

(19) H U

SZABADALMI LEÍRÁS

(11)
199430 B



MAGYAR
KÖZTÁRSASÁG
ORSZÁGOS
TALÁLMÁNYI
HIVATAL

(22) Bejelentés napja: 1987.12.23. (21) 5989/87

(30) Bejelentés elsőbbsége:
5256/86—8 86.12.24. CH
86 31 019 86.12.30. GB

(51) Int.Cl.₅
C 07 D 233/54;
C 07 D 403/04;
C 07 D 413/04;
C 07 D 417/04;
A 01 N 43/50;
A 01 N 43/54;
A 01 N 43/713;
A 01 N 43/72;
A 01 N 43/82.

(41) (42) Közzététel napja: 1988.11.28.
(45) Megadás meghirdetésének dátuma
a Szabadalmi Közlönyben: 1990.02.28.

(72) Feltalálók:
DE BRUYN Marcel Frans Leopold, Hoog-
straten,
VAN LOMMEN Guy Rosalia Eugène
Berlaar (BE)
LUTZ R. William, Riehen (CH)

(71) Bejelentő:
Janssen Pharmaceutica N.V. Beerse
(BE)

(54) HATÓANYAGKÉNT 1H-IMIDAZOL-SZÁRMAZÉKOKAT TARTALMAZÓ HERBICID SZEREK ÉS ELJÁRÁS A VEGYÜLETEK ELŐÁLLÍTÁSÁRA

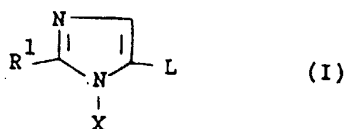
(57) KIVONAT

A találmány szerint alkalmazható 1H-imidazol-származékok (I) általános képletében

R¹ jelentése hidrogénatom vagy merkaptocsoport;

L jelentése 5—6 tagú heterociklusos gyűrű, amely heteroatomként egy oxigénatomot és/vagy 1—4 nitrogénatomot tartalmazhat és amely adott esetben benzolgyűrűvel anellálva és szubsztituálva lehet, valamint oxigénatommal, karbonil-, tiokarbonilcsoporttal vagy adott esetben szubsztituált nitrogénatommal egyszeresen vagy többszörösen megszakított nyílt szénláncú szénhidrogén-csoport,

X jelentése adott esetben egyszeresen vagy többszörösen szubsztituált 1—2 gyűrűs telített vagy telítetlen csoport, amely adott esetben heteroatomként egy oxigénatomot vagy kénatomot tartalmaz, X jelenthet még fenil-alkil-csoportot is.



HU 199430 B

A leírás terjedelme: 55 oldal, 39 képlet

A találmány tárgya hatóanyagként 1H-imidazol-5-karbonsav-származékokat tartalmazó herbicid szer és eljárás a vegyületek előállítására.

A 3 485 917. számú USA-beli szabadalmi leírásból ismert, hogy bizonyos 1H-imidazol-5-karbonsav-származékok fungicid hatással rendelkeznek. A 3 873 297. számú USA-beli szabadalmi leírásból ismert, hogy a fenti vegyületek közül néhány felhasználható a rügnövekedés gátlására. A 3 354 173., 3 336 326., 4 038 286. és 3 991 072. számú USA-beli szabadalmi leírások 1H-imidazol-5-karbonsav-észter és amid-származékokat ismertetnek, amelyek hipnotikus hatással rendelkeznek. A 4 182 624. számú USA-beli szabadalmi leírás szerint más 1H-imidazol-karbonsavak növény-növekedésszabályozóként, fungicidként és herbicidként alkalmazhatók. Bizonyos 1H-imidazol-5-karbonsav-származékokat és ezek növekedésgátló hatását ismerteti a 0185 961. és 0219 798. számú európai közrebecsátási irat.

Azt találtuk, hogy az (I) általános képletű 1H-imidazol-5-karbonsav-származékok vagy ezek sztereokémiai izomer formái vagy sói kiváló herbicid hatással rendelkeznek, a képletben

R¹ jelentése hidrogénatom vagy merkaptocsoport,

L jelentése cianocsoport, (a), (b), (d), (e), (f), (g'), (h'), (i) vagy (j) általános képletű csoport, ezekben a képletekben

E jelentése oxigénatom vagy $\begin{array}{c} | \\ \text{N} \\ | \\ \text{R} \end{array}$ képletű

csoport,

R jelentése hidrogénatom vagy 1—4 szénatomos alkilcsoport,

R⁴ jelentése trifluor-metil-csoport,

G jelentése oxigénatom vagy kénatom,

G¹ jelentése oxigénatom,

D jelentése kénatom, -N-, -N-O- vagy



-NH-NH- képletű csoport,

R² jelentése hidrogénatom, 1—5 szénatomos alkil-, 3—5 szénatomos alkenil-, 3—5 szénatomos alkinil-, (1—4 szénatomos alkil)-karbonil- vagy 3—7 szénatomos cikloalkilcsoport vagy fenil-, hidroxil-, 1—4 szénatomos alkoxi- vagy (1—4 szénatomos alkil)-karbonil-oxi-csoporttal monoszubsztituált 1—5 szénatomos alkilcsoport,

R³ jelentése hidrogénatom vagy 1—5 szénatomos alkilcsoport, vagy

R² és R³ együtt a kapcsolódó nitrogénatommal imidazolilcsoportot vagy egy vagy kettő 1—4 szénatomos alkilcsoporttal adott esetben szubsztituált pirrolidino-, piperidino-, morfolino- vagy tiomorfolinocsoportot vagy a 4-helyzetben 1—4 szénatomos alkil-, (1—4 szénatomos alkil)-karbamoil-csoporttal adott esetben

szubsztituált piperazinocsoportot is jelenthet,

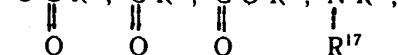
R^{3'} jelentése hidrogénatom, 1—4 szénatomos alkil- vagy fenil- (1—4 szénatomos alkil)-csoport,

R⁵ jelentése fenilcsoport vagy $\text{N}=\text{C}-\text{R}^{14}$

|

R¹⁵

általános képletű csoport, vagy halogénatommal, ciano-, 3—7 szénatomos cikloalkil- vagy hidroxilcsoporttal vagy



R¹⁹

O

-Si-R²⁰, -S-R¹⁹ vagy $\begin{array}{c} \text{O} \\ || \\ \text{P}-\text{OR}^{16} \end{array}$ általános

R²¹

R²²

képletű csoporttal monoszubsztituált 1—4 szénatomos alkilcsoport, ezekben a képletekben

R¹⁴, R¹⁵, R¹⁶, R¹⁷, R¹⁹, R²⁰ és R²¹ jelentése 1—4 szénatomos alkilcsoport vagy

R¹⁴ és R¹⁵ együtt 4—6 szénatomos alkilcsoportot jelent,

R¹⁶ és R¹⁷ együtt 3—6 szénatomos alkilcsoportot jelent,

R²² jelentése 1—4 szénatomos alkoxi-csoport,

X jelentése 9H-fluoren-9-il-, 4,5,6,7-tetrahidro-4-benzo(b)tienil-, 4-tiokromanil- vagy 2,3-dihidro-2,2-di-(1—4 szénatomos alkil)-3-benzo(b)fúril-csoport vagy (aa'), (ab'), (k'), vagy -CH-Z általános képletű

A

csoport, ezekben a képletekben

R⁶ és R⁷ jelentése hidrogénatom vagy 1—4 szénatomos alkilcsoport vagy a kettő együtt gem-helyzetben kapcsolódó 3—6 szénatomos spirocikloalkángyűrű vagy vic-helyzetben kapcsolódó 1—4 szénatomos alkilcsoport vagy ha X (ab') képletű csoport, akkor R⁶ és R⁷ együtt diszj-helyzetben kapcsolódó 1—4 szénatomos alkilcsoportot is jelenthet.

R^{6'} jelentése hidrogénatom, 1—4 szénatomos alkil- vagy fenil- (1—4 szénatomos alkil)-csoport, vagy

R^{6'} és R⁷ együtt vic-helyzetben kapcsolódó 1—4 szénatomos alkilcsoport,

R¹⁰ jelentése hidrogén- vagy halogénatom,

A jelentése hidrogénatom, 2-piridil-, 1-naftil-, 3—7 szénatomos cikloalkil-, 1—6 szénatomos alkilcsoport vagy alkilrészen 1—4 szénatomos alkoxycsoporttal adott esetben monoszubsztituált fenil- (1—4 szénatomos alkil)-csoport.

Z jelentése halogénatommal vagy 1—4 szénatomos alkilcsoporttal adott esetben monoszubsztituált fenilcsoport, azzal a megkötéssel, hogy

— L jelentése ciano-, karbamoil- vagy halogén-alkoxi-karbonil-csoporttól eltérő, ha X jelentése 1-fenil-etil-csoport,

— L jelentése dialkil-amino-alkoxi-karbonil-csoporttól eltérő, ha X jelentése 1-indanil- vagy 1,2,3,4-tetrahidro-1-naftil-csoport.

Meglepő módon az (I) általános képletű vegyületek erős herbicid hatással rendelkeznek és felhasználhatók gyomok irtására. Előnyös tulajdonságuk, hogy nagy dózis esetén sem, vagy csak kismértékben károsítják a hasznos kultúrnövényeket. Az (I) általános képletű vegyületek tehát értékes szelektív herbicidek olyan kultúrnövények esetén, mint cukorrépa, repce, szójabab, gyapot, napraforgó, gabonafélék, így búza, árpa, rozs és zab, valamint rizs és kukorica. Különösen széles koncentrációtartományban használható rizs, elsősorban átültetett rizs esetén, amelynek során a hatóanyagot előnyösen átültetés után alkalmazzuk. Kukorica esetén szelektív herbicid hatás érhető el preemergens és posztemergens kezeléssel.

Az (I) általános képletű vegyületeket 0,01—5,0 kg/ha mennyiségben alkalmazzuk. A környezeti körülményektől függően a felső határ szükség esetén túlléphető, előnyösen azonban 0,05—1,0 kg/ha mennyiséget alkalmazunk.

Az általános képlet értelmezésében az 1—5 szénatomos alkilcsoport egyenes vagy elágazó szénláncú telített szénhidrogéncsoportot jelent, ami lehet metilcsoport, etilcsoport, n-propilcsoport, izopropilcsoport, négy izomer butilcsoport és izomer pentilcsoportok az 1—6 szénatomos alkilcsoport jelentésébe beleesnek az 1—5 szénatomos alkilcsoport értelmezésében megadott csoportok, valamint ezek legfeljebb 6 szénatomos homológjai, a halogénatom előnyösen fluor-, klór-, bróm- vagy jódatom, elsősorban fluor- vagy klóratom, a 3—5 szénatomos alkenilcsoport lehet egyenes vagy elágazó szénláncú szénhidrogéncsoport, amely egy kettőskötést tartalmaz, ilyen például a 2-propenil-csoport, 3-butenil-csoport, 2-butenil-csoport, 2-pentenil-csoport, 3-pentenil-csoport, 2-metil-2-propenil-csoport, vagy 3-metil-2-butenil-csoport, elsősorban 2-propenil-csoport vagy 2-metil-2-propenil-csoport, 3—5 szénatomos alkinilcsoport egyenes vagy elágazó szénláncú szénhidrogéncsoport, amely egy hármas kötést tartalmaz, ilyen például a propargilcsoport, 2-butinil-csoport, 3-butinil-csoport, 2-pentinil-csoport, 3-pentinil-csoport vagy 4-pentinil-csoport, elsősorban propargilcsoport, a 3—7 szénatomos cikloalkilcsoport lehet ciklopropilcsoport, ciklobutilcsoport, ciklopentilcsoport, ciklohexilcsoport vagy cikloheptilcsoport, előnyösen ciklopentilcso-

port vagy ciklohexilcsoport és az 1—4 szénatomos alkilcsoport két vegyértékű egyenes vagy elágazó szénláncú telített szénhidrogéncsoport, így például metilcsoport, 1,2-etán-diil-csoport, 1,3-propán-diil-csoport, 1,4-bután-diil-csoport, 1,5-pentán-diil-csoport vagy 1,6-hexán-diil-csoport.

Az X és/vagy L csoport jelentéséből függően az (I) általános képletű vegyületek aszimmetrikus szénatomot tartalmazhatnak. Ellenkező értelmű megjelölés hiányában a vegyület kémiai megnevezése alatt a lehetséges sztereokémiai izomerformák elegyét értjük, amely elegyek tartalmazzák az összes diasztereomert és enantiomert.

A királis centrumok abszolút konfigurációja R és S jellel azonosítható (Pure Appl. Chem. 45, 11—30 (1976)). Az aszimmetriacentrumok relatív konfigurációját cisz és transz jellel, és ahol lehet, alfa és beta jellel jelöljük (Chemical Abstracts, 1977, Index Guide, Appendix IV. 203. paragrafus).

Néhány vegyületnél nem határoztuk meg a sztereokémiai konfigurációt. Ez esetben a sztereokémiai izomerformákat az elsőként izolált formánál „A” betűvel, míg a másodiknak izolált formánál „B” betűvel jelöljük, anélkül, hogy az aktuális sztereokémiai konfigurációra utalnánk.

Az (I) általános képletű vegyületek tiszta izomerformái az elegyekből önmagában ismert módon izolálhatók. Adott sztereokémiai forma előállításához előnyösen sztereoszzelektív szintézismódszert alkalmazunk. Ezeknél optikailag aktív kiindulási anyagok tiszta formáiból indulunk ki.

Az oltalmi kör kiterjed az (I) általános képletű vegyületeknek szerves vagy szervetlen savakkal képzett sóira. Savként alkalmazhatók ásványi savak, szulfonsavak, karbonsavak vagy foszforsavak tartalmú savak.

Sóképzéshez ásványi savként alkalmazható hidrogén-fluorid, hidrogén-klorid, hidrogén-bromid, hidrogén-jodid, kénsav, salétromsav, sósav, perklórsav, vagy foszforsav. Előnyösen alkalmazható továbbá szulfonsav, így toluolszulfonsav, benzolszulfonsav, metánszulfonsav vagy trifluor-metánszulfonsav, továbbá karbonsav, így ecetsav, trifluor-ecetsav, benzoészav, valamint foszforsav, foszfonsav és foszfinsav.

Előnyösek azok az (I) általános képletű vegyületek, amelyek képletében

R¹ jelentése a fenti,

L jelentése -C(=G¹)-O-R⁵ képletű csoport, ahol

G¹ jelentése a fenti,

R⁵ jelentése 1—4 szénatomos halogén-alkil-csoport, fenilcsoport, vagy

-N=CR¹⁴R¹⁵ általános képletű csoport, vagy -NR¹⁶R¹⁷, -O-COR¹⁶ csoporttal, 3—7 szénatomos cikloalkilcsoporttal -PO-(OR¹⁶)-R²², -SR¹⁹ csoporttal, szubsztituált 1—4 szénatomos alkilcso-

port, valamint -COOR^{16} vagy cianocsoporttal szubsztituált 1—4 szénatomos alkilcsoport,

R^{14} jelentése 1—4 szénatomos alkilcsoport, R^{15} jelentése 1—4 szénatomos alkilcsoport, R^{16} , R^{17} jelentése egymástól függetlenül 1—4 szénatomos alkilcsoport vagy R^{16} és R^{17} együtt 3—6 szénatomos alkilcsoportot képeznek,

R^{19} , R^{20} és R^{21} jelentése egymástól függetlenül 1—4 szénatomos alkilcsoport, R^{22} jelentése 1—4 szénatomos alkil-oxi-csoport,

X jelentése 4,5,6,7-tetrahidro-4-benzo(b)tienil-csoport, 9H-fluorén-9-il-csoport, vagy (aa') , (ab') , (k') általános képletű csoport vagy -CH(A)-Z általános képletű csoport, ahol

R^6 és R^7 jelentése egymástól függetlenül hidrogénatom, 1—4 szénatomos alkilcsoport vagy

R^6 és R^7 együtt vic-helyzetben kapcsolódó 1—4 szénatomos alkilencsoportot vagy

R^6 és R^7 két geminális szubsztituensként 3—6 szénatomos spirociklusos gyűrűt képezhet,

R^6 és R^7 együtt 1—4 szénatomos alkilencsoportot képeznek,

R^{10} jelentése hidrogénatom vagy halogénatom,

A jelentése hidrogénatom, egyenes vagy elágazó szénláncú 1—6 szénatomos alkilcsoport, valamint benzilcsoport vagy fenetilcsoport, valamint 2-piridil-csoport vagy 1-naftil-csoport,

Z jelentése fenilcsoport, amely szubsztituátlan vagy egy 1—4 szénatomos alkilcsoporttal vagy halogénatommal szubsztituált.

Előnyös (I) általános képletű vegyületek továbbá, amelyek képletében

L jelentése $\text{-C(=G)}^1\text{-O-R}^5$ általános képletű csoporttól eltérő.

Ezen belül előnyösek azok a vegyületek, amelyek képletében

L jelentése $\text{-C(=G)}^1\text{-D-R}^2$ általános képletű csoport.

Előnyösek továbbá azok az (I) általános képletű vegyületek, amelyek képletében

L jelentése cianocsoport, $\text{-C(=O)}^1\text{-D-R}^2$ vagy -COOR^5 általános képletű csoport, ahol

D jelentése -NR^3 vagy $\text{-NR}^3\text{-O-}$ általános képletű csoport,

R^2 jelentése hidrogénatom, 1—5 szénatomos alkilcsoport, 1—5 szénatomos hidroxialkil-csoport, 3—7 szénatomos cikloalkilcsoport, 3—5 szénatomos alkenilcsoport vagy 3—5 szénatomos alkinilcsoport,

R^3 jelentése hidrogénatom vagy 1—5 szénatomos alkilcsoport,

R^3 jelentése hidrogénatom vagy 1—4 szénatomos alkilcsoport,

R^5 jelentése fenilcsoport vagy

$\text{-N=C(R}^{14}\text{)(R}^{15}\text{)}$ általános képletű csoport, ahol

R^{14} és R^{15} jelentése egymástól függetlenül 1—4 szénatomos alkilcsoport,

5 X jelentése 1-indanil-csoport, 1-tetrahidro-naftil-csoport, 4-kromanil-csoport, amelyek adott esetben egy vagy két 1—4 szénatomos alkilcsoporttal vagy 5—6 szénatomos spiroalkandilcsoporttal szubsztituálva lehetnek,

10 A fentiekben belül

L jelentése lehet például cianocsoport, metil-karbamoil-csoport, etil-karbamoil-csoport, karbamoilcsoport, dimetil-karbamoil-csoport, propil-karbamoil-csoport, ciklopropil-karbamoil-csoport, metoxi-karbamoil-csoport, allil-karbamoil-csoport, propargil-karbamoil-csoport, hidroxi-etil-karbamoil-csoport vagy -COOR^5 általános képletű csoport, ahol

20 R^5 jelentése 3-klór-propil-csoport, metoxi-karbonil-metil-csoport, dietoxi-foszfonil-metil-csoport, ciano-metil-csoport, 2,2,2-trifluor-etil-csoport, 1-(metoxi-karbonil)-etil-csoport, vagy $\text{-N=C(CH}_3\text{)}_2$ csoport.

Külön kiemeljük azokat az (I) általános képletű vegyületeket, amelyek képletében

30 R^1 jelentése hidrogénatom,

X jelentése 2,3-dihidro-2,2-dimetil-1H-indén-1-il-csoport, 2,2-dimetil-1-tetrahidronaftil-csoport, 2,3-dimetil-kromán-4-il-csoport vagy 2-metil-kromán-4-il-csoport.

35 A legelőnyösebb vegyületekre példaként megnevezzük a következőket:

N-metil-1-(1,2,3,4-tetrahidro-1-naftil)-1H-imidazol-5-karboxamid, 1-(2,3-dihidro-2,2-dimetil-1H-indenil)-1H-imidazol-5-karboxamid és N-metil-1-(2,3-dihidro-2,2-dimetil-1H-indenil)-1H-imidazol-5-karboxamid.

Az (I) általános képletű vegyületek közül újak azok, amelyek képletében

45 (i) L jelentése cianocsoporttól, -CONH_2 csoporttól vagy R^5 helyén 1—5 szénatomos monohalogén-alkil-csoportot tartalmazó -COOR^5 általános képletű csoporttól eltérő, ha X jelentése 1-fenil-etil-csoport vagy

50 (ii) L jelentése R^5 helyén alkilrészeiben 1—5 szénatomos dialkil-amino-alkil-csoportot tartalmazó -COOR^5 általános képletű csoporttól eltérő, ha X jelentése 1-indanil-csoport, vagy 1,2,3,4-tetrahidro-1-naftil-csoport.

55 Az új vegyületek közül előnyösek azok, amelyek képletében

L jelentése R^5 helyén 1—5 szénatomos monohalogén-alkil-csoportot tartalmazó -COOR^5 általános képletű csoporttól eltérő,

60 ha

X jelentése alkilrészeiben 1—7 szénatomos 1-fenil-alkil-csoport.

L előnyös jelentése tehát cianocsoport, vagy -CO-D-R^2 vagy -COOR^5 általános képletű csoport, ahol

65

- D jelentése $\text{-NR}^3\text{-}$ vagy $\text{-NR}^3\text{-O-}$ általános képletű csoport,
- R^2 jelentése hidrogénatom, 1—5 szénatomos alkilcsoport, 1—4 szénatomos hidroxil-alkil-csoport, 3—7 szénatomos cikloalkil-csoport, 3—5 szénatomos alkenilcsoport vagy 3—5 szénatomos alkinilcsoport
- R^3 jelentése hidrogénatom vagy 1—5 szénatomos alkilcsoport,
- R^3 jelentése hidrogénatom vagy 1—4 szénatomos alkilcsoport,
- R^5 jelentése fenilcsoport, valamint $\text{-N}=\text{C}(\text{R}^{14})(\text{R}^{15})$ általános képletű csoport, ahol R^{14} és R^{15} jelentése egymástól függetlenül 1—4 szénatomos alkilcsoport, alkilrészeiben 1—4 szénatomos dialkil-oxi-foszfonicsoporttal, cianocsoporttal, (1—4 szénatomos alkil)-oxi-karbonil-csoporttal vagy egy-három halogénatommal szubsztituált 1—6 szénatomos alkilcsoport,
- X jelentése 1-indanilcsoport, 1-tetrahidronaftil-csoport, 4-kromanil-csoport, amelyek egy vagy két 1—4 szénatomos alkilcsoporttal vagy 5—6 szénatomos spiroalkandilcsoporttal szubsztituálva lehetnek Ezen belül
- L előnyös jelentése cianocsoport, metil-karbamoil-csoport, etil-karbamoil-csoport, karbamoilcsoport, dimetil-karbamoil-csoport, propil-karbamoil-csoport, ciklopropil-karbamoil-csoport, metoxi-karbamoil-csoport, allil-karbamoil-csoport, propargil-karbamoil-csoport, vagy hidroxetil-karbamoil-csoport, valamint -COOR^5 általános képletű csoport, ahol
- R^5 jelentése 3-klór-propil-csoport, metoxi-karbonil-metil-csoport, dietoxi-foszfonicil-metil-csoport, ciano-metil-csoport, 2,2,2-trifluor-etil-csoport, 1-(metoxi-karbonil)-etil-csoport vagy $\text{-N}=\text{C}(\text{CH}_3)_2$ csoport.
- Külön kiemeljük azokat az új vegyületeket, amelyek képletében
- R^1 jelentése hidrogénatom,
- X jelentése 2,3-dihidro-2,2-dimetil-1H-indén-1-il-csoport, 2,2-dimetil-1-tetrahidronaftil-csoport, 2,3-dimetil-kromán-4-il-csoport vagy 2-metil-kromán-4-il-csoport.
- A találmány tárgya továbbá eljárás az (I) általános képletű vegyületek előállítására.

A találmány értelmében az (I) általános képletű vegyületek előállítása során úgy járunk el, hogy (II) általános képletű vegyületet, a képletben

X és L jelentése a fenti,

hangyasav 1—4 szénatomos alkil-észterével kondenzálunk megfelelő bázis, például alkálifém-alkoxid vagy -hidrid, így nátrium-metoxid, kálium-etoxid, nátrium-hidrid, lítium-hidrid vagy hasonlókat jelenlétében inert oldószerben, majd a kapott (III) általános képletű köztiterméket, a képletben

X és L jelentése a fenti,

M jelentése alkálifématom, alkálifém-tiocianáttal sav jelenlétében (Ia) általános képletű 2-merkaptó-imidazollá alakítjuk, a képletben

X és L jelentése a fenti,

amelyet kívánt esetben (Ib) általános képletű vegyületté alakítunk salétromsav segítségével adott esetben alkálifém-nitrit, például nátrium-nitrit jelenlétében.

Inert oldószerként előnyösen alkalmazhatók például aromás szénhidrogének, így benzol, metil-benzol vagy dimetil-benzol, éterek, így 1,1'-oxi-biszetán, tetrahydrofurán, vagy 1,4-dioxán, valamint aprotikus szerves oldószerek. Az imidazol-gyűrű ciklizálási reakciójához erős ásványi savként alkalmazható például hidrogén-halogenid, így hidrogén-klorid.

Ebben a reakcióban a savat 5—50 mól, előnyösen 15—40 mól feleslegben alkalmazuk.

Az (Ib) általános képletű vegyület előállítható a (IV) általános képletű 4-amino-1H-imidazol-származék dezaminálásával is, a képletben

L és X jelentése a fenti,

L előnyös jelentése cianocsoport vagy amidcsoport.

A dezaminálás megvalósítható diazotálással és ezt követő redukálással, amelyet egymás után, vagyis a (IVa) általános képletű diazóniumsó izolálásával vagy egy lépésben, vagyis a diazóniumsó in situ redukálásával végezhetjük.

A (IV) általános képletű 4-amino-1H-imidazol-származékot vizes közegben alkálifém-nitrittel, például nátrium- vagy kálium-nitrittel sav, így hidrogén-klorid, kénsav vagy salétromsav jelenlétében, vagy nitrónium-tetrafluoroboráttal (NO^+BF_4^-) reagáltatva kapjuk a (IVa) általános képletű diazóniumsót, a képletben

L és X jelentése a fenti,

$\text{A}^\ominus$ jelentése a diazotálási reakcióban alkalmazott sav konjugált bázisának megfelelő anion vagy tetrafluoroborát anion.

A (IVa) általános képletű diazóniumsót megfelelő redukálószerrel, így hipofoszforsavval megemelt hőmérsékleten, előnyösen a reakcióelegy forráspontján redukáljuk.

A dezaminálás megvalósítható 1—5 szénatomos alkil-nitrit, így 1,1-dimetil-etil-nitrit vagy 3-metil-butil-nitrit segítségével is megfelelő aprotikus oldószerben, így tetrahydrofuránban, 1,4-dioxánban, triklór-metánban vagy N,N-dietil-formamidban, amelynek során a (IV) általános képletű 4-amino-1H-imidazol-származékból közvetlenül az (Ib) általános képletű vegyületet kapjuk. A reakció során általában megemelt hőmérsékleten, előnyösen a reakcióelegy forráspontján dolgozunk.

A kapott (I) általános képletű vegyületek önmagában ismert módon átalakíthatók.

Az L helyén álló csoport a karbonsav-származékok átalakítására ismert módszerekkel, például hidrolízissel és észterezéssel és/vagy átészterezéssel, és/vagy amidálással vagy átamidálással, vagy gyűrűzárási reakcióval más, az L jelentésébe eső csoporttá alakítható.

Az L helyén $-C(=G)-D-R^2$ - vagy $-C(=G^1)-O-R^5$ - csoportot tartalmazó (I) általános képletű vegyületek előállíthatók a megfelelő szerkezetű karbonsavból, tiokarbonsavból vagy ezek funkciók származékából amidálással vagy észterezéssel, vagy a megfelelő észterből vagy amidból átészterezéssel vagy átamidálással. Ennek során előnyösen úgy járunk el, hogy a savat aktív származékká alakítjuk, például halogénezéssel, így tionil-kloriddal, tionil-bromiddal, foszforil-kloriddal, foszforil-bromiddal, foszfor-trikloriddal, foszfor-tribromiddal, pentaklór-foszforánnal vagy más hasonló halogénezőszerszel, vagy a megfelelő anhidriddé történő dehidratálással, vagy acil-halogeniddel, így acetil-kloriddal, 2,2-dimetil-propanoil-kloriddal, etil-karbon-kloriddal vagy 1,1-dimetil-etil-karbon-kloriddal történő reakcióval.

A kapott (V) általános képletű aktív származékot, a képletben

R^1 , G és X jelentése a fenti,

T jelentése lehasadó csoport, például halogénatom, előnyösen klór- vagy brómatom, -O-acil-csoport, előnyösen 2–6 szénatomos -O-CO-alkil-csoport vagy 2–6 szénatomos -O-CO-O-alkil-csoport, vagy (I) általános képletű csoport,

megfelelő $H-O-R^5$ általános képletű hidroxivegyülettel reagáltatjuk, a képletben

R^5 jelentése a fenti.

A sóképzési reakció közben felszabaduló sav megkötésére előnyösen megfelelő bázist, például trialkil-amint, így trietil-amint alkalmazunk.

Az L helyén $-C(=G)-D-R^2$ vagy $-C(=G)-O-R^5$ általános képletű csoportot tartalmazó (I) általános képletű vegyületek előállíthatók úgy is, hogy a kiindulási anyagként alkalmazott savat vagy tiosavat és amint, merkapánt vagy alkoholt amid, észter vagy tioészter képzésére alkalmas reagenssel, például karbodiimiddal, így diciklohexil-karbodiimiddal (DCC), 2-halogén-1-alkil-piridinium-halogeniddal, így 2-klór-1-metil-piridinium-jodiddal, 1,1'-karbonil-bisz(1H-imidazol)-lal és hasonló reagenssel kezeljük. Az amidálási vagy észterezési reakciót előnyösen inert oldószerben, így szénhidrogénben, például metil-benzolban, dimetil-benzolban, halogénezett szénhidrogénben, például diklór-metánban, triklór-metánban, éterben, például tetrahydrofuránban, dioxánban, vagy bipoláris aprotikus oldószerben, például N,N-dimetil-formamidban, N,N-dimetil-acetamidban vagy hasonló oldószerben végezzük.

6

Az L helyén cianocsoportot tartalmazó (I) általános képletű vegyületek előállíthatók a megfelelő aminos-karbonil-vegyület dehidratálásával is. Dehidratálószerként alkalmazható például pentaklór-foszforán, foszforil-klorid, tionil-klorid, foszfor-pentoxid, valamint anhidridek, így ecetsav-anhidrid, trifluor-ecetsav-anhidrid és hasonlóak. A reakcióhőmérséklet az alkalmazott dehidratálószerrel függ, és általában szobahőmérséklet és a reakcióelegy forráspontja között, előnyösen 20–120°C közötti hőmérsékleten dolgozunk. A dehidratálási reakciót kívánt esetben inert szerves oldószerben, például halogénezett szénhidrogénben, így diklór-metánban, triklór-metánban, éterben, így tetrahydrofuránban, dioxánban, vagy poláros aprotikus oldószerben, így N,N-dimetil-formamidban, N,N-dimetil-acetamidban vagy hasonló oldószerben végezzük.

A tetrazol-származék előállítható a megfelelő nitril (L jelentése cianocsoport) és egy azid reakciójával inert szerves oldószerben, így N,N-dimetil-formamidban vagy dimetil-szulfoxidban 20–150°C közötti hőmérsékleten. Az L helyén (b), (d), (e), (f) vagy (g) általános képletű csoportot tartalmazó (I) általános képletű heterociklusos vegyületek előállíthatók a karbonsav vagy annak származéka, például sav-klorid, imino-éter, imino-tioéter, amidin vagy amidoxim és megfelelő reagens, így diamin, amino-alkohol, amino-mercaptán, amidoxim, alfa-halogén-ke-ton, alfa-halogén-aldehid, savhalogenid vagy karbonsav-anhidrid reakciójával. A fenti reakció az irodalomból ismert (például Chemistry of Carbon Compounds, IV. kötet, Elsevier Publ. Co. (1957) és Heterocyclic Compounds, Wiley N.Y., 5. kötet (1957), 6. kötet (1957) és 7. kötet (1961)).

A kéntartalmú (I) általános képletű vegyületek (L jelentése $-CS-D-R^2$) előállíthatók, ha a megfelelő oxigéntartalmú vegyületet (L jelentése $-CO-D-R^2$) foszfor-pentaszulfiddal vagy 2,4-bisz(4-metoxi-fenil)-2,4-diszulfid-1,3,2,4-ditiadifoszfetánnal (Lawesson reagens) reagáltatjuk. A reakciót előnyösen bázis jelenlétében szerves oldószerben, így N,N-dimetil-formamidban, N,N-dimetil-acetamidban, hexametil-foszfor-triamidban, acetonitrilben, metil-benzolban vagy dimetil-benzolban végezzük.

Az (I) általános képletű amidoxim-származékok (L jelentése $C(NH_2)=NOH$) előállíthatók a megfelelő nitril (L jelentése cianocsoport) és hidroxil-amin reakciójával.

Sztereo-kémiai izomerek előállításához sztereoselektív reakciólépéseket és reakciókörülményeket kell alkalmazni. A tiszta izomerek előállíthatók továbbá a sztereokémiai izomerelegyekből önmagában ismert elválasztási eljárásokkal.

Az új (I) általános képletű vegyületek előállításához alkalmazott kiindulási anyagok ismertek vagy ismert eljárásokkal előállíthatók.

65

Igy például a (II) általános képletű vegyületek előállíthatók, ha (VI) általános képletű amino-metilén-származékot, a képletben L és X jelentése a fenti, ecetsav-anhidrid jelenlétében hangyasavval reagáltatunk.

A (VI) általános képletű vegyületek előállíthatók, ha (VII) általános képletű amint, a képletben

X jelentése a fenti,

(VIII) általános képletű bróm-metilén-származékkal reagáltatunk, a képletben

L jelentése a fenti,

megfelelő bázis, így nátrium-karbonát jelenlétében.

A (IV) általános képletű 4-amino-1H-imidazol-származékok előállíthatók (IX) általános képletű vegyületek ciklizálásával, a képletben

X és L jelentése a fenti,

bázis-katalizátor jelenlétében megemelt hőmérsékleten oldószerben, így alkoholban. A ciklizálás megvalósítása során előnyösen úgy járunk el, hogy a (IX) általános képletű kiindulási anyagot alkoholban katalitikus mennyiségű alkoxiddal kezeljük forrásponti hőmérsékleten, ahol az alkoxidot alkálifémnek az oldószerként alkalmazott alkoholban történő feloldásával állítjuk elő. Eljárhatunk azonban úgy is, hogy a (IX) általános képletű vegyületet alkálifém-alkoxiddal reagáltatjuk poláros oldószerben, így N,N-dimetil-formamidban vagy dimetil-szulfoxidban. A reakcióhőmérséklet általában 60–140°C.

A (IX) általános képletű kiindulási anyag előállítható (X) általános képletű amidin alkilezésével, a képletben

X jelentése a fenti,

(VIII) általános képletű bróm-metilén-származék segítségével megfelelő bázis, például alkálifém-hidroxid, alkálifém-karbonát vagy hidrogén-karbonát, alkáliföldfém-karbonát vagy hidrogén-karbonát, alkáliföldfém-oxid, alkálifém-alkoxid vagy trialkil-amin, például nátrium-hidroxid, kálium-hidroxid, nátrium-karbonát, kálium-hidrogén-karbonát, magnézium-oxid, kalcium-oxid, nátrium-metoxid, nátrium-etoxid, kálium-etoxid, kálium-izopropoxid, piridin, N,N-dietil-etán-amin és hasonlóak jelenlétében. Bizonyos esetben előnyös lehet koronaéter alkalmazása. A reakcióhőmérséklet 10°C és a reakcióelegy forráspontja között változhat. A reakció megvalósítható oldószer nélkül, vagy oldószer, így N,N-dimetil-formamid, N,N-dimetil-acetamid vagy dimetil-szulfoxid jelenlétében.

A (X) általános képletű vegyületek előállíthatók (VII) általános képletű amin és (XI) általános képletű, 1–5 szénatomos alkil-N-ciano-metán-imidát reakciójával megfelelő inert oldószer, így triklór-metán, tetrahydrofuran, 1,4-dioxán, acetonitril, N,N-dimetil-formamid vagy N,N-dimetil-acetamid jelenlétében. A reakciót szobahőmérséklet és a

reakcióelegy forráspontja közötti, előnyösen 20–80°C közötti hőmérsékleten végezzük. A reakció közben felszabaduló 1–5 szénatomos alkohol és az oldószer csökkentett nyomáson végzett desztillációval történő eltávolításával (X) általános képletű N-ciano-amidint kapunk, amely további tisztítás nélkül általában közvetlenül felhasználható.

A (IV) általános képletű 4-amino-1H-imidazol-származékok előállíthatók továbbá a (VII) általános képletű aminból egy lépésben végrehajtott N-alkilezéssel és ciklizálással. Az eljárás során oldószerként és bázisként a kétlépéses szintézis során ismertetett oldószereket és bázisokat alkalmazzuk.

A (VII) általános képletű amin-származékok előállíthatók (XII) általános képletű oxim redukálásával, a képletben

X¹ jelentése olyan geminális kétvegyértékű csoport, amelyet az X csoportot az 1H-imidazol-5-karbonsav-csoporthoz kapcsoló szénatom hidrogénjének eltávolításával kapunk.

A redukciót általában hidrogénnel végezzük nemesfém katalizátor jelenlétében vagy fémhidrid reagenssel, így lítium-tetrahydro-alumínáttal vagy diboránnal végezzük megfelelő inert oldószerben, így éterben, például tetrahydrofuranban vagy 1,4-dioxánban. A (XII) általános képletű oxim elektrokémiai úton is redukálható.

A (XII) általános képletű oxim előállítható a megfelelő (XIII) általános képletű ketonból, képletben

X¹ jelentése a fenti,

hidroxilaminnal végzett reakcióval.

A (VII) általános képletű aminok előállíthatók továbbá a (XIII) általános képletű ketonok redukatív aminálásával formamid segítségével hangyasav jelenlétében, és az N-formilcsoport hidrogén-halogeniddal, például hidrogén-kloriddal történő eltávolításával.

A (VI) általános képletű köztitermékek előállíthatók továbbá a (XIII) általános képletű keton redukatív N-alkilezésével (XIV) általános képletű amino-metilén-származék segítségével, a képletben

X¹ és L jelentése a fenti.

A redukatív N-alkilezést általában a kevert és kívánt esetben melegített reakcióelegy hidrogénezésével végezzük megfelelő inert szerves oldószerben a katalitikus hidrogénezés ismert módszereivel. Oldószerként alkalmazható alkohol, például metanol vagy etanol, éter, például tetrahydrofuran. A hidrogénezést általában hidrogénatmoszféra alatt katalizátor, így szénre felvitt palládium vagy szénre felvitt platina jelenlétében végezzük. A hidrogénezés során bizonyos funkciócsoportok is reakcióba léphetnek, ennek elkerülésére a reakcióelegyhez megfelelő katalizátormérget, például tiofént adagolunk.

A redukatív N-alkilezés megvalósítható továbbá úgy is, hogy a kevert és kívánt esetben melegített reakcióelegyet nátrium-ciano-bórhidriddel, nátrium-bórhidriddel, hangya-

savval vagy ennek sójával, például ammónium-formiáttal kezeljük.

Azok az (V) általános képletű vegyületek, amelyek képletében

X jelentése szubsztituálatlan 1-indanilcsoporttól, 1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenil-csoporttól, és -CH (A)-Z általános képletű csoporttól eltérő,

A jelentése szubsztituálatlan 1—5 szénatomos alkilcsoport,

Z jelentése fenilcsoport, amely lehet szubsztituálatlan vagy egy 1—4 szénatomos alkilcsoporttal vagy halogénatommal szubsztituált,

R¹ jelentése hidrogénatom,

G jelentése oxigénatom és

T jelentése klóratom vagy brómatom, valamint ezek sói és sztereioizomer formái újak.

Az (V) általános képletű vegyületek közé tartozó karbonsavak és megfelelő 1—6 szénatomos alkil-észterek ismertek a 0 207 563., 0 234 656. és 0 240 050. számú európai közrebecsítési iratból és a 3 354 173., 3 336 326., 4 038 286. és 3 991 072. számú USA-beli szabadalmi leírásból.

Az (I) általános képletű vegyületek stabilak és alkalmazásuk esetén nincs szükség óvó rendszabályok betartására. Az (I) általános képletű vegyületek kiváló szelektív herbicid hatással rendelkeznek és felhasználhatók haszonnövények, elsősorban cukorrépa, szójabab, gabonafélék és előnyösen rizs és kukorica esetén. Bizonyos esetekben olyan gyomokra is alkalmazhatók, amelyek egyébként csak totális herbicidekkel írhatók. Megfelelő alkalmazási mennyiség esetén a kezelt növény olymértékben károsul, hogy elpusztul.

A találmány szerinti készítmények az (I) általános képletű hatóanyagok mellett egy vagy több inert hordozót és kívánt esetben más segédanyagot tartalmaznak, a készítményt a komponensek összekeverésével állítjuk elő.

Az (I) általános képletű vegyületek tehát önmagában ismert módon emulgeálható koncentrátumokká, közvetlenül permetezhető vagy hígítható oldatokká, hígított emulziókká, nedvesíthető porokká, oldható porokká, granulátumokká, és például polimer anyagban felvett kapszulakészítményekké alakíthatók. Az alkalmazott készítmény típusát és az alkalmazás módját, így permetezést, porzást, szórást az elérni kívánt hatástól és az adott körülményektől függően választjuk meg.

Oldószerként alkalmazhatók aromás szénhidrogének, előnyösen a 8—12 szénatomos frakciók, például dimetil-benzol-elegyek vagy szubsztituált naftalinok, ftalátok, így dibutil-ftalát vagy dioktil-ftalát, alifás vagy aliciklikus szénhidrogének, így ciklohexán vagy parafin, alkoholok és glikolok, és ezek éter- és észter-származékai, így etanol, etilenglikol, etilenglikol-monometil- vagy -monoetil-éter, ketonok, így ciklohexanon, erősen poláros

oldószer, így N-metil-2-pirrolidon, dimetil-szulfoxid vagy dimetil-formamid, valamint adott esetben epoxidált növényi és állati olajok, így epoxidált kókuszolaj vagy szójabab-olaj, továbbá víz.

Szilárd hordozóanyagként alkalmazhatók például por és diszpergálható porkészítmény esetén természetes ásványi anyagok, így kalcit, talkum, kaolin, montmorillonit vagy attapulgit. A fizikai tulajdonságok javítására alkalmazhatunk erősen diszpergált kóvasavat vagy polimert. Granulátumhoz alkalmazható porusos hordozóanyagként használható horzskő, tört téglá, szepiolit vagy bentonit, valamint nem-adszorbeáló hordozóanyagként kalcit vagy homok. Alkalmazható továbbá számos előgranulált szervetlen vagy szerves anyag, például dolomit vagy porított növényi maradékok.

Az (I) általános képletű vegyület tulajdonságaitól függően alkalmazunk különböző felületaktív anyagot, így nemionos, kationos és/vagy anionos felületaktív anyagot, amelyek megfelelő emulgeáló, diszpergáló és nedvesítő hatással rendelkeznek. Alkalmazhatók továbbá különböző felületaktív anyagok keverékei is.

Anionos felületaktív anyagként alkalmazhatók vízzoldható szappan és vízzoldható szintetikus felületaktív anyag.

Szappanként előnyösen alkalmazhatók hosszabb szénláncú (10—22 szénatomos) zsírsavak alkálifémsói, alkáliföldfémsói, vagy szubsztituálatlan vagy szubsztituált ammóniumsói, például oleinsav vagy sztearinsav nátrium- vagy káliumsója vagy természetes zsírsav elegye, amelyek előállíthatók például kókuszolajból vagy faggyúolajból. Alkalmazhatók továbbá az említett zsírsavak metil-taurinsói is.

Szintetikus felületaktív anyagként említhető például zsírsav-szulfonát, zsírsav-szulfát, szulfonozott benzimidazol-származék vagy alkil-aril-szulfonát.

A zsírsav-szulfonátok vagy szulfátok előnyösen alkalmazhatók alkálifémsó alkáliföldfémsó vagy szubsztituálatlan vagy szubsztituált ammóniumsói formájában, ahol az alkilcsoport előnyösen 8—22 szénatomos, amelybe beleértendő az acilcsoport alkilrésze is, ilyen például a lignin-szulfonsav nátrium- vagy káliumsója, dodecil-szulfát nátriumsója vagy káliumsója vagy természetes zsírsavakból nyert zsíralkohol-szulfátok nátrium- vagy káliumsói. Ide tartoznak az etilén-oxidot tartalmazó zsíralkohol-szulfonsavak és kénsav-észterek sói is. A szulfonilezett benzimidazol-származékok előnyösen két szulfonsav-csoportot és egy 8—22 szénatomos zsírsavcsoportot tartalmaznak. Az alkil-aril-szulfonátokra példaként említhető a dodecil-benzol-szulfonsav, dibutil-naftalén-szulfonsav vagy naftalén-szulfonsav/formaldehid kondenzációs termék nátrium-, kalcium- vagy trietanol-amin-sója. Alkalmazhatók továbbá foszfátok, például 4—14 mól etilén-oxidot tar-

talmazó p-nonil-fenol foszforsav-észtersója vagy foszfolipid.

Nemionos felületaktív anyagként előnyösen alkalmazhatók alifás vagy cikloalifás alkoholok poliglikoléterei, valamint telített és telítetlen zsírsavak és alkil-fenolok, amelyek 3—10 glikolétercsoportot és az alifás szénhidrogén részben 8—20 szénatomot, valamint az alkil-fenol-alkil részében 6—18 szénatomot tartalmaznak.

Nemionos felületaktív anyagként alkalmazhatók továbbá a poli(etilén-oxid) 1—10 szénatomos polipropilén-glikollal vagy etilén-diamino-polipropilén-glikollal képzett vízóldható adduktumai, amelyek 20—250 etilén-glikol-éter-csoportot és 10—100 propilén-glikol-csoportot tartalmaznak. Ezek a vegyületek általában 1—5 etilén-glikol egységet tartalmaznak egy propilén-glikol egységre számítva.

A nemionos felületaktív anyagokra példaként említhető a nonil-fenol-polietoxi-etanol, kasztorolaj-poliglikol-éter, polipropilén/poli-etilén-oxid adduktum, tributil-fenoxi-poli(etoxi-etanol), polietilén-glikol és oktil-fenoxi-polietoxi-etanol.

Emulgeálható koncentrátum

hatóanyag:	1-20 tömeg%, előnyösen 5-10 tömeg%
felületaktív anyag:	5-30 tömeg%, előnyösen 10-20 tömeg%
folyékony hordozóanyag:	50-94 tömeg%, előnyösen 70-85 tömeg%

Porkészítmények

hatóanyag:	0,1-10 tömeg%, előnyösen 0,1-1 tömeg%
szilárd hordozóanyag:	99,9-90 tömeg%, előnyösen 99,9-99 tömeg%

Szuszpenziós koncentrátum

hatóanyag:	5-75 tömeg%, előnyösen 10-50 tömeg%
víz:	94-25 tömeg%, előnyösen 88-30 tömeg%
felületaktív anyag:	1-40 tömeg%, előnyösen 2-30 tömeg%

Nedvesíthető por

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

Granulátum

hatóanyag:	0,5-30 tömeg%, előnyösen 3-15 tömeg%
szilárd hordozóanyag:	99,5-70 tömeg%, előnyösen 97-85 tömeg%

Nemionos felületaktív anyagként alkalmazható továbbá polietilénszorbitán zsírsav-észtere, így polioxi-etilénszorbitán-dioleát.

Kationos felületaktív anyagként előnyösen alkalmazhatók a kvaterner ammóniumsók, amelyek nitrogén-szubsztituensként legalább egy 8—22 szénatomos alkilcsoportot tartalmaznak, ahol a további szubsztituens lehet szubsztituálatlan vagy halogénezett rövid-szénláncú alkilcsoport, benzilcsoport vagy hidroxi-alkilcsoport. Sóként előnyösen alkalmazhatók a halogenidek, metil-szulfátok vagy etil-szulfátok, például a sztearil-trimetil-ammónium-klorid vagy benzil-di(2-klór-etil)-etil-ammónium-bromid.

A találmány szerinti herbicid készítmények előnyösen 0,1—95 tömeg%, elsősorban 0,1—80 tömeg% (I) általános képletű hatóanyagot és 1—99,9 tömeg% szilárd vagy folyékony segédanyagot és 0—25 tömeg%, előnyösen 0,1—25 tömeg% felületaktív anyagot tartalmaznak.

A találmány szerinti készítmények előnyös összetételei a következők:

A találmányt közelebbről az alábbi, nem korlátozó jellegű példákkal szemléltetjük.

Előállítási példák

A. A kiindulási anyagok előállítása

1. példa

a) 115 tömegrész 2,3-dihidro-2-propil-4H-1-benzopirán-4-on, 80 tömegrész metil-glicin, 15 tömegrész kálium-fluorid és 800 tömegrész metanol elegyét légköri nyomáson és szobahőmérsékleten 5 tömegrész 10 tömeg%-os szénre felvitt palládium katalizátor jelenlétében hidrogénezzük. A számolt hidrogén felvétele után a katalizátort kiszűrjük és a szűrletet bepároljuk. A maradékot 1,1'-oxi-biszetánban felvesszük. A szerves fázist vízzel és 5 tömeg%-os nátrium-hidroxid-oldattal mossuk, szárítjuk, szűrjük és bepároljuk. Így 97 tömegrész (73,0%) metil-(cisz+transz)-N-(3,4-dihidro-2-propil-2H-1-benzopirán-4-il)-glicint kapunk olajos maradék formájában (1. számú vegyület).

b) 97 tömegrész metil-(cisz+transz)-N-(3,4-dihidro-2-propil-2H-1-benzopirán-4-il)-glicin, 360 tömegrész hangyasav és 100 tömegrész ecetsavanhidrid elegyét egy éjszakán keresztül szobahőmérsékleten keverjük. A reakcióelegyet bepároljuk és a maradékot diklór-metánban felvesszük. A szerves fázist vízzel, nátrium-hidroxid oldattal és 5 tömeg%-os sósav-oldattal mossuk, szárítjuk, szűrjük és bepároljuk. Így 78 tömegrész (76,4%) metil-(cisz+transz)-N-(3,4-dihidro-2-propil-2H-1-benzopirán-4-il)-N-formil-glicint kapunk maradék formájában (2. számú közti termék).

c) 76 tömegrész metil-(cisz+transz)-N-(3,4-dihidro-2-propil-2H-1-benzopirán-4-il)-N-formil-glicin 188 tömegrész tetrahydrofuranban felvett oldatához keverés közben 13 tömegrész 50 tömeg%-os nátrium-hidrid diszperziót adunk. A reakcióelegyet egy órán keresztül szobahőmérsékleten keverjük, majd 75 tömegrész metil-formiátot adunk hozzá. Ezután egy éjszakán keresztül szobahőmérsékleten keverjük, a csapadékot kiszűrjük és 160 tömegrész metanol, 100 tömegrész víz és 36 tömegrész koncentrált sósav elegyében oldjuk. Az oldatot 60 tömegrész kálium-tiocianát 30 tömegrész vízben felvett oldatával elegyítjük és egy éjszakán keresztül szobahőmérsékleten keverjük. Az elválasztott olajat szárítjuk. Így 56 tömegrész (33,6%) metil-(cisz+transz)-1-(3,4-dihidro-2-propil-2H-1-benzopirán-4-il)-2-merkaptó-1H-imidazol-5-karboxilátot kapunk olajos maradék formájában. (3. számú kiindulási anyag)

d) 56 tömegrész metil-(cisz+transz)-1-(3,4-dihidro-2-propil-2H-1-benzopirán-4-il)-2-merkaptó-1H-imidazol-5-karboxilátot 200 tömegrész 10 tömeg%-os salétromsav oldatban oldunk. Az intenzív reakció lejátszódása után a reakcióelegyet őrölt jégen lehűtjük és nátrium-hidroxid oldattal kezeljük. A terméket diklór-metánnal extraháljuk, az extraktumot vízzel mossuk, szárítjuk, szűrjük és be-

pároljuk. A maradékot szilikagélen hexán/etil-acetát 90:10 eleggyel eluálva oszlopkromatográfiásan tisztítjuk. Az első frakciót összegyűjtjük és az eluent bepároljuk. A maradékot 1,1'-oxi-biszetánnal kristályosítjuk. A terméket szűrjük és szárítjuk. Így 4,6 tömegrész (9,0%) metil-(cisz)-1-(3,4-dihidro-2-propil-2H-1-benzopirán-4-il)-1H-imidazol-5-karboxilátot kapunk. Olvadáspont 106,5°C (4. számú kiindulási anyag).

A második frakciót összegyűjtjük és az eluent bepároljuk. A maradékot 2-propanonban és 1,1'-oxi-biszetánban nitrátsóvá alakítjuk. A sót szűrjük és szárítjuk. Így 10,1 tömegrész (16,3%) metil-(transz)-1-(3,4-dihidro-2-propil-2H-1-benzopirán-4-il)-1H-imidazol-5-karboxilát-mononitrátot kapunk. Olvadáspont 150,2°C (5. számú kiindulási anyag).

2. példa

a) 79,5 tömegrész 6-fluor-2,3-dihidro-2-metil-4H-1-benzopirán-4-on, 63 tömegrész hidroxil-amin-hidroklorid és 378 tömegrész piridin elegyét visszafolyatási hőmérsékleten egy éjszakán keresztül keverjük. A reakcióelegyet vízre öntjük, a csapadékot szűrjük és vákuumban 60°C hőmérsékleten szárítjuk. Így 69,5 tömegrész (80,9%) 6-fluor-2,3-dihidro-2-metil-4H-1-benzopirán-4-on-oximot kapunk. Olvadáspont 142,5°C (6. számú kiindulási anyag).

b) 68,5 tömegrész 6-fluor-2,3-dihidro-2-metil-4H-1-benzopirán-4-on-oxim és 480 tömegrész ammóniával telített metanol elegyét légköri nyomáson és szobahőmérsékleten 6 tömegrész Raney-nikkel katalizátoron hidrogénezzük. A számolt mennyiségű hidrogén felvétele után a katalizátort kiszűrjük és a szűrletet bepároljuk. Így 62 tömegrész (97,8%) 6-fluor-3,4-dihidro-2-metil-2H-1-benzopirán-4-amint kapunk maradék formájában (7. számú kiindulási anyag).

c) 62 tömegrész 6-fluor-3,4-dihidro-2-metil-2H-1-benzopirán-4-amin, 53 tömegrész metil-2-bróm-acetát, 38 tömegrész N,N-dietyl-etan-amin és 52 tömegrész N,N-dimetil-formamid elegyét egy éjszakán keresztül szobahőmérsékleten keverjük. Diklór-metán hozzáadása után a csapadékot szűrjük. A szűrletet négyszer vízzel mossuk, szárítjuk, szűrjük és bepároljuk. A maradékot szilikagélen hexán/etil-acetát 80:20 eleggyel eluálva oszlopkromatográfiásan tisztítjuk. A kívánt frakciót összegyűjtjük és az eluent lepároljuk. Így 35,7 tömegrész (43,7%) metil-transz-N-(6-fluor-3,4-dihidro-2-metil-2H-1-benzopirán-4-il)-glicint kapunk maradék formájában (8. számú kiindulási anyag).

d) 35,7 tömegrész metil-transz-N-(6-fluor-3,4-dihidro-2-metil-2H-1-benzopirán-4-il)-glicint 128 tömegrész hangyasavval és 30 tömegrész ecetsavanhidriddel elegyítünk jeges hűtés közben, majd az elegyet egy éjszakán keresztül szobahőmérsékleten keverjük. Víz hozzáadása után a terméket diklór-metánnal

extraháljuk. Az extraktumot vízzel és kétszer nátrium-karbonát oldattal mossuk, szárítjuk, szűrjük és bepároljuk. Így 36,7 tömegrész (93,1%) metil-transz-N-(6-fluor-3,4-dihidro-2-metil-2H-1-benzopirán-4-il)-N-formil-glicin kapunk maradék formájában (9. számú kiindulási anyag).

e) 36,7 tömegrész metil-transz-N-(6-fluor-3,4-dihidro-2-metil-2H-1-benzopirán-4-il)-N-formil-glicin 225 tömegrész tetrahydrofuranban felvett oldatához keverés közben cseppenként 6,5 tömegrész 50 tömeg%-os nátrium-hidrid diszperziót adunk. Az adagolás befejeződése után 22,1 tömegrész metil-formiátot adunk hozzá és az elegyet egy éjszakán keresztül 60°C hőmérsékleten keverjük. Hűtés után a csapadékot kiszűrjük, petroléterrel mossuk és 104 tömegrész metanolal, 36 tömegrész koncentrált sósav 100 tömegrész vízben felvett oldatával és 17,3 tömegrész kálium-tio-cianát 40 tömegrész vízben felvett oldatával elegyítjük. A reakcióelegyet egy éjszakán keresztül 60°C hőmérsékleten keverjük, majd hűtjük és a terméket szűrjük és 80°C hőmérsékleten szárítjuk. Így 28 tömegrész (62,0%) metil-transz-1-(6-fluor-3,4-dihidro-2-metil-2H-1-benzopirán-4-il)-2-merkapto-1H-imidazol-5-karboxilátot kapunk (10. számú kiindulási anyag).

f) 28 tömegrész metil-transz-1-(6-fluor-3,4-dihidro-2-metil-2H-1-benzopirán-4-il)-2-merkapto-1H-imidazol-5-karboxilát, 0,1 tömegrész nátrium-nitrit, 52,5 tömegrész koncentrált salétromsav és 90 tömegrész víz elegyet 2 órán keresztül szobahőmérsékleten keverjük. Örölt jég hozzáadása után a reakcióelegyet nátrium-hidroxid oldattal kezeljük. A terméket diklór-metánnal extraháljuk, az extraktumot szárítjuk, szűrjük és bepároljuk. A maradékot acetonitrilből átkristályosítjuk. A terméket szűrjük, a szűrletet félretesszük, és 60°C hőmérsékleten szárítjuk. Az első frakcióban 15 tömegrész (59,3%) metil-transz-1-(6-fluor-3,4-dihidro-2-metil-2H-1-benzopirán-4-il)-1H-imidazol-5-karboxilát-mononitrátot kapunk. Olvadáspont 124,6°C. (11. számú kiindulási anyag).

A félretett szűrletet bepároljuk és így második frakciót kapunk.

Összkitermelés 23,6 tömegrész (93,3%) (11. számú kiindulási anyag).

3. példa

a) 100 tömegrész 5-klór-2,3-dihidro-1H-indén-1-on, 241 tömegrész metil-jodid és 360 tömegrész 2-metil-2-propanol elegyéhez keverés közben cseppenként 148 tömegrész 2-metil-2-propanol-káliumsót adagolunk 50°C alatti hőmérsékleten nitrogénatmoszféra alatt. Az adagolás befejeződése után a reakcióelegyet egy éjszakán keresztül szobahőmérsékleten keverjük. A csapadékot kiszűrjük, diklór-metánnal mossuk és a szűrletet bepároljuk. A maradékot 13,30 Pa nyomáson desztilláljuk. Így 84 tömegrész (71,9%) 5-klór-2,3-dihidro-

-2,2-dimetil-1H-indén-1-ont kapunk maradék formájában (12. számú kiindulási anyag).

b) 90 tömegrész formamid és 42 tömegrész hangyasav elegyéhez keverés és melegítés (130°C) közben cseppenként 85 tömegrész 5-klór-2,3-dihidro-2,2-dimetil-1H-indén-1-ont adunk. Az adagolás befejeződése után a reakcióelegyet 12 órán keresztül 150°C hőmérsékleten keverjük. Hűtés után a reakcióelegyet vízre öntjük és a terméket diklór-metánnal extraháljuk. Az extraktumot szárítjuk, szűrjük és bepároljuk. A maradékot 240 tömegrész koncentrált sósavval kezeljük és az elegyet egy órán keresztül visszafolyatási hőmérsékleten keverjük. Hűtés után örölt jégre öntjük és nátrium-hidroxid oldattal kezeljük. A terméket diklór-metánnal extraháljuk, az extraktumot vízzel mossuk, szárítjuk, szűrjük és bepároljuk. A maradék savas extrakciójával 33 tömegrész (36,6%) 5-klór-2,3-dihidro-2,2-dimetil-1H-indén-1-amint kapunk olajos maradék formájában (13. számú kiindulási anyag).

c) 32 tömegrész 5-klór-2,3-dihidro-2,2-dimetil-1H-indén-1-amin 188 tömegrész N,N-dimetil-formamidban felvett oldatához keverés közben 16 tömegrész etil-N-ciano-metán-imidátot adunk. Az elegyet egy órán keresztül 100°C hőmérsékleten keverjük, majd hűtjük és a kapott etanol vákuumban ledesztilláljuk. A maradékot 25,3 tömegrész N-metil-alfa-bróm-acetamid, 48 tömegrész kálium-karbonát és kis mennyiségű dodekahidro-(1,4,7,10,13,16)-hexaoxaciklooctadecin elegyével elegyítjük. Ezután 80°C hőmérsékleten egy órán keresztül és 130°C hőmérsékleten egy éjszakán keresztül keverjük. Végül 300 tömegrész vízre öntjük és a terméket etil-acetáttal extraháljuk. Az extraktumot kétszer vízzel mossuk, szárítjuk, szűrjük és bepároljuk. A maradékot 2,2'-oxi-biszpropánból átkristályosítjuk. A terméket szűrjük és szárítjuk. Így N-metil-4-amino-1-(5-klór-2,3-dihidro-2,2-dimetil-1H-indén-1-il)-1H-imidazol-5-karboxamidot kapunk (14. számú kiindulási anyag).

4. példa

a) 80,3 tömegrész 2,3-dimetil-4H-1-benzopirán-4-on és 480 tömegrész metanol elegyét légköri nyomáson és szobahőmérsékleten 6 tömegrész Raney-nikkel katalizátoron hidrogénezünk. A számolt mennyiségű hidrogén felvétele után a katalizátort kiszűrjük és a szűrletet bepároljuk. A maradékot 2,2'-oxi-biszpropánból átkristályosítjuk. A terméket szűrjük és 50°C hőmérsékleten vákuumban szárítjuk. Így 38 tömegrész (46,3%) 3,4-dihidro-2,3-dimetil-2H-1-benzopirán-4-olt kapunk (15. számú kiindulási anyag).

b) 26 tömegrész króm(VI)-oxid 90 tömegrész vízben felvett oldatához keverés és jégfürdős hűtés közben 58,9 tömegrész koncentrált kénsavat adunk. A kapott oldatot 38 tömegrész 3,4-dihidro-2,3-dimetil-2H-1-benzopirán-4-ol 248 tömegrész 2-propanonban felvett

oldatához csepegtetjük (exoterm reakció). Az adagolás befejeződése után az elegyet 4 órán keresztül szobahőmérsékleten keverjük. Ezután vízre öntjük és a terméket triklór-metánnal extraháljuk. Az extraktumot vízzel mossuk, szárítjuk, szűrjük és bepároljuk. Így 36 tömegrész (97,3%) 2,3-dihidro-2,3-dimetil-4H-1-benzopirán-4-ont kapunk maradék formájában (16. számú kiindulási anyag).

A 2. példában leírt módon a kapott anyagot ($\pm$)-metil-(2-alfa-3-alfa-4-béta)-1-(3,4-dihidro-2,3-dimetil-2H-1-benzopirán-4-il)-1H-imidazol-5-karboxiláttá alakítjuk (17. számú kiindulási anyag).

5. példa

a) 20,4 tömegrész 2-((1,2,3-tetrahydro-1-naftalenil)-amino)-acetonitril és 11 tömegrész hangyasav 215 tömegrész dimetil-benzolban felvett oldatát 3 órán keresztül visszafolyatás közben keverjük. A kapott elegyet vízzel, nátrium-hidrogén-karbonát oldattal, ammónium-hidroxid-oldattal és vízzel mossuk, szárítjuk, szűrjük és bepároljuk. A maradékot petroléterből átkristályosítjuk. A terméket szűrjük és szárítjuk. Így 13,4 tömegrész (57%) N-(ciano-metil)-N-(1,2,3,4-tetrahydro-1-naftalenil)-formamidot kapunk. Olvadáspont 100°C (18. számú kiindulási anyag).

b) 8,5 tömegrész nátrium-etoxid 450 tömegrész metil-benzolban felvett elegyéhez keverés közben cseppenként 13,4 tömegrész N-(ciano-metil)-N-(1,2,3,4-tetrahydro-1-naftalenil)-formamid 19 tömegrész etil-formiátban felvett oldatát csepegtetjük. Az adagolás befejeződése után a reakcióelegyet egy éjszakán keresztül szobahőmérsékleten keverjük. Ezután 200 tömegrész vízzel elegyítjük és a keverést 15 percen keresztül folytatjuk. A fázisokat elválasztjuk és a metil-benzolos fázist vízzel extraháljuk. A vizes fázist sósav-oldattal savanyítjuk és a terméket háromszor triklór-metánnal extraháljuk. Az egyesített extraktumokat szárítjuk, szűrjük és bepároljuk. Így 13 tömegrész N-(1-ciano-2-oxo-etil)-N-(1,2,3,4-tetrahydro-1-naftalenil)-formamidot kapunk maradék formájában (19. számú kiindulási anyag).

6. példa

a) 29,4 tömegrész metil-1-(1,2,3,4-tetrahydro-2,2-dimetil-1-naftalenil)-1H-imidazol-5-karboxilát 180 tömegrész tetrahydrofuranban felvett oldatához keverés közben cseppenként 100 tömegrész lítium-tetrahydro-aluminát 1,1'-oxi-biszetánban felvett, 1 mól/liter koncentrációjú oldatát adagoljuk (exoterm reakció). Az adagolás befejeződése után az elegyet 2 órán keresztül szobahőmérsékleten keverjük, majd hűtjük és óvatosan 30 tömegrész vízzel elegyítjük. Ezután 10 percen keresztül szobahőmérsékleten keverjük, majd a csapadékot kiszűrjük és a szűrletet bepároljuk. A maradékot triklór-metánban oldjuk, a szerves fázist vízzel mossuk, szárítjuk, szűrjük és bepároljuk. A maradékot acetonitrilből átkris-

12

tályosítjuk. A terméket szűrjük és szárítjuk. Így 22 tömegrész (85,8%) 1-(1,2,3,4-tetrahydro-2,2-dimetil-1-naftalenil)-1H-imidazol-5-metanolt kapunk. Olvadáspont 159,4°C (20. számú kiindulási anyag).

b) 19,4 tömegrész 1-(1,2,3,4-tetrahydro-2,2-dimetil-1-naftalenil)-1H-imidazol-5-metanol 560 tömegrész 2-propanonban felvett oldatához keverés és melegítés közben 100 tömegrész aktivált mangán(IV)-oxidot adunk. Az elegyet 1,5 órán keresztül szobahőmérsékleten keverjük, majd szűrjük és a szűrletet bepároljuk. A maradékot diklór-metánban oldjuk, a szerves fázist 5 tömeg%-os nátrium-hidroxid oldattal és vízzel mossuk, szárítjuk, szűrjük és bepároljuk. A maradékot acetonitrilből átkristályosítjuk. A terméket szűrjük és szárítjuk. Így 16 tömegrész (82,9%) 1-(1,2,3,4-tetrahydro-2,2-dimetil-1-naftalenil)-1H-imidazol-5-karboxaldehidet kapunk. Olvadáspont 138,6°C (21. számú kiindulási anyag).

A többi kiindulási anyag ismert vagy ismert eljárásokkal analóg módon előállítható.

25 B. Az (I) általános képletű vegyületek előállítás

7. példa

20 tömegrész 1-(2,3-dihidro-2,2-dimetil-1H-indén-1-il)-1H-imidazol-5-karbonsavat 162 tömegrész tionil-kloriddal kezelünk. A hidrogén-klorid és kén-dioxid gáz fejlődésének befejeződése után a tionil-klorid feleslegét ledesztilláljuk. A maradékot 356 tömegrész tetrahydrofuranban oldjuk és 25 tömegrész metil-aminnal elegyítjük. A reakcióelegyet 15 órán keresztül 20–25°C közötti hőmérsékleten keverjük. A csapadékot összegyűjtjük és szárítjuk. Így 9,7 tömegrész 1-(2,3-dihidro-2,2-dimetil-1H-indén-1-il)-1H-imidazol-5-karbonsav-metil-amidot kapunk. Olvadáspont 100–100,5°C (1.03. számú vegyület).

8. példa

5,0 tömegrész 1-(2,3-dihidro-2,2-dimetil-1H-indén-1-il)-1H-imidazol-5-karbonsavat 1 órán keresztül 32,4 tömegrész frissen desztillált tionil-kloridban refluxálunk. A tionil-klorid feleslegét ledesztilláljuk és a maradékot 130 tömegrész diklór-metánban oldjuk. Hozzáadunk 5 tömegrész 2-propanon-oximot és 5 tömegrész N,N-dietyl-etán-amint. Az elegyet 5 órán keresztül szobahőmérsékleten keverjük, majd vízzel mossuk és szárazra pároljuk. A terméket szilikagélen hexán/etil-acetát eleggyel eluálva oszlopkromatográfiásan tisztítjuk. A tiszta frakciókat összegyűjtjük és az eluenst lepároljuk. Így 5,1 tömegrész ((1-metil-etilidén)-amino)-1-(2,3-dihidro-2,2-dimetil-1H-indén-1-il)-1H-imidazol-5-karboxilátot kapunk, olvadáspont 81–83°C (1.76 számú vegyület).

9. példa

15 tömegrész ciklopropán-metanolt 10°C hőmérsékletre hűtünk. Ezen a hőmérsékleten

részletekben 5 tömegrész dl-1-(1-fenil-etil)-1H-imidazol-5-karbonil-klorid-hidrokloridot adunk hozzá. A szilárd anyag oldódása után az elegyet 50 tömegrész vízre öntjük. A vizes fázist 5n nátrium-hidroxid oldattal meglúgosítjuk és éterrel extraháljuk. Az extraktumot magnézium-szulfáton szárítjuk, szűrjük és a szűrlethez hidrogén-klorid gázzal telített 2-propanolt adunk. A csapadékot szűrjük és kismennyiségű 2-propanolban oldjuk. A meleg oldathoz vízmentes étert adunk, míg zavaros oldatot nem kapunk. Ezt néhány órán keresztül szobahőmérsékleten tartjuk, majd a szilárd anyagot szűrjük és vákuumban bepároljuk. Így 3,5 tömegrész (ciklopropil-metil)-dl-1-(1-fenil-etil)-1H-imidazol-5-karboxilát-hidrokloridot kapunk. Olvadáspont 148,5–151°C (13.95 számú vegyület).

10. példa

5 tömegrész 1-(2,3-dihidro-3,3-dimetil-1H-indén-1-il)-1H-imidazol-5-karbonsav 45 tömegrész tetrahydrofuránban felvett oldatát keverés és melegítés (mintegy 40°C) közben 3,2 tömegrész 1,1'-karbonil-bisz(1H-imidazol)-l-al elegyítjük. Az elegyet 1 órán keresztül 40°C hőmérsékleten keverjük, majd 1 tömegrész metil-amin gázt adunk hozzá. Ezután egy éjszakán keresztül szobahőmérsékleten keverjük, végül bepároljuk és a maradékot vízben felvesszük. A terméket triklór-etánnal extraháljuk, az extraktumot vízzel mossuk, szárítjuk, szűrjük és bepároljuk. A maradékot szilikagélen triklór-metán/metanol 95:5 eleggyel eluálva oszlopkromatográfiásan tisztítjuk. A tiszta frakciókat összegyűjtjük és az eluenst bepároljuk. A maradékot acetónitrilből átkristályosítjuk. A terméket szűrjük és szárítjuk. Így 3,54 tömegrész (67,3%) 1-(2,3-dihidro-3,3-dimetil-1H-indén-1-il)-N-metil-1H-imidazol-5-karboxamidot kapunk. Olvadáspont 167,4°C (1,67 számú vegyület).

11. példa

4,0 tömegrész 1-(1,2,3,4-tetrahidro-2,2-dimetil-1-naftalenil)-1H-imidazol-5-karbonsav 67,5 tömegrész tetrahydrofuránban felvett oldatához keverés és melegítés közben 2,4 tömegrész 1,1'-karbonil-bisz(1H-imidazol)-t adunk. Az elegyet 2 órán keresztül szobahőmérsékleten keverjük, majd bepároljuk és a maradékot vízben felvesszük. A terméket triklór-metánnal extraháljuk, az extraktumot szárítjuk, szűrjük és bepároljuk. A maradékot 2,2'-oxi-biszpropánból átkristályosítjuk. A terméket szűrjük és szárítjuk. Így 3,27 tömegrész (68,0%) 1-((1-(1,2,3,4-tetrahidro-2,2-dimetil-1-naftalenil)-1H-imidazol-5-il)-karbonil)-1H-imidazol-5-karboxilátot kapunk. Olvadáspont 122,4°C (2.96 számú vegyület).

12. példa

50 tömegrész 1-((1-(1,2,3,4-tetrahidro-2,2-dimetil-1-naftalenil)-1H-imidazol-5-il)-karbonil)-1H-imidazol 225 tömegrész tetrahydrofuránban felvett oldatába 2 órán keresztül

ammóniagázt vezetünk. A reakcióelegyet hagyjuk egy éjszakán keresztül szobahőmérsékleten állni, majd a csapadékot kiszűrjük, tetrahydrofuránnal és 2,2'-oxi-biszpropánnal mossuk és acetónitrilben szuszpendáljuk. A csapadékot szűrjük és etanolból átkristályosítjuk. A terméket szűrjük és szárítjuk. Így 26,6 tömegrész (63,3%) 1-(1,2,3,4-tetrahidro-2,2-dimetil-1-naftalenil)-1H-imidazol-5-karboxamidot kapunk. Olvadáspont 238,2°C (2.25 számú vegyület).

A 12. példában megadott módon állítható elő az 1-(1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenil)-1H-imidazol-5-karboxamid. Olvadáspont 207–208°C (2.08 számú vegyület).

13. példa

4 tömegrész 1-((1-(1,2,3,4-tetrahidro-2,2-dimetil-1-naftalenil)-1H-imidazol-5-il)-karbonil)-1H-imidazol és 48 tömegrész N,N-dimetil-formamid elegyéhez keverés közben 1,2 tömegrész metil-merkaptánt adunk. Az elegyet 12 órán keresztül szobahőmérsékleten keverjük, majd bepároljuk. A maradékot vízben felvesszük és a terméket triklór-etánnal extraháljuk. Az extraktumot szárítjuk, szűrjük és bepároljuk. A maradékot szilikagélen triklór-metán/metanol 99:1 eleggyel eluálva oszlopkromatográfiásan tisztítjuk. A tiszta frakciókat összegyűjtjük és az eluenst bepároljuk. Az olajos maradékot 2,2'-oxi-biszpropánban megszilárdítjuk. A terméket szűrjük és szárítjuk. Így 2,28 tömegrész (60,9%) S-metil-1-(1,2,3,4-tetrahidro-2,2-dimetil-1-naftalenil)-1H-imidazol-5-karboxilátot kapunk. Olvadáspont 80,7°C (2,30 számú vegyület).

14. példa

9,7 tömegrész 1-(1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenil)-1H-imidazol-5-karbonsav 90 tömegrész N,N-dimetil-formamidban felvett oldatához keverés közben 1,9 tömegrész 50 tömeg%-os nátrium-hidrid diszperziót adunk. Az elegyet 15 percen keresztül szobahőmérsékleten keverjük, majd 3,3 tömegrész klór-acetonitril csepegtetünk hozzá. Az adagolás befejezése után 18 órán keresztül szobahőmérsékleten keverjük, majd bepároljuk és a maradékot vízben felvesszük. A terméket triklór-metánnal extraháljuk, az extraktumot szárítjuk, szűrjük és bepároljuk. A maradékot szilikagélen triklór-metán/metanol 95:5 eleggyel eluálva oszlopkromatográfiásan tisztítjuk. A tiszta frakciókat összegyűjtjük és az eluenst bepároljuk. A maradékot 2,2'-oxi-biszpropánból átkristályosítjuk. A terméket szűrjük és szárítjuk. Így 7,4 tömegrész (66,1%) ciano-metil-1-(1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenil)-1H-imidazol-5-karboxilátot kapunk. Olvadáspont 109,6°C (2.118 számú vegyület).

15. példa

27,4 tömegrész 2-bróm-2-metil-propán és 100 tömegrész dimetil-szulfoxid elegyét 1 órán keresztül szobahőmérsékleten keverjük. 4,8 tömegrész 1-(1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenil)-

-1H-imidazol-5-karbonsav és 16,8 tömegrész nátrium-hidrogén-karbonát hozzáadása után az elegyet egy éjszakán keresztül szobahőmérsékleten keverjük. Ezután 600 tömegrész vízre öntjük és a terméket 1,1'-oxi-biszetánnal extraháljuk. Az extraktumot szárítjuk, szűrjük és bepároljuk. A maradékot szilikagélén triklór-metán eluenssel oszlopkromatográfiásan tisztítjuk. A tiszta frakciókat összegyűjtjük és az eluent bepároljuk. A maradékot 2,2'-oxi-biszpropánnal átkristályosítjuk. A terméket szűrjük és szárítjuk. Így 3,3 tömegrész (54,6%) (metil-tio)-metil-1-(1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenil)-1H-imidazol-5-karboxilátot kapunk. Olvadáspont 99,4°C (2.120 számú vegyület).

16. példa

4,3 tömegrész (R)-(+)-1-(1-fenil-etil)-1H-imidazol-5-karbonsav és 80 tömegrész metanol elegyéhez keverés közben 0,5 tömegrész nátriumot adunk (exoterm reakció). Az elegyet 30 percen keresztül keverjük, majd az oldószert lepároljuk és a maradékot 80 tömegrész acetonnitrilben szuszpendáljuk. Ezután 2,8 tömegrész 1-klór-2-propanont adunk hozzá és 4 órán keresztül visszafolyatás közben keverjük. A reakcióelegyet hűtjük, szűrjük és a szűrletet bepároljuk. A maradékot szilikagélén triklór-metán/metanol 97,5:2,5 eleggyel eluálva oszlopkromatográfiásan tisztítjuk. A tiszta frakciókat összegyűjtjük és az eluent bepároljuk. A maradékot 2-propanon és 2-propanol elegyében hidroklorid sóvá alakítjuk. A söt szűrjük és szárítjuk. Így 4 tömegrész (64%) (R)-(+)-2-oxo-propil-1-(1-fenil-etil)-1H-imidazol-5-karboxilát-monohidrokloridot kapunk, olvadáspont 149,7°C, $\alpha_D^{20} = +42,02^\circ$ ($c=0,1$ tömeg%, etanol). (13.98 számú vegyület).

17. példa

4 tömegrész metil-(2-alfa-3-alfa-4-béta)-1-(3,4-dihidro-2,3-dimetil-2H-1-benzopirán-4-il)-1H-imidazol-5-karboxilát és 80 tömegrész 40 tömeg%-os vizes metil-amin oldat elegyét 4 órán keresztül szobahőmérsékleten keverjük. A terméket triklór-metánnal extraháljuk, az extraktumot szárítjuk, szűrjük és bepároljuk. A maradékot 2-propanon és 1,1'-oxi-biszetán elegyében nitrátsóvá alakítjuk. A söt szűrjük és vákuumban 60°C hőmérsékleten szárítjuk. Így 3,6 tömegrész (73,8%) (2-alfa-3-alfa-4-béta)-1-(3,4-dihidro-2,3-dimetil-2H-1-benzopirán-4-il)-N-metil-1H-imidazol-5-karboxamid-mononitrátot kapunk, olvadáspont 189,5°C (6.93 számú vegyület).

18. példa

12,5 tömegrész metil-1-(1,2,3,4-tetrahidro-2,2-dimetil-1-naftalenil)-1H-imidazol-5-karboxilát 30 tömegrész 50 tömeg%-os nátrium-hidroxid oldatban és 30 tömegrész vízben felvett oldatát 1 órán keresztül forraljuk. Hűtés után a reakcióelegyet savanyítjuk és a terméket triklór-metánnal extraháljuk. Az

extraktumot vízzel mossuk, szárítjuk, szűrjük és bepároljuk. A maradékot 90 tömegrész tetrahydrofuránban felvesszük és 6,4 tömegrész 1,1'-karbonil-bisz(1H-imidazol)-t adunk hozzá. 15 percen keresztül szobahőmérsékleten keverjük, majd egyszerre 18 tömegrész metil-amin adunk hozzá és 1 órán keresztül ugyanezen a hőmérsékleten keverjük. A tetrahydrofurános fázist bepároljuk és a maradékot diklór-metánban felvesszük. A szerves fázist 5 tömeg%-os nátrium-hidroxid oldattal és vízzel mossuk, szárítjuk, szűrjük és bepároljuk. A maradékot szilikagélén triklór-metán/metanol 90:10 eleggyel eluálva oszlopkromatográfiásan tisztítjuk. A tiszta frakciókat összegyűjtjük és az eluent bepároljuk. A maradékot 2-propanon és 2,2'-oxi-biszpropán elegyében nitrátsóvá alakítjuk. A söt szűrjük és szárítjuk. Így 1,4 tömegrész (9,3%) N-metil-1-(1,2,3,4-tetrahidro-2,2-dimetil-1-naftalenil)-1H-imidazol-5-karboxamid-mononitrátot kapunk, olvadáspont 195,2°C (2.04 számú vegyület).

19. példa

3 tömegrész metil-1-(1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenil)-1H-imidazol-5-karboxilát és 20 tömegrész hidrazin-monohidrát elegyét 4 órán keresztül visszafolyatás közben keverjük. A reakcióelegyet vízre öntjük és dörzsöléssel kristályosítjuk. Szűrjük és 50 tömeg%-os etanolból átkristályosítjuk. Így 1,8 tömegrész 1-(1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenil)-1H-imidazol-5-karbonsav-hidrazidot kapunk, olvadáspont 177,5–180°C (2.86 számú vegyület).

20. példa

2,8 tömegrész ($\pm$)-metil-1-(1-fenil-etil)-1H-imidazol-5-karboxilát, 32 tömegrész abszolút etanol és 5 tömegrész hidrazin-monohidrát elegyét 16 órán keresztül visszafolyatás közben keverjük. A reakcióelegyet csökkentett nyomáson lepároljuk és a szilárd maradékot forró benzollal kezeljük. Az egészet szűrjük és a szilárd anyagot kistérfogató forró 2-propanolból, zavarosodásig petroléter hozzáadásával átkristályosítjuk. Szobahőmérsékletre lehűtve a termék kicsapódik, amelyet szűrünk és szárítunk. Így 2 tömegrész ($\pm$)-1-(1-fenil-etil)-1H-imidazol-5-karbonsav-hidrazidot kapunk, olvadáspont 134–135,5°C (13.62 számú vegyület).

21. példa

10 tömegrész metil-1-(fenil-(2-piridinil)-metil)-1H-imidazol-5-karboxilát, 2,1 tömegrész 2-amino-etanol és 100 tömegrész víz elegyét 2 órán keresztül visszafolyatás közben keverjük. Hozzáadunk 80 tömegrész metanolt és egy héten keresztül visszafolyatás közben keverjük. Az elegyet vízzel hígítjuk és a terméket diklór-metánnal extraháljuk. Az extraktumot szárítjuk, szűrjük és bepároljuk. A maradékot szilikagélén triklór-metán/metanol 95:5 eleggyel eluálva oszlopkromatográfiá-

san tisztítjuk. A tiszta frakciókat összegyűjtjük és az eluenst bepároljuk. A maradékot 1,1'-oxi-biszetán és triklór-metán elegyből átkristályosítjuk. A terméket szűrjük és vákuumban 60°C hőmérsékleten szárítjuk. Így 0,8 tömegrész (7,2%) N-(2-hidroxi-etil)-1-(fenil-(2-piridinil)-metil)-1H-imidazol-5-karboxamidot kapunk, olvadáspont 142,4°C (13.77 számú vegyület).

22. példa

10,8 tömegrész 1-(1,2,3,4-tetrahidro-2,2-dimetil-1-naftalenil)-1H-imidazol-5-karbonsav 94 tömegrész N,N-dimetil-formamidban felvett oldatához keverés és melegítés közben 6,5 tömegrész 1,1'-karbonil-bisz(1H-imidazol)-t adunk. Az elegyet 1 órán keresztül szobahőmérsékleten keverjük, majd 3,9 tömegrész 2-amino-etanol adunk hozzá. A reakcióelegyet egy éjszakán keresztül szobahőmérsékleten keverjük, majd bepároljuk és a maradékot vízben felvesszük. A terméket triklór-metánnal extraháljuk, az extraktumot szárítjuk, szűrjük és bepároljuk. A maradékot 2,2'-oxi-biszpropánban megszilárdítjuk. A csapadékot szűrjük és acetonitrilből átkristályosítjuk. A terméket szűrjük és szárítjuk. Így 8,4 tömegrész (67,0%) N-(2-hidroxi-etil)-1-(1,2,3,4-tetrahidro-2,2-dimetil-1-naftalenil)-1H-imidazol-5-karboxamidot kapunk. Olvadáspont 150,3°C (2.43. számú vegyület).

A 22. példában leírt módon állíthatók elő a következő vegyületek:

1-((1-(3,4-dihidro-2,2-dimetil-2H-1-benzopirán-4-il)-1H-imidazol-5-il)-karbonil)-piperazin, olvadáspont 157,5°C (6.24. számú vegyület),
1-(3,4-dihidro-2,2-dimetil-2H-1-benzopirán-4-il)-1H-imidazol-5-karbonsavat 1,1'-karbonil-bisz(1H-imidazol)-lal reagáltatunk N,N-dimetil-formamidban és az aktivált imidazolil-észtert in situ piperazinnal kezeljük),
N-metil-1-(1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenil)-1H-imidazol-5-karboxamid-mononitrát, olvadáspont 155,5°C (2.03 számú vegyület),
N-(2-hidroxi-1,1-dimetil-etil)-1-(1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenil)-1H-imidazol-5-karboxamid olvadáspont 159,4°C (2.91 számú vegyület).

23. példa

4 tömegrész N-(2-hidroxi-etil)-1-(1,2,3,4-tetrahidro-2,2-dimetil-1-naftalenil)-1H-imidazol-5-karboxamid 30 tömegrész piridinben felvett oldatához keverés közben 1,4 tömegrész ecetsavanhidridet adunk. Az elegyet egy éjszakán keresztül szobahőmérsékleten keverjük, majd bepároljuk. A maradékot vízben felvesszük és a terméket triklór-metánnal extraháljuk, az extraktumot szárítjuk, szűrjük és bepároljuk. A maradékot acetonitrilből átkristályosítjuk. A terméket szűrjük és szárítjuk. Így 3,0 tömegrész (67,5%) 2-((1-(1,2,3,4-tetrahidro-2,2-dimetil-1-naftalenil)-

-1H-imidazol-5-il)-karbonil-amino)-etil-acetátot kapunk. Olvadáspont 155,9°C (2.99 számú vegyület).

24. példa

4,3 tömegrész 2((1-(3,4-dihidro-2,2-dimetil-2H-1-benzopirán-4-il)-1H-imidazol-5-il)-karbonil)-piperazin és 225 tömegrész metil-benzol elegyéhez keverés közben 0,85 tömegrész metil-izocianátot adunk. Az elegyet 2 órán keresztül szobahőmérsékleten keverjük, a csapadékot szűrjük és szilikagélen triklór-metán/metanol 90:10 eleggyel eluálva oszlopkromatográfiásan tisztítjuk. A tiszta frakciókat összegyűjtjük és az eluenseket bepároljuk. A maradékot 2,2'-oxi-biszpropánban megszilárdítjuk. A terméket szűrjük és szárítjuk. Így 2,7 tömegrész (54,3%) 4-((1-(3,4-dihidro-2,2-dimetil-2H-1-benzopirán-4-il)-1H-imidazol-5-il)-karbonil)-N-metil-1-piperazin-karboxamidot kapunk. Olvadáspont 115,9°C (6.81 számú vegyület).

25. példa

8,4 tömegrész N-metil-1-(1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenil)-1H-imidazol-5-karboxamid és 13 tömegrész 2,4-bisz(4-metoxi-fenil)-2,4-diszulfid-1,3,2,4-ditia-difoszfetán 40 tömegrész hexametil-foszforsav-triamidban felvett oldatát 24 órán keresztül 100°C hőmérsékleten keverjük. A hexametil-foszforsav-triamidos fázist bepároljuk és a maradékot víz és 1,1'-oxi-biszetán elegyében keverjük. Az elválasztott szerves fázist vízzel mossuk, szárítjuk, szűrjük és bepároljuk. A maradékot szilikagélen triklór-metán eluenssel oszlopkromatográfiásan tisztítjuk. A tiszta frakciókat összegyűjtjük és az eluenst bepároljuk. A maradékot 2,2'-oxi-biszpropánból átkristályosítjuk. A terméket szűrjük és szárítjuk. Így 1,6 tömegrész (14,5%) N-metil-1-(1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenil)-1H-imidazol-5-karboxamidot kapunk, olvadáspont 174,1°C (2.89 számú vegyület).

26. példa

10,7 tömegrész 1-(1,2,3,4-tetrahidro-2,2-dimetil-1-naftalenil)-1H-imidazol-5-karboxamid, 6,5 tömegrész piridin és 120 tömegrész 1,4-dioxán elegyéhez keverés és hűtés (5°C, jég/víz fürdő) közben cseppenként 6,1 tömegrész tri-fluor-ecetsav-anhidridet adunk 30 perc alatt. A reakcióelegyet hagyjuk szobahőmérsékletre melegedni és egy éjszakán keresztül szobahőmérsékleten keverjük. Ezután bepároljuk és a maradékot jeges vízben felvesszük. Az egészet 50 tömeg%-os nátrium-hidroxid oldattal kezeljük és a terméket diklór-metánnal extraháljuk. Az extraktumot vízzel mossuk, szárítjuk, szűrjük és bepároljuk. A maradékot szilikagélen triklór-metán/metanol 99:1 eleggyel eluálva oszlopkromatográfiásan tisztítjuk. A tiszta frakciókat összegyűjtjük és az eluenst bepároljuk. A maradékot 2,2'-oxi-biszpropánból átkristályosítjuk. A terméket szűrjük és szárítjuk. Így 4,2 tömegrész (41,7%)

1-(1,2,3,4-tetrahidro-2,2-dimetil-1-naftalenil)-1H-imidazol-5-karbonitril kapunk, olvadáspont 81,9°C (2.26 számú vegyület).

27. példa

9,6 tömegrész tionil-kloridot adunk 7,9 tömegrész N-(2-hidroxil-1,1-dimetil-etil)-1-(1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenil)-1H-imidazol-5-karboxamidhoz exoterm reakció). Az elegyet 1 órán keresztül szobahőmérsékleten keverjük, majd 350 tömegrész 1,1'-oxi-biszetánhoz öntjük. A kapott elegyet bepároljuk és a maradékot vízben, nátrium-karbonátban és triklór-metánban felvesszük. Az elválasztott szerves fázist szárítjuk, szűrjük és bepároljuk. A maradékot szilikagélén először triklórmetán/metanol 95:5 eleggyel, majd triklórmetánnal eluálva oszlopkromatográfiásan tisztítjuk. A tiszta frakciókat összegyűjtjük és az eluenst bepároljuk. A maradékot szilikagélén metil-benzol/triklór-metán/metanol/86:10:4 eleggyel eluálva ismét oszlopkromatográfiásan tisztítjuk. A tiszta frakciókat összegyűjtjük és az eluenst bepároljuk. A maradékot petroléterből átkristályosítjuk. A terméket szűrjük és szárítjuk. Így 1,09 tömegrész (14,7%) 5-(4,5-dihidro-4,4-dimetil-2-oxazolil)-1-(1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenil)-1H-imidazolt kapunk. Olvadáspont 107,4°C (2.95 számú vegyület).

28. példa

5,08 tömegrész 1-(1,2,3,4-tetrahidro-2,2-dimetil-1-naftalenil)-1H-imidazol-5-karboxaldehyd, 2,1 tömegrész 1,2-benzol-diamin és 20 tömegrész nitrobenzol elegyét 30 percen keresztül visszafolyatás közben keverjük. A maradék nitrobenzolt vákuumban ledesztilláljuk, és a maradékot szilikagélén triklór-metán/metanol 95:5 eleggyel eluálva oszlopkromatográfiásan tisztítjuk. A második frakciót összegyűjtjük és az eluenst bepároljuk. A maradékot acetonnitrilből átkristályosítjuk. A terméket szűrjük és szárítjuk. Így 2,46 tömegrész (35,9%) 2-(1-(1,2,3,4-tetrahidro-2,2-dimetil-1-naftalenil)-1H-imidazol-5-il)-1H-benzimidazolt kapunk. Olvadáspont 228,5°C (2.82 számú vegyület).

29. példa

5,0 tömegrész 1-(1,2,3,4-tetrahidro-2,2-dimetil-1-naftalenil)-1H-imidazol-5-karbonitril, 1,5 tömegrész hidroxil-amin-hidroklorid, 1,16 tömegrész nátrium-karbonát, 16 tömegrész etanol és 20 tömegrész víz elegyét egy éjszakan keresztül visszafolyatás közben keverjük. A reakcióelegyet bepároljuk és a maradékot vízben felvesszük. A terméket triklór-metánnal extraháljuk, az extraktumot szárítjuk, szűrjük és bepároljuk. A maradékot szilikagélén triklór-metán/metanol 95:5 eleggyel eluálva oszlopkromatográfiásan tisztítjuk. A tiszta frakciókat összegyűjtjük és az elegyet bepároljuk. A maradékot 2-propanolból átkristályosítjuk. A terméket szűrjük és szárítjuk. Így 0,44 tömegrész (7,7%) N'-hidroxil-

1-(1,2,3,4-tetrahidro-2,2-dimetil-1-naftalenil)-1H-imidazol-5-karboximid-amidot kapunk, olvadáspont 244,2°C (2.76 számú vegyület).

5 30. példa

7,5 tömegrész 1-(1,2,3,4-tetrahidro-2,2-dimetil-1-naftalenil)-1H-imidazol-5-karbonitril, 2,6 tömegrész nátrium-azid, 2,1 tömegrész ammónium-klorid, 0,1 tömegrész lítium-klorid és 47 tömegrész N,N-dimetil-formamid elegyét 16 órán keresztül 125°C hőmérsékleten keverjük. Szobahőmérsékletre történő lehűlés után az elegyet szűrjük és a szűrletet bepároljuk. A maradékot lúgos vízben oldjuk és diklór-metánnal elegyítjük. Összeszerázás után az elválasztott vizes fázist 10 tömeg%-os sósav-oldattal pH=4 értékre állítjuk. A csapadékot szűrjük és 750 tömegrész triklór-metánban oldjuk. A szerves fázist szárítjuk, szűrjük és bepároljuk. A kapott olajat lúgos vízben oldjuk, szűrjük és a szűrletet 10 tömeg%-os sósav-oldattal pH=4 értékre állítjuk. A terméket szűrjük, vízzel mossuk és 110°C hőmérsékleten szárítjuk. Így 4,01 tömegrész (45,4%) 5-(1-(1,2,3,4-tetrahidro-2,2-dimetil-1-naftalenil)-1H-imidazol-2-il)-1H-tetrazolt kapunk. Olvadáspont 155,7°C (2.129 számú vegyület).

30 31. példa

12,3 tömegrész N-(1-ciano-2-oxo-etil)-N-(1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenil)-formamid, 6 tömegrész koncentrált sósav, 20 tömegrész víz és 32 tömegrész etanol elegyéhez keverés közben 5,2 tömegrész kálium-tiocianát 20 tömegrész vízben felvett oldatát adjuk és 3 órán keresztül visszafolyatás közben keverjük. A reakcióelegyet hagyjuk lehűlni és a csapadékot szűrjük. Szilikagélén triklór-metán/metanol 90:10 eleggyel eluálva oszlopkromatográfiásan többször tisztítjuk. A tiszta frakciókat összegyűjtjük és az eluenst bepároljuk. A maradékot metanol/víz elegyből átkristályosítjuk. Így 1,3 tömegrész (9%) 1-(1,2,3,4-tetrahidro-1-naftalenil)-2-merkaptó-1H-imidazol-5-karboxamidot kapunk. Olvadáspont: 227,7°C. (2.69 számú vegyület).

32. példa

a) 12 tömegrész 1-(2,3-dihidro-2,2-dimetil-1H-indén-1-il)-1H-imidazol-5-karbonsavat 81 tömegrész tionil-kloriddal kezelünk. 1 órán keresztül visszafolyatás közben keverjük, majd a tionil-klorid feleslegét ledesztilláljuk. A maradékot 225 tömegrész tetrahidrofuránban oldjuk és 2 órán keresztül ammónia gázzal telítjük. 250 tömegrész víz hozzáadása után a csapadékot szűrjük és szárítjuk. Így 10,7 tömegrész (88,9%) 1-(2,3-dihidro-2,2-dimetil-1H-indén-1-il)-1H-imidazol-5-karboxamidot kapunk. Olvadáspont 218–219°C (1.73 számú vegyület).

b) 29 tömegrész 1-(2,3-dihidro-2,2-dimetil-1H-indén-1-il)-1H-imidazol-5-karboxamid és 18,3 tömegrész piridin elegyét 113 tömegrész 1,4-dioxánban diszpergáljuk. 17,6 tömegrész

31

trifluor-ecetsav-anhidridet csepegtetünk hozzá, majd 24 órán keresztül keverjük és bepároljuk. A maradékot 1,1'-oxi-biszetánban oldjuk és vízzel extraháljuk. A szerves fázist szárítjuk, szűrjük és bepároljuk. A maradékot 1,1'-oxi-biszetán és petroléter elegyéből átkristályosítjuk. A terméket szűrjük és szárítjuk. Így 12,5 tömegrész (43,2%) 1-(2,3-dihidro-2,2-dimetil-1H-indén-1-il)-1H-imidazol-5-karbonitrilt kapunk, olvadáspont 73–73,5°C (1.15 számú vegyület).

c) 2 tömegrész 1-(2,3-dihidro-2,2-dimetil-1H-indén-1-il)-1H-imidazol-5-karbonitril 18 tömegrész 1,2-etán-diamin és 1 tömegrész ezüst-nitrát elegyét 24 órán keresztül visszafolyatás közben keverjük. Ezután vízre öntjük és a terméket diklór-metánnal extraháljuk. Az extraktumot szárítjuk, szűrjük és bepároljuk. A maradékot 1,1'-oxi-biszetánból átkristályosítjuk. A terméket szűrjük és szárítjuk. Így 1,8 tömegrész (80,3%) 5-(4,5-dihidro-1H-imidazol-2-il)-1-(2,3-dihidro-2,2-dimetil-1H-indén-1-il)-1H-imidazol-5-karbonitrilt kapunk, olvadáspont 155–156°C (1.37 számú vegyület).

33. példa

3 tömegrész 1-(2,3-dihidro-2,2-dimetil-1H-indén-1-il)-1H-imidazol-5-karbonitril, 1,75 tömegrész hidroxil-amino-monohidroklorid, 1 tömegrész nátrium-hidroxid és 16 tömegrész

32

metanol elegyét 5 órán keresztül visszafolyatás közben forraljuk. A reakcióelegyet vízre öntjük, csapadékot szűrjük és 18 tömegrész tetrahidrofuranban diszpergáljuk. 1,7 tömegrész trifluor-ecetsav-anhidridet csepegtetünk hozzá, majd 4 órán keresztül szobahőmérsékleten keverjük. Ezután vízre öntjük, a csapadékot szűrjük és szárítjuk. Így 0,5 tömegrész (11,1%) 3-(1-(2,3-dihidro-2,2-dimetil-1H-indén-1-il)-1H-imidazol-5-il)-5-trifluor-metil-1,2,4-oxadiazolt kapunk. Olvadáspont 92–98°C (1,35 számú vegyület).

34. példa

10 tömegrész N-metil-4-amino-1-(5-klór-2,3-dihidro-2,2-dimetil-1H-indén-1-il)-1H-imidazol-5-karboxamid 47 tömegrész N,N-dimetil-formamidban felvett elegyét keverés és melegítés (70°C) közben 5,1 tömegrész 1,1-dimetil-etil-nitrattal elegyítjük. Az elegyet 30 percen keresztül keverjük, majd vízre öntjük és a terméket 1,1'-oxi-biszetánnal extraháljuk. Az extraktumot vízzel kétszer mossuk, szárítjuk, szűrjük és bepároljuk. A maradékot 2,2'-oxi-biszpropánban nitrátsóvá alakítjuk. A sót szűrjük és vákuumban szárítjuk. Így N-metil-1-(5-klór-2,3-dihidro-2,2-dimetil-1H-indén-1-il)-1H-imidazol-5-karboxamid-mononitrátot kapunk (1.75 számú vegyület).

A következő 1–9. táblázatban szereplő vegyületek a fenti példákkal analóg módon állíthatók elő.

1. táblázat

/Ic/ általános képletű vegyületek előállítása

Vegyület száma	R ¹	R ⁶	R ⁷	R ¹⁰	L	Fizikai adatok /op./
1.02	H	2-CH ₃	2-CH ₃	H	-CO-NH-CH ₂ -CH ₂ OH	118-122°C
1.03	H	2-CH ₃	2-CH ₃	H	-CO-NH-CH ₃	122-127°C
1.04	H	2-CH ₃	2-CH ₃	H	-CO-NH-OCH ₃	66-68°C
1.05	H	2-CH ₃	2-CH ₃	H	-CO-SCH ₃	
1.06	H	2-CH ₃	2-CH ₃	H	-CO-SC ₂ H ₅	
1.07	H	2-CH ₃	2-CH ₃	H	piperidino- -karbonil	
1.08	H	2-CH ₃	2-CH ₃	H	pirrolidino- -karbonil	
1.09	H	2-CH ₃	2-CH ₃	H	-CO-NH-C ₂ H ₅	
1.10	H	2-CH ₃	2-CH ₃	H	-CO-NH-C ₃ H ₇ -n	gyanta
1.11	H	2-CH ₃	2-CH ₃	H	-CO-N(CH ₃) ₂	96-96,5°C
1.12	H	2-CH ₃	2-CH ₃	H	-CO-NH-C ₃ H ₅ -c	
1.13	H	2-CH ₃	2-CH ₃	H	-CO-NH-C ₄ H ₉ -n	
1.14	H	2-CH ₃	2-CH ₃	H	-CO-NH ₂	218-219°C
1.15	H	2-CH ₃	2-CH ₃	H	-CN	73-73,5°C
1.16	H	2-CH ₃	H	H	-CO-NH ₂	
1.17	H	2-CH ₃	H	H	-CN	
1.18	H	2-CH ₃	H	H	-CO-NH-OCH ₃	
1.19	H	2-CH ₃	H	H	-CO-NH-CH ₃	
1.20	H	2-CH ₃	H	H	-CO-NH-C ₂ H ₅	
1.21	H	2-CH ₃	H	H	-CO-NH-C ₃ H ₅ -c	
1.23	H	2-(CH ₂) ₄ -2		H	-CO-NH-CH ₃	

Vegyület száma	R ¹	R ⁶	R ⁷	R ¹⁰	L	Fizikai adatok /op./
1.24	H	2-(CH ₂) ₄ -2	H		-CO-NH-OCH ₃	135-137°C
1.25	H	2-C ₂ H ₅	2-C ₂ H ₅	H	-CO-NH-CH ₃	
1.26	H	2-CH ₃	2-C ₂ H ₅	H	-CO-NH ₂	
1.27	H	2-CH ₃	2-C ₂ H ₅	H	-CN	
1.28	H	2-CH ₃	2-C ₂ H ₅	H	-CO-NH-CH ₃	
1.29	H	2-CH ₃	2-C ₂ H ₅	H	-CO-S-CH ₃	
1.30	H	2-CH ₃	2-C ₂ H ₅	H	-CO-NH-OCH ₃	
1.31	H	H	H	H	-CO-NH-CH ₃	HNO ₃ /op. 133,0°C
1.32	H	2-CH ₃	2-CH ₃	H	1-metil-1H-tetrazol-5-il	>100°C (bomlik)
1.33	H	2-CH ₃	2-CH ₃	H	-CO-NH-NH-CH ₃	
1.34	H	2-CH ₃	2-CH ₃	H	$\begin{array}{c} \text{N-OH} \\ \diagup \\ \text{C} \\ \diagdown \\ \text{NH}_2 \end{array}$	
1.35	H	2-CH ₃	2-CH ₃	H	5-(trifluor-metil)-1,2,4-oxadiazol-3-il	92-98°C
1.36	H	2-CH ₃	2-CH ₃	H	-CO-N(C ₂ H ₅) ₂	100-100,5°C
1.37	H	2-CH ₃	2-CH ₃	H	2-imidazolin-2-il	155-156°C
1.38	SH	2-(CH ₂) ₃ -3	H		-CO-NH-CH ₃	λ/op. 190,1°C
1.39	H	2-(CH ₂) ₃ -3	H		-CO-NH-CH ₃	
1.40	SH	2-(CH ₂) ₄ -3	H		-CO-NH-CH ₃	
1.41	H	2-(CH ₂) ₄ -3	H		-CO-NH-CH ₃	
1.44	H	2-CH ₃	2-CH ₃	H	-CO-NH-COCH ₃	
1.45	H	2-CH ₃	2-CH ₃	H	benzimidazol-2-il	

Vegyület száma	R ¹	R ⁶	R ⁷	R ¹⁰	L	Fizikai adatok /op./
1.47	H	2-CH ₃	2-CH ₃	H	3-metil-1,2,4- -oxa-diazol- -5-il	
1.49	H	2-CH ₃	2-CH ₃	6-F	-CO-NH-CH ₃	
1.51	H	2-CH ₃	2-CH ₃	6-Br	-CO-NH-CH ₃	
1.52	SH	2-CH ₃	2-CH ₃	6-Br	-CO-NH-CH ₃	
1.53	H	2-CH ₃	2-CH ₃	5-F	-CO-NH-CH ₃	
1.55	H	2-(CH ₂) ₅ -2		H	-CO-NH-CH ₃	
1.56	SH	2-(CH ₂) ₅ -2		H	-CO-NH-CH ₃	
1.57	H	2-CH ₃	2-CH ₃	H	piperazino- -karbonil	
1.58	SH	2-CH ₃	2-CH ₃	H	piperazino- -karbonil	
1.59	H	2-CH ₃	2-CH ₃	H	4-metil-pipe- razino-karbonil	
1.60	SH	2-CH ₃	2-CH ₃	H	4-metil-pipe- razino-karbonil	

Vegyület száma	R ¹	R ⁶	R ⁷	R ¹⁰	L	Fizikai ada- tok /op./
1.67	H	3-CH ₃	3-CH ₃	H	-CO-NH-CH ₃	167,4°C
1.68	H	3-CH ₃	H	H	-CO-NH-CH ₃	HNO ₃ /op 99,4°C
1.69	H	2-CH ₃	2-CH ₃	H	-CO-NH-CH ₃	H ₂ O
1.70	H	2-CH ₃	2-CH ₃	H	morfolino-kar- bonil	148-149°C
1.71	H	2-CH ₃	2-CH ₃	H	2,6-dimetil-mor- folino-karbonil	155-157°C
1.72	H	2-CH ₃	2-CH ₃	H	-CO-N[CH(CH ₃) ₂] ₂	228-229°C
1.73	H	2-CH ₃	2-CH ₃	H	-CO-NH ₂	218-219°C
1.74	H	2-CH ₃	2-CH ₃	H	-CO-NH-CH ₃	(±) 138-145°C [α] _D ^{-54,7°} 0,25 H ₂ O
1.75	H	2-CH ₃	2-CH ₃	5-Cl	-CO-NH-CH ₃	HNO ₃ /op. 199,1°C
1.76	H	2-CH ₃	2-CH ₃	H	-COO-N=C(CH ₃) ₂	81-83°C
1.77	H	2-CH ₃	2-CH ₃	H	-COO-C ₆ H ₅	99-101°C
1.78	H	2-CH ₃	2-CH ₃	H	-COO-(CH ₂) ₃ Cl	
1.79	H	2-CH ₃	2-CH ₃	H	-COO-CH ₂ COOCH ₃	
1.80	H	2-CH ₃	2-CH ₃	H	-COO-CH(CH ₃)COOCH ₃ (R)	gyanta
1.81	H	2-CH ₃	2-CH ₃	H	-COO-CH(CH ₃)COOCH ₃ (S)	gyanta
1.82	H	2-CH ₃	2-CH ₃	H	-COO-CH ₂ PO(OC ₂ H ₅) ₂	88,5-90°C
1.84	H	2-CH ₃	2-CH ₃	H	-COO-CH ₂ Si(CH ₃) ₃	
1.85	H	2-CH ₃	2-CH ₃	H	COO-(CH ₂) ₂ Si(CH ₃) ₃	olaj

Vegyület száma	R ¹	R ⁶	R ⁷	R ¹⁰	L	Fizikai adatok /op./
1.86	H	2-CH ₃	2-CH ₃	H	-CONH ₂	op190-192°C [α] _D =-91,1°
1.87	H	2-CH ₃	2-CH ₃	H	-CONH ₂	(+)
1.88	H	2-CH ₃	2-CH ₃	H	-CONH-CH ₃	(+)
1.89	H	2-CH ₃	3-CH ₃	H	-CONH-CH ₃	
1.90	H	2-CH ₃	3-CH ₃	H	-CONH-CH ₃	1,2-cisz 2,3-cisz
1.91	H	2-CH ₃	3-CH ₃	H	-CONH-CH ₃	1,2-cisz 2,3-transz
1.92	H	2-CH ₃	3-CH ₃	H	-CONH-CH ₃	1,2-transz: 2,3-cisz
1.93	H	2-CH ₃	3-CH ₃	H	-CONH-CH ₃	1,2-transz; 2,3-transz
1.94	H	2-CH ₂ -C ₆ H ₅	H	H	-CONH-CH ₃	1,2-transz NHO ₃ .109,0°C
1.95	H	2-CH ₂ -C ₆ H ₅	H	H	-CONH-CH ₃	1/2H ₂ O, 1,2-cisz 98,4°C
1.96	H	2-CH ₃	2-CH ₃	H	-CONH-NH ₂	164-169°C
1.97	H	2-CH ₃	2-CH ₃	H	-CONHCH ₂ -C ₆ H ₅	54-57°C
1.98	H	2-CH ₃	2-CH ₃	H	-CN	[α] _D =-59,1±1,2 gyanta

2. táblázat

/Id/ általános képletű vegyületek előállítása

Vegyület száma	R ¹	R ⁶	R ⁷	R ¹⁰	L	Fizikai adatok /op./
2.01	H	H	H	6-Cl	-CO-NH-CH ₃	HNO ₃ /op. 177,7°C
2.02	H	H	H	7-F	-CO-NH-CH ₃	HNO ₃ /op. 164°C
2.03	H	H	H	H	-CO-NH-CH ₃	HNO ₃ /op. 155,5°C
2.04	H	2-CH ₃	2-CH ₃	H	-CO-NH-CH ₃	HNO ₃ /op. 195,2°C
2.05	H	H	H	H	piperidino- -karbonil	HNO ₃ op. 148,3°C
2.06	H	H	H	H	piperidino- -karbonil	118°C
2.07	H	H	H	H	-CO-NH-C ₂ H ₅	HNO ₃ /op. 143,5°C
2.08	H	H	H	H	-CO-NH ₂	207-208°C
2.09	H	H	H	H	pirrolidino- -karbonil	200-201°C
2.10	H	H	H	H	morfolino- -karbonil	szilárd
2.11	H	H	H	H	-CN	89-90°C
2.12	H	H	H	H	-CO-NH-C ₃ H ₅ -c	166-167°C
2.13	H	H	H	H	-CO-NH-C ₃ H ₇ -n	137-138°C
2.14	H	H	H	H	-CO-NH-OCH ₃	112-113°C
2.15	H	H	H	H	-CO-NH-CH ₃	105-106°C
2.16	H	H	H	H	-CO-N(CH ₃) ₂	
2.17	H	H	H	H	-CO-NH-C ₄ H ₉ -n	

Vegyület száma	R ¹	R ⁶	R ⁷	R ¹⁰	L	Fizikai adatok /op./
2.18	H	H	H	H	-CO-NH-CH ₂ -C≡CH	HNO ₃ / op. 128°C
2.19	H	H	H	H	-CO-NH-CH ₃	HNO ₃ /op. 159°C
2.20	H	H	H	H	-CO-SCH ₃	
2.21	H	H	H	H	-CO-NH-C ₃ H ₇ -i	
2.22	H	H	H	H	-CO-NH-C ₅ H ₁₁ -n	
2.23	H	H	H	H	-CO-S-C ₂ H ₅	
2.24	H	H	H	H	-CO-NH-C ₆ H ₁₁ -c	
2.25	H	2-CH ₃	2-CH ₃	H	-CO-NH ₂	238,2°C
2.26	H	2-CH ₃	2-CH ₃	H	-CN	81,9°C
2.27	H	2-CH ₃	2-CH ₃	H	-CO-NH-C ₂ H ₅	116,9°C
2.28	H	2-CH ₃	2-CH ₃	H	-CO-N(CH ₃) ₂	
2.29	H	2-CH ₃	2-CH ₃	H	-CO-NH-C ₃ H ₅ -c	80,7°C
2.30	H	2-CH ₃	2-CH ₃	H	-CO-S-CH ₃	
2.31	H	2-CH ₃	2-CH ₃	H	-CO-S-C ₂ H ₅	
2.32	H	2-CH ₃	2-CH ₃	H	piperidino- -karbonil	
2.33	H	2-CH ₃	2-CH ₃	H	morfolino- -karbonil	
2.34	H	2-CH ₃	2-CH ₃	H	-CO-NH-CH ₂ -C≡CH	HCl 1/2H ₂ O 141,2°C
2.35	H	2-CH ₃	2-CH ₃	H	-CO-NH-CH ₃	HNO ₃ /op. 132,4°C
2.36	H	2-CH ₃	2-CH ₃	H	-CO-NH-OCH ₃	
2.37	H	2-CH ₃	2-CH ₃	H	-CO-NH-C ₃ H ₇ -n	
2.38	H	2-CH ₃	2-CH ₃	H	pirrolidino- -karbonil	
2.39	H	2-CH ₃	H	H	-CO-NH-CH ₃	

Vegyület száma	R ¹	R ⁶	R ⁷	R ¹⁰	L	Fizikai adatok /op /
2.40	H	2-CH ₃	H	H	-CO-S-CH ₃	124,1°C 150,3°C
2.41	H	2-CH ₃	H	H	-CO-NH-OCH ₃	
2.42	H	H	H	H	-CO-NH-CH ₂ -CH ₂ OH	
2.43	H	2-CH ₃	2-CH ₃	H	-CO-NH-CH ₂ -CH ₂ OH	
2.49	H	2-(CH ₂) ₄ -2	H	H	-CO-NH ₂	220- 227,7°C
2.50	H	2-(CH ₂) ₄ -2	H	H	-CN	
2.51	H	2-(CH ₂) ₄ -2	H	H	-CO-NH-CH ₃	
2.52	H	2-(CH ₂) ₄ -2	H	H	-CO-S-CH ₃	
2.53	H	2-(CH ₂) ₄ -2	H	H	-CO-NH-OCH ₃	
2.54	H	2-(CH ₂) ₅ -2	H	H	-CO-NH ₂	
2.55	H	2-(CH ₂) ₅ -2	H	H	-CN	
2.56	H	2-(CH ₂) ₅ -2	H	H	-CO-NH-CH ₃	
2.57	H	2-(CH ₂) ₅ -2	H	H	-CO-S-CH ₃	
2.58	H	2-(CH ₂) ₅ -2	H	H	-CO-NH-OCH ₃	
2.59	SH	2-(CH ₂) ₅ -2	H	H	-CO-NH-OCH ₃	
2.60	H	2-C ₂ H ₅	H	H	-CO-NH-CH ₃	
2.61	H	2-C ₃ H ₇ -n	H	H	-CO-NH-CH ₃	
2.62	H	2-C ₄ H ₉ -n	H	H	-CO-NH-CH ₃	
2.64	H	2-C ₃ H ₇ -i	H	H	-CO-NH-CH ₃	
2.65	SH	2-CH ₃	2-CH ₃	H	-CO-NH ₂	
2.66	SH	2-CH ₃	2-CH ₃	H	-CN	
2.67	SH	2-CH ₃	2-CH ₃	H	-CO-NH-CH ₃	
2.68	SH	2-CH ₃	2-CH ₃	H	-CO-NH-NH ₂	
2.69	SH	H	H	H	-CO-NH ₂	

Vegyület száma	R ¹	R ⁶	R ⁷	R ¹⁰	R ¹¹	L	Fizikai adatok /op./
2.70	H	H	H	H		1-metil-1H-tetrazol-5-il	244,2°C
2.72	H	H	H	H		-C(NH ₂)=N-OH	
2.73	H	H	H	H		3,4,5,6-tetrahidro-pirimidin-2-il	
2.74	H	2-(CH ₂) ₃ -3		H		-CO-NH-CH ₃	
2.75	H	3-(CH ₂) ₃ -4		H		-CO-NH-CH ₃	
2.76	H	2-CH ₃	2-CH ₃	H		-C(NH ₂)=N-OH	
2.77	H	2-CH ₃	2-CH ₃	H		5-(trifluor-metil)-1,2,4-oxadiazol-3-il	
2.78	H	2-CH ₃	2-CH ₃	H		-CO-N(C ₂ H ₅) ₂	
2.79	H	2-CH ₃	2-CH ₃	H		2-imidazolin-2-il	
2.80	H	2-CH ₃	2-CH ₃	H		3-metil-1,2,4-oxadiazol-5-il	
2.81	H	2-CH ₃	2-CH ₃	H		-CO-NH-C ₅ H ₁₁ -n	228,5°C
2.82	H	2-CH ₃	2-CH ₃	H		benzimidazol-2-il	
2.83	H	2-(CH ₂) ₄ -3		H		-CO-NH-CH ₃	
2.84	H	2-(CH ₂) ₄ -3		H		-CO-NH-CH ₃	HNO ₃ /op. 127,8°C
2.85	H	H	H	H		-CO-NH-CH ₂ -CH=CH ₂	
2.86	H	H	H	H		-CO-NH-NH ₂	
2.87	H	H	H	H		-CO-NH-NH-CO-CH ₃	257,8°C
2.88	H	H	H	H		pirrolidinó-karbonil	HNO ₃ /op. 158,8°C

Vegyület száma	R ¹	R ⁶	R ⁷	R ¹⁰	L	Fizikai adatok /op./
2.89	H	H	H	H	-CS-NH-CH ₃	174,1°C
2.90	H	H	H	H	-CO-NH-OH	122,1°C
2.91	H	H	H	H	$\begin{array}{c} \text{CH}_3 \\ \\ \text{-CO-NH-C-CH}_2\text{-OH} \\ \\ \text{CH}_3 \end{array}$	159,4°C
2.92	H	2-CH ₃	2-CH ₃	H	-CO-NH-CH ₂ -CH=CH ₂	HCl 1/2H ₂ O 128,2°C
2.93	H	2-CH ₃	2-CH ₃	H	-CO-NH-(CH ₂) ₂ -OCH ₃	121,0°C
2.94	H	2-CH ₃	2-CH ₃	H	-CO-NH-OH	133,7°C
2.95	H	H	H	H	4,4-dimetil-2-oxazolin-2-il	107,4°C
2.96	H	2-CH ₃	2-CH ₃	H	imidazol-1-il-karbonil	122,4°C
2.97	H	3-(CH ₂) ₄ -4		H	-CO-NH-CH ₃	HNO ₃ /op. 177,8°C
2.98	SH	2-CH ₃	2-CH ₃	H	-CO-NH-C ₄ H ₉ -n	
2.99	H	2-CH ₃	2-CH ₃	H	CONH-(CH ₂) ₂ OCOCH ₃	155,9°C
2.100	H	2-CH ₃	2-CH ₃	H	-COO-N=C(CH ₃) ₂	
2.101	H	2-CH ₃	2-CH ₃	H	-COO-CH ₂ CN	
2.102	H	2-CH ₃	2-CH ₃	H	-COO-CH ₂ CH ₂ OCOCH ₃	78°C

Vegyület száma	R ¹	R ⁶	R ⁷	R ¹⁰	L	Fizikai adatok /op./
2.112	H	2-CH ₃	2-CH ₃	H	-COO-N=C(CH ₃) ₂	HCl
2.113	H	2-CH ₃	2-CH ₃	H	-COO-N=C(CH ₃) ₂	HNO ₃
2.114	SH	2-CH ₃	2-CH ₃	H	-COO-C ₆ H ₅	
2.115	H	H	H	H	-COO-(CH ₂) ₂ N(CH ₃) ₂	2HNO ₃ /op. 133-136°C
2.116	H	H	H	H	-COO-N=C(CH ₃) ₂	125,7°C
2.117	H	H	H	H	ciklohexilidén- -iminó-oxi-kar- bonil	HNO ₃ /op. 159,2°C
2.118	H	H	H	H	-COO-CH ₂ -CN	109,6°C
2.119	H	H	H	H	-COO-C ₆ H ₅	HNO ₃ /op. 153,6°C
2.120	H	H	H	H	-COO-CH ₂ -S-CH ₃	99,4°C
2.121	H	H	H	H	-COO-CH ₂ COOCH ₃	HCl/op. 189,5°C
2.122	H	H	H	H	-COO-CH ₂ -CH ₂ OCOCH ₃	77,2°C
2.124	H	H	H	H	-COO-CH(CH ₃)- CO-OCH ₃	HCl/op. 151,5°C
2.125	H	H	H	H	-COO-CH ₂ -CO-CH ₃	HCl/op. 130,2°C
2.126	H	H	H	H	-COO-(CH ₂) ₂ -OH	104,3°C
2.127	H	2-CH ₃	2-CH ₃	H	-COO-CH ₂ -CH ₂ OH	108,1°C
2.128	H	2-CH ₃	2-CH ₃	H	-CO-NH-C ₃ H ₇ -i	
2.129	H	2-CH ₃	2-CH ₃	H	1H-tetrazol-5- -il	155,7°C
2.130	H	2-CH ₃	2-CH ₃	H	-CO-NH-CH ₃	(+)
2.131	H	2-CH ₃	2-CH ₃	H	-CO-NH-CH ₃	(-)

Vegyület száma	R ¹	R ⁶	R ⁷	R ¹⁰	L	Fizikai adatok /op./
2.132	H	2-CH ₃	2-CH ₃	H	-CO-NH ₂	(+)
2.133	H	2-CH ₃	2-CH ₃	H	-CO-NH ₂	(-)
2.134	H	2-CH ₃	3-CH ₃	H	-CO-NH-CH ₃	
2.135	H	2-CH ₃	3-CH ₃	H	-CO-NH-CH ₃	1,2-cisz; 2,3-cisz
2.136	H	2-CH ₃	3-CH ₃	H	-CO-NH-CH ₃	1,2-cisz; 2,3-transz
2.137	H	2-CH ₃	3-CH ₃	H	-CO-NH-CH ₃	1,2-transz; 2,3-cisz
2.138	H	2-CH ₃	3-CH ₃	H	-CO-NH-CH ₃	1,2-transz: 2,3-transz
2.139	H	2-(CH ₂) ₃ -3		H	-CO-NH-CH ₃	
2.140	H	2-(CH ₂) ₄ -3		H	-CO-NH-CH ₃	
2.141	H	2-(CH ₂) ₂ -4		H	-CO-NH-CH ₃	
2.142	H	2-(CH ₂) ₃ -4		H	-CO-NH-CH ₃	
2.143	H	2-(CH ₂) ₂ -4		H	imidazol-1-il- -karbonil	219,6°C

3. táblázat

/Iq/ általános képletű vegyületek előállítása

Vegyület száma	R ¹		L	Fizikai ada- tok /op./
5.01	H		-CO-NH-CH ₃	198°C
5.02	SH		-CO-NH-CH ₃	
5.03	H		-CO-NH ₂	201,1°C
5.04	SH		-CO-NH ₂	
5.05	H		-CN	
5.06	SH		-CN	
5.07	H		-CO-SCH ₃	
5.08	H		-CO-NH-OCH ₃	
5.11	H		pirolidino- -karbonil	163,4°C
5.12	H		piperidino- -karbonil	159,0°C
5.13	H		-CO-NH-CH ₂ C≡CH	174,6°C
5.14	H		-CO-NH-CH ₂ -CH ₃	148,3°C
5.15	H		-CO-N(CH ₃) ₂	140,4°C
5.16	H		4-metil-pipe- razino-karbonil	200,6°C
5.17	H		-CO-NH-CH(CH ₃) ₂	176,3°C
5.18	H		-CO-NH-CH ₂ -CH=CH ₂	72,6°C
5.19	H		-CO-NH-C ₆ H ₁₁ -c	174,1°C
5.20	H		morfolino-kar- bonil	177,4°C

Vegyület száma	R^1		L	Fizikai ada- tok (op.)
5.21	H		tiomorfolinó- -karbonil -CO-NH-C ₂ H ₅	201,0°C
5.22	H			
5.23	H		piperazino-kar- bonil	158,3°C
5.24	H		-CO-NH-C ₃ H ₅ -c	HCl/op. 237,6°C
5.25	H		4-(metil-karbo- nil)-piperazino- -karbonil	HNO ₃ /op. 187,8°C
5.26	H		-COO-N=C(CH ₃) ₂	150,1°C
5.27	H		ciklohexilidén- imino-oxi- -karbonil	146,8°C

4. táblázat

/Ih/ általános képletű vegyületek előállítása

Vegyület száma	R ¹	R ⁶	R ⁷	R ¹⁰	L	Fizikai adatok /°C /
6.01	H	2-CH ₃	2-CH ₃	H	morfolino-kar- bonil	132°C
6.02	H	2-CH ₃	2-CH ₃	H	-CO-NH-C ₂ H ₅	188°C
6.03	H	2-CH ₃	2-CH ₃	H	-CO-NH-C ₃ H ₇ -i	153°C
6.04	H	2-CH ₃	2-CH ₃	H	-CO-NH-C ₃ H ₇ -n	191°C
6.05	H	2-CH ₃	2-CH ₃	H	pirrolidino- -karbonil	115°C
6.06	H	2-CH ₃	2-CH ₃	H	piperidino- -karbonil	128°C
6.07	H	2-CH ₃	2-CH ₃	H	-CO-NH-CH ₃	188°C
6.08	H	2-CH ₃	2-CH ₃	H	-CO-S-CH ₃	120°C
6.09	H	2-CH ₃	2-CH ₃	H	-CO-N(CH ₃) ₂	178°C
6.10	H	2-CH ₃	2-CH ₃	H	-CO-NH ₂	156°C
6.11	H	2-CH ₃	2-CH ₃	H	-CO-NH-CH ₂ -CH ₂ OH	178°C
6.12	H	2-CH ₃	2-CH ₃	H	-CO-NH-NH ₂	168, 2°C
6.13	H	2-CH ₃	2-CH ₃	H	-CN	
6.14	H	2-CH ₃	2-CH ₃	H	-CO-NH-C ₄ H ₉ -n	
6.15	H	2-CH ₃	H	H	-CO-NH ₂	
6.16	H	2-CH ₃	H	H	-CO-NH-NH-CH ₃	
6.17	H	2-CH ₃	H	H	pirrolidino- -karbonil	
6.18	H	2-CH ₃	H	H	piperidino- -karbonil	

Vegyület száma	R ¹	R ⁶	R ⁷	R ¹⁰	L	Fizikai adatok /op./
6.19	H	2-CH ₃	H	H	-CO-NH-CH ₂ -CH ₂ OH	
6.20	H	2-CH ₃	H	H	-CO-N(CH ₃) ₂	
6.21	H	2-CH ₃	H	H	-CO-NH-C ₃ H ₇ -n	
6.22	H	3-CH ₃	H	H	-CO-NH-CH ₃	
6.23	H	3-CH ₃	H	H	-CO-NH-C ₃ H ₇ -n	
6.24	H	2-CH ₃	2-CH ₃	H	piperazino-kar- bonil	157,5°C
6.25	H	2-CH ₃	2-CH ₃	H	-CO-NH-OH	149°C
6.26	SH	2-CH ₃	2-CH ₃	H	-CO-NH-CH ₃	
6.27	H	2-CH ₃	2-CH ₃	H	-CO-SCH ₃	
6.28	H	2-CH ₃	2-CH ₃	H	-CO-NH-CH ₂ -CH=CH ₂	168°C
6.29	H	2-CH ₃	2-CH ₃	H	-CO-NH-CH ₂ -C≡CH	140,1°C
6.30	H	2-CH ₃	2-CH ₃	H	-CO-NH-NH-CH ₃	188°C
6.31	H	H	H	H	-CO-NH-CH ₃	192°C
6.32	H	2-(CH ₂) ₄ -3	H	H	-CO-NH-CH ₃	HNO ₃ /OP. 162°C
6.33	H	2-(CH ₂) ₄ -3	H	H	-CO-NH-CH ₃	HNO ₃ /OP. 160°C
6.34	H	2-(CH ₂) ₃ -3	H	H	-CO-NH-CH ₃	
6.35	H	2-CH ₃	H	H	-CO-NH-CH ₃	cis/OP 247,1°C
6.36	H	2-CH ₃	H	H	-CO-NH-CH ₃	trans/HNO ₃ 179,2°C
6.37	H	2-CH ₃	2-CH ₃	H	1-metil-1H-tet- razol-5-il	
6.38	H	2-CH ₃	2-CH ₃	H	-C(NH ₂)=N-OH	
6.39	H	2-CH ₃	2-CH ₃	H	5-(trifluor-me- til)-1,2,4-oxa- diazol-3-il	
6.40	H	2-CH ₃	2-CH ₃	H	2-imidazolin- -2-il	

Vegyület száma	R ¹	R ⁶	R ⁷	R ¹⁰	L	Fizikai adatok /op./
6.41	H	2-CH ₃	2-CH ₃	H	3,4,5,6-tetra- hidro-pirimi- din-2-il	
6.42	H	2-CH ₃	H	H	-CO-NH ₂	trans ₂
6.43	H	2-CH ₃	H	H	-CO-NH ₂	cis ₂
6.44	H	2-CH ₃	H	H	-CO-NH-CH ₃	trans ₂ /HNO ₃ 176, 2°C
6.45	H	2-CH ₃	H	H	-CO-NH-CH ₃	cis ₂
6.46	H	2-CH ₃	H	H	-CO-NH-C ₂ H ₅	trans ₂
6.47	H	2-CH ₃	H	H	-CO-NH-C ₂ H ₅	cis ₂
6.48	H	2-CH ₃	H	H	-CO-NH-C ₃ H ₇ -n	trans ₂
6.49	H	2-CH ₃	H	H	-CO-NH-C ₃ H ₇ -n	cis ₂
6.50	H	2-CH ₃	H	H	-CO-N(CH ₃) ₂	trans ₂
6.51	H	2-CH ₃	H	H	-CO-N(CH ₃) ₂	cis ₂
6.52	H	2-CH ₃	H	H	morfolino- -karbonil	trans ₂
6.53	H	2-CH ₃	H	H	morfolino- -karbonil	cis ₂
6.54	H	2-CH ₃	H	H	piperidino- -karbonil	trans ₂
6.55	H	2-CH ₃	H	H	piperidino- -karbonil	cis ₂
6.56	H	2-CH ₃	H	H	pirrolidino- -karbonil	trans ₂
6.57	H	2-CH ₃	H	H	pirrolidino- -karbonil	cis ₂
6.58	H	2-CH ₃	H	H	-CO-NH-NH ₂	trans ₂
6.59	H	2-CH ₃	H	H	-CO-NH-NH ₂	cis ₂
6.60	H	2-CH ₃	H	H	-CN	trans ₂
6.61	H	2-CH ₃	H	H	-CN	cis ₂
6.62	H	2-CH ₃	H	H	-CO-NH-NH-CH ₃	trans ₂

Vegyület száma	R ¹	R ⁶	R ⁷	R ¹⁰	L	Fizikai adatok /op./
6.63	H	2-CH ₃	H	H	-CO-NH-NH-CH ₃	cisz
6.64	H	2-CH ₃	H	H	-CO-NH-OH	transz
6.65	H	2-CH ₃	H	H	-CO-NH-OH	cisz
6.66	H	H	H	8-Cl	-CO-NH-CH ₃	HNO ₃ /op. 183,1°C
6.67	H	2-(CH ₂) ₄ -2		6-Br	-CO-NH-CH ₃	HNO ₃ /op. 176,2°C
6.68	H	2-(CH ₂) ₄ -2		H	-CO-NH-CH ₃	HNO ₃ /op. 157,2°C
6.69	H	H	H	6-Cl	-CO-NH-CH ₃	HNO ₃ /op. 181,6°C
6.70	H	2-CH ₃	2-CH ₃	H	-CO-N(CH ₃)-OCH ₃	104,7°C
6.71	H	2-CH ₃	2-CH ₃	H	-CO-NHOCH ₃	214,1°C
6.72	H	2-CH ₃	2-CH ₃	H	-CO-NH-CH-CH ₂ -CH ₃ CH ₂ -OH	163,3°C
6.73	H	2-CH ₃	2-CH ₃	H	-CO-NH-O-CH ₂ -C ₆ H ₅	86,3°C
6.74	H	2-C ₂ H ₅	H	H	-CO-NH-CH ₃	cisz op. 205,6°C
6.75	H	2-CH ₃	2-CH ₃	H	-CO-NH-(CH ₂) ₂ OCH ₃	141,2°C
6.76	H	2-CH ₃	3-CH ₃	H	-CO-NH-CH ₃	(A+B)/HNO ₃ 157,3°C
6.77	H	2-CH ₃	2-CH ₃	H	4-metil-pipera- zino-karbonil	119,7°C
6.79	H	2-CH ₃	2-CH ₃	H	-CO-NH-CH ₂ -CH ₂ - O-CO-CH ₃	106,4°C
6.80	H	2-CH ₃	2-CH ₃	H	4-(metil-karbo- nil)-piperazino- -karbonil	176,2°C
6.81	H	2-CH ₃	2-CH ₃	H	4-(metil-karba- moil)-piperazi- no-karbonil	115,9°C
6.82	H	2-CH ₃	H	6-F	-CO-NH-CH ₃	transz NHO ₃ 185,2°C
6.83	H	2-CH ₃	H	6-F	-CO-NH-CH ₃	cisz op. 208,2°C
6.84	H	2-CH ₃	H	H	-COO-N=C(CH ₃)	
6.85	H	2-CH ₃	H	H	COO-CH ₂ CH ₂ Si(CH ₃) ₃	

Vegyület száma	R ¹	R ⁶	R ⁷	R ¹⁰	L	Fizikai adatok /op./
6.86	H	2-CH ₃	H	H	COO-CH ₂ -COOCH ₃	
6.87	H	2-CH ₃	H	H	COO-(CH ₂) ₃ -Cl	
6.89	H	2-CH ₃	2-CH ₃	H	-COO-N=C(CH ₃) ₂	HNO ₃ /op. 146,9°C
6.90	H	2-CH ₃	2-CH ₃	H	ciklohexilidén- -imino-oxi- -karbonil CONH-CH ₃	HNO ₃ /op. 144,5°C
6.91	SH	2-CH ₃	3-CH ₃	H	CONH-CH ₃	
6.92	H	2-CH ₃	3-CH ₃	H	CONH-CH ₃	
6.93	H	2-CH ₃	3-CH ₃	H	CONH-CH ₃	2,3-cisz; 3,4-transz .HNO ₃ /op. 189,5°C
6.94	H	2-CH ₃	3-CH ₃	H	CONH-CH ₃	2,3-cisz; 3,4-cisz
6.95	H	2-CH ₃	3-CH ₃	H	CONH-CH ₃	2,3-transz; 3,4-cisz
6.96	H	2-CH ₃	3-CH ₃	H	CONH-CH ₃	2,3-transz 3,4-transz
6.97	H	2-CH ₃	3-CH ₃	H	CONH-CH ₃	2,3-cisz 3,4-transz(+)
6.98	H	2-CH ₃	3-CH ₃	H	CONH-CH ₃	2,3-cisz 3,4-transz(-)
6.99	H	2-CH ₃	3-CH ₃	H	CONH-CH ₃	2,3-cisz; 3,4-cisz(+)
6.100	H	2-CH ₃	3-CH ₃	H	CONH-CH ₃	2,3-cisz; 3,4-cisz(-)
6.101	H	2-CH ₃	3-CH ₃	H	CONH-CH ₃	2,3-transz 3,4-cisz(+)
6.102	H	2-CH ₃	3-CH ₃	H	CONH-CH ₃	2,3-transz 3,4-cisz(-)
6.103	H	2-CH ₃	3-CH ₃	H	CONH-CH ₃	2,3-transz 3,4-transz(+)
6.104	H	2-CH ₃	3-CH ₃	H	CONH-CH ₃	2,3-transz 3,4-transz(-)
6.105	H	2-C ₃ H ₇ ⁱ	H	H	CONH-CH ₃	trans/HNO ₃ /1/2H ₂ O 156,3°C
6.106	H	2-C ₄ H ₉ ^t	H	H	CONH-CH ₃	trans/HNO ₃ /H ₂ O 156,3°C

5. táblázat

/Ii/ általános képletű vegyületek előállítás

Vegyület száma	R ¹	R ⁶	R ⁷	L	Fizikai adatok /op./
7.3	SH	CH ₃	CH ₃	CO-NH-CH ₃	.HNO ₃ /op - 190,8°C (+) (-)
7.4	H	CH ₃	CH ₃	CO-NH-CH ₃	
7.5	H	CH ₃	CH ₃	CO-NH-CH ₃	
7.6	H	CH ₃	CH ₃	CO-NH-CH ₃	
7.10	H	CH ₃	CH ₃	CN	
7.11	H	CH ₃	CH ₃	CO-NH ₂	

6 táblázat

/Ij/ általános képletű vegyületek előállítás

Vegy. száma	R ¹	L	Fizikai adatok /op./
8.01	H	CONHCH ₃	HCl 1/2 H ₂ O 176,3°C
8.02	SH	CONHCH ₃	163,3°C
8.05	H	CN	HNO ₃ /op. 136,5°C
8.06	H	CONH ₂	

7. táblázat

/Im/ általános képletű vegyületek előállítás

Vegyület száma	R ¹	L	Fizikai ada- tok /op./
11.01	H	-CO-NH ₂	125,2°C
11.02	H	-CN	
11.03	H	-CO-NH-CH ₃	
11.04	H	-CO-NH-OCH ₃	
11.05	H	-CO-SCH ₃	
11.11	SH	-CO-NH ₂	

8. táblázat

/Ip/ általános képletű vegyületek előállítás

Vegy. száma	R ¹	A	Z	L	Fizikai adatok /op./
13.01	H	C ₃ H ₇ -n	3-Cl-C ₆ H ₄	-CO-NH-CH ₃	138°C
13.02	H	C ₃ H ₇ -n	3-Cl-C ₆ H ₄	-CO-NH ₂	
13.03	H	C ₃ H ₇ -n	3-Cl-C ₆ H ₄	-CO-SCH ₃	
13.04	H	C ₃ H ₇ -n	3-Cl-C ₆ H ₄	-CO-NH-OCH ₃	
13.05	H	C ₃ H ₇ -n	3-Cl-C ₆ H ₄	-CO-NH-C ₃ H ₇ -n	
13.06	H	C ₃ H ₇ -n	2-Cl-C ₆ H ₄	-CO-NH-CH ₃	
13.07	H	C ₃ H ₇ -n	2-Cl-C ₆ H ₄	-CO-NH ₂	
13.08	H	C ₃ H ₇ -n	2-Cl-C ₆ H ₄	-CO-NH-C ₂ H ₅	
13.09	H	C ₃ H ₇ -n	2-Cl-C ₆ H ₄	-CO-S-CH ₃	
13.10	H	C ₃ H ₇ -n	2-Cl-C ₆ H ₄	-CN	
13.11	H	C ₃ H ₇ -n	C ₆ H ₅	-CO-NH-CH ₃	HNO ₃ /op. 181,3°C
13.12	H	C ₃ H ₇ -n	C ₆ H ₅	-CO-NH ₂	
13.13	H	C ₃ H ₇ -n	C ₆ H ₅	-CO-S-CH ₃	
13.14	H	C ₃ H ₇ -n	C ₆ H ₅	-CO-NH-OCH ₃	
13.15	H	C ₃ H ₇ -n	C ₆ H ₅	-CO-NH-C ₃ H ₇ -n	
13.16	H	benzil	C ₆ H ₅	-CO-NH-CH ₃	
13.17	H	benzil	C ₆ H ₅	-CO-NH ₂	
13.18	H	benzil	C ₆ H ₅	-CO-NH-C ₂ H ₅	
13.19	H	benzil	C ₆ H ₅	-CO-SCH ₃	
13.20	H	benzil	C ₆ H ₅	-CN	
13.21	H	C ₃ H ₇ -n	2-CH ₃ -C ₆ H ₄	-CO-NH-CH ₃	HNO ₃ /op. 202,2°C
13.22	H	C ₃ H ₇ -n	2-CH ₃ -C ₆ H ₄	-CO-NH ₂	
13.23	H	C ₃ H ₇ -n	2-CH ₃ -C ₆ H ₄	-CO-SCH ₃	
13.24	H	C ₃ H ₇ -n	2-CH ₃ -C ₆ H ₄	-CO-NH-OCH ₃	
13.25	H	C ₃ H ₇ -n	2-CH ₃ -C ₆ H ₄	-CO-NH-C ₃ H ₇ -n	
13.26	H	2-piridil	C ₆ H ₅	-CO-NH-CH ₃	
					HCl/ op. 234,5°C

Vegyület száma	R ¹	A	Z	L	Fizikai adatok /op./
13.27	H	2-piridil	C ₆ H ₅	-CO-NH ₂	154°C
13.28	H	2-piridil	C ₆ H ₅	-CO-N(CH ₃) ₂	
13.29	H	2-piridil	C ₆ H ₅	-CO-SCH ₃	
13.30	H	2-piridil	C ₆ H ₅	-CN	
13.31	H	C ₃ H ₇ -i	3-Cl-C ₆ H ₄	-CO-NH-CH ₃	
13.32	H	C ₃ H ₇ -i	3-Cl-C ₆ H ₄	-CO-NH ₂	
13.33	H	C ₃ H ₇ -i	3-Cl-C ₆ H ₄	-CO-SCH ₃	
13.34	H	C ₃ H ₇ -i	3-Cl-C ₆ H ₄	-CO-NH-OCH ₃	
13.35	H	C ₃ H ₇ -i	3-Cl-C ₆ H ₄	-CO-NH-C ₃ H ₇ -n	
13.36	H	C ₃ H ₇ -i	C ₆ H ₅	-CO-NH-CH ₃	
13.37	H	C ₃ H ₇ -i	C ₆ H ₅	-CO-NH ₂	
13.38	H	C ₃ H ₇ -i	C ₆ H ₅	-CO-NH-C ₂ H ₅	
13.39	H	C ₃ H ₇ -i	C ₆ H ₅	-CO-S-CH ₃	
13.40	H	C ₃ H ₇ -i	C ₆ H ₅	-CN	
13.41	H	ciklohexil	C ₆ H ₅	-CO-NH-CH ₃	HNO ₃ /op. 138°C
13.42	H	ciklohexil	C ₆ H ₅	-CO-NH ₂	
13.43	H	ciklohexil	C ₆ H ₅	-CO-S-CH ₃	
13.44	H	ciklohexil	C ₆ H ₅	-CO-NH-OCH ₃	
13.45	H	ciklohexil	C ₆ H ₅	-CO-NH-C ₃ H ₇ -n	
13.51	H	-CH ₂ -CH ₂ -C ₆ H ₅	C ₆ H ₅	-CO-NH-CH ₃	HNO ₃ /op. 135°C
13.52	H	-CH ₂ -CH ₂ -C ₆ H ₅	C ₆ H ₅	-CO-NH ₂	
13.53	H	-CH ₂ -CH ₂ -C ₆ H ₅	C ₆ H ₅	-CO-SCH ₃	
13.54	H	-CH ₂ -CH ₂ -C ₆ H ₅	C ₆ H ₅	-CO-NH-OCH ₃	
13.55	H	-CH ₂ -CH ₂ -C ₆ H ₅	C ₆ H ₅	-CO-NH-C ₃ H ₇ -n	
13.56	H	CH(OC ₂ H ₅)-C ₆ H ₅	C ₆ H ₅	-CO-NH-CH ₃	HNO ₃ /op. 185°C

Vegy. száma	R ¹	A	Z	L	Fizikai adatok /op./
13.57	H	-CH(OC ₂ H ₅)-C ₆ H ₅	C ₆ H ₅	-CO-NH ₂	
13.58	H	-CH(OC ₂ H ₅)-C ₆ H ₅	C ₆ H ₅	-CO-NH-C ₂ H ₅	
13.59	H	-CH(OC ₂ H ₅)-C ₆ H ₅	C ₆ H ₅	-CO-SCH ₃	
13.60	H	-CH(OC ₂ H ₅)-C ₆ H ₅	C ₆ H ₅	-CN	
13.61	H	CH ₃	C ₆ H ₅	-CO-NH-CH ₃	1/2 H ₂ O 85-88°C
13.62	H	CH ₃	C ₆ H ₅	-CO-NH-NH ₂	134-135,5°C
13.63	H	CH ₃	C ₆ H ₅	-CO-N(CH ₃) ₂	122-123°C
13.66	H	CH ₃	C ₆ H ₅	morfolino- -karbonil	HCl/ op 240-242°C
13.67	H	CH ₃	C ₆ H ₅	-CO-NH ₂	(+) op. 115,9°C [α] _D =+84,6° *
13.68	H	CH ₃	C ₆ H ₅	-CO-NH ₂	(-) op. 123,8°C [α] _D =-80,4° *
13.69	H	CH ₃	C ₆ H ₅	-CN	(+) op. 129,3°C [α] _D =+40,6° *
13.70	SH	CH ₃	C ₆ H ₅	-CO-NH ₂	+H ₂ O/op. 245,3°C [α] _D =+84,7° *
13.71	SH	CH ₃	C ₆ H ₅	-CO-NH ₂	-H ₂ O/op. 244,8°C [α] _D =-85,8° *
13.72	SH	H	C ₆ H ₅	-CO-NH ₂	255,3-262,2°C
13.73	H	CH ₃	C ₆ H ₅	piperidino- -karbonil	160,5°C
13.74	H	CH ₃	C ₆ H ₅	piperidino- -karbonil	(+)-R 184,0°C [α] _D =+67,3° *
13.75	H	CH ₃	C ₆ H ₅	pirrolidino- -karbonil	(+)-R 126,4°C
13.76	H	CH ₃	C ₆ H ₅	pirrolidino- -karbonil	109,8°C

Vegyület száma	R ¹	A	Z	L	Fizikai adatok /op./
13.77	H	2-piridil	C ₆ H ₅	-CO-NH-(CH ₂) ₂ OH	142,4°C
13.78	H	1-naftil	C ₆ H ₅	-CO-NH-CH ₃	221,7°C
13.79	H	C ₃ H ₇ -n	4-F-C ₆ H ₄	-CO-NH-CH ₃	HNO ₃ /op. 178,5°C
13.80	H	2-piridil	C ₆ H ₅	-CO-NH-CH ₃	2 HCl/op. 216,6°C
13.81	H	C ₃ H ₇ -n	3-F-C ₆ H ₄	-CO-NH-CH ₃	olaj
13.82	H	C ₃ H ₇ -n	2-Br-C ₆ H ₄	-CO-NH-CH ₃	151,5°C
13.83	H	C ₃ H ₇ -n	4-Cl-C ₆ H ₄	-CO-NH-CH ₃	HCl/op. 111,9°C
13.84	H	C ₃ H ₇ -n	3-Br-C ₆ H ₄	-CO-NH-CH ₃	olaj
13.85	H	C ₃ H ₇ -n	4-Br-C ₆ H ₄	-CO-NH-CH ₃	130,1°C
13.86	H	C ₃ H ₇ -i	2-Cl-C ₆ H ₄	-CO-NH-CH ₃	181,5°C
13.88	H	2-piridil	2-CH ₃ -C ₆ H ₄	-CO-NH-CH ₃	206,5°C
13.89	H	C ₃ H ₇ -n	2-Cl-C ₆ H ₄	-COO-N=C(CH ₃) ₂	
13.90	H	C ₃ H ₇ -n	2-Cl-C ₆ H ₄	COO-CH ₂ -Si(CH ₃) ₃	
13.91	H	C ₃ H ₇ -n	2-Cl-C ₆ H ₄	-COO-CH ₂ -PO (OC ₂ H ₅) ₂	
13.93	H	C ₃ H ₇ -n	2-Cl-C ₆ H ₄	-COO-(CH ₂) ₃ -Cl	
13.94	H	CH ₃	C ₆ H ₅	-COO-(CH ₂) ₂ -Cl	HCl/ 1/2H ₂ O 83,5-85°C
13.95	H	CH ₃	C ₆ H ₅	-COO-CH ₂ -C ₃ H ₅ -c	HCl/ 148,5-151°C
13.96	H	CH ₃	C ₆ H ₅	COO-(CH ₂) ₂ -C ₆ H ₄ -c	HCl/op. 121-125°C
13.97	H	CH ₃	C ₆ H ₅	piperidino- -etoxi-kar- bonil	195-205°C (53,3 Pa)
13.98	H	CH ₃	C ₆ H ₅	-COO-CH ₂ -COCH ₃	(R)-(+)/HCl 149,7°C [α] = +42,0°
13.101	H	C ₂ H ₅	2-Cl-C ₆ H ₄	-CO-NH-CH ₃	214,4°C

* = c = 1% metanolban

** = c = 0,1% etanolban

* *

9. táblázat

/Is/ általános képletű vegyületek előállítás

Vegyület száma	X	T	Fizikai adatok
15.1	2,3-dihidro-2,2-dimetil-1H-indenil	Cl	
15.2	2,3-dihidro-2,2-dimetil-1H-indenil	Br	
15.3	2,2-dimetil-1,2,3,4-tetrahidro-naftalén-1-il	Cl	
15.4	2,3-dihidro-2,2-dimetil-4H-1-benzopirán-4-il	Cl	
15.5	2,3-dihidro-2,3-dimetil-4H-1-benzopirán-4-il	Cl	
15.6	2,3-dihidro-2,2-dimetil-benzofurán-3-il	Cl	
15.7	1-(2-piridinil)-butil	Cl	
15.8	1-(2-metoxi-fenil)-butil	Cl	
15.9	1-(2-klór-fenil)-butil	Cl	

C. Készítményelőállítási példák

35. példa

Szilárd hatóanyagot tartalmazó készítmények 40

a)	Nedvesíthető por		
	a)	b)	c)
2.03 számú vegyület	20%	50%	0,5%
nátrium-ligninszulfonát	5%	5%	5%
nátrium-lauril-szulfát	3%	—	—
nátrium-diizobutil-naf-talinszulfonát	—	6%	6%
oktil-fenol-polietilén-glikol-éter (7—8 mól etilén-oxid)	—	2%	2%
erősen diszpergált kavasav	5%	27%	27%
kaolin	67%	10%	—
nátrium-klorid	—	—	59,5%

A hatóanyagot alaposan elkeverjük a segédanyagokkal és a kapott keveréket megfelelő malomban őrljük. A nedvesíthető por készítmény vízzel a kívánt koncentrációjú szuszpenzióvá hígítható.

b) Emulgeálható koncentrátum

	a)	b)
2.03 számú vegyület	10%	1%
oktil-fenol-polietilén-glikol-éter (4—5 mól etilén-oxid)	3%	3%
kalcium-dodecil-benzolszulfonát	3%	3%

42

kasztorolaj-poliglikol-éter
(36 mól etilén-oxid)

4%

4%

ciklohexanon

30%

10%

dimetil-benzol-elegy

50%

79%

A koncentrátumból vízzel hígítva kívánt koncentrációjú emulzió állítható elő.

c) Porkészítmények

	a)	b)
2.03 számú vegyület	0,1%	1%
talkum	99,9%	—
kaolin	—	99%

A készítmény előállításához a hatóanyagot a hordozóanyaggal keverjük és a keveréket malomban őrljük.

d) Granulátum

	a)	b)
2.03 számú vegyület	10%	1%
nátrium-ligninszulfonát	2%	2%
karboxi-metil-cellulóz	1%	1%
kaolin	87%	96%

A hatóanyagot a segédanyagokkal keverjük és őrljük; a keveréket vízzel nedvesítjük. Ezután extrudáljuk és áramló levegővel szárítjuk.

65

e) Bevont granulátum

2.03 számú vegyület	3%
polietilén-glikol (móltömeg 200)	2%
kaolin	95%

A finoman porított hatóanyagot keverőberendezésben a polietilén-glikollal nedvesített kaolin felületére visszük fel. A kapott bevontos granulátum nem porzik.

f) Szuszpenziós koncentrátum

	a)	b)
2.03 számú vegyület	40%	5%
etilén-glikol	10%	10%
nonil-fenol-polietilén-glikol-éter (15 mól etilén-oxid)	6%	1%
nátrium-lignin-szulfát	10%	5%
karboxi-metil-cellulóz	1%	1%
37 tömeg%-os vizes formaldehid-oldat	0,2%	0,2%
szilikonolaj 75 tömeg%-os vizes emulzió formájában	0,8%	0,8%
víz	32%	77%

A finoman porított hatóanyagot alaposan elkeverjük a segédanyagokkal, majd a kapott szuszpenziós koncentrátumot felhasználás előtt vízzel a kívánt koncentrációjú szuszpenzióvá hígítjuk.

g) Sóoldat

2.03 számú vegyület	5%
izopropil-amin	1%
oktil-fenol-polietilén-glikol-éter (78 mól etilén-oxid)	3%
víz	91%

36. példa

Készítmény folyékony hatóanyagból

a) Emulgeálható koncentrátum

	a)	b)	c)
2.03 számú vegyület	20%	40%	50%
kalcium-dodecil-benzol-szulfonát	5%	8%	5,8%
kasztorolaj-polietilén-glikol-éter (36 mól etilén-oxid)	5%	—	—
tributil-fenol-polietilén-glikol-éter (30 mól etilén-oxid)	—	12%	4,2%
ciklohexanon	—	15%	20%
dimetil-benzol-elegy	70%	25%	20%

A fenti koncentrátumból vízzel hígítva kívánt koncentrációjú emulziót kapunk.

b) Oldat

	a)	b)	c)	d)
2.03 számú vegyület	80%	10%	5%	95%
etilén-glikol-monometil-éter	20%	—	—	—
polietilén-glikol (móltömeg 400)	—	70%	—	—
N-metil-2-pirrolidon	—	20%	—	—
epoxidált kókuszolaj	—	—	1%	5%
petróleum desztillátum (forráspont 160—190°C)	—	—	94%	—

A kapott oldat mikrocseppek formájában felhasználható.

c) Granulátum

	a)	b)
2.03 számú vegyület	5%	10%
kaolin	94%	—
erősen diszpergált kovasav	1%	—
attapulgit	—	90%

A hatóanyagot metilén-kloridban oldjuk, az oldatot a hordozóanyagra permetezzük, majd az oldószert vákuumban elpárologtatjuk.

d) Porkészítmény

	a)	b)
2.03 számú vegyület	2%	5%
erősen diszpergált kovasav	1%	5%
talcum	97%	—
kaolin	—	90%

20 D. Biológiai példák

37. példa

Pre-emergens herbicid hatás

A vizsgált növények elvetése után az üvegházba állított cserepek (8×8 cm, felület 0,64×10⁻⁶ ha) talaját 20 ml vizes hatóanyag-készítménnyel kezeljük, amelynek során a készítményt műanyag fecskendő segítségével egyenletesen eloszlatjuk a felületen. A hatóanyag-készítményt 25 tömeg%-os emulgeálható koncentrátumból vagy rosszul oldódó hatóanyag esetén 25 tömeg%-os nedvesíthető porkészítményből állítjuk elő. A 25 tömeg%-os emulgeálható koncentrátum összetétele:

35	hatóanyag	25 tömeg%
	kalcium-dodecil-benzolszulfonát	5 tömeg%
	kasztorolaj-polietilén-glikol-éter (36 mól etilén-oxid)	5 tömeg%
40	dimetil-benzol	65 tömeg%
	A 25 tömeg%-os nedvesíthető porkészítmény összetétele:	
	hatóanyag	25 tömeg%
	nátrium-ligninszulfonát	5 tömeg%
45	nátrium-lauril-szulfonát	3 tömeg%
	magas diszperzitásfokú kovasav	5 tömeg%
	kaolin	62 tömeg%

A hatóanyag-készítményt olyan mértékben hígítjuk, hogy a hatóanyag felhasználási mennyisége cserepenként 4 kg/ha legyen (vagyis 2,56 mg cserepenként, illetve 2,56 mg/20 ml=0,0128 tömeg%). A 25 tömeg%-os emulgeálható koncentrátumot vagy a 25 tömeg%-os nedvesíthető porkészítményt (512 mg) vízzel közvetlenül a felhasználás előtt 1,0 literre hígítjuk.

A cserepeket 22—25°C hőmérsékleten és 50—70% relatív páratartalomnál üvegházban tartjuk. A kiértékelést három hét elteltével az alábbi értékelés alapján végezzük: 1= a növény nem csírázott ki vagy teljesen elszáradt

2—3= nagyon erős hatás

4—6= átlagos hatás

7—8= enyhe hatás

9= nincs hatás.

A pre-emergens vizsgálat eredményei:
4 kg/hektár hatóanyag-dózisnál az alábbi
táblázat tartalmazza:

Vegyület száma	digitaria	poa	bromus	setaria	echinochloa	avena fatua	cynodon
2.01	1	1	1	3	1	2	2
2.02	1	1	1	1	1	2	1
2.03	1	1	1	1	1	1	1
2.04	1	1	1	1	1	1	1
2.07	1	1	1	1	1	4	1
6.02	1	3	1	1	1	9	2
6.07	1	1	1	1	1	1	1
6.08	1	2	6	3	1	5	2
6.11	1	2	1	1	1	9	1
6.28	2	2	2	2	2	9	1
6.29	1	1	2	5	2	5	1

38. példa

Poszt-emergens herbicid hatás

A vizsgált gyomokat és kultúrnövényeket 4–6-leveles állapotban a hatóanyag viz-es diszperziójával permetezzük meg 4 kg/ha dózisban és a növényeket 24–26°C hőmérsékleten és 45–60% relatív páratartalom

25

tartjuk. A vizsgálatot 15 nap elteltével a pre-emergens vizsgálatnál megadott számok alapján értékeljük. A poszt-emergens vizsgálat eredményei:
4 kg/hektár hatóanyag dózisnál az alábbi táblázat tartalmazza:

Vegyület száma	solanum	sinapis	phaseolus
1.02	3	3	2
1.03	2	2	2
1.04	2	2	2
1.15	2	2	2
1.31	2	2	2
1.68	2	3	2
1.73	1	3	3
1.77	2	3	2
1.80	3	2	2
1.81	3	2	2
1.85	2	3	2
1.96	3	2	2
1.97	3	2	2
2.07	2	2	2
2.20	2	2	3
2.34	3	2	2
2.85	2	3	3
2.92	3	2	2
2.125	2	2	3
5.18	3	2	2
6.36	2	3	2
6.69	2	4	2
6.76	2	3	2
11.03	3	1	3
13.26	2	3	2
13.11	3	3	2

39. példa

Herbicid hatás hántolatlan rizs esetén

Echinochloa crus-galli és Monochoria vaginalis magjait műanyag edényekbe (60 cm²

85

felület, 500 ml térfogat) ültetjük. A talaj felületét megnedvesítjük, majd három nap elteltével a víz szintjét lassan a talaj fölé (3–5 mm) emeljük. Vetés után három nappal a

hatóanyag vizes emulzióját permetezzük az edényekre 4 kg/hektár dózisban (hígítás 550 liter/hektár). Az edényeket három héten keresztül üvegházban tartjuk 20–25°C hőmérsékleten magas páratartalom mellett.

5

A kiértékelést a 38. példában megadott számok alapján végezzük.

A mérési eredményeket 4 kg/hektár hatóanyag dóziséknál az alábbi táblázat tartalmazza:

Vegyület száma	Echinochloa	Monochoria
1.02	1	1
1.03	1	1
1.04	1	1
1.10	1	1
1.11	1	1
1.14	1	1
1.15	1	1
1.31	1	1
1.36	1	1
1.67	1	1
1.68	1	1
1.73	1	1
1.74	1	1
1.76	1	1
1.77	1	1
1.80	1	1
1.81	1	1
1.82	1	1
1.85	1	1
1.95	1	1
1.96	1	1
1.97	1	1
2.02	1	2
2.03	1	1
2.07	1	1
2.08	1	1
2.11	1	1
2.12	1	1
2.13	1	1
2.14	1	1
2.15	1	1
2.20	1	1
2.34	1	1
2.42	1	1
2.43	1	1
2.85	1	1
2.88	2	1
2.90	1	1
2.92	1	1
2.99	1	1
2.118	2	1
2.122	2	1
2.125	2	1
2.126	1	1
5.01	1	1
5.14	1	1
5.15	1	1
5.17	2	1

Vegyület száma	Echinochloa	Monochoria
5.18	1	1
5.24	1	1
6.07	1	2
6.08	1	1
6.09	1	1
6.02	1	1
6.04	1	1
6.11	1	1
6.28	1	1
6.29	1	1
6.35	1	1
6.36	1	1
6.66	1	1
6.67	1	1
6.68	1	1
6.69	1	1
6.70	1	1
6.71	1	1
6.74	1	1
6.76	1	1
6.79	1	1
11.03	1	1
13.11	1	1
13.26	1	1
13.41	1	1
13.51	1	1
13.56	1	1
13.77	1	1
13.79	1	1
13.82	1	1
13.83	1	1

SZABADALMI IGÉNYPONTOK

1. Herbicid szer, *azzal jellemezve*, hogy hatóanyagként (I) általános képletű 1H-imidazol-származékot vagy annak sztereokémiai izomerformáját vagy sóját tartalmazza, a képletben

R¹ jelentése hidrogénatom vagy merkaptocsoport,

L jelentése cianocsoport, (a), (b), (d), (e), (f), (g'), (h'), (i) vagy (j) általános képletű csoport, ezekben a képletekben

E jelentése oxigénatom vagy -N- képletű

R

csoport,

R jelentése hidrogénatom vagy 1—4 szénatomos alkilcsoport,

R⁴ jelentése trifluor-metil-csoport,

G jelentése oxigénatom vagy kénatom,

G¹ jelentése oxigénatom,

D jelentése kénatom, -N-, -N-O- vagy -NH-

R³ R^{3'}

-NH- képletű csoport,

R² jelentése hidrogénatom, 1—5 szénatomos alkil-, 3—5 szénatomos alkenil-, 3—5 szénatomos alkinil-, (1—4 szénatomos alkil)-karbonil- vagy 3—7 szénatomos cikloalkilcsoport vagy fenil-, hidroxil-, 1—4 szénatomos alkoxi- vagy (1—4 szénatomos alkil)-karbonil-oxi-csoporttal monoszubsztituált 1—5 szénatomos alkilcsoport,

R³ jelentése hidrogénatom vagy 1—5 szénatomos alkilcsoport, vagy

R² és R³ együtt a kapcsolódó nitrogénatommal imidazólcsoportot vagy egy vagy kettő 1—4 szénatomos alkilcsoporttal adott esetben szubsztituált pirrolidino-, piperidino-, morfolino- vagy tiomorfolinocsoportot vagy a 4-helyzetben 1—4 szénatomos alkil-, (1—4 szénatomos alkil)-karbamoil-csoporttal adott esetben szubsztituált piperazinocsoportot is jelenthet,

R^{3'} jelentése hidrogénatom, 1—4 szénatomos alkil- vagy fenil- (1—4 szénatomos alkil)-csoport,

$$\begin{array}{cccc} \text{H} & \text{H} & \text{H} & \text{H} \\ | & | & | & | \\ \text{O} & \text{O} & \text{O} & \text{R}^{17} \end{array}$$
$$\begin{array}{c} \text{R}^{19} \\ | \\ -\text{Si-R}^{20}, -\text{S-R}^{19} \text{ vagy } -\text{P}-\text{OR}^{16} \end{array} \begin{array}{c} \text{O} \\ || \\ \text{általános} \end{array}$$
 R^{21} R^{22}

képletű csoporttal monoszubsztituált 1–4 szénatomos alkilcsoport, ezekben a képletekben R^{14} , R^{15} , R^{16} , R^{17} , R^{19} , R^{20} és R^{21} jelentése 1–4 szénatomos alkilcsoport vagy

R^{14} és R^{15} együtt 4—6 szénatomos alkilénecsoportot jelent,

R¹⁶ és R¹⁷ együtt 3—6 szénatomos alkilénecsoportot jelent,

R^{22} jelentése 1—4 szénatomos alkoxi-
csoport.

X jelentése 9H-fluoren-9-il-, 4,5,6,7-tetrahidro-4-benzo(b)tienil-, 4-tiokromanil- vagy 2,3-dihidro-2,2-di(1-4 szénatomos alkil)-3-benzo(b)furil-csoport vagy (aa'), (ab'), (k') vagy -CH₂-Z általános képletű csoport

A

ezekben a képletekben

R^6 és R^7 jelentése hidrogénatom vagy 1–4 szénatomos alkilcsoport vagy a kettő együtt gem-helyzetben kapcsolódó 3–6 szénatomos spirocikloalkángyűrű vagy vic-helyzetben kapcsolódó 1–4 szénatomos alkilcsoport vagy ha X (ab') képletű csoport akkor R^6 és R^7 együtt diszj-helyzetben kapcsolódó 1–4 szénatomos alkilcsoportot is jelenthet.

R⁶, jelentése hidrogénatom, 1—4 szénatomos alkil- vagy fenil- (1—4 szénatomos alkil)-csoport, vagy

R⁶ és R⁷ együtt vic-helyzetben kapcsolódó
1—4 szénatomos alkilénecsoporthoz,

R^{10} jelentése hidrogén- vagy halogénatom,

A jelentése hidrogénatom, 2-piridil-, 1-naftil-, 3-7 szénatomos cikloalkil-, 1-6 szénatomos alkilcsoport vagy alkilrészen 1-4 szénatomos alkoxicsoporthal adott esetben monoszubsztituált fenil-(1-4 szénatomos alkil)-csoport

Z jelentése halogénatommal vagy 1—4 szénatomos alkilcsoporttal adott esetben monoszubsztituált fenilcsoport,

azzal a megkötéssel, hogy

—L jelentése ciano-, karbamoi- vagy halogén-alkoxi-karbonil-csoporttól eltérő, ha X jelentése 1-fenil-etil-csoport,

—L jelentése dialkil-amino-alkoxi-karbonil-csoporttól eltérő, ha X jelentése 1-indanil- vagy 1,2,3,4-tetrahidro-1-naftil-csoport.

0,1–95 tömeg% mennyiségben szilárd hordozóanyagok, célszerűen természetes ásványi anyag és/vagy folyékony hígítóanyagok, célszerűen poláros vagy apoláros oldószerek, és adott esetben felületaktív anyagok, célszerűen anionos vagy nemionos diszpergáló és/vagy emulgeáló anyagok mellett.

(Elsőbbsége: 1987. 12. 23.)

2. Az 1. igénypont szerinti herbicid szer,
 10 azzal jellemezve, hogy hatóanyagként olyan
 (I) általános képletű vegyületet tartalmaz,
 amelynek képletében

L jelentése cianocsoport, $-\text{CO}-\text{D}-\text{R}^2$ vagy $-\text{CO}-\text{O}-\text{R}^5$ általános képletű csoport,

15 R^1 és X jelentése az 1. igénypontban megadott.
(Elsőbbsége: 1987. 12. 23.)

3. A 2. igénypont szerinti herbicid szer, **azzal jellemezve, hogy hatóanyagként olyan (I) általános képletű vegyületet tartalmaz,**
20 **amelynek képletében**

R^1 jelentése hidrogénatom.

25 X jelentése 2,3-dihidro-2,2-dimetil-1H-indén-
-1-il-csoport, 2,2-dimetil-1-tetrahidronaftil-
-csoport, 2,3-dimetil-kromán-4-il-csoport
vagy 2-metil-kromán-4-il-csoport.

L jelentése a 2. igénypontban megadott.
(Elsőbbsége: 1987. 12. 23.)

4. A 2. igénypont szerinti herbicid szer, azzal jellemezve, hogy hatóanyagként N-metil-1-(1,2,3,4-tetrahidro-1-naftil)-1H-imidazol-5-karboxamidot, 1-(2,3-dihidro-2,2-dimetil-1H-indenil)-1H-imidazol-5-karboxamidot vagy N-metil-1-(2,3-dihidro-2,2-dimetil-1H-indenil)-1H-imidazol-5-karboxamidot tartalmaz.

(Elsőbbsége: 1987. 12. 23.)

5. Eljárás az (I) általános képletű 1H-imidazol-származékok és sztereokémiai izomerformái vagy sói előállítására, a képletben R^1 jelentése hidrogénatom vagy merkaptocsoport.

L jelentése cianocsoport, (a), (b), (d), (e), (f), (g'), (h'), (i) vagy (j) általános képletű csoport, ezekben a képletekben

45 E jelentése oxigénatom vagy -N- képletű
R

R csoport,
50 jelentése hidrogénatom vagy 1—4 szén-
atomos alkilcsoport.

R⁴ jelentése trifluor-metil-csoport,

G₂ jelentése oxigénatom vagy kénatom,

G¹ jelentése oxigénatom,

D jelentése kénatom, -N-, -N-O- vagy -NH-

$$\begin{array}{c} \text{R}^3 \quad \text{R}^{3'} \end{array}$$

-NH- képletű csoport,

R² jelentése hidrogénatom, 1–5 szénatomos alkil-, 3–5 szénatomos alkenil-, 3–5 szénatomos alkinil-, (1–4 szénatomos alkil)-karbonil- vagy 3–7 szénatomos cikloalkilcsoport vagy fenil-, hidroxil-, 1–4 szénatomos alkoxi- vagy (1–4 szénatomos alkil)-karbonil-oxi-csoporttal monoszubsztituált 1–5 szénatomos alkilcsoport.

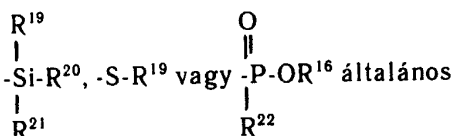
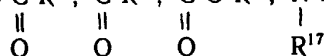
R³ jelentése hidrogénatom vagy 1—5 szénatomos alkilcsoport, vagy

R² és R³ együtt a kapcsolódó nitrogénatommal imidazolilcsoportot vagy egy vagy kettő 1—4 szénatomos alkilcsoporttal adott esetben szubsztituált pirrolidino-, piperidino-, morfolino- vagy tiomorfolinocsoportot vagy a 4-helyzetben 1—4 szénatomos alkil-, (1—4 szénatomos alkil)-karbamoil-csoporttal adott esetben szubsztituált piperazinocsoportot is jelenthet,

R³ jelentése hidrogénatom 1—4 szénatomos alkil- vagy fenil-(1—4 szénatomos alkil)-csoport,

R⁵ jelentése fenilcsoport vagy $\text{N}=\text{C}-\text{R}^{14}$
 R^{15}

általános képletű csoport, vagy halogénatommal, ciano-, 3—7 szénatomos cikloalkil- vagy hidroxilcsoporttal vagy $-\text{O}-\text{C}-\text{R}^{16}$, $-\text{C}-\text{R}^{16}$, $-\text{C}-\text{O}-\text{R}^{16}$, $-\text{N}-\text{R}^{16}$,



csoporttal monoszubsztituált 1—4 szénatomos alkilcsoport, ezekben a képletekben

R¹⁴, R¹⁵, R¹⁶, R¹⁷, R¹⁹, R²⁰ és R²¹ jelentése 1—4 szénatomos alkilcsoport vagy

R¹⁴ és R¹⁵ együtt 4—6 szénatomos alkilcsoportot jelent,

R¹⁶ és R¹⁷ együtt 3—6 szénatomos alkilcsoportot jelent,

R²² jelentése 1—4 szénatomos alkoxi-csoport,

X jelentése 9H-fluoren-9-il-, 4,5,6,7-tetrahidro-4-benzo(b)tienil-, 4-tiokromanil- vagy 2,3-dihidro-2,2-di(1—4 szénatomos alkil)-3-benzo(b)furil-csoport vagy (aa'), (ab'), (k') vagy -CH-Z általános képletű csoport

I

A

ezekben a képletekben

R⁶ és R⁷ jelentése hidrogénatom vagy 1—4 szénatomos alkilcsoport vagy a kettő együtt gem-helyzetben kapcsolódó 3—6 szénatomos spirocikloalkángyűrű vagy vic-helyzetben kapcsolódó 1—4 szénatomos alkilcsoport vagy ha X (ab') képletű csoport, akkor R⁶ és R⁷ együtt diszj-helyzetben kapcsolódó 1—4 szénatomos alkilcsoportot is jelenthet,

R⁶ jelentése hidrogénatom, 1—4 szénatomos alkil- vagy fenil-(1—4 szénatomos alkil)-csoport, vagy

R⁶ és R⁷ együtt vic-helyzetben kapcsolódó 1—4 szénatomos alkilcsoport,

R¹⁰ jelentése hidrogén- vagy halogénatom, A jelentése hidrogénatom, 2-piridil-, 1-naftil-, 3—7 szénatomos cikloalkil-, 1—6 szénatomos alkilcsoport vagy alkilrészen 1—4 szénatomos alkoxi-csoporttal adott esetben monoszubsztituált fenil-(1—4 szénatomos alkil)-csoport,

Z jelentése halogénatommal vagy 1—4 szénatomos alkilcsoporttal adott esetben monoszubsztituált fenilcsoport, azzal a megkötéssel, hogy

—L jelentése ciano-, karbamoil- vagy halogén-alkoxi-karbonil-csoporttól eltérő, ha ha X jelentése 1-fenil-etil-csoport,

—L jelentése dialkil-amino-alkoxi-karbonil-csoporttól eltérő, ha X jelentése 1-indanil- vagy 1,2,3,4-tetrahidro-1-naftil-csoport,

azzal jellemezve, hogy

a) (II) általános képletű vegyületet, a képletben X és L jelentése a tárgyi körben megadott, hangyasav 1—4 szénatomos alkilészterével kondenzálunk bázis jelenlétében inert oldószerben, majd a kapott (III) általános képletű köztterméket, a képletben

X és L jelentése a tárgyi körben megadott, M jelentése alkálifématom,

alkálifém-tiocianáttal sav jelenlétében (Ia) általános képletű 2-merkaptó-imidazol-származékká alakítjuk, a képletben

X és L jelentése a tárgyi körben megadott, amelyet kívánt esetben salétromsav segítségével, adott esetben alkálifém-nitrit jelenlétében (Ib) általános képletű vegyületté alakítunk, a képletben

X és L jelentése a tárgyi körben megadott, vagy

b) (V) általános képletű aktivált vegyületet, a képletben R¹, G és X jelentése a fenti, T jelentése reakcióképes lehasadó csoport,

H-O-R⁵ általános képletű alkohollal reagáltatunk inert oldószerben, adott esetben bázis jelenlétében, amelynek során L helyén -C(=G¹)-O-R⁵ csoportot tartalmazó (I) általános képletű vegyületet kapunk, majd kívánt esetben a kapott vegyületet önmagában ismert módon más, az (I) általános képletű körén belül eső vegyületté alakítjuk és kívánt esetben megfelelő savval kezelve sóvá alakítjuk és/vagy a kívánt sztereokémiai izomerformát elválasztjuk.

(Elsőbbsége: 1987. 12. 23.)

6. Herbicid szer, azzal jellemezve, hogy hatóanyagként (I) általános képletű 1H-imidazol-származékot vagy annak, sztereokémiai izomerformáját vagy sóját tartalmazza, a képletben

R¹ jelentése hidrogénatom vagy merkaptó-csoport,

L jelentése cianocsoport, (a), (b') (d), (f), (g'), (h') vagy (i) általános képletű csoport, ezekben a képletekben

- E jelentése oxigénatom vagy -N- képletű

$$\begin{array}{c} | \\ R \end{array}$$

 csoport,
 R jelentése hidrogénatom vagy 1—4 szénatomos alkilcsoport,
 G jelentése oxigénatom vagy kénatom,
 D jelentése kénatom, -N-, -N-O- vagy -NH-

$$\begin{array}{c} | \\ R^3 \quad R^{3'} \end{array}$$

 -NH- képletű csoport,
 R² jelentése hidrogénatom, 1—5 szénatomos alkil-, 3—5 szénatomos alkenil-, 3—5 szénatomos alkinil-, (1—4 szénatomos alkil)-karbonil- vagy 3—7 szénatomos cikloalkilcsoport vagy fenil-, hidroxil-, 1—4 szénatomos alkoxi- vagy (1—4 szénatomos alkil)-karbonil-oxi-csoporttal monoszubsztituált 1—5 szénatomos alkilcsoport,
 R³ jelentése hidrogénatom vagy 1—5 szénatomos alkilcsoport, vagy
 R² és R³ együtt a kapcsolódó nitrogénatommal egy vagy kettő 1—4 szénatomos alkilcsoporttal adott esetben szubsztituált pirrolidino-, piperidino-, morfolino- vagy tiomorfolinocsoportot vagy piperazinocsoportot is jelenthet,
 R^{3'} jelentése hidrogénatom vagy 1—4 szénatomos alkilcsoport,
 X jelentése 9H-fluoren-9-il-, 4,5,6,7-tetrahidro-4-benzo(b)tienil-, 4-tiokromanil- vagy (aa'), (ab'), vagy -CH-Z általános képletű

$$\begin{array}{c} \diagup \\ A \end{array}$$

 csoport, ezekben a képletekben
 R⁶ és R⁷ jelentése hidrogénatom vagy 1—4 szénatomos alkilcsoport vagy a kettő együtt gem-helyzetben kapcsolódó 3—6 szénatomos spirocikloalkángyűrű vagy vic-helyzetben kapcsolódó 1—4 szénatomos alkilcsoport,
 R^{6'} jelentése hidrogénatom, 1—4 szénatomos alkil- vagy fenil- (1—4 szénatomos alkil)-csoport, vagy
 R⁶ és R⁷ együtt vic-helyzetben kapcsolódó 1—4 szénatomos alkilcsoport,
 R¹⁰ jelentése hidrogén- vagy halogénatom,
 A jelentése hidrogénatom, 2-piridil-, 1-naftil-, 3—7 szénatomos cikloalkil-, 1—6 szénatomos alkilcsoport vagy al-alkilrészen 1—4 szénatomos alkoxi-csoporttal adott esetben monoszubsztituált fenil- (1—4 szénatomos alkil)-csoport,
 Z jelentése halogénatommal vagy 1—4 szénatomos alkilcsoporttal adott esetben monoszubsztituált fenilcsoport,
 azzal a megkötéssel, hogy
 —L jelentése ciano- vagy karbamoilcsoporttól eltérő, ha X jelentése 1-fenil-etil-csoport, 0,1—95 tömeg% mennyiségben szilárd hordozóanyagok, célszerűen természetes ásványi anyag és/vagy folyékony hígítóanyagok, célszerűen poláros vagy apoláros oldószerek, és adott esetben felületaktív anyagok, célsze-

- rűen anionos vagy nemionos diszpergáló és/vagy emulgeáló anyagok mellett.
 (Elsőbbsége: 1986. 12. 30.)
 7. A 6. igénypont szerinti herbicid szer, azzal jellemezve, hogy hatóanyagként olyan (I) általános képletű vegyületet tartalmaz, amelynek képletében
 L jelentése cianocsoport, -CO-D-R² vagy -CO-O-R⁵ általános képletű csoport,
 R¹ és X jelentése a 6. igénypontban megadott.
 (Elsőbbsége: 1986. 12. 30.)
 8. A 6. igénypont szerinti herbicid szer, azzal jellemezve, hogy hatóanyagként olyan (I) általános képletű vegyületet tartalmaz, amelynek képletében
 R¹ jelentése hidrogénatom,
 X jelentése 2,3-dihidro-2,2-dimetil-1H-indén-1-il-csoport, 2,2-dimetil-1-tetrahidronaftil-csoport, 2,3-dimetil-kromán-4-il-csoport vagy 2-metil-kromán-4-il-csoport,
 L jelentése a 6. igénypontban megadott.
 (Elsőbbsége: 1986. 12. 30.)
 9. A 6. igénypont szerinti herbicid szer, azzal jellemezve, hogy hatóanyagként N-metil-1-(1,2,3,4-tetrahidro-1-naftil)-1H-imidazol-5-karboxamidot, 1-(2,3-dihidro-2,2-dimetil-1H-indenil)-1H-imidazol-5-karboxamidot vagy N-metil-1-(2,3-dihidro-2,2-dimetil-1H-indenil)-1H-imidazol-5-karboxamidot tartalmaz.
 (Elsőbbsége: 1986. 12. 30.)
 10. Eljárás az (I) általános képletű 1H-imidazol-származékok és sztereokémiai izomerformái vagy sói előállítására a képletben
 R¹ jelentése hidrogénatom vagy merkaptocsoport,
 L jelentése cianocsoport, (a), (b'), (d), (f), (g'), (h') vagy (i) általános képletű csoport, ezekben a képletekben
 E jelentése oxigénatom vagy -N- képletű

$$\begin{array}{c} | \\ R \end{array}$$

 csoport
 R jelentése hidrogénatom vagy 1—4 szénatomos alkilcsoport,
 G jelentése oxigénatom vagy kénatom,
 D jelentése kénatom, -N-, -N-O- vagy -NH-

$$\begin{array}{c} | \\ R^3 \quad R^{3'} \end{array}$$

 -NH- képletű csoport,
 R² jelentése hidrogénatom, 1—5 szénatomos alkil-, 3—5 szénatomos alkenil-, 3—5 szénatomos alkinil-, (1—4 szénatomos alkil)-karbonil- vagy 3—7 szénatomos cikloalkilcsoport vagy fenil-, hidroxil-, 1—4 szénatomos alkoxi- vagy (1—4 szénatomos alkil)-karbonil-oxi-csoporttal monoszubsztituált 1—5 szénatomos alkilcsoport,
 R³ jelentése hidrogénatom vagy 1—5 szénatomos alkilcsoport, vagy
 R² és R³ együtt a kapcsolódó nitrogénatommal egy vagy kettő 1—4 szénatomos alkilcsoporttal adott esetben szubsztituált pirrolidino-, piperidino-, morfolino- vagy tiomorfolinocsoportot vagy piperazinocsoportot is jelenthet,

- $R^{3'}$ jelentése hidrogénatom, 1—4 szénatomos alkilcsoport,
 X jelentése 9H-fluoren-9-il-, 4,5,6,7-tetrahidro-4-benzo(b)tienil-, 4-tiokromanil- vagy (aa'), (ab') vagy -CH-Z általános képletű



csoport, ezekben a képletekben

R^6 és R^7 jelentése hidrogénatom vagy 1—4 szénatomos alkilcsoport vagy a kettő együtt gem-helyzetben kapcsolódó 3—6 szénatomos spirocikloalkángyűrű vagy vic-helyzetben kapcsolódó 1—4 szénatomos alkilcsoport,

R^6 jelentése hidrogénatom, 1—4 szénatomos alkil- vagy fenil- (1—4 szénatomos alkil)-csoport, vagy

R^6 és R^7 együtt vic-helyzetben kapcsolódó 1—4 szénatomos alkilcsoport,

R^{10} jelentése hidrogén- vagy halogénatom, A jelentése hidrogénatom, 2-piridil-, 1-naftil-, 3—7 szénatomos cikloalkil-, 1—6 szénatomos alkilcsoport vagy alkilrészen 1—4 szénatomos alkoxicsoporttal adott esetben monoszubsztituált fenil- (1—4 szénatomos alkil)-csoport,

Z jelentése halogénatommal vagy 1—4 szénatomos alkilcsoporttal adott esetben monoszubsztituált fenilcsoport,

azzal a megkötéssel, hogy

—L jelentése ciano- vagy karbamoilcsoporttól eltérő, ha X jelentése 1-fenil-etil-csoport, azzal jellemezve, hogy

a) (II) általános képletű vegyületet, a képletben X és L jelentése a tárgyi körben megadott, hangyasav 1—4 szénatomos alkilészterével kondenzálunk alkálifém-alkoholát jelenlétében inert oldószerben, majd a kapott (III) általános képletű köztiterméket, a képletben

X és L jelentése a tárgyi körben megadott, M jelentése alkálifématom, alkálifém-tiocianáttal sav jelenlétében (Ia) általános képletű 2-merkaptó-imidazol-származékká alakítjuk, a képletben

X és L jelentése a tárgyi körben megadott, amelyet kívánt esetben salétromsav segítségével, adott esetben nátrium-nitrit jelenlétében (Ib) általános képletű vegyületté alakítunk, a képletben

X és L jelentése a tárgyi körben megadott, vagy

b) (V) általános képletű aktivált merkaptánt vagy amidot, a képletben

R^1 , G és X jelentése a fenti,

T jelentése klór-, brómatom, (1—5 szénatomos alkil)-karbonil-oxi- vagy (I) általános képletű csoport

H-O-R^5 általános képletű alkohollal reagáltatunk inert oldószerben, adott esetben bázis jelenlétében, amelynek során L helyén $\text{-C(=G)}^1\text{-O-R}^5$ csoportot tartalmazó (I) általános képletű vegyületet kapunk, majd kívánt esetben a kapott vegyületet önmagában ismert módon más, az (I) általános képletű körén belül eső vegyületté alakítjuk és kívánt

50

esetben megfelelő sávvál kezelve sóvá alakítjuk és/vagy a kívánt sztereokémiai izomerformát elválasztjuk.

(Elsőbbsége: 1986. 12. 30.)

- 5 11. Herbicid szer, azzal jellemezve, hogy hatóanyagként (I) általános képletű 1H-imidazol-származékot vagy annak sztereokémiai izomerformáját vagy sóját tartalmazza, a képletben

- 10 R^1 jelentése hidrogénatom vagy merkaptocsoport,

L jelentése (j) általános képletű csoport, ebben a képletben

- 15 G^1 jelentése oxigénatom,

- R^5 jelentése fenilcsoport vagy -N=C-R^{14} általános képletű csoport, vagy halogénatommal, ciano-, 3—7 szénatomos cikloalkilcsoporttal vagy

- 20 -O-C-R^{16} , -C-R^{16} , -C-O-R^{16} , -N-R^{16} ,
 $\text{O} \quad \text{O} \quad \text{O} \quad \text{R}^{17}$

- 25 R^{19} -Si-R^{20} , -S-R^{19} vagy -P-OR^{16} általános
 $\text{R}^{21} \quad \text{R}^{22}$

- 30 képletű csoporttal monoszubsztituált 1—4 szénatomos alkilcsoport, ezekben a képletekben
 R^{14} , R^{15} , R^{16} , R^{17} , R^{19} , R^{20} és R^{21} jelentése 1—4 szénatomos alkilcsoport

- 35 R^{16} és R^{17} együtt 3—6 szénatomos alkilcsoportot jelent,
 R^{22} jelentése 1—4 szénatomos alkoxicsoport,

- 40 X jelentése 9H-fluoren-9-il-, 4,5,6,7-tetrahidro-4-benzo(b)tienil-, 4-tiokromanil- vagy 2,3-dihidro-2,2-di(1—4 szénatomos alkil)-3-benzo(b)furil-csoport vagy (aa'), (ab'), (k') vagy -CH-Z általános képletű csoport

- 45 A
 ezekben a képletekben

- R^6 és R^7 jelentése hidrogénatom vagy 1—4 szénatomos alkilcsoport vagy a kettő együtt gem-helyzetben kapcsolódó 3—6 szénatomos spirocikloalkángyűrű vagy vic-helyzetben kapcsolódó 1—4 szénatomos alkilcsoport,

- 50 $R^{6'}$ jelentése hidrogénatom, 1—4 szénatomos alkil- vagy fenil- (1—4 szénatomos alkil)-csoport, vagy

- R^6 és R^7 együtt vic-helyzetben kapcsolódó 1—4 szénatomos alkilcsoport,

- 55 R^{10} jelentése hidrogén- vagy halogénatom, A jelentése hidrogénatom, 2-piridil-, 1-naftil-, 3—7 szénatomos cikloalkil-, 1—6 szénatomos alkilcsoport vagy alkilrészen 1—4 szénatomos alkoxicsoporttal adott esetben monoszubsztituált fenil- (1—4 szénatomos alkil)-csoport,

- 60 R^{14} , R^{15} , R^{16} , R^{17} , R^{19} , R^{20} és R^{21} jelentése 1—4 szénatomos alkilcsoport

- 65 R^{16} és R^{17} együtt 3—6 szénatomos alkilcsoportot jelent,
 R^{22} jelentése 1—4 szénatomos alkoxicsoport,

Z jelentése halogénatommal vagy 1—4 szénatomos alkilesorporttal adott esetben monoszubsztituált fenilcsoport, azzal a megkötéssel, hogy

—L jelentése halogén-alkoxi-karbonil-csoporttól eltérő, ha X jelentése 1-fenil-etil-csoport,

—L jelentése dialkil-amino-alkoxi-karbonil-csoporttól eltérő, ha X jelentése 1-indanil- vagy 1,2,3,4-tetrahidro-1-naftil-csoport,

0,1—95 tömeg% mennyiségben szilárd hordozóanyagok, célszerűen természetes ásványi anyag és/vagy folyékony hígítóanyagok, célszerűen poláros vagy apoláros oldószerek, és adott esetben felületaktív anyagok, célszerűen anionos vagy nemionos diszpergáló és/vagy emulgeáló anyagok mellett.

(Elsőbbsége: 1986. 12. 24.)

12. A 11. igénypont szerinti herbicid szer, azzal jellemezve, hogy hatóanyagként olyan (I) általános képletű vegyületet tartalmaz, amelynek képletében

R¹ jelentése hidrogénatom,

X jelentése 2,3-dihidro-2,2-dimetil-1H-indén-1-il-csoport, 2,2-dimetil-1-tetrahidro-naftil-csoport, 2,3-dimetil-kromán-4-il-csoport vagy 2-metil-kromán-4-il-csoport,

L jelentése a 11. igénypontban megadott, (Elsőbbsége: 1986. 12. 24.)

13. A 11. igénypont szerinti herbicid szer, azzal jellemezve, hogy hatóanyagként N-metil-1-(1,2,3,4-tetrahidro-1-naftil)-1H-imidazol-5-karboxamidot, 1-(2,3-dihidro-2,2-dimetil-1H-indenil)-1H-imidazol-5-karboxamidot vagy N-metil-1-(2,3-dihidro-2,2-dimetil-1H-indenil)-1H-imidazol-5-karboxamidot tartalmaz.

(Elsőbbsége: 1986. 12. 24.)

14. Eljárás az (I) általános képletű 1H-imidazol-származékok és sztereokémiai izomerformái vagy sói előállítására, a képletben

R¹ jelentése hidrogénatom vagy merkaptocsoport,

L jelentése (j) általános képletű csoport, ebben a képletben

G¹ jelentése fenilcsoport vagy -N=C-R¹⁴

R¹⁵

általános képletű csoport, vagy halogénatommal, ciano-, 3—7 szénatomos cikloalkilcsoporttal vagy

-O-C-R¹⁶, -C-R¹⁶, -C-O-R¹⁶, -N-R¹⁶,

O O O R¹⁷

R¹⁹ O R¹⁷

-Si-R²⁰, -S-R¹⁹ vagy -P-OR¹⁶ általános

R²¹ R²²

képletű csoporttal monoszubsztituált 1—4 szénatomos alkilcsoport, ezekben a képletekben

R¹⁴, R¹⁵, R¹⁶, R¹⁷, R¹⁹, R²⁰ és R²¹ jelentése 1—4 szénatomos alkilcsoport vagy

R¹⁶ és R¹⁷ együtt 3—6 szénatomos alkilcsoportot jelent,

R²² jelentése 1—4 szénatomos alkoxi-csoport,

5 X jelentése 9H-fluoren-9-il-, 4,5,6,7-tetrahidro-4-benzo(b)tienil-, 4-tiokromanil- vagy 2,3-dihidro-2,2-di(1—4 szénatomos alkil)-3-benzo(b)furil-csoport vagy (aa'), (ab'), (k') vagy -CH-Z általános képletű csoport

10

A

ezekben a képletekben

R⁶ és R⁷ jelentése hidrogénatom vagy 1—4 szénatomos alkilcsoport vagy a kettő együtt gem-helyzetben kapcsolódó 3—6 szénatomos spirocikloalkángyűrű vagy vic-helyzetben kapcsolódó 1—4 szénatomos alkilcsoport,

R⁶ jelentése hidrogénatom, 1—4 szénatomos alkil- vagy fenil-(1—4 szénatomos alkil)-csoport, vagy

R⁶ és R⁷ együtt vic-helyzetben kapcsolódó 1—4 szénatomos alkilcsoport,

R¹⁰ jelentése hidrogén- vagy halogénatom,

A jelentése hidrogénatom, 2-piridil-, 1-naftil-, 3—7 szénatomos cikloalkil-, 1—6 szénatomos alkilcsoport vagy alkilrészen 1—4 szénatomos alkoxicsoporttal adott esetben monoszubsztituált fenil-(1—4 szénatomos alkil)-csoport,

Z jelentése halogénatommal vagy 1—4 szénatomos alkilcsoporttal adott esetben monoszubsztituált fenilcsoport, azzal a megkötéssel, hogy

—L jelentése halogén-alkoxi-karbonil-csoporttól eltérő, ha X jelentése 1-fenil-etil-csoport,

—L jelentése dialkil-amino-alkoxi-karbonil-csoporttól eltérő, ha X jelentése 1-indanil- vagy 1,2,3,4-tetrahidro-1-naftil-csoport,

azzal jellemezve, hogy

a) az L helyén (1—6 szénatomos alkoxi)-karbonil-csoportot tartalmazó (I) általános képletű vegyületek előállításához (II) általános képletű vegyületet, a képletben

X jelentése a tárgyi körben megadott,

L jelentése a fenti,

hangyasav 1—4 szénatomos alkilészterével kondenzálunk alkálifém-alkoholát jelenlétében inert oldószerekben, majd a kapott (III) általános képletű köztiterméket, a képletben

X jelentése a tárgyi körben megadott,

L jelentése a fenti,

M jelentése alkálifématom,

alkálifém-tiocianáttal sav jelenlétében (Ia) általános képletű 2-merkaptó-imidazol-származékká alakítjuk, a képletben

X jelentése a tárgyi körben megadott,

L jelentése a fenti,

amelyet kívánt esetben salétromsav segítségével, adott esetben nátrium-nitrit jelenlétében (Ib) általános képletű vegyületté alakítunk, a képletben

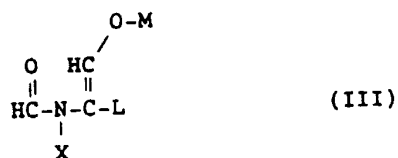
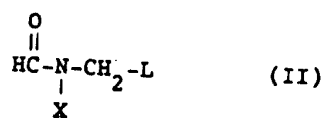
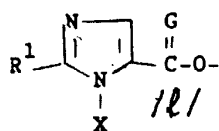
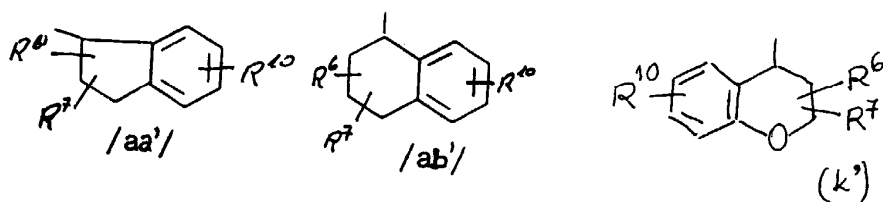
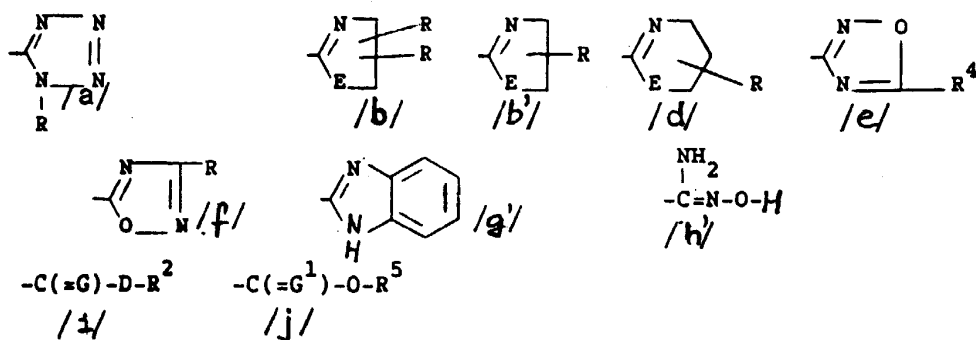
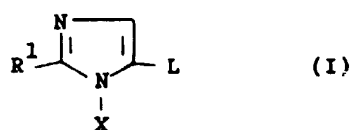
65

X jelentése a tárgyi körben megadott,
 L jelentése a fenti,
 vagy
 b) (V) általános képletű aktivált vegyületet, a képletben
 R^1 és X jelentése a fenti,
 G jelentése azonos G^1 jelentésével,
 T jelentése klór-, brómatom, (1—5 szén-atomos alkil)-karbonil-oxi- vagy (I) általános képletű csoport,
 $H-O-R^5$ általános képletű alkohollal reagál-

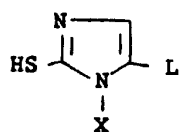
5 tatunk inert oldószerben, adott esetben bázis jelenlétében, amelynek során L helyén $-C(=G^1)-O-R^5$ csoportot tartalmazó (I) általános képletű vegyületet kapunk, majd kívánt esetben a kapott vegyületet önmagában ismert módon más, az (I) általános képletű körén belül eső vegyületté alakítjuk és kívánt esetben megfelelő savval kezelve sóvá alakítjuk és/vagy a kívánt sztereokémiai izomerformát elválasztjuk.
 10 (Elsőbbsége: 1986. 12. 24.)

3 lap rajz képletekkel

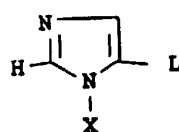
Int.Cl. C 07 D 233/54; C 07 D 403/04;
C 07 D 413/04; C 07 D 417/04; A 01 N 43/50;
A 01 N 43/54; A 01 N 43/713; A 01 N 43/72;
A 01 N 43/82



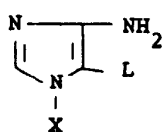
Int.Cl₅ C 07 D 233/54; C 07 D 403/04;
C 07 D 413/04; C 07 D 417/04; A 01 N 43/50;
A 01 N 43/54; A 01 N 43/713; A 01 N 43/72;
A 01 N 43/82



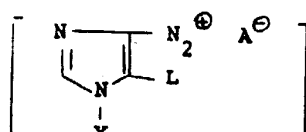
(Ia)



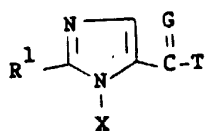
(Ib)



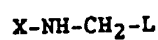
(IV)



(IV-a)



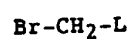
(V)



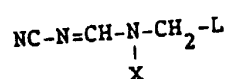
(VI)



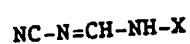
(VII)



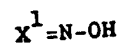
(VIII)



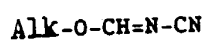
(IX)



(X)



(XII),

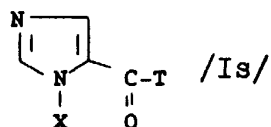
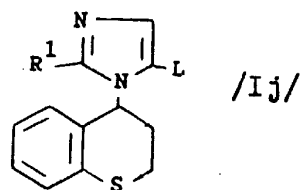
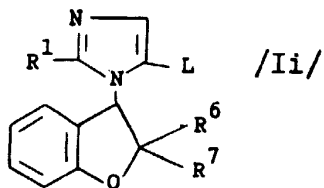
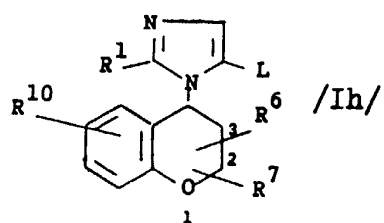
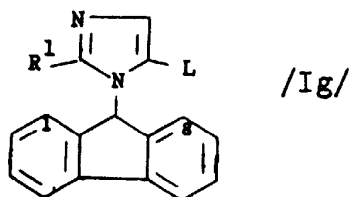
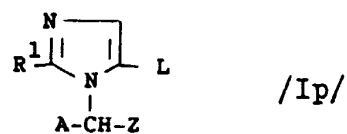
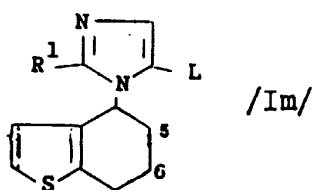
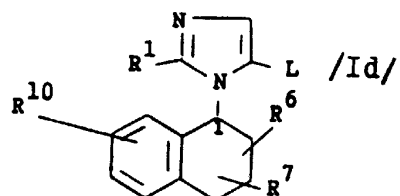
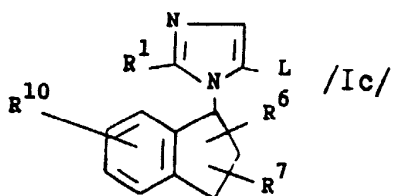


(XI)



(XIII)

Int.Cl. C 07 D 233/54; C 07 D 403/04;
C 07 D 413/04; C 07 D 417/04; A 01 N 43/50;
A 01 N 43/54; A 01 N 43/713; A 01 N 43/72;
A 01 N 43/82



Kiadja: Országos Találmányi Hivatal, Budapest
A kiadásért felel: Himer Zoltán osztályvezető

№ 990. Nyomdaipari vállalat, Ungvár