport, di(1-6 szénatomos alkil)-amino-csoport vagy fenoxics csoport, amelyben a fenil-csoport adott esetben 1-3 szénatomos alkilcsoporttal, 1-3 szénatomos halogén-alkil-csoporttal, 1-3 szénatomos alkoxics csoporttal, 1-3 szénatomos halogén-alkoxi-csoporttal, halogénatommal ciano- vagy nitrocsoporttal szubsztituált;



R₂ jelentése ezenkívül fenilcsoport, naftilcsoport vagy egy öt- vagy hattagú aromás csoport, amely a nitrogén-, oxigén- és kénatom közül kiválasztott egy vagy két heteroatomot tartalmazhat, ahol a fenilcsoport, a naftilcsoport és az öt- vagy hattagú aromás csoport adott esetben halogén-atommal, 3-8 szénatomos cikloalkilcsoporttal, hidrox-, merkapt-, amino-, ciano-, nitro- vagy formilcsoporttal szubsztituált lehet; és/vagy a fenilcsoport, a naftilcsoport és az öt- vagy hattagú aromás csoport adott esetben a következő csoportokkal szubsztituált lehet: 1-6 szénatomos alkilcsoport, 1-6 szénatomos alkoxics csoport, hidrox-(1-6 szénatomos alkil)-csoport, (1-6 szénatomos alkoxi)-(1-6 szénatomos alkil)-csoport, (1-6 szénatomos alkoxi)-(1-6 szénatomos alkoxi)-csoport, (1-6 szénatomos alkil)-karbonil-csoport, 1-6 szénatomos alkil-tio-csoport, 1-6 szénatomos alkil-szulfonil-csoport, 1-6 szénatomos alkil-szulfonil-csoport, mono-(1-6 szénatomos alkil)-amino-csoport, di(1-6 szénatomos alkil)-amino-csoport, [(1-6 szénatomos alkil)-karbonil]-amino-csoport, N-[(1-6 szénatomos alkil)-karbonil]-N-(1-6 szénatomos alkil)-amino-csoport, 2-6 szénatomos alkenil-csoport, (3-6 szénatomos alkenil)-oxi-csoport, hidrox-(3-6 szénatomos alkenil)-csoport, (1-6 szénatomos alkoxi)-(2-6 szénatomos alkenil)-csoport, [(1-6 szénatomos alkoxi)-(3-6 szénatomos alkenil)]-oxi-csoport, (2-6 szénatomos alkenil)-karbonil-csoport, 2-6 szénatomos alkenil-tio-csoport, 2-6 szénatomos alkenil-szulfonil-csoport,



2-6 szénatomos alkenil-szulfonil-csoport, mono- vagy di-(2-6 szénatomos alkenil)-amino-csoport, *N*-(1-6 szénatomos alkil)-*N*-(3-6 szénatomos alkenil)-amino-csoport, [(2-6 szénatomos alkenil)-karbonil]-amino-csoport, *N*-[(2-6 szénatomos alkenil)-karbonil]-*N*-(1-6 szénatomos alkil)-amino-csoport, 2-6 szénatomos alkinilcsoport, (3-6 szénatomos alkinil)-oxi-csoport, hidroxil-(3-6 szénatomos alkinil)-csoport, (1-6 szénatomos alkoxi)-(2-6 szénatomos alkinil)-csoport, [(1-6 szénatomos alkoxi)-(3-6 szénatomos alkinil)]-oxi-csoport, (2-6 szénatomos alkinil)-karbonil-csoport, 2-6 szénatomos alkinil-tio-csoport, 2-6 szénatomos alkinil-szulfinil-csoport, 2-6 szénatomos alkinil-szulfonil-csoport, mono- vagy di(2-6 szénatomos alkinil)-amino-csoport, *N*-(1-6 szénatomos alkil)-*N*-(3-6 szénatomos alkinil)-amino-csoport, [(2-6 szénatomos alkinil)-karbonil]-amino-csoport vagy *N*-[(2-6 szénatomos alkinil)-karbonil]-*N*-(1-6 szénatomos alkil)-amino-csoport; és/vagy a fenilcsoport, a naftilcsoport és az öt- vagy hattagú aromás csoport adott esetben a következő csoportokkal szubsztituált lehet: halogén-szubsztituált 1-6 szénatomos alkilcsoport, 1-6 szénatomos alkoxicssoport, hidroxil-(1-6 szénatomos alkil)-csoport, (1-6 szénatomos alkoxi)-(1-6 szénatomos alkil)-csoport, (1-6 szénatomos alkoxi)-(1-6 szénatomos alkil)-csoport, (1-6 szénatomos alkil)-karbonil-csoport, 1-6 szénatomos alkil-tio-csoport, 1-6 szénatomos alkil-szulfinil-csoport, 1-6 szénatomos alkil-szulfonil-csoport, mono(1-6 szénatomos alkil)-amino-csoport,



di(1-6 szénatomos alkil)-amino-csoport, [(1-6 szénatomos alkil)-karbonil]-amino-csoport, *N*[(1-6 szénatomos alkil)-karbonil]-*N*-(1-6 szénatomos alkil)-amino-csoport, 2-6 szénatomos alkenilcsoport, (3-6 szénatomos alkenil)-oxi-csoport, hidroxil-(3-6 szénatomos alkenil)-csoport, (1-6 szénatomos alkoxi)-(2-6 szénatomos alkenil)-csoport, [(1-6 szénatomos alkoxi)-(3-6 szénatomos alkenil)]-oxi-csoport, (2-6 szénatomos alkenil)-karbonil-csoport, 2-6 szénatomos alkenil-tio-csoport, 2-6 szénatomos alkenil-szulfonil-csoport, mono- vagy di(2-6 szénatomos alkenil)-amino-csoport, *N*-(1-6 szénatomos alkil)-*N*-(3-6 szénatomos alkenil)-amino-csoport, [(2-6 szénatomos alkenil)-karbonil]-amino-csoport, *N*[(2-6 szénatomos alkenil)-karbonil]-*N*-(1-6 szénatomos alkil)-amino-csoport, 2-6 szénatomos alkinilcsoport, (3-6 szénatomos alkinil)-oxi-csoport, hidroxil-(3-6 szénatomos alkinil)-csoport, (1-6 szénatomos alkoxi)-(2-6 szénatomos alkinil)-csoport, [(1-6 szénatomos alkoxi)-(3-6 szénatomos alkinil)]-oxi-csoport, (2-6 szénatomos alkinil)-karbonil-csoport, 2-6 szénatomos alkinil-tio-csoport, 2-6 szénatomos alkinil-szulfonil-csoport, mono- vagy di(2-6 szénatomos alkinil)-amino-csoport, *N*-(1-6 szénatomos alkil)-*N*-(3-6 szénatomos alkinil)-amino-csoport, [(2-6 szénatomos alkinil)-karbonil]-amino-csoport vagy *N*[(2-6 szénatomos alkinil)-karbonil]-*N*-(1-6 szénatomos alkil)-amino-csoport; és/vagy a fenilcsoport, a naftilcsoport és az öt- vagy hattagú

aromás csoport adott esetben a következő csoportokkal szubsztituált lehet: $-\text{COOR}_{50}$, $-\text{CONR}_{51}$, $-\text{SO}_2\text{NR}_{53}\text{R}_{54}$ vagy $-\text{SO}_2\text{OR}_{55}$ általános képletű csoport, ahol

R_{50} , R_{51} , R_{52} , R_{53} , R_{54} és R_{55} mindegyikének jelentése egymástól függetlenül 1-6 szénatomos alkilcsoport, 2-6 szénatomos alkenilcsoport vagy 3-6 szénatomos alkinilcsoport, vagy halogénatommal, hidroxi-, alkoxi-, merkaptó-, amino-, ciano-, nitro-, alkil-tio-, alkil-szulfonil- vagy alkil-szulfonil-csoporttal szubsztituált 1-6 szénatomos alkilcsoport, 2-6 szénatomos alkenilcsoport vagy 3-6 szénatomos alkinilcsoport;

n értéke 1 vagy 2;

R_4 és R_5 azokkal a nitrogénatomokkal együtt, amelyekhez kötődnek, egy telített vagy telítetlen 5-8 tagú heterociklusos gyűrűt képeznek, amely

1) adott esetben oxigén-, kénatommal vagy $>\text{NR}_{14}$ általános képletű csoporttal van megszakítva és/vagy adott esetben halogénatommal, 1-10 szénatomos alkilcsoporttal, 1-10 szénatomos halogén-alkil-csoporttal, hidroxics csoporttal, 1-6 szénatomos alkoxics csoporttal, (1-6 szénatomos alkoxi)-(1-6 szénatomos alkoxi)-csoporttal, 1-6 szénatomos halogén-alkoxi-csoporttal, merkaptocsoporttal, 1-6 szénatomos alkil-tio-csoporttal, 3-7 szénatomos cikloalkilcsoporttal, heteroarilcsoporttal, heteroaril-(1-6 szénatomos alkil)-csoporttal, fenilcsoporttal, fenil-(1-6 szénatomos alkil)-csoporttal vagy benzil-oxi-csoporttal szubsztituált,

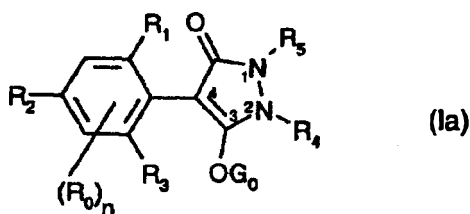
ahol az utóbbi három szubsztituens fenilcsoportja adott esetben halogénatommal, 1-6 szénatomos alkilcsoporttal, 1-6 szénatomos halogén-alkil-csoporttal, 1-6 szénatomos alkoxicssoporttal, 1-6 szénatomos halogén-alkoxi-csoporttal vagy nitrocsoporttal szubsztituált, és/vagy

2) egy kondenzált vagy spiro-kötött 2-6 szénatomos, adott esetben oxigén- vagy kénatommal megszakított alkilén- vagy alkenilénláncot tartalmazhat, vagy a telített vagy telítetlen heterociklusos gyűrű legalább egy gyűrűatomja köti össze az alkilén- vagy alkenilénláncot;

R_{14} jelentése hidrogénatom, 1-4 szénatomos alkilcsoport, (1-6 szénatomos alkil)-karbonil-csoport, 1-6 szénatomos alkil-szulfonil-csoport, 3-6 szénatomos alkenilcsoport vagy 3-6 szénatomos alkinilcsoport; és

G jelentése hidrogénatom, egy fémion-ekvivalens vagy egy ammónium-, szulfónium- vagy foszfónium-kation.

18. (Ia) általános képletű vegyületek,



amelyek képletében

R_0 jelentése egymástól függetlenül halogénatom, 1-6 szénatomos alkilcsoport, 2-6 szénatomos alkenilcsoport, 2-6 szénatomos alkinilcsoport, 1-6 szénatomos halogén-alkil-cso-

port, ciano-(1-6 szénatomos alkil)-csoport, 2-6 szénatomos halogén-alkenil-csoport, ciano-(2-6 szénatomos alkenil)-csoport, 2-6 szénatomos halogén-alkinil-csoport, ciano-(2-6 szénatomos alkinil)-csoport, hidroxics csoport, 1-6 szénatomos hidroxil-alkil-csoport, 1-6 szénatomos alkoxil-csoport, nitro-, aminocsoport, 1-6 szénatomos alkil-amino-csoport, di(1-6 szénatomos alkil)-amino-csoport, [(1-6 szénatomos alkil)-karbonil]-amino-csoport, [(1-6 szénatomos alkil)-szulfonil]-amino-csoport, [(1-6 szénatomos alkil)-amino]-szulfonil-csoport, (1-6 szénatomos alkil)-karbonil-csoport, [(1-6 szénatomos alkil)-karbonil]-(1-6 szénatomos alkil)-csoport, [(1-6 szénatomos alkoxi)-karbonil]-(1-6 szénatomos alkil)-csoport, [(1-6 szénatomos alkil)-karbonil]-(2-6 szénatomos alkenil)-csoport, [(1-6 szénatomos alkoxi)-karbonil]-(2-6 szénatomos alkenil)-csoport, [(1-6 szénatomos alkil)-karbonil]-(2-6 szénatomos alkinil)-csoport, [(1-6 szénatomos alkoxi)-karbonil]-(2-6 szénatomos alkinil)-csoport, (1-6 szénatomos alkoxi)-karbonil-csoport, ciano-, karboxilcsoport, fenilcsoport vagy aromás csoport, amely a nitrogén-, az oxigén- és a kénatom közül kiválasztott 1 vagy 2 heteroatomot tartalmaz, ahol az utóbbi két aromás csoport adott esetben 1-3 szénatomos alkilcsoporttal, 1-3 szénatomos halogén-alkil-csoporttal, 1-3 szénatomos alkoxilcsoporttal, 1-3 szénatomos alkoxilcsoporttal, 1-3 szénatomos halogén-alkoxil-csoporttal, halogénatommal, ciano- vagy nitrocsoporttal szubsztituált; vagy

R₀ a szomszédos R₁, R₂ és R₃ szubsztituensekkel együtt egy te-

lített vagy telítetlen 3-6 szénatomos szénhidrogénhidat képezhet, amelyet a nitrogén-, oxigén- és kénatom közül kiválasztott egy vagy két heteroatom szakíthat meg és/vagy amely 1-4 szénatomos alkilcsoporttal szubsztituált lehet;

R₁, R₂ és R₃ mindegyikének jelentése egymástól függetlenül hidrogén-, halogénatom, 1-6 szénatomos alkilcsoport, 2-6 szénatomos alkenilcsoport, 2-6 szénatomos alkinilcsoport, 3-6 szénatomos cikloalkilcsoport, 1-6 szénatomos halogén-alkil-csoport, 2-6 szénatomos halogén-alkenil-csoport, [(1-6 szénatomos alkoxi)-karbonil]-(2-6 szénatomos alkenil)-csoport, [(1-6 szénatomos alkil)-karbonil]-(2-6 szénatomos alkenil)-csoport, ciano-(2-6 szénatomos alkenil)-csoport, nitro-(2-6 szénatomos alkenil)-csoport, 2-6 szénatomos halogén-alkinil-csoport, [(1-6 szénatomos alkoxi)-karbonil]-(2-6 szénatomos alkinil)-csoport, [(1-6 szénatomos alkil)-karbonil]-(2-6 szénatomos alkinil)-csoport, ciano-(2-6 szénatomos alkinil)-csoport, nitro-(2-6 szénatomos alkinil)-csoport, 3-6 szénatomos halogén-cikloalkil-csoport, hidroxil-(1-6 szénatomos alkil)-csoport, (1-6 szénatomos alkoxi)-(1-6 szénatomos alkil)-csoport, [(1-6 szénatomos alkil)-tio]-(1-6 szénatomos alkil)-csoport, cianocsoport, (1-4 szénatomos alkil)-karbonil-csoport, (1-6 szénatomos alkoxi)-karbonil-csoport, hidroxil-csoport, 1-10 szénatomos alkoxicssoport, 3-6 szénatomos alkenil-oxi-csoport, 3-6 szénatomos alkinil-oxi-csoport, 1-6 szénatomos halogén-alkoxi-csoport, 3-6 szénatomos (halogén-alkenil)-oxi-csoport, (1-6 szénatomos alkoxi)-(1-6

szénatomos alkoxi)-csoport, merkaptocsoport, 1-6 szénatomos alkil-tio-csoport, 1-6 szénatomos (halogén-alkil)-tio-csoport, 1-6 szénatomos alkil-szulfinil-csoport, 1-6 szénatomos alkil-szulfonil-csoport, nitro-, aminocsoport, 1-6 szénatomos alkil-amino-csoport, di(1-6 szénatomos alkil)-amino-csoport vagy fenoxicssoport, amelyben a fenilcsoport adott esetben 1-3 szénatomos alkilcsoporttal, 1-3 szénatomos halogén-alkil-csoporttal, 1-3 szénatomos alkoxicssoporttal, 1-3 szénatomos halogén-alkoxi-csoporttal, halogénatommal ciano- vagy nitrocsoporttal szubsztituált;

R₂ jelentése ezenkívül fenilcsoport, naftilcsoport vagy egy öt- vagy hattagú aromás csoport, amely a nitrogén-, oxigén- és kénatom közül kiválasztott egy vagy két heteroatomot tartalmazhat, ahol a fenilcsoport, a naftilcsoport és az öt- vagy hattagú aromás csoport adott esetben halogénatommal, 3-8 szénatomos cikloalkilcsoporttal, hidrox-, merkapt-, amino-, ciano-, nitro- vagy formilcsoporttal szubsztituált lehet; és/vagy

a fenilcsoport, a naftilcsoport és az öt- vagy hattagú aromás csoport adott esetben a következő csoportokkal szubsztituált lehet: 1-6 szénatomos alkilcsoport, 1-6 szénatomos alkoxicssoport, hidrox-(1-6 szénatomos alkil)-csoport, (1-6 szénatomos alkoxi)-(1-6 szénatomos alkil)-csoport, (1-6 szénatomos alkoxi)-(1-6 szénatomos alkoxi)-csoport, (1-6 szénatomos alkil)-karbonil-csoport, 1-6 szénatomos alkil-tio-csoport, 1-6 szénatomos alkil-szulfinil-csoport, 1-6 szénatomos alkil-szulfonil-csoport, mono-

(1-6 szénatomos alkil)-amino-csoport, di(1-6 szénatomos alkil)-amino-csoport, [(1-6 szénatomos alkil)-karbonil]-amino-csoport, *N*-[(1-6 szénatomos alkil)-karbonil]-*N*-(1-6 szénatomos alkil)-amino-csoport, 2-6 szénatomos alkenil-csoport, (3-6 szénatomos alkenil)-oxi-csoport, hidroxii-(3-6 szénatomos alkenil)-csoport, (1-6 szénatomos alkoxi)-(2-6 szénatomos alkenil)-csoport, [(1-6 szénatomos alkoxi)-(3-6 szénatomos alkenil)]-oxi-csoport, (2-6 szénatomos alkenil)-karbonil-csoport, 2-6 szénatomos alkenil-tio-csoport, 2-6 szénatomos alkenil-szulfonil-csoport, 2-6 szénatomos alkenil-szulfonil-csoport, mono- vagy di(2-6 szénatomos alkenil)-amino-csoport, *N*-(1-6 szénatomos alkil)-*N*-(3-6 szénatomos alkenil)-amino-csoport, [(2-6 szénatomos alkenil)-karbonil]-amino-csoport, *N*-[(2-6 szénatomos alkenil)-karbonil]-*N*-(1-6 szénatomos alkil)-amino-csoport, 2-6 szénatomos alkinilcsoport, (3-6 szénatomos alkinil)-oxi-csoport, hidroxii-(3-6 szénatomos alkinil)-csoport, (1-6 szénatomos alkoxi)-(2-6 szénatomos alkinil)-csoport, [(1-6 szénatomos alkoxi)-(3-6 szénatomos alkinil)]-oxi-csoport, (2-6 szénatomos alkinil)-karbonil-csoport, 2-6 szénatomos alkinil-tio-csoport, 2-6 szénatomos alkinil-szulfonil-csoport, 2-6 szénatomos alkinil-szulfonil-csoport, mono- vagy di(2-6 szénatomos alkinil)-amino-csoport, *N*-(1-6 szénatomos alkil)-*N*-(3-6 szénatomos alkinil)-amino-csoport, [(2-6 szénatomos alkinil)-karbonil]-amino-csoport vagy *N*-[(2-6 szénatomos alkinil)-karbonil]-*N*-(1-6 szénatomos alkil)-amino-csoport; és/vagy



a fenilcsoport, a naftilcsoport és az öt- vagy hattagú aromás csoport adott esetben a következő csoportokkal szubsztituált lehet: halogén-szubsztituált 1-6 szénatomos alkilcsoport, 1-6 szénatomos alkoxics csoport, hidrox-(1-6 szénatomos alkil)-csoport, (1-6 szénatomos alkoxi)-(1-6 szénatomos alkil)-csoport, (1-6 szénatomos alkoxi)-(1-6 szénatomos alkil)-csoport, (1-6 szénatomos alkoxi)-(1-6 szénatomos alkil)-csoport, (1-6 szénatomos alkil)-karbonil-csoport, 1-6 szénatomos alkil-tio-csoport, 1-6 szénatomos alkil-szulfinil-csoport, 1-6 szénatomos alkil-szulfonil-csoport, mono(1-6 szénatomos alkil)-amino-csoport, di(1-6 szénatomos alkil)-amino-csoport, [(1-6 szénatomos alkil)-karbonil]-amino-csoport, N-[(1-6 szénatomos alkil)-karbonil]-N-(1-6 szénatomos alkil)-amino-csoport, 2-6 szénatomos alkenilcsoport, (3-6 szénatomos alkenil)-oxi-csoport, hidrox-(3-6 szénatomos alkenil)-csoport, (1-6 szénatomos alkoxi)-(2-6 szénatomos alkenil)-csoport, [(1-6 szénatomos alkoxi)-(3-6 szénatomos alkenil)]-oxi-csoport, (2-6 szénatomos alkenil)-karbonil-csoport, 2-6 szénatomos alkenil-tio-csoport, 2-6 szénatomos alkenil-szulfinil-csoport, 2-6 szénatomos alkenil-szulfonil-csoport, mono- vagy di(2-6 szénatomos alkenil)-amino-csoport, N-(1-6 szénatomos alkil)-N-(3-6 szénatomos alkenil)-amino-csoport, [(2-6 szénatomos alkenil)-karbonil]-amino-csoport, N-[(2-6 szénatomos alkenil)-karbonil]-N-(1-6 szénatomos alkil)-amino-csoport, 2-6 szénatomos alkinilcsoport, (3-6 szénatomos alkinil)-oxi-csoport, hidrox-(3-6 szénatomos alkinil)-csoport, (1-6 szénatomos alkoxi)-(2-6 szénatomos alki-

nil)-csoport, [(1-6 szénatomos alkoxi)-(3-6 szénatomos alkinil)]-oxi-csoport, (2-6 szénatomos alkinil)-karbonil-csoport, 2-6 szénatomos alkinil-tio-csoport, 2-6 szénatomos alkinil-szulfinil-csoport, 2-6 szénatomos alkinil-szulfonyl-csoport, mono- vagy di(2-6 szénatomos alkinil)-amino-csoport, *N*-(1-6 szénatomos alkil)-*N*-(3-6 szénatomos alkinil)-amino-csoport, [(2-6 szénatomos alkinil)-karbonil]-amino-csoport vagy *N*-[(2-6 szénatomos alkinil)-karbonil]-*N*-(1-6 szénatomos alkil)-amino-csoport; és/vagy a fenilcsoport, a naftilcsoport és az öt- vagy hattagú aromás csoport adott esetben a következő csoportokkal szubsztituált lehet: -COOR₅₀, -CONR₅₁, -SO₂NR₅₃R₅₄ vagy -SO₂OR₅₅ általános képletű csoport, ahol

R₅₀, R₅₁, R₅₂, R₅₃, R₅₄ és R₅₅ mindegyikének jelentése egymástól függetlenül 1-6 szénatomos alkilcsoport, 2-6 szénatomos alkenilcsoport vagy 3-6 szénatomos alkinilcsoport, vagy halogénatommal, hidroxil-, alkoxil-, merkaptol-, aminos-, ciano-, nitro-, alkil-tio-, alkil-szulfinil- vagy alkil-szulfonyl-csoporttal szubsztituált 1-6 szénatomos alkilcsoport, 2-6 szénatomos alkenilcsoport vagy 3-6 szénatomos alkinilcsoport;

n értéke 1 vagy 2;

R₄ és R₅ azokkal a nitrogénatomokkal együtt, amelyekhez kötődnek, egy telített vagy telítetlen 5-8 tagú heterociklusos gyűrűt képeznek, amely

1) adott esetben oxigén-, kénatommal vagy >NR₁₄ általános

képletű csoporttal van megszakítva és/vagy adott esetben halogénatommal, 1-10 szénatomos alkilcsoporttal, 1-10 szénatomos halogén-alkil-csoporttal, hidroxicssoporttal, 1-6 szénatomos alkoxicssoporttal, (1-6 szénatomos alkoxi)-(1-6 szénatomos alkoxi)-csoporttal, 1-6 szénatomos halogén-alkoxi-csoporttal, merkaptocsoporttal, 1-6 szénatomos alkil-tio-csoporttal, 3-7 szénatomos cikloalkilcsoporttal, heteroarilcsoporttal, heteroaril-(1-6 szénatomos alkil)-csoporttal, fenilcsoporttal, fenil-(1-6 szénatomos alkil)-csoporttal vagy benzil-oxi-csoporttal szubsztituált, ahol az utóbbi három szubsztituens fenilcsoportja adott esetben halogénatommal, 1-6 szénatomos alkilcsoporttal, 1-6 szénatomos halogén-alkil-csoporttal, 1-6 szénatomos alkoxicssoporttal, 1-6 szénatomos halogén-alkoxi-csoporttal vagy nitrocsoporttal szubsztituált, és/vagy

2) egy kondenzált vagy spiro-kötött 2-6 szénatomos, adott esetben oxigén- vagy kénatommal megszakított alkilén- vagy alkenilénláncot tartalmazhat, vagy a telített vagy telítetlen heterociklusos gyűrű legalább egy gyűrűatomja köti össze az alkilén- vagy alkenilénláncot;

R_{14} jelentése hidrogénatom, 1-4 szénatomos alkilcsoport, (1-6 szénatomos alkil)-karbonil-csoport, 1-6 szénatomos alkil-szulfonil-csoport, 3-6 szénatomos alkenilcsoport vagy 3-6 szénatomos alkinilcsoport; és

G_0 jelentése $-C(O)-R_{30}$, $-C(X_1)-X_2-R_{31}$, $-C(X_3)-N(R_{32})-R_{33}$, $-SO_2-R_{34}$ vagy $-P(X_4)(R_{35})-R_{36}$ általános képletű csoport;



X_1 , X_2 , X_3 és X_4 mindegyikének jelentése egymástól függetlenül oxigén- vagy kénatom;

R_{30} jelentése adott esetben halogénatommal szubsztituált 1-20 szénatomos alkilcsoport, 2-20 szénatomos alkenilcsoport, (1-8 szénatomos alkoxi)-(1-8 szénatomos alkil)-csoport, [(1-8 szénatomos alkil)-tio]-(1-8 szénatomos alkil)-csoport, [poli(1-10 szénatomos alkoxi)]-(1-8 szénatomos alkil)-csoport, vagy adott esetben halogénatommal szubsztituált 3-8 szénatomos cikloalkilcsoport, (3-6 szénatomos cikloalkil)-(1-6 szénatomos alkil)-csoport, heterociklil-(1-6 szénatomos alkil)-csoport, heteroaril-(1-6 szénatomos alkil)-csoport, adott esetben halogénatommal, ciano-, nitrocsoporttal, 1-6 szénatomos alkilcsoporttal, 1-6 szénatomos alkoxicsoporttal, 1-6 szénatomos halogén-alkil-csoporttal, 1-6 szénatomos halogén-alkoxi-csoporttal, 1-6 szénatomos alkil-tio-csoporttal vagy 1-6 szénatomos alkil-szulfonil-csoporttal szubsztituált fenilcsoport, adott esetben halogénatommal, ciano-, nitrocsoporttal, 1-6 szénatomos alkilcsoporttal, 1-6 szénatomos alkoxicsoporttal, 1-6 szénatomos halogén-alkil-csoporttal vagy 1-6 szénatomos halogén-alkoxi-csoporttal szubsztituált fenil-(1-6 szénatomos alkil)-csoport, adott esetben halogénatommal vagy 1-6 szénatomos alkilcsoporttal szubsztituált heteroarilcsoport, adott esetben halogénatommal vagy 1-6 szénatomos alkilcsoporttal szubsztituált fenoxi-(1-6 szénatomos alkil)-csoport, vagy adott esetben halogénatommal, aminocsoporttal vagy 1-6 szénatomos alkilcsoporttal

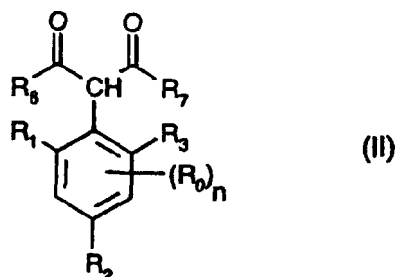


szubsztituált (heteroaril-oxi)-(1-6 szénatomos alkil)-csoport;

R₃₁ jelentése adott esetben halogénatommal szubsztituált 1-20 szénatomos alkilcsoport, 2-20 szénatomos alkenilcsoport, (1-8 szénatomos alkoxi)-(2-8 szénatomos alkil)-csoport, [poli(1-8 szénatomos alkoxi)]-(2-8 szénatomos alkil)-csoport, vagy adott esetben halogénatommal vagy 1-6 szénatomos alkoxicsoporttal szubsztituált 3-8 szénatomos cikloalkilcsoport, (3-6 szénatomos cikloalkil)-(1-6 szénatomos alkil)-csoport, heterociklil-(1-6 szénatomos alkil)-csoport, heteroaril-(1-6 szénatomos alkil)-csoport, adott esetben halogénatommal, ciano-, nitrocsoporttal, 1-6 szénatomos alkilcsoporttal, 1-6 szénatomos alkoxicsoporttal, 1-6 szénatomos halogén-alkil-csoporttal vagy 1-6 szénatomos halogén-alkoxi-csoporttal szubsztituált fenil- vagy benzilcsoport; és

R₃₄ jelentése adott esetben halogénatommal szubsztituált 1-8 szénatomos alkilcsoport, vagy adott esetben halogénatommal, 1-6 szénatomos alkilcsoporttal, 1-6 szénatomos alkoxicsoporttal, 1-4 szénatomos halogén-alkil-csoporttal, 1-4 szénatomos halogén-alkoxi-csoporttal, ciano- vagy nitrocsoporttal szubsztituált fenilcsoport.

19. (II) általános képletű vegyületek,



amelyek képletében R_0 , R_1 , R_2 , R_3 , R_6 és R_7 jelentése, valamint n értéke az 1. igénypontban meghatározott.

20. Egy 19. igénypont szerinti (II) általános képletű vegyület, amelyben R_1 , R_2 és R_3 mindegyikének jelentése egymástól függetlenül hidrogén-, halogénatom, 1-4 szénatomos alkilcsoport, 1-4 szénatomos halogén-alkil-csoport, 2-4 szénatomos alkenilcsoport, 2-4 szénatomos halogén-alkenil-csoport, 2-4 szénatomos alkinilcsoport, 3-6 szénatomos cikloalkilcsoport, (1-4 szénatomos alkil)-karbonil-csoport, (1-6 szénatomos alkoxi)-karbonil-csoport, hidroxicssoport, 1-4 szénatomos alkoxicssoport, 3-4 szénatomos alkenil-oxi-csoport, 3-4 szénatomos alkinil-oxi-csoport, 1-4 szénatomos halogén-alkoxi-csoport, nitro- vagy aminocsoport.

21. Egy 19. igénypont szerinti (II) általános képletű vegyület, amelyben R_1 jelentése 2-6 szénatomos alkilcsoport.

22. Egy 19. igénypont szerinti (II) általános képletű vegyület, amelyben n értéke 0.

23. Egy 22. igénypont szerinti (II) általános képletű vegyület, amelyben R_1 jelentése 2-4 szénatomos alkilcsoport, 1-4 szénatomos alkoxicssoport, 2-4 szénatomos alkinilcsoport vagy 3-6 szénatomos cikloalkilcsoport, és R_3 jelentése 1-4 szénatomos alkilcsoport, 1-4 szénatomos alkoxicssoport, 2-4 szénatomos



alkinilcsoport vagy 3-6 szénatomos cikloalkilcsoport.

24. Egy 19. igénypont szerinti (II) általános képletű vegyület, amelyben R_1 jelentése 2-6 szénatomos alkinilcsoport.

25. Egy 19. igénypont szerinti (II) általános képletű vegyület, amelyben R_1 és R_3 mindegyikének jelentése egymástól függetlenül 2-6 szénatomos alkilcsoport, 2-6 szénatomos alkinilcsoport, 1-10 szénatomos alkoxicssoport vagy 3-6 szénatomos cikloalkilcsoport.

26. Egy 25. igénypont szerinti (II) általános képletű vegyület, amelyben R_1 jelentése 2-6 szénatomos alkilcsoport, és R_3 jelentése 2-6 szénatomos alkilcsoport, 2-6 szénatomos alkinilcsoport vagy 1-10 szénatomos alkoxicssoport.

27. Egy 19. igénypont szerinti (II) általános képletű vegyület, amelyben

R_6 jelentése $R_8R_9N^-$ általános képletű csoport, R_7 jelentése $R_{10}R_{11}N^-$ általános képletű csoport, valamint R_8 , R_9 , R_{10} és R_{11} jelentése a fentiekben meghatározott.

+rajz mell

SW

A meghatalmazott:


Pál Zoltán
Közvetítői Ügyvéd
2025.07.03. Szabadalmi Ügyvédi Iroda
tagja
H-1062 Budapest, Andrássy út 113.
Telefon: 461-7000 Fax: 461-1099