

P9503930

ÜZÉRT  
IDŐ

74311 A

**SZUBSZTITUÁLT SPIROHETEROCIKLUSOS 1H-3-ARIL-PIRROLIDIN-  
-2,4-DION-SZÁRMAZÉKOK, ELJÁRÁS AZ ELŐÁLLÍTÁSUKRA ÉS KÁRTEVŐ  
ELLENI SZERKÉNT VALÓ ALKALMAZÁSUK**

**KIVONAT**

A találmány új (I) általános képletű szubsztituált spirociklusos 1H-3-aril-pirrolidin-2,4-dion-származékokra, az előállításukra szolgáló eljárásokra és kártevőirtó szerként, valamint herbicidként történő felhasználásukra vonatkozik.

Az (I) általános képletben

A és B együttes jelentése a szomszédos szénatommal együtt, amelyhez kapcsolódnak, legalább egy heteroatom által megszakított szubsztituálatlan vagy szubsztituált 5-6 tagú ciklus,

X jelentése alkilcsoport, halogénatom vagy alkoxics csoport,

Y jelentése hidrogén- vagy halogénatom, alkil-, alkoxi- vagy halogén-alkilcsoport,

Z jelentése alkilcsoport, halogénatom vagy alkoxics csoport,

n jelentése 0, 1, 2 vagy 3,

G jelentése (a) hidrogénatom vagy (b), (c), (d), (e), (f) vagy (g) általános képletű csoportok, ahol a képletekben

E jelentése egyvegyértéknyi fémion vagy ammóniumion,

L és M jelentése oxigén- vagy kénatom,

R<sup>1</sup> jelentése adott esetben halogénatommal szubsztituált alkil-, alkenil-, alkoxi-alkil-, alkil-tio-alkil-, poli(alkoxi-alkil)- vagy cikloalkil-csoport, amely heteroatomot is tartalmazhat, továbbá R<sup>1</sup> je-

jelentése adott esetben szubsztituált fenil-, fenil-alkil-, hetero-aril-, fenoxi-alkil- vagy hetero-aril-oxi-alkilcsoport,

$R^2$  jelentése adott esetben szubsztituált alkil-, cikloalkil-, alkenil-, alkoxi-alkil-, poli(alkoxi-alkil)- vagy adott esetben szubsztituált fenil- vagy benzilcsoport,

$R^3$ ,  $R^4$  és  $R^5$  jelentése egymástól függetlenül adott esetben halogénatommal szubsztituált alkil-, alkoxi-, alkil-amino-, dialkil-amino-, alkil-tio-, alkenil-tio, cikloalkil-tio- vagy adott esetben szubsztituált fenil-, fenoxi- vagy fenil-tio-csoport,

$R^6$  és  $R^7$  jelentése egymástól függetlenül hidrogénatom, adott esetben halogénatommal szubsztituált alkil-, cikloalkil-, alkenil-, alkoxi-, alkoxi-alkil-, adott esetben szubsztituált fenil- vagy benzilcsoport, vagy

$R^6$  és  $R^7$  a N-atommal együttesen, amelyhez kötődnek, egy, adott esetben oxigén- vagy kénatomot tartalmazó ciklust jelentenek.

*R<sup>1</sup>*

P95C93C

000000

A

ÖZÖRÉNY  
TUDÁNY

**SZUBSZTITUÁLT SPIROHETEROCIKLUSOS 1H-3-ARIL-PIRROLIDIN-  
-2,4-DION-SZÁRMAZÉKOK, ELJÁRÁS AZ ELŐÁLLÍTÁSUKRA ÉS KÁRTEVŐ  
ELLENI SZERKÉNT VALÓ ALKALMAZÁSUK**

A találmány új szubsztituált spirociklusos 1H-3-aril-pirrolidin-2,4-dion-származékokra, az előállításukra szolgáló eljárásokra és kártevőirtó szerként, valamint herbicidként történő felhasználásukra vonatkozik.

A 3-acil-pirrolidin-2,4-dionok farmakológiai tulajdonságait S. Suzuki és mtsai írták le (Chem. Pharm. Bull. 15, 1120 /1967/). Továbbá R. Schmierer és H. Mildenberger N-fenil-pirrolidin-2,4-dionokat szintetizáltak (Liebigs Ann. Chem. 1985, 1095), ezen vegyületek biológiai hatékonyságát azonban nem ismertették. Leírták továbbá az 5-vinil-tetramsavakat és farmakológiai tulajdonságaikat a GB-A 22 66 888 sz. közrebocsátási iratban.

Az EP-A 0 262 399 sz. közrebocsátási iratból a 3-aril-pirrolidin-2,4-dionok megismerhetők, melyeknek azonban sem herbicid, sem inszekticid vagy akaricid hatása nem ismeretes. Herbicid, inszekticid vagy akaricid hatása a szubsztituálatlan, biciklusos 3-aril-pirrolidin-2,4-dion-származékoknak (EP-A 355 599 és EP-A 415-211), valamint a szubsztituált mono-ciklusos 3-aril-pirrolidin-2,4-dion-származékoknak (EP-A 377 893, EP 442 077, EP 497 127) és a szubsztituált

biciklusos 3-aril-pirrolidon-származékoknak (EP 501 129) ismert.

Továbbá ismertek policiklusos 3-aril-pirrolidin-2,4-dion-származékok (EP 442 073), valamint 1H-3-aril-pirrolidin-dion-származékok is (EP 456 063 és EP 521 334).

A jelen találmány új (I) általános képletű szubsztituált spirociklusos 1H-3-aril-pirrolidin-2,4-dion-származékokra vonatkozik, mely képletben

A és B együttes jelentése a szomszédos szénatommal együtt, amelyhez kapcsolódnak, egy, legalább egy heteroatom által megszakított szubsztituálatlan vagy szubsztituált 5-6 tagú ciklus,

X jelentése halogénatom, alkil- vagy alkoxicsoport,

Y jelentése hidrogén- vagy halogénatom, alkil-, alkoxi- vagy halogén-alkilcsoport,

Z jelentése halogénatom, alkil- vagy alkoxicsoport,

n jelentése 0, 1, 2 vagy 3,

G jelentése (a) hidrogénatom vagy (b), (c), (d), (e), (f) vagy (g) általános képletű csoportok, ahol a képletekben

E jelentése egyvegyértéknyi fémion vagy ammóniumion,

L és M jelentése oxigén- vagy kénatom,

R<sup>1</sup> jelentése adott esetben halogénatommal szubsztituált alkil-, alkenil-, alkoxi-alkil-, alkil-tio-alkil-, poli(alkoxi-alkil)- vagy cikloalkil-csoport, amely heteroatomot is tartalmazhat, továbbá R<sup>1</sup> je-

lentése adott esetben szubsztituált fenil-, fenil-alkil-, hetero-aril-, fenoxi-alkil- vagy hetero-aril-oxi-alkilcsoport,

R<sup>2</sup> jelentése adott esetben szubsztituált alkil-, cikloalkil-, alkenil-, alkoxi-alkil-, poli(alkoxi-alkil)- vagy adott esetben szubsztituált fenil- vagy benzilcsoport,

R<sup>3</sup>, R<sup>4</sup> és R<sup>5</sup> jelentése egymástól függetlenül adott esetben halogénatommal szubsztituált alkil-, alkoxi-, alkil-amino-, dialkil-amino-, alkil-tio-, alkenil-tio, cikloalkil-tio- vagy adott esetben szubsztituált fenil-, fenoxi- vagy fenil-tio-csoport,

R<sup>6</sup> és R<sup>7</sup> jelentése egymástól függetlenül hidrogénatom, adott esetben halogénatommal szubsztituált alkil-, cikloalkil-, alkenil-, alkoxi-, alkoxi-alkil-, adott esetben szubsztituált fenil- vagy benzilcsoport, vagy

R<sup>6</sup> és R<sup>7</sup> a N-atommal együttesen, amelyhez kötődnek, egy, adott esetben oxigén- vagy kénatomot tartalmazó ciklust jelentenek.

A (I) általános képlet G csoportjának különböző (a), (b), (c), (d), (e), (f) és (g) jelentéseivel kapcsolatban az (Ia)-(Ig) képleteket adjuk meg, ahol

A, B, E, L, M, X, Y, Z, R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup>, R<sup>3</sup>, R<sup>4</sup>, R<sup>5</sup>, R<sup>6</sup> és R<sup>7</sup> és n jelentése a fentiekben megadott.

Egy vagy több kiralitáscentrum alapján az (Ia)-(Ig) képletű vegyületek általában sztereoizomer-keverék formájában keletkeznek.

Továbbá azt találtuk, hogy az új (I) általános képletű szubsztituált 1H-3-aril-pirrolidin-2,4-dion-származékok a következőkben leírt eljárásokkal állíthatók elő.

(A) Az (Ia) általános képletű 1H-3-aril-pirrolidin-2,4-dionokat vagy ezek enoljait, ahol  
A, B, X, Y, Z és n jelentése a fentiekben megadott, úgy kapjuk meg, hogyha egy (II) általános képletű N-acil-aminosavésztert, ahol  
A, B, X, Y, Z és n jelentése a fenti és R<sup>8</sup> jelentése alkilcsoport, higitószer és egy bázis jelenlétében intramolekulárisan kondenzálunk, vagy

(B) az (Ib) általános képletű vegyületeket, ahol  
A, B, X, Y, Z, R<sup>1</sup> és n jelentése a fentiekben megadott, úgy kapjuk meg, hogyha egy (Ia) általános képletű vegyületet, ahol  
A, B, X, Y, Z és n jelentése a fenti,  
α) egy (III) általános képletű savhalogeniddel, ahol R<sup>1</sup> jelentése a fentiekben megadott és Hal jelentése halogén-, különösen klór- vagy bróm-atom,

adott esetben higitószer és adott esetben egy sav-  
megkötőszer jelenlétében reagáltatunk,  
vagy

- β) egy (IV) általános képletű karbonsavanhidriddel,  
ahol  
 $R^1$  jelentése a fenti,  
adott esetben higitószer és adott esetben egy sav-  
megkötőszer jelenlétében reagáltatunk;  
vagy

- (C) az (Ic) általános képletű vegyületeket, ahol  
A, B, X, Y, Z,  $R^2$  és n jelentése a fentiekben megadott,  
és M jelentése oxigén- vagy kénatom,  
úgy állíthatjuk elő, hogy egy (Ia) általános képletű  
vegyületet, ahol  
A, B, X, Y, Z és n jelentése a fenti,  
egy (V) általános képletű klór-hangyasav-észterrel vagy  
klór-hangyasav-tiolészterrel, ahol  
 $R^2$  és M jelentése a fenti,  
adott esetben egy higitószer és adott esetben egy sav-  
megkötőszer jelenlétében reagáltatunk;  
vagy

- (D) az (Ic-2) általános képletű vegyületek előállítására,  
ahol A, B,  $R^2$ , X, Y, Z és n jelentése a fenti és  
M jelentése oxigén- vagy kénatom,  
egy (Ia) általános képletű vegyületet, ahol  
A, B, X, Y, Z és n jelentése a fentiekben megadott,

- $\alpha$ ) egy (VI) általános képletű klór-monotio-hangyasav-észterrel vagy klór-ditio-hangyasavészterrel, ahol M és  $R^2$  jelentése a fenti, adott esetben higitószer és adott esetben egy savmegkötőszer jelenlétében reagáltatunk; vagy
- $\beta$ ) szénkénnel és végül egy (VII) általános képletű alkil-halogeniddel, ahol  $R^2$  jelentése a fenti és Hal jelentése klór-, bróm vagy jódatom, adott esetben higitószer és adott esetben egy bázis jelenlétében reagáltatunk; vagy
- (E) az (Id) képletű vegyületeket, ahol A, B, X, Y, Z,  $R^3$  és n jelentése a fenti, úgy kapjuk meg, hogyha egy (Ia) képletű vegyületet, ahol A, B, X, Y, Z és jelentése a fentiekben megadott, egy (VIII) általános képletű szulfonsav-kloriddal, ahol  $R^3$  jelentése a fenti, adott esetben higitószer és adott esetben egy savmegkötőszer jelenlétében reagáltatunk; vagy
- (F) az (Ie) általános képletű 3-aril-pirrolidin-2,4-dionokat ahol A, B, X, Y, Z,  $R^4$ ,  $R^5$  és n jelentése a fenti, megkapjuk, hogyha egy (Ia) képletű 1-H-3-aril-pirrolidin-2,4-diont illetve ennek enolját, ahol

A, B, X, Y, Z és n jelentése a fenti,  
 egy (IX) általános képletű foszfor-vegyülettel, ahol  
 L, R<sup>4</sup> és R<sup>5</sup> jelentése a fenti és  
 Hal jelentése halogén, előnyösen klór- vagy brómatom,  
 adott esetben higitószer és adott esetben egy savmeg-  
 kötőszer jelenlétében reagáltatunk;  
 vagy

(G) az (If) általános képletű vegyületeket, ahol  
 A, B, X, Y, Z és n jelentése a fenti és  
 E egyvegyértéknyi fémiont vagy ammóniumiont jelent,  
 úgy állítjuk elő, hogy egy (Ia) képletű vegyületet, ahol  
 A, B, X, Y, Z és n jelentése a fenti,  
 egy (X) képletű fémvegyülettel vagy (XI) képletű amin-  
 nal, ahol  
 Me jelentése egy- vagy kétértékű fémion,  
 t jelentése 1 vagy 2,  
 R<sup>10</sup>, R<sup>11</sup> és R<sup>12</sup> jelentése egymástól függetlenül hidro-  
 génatom vagy alkilcsoport és  
 R<sup>13</sup> jelentése hidrogénatom, hidroxil- vagy 1-4 szénato-  
 mos alkoxi-csoport,  
 adott esetben higitószer jelenlétében reagáltatunk.

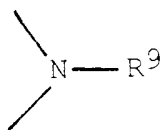
(H) Továbbá azt találtuk, hogy az (Ig) általános képletű ve-  
 gyületeket, ahol  
 A, B, X, Y, Z, R<sup>6</sup>, R<sup>7</sup> és n jelentése a fenti,  
 úgy kapjuk meg, hogyha egy (Ia) képletű vegyületet, ahol  
 A, B, X, Y, Z és n jelentése a fenti,

- $\alpha$ ) egy (XII) képletű vegyülettel, ahol  
 L és  $R^6$  jelentése a fenti,  
 adott esetben higitószer és adott esetben egy ka-  
 talizátor jelenlétében reagáltatunk,  
 vagy
- $\beta$ ) egy (XIII) képletű karbamidsav-kloriddal vagy tio-  
 karbamidsav-kloriddal, ahol  
 L,  $R^6$  és  $R^7$  jelentése a fenti,  
 adott esetben higitószer és adott esetben egy sav-  
 megkötőszer jelenlétében reagáltatunk.

Továbbá azt találtuk, hogy az új (I) általános képletű 1H-3-  
 aril-pirrolidin-2,4-dion-származékok kiemelkedő inszekticid,  
 akaricid és herbicid hatást mutatnak.

A találmány szerinti általános képletekben:

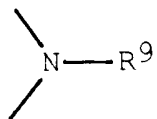
A, B és a szénatom, amelyhez kapcsolódnak, jelentése előnyö-  
 sen egy 5-6-tagú spirociklus, amely az



képletű csoportot és/vagy oxigénatomot és/vagy kénatomot  
 tartalmaz, és amely szubsztituálatlan vagy egy vagy több  
 alkil-, cikloalkil-, halcalkil-, alkoxi-, tioalkil-, fe-  
 nilcsoporttal vagy halogénatommal szubsztituált lehet.

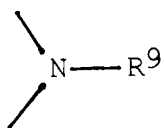
A, B és a szénatom, amelyhez kapcsolódnak, jelentése különö-

sen előnyösen egy 5-6-tagú spirociklus, amely az



képletű csoportot és/vagy oxigénatomot és/vagy kénatomot tartalmaz, és amely szubsztituálatlan vagy egy vagy több 1-6 szénatomos alkil-, 1-8 szénatomos cikloalkil-, 1-3 szénatomos haloalkil-, 1-4 szénatomos alkoxi-, 1-4 szénatomos tioalkil- vagy fenilcsoporttal, fluor- vagy klór-atommal szubsztituált lehet..

A, B és a szénatom, amelyhez kapcsolódnak, együttes jelentése legelőnyösebben egy 5-6-tagú spirociklus, amely az



képletű csoportot és/vagy oxigénatomot és/vagy kénatomot tartalmaz, és amely szubsztituálatlan vagy egy vagy több metil-, etil-, propil-, izopropil-, butil-, izobutil-, szek-butil-, terc-butil-, ciklohexil-, trifluor-metil-, metoxi-, metiltio- vagy fenilcsoporttal, fluor- vagy klór-atommal szubsztituált lehet.

X jelentése előnyösen 1-6 szénatomos alkilcsoport, halogénatom vagy 1-6 szénatomos alkoxics csoport, még előnyösebben 1-4 szénatomos alkilcsoport, halogénatom vagy 1-4 szénatomos alkoxics csoport, és legelőnyösebben metil-, etil-, propil-, 2-propilcsoport, fluor-, klór- vagy bróm-

atom, metoxi- vagy etoxicsoport.

- Y jelentése előnyösen hidrogénatom, 1-6 szénatomos alkilcsoport, halogénatom, 1-6 szénatomos alkoxi- vagy 1-3 szénatomos halogén-alkilcsoport, még előnyösebben hidrogénatom, 1-4 szénatomos alkilcsoport, halogénatom, 1-4 szénatomos alkoxi- vagy 1-2 szénatomos halogén-alkilcsoport, és legelőnyösebben hidrogénatom, metil-, etil-, propil-, i-propil-, butil-, i-butil-, terc-butil-, metoxi-, etoxi- vagy trifluor-metilcsoport, klór- vagy brómatom.
- Z jelentése előnyösen 1-6 szénatomos alkilcsoport, halogénatom vagy 1-6 szénatomos alkoxicsoport, még előnyösebben 1-4 szénatomos alkilcsoport, halogénatom vagy 1-4 szénatomos alkoxicsoport, és legelőnyösebben metil-, etil-, propil-, i-propil-, butil-, i-butil-, terc-butil-, metoxi- vagy etoxicsoport, fluor-, klór- vagy brómatom.
- G jelentése (a) hidrogénatom vagy (b), (c), (d), (e), (f) vagy (g) képletű csoport, amelyekben  
 E jelentése egyvegyértéknyi fémion vagy ammóniumion és  
 L és M jelentése oxigén- vagy kénatom.
- R<sup>1</sup> jelentése előnyösen adott esetben halogénatommal szubsztituált 1-20 szénatomos alkil-, 2-10 szénatomos alkenil-, (1-8 szénatomos alkoxi)-(1-8 szénatomos alkil)-, (1-8 szénatomos alkil)-tio-(1-8 szénatomos alkil)-, (1-8

szénatomos polialkoxi)-(1-8 szénatomos alkil)- vagy 3-8 gyűrűatomot tartalmazó cikloalkilcsoport, amely oxigén- és/vagy kénatommal lehet megszakítva és egy 1-6 szénatomos alkilcsoporttal lehet helyettesítve,

adott esetben halogénatommal, nitro-, 1-6 szénatomos alkil-, 1-6 szénatomos alkoxi-, 1-6 szénatomos halogén-alkil- vagy 1-6 szénatomos halogén-alkoxicssoporttal szubsztituált fenilcsoport,

adott esetben halogénatommal, nitro-, 1-6 szénatomos alkil-, 1-6 szénatomos alkoxi-, 1-6 szénatomos halogén-alkil- vagy 1-6 szénatomos halogén-alkoxicssoporttal szubsztituált fenil-(1-6 szénatomos alkil)-csoport,

adott esetben halogénatommal és/vagy 1-6 szénatomos alkilcsoporttal szubsztituált heteroarilcsoport,

adott esetben halogénatommal és/vagy 1-6 szénatomos alkilcsoporttal szubsztituált fenoxi-(1-6 szénatomos alkil)-csoport vagy

adott esetben halogénatommal, amino- és/vagy 1-6 szénatomos alkilcsoporttal szubsztituált heteroaril-oxi-(1-6 szénatomos alkil)-csoport.

R<sup>2</sup> jelentése előnyösen adott esetben halogénatommal szubsztituált 1-20 szénatomos alkil-, 3-10 szénatomos alke-

nil-, (1-8 szénatomos alkoxi)-(2-8 szénatomos alkil)-,  
(1-8 szénatomos polialkoxi)-(2-8 szénatomos alkil)-  
csoport,

adott esetben halogénatommal vagy 1-6 szénatomos alkil-  
csoporttal szubsztituált 3-6 szénatomos cikloalkilcso-  
port vagy

adott esetben halogénatommal, nitro-, 1-6 szénatomos  
alkil-, 1-6 szénatomos alkoxi- vagy 1-6 szénatomos  
halogén-alkilcsoporttal szubsztituált fenil-vagy benzil-  
csoport.

R<sup>3</sup>, R<sup>4</sup> és R<sup>5</sup> jelentése egymástól függetlenül előnyösen adott  
esetben halogénatommal szubsztituált 1-8 szénatomos al-  
kil-, 1-8 szénatomos alkoxi-, 1-8 szénatomos alkil-ami-  
no-, di(1-8 szénatomos alkil)-amino-, 1-8 szénatomos  
alkil-tio-, 3-5 szénatomos alkenil-tio-, 3-7 szénatomos  
cikloalkil-tio-, továbbá adott esetben halogénatommal,  
nitro-, ciano-, 1-4 szénatomos alkoxi-, 1-4 szénatomos  
halogénalkoxi-, 1-4 szénatomos alkil-tio-, 1-4 szénato-  
mos halogénalkil-tio-, 1-4 szénatomos alkil-, 1-4 szén-  
atomos halogénalkil-csoporttal szubsztituált fenil-,  
fenoxi- vagy fenil-tiocsoport.

R<sup>6</sup> és R<sup>7</sup> jelentése egymástól függetlenül előnyösen hidrogén-  
atom, adott esetben halogénatommal szubsztituált 1-10  
szénatomos alkil-, 3-10 szénatomos cikloalkil-, 1-10

szénatomos alkoxi-, 3-8 szénatomos alkenil-, (1-8 szénatomos alkoxi)-(1-8 szénatomos alkil)-csoport, adott esetben halogénatommal, 1-8 szénatomos halogénalkil-, 1-8 szénatomos alkil- vagy 1-8 szénatomos alkoxicsoporttal szubsztituált fenil- vagy benzilcsoport, vagy a N-atommal együtt, amelyhez kötődnek egy, adott esetben oxigén- vagy kénatommal megszakított 3-7-tagú gyűrű.

$R^9$  jelentése előnyösen hidrogénatom,  $R^1$ ,  $COR^1$ ,  $CO_2R^2$ , ahol  $R^1$  illetőleg  $R^2$  jelentése azonos a fentiekben  $R^1$ -re illetve  $R^2$ -re megadott előnyös jelentésekkel.

$n$  jelentése előnyösen 0, 1, 2 vagy 3.

$G$  különösen előnyös jelentése (a) hidrogénatom vagy (b), (c), (d), (e), (f) vagy (g) képletű csoportok, ahol

$E$  jelentése egyvegyértéknyi fémion vagy ammóniumion és  $L$  és  $M$  jelentése oxigén- vagy kénatom,

$R^1$  jelentése különösen előnyösen adott esetben halogénatommal szubsztituált 1-16 szénatomos alkil-, 2-8 szénatomos alkenil-, (1-6 szénatomos alkoxi)-(1-6 szénatomos alkil)-, (1-6 szénatomos alkil)-tio-(1-6 szénatomos alkil)-, (1-6 szénatomos polialkoxi)-(1-6 szénatomos alkil)- vagy 3-7 gyűrűatomot tartalmazó cikloalkilcsoport, amely oxigén- és/vagy kénatommal lehet megszakítva és egy 1-4 szénatomos alkilcsoporttal lehet helyettesítve,

adott esetben halogénatommal, nitro-, 1-4 szénatomos alkil-, 1-4 szénatomos alkoxi-, 1-3 szénatomos halogén-alkil- vagy 1-3 szénatomos halogén-alkoxicsoporttal szubsztituált fenilcsoport,

adott esetben halogénatommal, 1-4 szénatomos alkil-, 1-4 szénatomos alkoxi-, 1-3 szénatomos halogénalkil- vagy 1-3 szénatomos halogén-alkoxicsoporttal szubsztituált fenil-(1-4 szénatomos alkil)-csoport,

adott esetben fluor-, klór-, brómatommal és/vagy 1-4 szénatomos alkilcsoporttal szubsztituált furanil-, tienil-, piridil-, pirimidil-, tiazolil- vagy pirazolil-csoport,

adott esetben fluor-, klór-, brómatommal és/vagy 1-4 szénatomos alkilcsoporttal szubsztituált fenoxi-(1-5 szénatomos alkil)-csoport vagy

adott esetben fluor-, klór-, brómatommal és/vagy 1-4 szénatomos alkilcsoporttal szubsztituált piridiloxi-(1-6 szénatomos alkil)-, pirimidiloxi-(1-6 szénatomos alkil)- vagy tiazoliloxi-(1-6 szénatomos alkil)-csoport.

R<sup>2</sup> jelentése különösen előnyösen adott esetben halogénatommal szubsztituált 1-16 szénatomos alkil-, 3-8 szénatomos alkenil-, (1-6 szénatomos alkoxi)-(2-6 szénatomos alkil)-, (1-6 szénatomos polialkoxi)-(2-6 szénatomos

alkil)-csoport,

adott esetben fluor-, klóratommal vagy 1-4 szénatomos alkilcsoporttal szubsztituált 3-6 szénatomos cikloalkil-csoport vagy

adott esetben halogénatommal, nitro-, 1-4 szénatomos alkil-, 1-3 szénatomos alkoxi- vagy 1-3 szénatomos halogén-alkilcsoporttal szubsztituált fenil-vagy benzil-csoport.

R<sup>3</sup>, R<sup>4</sup> és R<sup>5</sup> jelentése egymástól függetlenül különösen előnyösen adott esetben halogénatommal szubsztituált 1-6 szénatomos alkil-, 1-6 szénatomos alkoxi-, 1-6 szénatomos alkil-amino-, di(1-6 szénatomos alkil)-amino-, 1-6 szénatomos alkil-tio-, 3-4 szénatomos alkenil-tio-, 3-6 szénatomos cikloalkil-tio-, továbbá adott esetben fluor-klór- vagy brómatommal, nitro-, ciano-, 1-3 szénatomos alkoxi-, 1-3 szénatomos halogénalkoxi-, 1-3 szénatomos alkil-tio-, 1-3 szénatomos halogénalkil-tio-, 1-3 szénatomos alkil-, 1-3 szénatomos halogénalkil-csoporttal szubsztituált fenil-, fenoxi- vagy fenil-tiocsoport.

R<sup>6</sup> és R<sup>7</sup> jelentése egymástól függetlenül különösen előnyösen hidrogénatom, adott esetben halogénatommal szubsztituált 1-8 szénatomos alkil-, 3-8 szénatomos cikloalkil-, 1-8 szénatomos alkoxi-, 3-6 szénatomos alkenil-, (1-6 szénatomos alkoxi)-(1-6 szénatomos alkil)-csoport, adott e-

setben halogénatommal, 1-5 szénatomos halogénalkil-, 1-5 szénatomos alkil- vagy 1-5 szénatomos alkoxicsoporttal szubsztituált fenil- vagy benzilcsoport, vagy a N-atommal együtt, amelyhez kötődnek egy, adott esetben oxigén- vagy kénatommal megszakított 4-7-tagú gyűrű.

R<sup>9</sup> jelentése különösen előnyösen hidrogénatom, COR<sup>1'</sup>, CO<sub>2</sub>R<sup>1'</sup> ahol R<sup>1'</sup> jelentése 1-6 szénatomos alkil-, fenil- vagy benzilcsoport.

n jelentése különösen előnyösen 0, 1 vagy 2.

G egészen különösen előnyös jelentése (a) hidrogénatom vagy (b), (c), (d), (e), (f) vagy (g) képletű csoportok, ahol

E jelentése egyvegyértéknyi fémion vagy ammóniumion és L és M jelentése oxigén- vagy kénatom.

R<sup>1</sup> jelentése egészen különösen előnyösen adott esetben fluor- vagy klóratommal szubsztituált 1-14 szénatomos alkil-, 2-6 szénatomos alkenil-, (1-4 szénatomos alkoxi)-(1-6 szénatomos alkil)-, (1-4 szénatomos alkil)-tio-(1-6 szénatomos alkil)-, (1-4 szénatomos polialkoxi)-(1-4 szénatomos alkil)- vagy 3-6 gyűrűatomot tartalmazó cikloalkilcsoport, amely 1-2 oxigén- és/vagy kénatommal lehet megszakítva és metil- vagy etilcsoporttal lehet helyettesítve,

adott esetben fluor-, klór- vagy brómatommal, metil-, etil-, propil-, i-propil-, metoxi-, etoxi-, trifluor-metil-, trifluor-metoxi- vagy nitrocsoporttal szubsztituált fenilcsoport,

adott esetben fluor-, klór- vagy brómatommal, metil-, etil-, propil-, i-propil-, metoxi-, etoxi-, trifluor-metil- vagy trifluor-metoxi-csoporttal szubsztituált fenil-(1-3 szénatomos alkil)-csoport,

adott esetben fluor-, klór-, brómatommal, metil- vagy etilcsoporttal szubsztituált furanil-, tienil-, piridil-, pirimidil-, tiazolil- vagy pirazolil-csoport,

adott esetben fluor-, klóratommal, metil- vagy etilcsoporttal szubsztituált fenoxi-(1-4 szénatomos alkil)-csoport vagy

adott esetben fluor-, klóratommal, metil- vagy etilcsoporttal szubsztituált piridiloxi-(1-4 szénatomos alkil)-pirimidiloxi-(1-4 szénatomos alkil)- vagy tiazoliloxi-(1-4 szénatomos alkil)-csoport.

R<sup>2</sup> jelentése egészen különösen előnyösen adott esetben fluor- vagy klóratommal szubsztituált 1-14 szénatomos alkil-, 3-6 szénatomos alkenil-, (1-4 szénatomos alkoxi)-(2-6 szénatomos alkil)-, (1-4 szénatomos polialkoxi)-(2-6 szénatomos alkil)-csoport, adott esetben fluor-

vagy klóratommal, metil- vagy etilcsoporttal szubsztituált 3-6 szénatomos cikloalkilcsoport vagy

adott esetben fluor- vagy klóratommal, nitro-, metil-, etil-, propil-, i-propil-, metoxi-, etoxi- vagy tri-fluor-metilcsoporttal szubsztituált fenil- vagy benzil-csoport.

R<sup>3</sup>, R<sup>4</sup> és R<sup>5</sup> jelentése egymástól függetlenül egészen különösen előnyösen adott esetben fluor- vagy klóratommal szubsztituált 1-4 szénatomos alkil-, 1-4 szénatomos alkoxi-, 1-4 szénatomos alkil-amino-, di(1-4 szénatomos alkil)-amino-, 1-4 szénatomos alkil-tio-, továbbá adott esetben fluor-, klór- vagy brómatommal, nitro-, ciano-, 1-2 szénatomos alkoxi-, 1-2 szénatomos fluoralkoxi-, 1-2 szénatomos alkil-tio-, 1-2 szénatomos fluoralkil-tio-, 1-3 szénatomos alkilcsoporttal szubsztituált fenil-, fenoxi- vagy fenil-tiocsoport.

R<sup>6</sup> és R<sup>7</sup> jelentése egymástól függetlenül egészen különösen előnyösen hidrogénatom, adott esetben fluor-, klór vagy brómatommal szubsztituált 1-6 szénatomos alkil-, 3-6 szénatomos cikloalkil-, 1-6 szénatomos alkoxi-, (1-6 szénatomos alkoxi)-(1-4 szénatomos alkil)-csoport, adott esetben fluor-, klór- vagy brómatommal, 1-4 szénatomos halogénalkil-, 1-4 szénatomos alkil- vagy 1-4 szénatomos alkoxicssoporttal szubsztituált fenil- vagy benzil-csoport, vagy a N-atommal együtt, amelyhez kötődnek egy,

adott esetben oxigén- vagy kénatommal megszakított 5-7-tagú gyűrű.

$R^9$  jelentése egészen különösen előnyösen hidrogénatom,  $COR^{1'}$ ,  $CO_2R^{1'}$ , ahol  $R^{1'}$  jelentése 1-4 szénatomos alkil-, fenil- vagy benzilcsoport.

$n$  jelentése egészen különösen előnyösen 0 vagy 1.

Egy vagy több kiralitáscentrum alapján az (Ia)-(Ig) képletű vegyületek általában mint sztereoizomer-keverékek keletkeznek. Felhasználhatók diasztereoizomer-keverékek valamint tiszta diasztereomerek vagy enantiomerek formájában is.

Ha a 4-(2,4-diklór-fenil-acetil-amino)-1-acetil-piperidin-4-karbonsav-etilészterből kiindulva az (A) eljárást alkalmazzuk, akkor a találmány szerinti eljárás lefolyását az (1) reakcióvázlat szemlélteti.

Ha a (B) eljárás  $\alpha$  változata szerint járunk el 3-(2,4,6-trimetil-fenil)-5,5-(etilén-tio-etilén)-pirrolidin-2,4-dionból és pivaloil-kloridból kiindulva, abban az esetben a találmány szerinti eljárás lefolyását a (2) reakcióvázlaton mutatjuk be.

Ha a (B) eljárás  $\beta$  változata szerint kiindulási anyagként 3-(2,4,6-trimetil-fenil)-5,5-(etilén-tio-etilén)-pirrolidin-2,4-diont és ecetsavanhidridet alkalmazunk, akkor a találmány

szerinti eljárás lefolyása a (3) reakcióvázlaton követhető.

Ha a (C) eljárás szerint járunk el 3-(2,4,6-trimetil-fenil)-5,5-(etilén-tio-metilén)-pirrolidin-2,4-dionból és klórhangyasav-etoxi-etilészterből kiindulva, akkor a találmány szerinti eljárás lefolyását a (4) reakcióvázlat szemlélteti.

Ha a (D) eljárás  $\alpha$ ) változata szerint járunk el és 3-(2,4,6-trimetil-fenil)-5,5-(etilén-oxa-etilén)-pirrolidin-2,4-dionból és klór-monotio-hangyasav-metilészterből indulunk ki, akkor a reakció lefolyását az (5) reakcióvázlaton mutatjuk be.

Ha a (D) eljárás  $\beta$ ) változata szerint eljárva kiindulási anyagokként 3-(2,4,6-trimetil-fenil)-5,5-(etilén-tio-etilén)-pirrolidin-2,4-diont, szénkéneget és metiljodidot alkalmazunk, akkor a reakció lefolyása a (6) reakcióvázlaton látható.

Ha az (E) eljárás szerint járunk el 3-(2,4,6-trimetil-fenil)-5,5-(metilén-tio-propilén)-pirrolidin-2,4-dionból és metánszulfonsav-kloridból kiindulva, abban az esetben a reakció lefolyását a (7) reakcióvázlat szemlélteti.

Ha az (F) eljárás szerint kiindulási anyagokként 3-(2,4-dimetil-fenil)-5,5-(etilén-tio-etilén)-pirrolidin-2,4-diont és metántio-foszforsavklorid-(2,2,2-trifluor-etilészter)-t alkalmazunk, akkor a reakció lefolyását a (8) reakcióvázlaton mutatjuk be.

Ha a (G) eljárás szerint reakciókomponensekként 3-(2,4,6-trimetil-fenil)-5,5-(etilén-tio-metilén)-pirrolidin-2,4-diont és NaOH-ot alkalmazunk, akkor a reakció lefolyása a (9) reakciósémán követhető.

Ha a (H) eljárás  $\alpha$ ) változata szerint kiindulási anyagként 3-(2,4,6-trimetil-fenil)-5,5-(etilén-oxa-etilén)-pirrolidin-2,4-diont és etil-izocianátot alkalmazunk, úgy a reakció lefolyását a (10) reakcióvázlat szemlélteti.

Ha a (H) eljárás  $\beta$ ) változata szerint eljárva 3-(2,4,6-trimetil-fenil)-5,5-(etilén-benzilamino-etilén)-pirrolidin-2,4-dionból és dimetil-karbamidsav-kloridból indulunk ki, a reakció lefolyását ekkor a (11) reakcióvázlaton mutatjuk be.

A (XIVa) képletű heteroatomokkal megszakított ciklusos aminokarbonsavak, amelyekben A és B jelentése a fentiekben megadott, általában Bucherer-Bergs-féle reakcióval vagy Strecker-szintézissel állíthatók elő (L. Munday: J. Chem. Soc. 4372 /1961/; J.T. Eward, C. Jitrangeri: Can. J. Chem. 53, 3339 /1975/).

Továbbá a fenti (A) eljárásnál alkalmazott (II) általános képletű kiindulási anyagokat - ahol A, B, X, Y, Z, n és R<sup>8</sup> jelentése a fentiekben megadott - úgy állíthatjuk elő, hogy egy (XVI) képletű amino-nitrilt, amely képletben A és B jelentése a fenti, egy (XV) képletű fenilecetsav-halogeniddel, mely képletben X, Y, Z és n jelentése a fentiekben megadott

és Hal jelentése klór- vagy brómatom, a (XVII) képletű vegyületté, mely képletben A, B, X, Y, Z és n jelentése a fentiekben megadott, átalakítunk, amelyet végül kénsavas alkoholizisnek vetünk alá.

A (XVII) képletű vegyületek ugyancsak újak és egy korábban benyújtott szabadalmi bejelentés közös igénypontjának tárgyát képezik, amely az eljárást is magában foglalja.

A fentiekben leírt (A) eljáráshoz kiindulási anyagokként szükséges (II) általános képletű vegyületek, mely képletben A, B, X, Y, Z, n és  $R^8$  jelentése a fentiekben megadott, is újak és a korábban benyújtott bejelentés közös igénypontjának tárgyát képezik.

A (II) képletű acil-aminosavésztereket például úgy kaphatjuk meg, hogy egy (XIV) képletű aminosav-származékot, amelyben  $R^{8'}$  jelentése hidrogénatom (XIVa) vagy alkilcsoport (XIVb) és A és B jelentése a fentiekben megadott, egy (XV) képletű fenilecetsav-halogeniddel, mely képletben X, Y, Z és n jelentése a fentiekben megadott és Hal jelentése klór- vagy brómatom, acilezzük (Chem. Reviews 52, 237-416 /1953/; Bhattacharya: Indien J. Chem. 6, 341-5 /1968/), és az így megképződött ( $R^{8'}$  = hidrogénatom) (IIa) képletű acilaminosav-származékokat, mely képletben A, B, X, Y, Z és n jelentése a fentiekben megadott, észterezzük.

Példaként, de nem korlátozó jelleggel, az előállítási példákban megnevezett köztitermékeken kívül az alábbi (II) képletű vegyületeket soroljuk fel:

N-(2,4-diklór-fenil-acetil)-1-amino-tiolán-karbonsav-metilészter,

N-(2,4-diklór-fenil-acetil)-1-amino-tetrahidro-tio-pirán-karbonsav-metilészter,

N-(2,4-diklór-fenil-acetil)-1-amino-tetrahidro-pirán-karbonsav-metilészter,

4-(2,4-diklór-fenil-acetil-amino)-N-metil-piperidin-4-karbonsav-metilészter,

4-(2,4-diklór-fenil-acetil-amino)-N-acetil-piperidin-4-karbonsav-metilészter,

4-(2,4-diklór-fenil-acetil-amino)-N-(karboxi-etil)-piperidin-4-karbonsav-metilészter,

N-(2,6-diklór-fenil-acetil)-1-amino-tiolán-karbonsav-metilészter,

N-(2,6-diklór-fenil-acetil)-1-amino-tetrahidro-tio-pirán-karbonsav-metilészter,

N-(2,6-diklór-fenil-acetil)-1-amino-tetrahidropirán-karbonsav-metilészter,

4-(2,6-diklór-fenil-acetil-amino)-N-metil-piperidin-4-karbonsav-metilészter,

4-(2,6-diklór-fenil-acetil-amino)-N-acetil-piperidin-4-karbonsav-metilészter,

4-(2,6-diklór-fenil-acetil-amino)-N-(karboxi-etil)-piperidin-4-karbonsav-metilészter,

N-(2-klór-6-fluor-fenil-acetil)-1-amino-tiolán-karbonsav-metilészter,

N-(2-klór-6-fluor-fenil-acetil)-1-amino-tetrahidro-tio-pirán-karbonsav-metilészter,

N-(2-klór-6-fluor-fenil-acetil)-1-amino-tetrahidropirán-karbonsav-metilészter,

4-(2-klór-6-fluor-fenil-acetil-amino)-N-metil-piperidin-4-karbonsav-metilészter,

4-(2-klór-6-fluor-fenil-acetil-amino)-N-acetil-piperidin-4-karbonsav-metilészter,

4-(2-klór-6-fluor-fenil-acetil-amino)-N-(karboxi-etil)-piperidin-4-karbonsav-metilészter,

N-(2,4,6-trimetil-fenil-acetil)-1-amino-tiolán-karbonsav-metilészter,

N-(2,4,6-trimetil-fenil-acetil)-1-amino-tetrahidro-tio-pirán-karbonsav-metilészter,

N-(2,4,6-trimetil-fenil-acetil)-1-amino-tetrahidropirán-karbonsav-metilészter,

4-(2,4,6-trimetil-fenil-acetil-amino)-N-metil-piperidin-4-karbonsav-metilészter,

4-(2,4,6-trimetil-fenil-acetil-amino)-N-acetil-piperidin-4-karbonsav-metilészter,

4-(2,4,6-trimetil-fenil-acetil-amino)-N-(karboxi-etil)-piperidin-4-karbonsav-metilészter,

N-(2,4-dimetil-fenil-acetil)-1-amino-tiolán-karbonsav-metilészter,

N-(2,4-dimetil-fenil-acetil)-1-amino-tetrahidro-tio-pirán-karbonsav-metilészter,

N-(2,4-dimetil-fenil-acetil)-1-amino-tetrahidropirán-karbonsav-metilészter,  
 4-(2,4-dimetil-fenil-acetil-amino)-N-metil-piperidin-4-karbonsav-metilészter,  
 4-(2,4-dimetil-fenil-acetil-amino)-N-acetil-piperidin-4-karbonsav-metilészter,  
 4-(2,4-dimetil-fenil-acetil-amino)-4-(karboxi-etil)-piperidin-4-karbonsav-metilészter,  
 N-(2,4-dimetil-fenil-acetil)-1-amino-4-fenil-ciklohexán-karbonsav-metilészter.

Példaként, de nem korlátozó jelleggel, az előállítási példákban megnevezett köztitermékeken kívül az alábbi (IIa) képletű vegyületeket soroljuk fel:

N-(2,4-diklór-fenil-acetil)-1-amino-tiolán-karbonsav,  
 N-(2,4-diklór-fenil-acetil)-1-amino-tetrahidro-tio-pirán-karbonsav,  
 N-(2,4-diklór-fenil-acetil)-1-amino-tetrahidropirán-karbonsav,  
 4-(2,4-diklór-fenil-acetil-amino)-N-metil-piperidin-4-karbonsav,  
 4-(2,4-diklór-fenil-acetil-amino)-N-acetil-piperidin-4-karbonsav,  
 4-(2,4-diklór-fenil-acetil-amino)-N-(karboxi-etil)-piperidin-4-karbonsav,  
 N-(2,6-diklór-fenil-acetil)-1-amino-tiolán-karbonsav,

N-(2,6-diklór-fenil-acetil)-1-amino-tetrahydro-tio-pirán-karbonsav,  
 N-(2,6-diklór-fenil-acetil)-1-amino-tetrahidropirán-karbonsav,  
 4-(2,6-diklór-fenil-acetil-amino)-N-metil-piperidin-4-karbonsav,  
 4-(2,6-diklór-fenil-acetil-amino)-N-acetil-piperidin-4-karbonsav,  
 4-(2,6-diklór-fenil-acetil-amino)-N-(karboxi-etil)-piperidin-4-karbonsav,  
 N-(2-klór-6-fluor-fenil-acetil)-1-amino-tiolán-karbonsav,  
 N-(2-klór-6-fluor-fenil-acetil)-1-amino-tetrahydro-tio-pirán-karbonsav,  
 N-(2-klór-6-fluor-fenil-acetil)-1-amino-tetrahidropirán-karbonsav,  
 4-(2-klór-6-fluor-fenil-acetil-amino)-N-metil-piperidin-4-karbonsav,  
 4-(2-klór-6-fluor-fenil-acetil-amino)-N-acetil-piperidin-4-karbonsav,  
 4-(2-klór-6-fluor-fenil-acetil-amino)-N-(karboxi-etil)-piperidin-4-karbonsav,  
 N-(2,4,6-trimetil-fenil-acetil)-1-amino-tiolán-karbonsav,  
 N-(2,4,6-trimetil-fenil-acetil)-1-amino-tetrahydro-tio-pirán-karbonsav,  
 N-(2,4,6-trimetil-fenil-acetil)-1-amino-tetrahidropirán-karbonsav,  
 4-(2,4,6-trimetil-fenil-acetil-amino)-N-metil-piperidin-4-karbonsav,

4-(2,4,6-trimetil-fenil-acetil-amino)-N-acetil-piperidin-4-karbonsav,  
 4-(2,4,6-trimetil-fenil-acetil-amino)-N-(karboxi-etil)-piperidin-4-karbonsav,  
 N-(2,4-dimetil-fenil-acetil)-1-amino-tiolán-karbonsav,  
 N-(2,4-dimetil-fenil-acetil)-1-amino-tetrahidro-tio-pirán-karbonsav,  
 N-(2,4-dimetil-fenil-acetil)-1-amino-tetrahidropirán-karbonsav,  
 4-(2,4-dimetil-fenil-acetil-amino)-N-metil-piperidin-4-karbonsav,  
 4-(2,4-dimetil-fenil-acetil-amino)-N-acetil-piperidin-4-karbon-sav,  
 4-(2,4-dimetil-fenil-acetil-amino)-4-(karboxi-etil)-piperidin-4-karbonsav.

Példaként, de nem korlátozó jelleggel, az előállítási példákban megnevezett köztitermékeken kívül az alábbi (XVII) képletű vegyületeket soroljuk fel:

N-(2,4-diklór-fenil-acetil)-1-amino-tiolán-karbonsav-nitril,  
 N-(2,4-diklór-fenil-acetil)-1-amino-tetrahidro-tio-pirán-karbonsav-nitril,  
 N-(2,4-diklór-fenil-acetil)-1-amino-tetrahidropirán-karbonsav-nitril,  
 4-(2,4-diklór-fenil-acetil-amino)-N-metil-piperidin-4-karbonsav-nitril,

4-(2,4-diklór-fenil-acetil-amino)-N-acetil-piperidin-4-karbonsav-nitril,

4-(2,4-diklór-fenil-acetil-amino)-N-(karboxi-etil)-piperidin-4-karbonsav-nitril,

N-(2,6-diklór-fenil-acetil)-1-amino-tiolán-karbonsav-nitril,

N-(2,6-diklór-fenil-acetil)-1-amino-tetrahidro-tio-pirán-karbonsav-nitril,

N-(2,6-diklór-fenil-acetil)-1-amino-tetrahidropirán-karbonsav-nitril,

4-(2,6-diklór-fenil-acetil-amino)-N-metil-piperidin-4-karbonsav-nitril,

4-(2,6-diklór-fenil-acetil-amino)-N-acetil-piperidin-4-karbonsav-nitril,

4-(2,6-diklór-fenil-acetil-amino)-N-(karboxi-etil)-piperidin-4-karbonsav-nitril,

N-(2-klór-6-fluor-fenil-acetil)-1-amino-tiolán-karbonsav-nitril,

N-(2-klór-6-fluor-fenil-acetil)-1-amino-tetrahidro-tio-pirán-karbonsav-nitril,

N-(2-klór-6-fluor-fenil-acetil)-1-amino-tetrahidropirán-karbonsav-nitril,

4-(2-klór-6-fluor-fenil-acetil-amino)-N-metil-piperidin-4-karbonsav-nitril,

4-(2-klór-6-fluor-fenil-acetil-amino)-N-acetil-piperidin-4-karbonsav-nitril,

4-(2-klór-6-fluor-fenil-acetil-amino)-N-(karboxi-etil)-piperidin-4-karbonsav-nitril,

N-(2,4,6-trimetil-fenil-acetil)-1-amino-tiolán-karbonsav-nitril,  
 N-(2,4,6-trimetil-fenil-acetil)-1-amino-tetrahydro-tio-pirán-karbonsav-nitril,  
 N-(2,4,6-trimetil-fenil-acetil)-1-amino-tetrahidropirán-karbonsav-nitril,  
 4-(2,4,6-trimetil-fenil-acetil-amino)-N-metil-piperidin-4-karbonsav-nitril,  
 4-(2,4,6-trimetil-fenil-acetil-amino)-N-acetil-piperidin-4-karbonsav-nitril,  
 4-(2,4,6-trimetil-fenil-acetil-amino)-N-(karboxi-etil)-piperidin-4-karbonsav-nitril,  
 N-(2,4-dimetil-fenil-acetil)-1-amino-tiolán-karbonsav-nitril,  
 N-(2,4-dimetil-fenil-acetil)-1-amino-tetrahydro-tio-pirán-karbonsav-nitril,  
 N-(2,4-dimetil-fenil-acetil)-1-amino-tetrahidropirán-karbonsav-nitril,  
 4-(2,4-dimetil-fenil-acetil-amino)-N-metil-piperidin-4-karbonsav-nitril,  
 4-(2,4-dimetil-fenil-acetil-amino)-N-acetil-piperidin-4-karbonsav-nitril,  
 4-(2,4-dimetil-fenil-acetil-amino)-4-(karboxi-etil)-piperidin-4-karbonsav-nitril.

A (IIa) képletű vegyületek a (XV) képletű fenilecetsav-halogenidekből és a (XIVa) képletű aminosavakból például Schotten-Baumann reakcióval állíthatók elő (Organikum, 9. kiadás, 446 o. /1970/ VEB Deutscher Verlag der Wissenschaft-

ten, Berlin).

A találmány szerinti (B), (C), (D), (E), (F), (G) és (H) eljárások megvalósításához kiindulási anyagokként szükséges (III) képletű savhalogenidek, (IV) képletű karbonsavanhidridek, (V) képletű klór-hangyasavészter vagy klór-hangyasavtioészter, (VI) képletű klór-monotio-hangyasavészter vagy klór-ditio-hangyasavészter, (VII) képletű alkilhalogenidek, (VIII) képletű szulfonsav-kloridok, (IX) képletű foszforvegyületek és a (X) képletű fémhidroxidok vagy (XI) képletű aminok és a (XII) képletű izocianátok vagy (XIII) képletű karbamidsavklorid mind a szerves illetve szervetlen kémiában általánosan ismertek.

Az (A) eljárást azzal jellemezhetjük, hogy a (II) általános képletű vegyületeket, ahol A, B, X, Y, Z, n és  $R^8$  jelentése a fenti, bázisok jelenlétében intramolekuláris kondenzálásnak vetjük alá.

Higitószerként a találmány szerinti (A) eljárásnál valamennyi szokásos inert, szerves oldószert alkalmazhatjuk. Előnyösen hasznosíthatók a szénhidrogének, például toluol vagy xilol, továbbá éterek, például dibutil-éter, tetrahydrofurán, dioxán, glikol-dimetil-éter és diglikol-dimetil-éter, ezenkívül a poláros oldószerek, például dimetil-szulfoxid, szulfolán, dimetil-formamid és N-metil-pirrolidon, valamint alkoholok, például metanol, etanol, propanol, izo-propanol, butanol, izo-butanol és terc-butanol.

Bázisokként (deprotonáló szer) a találmány szerinti (A) eljárás során valamennyi szokásos protonakceptort alkalmazhatjuk. Előnyösen használhatók az alkálifém- és alkáliföldfém-oxidok, -hidroxidok- és -karbonátok, például nátrium-hidroxid, kálium-hidroxid, magnézium-oxid, kalcium-oxid, nátrium-karbonát, kálium-karbonát és kalcium-karbonát, amelyeket fázis-átvivő katalizátorok, például trietil-benzil-ammónium-klorid, tetrabutyl-ammónium-bromid, Adogen 464® vagy TDA 1 jelenlétében is alkalmazhatunk /az Adogen 464 = metil-tri-(8-10 szénatomos alkil)-ammónium-klorid, és a TDA 1 = tris(metoxi-etoxi-etil)-amin/.

Továbbá használhatók az alkálifémek, például nátrium vagy kálium, az alkálifém- és alkáliföldfém-amidok és -hidridek, mint például nátrium-amid, nátrium-hidrid és kalcium-hidrid, ezenkívül alkálifém-alkoholátokat, például nátrium-metilátot, nátrium-etilátot és kálium-terc-butylátot is alkalmazhatunk.

A találmány szerinti (A) eljárásnál a reakció-hőmérsékletét tág határon belül változtathatjuk. Általában 0°C és 250°C közötti, előnyösen 50°C és 150°C közötti hőmérsékleten dolgozunk.

Rendszerint a találmány szerinti (A) eljárást atmoszférikus nyomáson hajtjuk végre.

Az (A) eljárás kivitelezésénél a (II) általános képletű reakciókomponenst és a deprotonáló bázist általában körülbelül

kétszeres ekvimoláris mennyiségben használjuk. Az is lehetséges, hogy az egyik vagy másik komponenst nagyobb feleslegben (legfeljebb 3 mól-ig) alkalmazhatjuk.

A (B $\alpha$ ) eljárás azzal jellemezhető, hogy az (Ia) képletű vegyületeket egy (III) képletű karbonsav-halogeniddel reagáltatjuk.

A találmány szerinti (B $\alpha$ ) eljárásnál hígítószerként a savhalogenidek alkalmazásánál valamennyi, ilyen vegyületekkel szemben inert oldószert alkalmazhatjuk. Előnyösen használhatunk szénhidrogéneket, például benzint, benzolt, toluolt, xilolt és tetralint, továbbá halogénezett szénhidrogéneket, például metilén-kloridot, kloroformot, széntetrakloridot, klórbenzolt és orto-diklórbenzolt, valamint ketonokat, például acetont és metil-izopropil-ketont, továbbá étereket, például dietil-étert, tetrahidrofuránt és dioxánt, ezenkívül karbonsav-észtereket, például etil-acetátot, és erősen poláros oldószereket, például dimetil-szulfoxidot és szulfolánt. Ha a savhalogenid hidrolízis-stabilitása megengedi, a reakciót víz jelenlétében is kivitelezhetjük.

Ha a megfelelő karbonsav-halogenideket használjuk, akkor savmegkötő szerként a találmány szerinti (B $\alpha$ ) eljárásnál valamennyi szokásos savmegkötő szóba jöhet. Előnyösen alkalmazhatók a tercier aminok, például trietil-amin, piridin, diazabiciklooktán (DABCO), diazabicikloundecén (DBU), diazabiciklononén (DBN), Hünig-féle bázis és N,N-dimetil-anilin,

továbbá alkáliföldfém-oxidok, például magnézium- és kalcium-oxid, ezenkívül alkáli- és alkáliföldfém-karbonátok, például nátrium-karbonát, kálium-karbonát és kalcium-karbonát valamint alkáli-hidroxidok, például nátrium-hidroxid és kálium-hidroxid.

A reakció hőmérsékletét a találmány szerinti (B $\alpha$ ) eljárásnál a karbonsav-halogenidek alkalmazásakor is széles intervallumon belül változtathatjuk. Általában -20°C és +150 °C, előnyösen 0°C és 100°C közötti hőmérsékleten dolgozunk.

A találmány szerinti (B $\alpha$ ) eljárás kivitelezése során az (Ia) általános képletű kiindulási anyagokat, valamint a (III) általános képletű karbonsav-halogenideket rendszerint közel ekvivalens mennyiségben alkalmazzuk. A karbonsav-halogenidet azonban nagyobb feleslegben is (egészen 5 mól-ig) használhatjuk. A feldolgozás a szokásos módokon történik.

A (B $\beta$ ) eljárásra az jellemző, hogy az (Ia) képletű vegyületeket (IV) képletű karbonsavanhidridekkel reagáltatjuk.

A találmány szerinti (B $\beta$ ) eljárásnál reakciókomponensként a (IV) képletű karbonsavanhidrideket használjuk, így higitószerként előnyösen azokat a higitószereket alkalmazhatjuk, amelyek a savhalogenidek használatakor is előnyösként szóba jönnek. Általában az alkalmazott karbonsavanhidridet feleslegben is használhatjuk, ilyenkor az egyidejűleg higitószerként is funkcionál.

A reakció hőmérsékletét a találmány szerinti (B $\beta$ ) eljárásnál a karbonsavanhidridek alkalmazásakor is tág határokon belül változtathatjuk. Általában  $-20^{\circ}\text{C}$  és  $+150^{\circ}\text{C}$ , előnyösen  $0^{\circ}\text{C}$  és  $100^{\circ}\text{C}$  közötti hőmérsékleten dolgozunk.

A találmány szerinti (B $\beta$ ) eljárás kivitelezése során az (Ia) képletű kiindulási anyagokat és a (IV) képletű karbonsavanhidrideket rendszerint közel ekvivalens mennyiségben alkalmazzuk. A karbonsavanhidridet azonban nagyobb feleslegben is (egészen 5 mól-ig) használhatjuk. A feldolgozás a szokásos módokon történik.

Általában úgy járunk el, hogy a higitószert és a feleslegben lévő karbonsavanhidridet, valamint a keletkező karbonsavat desztillációval vagy szerves oldószerrel vagy vízzel történő mosással eltávolítjuk.

A (C) eljárást az jellemzi, hogy egy (Ia) képletű vegyületet (V) képletű klór-hangyasav-észterrel vagy klór-hangyasav-tiolészterrel reagáltatunk.

Ha a megfelelő klór-hangyasav-észtereket illetve klór-hangyasav-tiolésztereket használjuk, akkor savmegkötő szerként a találmány szerinti (C) eljárásnál valamennyi szokásos savmegkötőszer szóba jöhet. Előnyösen alkalmazhatunk tercier aminokat, például trietil-amint, piridint, DABCO-t, DBU-t, DBA-t, Hünig-bázist és N,N-dimetil-anilint, továbbá alkáliföldfém-oxidokat, például magnézium- és kalcium-oxidot, ezen-

kivül alkáli- és alkáliföldfém-karbonátokat, például nátrium-karbonátot, kálium-karbonátot és kalcium-karbonátot, valamint alkáli-hidroxidokat, például nátrium- és kálium-hidroxidot.

Hígítószerként a találmány szerinti (C) eljárásnál a klór-hangyasav-észter illetve klór-hangyasav-tiolészter alkalmazásánál az összes, ilyen vegyületekkel szemben inert oldószert használhatjuk. Előnyösen alkalmazhatók szénhidrogének, például benzin, benzol, toluol, xilol és tetralin, továbbá halogénezett szénhidrogének, például metilén-klorid, kloroform, széntetraklorid, klór-benzol és orto-diklór-benzol, továbbá ketonok, például aceton és metil-izopropil-keton, valamint éterek, például dietil-éter, tetrahidrofuran és dioxán, ezenkívül karbonsav-észterek, például etil-acetát és erősen poláros oldószerek is, például dimetil-szulfoxid és szulfolán.

Klórhangyasav-észtereket illetve klór-hangyasav-tiolésztereket alkalmazva (V) képletű karbonsav-származékként a reakció hőmérséklete a találmány szerinti (C) eljárás során tág határok között változhat. Ha egy hígítószer és savmegkötőszer jelenlétében dolgozunk, akkor a reakcióhőmérséklet rendszerint  $-20^{\circ}\text{C}$  és  $+100^{\circ}\text{C}$ , előnyösen  $0^{\circ}\text{C}$  és  $50^{\circ}\text{C}$  között változik.

A találmány szerinti (C) eljárást általában atmoszferikus nyomáson végezzük.

A találmány szerinti (C) eljárásnál az (Ia) képletű kiindulási anyagot és a megfelelő (II) képletű klór-hangyasav-

észtert illetve klór-hangyasav-tiolésztert rendszerint közel ekvivalens mennyiségben alkalmazzuk. Azonban az is lehetséges, hogy az egyik vagy másik komponenst nagyobb feleslegben (legfeljebb 2 mól-ig) reagáltatjuk. A feldolgozás ezután a szokásos módon történik. Általában úgy járunk el, hogy a kivált sót eltávolítjuk és a visszamaradó reakcióelegyet a hígítószer eltávolításával betöményítjük.

A (Dα) eljárást az jellemzi, hogy 1 mól (Ia) képletű kiindulási anyagot kb. 1 mól (VI) képletű klór-monotio-hangyasav-észterrel illetve klór-ditio-hangyasav-észterrel 0°C és 120°C között, előnyösen 20 és 60°C közötti hőmérsékleten reagáltatunk.

Adott esetben alkalmazott hígítószerként minden inert poláros szerves oldószer szóba jöhet, például éterek, amidok, alkoholok, szulfonok és szulfoxidok. Előnyösen dimetil-szulfoxidot, terahidrofuránt, dimetil-formamidot és dimetil-szulfidot használhatunk.

Ha egyik előnyös kiviteli mód szerint egy erős deprotonáló szer feleslegével, például nátrium-hidrid vagy kálium-terc-butilát, az (Ia) képletű vegyület enolátját állítjuk elő, akkor a savmegkötőszer további feleslegére nincs szükség.

Savmegkötőszerként a szokásos szervetlen vagy szerves bázisok jöhetnek szóba, például nátrium-hidroxid, nátrium-karbonát, kálium-karbonát, piridin és trietil-amin.

A reakciót normálynomáson vagy magasabb nyomáson , előnyösen normálynomáson folytatjuk le. A feldolgozás ismert módszerekkel történik.

A (Dβ) eljárás során 1 mól (Ia) képletű kiindulási anyaghoz ekvivalens mennyiségben vagy feleslegben szénkéneget adunk.

Ennél a reakciónál előnyösen 0 és 50°C között, különösen előnyösen 20 és 30°C közötti hőmérsékleten dolgozunk.

Gyakran célszerű először az (Ia) képletű kiindulási anyagból egy deprotonáló szer (például kálium-tercier-butilat vagy nátrium-hidrid) feleslegében a megfelelő só előállítani. Az (Ia) képletű vegyületet a szénkéneggel mindaddig reagáltatjuk, amíg a köztitermék képződése befejeződik, például több órán át kevertetjük szobahőmérsékleten.

A további átalakítást a (VII) képletű alkilhalogeniddel előnyösen 0 és 70°C között, különösen 20 és 50°C közötti hőmérsékleten végezzük. Ennek során az alkilhalogenidet legalább ekvimoláris mennyiségben alkalmazzuk.

Atmoszferikus vagy megemelt nyomáson, előnyösen atmoszferikus nyomáson dolgozunk. A feldolgozás a szokásos módokon történik.

Az (E) eljárás során 1 mól (Ia) képletű kiindulási anyagot kb. 1 mól (VIII) képletű szulfonsav-kloriddal 0 és 150°C,

előnyösen 20 és 70°C közötti hőmérsékleten reagáltatunk.

Az adott esetben alkalmazható hígítószerként minden inert poláros szerves oldószer szóba jöhet, például éterek, amidok, nitrilek, alkoholok, szulfonok, szulfoxidok vagy halogénezett szénhidrogének, például metilén-klorid. Előnyös oldószereként dimetil-szulfoxidot, tetrahidrofuránt, dimetil-formamidot, dimetil-szulfidot és metilén-kloridot alkalmazunk.

Ha egyik előnyös kiviteli mód szerint egy erős deprotonáló szer feleslegével (például nátrium-hidrid vagy kálium-terc-butilát) az (Ia) képletű vegyület enolátját állítjuk elő, akkor a savmegkötő szer további feleslegére nincs szükség.

Ha savmegkötőszert alkalmazunk, akkor a szokásos szervetlen vagy szerves bázisok jöhetnek szóba, például nátrium-hidroxid, nátrium-karbonát, kálium-karbonát és piridin.

A reakciót atmoszférikus vagy megemelt nyomáson hajtjuk végre, előnyösen atmoszférikus nyomáson dolgozunk. A feldolgozás a szokásos módokon történik.

Az (E) eljárásnál adott esetben fázis-transzfer-körülmények között dolgozunk (W.J. Süillane és mtsai: J. Chem. Soc., Perkin Trans I, (3) 677-9 /1982/). Ebben az esetben 1 mól (Ia) képletű kiindulási anyagot 0,3-1,5 mól (VIII) képletű szulfonsav-kloriddal, előnyösen 0,5 móllal, 0 és 150°C, előnyösen 20 és 70°C közötti hőmérsékleten reagáltatunk.

Fázis-transzfer-katalizátorként minden kvaterner ammónium-sót alkalmazhatunk, előnyösen tetraoktil-ammónium-bromidot és benzil-trietil-ammónium-kloridot. Szerves oldószerekként ebben az esetben a nem-poláros inert oldószerek szolgálnak, előnyösen benzolt vagy toluolt használunk.

Az (F) eljárás során ahhoz hogy az (Ie) képletű vegyületet megkapjuk 1 mól (Ia) képletű vegyületet 1-2, előnyösen 1-1,3 mól (IX) képletű foszfor-vegyülettel  $-40$  és  $150^{\circ}\text{C}$  között, előnyösen  $-10$  és  $110^{\circ}\text{C}$  közötti hőmérsékleten reagáltatunk.

Az adott esetben alkalmazható hígítószerként minden inert poláros szerves oldószer szóba jöhet, például éterek, amidok, nitrilek, alkoholok, szulfonok, szulfoxidok, stb. Előnyös oldószerként acetonitrilt, dimetil-szulfoxidot, tetrahidrofuránt, dimetil-formamidot és dimetil-szulfidot alkalmazunk.

Az adott esetben alkalmazott savmegkötőszerként a szokásos szervetlen vagy szerves bázisok jöhetnek szóba, például nátrium-hidroxid, nátrium-karbonát, kálium-karbonát és piridin.

Az eljárást atmoszferikus nyomáson vagy megemelt nyomáson hajthatjuk végre, előnyösen atmoszferikus nyomáson dolgozunk. A feldolgozás a szerves kémia ismert módszerei szerint történik. A kiváló végtermék tisztítását előnyösen kristályosítással, kromatográfiás tisztítással vagy úgynevezett

"kidesztilláció"-val, azaz az illó alkotórészek vákuumban történő eltávolításával végezzük.

A (G) eljárás azzal jellemezhető, hogy az (Ia) képletű vegyületeket a (X) képletű fémvegyületekkel vagy (XI) képletű aminokkal reagáltatjuk.

A találmány szerinti (G) eljárásban higitószerként előnyösen étereket, például tetrahidrofuránt, dioxánt, dietil-étert vagy alkoholokat, például metanolt, etanolt, izo-propanolt, de vizet is alkalmazhatunk. A találmány szerinti (G) eljárást rendszerint normálnyomáson hajtjuk végre. A reakcióhőmérséklet általában  $-20$  és  $100^{\circ}\text{C}$  közötti, előnyösen  $0$  és  $50^{\circ}\text{C}$  közötti hőmérséklet.

A (H $\alpha$ ) eljárás során 1 mól (Ia) képletű kiindulási anyagot kb. 1 mól (XII) képletű izocianáttal reagáltatunk  $0$  és  $100^{\circ}\text{C}$ , előnyösen  $20$  és  $50^{\circ}\text{C}$  közötti hőmérsékleten.

Az adott esetben alkalmazott higitószereként minden inert szerves oldószer szóba jöhet, például éterek, amidok, nitrilek, szulfonok vagy szulfoxidok.

Adott esetben a reakciót meggyorsíthatjuk katalizátorok alkalmazásával. Katalizátorokként nagyon előnyösek lehetnek a cinkorganikus vegyületek, mint például dibutil-cink-dilaurát. Az eljárás során előnyösen normálnyomáson dolgozunk.

A (H $\beta$ ) eljárás során 1 mól (Ia ) képletű kiindulási anyagot kb. 1 mól (XIII) képletű karbamidsav-kloriddal reagáltatunk 0 és 150°C, előnyösen 20 és 70°C közötti hőmérsékleten.

Az adott esetben alkalmazott hígítószerekként minden inert szerves oldószer szóba jöhet, például éterek, amidok, alkoholok, szulfonok vagy szulfoxidok. Előnyösen dimetil-szulfoxidot, tetrahidrofuránt, dimetil-formamidot vagy metilén-kloridot alkalmazunk.

Ha egyik előnyös kiviteli mód szerint egy erős deprotonáló szer feleslegével (például nátrium-hidrid vagy kálium-terc-butilát) az (Ia) képletű vegyület enolátját állítjuk elő, akkor a savmegkötő szer további feleslegére nincs szükség.

Ha savmegkötőszert alkalmazunk, akkor a szokásos szervetlen vagy szerves bázisok jöhetnek szóba, például nátrium-hidroxid, nátrium-karbonát, kálium-karbonát, trietil-amin vagy piridin.

Az eljárást atmoszferikus nyomáson vagy megemelt nyomáson hajthatjuk végre, előnyösen atmoszferikus nyomáson dolgozunk. A feldolgozás a szokásos módokon történik.

A hatóanyagok alkalmasak az állati kártevők, előnyösen az izeltlábúak és nematódák, különösen a rovarok és pókok elpusztítására, amelyek a mezőgazdaságban, erdőkben, készlet- és anyagvédelemben, valamint a higiéniaszektorban fordulnak

elő. A normálisan érzékeny és rezisztens fajok ellen is hatásosak, valamint ezek ellen az egyes vagy összes fejlődési stádiumban alkalmazhatók.

A fent említett kártevőkhöz tartoznak a következők:

Az Isopoda rendből pl. az *Oniscus asellus*, *Armadillidium vulgare*, *Porcellio scaber*.

A Diplopoda rendből pl. a *Blaniulus guttulatus*.

A Chilopoda rendből pl. a *Geophilus carpophagus*, *Scutigera spec..*

A Symphyla rendből pl. a *Scutigera immaculata*.

A Thysanura rendből pl. a *Lepisma saccharina*.

A Collembola rendből pl. az *Onychiurus armatus*.

Az Orthoptera rendből pl. a *Blatta orientalis*, *Periplaneta americana*, *Leucophaea maderae*, *Blattella germanica*, *Acheta domesticus*, *Gryllotalpa* spp., *Locusta migratoria migratorioides*, *Melanoplus differentialis*, *Schistocerca gregaria*.

A Dermaptera rendből pl. a *Forficula auricularia*.

Az Isoptera rendből pl. a *Reticulitermes* spp..

Az Anoplura rendből pl. a *Phylloxera vastatrix*, *Pemphigus* spp., *Pediculus humanus corporis*, *Haematopinus* spp., *Linognathus* spp..

A Mallophaga rendből pl. a *Trichodectes* spp., *Damalinea* spp..

A Thysanoptera rendből pl. a *Hercinothrips femoralis*, *Thrips tabaci*.

A Heteroptera rendből pl. az *Eurygaster* spp., *Dysdercus intermedius*, *Piesma quadrata*, *Cimex lectularius*, *Rhodnius prolixus*, *Triatoma* spp.

A Homoptera rendből pl. az *Aleurodes brassicae*, *Bemisia tabaci*, *Traleurodes vaporariorum*, *Aphis gossypii*, *Brevicoryne brassicae*, *Cryptomyzus ribis*, *Aphis fabae*, *Doralis pomi*, *Eriosoma lanigerum*, *Hyalopterus arundinis*, *Macrosiphum avenae*, *Myzus* spp., *Phorodon humuli*, *Rhopalosiphum padi*, *Empoasca* spp., *Euscelis bilobatus*, *Nephotettix cincticeps*, *Lecanium corni*, *Saissetia oleae*, *Laodelphax striatellus*, *Nilaparvata lugens*, *Aonidiella aurantii*, *Aspidiotus hederae*, *Pseudococcus* spp., *Psylla* spp..

A Lepidoptera rendből pl. a *Pectinophora gossypiella*, *Bupalus piniarius*, *Cheimatobia brumata*, *Lithocolletis blancardella*, *Hyponomeuta padella*, *Plutella maculipennis*, *Malacosoma neustria*, *Euproctis chryorrhoea*, *Lymantria* spp., *Bucculatrix thurberiella*, *Phyllocnistis citrella*, *Agrotis* spp., *Euxoa* spp., *Feltia* spp., *Earias insulana*, *Heliothis* spp., *Spodoptera exigua*, *Mamestra brassicae*, *Panolis flammea*, *Prodenia litura*, *Spodoptera* spp., *Trichoplusiani*, *Carpocapsa pomonella*, *Pieris* spp., *Chilo* spp., *Pyrausta nubilalis*, *Ephestia kuehniella*, *Galleria mellonella*, *Tineola bisselliella*, *Tinea pellionella*, *Hofmannophila pseudospretella*, *Cacoecia podana*, *Capua reticulana*, *Choristoneura fumiferana*,

*Clysia ambiguella*, *Homona magnanima*, *Tortrix viridana*.

A Coleoptera rendből pl. az *Anobium punctatum*, *Phizopertha dominica*, *Acanthoscelides obtectus*, *Hylotrupes bajulus*, *Agelastica alni*, *Leptinotarsa decemlineata*, *Phaedon cochleariae*, *Diabrotica* spp., *Psylliodes chrysocephala*, *Epilachna varivestis*, *Atomaria* spp., *Oryzaephilus surinamensis*, *Anthonomus* spp., *Sitophilus* spp., *Otiorrhynchus sulcatus*, *Cosmopolites sordidus*, *Ceuthorrhynchus assimilis*, *Hypera postica*, *Dermetes* spp., *Trogoderma* spp., *Anthrenus* spp., *Attagenus* spp., *Lyctus* spp., *Meligethes aeneus*, *Ptinus* spp., *Niptus hololeucus*, *Gibbium psylloides*, *Tribolium* spp., *Tenebrio molitor*, *Agriotes* spp., *Conoderus* spp., *Melolontha melolontha*, *Amphimallon solstitialis*, *Costelytra zealandica*.

A Hymenoptera rendből pl. a *Diprion* spp., *Hoplocampa* spp., *Lasius* spp., *Monomorium pharaonis*, *Vespa* spp..

A Diptera rendből pl. az *Aedes* spp., *Anopheles* spp., *Culex* spp., *Drosophila melanogaster*, *Musca* spp., *Fannia* spp., *Calliphora erythrocephala*, *Lucilia* spp., *Chrysomyia* spp., *Cuterebra* spp., *Gastrophilus* spp., *Hyppobosca* spp., *Stomoxys* spp., *Oestrus* spp., *Hypoderma* spp., *Tabanus* spp., *Tannia* spp., *Bibio hortulanus*, *Oscinella frit*, *Phorbia* spp., *Pegomyia hyoscyami*, *Ceratitis capitata*, *Dacus oleae*, *Tipula paludosa*.

A Siphonaptera rendből pl. a *Xenopsylla cheopis*, *Ceratophyllus* spp..

Az Arachnida rendből pl. a *Scorpio maurus*, *Latrodectus mactans*.

Az Acarina rendből pl. az *Acarus siro*, *Argas* spp., *Ornithodoros* spp., *Dermanyssus gallinae*, *Eriophyes ribis*, *Phyllocoptura oleivora*, *Boophilus* spp., *Rhipicephalus* spp., *Amblyomma* spp., *Hyalomma* spp., *Ixodes* spp., *Psoroptes* spp., *Chorioptes* spp., *Sarcoptes* spp., *Tarsonemus* spp., *Bryobia praetiosa*, *Panonychus* spp., *Tetranychus* spp..

A találmány szerinti hatóanyagok magas inszekticid és akaricid hatékonyságukkal tűnnek ki.

Különösen jó sikerrel alkalmazhatók a növénykárosító rovarokkal szemben, például a tormalevélbogár (*Phaedon cochleariae*) lárvái ellen vagy a zöld rizskabóca (*Nephotettix cincticeps*) lárvái ellen, a növénykárosító atkák, például az összes pókatka vagy babpókatka (*Tetranychus urticae*) elpusztításához.

A találmány szerinti hatóanyagokat alkalmazhatjuk lombhullató szerekként, föld feletti részeket elpusztító szerekként, növényirtó szerekként, különösen gyomirtó szerekként. Gyomon a legszélesebb értelemben véve mindazon növényeket értjük, amelyek nem-kivánt helyen nőnek.

A találmány szerinti hatóanyagokat például az alábbi növényeknél alkalmazhatjuk:

Kétszikű gyomnövény nemzetségek: Sinapsis, Lepidium, Galium, Stellaria, Matricaria, Anthemis, Galinsoga, Chenopodium, Urtica, Senecio, Amaranthus, Portulaca, Xanthium, Convolvulus, Ipomoea, Polygonum, Sesbania, Ambrosia, Cirsium, Carduus, Sonchus, Solanum, Rorippa, Rotala, Lindernia, Veronica, Abutilon, Emex, Datura, Viola, Galeopsis, Papaver, Centaurea, Trifolium, Ranunculus, Taraxacum.

Kétszikű kultúrák nemzetségei: Gossypium, Glycine, Beta, Daucus, Phaseolus, Pisum, Solanum, Linum, Ipomoea, Vicia, Nicotiana, Lycopersicon, Arachis, Brassica, Lactuca, Cucumis, Cucurbita.

Egyszikű gyomnövény nemzetségek: Echinochloa, Setaria, Panicum, Digitaria, Phelum, Poa, Festuca, Eleusine, Brachiaria, Lolium, Bromus, Avena, Cyperus, Sorghum, Agropyron, Canodon, Monochoria, Fimbristylis, Sagittaria, Eleocharis, Scirpus, Paspalum, Ischaemum, Sphenoclea, Dactyloctenium, Agrostis, Alopecurus, Apera.

Egyszikű kultúrák nemzetségei: Oryza, Zea, Triticum, Hordeum, Avena, Secale, Sorghum, Panicum, Saccharum, Ananas, Asparagus, Allium.

A találmány szerinti hatóanyagok felhasználhatósága azonban nem korlátozódik a fenti kultúrákra, hanem egyéb növényekre is kiterjed.

A vegyületek alkalmasak - koncentrációtól függően - totál-gyomirtáshoz, például ipari területeken, vasúti sínek mentén, fás vagy fa nélküli utakon és tereken. A szerek továbbá erdőkben, diszcserje-, gyümölcs-, szőlő-, citrus-, dió-, banán-, kávé-, tea-, gumi-, olajpálma-, kakaó-, bogyós növények- és komlókultúrákban gyomirtásra, pázsitban, sportgyepen és legelőkön és nem-évelő kultúrákban szelektív gyomirtásra alkalmazhatók.

A találmány szerinti hatóanyagok nagyon alkalmasak egyszikű gyomnövények szelektív irtására kétszikű kultúrákban az elő- és utószaporítási eljárásban. Így például gyapotban vagy cukorrépában nagyon jó sikerrel alkalmazhatók a gyomok irtására.

A hatóanyagokat a szokásos készítményekké alakíthatjuk át, így oldatokká, emulziókká, szóróporrá, szuszpenziókká, porrá, habbá, pasztává, oldható porrá, granulátummá, szuszpenziós-emulziós-koncentrátummá, hatóanyaggal impregnált természetes vagy szintetikus anyaggá, valamint polimer anyagokban lévő finomkapszulákká.

Ezeket a készítményeket ismert módon állítjuk elő, például oly módon, hogy a hatóanyagokat a hordozóanyagokkal, tehát

folyékony oldószerekkel és/vagy szilárd vivőanyagokkal összekeverjük, és adott esetben felületaktív anyagokat, tehát emulgeálószerket és/vagy diszpergálószerket és/vagy habképző anyagokat is alkalmazunk.

Amennyiben hordozóanyagként vizet alkalmazunk, segédoldószerként egy szerves oldószert is adhatunk az elegyhez. Folyékony oldószerként lényegében szóba jöhetnek: aromás vegyületek, például xilol, toluol vagy alkil-naftalinok; klórozott aromás vagy klórozott alifás szénhidrogének, például klór-benzol, klór-etilén vagy metilén-klorid; alifás szénhidrogének, például ciklohexán vagy paraffinok, pl. kőolajfrakciók, ásványi és növényi olajok; alkoholok, pl. butanol vagy glikol; valamint ezek éterei és észterei; ketonok, pl. aceton, metil-etil-keton, metil-izobutil-keton vagy ciklohexanon; erősen poláros oldószerek, például dimetil-formamid és dimetil-szulfoxid, valamint a víz.

Szilárd hordozóanyagként szóba jöhetnek:

például ammónium-sók és természetes kőlisztek, mint a kaolin, agyagföld, talkum, kréta, kvarc, attapulgit, montmorillonit vagy diatómaföld és mesterséges lisztek, például nagy diszperzitású kovasav, alumínium-oxid és szilikátok.

Granulátumokhoz szilárd hordozóanyagként például összetört és frakcionált természetes kőzetek, mint a kalcit, márvány, horzsakő, szepiolit, dolomit alkalmazható, valamint előállíthatunk szintetikus granulátumokat szervetlen vagy szerves lisztekből, és granulátumokat szerves anyagból, például fa-

lisztből, kókuszhéjból, kukoricacsutkából és dohányszárból. Emulgeálószerként és/vagy habképző anyagként nemionos és anionos emulgeátorokat, például poli(oxi-etilén)-zsírsav-észtert, poli(oxi-etilén)-zsíralkohol-étert, például alkil-aril-poliglikol-étert, alkil-szulfonátokat, alkil-szulfátokat, aril-szulfonátokat, valamint tojásfehérje-hidrolizátumot alkalmazhatunk; diszpergálószerként például lignin-szulfit-lúgot és metil-cellulózt használhatunk.

A készítményekben előfordulhatnak tapadást elősegítő anyagok is, például karboxi-metil-cellulóz, természetes és szintetikus por alakú, szemcsés vagy latex formájú polimerek, például gumiarábikum, poli(vinil-alkohol), poli(vinil-acetát), és természetes foszfolipidek, például kefalinok, lecitinek és szintetikus foszfolipidek. További segédanyagok lehetnek az ásványi és növényi olajok.

Festékeként, például szervesetlen pigmentek, mint a vas-oxid, titán-oxid, ferrocianid és szerves festékek, mint például alizarin, azo-fémftalo-cianon-színezékek és nyomelemek, mint például bórvegyületek, vas-, mangán-, réz-, kobalt-, molibdén- és cinksók is felhasználhatók.

A készítmények hatóanyag-tartalma általában 0,1 -95 tömeg%, előnyösen 0,5-90 tömeg%.

A találmány szerinti hatóanyagokat önmagukban vagy ismert herbicidekkel együtt összekeverve készítményekben lehet fel-

használni, amelyek készkészítmények vagy tárolásra alkalmas keverékek lehetnek.

A keverékekben ismert herbicidként szóba jöhet például az 1-amino-6-etil-tio-3-(2,2-dimetil-propil)-1,3,5-triazin-2,4-(1H,3H)-dion (AMETHYDIONE) vagy az N-(2-benzthiazolil)-N,N'-dimetil-karbamid (METABENZTHIAZURON) gyomirtáshoz gabonában; a 4-amino-3-metil-6-fenil-1,2,4-triazin-5(4H)-on (METAMITRON) gyomirtáshoz a cukorrépában és 4-amino-6-(1,1-dimetil-etil)-3-metiltio-1,2,4-triazin-5(4H)-on (METRIBUZIN) a szójabab gyomtalanításához. Továbbá alkalmazható 2,4-diklór-fenoxi-ecetsav (2,4-D); 4-(2,4-diklór-fenoxi)-vajsav (2,4-DB); 2,4-diklór-fenoxi-propionsav (2,4-DP); 3-izopropil-2,1,3-benzotiadiazin-4-on-2,2-dioxid (BENTAZON); metil-5-(2,4-diklór-fenoxi)-2-nitro-benzoát (BIFENOX); 3,5-dibróm-4-hidroxibenzonitril (BROMOXYNIL); 2-klór-N-[(4-metoxi-6-metil-1,3,5-triazin-2-il)-amino]-karbonil-benzolszulfonamid (CHLORSULFURON); 2-[4-(2,4-diklór-fenoxi)-fenoxi]-propionsav, ennek metil- vagy etil-észtere (DICLOFOPMETHYL); 4-amino-6-t-butil-3-etiltio-1,2,4-triazin-5(4H)-on (ETHIOZIN); 2-[4-[(6-klór-2-benzoxazolil)-oxi]-fenoxi]-propánsav, ennek metil- vagy etil-észtere (FENOXAPROP); [(4-amino-3,5-diklór-6-fluor-2-piridinil)-oxi]-ecetsav illetve ennek 1-metil-heptil-észtere (FLUROXYPYR); metil-2-[4,5-dihidro-4-metil-4-(1-metil-etil)-5-oxo-1H-imidazol-2-il]-4(5)-metil-benzoát (IMAZAMETHABENZ); 3,5-dijód-4-hidroxibenzonitril (IOXYNIL); N,N-dimetil-N'-(4-izopropil-fenil)-karbamid (ISOPROTURON); (2-metil-4-klór-fenoxi)-ecetsav (MCPA); (4-klór-2-metil-fenoxi)-propionsav

(MCPPE); N-metil-2-(1,3-benzotiazol-2-il-oxi)-acetanilid (MEFENACET); 2-[[[(4-metoxi-6-metil-1,3,5-triazin-2-il)-amino]-karbonil]-amino]-szulfonil-benzoészav (METSULFURON); N-(1-etil-propil)-3,4-dimetil-2,6-dinitro-anilin (PENDIMETHALIN); o-(6-klór-3-fenil-piridazin-4-il)-S-oktil-tiokarbonát (PYRIDATE); 4-etil-amino-2-t-butil-amino-6-metiltio-s-triazin (TERBUTRYNE); 3-[[[(4-metoxi-6-metil-1,3,5-triazin-2-il)-amino]-karbonil]-amino]-szulfonil]-tiofén-2-karbonsav (THIAMETURON). Néhány keverék meglepő módon szinergetikus hatást is mutat.

A keverékek egyéb ismert hatóanyagokat, mint például fungicideket, inszekticideket, akaricideket, nematocideket, madárelledel, növényi tápanyagok és talajjavítószerek elleni védőanyagokat is tartalmazhatnak.

Az inszekticidekhez tartoznak például a foszforsavészterek, karbamátok, karbonsav-észterek, klórozott szénhidrogének, fenil-karbamidok és mikroorganizmusok által termelt anyagok.

Az alábbi vegyületeket nevezzük meg:

Acrinatrín, Alphamethrin, Betacyfluthrin, Bifenthrin, Brofenprox, Cis-Resmethrin, Clopythrin, Cycloprothrin, Cyfluthrin, Cyhalothrin, Cypermethrin, Deltamethrin, Esfenvalerate, Etofenprox, Fenpropathrin, Fenvalerate, Flucythrinate, Fluvalinate, Lambda-Cyhalothrin, Permethrin, Pyresmethrin, Pyrethrum, Silafluofen, Tralomethrin, Zeta-methrin, Alanycarb, Bendiocarb, Benfuracarb, Bufencarb, Butocarboxim, Carbaryl,

Cartap, Ethiofencarb, Fenobucarb, Fenoxycarb, Isoprocarb, Methiocarb, Methomyl, Metolcarb, Oxamyl, Pirimicarb, Promecarb, Propoxur, Terbam, Thiodicarb, Thiofanox, Trimethacarb, XMC, Xylylcarb, Acephate, Azinphos A, Azinphos M, Bromophos A, Cadusafos, Carbophenothion, Chlorfenvinphos, Chlormephos, Chlorpyrifos, Chlorpyrifos M, Cyanophos, Demeton M, Demeton-S-methyl, Demeton S, Diazinon, Dichlorvos, Dicliphos, Dichlorfenthion, Dicrotophos, Dimethoate, Dimethylvinphos, Dioxathion, Disulfoton, Edifenphos, Ethion, Etrimphos, Fenitrothion, Fenthion, Fonophos, Formothion, Heptenophos, Iprobenfos, Isazophos, Isoxathion, Phorate, Malathion, Mecarbam, Mervinphos, Mesulfenphos, Methacrifos, Methamidophos, Naled, Omethoate, Oxydemeton M, Oxydeprofos, Parathion A, Parathion M, Phenthoate, Phorate, Phosalone, Phosmet, Phosphamdon, Phoxim, Pirimiphos A, Pirimiphos M, Propaphos, Prothiophos, Prothoate, Pyraclophos, Pyridaphenthion, Quinalphos, Salithion, Sebufos, Sulfotep, Sulprofos, Tetrachlorvinphos, Temephos, Thiomethon, Thionazin, Trichlorfon, Triazophos, Vamidothion, Buprofezin, Chlorfluazuron, Diflubenzuron, Flucycloxuron, Flufenoxuron, Hexaflumuron, Pyriproxifen, Tebufenozide, Teflubenzuron, Triflumuron, Imidacloprid, Nitenpyram, N-[(6-chloro-3-pyridinyl)methyl]-N'-cyano-N-methyl-ethanimidamid (NI-25), Abamectin, Amitrazin, Avermectin, Azadirachtin, Bensultap, Bacillus thuriniensis, Cyromazine, Diafenthiuron, Emamectin, Ethofenprox, Fenpyrad, Fipronil, Flufenprox, Lufenuron, Metaldehyd, Milbemectin, Pymetrozine, Tebufenpyrad, Triazuron, Aldicarb, Bendiocarb, Benfuracarb, Carbofuran,

Carbosulfan, Chlorethoxyfos, Cloethocarb, Disulfoton, Ethophrophos, Etrimphos, Fenymiphos, Fipronil, Fonofos, Fosthiazate, Furathiocarb, HCH, Isazophos, Isofenphos, Methiocarb, Monocrotophos, Nitenpyram, Oxamyl, Phorate, Phoxim, Prothiofos, Pyrachlofos, Sebufos, Silafluofen, Tebupirimphos, Tefluthrin, Terbufos, Thiodicarb, Thiafenox, Azocyclotin, Butylpyridaben, Clofentezine, Cyhexatin, Diafenthion, Diethion, Emamectin, Fenazaquin, Fenbutatin Oxide, Fenothiocarb, Fenpropathrin, Fenpyrad, Fenpyroximate, Fluazinam, Fluazuron, Flucycloxuron, Flufenoxuron, Fluvalinate, Fubfenprox, Hexythiazox, Ivermectin, Methidathion, Monocrotophos, Moxidectin, Naled, Phosalone, Profenofos, Pyraclofos, Pyridaben, Pyrimidifen, Tebufenpyrad, Thuringiensin, Triarathene valamint 4-bróm-2-(4-klór-fenil)-1-(etoximetil)-5-(trifluor-metil)-1H-pirrol-3-karbonitril (AC 303630)

A hatóanyagokat önmagukban, készítmények formájában vagy azokból további hígítószerrel készített felhasználási formákban, mint például felhasználásra-kész oldatok, szuszpenziók, emulziók, porok, paszták és granulátumok, alkalmazhatjuk. A felhasználás a szokásos módokon történik, például öntözéssel, spricceléssel, permetezéssel vagy szórással.

A találmány szerinti hatóanyagokat a növények szaporodása előtt és után is alkalmazhatjuk. Bedolgozhatjuk őket a talajba a vetés előtt is.

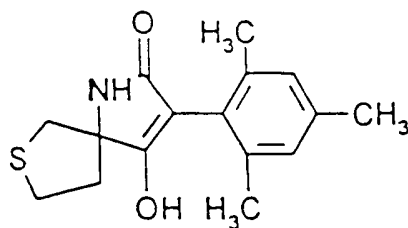
Az alkalmazott hatóanyag mennyisége széles határok között változhat, es lényegében a kívánt effektus fajtájától függ. Általában a felhasznált mennyiség 0,01 - 10 kg hatóanyag pro hektár talajfelszín, előnyösen 0,05 - 5 kg pro ha.

A találmány szerinti hatóanyagok előállítását és felhasználását az általmi kör korlátozása nélkül az alábbi példákön mutatjuk be.

#### **Előállítási példák:**

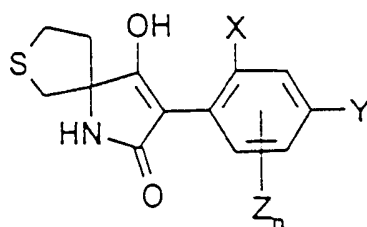
##### Ia - 1. példa:

49,9 g kálium-t-butilátot 130 ml vízmentes tetrahidrofuránba helyezünk es keverés közben 65 g N-(2,4,6-trimetil-fenil)-acetil-tetrahidrotiofén-3-amino-karbonsav-metilészter 420 ml száraz toluolban készített oldatával elegyítjük és 90 percig visszafolyó hűtő alatt forraljuk. Lehűlés után a reakcióelegyet 650 ml vízzel meghigitjuk és a vizes fázist elválasztjuk. A szerves fázist ismételten 300 ml vízzel mossuk. A vizes fázisokat egyesítjük, 70 ml koncentrált sósavval megsavanyítjuk, a kivált csapadékot leszivatjuk és megszárítjuk. Így 56 g (96 %) anyagot kapunk, op.: >230 °C.



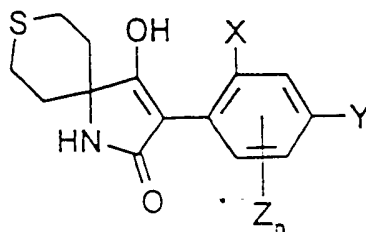
Analóg módon állítjuk elő a következő vegyületeket.

1a táblázat



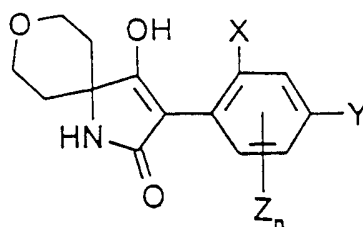
| példaszám | X               | Y               | Z <sub>n</sub> | Fp. °C |
|-----------|-----------------|-----------------|----------------|--------|
| I a-2     | Cl              | Cl              | H              | > 220  |
| I a-3     | Cl              | H               | 6-F            |        |
| I a-4     | Cl              | H               | 6-Cl           |        |
| I a-5     | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              |        |
| I a-6     | Cl              | CF <sub>3</sub> | 6-Cl           |        |

1b táblázat



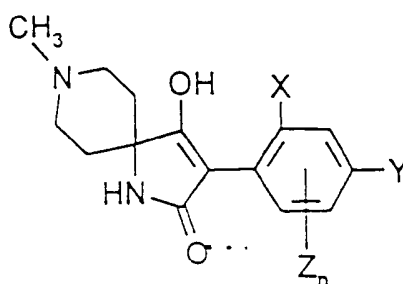
| példaszám | X               | Y               | Z <sub>n</sub>    | Fp. °C |
|-----------|-----------------|-----------------|-------------------|--------|
| I a-7     | Cl              | Cl              | H                 |        |
| I a-8     | Cl              | H               | 6-F               |        |
| I a-9     | Cl              | H               | 6-Cl              |        |
| I a-10    | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H                 |        |
| I a-11    | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | 6-CH <sub>3</sub> | >220   |
| I a-12    | Cl              | CF <sub>3</sub> | 6-Cl              |        |

1c táblázat



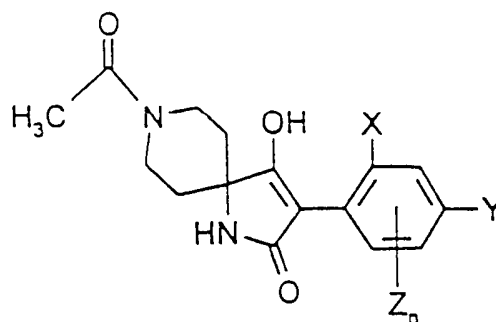
| példaszám | X               | Y               | Z <sub>n</sub>    | Fp. °C |
|-----------|-----------------|-----------------|-------------------|--------|
| I a-13    | Cl              | Cl              | H                 | >220   |
| I a-14    | Cl              | H               | 6-F               |        |
| I a-15    | Cl              | H               | 6-Cl              |        |
| I a-16    | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H                 | > 230  |
| I a-17    | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | 6-CH <sub>3</sub> | >220   |
| I a-18    | Cl              | CF <sub>3</sub> | 6-Cl              |        |

1d táblázat



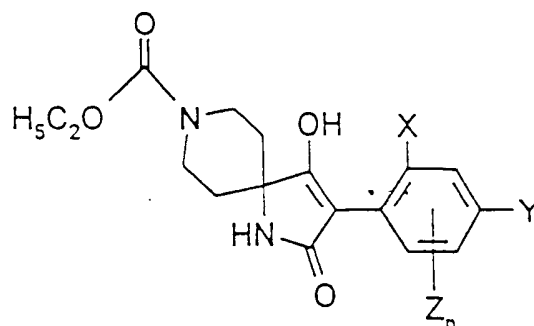
| példaszám | X               | Y               | Z <sub>n</sub>    | Fp. °C |
|-----------|-----------------|-----------------|-------------------|--------|
| I a-20    | Cl              | Cl              | H                 |        |
| I a-21    | Cl              | H               | 6-F               |        |
| I a-22    | Cl              | H               | 6-Cl              |        |
| I a-23    | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H                 |        |
| I a-24    | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | 6-CH <sub>3</sub> | >220   |
| I a-25    | Cl              | CF <sub>3</sub> | 6-Cl              |        |

1e táblázat



| példaszám | X               | Y               | Z <sub>n</sub>    | Fp. °C |
|-----------|-----------------|-----------------|-------------------|--------|
| I a-26    | Cl              | Cl              | H                 |        |
| I a-27    | Cl              | H               | 6-F               |        |
| I a-28    | Cl              | H               | 6-Cl              |        |
| I a-29    | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H                 |        |
| I a-30    | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | 6-CH <sub>3</sub> | >220   |
| I a-31    | Cl              | CF <sub>3</sub> | 6-Cl              |        |

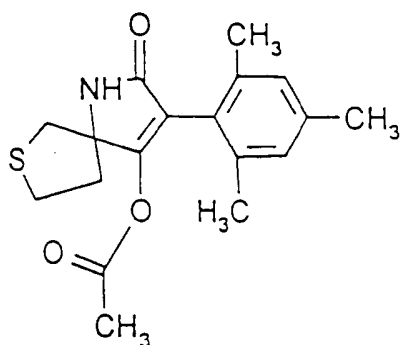
1f táblázat



| példaszám | X               | Y               | Z <sub>n</sub>    | Fp. °C |
|-----------|-----------------|-----------------|-------------------|--------|
| I a-32    | Cl              | Cl              | H                 |        |
| I a-33    | Cl              | H               | 6-F               |        |
| I a-34    | Cl              | H               | 6-Cl              |        |
| I a-35    | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H                 |        |
| I a-36    | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | 6-CH <sub>3</sub> |        |
| I a-37    | Cl              | CF <sub>3</sub> | 6-Cl              |        |

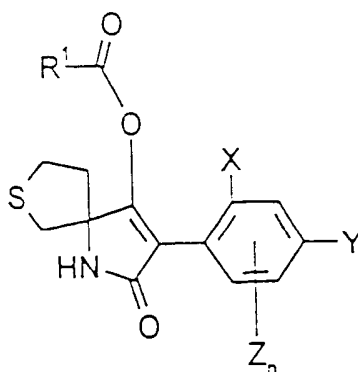
Ib - 1. példa:

5,8 g az Ia - 1. példa szerint előállított vegyületet 70 ml vízmentes metilén-kloridban 2,8 ml trietil-aminnal elegyítünk, és 0 - 10 °C-on 1,5 ml acetyl-klorid 5 ml vízmentes metilén-kloridban készített oldatát adjuk hozzá. A reakcióelegyet kétszer 200 ml 0,5 N nátrium-hidroxiddal mossuk, magnézium-szulfáton szárítjuk és az oldószert ledesztilláljuk. Így 1,7 g (26%) anyagot kapunk, mp.: 211°C.



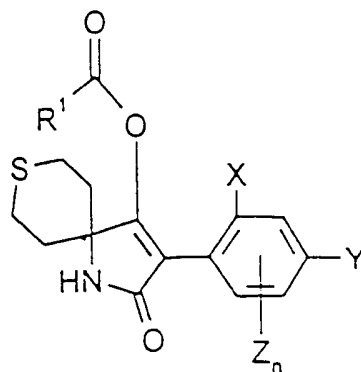
Ib-1

Analóg módon állítjuk elő az alábbi vegyületeket.

2a táblázat

| példaszám | X               | Y               | Z <sub>n</sub>    | R <sup>1</sup>                  | Fp. °C  |
|-----------|-----------------|-----------------|-------------------|---------------------------------|---------|
| I b-2     | Cl              | Cl              | H                 | CH <sub>3</sub>                 | 199-201 |
| I b-3     | Cl              | H               | 6-F               | CH <sub>3</sub>                 |         |
| I b-4     | Cl              | H               | 6-Cl              | CH <sub>3</sub>                 |         |
| I b-5     | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H                 | CH <sub>3</sub>                 |         |
| I b-6     | Cl              | CF <sub>3</sub> | 6-Cl              | CH <sub>3</sub>                 |         |
| I b-7     | Cl              | Cl              | H                 | i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub> | 133-135 |
| I b-8     | Cl              | H               | 6-F               | i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub> |         |
| I b-9     | Cl              | H               | 6-Cl              | i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub> |         |
| I b-10    | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H                 | i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub> |         |
| I b-11    | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | 6-CH <sub>3</sub> | i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub> | 175     |
| I b-12    | Cl              | CF <sub>3</sub> | 6-Cl              | i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub> |         |
| I b-13    | Cl              | Cl              | H                 | t-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub> |         |
| I b-14    | Cl              | H               | 6-F               | t-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub> |         |
| I b-15    | Cl              | H               | 6-Cl              | t-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub> |         |
| I b-16    | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H                 | t-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub> |         |
| I b-17    | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | 6-CH <sub>3</sub> | t-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub> | 185     |
| I b-18    | Cl              | CF <sub>3</sub> | 6-Cl              | t-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub> |         |
| I b-19    | Cl              | Cl              | H                 | Ph                              |         |
| I b-20    | Cl              | H               | 6-F               | Ph                              |         |
| I b-21    | Cl              | H               | 6-Cl              | Ph                              |         |
| I b-22    | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H                 | Ph                              |         |
| I b-23    | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | 6-CH <sub>3</sub> | Ph                              |         |
| I b-24    | Cl              | CF <sub>3</sub> | 6-Cl              | Ph                              |         |

2b táblázat

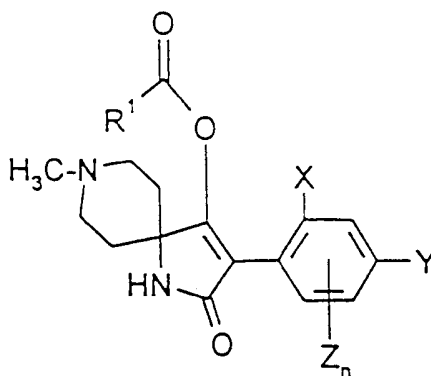


| példaszám | X               | Y               | Z <sub>n</sub>    | R <sup>1</sup>                  | Fp. °C  |
|-----------|-----------------|-----------------|-------------------|---------------------------------|---------|
| I b-25    | Cl              | Cl              | H                 | CH <sub>3</sub>                 |         |
| I b-27    | Cl              | H               | 6-F               | CH <sub>3</sub>                 |         |
| I b-28    | Cl              | H               | 6-Cl              | CH <sub>3</sub>                 |         |
| I b-29    | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H                 | CH <sub>3</sub>                 |         |
| I b-30    | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | 6-CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>                 | >220    |
| I b-31    | Cl              | CF <sub>3</sub> | 6-Cl              | CH <sub>3</sub>                 |         |
| I b-32    | Cl              | Cl              | H                 | i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub> |         |
| I b-33    | Cl              | H               | 6-F               | i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub> |         |
| I b-34    | Cl              | H               | 6-Cl              | i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub> |         |
| I b-35    | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H                 | i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub> |         |
| I b-36    | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | 6-CH <sub>3</sub> | i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub> | 208-209 |
| I b-37    | Cl              | CF <sub>3</sub> | 6-Cl              | i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub> |         |
| I b-38    | Cl              | Cl              | H                 | t-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub> |         |
| I b-39    | Cl              | H               | 6-F               | t-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub> |         |
| I b-40    | Cl              | H               | 6-Cl              | t-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub> |         |
| I b-41    | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H                 | t-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub> |         |
| I b-42    | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | 6-CH <sub>3</sub> | t-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub> | > 220   |
| I b-43    | Cl              | CF <sub>3</sub> | 6-Cl              | t-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub> |         |
| I b-44    | Cl              | Cl              | H                 | Phenyl                          |         |
| I b-45    | Cl              | H               | 6-F               | Phenyl                          |         |

2b táblázat (folytatás)

| példaszám | X               | Y               | Z <sub>n</sub>    | R <sup>1</sup> | Fp. °C |
|-----------|-----------------|-----------------|-------------------|----------------|--------|
| I b-46    | Cl              | H               | 6-Cl              | Phenyl         |        |
| I b-47    | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H                 | Phenyl         |        |
| I b-48    | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | 6-CH <sub>3</sub> | Phenyl         |        |
| I b-49    | Cl              | CF <sub>3</sub> | 6-Cl              | Phenyl         |        |

2c táblázat

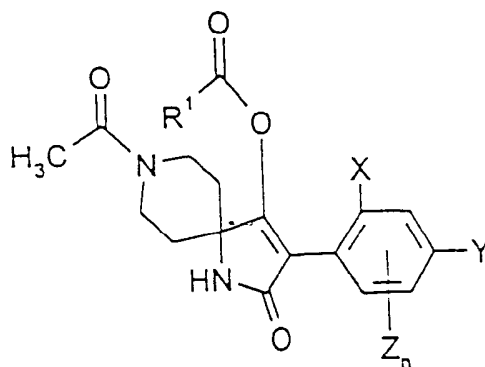


| példaszám | X               | Y               | Z <sub>n</sub>    | R <sup>1</sup>                  | Fp. °C |
|-----------|-----------------|-----------------|-------------------|---------------------------------|--------|
| I b-50    | Cl              | Cl              | H                 | CH <sub>3</sub>                 |        |
| I b-51    | Cl              | H               | 6-F               | CH <sub>3</sub>                 |        |
| I b-52    | Cl              | H               | 6-Cl              | CH <sub>3</sub>                 |        |
| I b-53    | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H                 | CH <sub>3</sub>                 |        |
| I b-54    | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | 6-CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>                 |        |
| I b-55    | Cl              | CF <sub>3</sub> | 6-Cl              | CH <sub>3</sub>                 |        |
| I b-56    | Cl              | Cl              | H                 | i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub> |        |
| I b-57    | Cl              | H               | 6-F               | i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub> |        |
| I b-58    | Cl              | H               | 6-Cl              | i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub> |        |
| I b-59    | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H                 | i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub> |        |
| I b-60    | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | 6-CH <sub>3</sub> | i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub> |        |
| I b-61    | Cl              | CF <sub>3</sub> | 6-Cl              | i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub> |        |

2c táblázat (folytatás)

| példaszám | X               | Y               | Z <sub>n</sub>    | R <sup>1</sup>                  | Fp. °C |
|-----------|-----------------|-----------------|-------------------|---------------------------------|--------|
| I b-62    | Cl              | Cl              | H                 | t-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub> |        |
| I b-63    | Cl              | H               | 6-F               | t-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub> |        |
| I b-64    | Cl              | H               | 6-Cl              | t-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub> |        |
| I b-65    | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H                 | t-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub> |        |
| I b-66    | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | 6-CH <sub>3</sub> | t-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub> |        |
| I b-67    | Cl              | CF <sub>3</sub> | 6-Cl              | t-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub> |        |
| I b-68    | Cl              | Cl              | H                 | Phenyl                          |        |
| I b-69    | Cl              | H               | 6-F               | Phenyl                          |        |
| I b-70    | Cl              | H               | 6-Cl              | Phenyl                          |        |
| I b-71    | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H                 | Phenyl                          |        |
| I b-72    | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | 6-CH <sub>3</sub> | Phenyl                          |        |
| I b-73    | Cl              | CF <sub>3</sub> | 6-Cl              | Phenyl                          |        |

2d táblázat

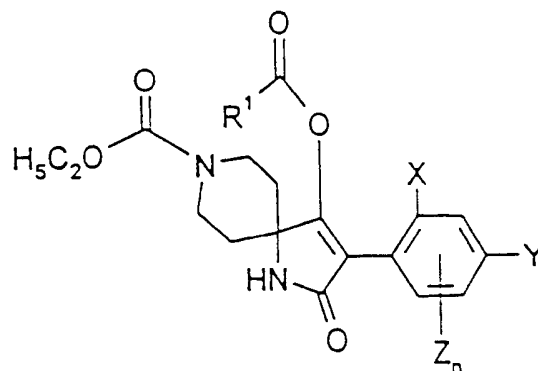


| példaszám | X               | Y               | Z <sub>n</sub> | R <sup>1</sup>  | Fp. °C |
|-----------|-----------------|-----------------|----------------|-----------------|--------|
| I b-74    | Cl              | Cl              | H              | CH <sub>3</sub> |        |
| I b-75    | Cl              | H               | 6-F            | CH <sub>3</sub> |        |
| I b-76    | Cl              | H               | 6-Cl           | CH <sub>3</sub> |        |
| I b-77    | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | CH <sub>3</sub> |        |

2d táblázat (folytatás)

| példaszám | X               | Y               | Z <sub>n</sub>    | R <sup>1</sup>                  | Fp. °C |
|-----------|-----------------|-----------------|-------------------|---------------------------------|--------|
| I b-78    | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | 6-CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>                 |        |
| I b-79    | Cl              | CF <sub>3</sub> | 6-Cl              | CH <sub>3</sub>                 |        |
| I b-80    | Cl              | Cl              | H                 | i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub> |        |
| I b-81    | Cl              | H               | 6-F               | i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub> |        |
| I b-82    | Cl              | H               | 6-Cl              | i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub> |        |
| I b-83    | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H                 | i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub> |        |
| I b-84    | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | 6CH <sub>3</sub>  | i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub> |        |
| I b-85    | Cl              | CF <sub>3</sub> | 6-Cl              | i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub> |        |
| I b-86    | Cl              | Cl              | H                 | t-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub> |        |
| I b-87    | Cl              | H               | 6-F               | t-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub> |        |
| I b-88    | Cl              | H               | 6-Cl              | t-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub> |        |
| I b-89    | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H                 | t-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub> |        |
| I b-90    | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | 6-CH <sub>3</sub> | t-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub> |        |
| I b-91    | Cl              | CF <sub>3</sub> | 6-Cl              | t-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub> |        |
| I b-92    | Cl              | Cl              | H                 | Phenyl                          |        |
| I b-93    | Cl              | H               | 6-F               | Phenyl                          |        |
| I b-94    | Cl              | H               | 6-Cl              | Phenyl                          |        |
| I b-95    | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H                 | Phenyl                          |        |
| I b-96    | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | 6-CH <sub>3</sub> | Phenyl                          |        |
| I b-97    | Cl              | CF <sub>3</sub> | 6-Cl              | Phenyl                          |        |

2e táblázat

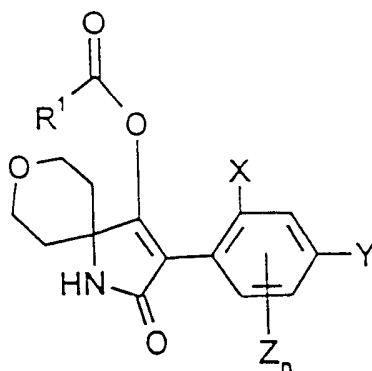


| példaszám | X               | Y               | Z <sub>n</sub>    | R <sup>1</sup>                  | Fp. °C |
|-----------|-----------------|-----------------|-------------------|---------------------------------|--------|
| I b-98    | Cl              | Cl              | H                 | CH <sub>3</sub>                 |        |
| I b-99    | Cl              | H               | 6-F               | CH <sub>3</sub>                 |        |
| I b-100   | Cl              | H               | 6-Cl              | CH <sub>3</sub>                 |        |
| I b-101   | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H                 | CH <sub>3</sub>                 |        |
| I b-102   | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | 6-CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>                 |        |
| I b-103   | Cl              | CF <sub>3</sub> | 6-Cl              | CH <sub>3</sub>                 |        |
| I b-104   | Cl              | Cl              | H                 | i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub> |        |
| I b-105   | Cl              | H               | 6-F               | i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub> |        |
| I b-106   | Cl              | H               | 6-Cl              | i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub> |        |
| I b-107   | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H                 | i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub> |        |
| I b-108   | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | 6-CH <sub>3</sub> | i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub> |        |
| I b-109   | Cl              | CF <sub>3</sub> | 6-Cl              | i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub> |        |
| I b-110   | Cl              | Cl              | H                 | t-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub> |        |
| I b-111   | Cl              | H               | 6-F               | t-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub> |        |
| I b-112   | Cl              | H               | 6-Cl              | t-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub> |        |
| I b-113   | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H                 | t-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub> |        |
| I b-114   | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | 6-CH <sub>3</sub> | t-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub> |        |
| I b-115   | Cl              | CF <sub>3</sub> | 6-Cl              | t-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub> |        |
| I b-116   | Cl              | Cl              | H                 | Phenyl                          |        |
| I b-117   | Cl              | H               | 6-F               | Phenyl                          |        |

2e táblázat (folytatás)

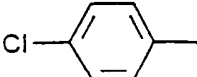
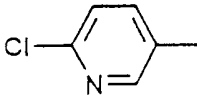
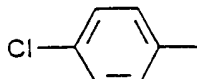
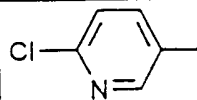
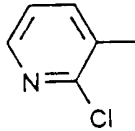
| példaszám | X               | Y               | Z <sub>n</sub>    | R <sup>1</sup> | Fp. °C |
|-----------|-----------------|-----------------|-------------------|----------------|--------|
| I b-118   | Cl              | H               | 6-Cl              | Phenyl         |        |
| I b-119   | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H                 | Phenyl         |        |
| I b-120   | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | 6-CH <sub>3</sub> | Phenyl         |        |
| I b-121   | Cl              | CF <sub>3</sub> | 6-Cl              | Phenyl         |        |

2f táblázat

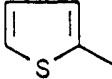
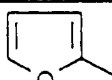


| példaszám | X               | Y               | Z <sub>n</sub>    | R <sup>1</sup>                  | Fp. °C  |
|-----------|-----------------|-----------------|-------------------|---------------------------------|---------|
| I b-122   | Cl              | Cl              | H                 | CH <sub>3</sub>                 | > 220   |
| I b-123   | Cl              | H               | 6-F               | CH <sub>3</sub>                 |         |
| I b-124   | Cl              | H               | 6-Cl              | CH <sub>3</sub>                 |         |
| I b-125   | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H                 | CH <sub>3</sub>                 | 186     |
| I b-126   | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | 6-CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>                 | > 220   |
| I b-127   | Cl              | CF <sub>3</sub> | 6-Cl              | CH <sub>3</sub>                 |         |
| I b-128   | Cl              | Cl              | H                 | i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub> | 205-206 |
| I b-129   | Cl              | H               | 6-F               | i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub> |         |
| I b-130   | Cl              | H               | 6-Cl              | i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub> |         |
| I b-131   | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H                 | i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub> | 169     |
| I b-132   | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | 6-CH <sub>3</sub> | i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub> | 212-215 |
| I b-133   | Cl              | CF <sub>3</sub> | 6-Cl              | i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub> |         |

2f táblázat (folytatás)

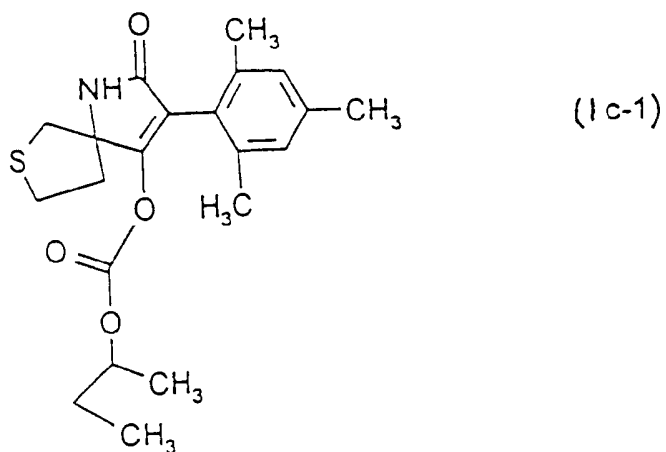
| példaszám | X               | Y               | Z <sub>n</sub>    | R <sup>1</sup>                                                                       | Fp. °C  |
|-----------|-----------------|-----------------|-------------------|--------------------------------------------------------------------------------------|---------|
| I b-134   | Cl              | Cl              | H                 | t-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>                                                      | 209-212 |
| I b-135   | Cl              | H               | 6-F               | t-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>                                                      |         |
| I b-136   | Cl              | H               | 6-Cl              | t-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>                                                      |         |
| I b-137   | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H                 | t-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>                                                      | 162     |
| I b-138   | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | 6-CH <sub>3</sub> | t-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>                                                      |         |
| I b-139   | Cl              | CF <sub>3</sub> | 6-Cl              | t-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>                                                      |         |
| I b-140   | Cl              | Cl              | H                 | Ph                                                                                   |         |
| I b-141   | Cl              | H               | 6-F               | Ph                                                                                   |         |
| I b-142   | Cl              | H               | 6-Cl              | Ph                                                                                   |         |
| I b-143   | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H                 | Ph                                                                                   |         |
| I b-144   | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | 6-CH <sub>3</sub> | Ph                                                                                   |         |
| I b-145   | Cl              | CF <sub>3</sub> | 6-Cl              | Ph                                                                                   |         |
| I b-146   | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H                 | H <sub>5</sub> C <sub>2</sub> -O-CH <sub>2</sub> -                                   | 171     |
| I b-147   | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H                 |  | > 220   |
| I b-148   | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H                 |  | > 220   |
| I b-149   | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | 6-CH <sub>3</sub> | (CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub> C-CH <sub>2</sub> -                                  | 199     |
| I b-150   | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | 6-CH <sub>3</sub> |  | > 220   |
| I b-151   | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | 6-CH <sub>3</sub> |  | > 220   |
| I b-152   | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | 6-CH <sub>3</sub> |  | > 220   |

2f táblázat (folytatás)

| példaszám | X               | Y               | Z <sub>n</sub>    | R <sup>1</sup>                                                                    | Fp. °C |
|-----------|-----------------|-----------------|-------------------|-----------------------------------------------------------------------------------|--------|
| I b-153   | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | 6-CH <sub>3</sub> |  | > 220  |
| I b-154   | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | 6-CH <sub>3</sub> |  | 201    |
| I b-155   | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | 6-CH <sub>3</sub> | H <sub>5</sub> C <sub>2</sub> -O-CH <sub>2</sub> -                                | 182    |
| I b-156   | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | 6-CH <sub>3</sub> | i-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>                                                   | > 220  |
| I b-157   | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | 6-CH <sub>3</sub> |  | 214    |

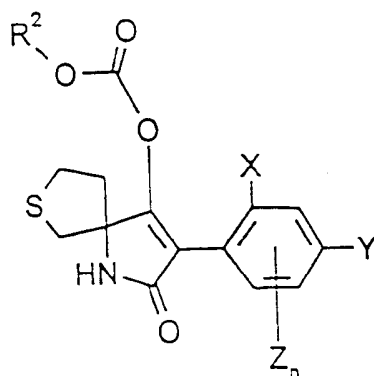
Ic - 1. példa:

5,8 g az Ia - 1. példa szerinti előállított vegyületet 70 ml vízmentes metilén-kloridban 2,8 ml trietil-aminnal elegyítünk, és 0 - 10 °C-on 2,7 g klór-hangyasav-sek-butyl-észtert adunk hozzá 5 ml vízmentes metilén-kloridban. A reakcióelegyet kétszer 200 ml 0,5 N-nátron-lúggal mossuk, magnézium-szulfáton szárítjuk és az oldószert ledesztilláljuk. Így 1,7 g (22%) anyagot kapunk, op.: 157 °C.



Analóg módon állítjuk elő a következő vegyületeket:

3a táblázat

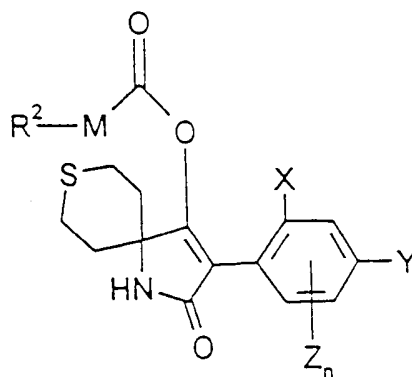


| példaszám | X               | Y               | Z <sub>n</sub>    | R <sup>2</sup>                | Fp. °C  |
|-----------|-----------------|-----------------|-------------------|-------------------------------|---------|
| I c-2     | Cl              | Cl              | H                 | CH <sub>3</sub>               |         |
| I c-3     | Cl              | H               | 6-F               | CH <sub>3</sub>               |         |
| I c-4     | Cl              | H               | 6-Cl              | CH <sub>3</sub>               |         |
| I c-5     | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H                 | CH <sub>3</sub>               |         |
| I c-6     | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | 6-CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>               |         |
| I c-7     | Cl              | CF <sub>3</sub> | 6-Cl              | CH <sub>3</sub>               |         |
| I c-8     | Cl              | Cl              | H                 | C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> | 159-162 |

3a táblázat (folytatás)

| példaszám | X               | Y               | Z <sub>n</sub>    | R <sup>2</sup>                  | Fp. °C |
|-----------|-----------------|-----------------|-------------------|---------------------------------|--------|
| I c-9     | Cl              | H               | 6-F               | C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>   |        |
| I c-10    | Cl              | H               | 6-Cl              | C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>   |        |
| I c-11    | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H                 | C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>   |        |
| I c-12    | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | 6-CH <sub>3</sub> | C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>   | 134    |
| I c-13    | Cl              | Cl              | H                 | i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub> |        |
| I c-14    | Cl              | H               | 6-F               | i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub> |        |
| I c-15    | Cl              | H               | 6-Cl              | i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub> |        |
| I c-16    | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H                 | i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub> |        |
| I c-17    | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | 6-CH <sub>3</sub> | i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub> |        |
| I c-18    | Cl              | CF <sub>3</sub> | 6-Cl              | i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub> |        |
| I c-19    | Cl              | Cl              | H                 | s-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub> |        |
| I c-20    | Cl              | H               | 6-F               | s-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub> |        |
| I c-21    | Cl              | H               | 6-Cl              | s-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub> |        |
| I c-22    | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H                 | s-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub> |        |
| I c-23    | Cl              | CF <sub>3</sub> | 6-Cl              | s-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub> |        |
| I c-24    | Cl              | Cl              | H                 | Phenyl                          |        |
| I c-25    | Cl              | H               | 6-F               | Phenyl                          |        |
| I c-26    | Cl              | H               | 6-Cl              | Phenyl                          |        |
| I c-27    | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H                 | Phenyl                          |        |
| I c-28    | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | 6-CH <sub>3</sub> | Phenyl                          |        |
| I c-29    | Cl              | CF <sub>3</sub> | 6-Cl              | Phenyl                          |        |
| I c-30    | Cl              | Cl              | H                 | Benzyl                          |        |
| I c-31    | Cl              | H               | 6-F               | Benzyl                          |        |
| I c-32    | Cl              | H               | 6-Cl              | Benzyl                          |        |
| I c-33    | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H                 | Benzyl                          |        |
| I c-34    | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | 6-CH <sub>3</sub> | Benzyl                          |        |
| I c-35    | Cl              | CF <sub>3</sub> | 6-Cl              | Benzyl                          |        |

3b táblázat

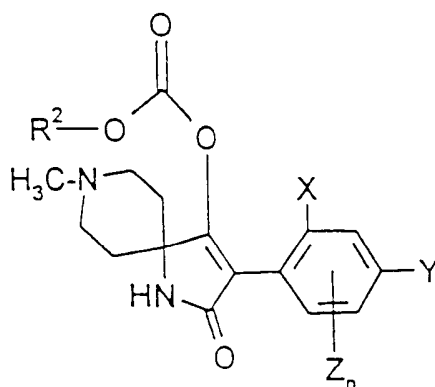


| példaszám | X               | Y               | Z <sub>n</sub>    | R <sup>2</sup>                  | M | Fp. °C  |
|-----------|-----------------|-----------------|-------------------|---------------------------------|---|---------|
| I c-36    | Cl              | Cl              | H                 | i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub> | S |         |
| I c-37    | Cl              | H               | 6-F               | i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub> | S |         |
| I c-38    | Cl              | H               | 6-Cl              | i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub> | S |         |
| I c-39    | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H                 | i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub> | S |         |
| I c-40    | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | 6-CH <sub>3</sub> | i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub> | S | 208-209 |
| I c-41    | Cl              | CF <sub>3</sub> | 6-Cl              | CH <sub>3</sub>                 | O |         |
| I c-42    | Cl              | Cl              | H                 | C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>   | O |         |
| I c-43    | Cl              | H               | 6-F               | C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>   | O |         |
| I c-44    | Cl              | H               | 6-Cl              | C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>   | O |         |
| I c-45    | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H                 | C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>   | O |         |
| I c-46    | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | 6-CH <sub>3</sub> | C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>   | O | 201-202 |
| I c-47    | Cl              | Cl              | H                 | i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub> | O |         |
| I c-48    | Cl              | H               | 6-F               | i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub> | O |         |
| I c-49    | Cl              | H               | 6-Cl              | i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub> | O |         |
| I c-50    | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H                 | i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub> | O |         |
| I c-51    | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | 6-CH <sub>3</sub> | i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub> | O |         |
| I c-52    | Cl              | CF <sub>3</sub> | 6-Cl              | i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub> | O |         |
| I c-53    | Cl              | Cl              | H                 | s-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub> | O |         |
| I c-54    | Cl              | H               | 6-F               | s-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub> | O |         |

3b táblázat (folytatás)

| példaszám | X               | Y               | Z <sub>n</sub>    | R <sup>2</sup>                  | M | Fp. °C  |
|-----------|-----------------|-----------------|-------------------|---------------------------------|---|---------|
| I c-55    | Cl              | H               | 6-Cl              | s-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub> | O |         |
| I c-56    | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H                 | s-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub> | O |         |
| I c-57    | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | 6-CH <sub>3</sub> | s-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub> | O | 185-187 |
| I c-58    | Cl              | CF <sub>3</sub> | 6-Cl              | s-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub> | O |         |
| I c-60    | Cl              | Cl              | H                 | Phenyl                          | O |         |
| I c-61    | Cl              | H               | 6-F               | Phenyl                          | O |         |
| I c-62    | Cl              | H               | 6-Cl              | Phenyl                          | O |         |
| I c-63    | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H                 | Phenyl                          | O |         |
| I c-64    | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | 6-CH <sub>3</sub> | Phenyl                          | O |         |
| I c-65    | Cl              | CF <sub>3</sub> | 6-Cl              | Phenyl                          | O |         |
| I c-66    | Cl              | Cl              | H                 | Benzyl                          | O |         |
| I c-67    | Cl              | H               | 6-F               | Benzyl                          | O |         |
| I c-68    | Cl              | H               | 6-Cl              | Benzyl                          | O |         |
| I c-69    | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H                 | Benzyl                          | O |         |
| I c-70    | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | 6-CH <sub>3</sub> | Benzyl                          | O |         |
| I c-71    | Cl              | CF <sub>3</sub> | 6-Cl              | Benzyl                          | O |         |

3c táblázat



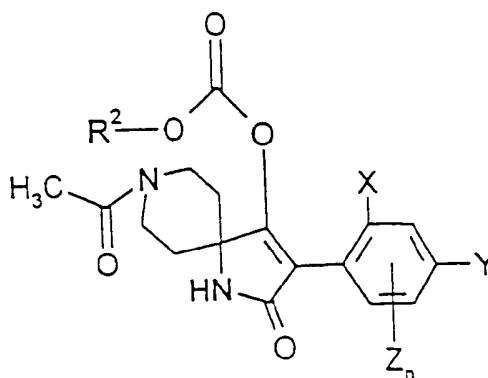
3c táblázat (folytatás)

| példaszám | X               | Y               | Z <sub>n</sub>    | R <sup>2</sup>                  | Fp. °C |
|-----------|-----------------|-----------------|-------------------|---------------------------------|--------|
| I c-72    | Cl              | Cl              | H                 | CH <sub>3</sub>                 |        |
| I c-73    | Cl              | H               | 6-F               | CH <sub>3</sub>                 |        |
| I c-74    | Cl              | H               | 6-Cl              | CH <sub>3</sub>                 |        |
| I c-75    | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H                 | CH <sub>3</sub>                 |        |
| Ic -76    | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | 6-CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>                 |        |
| I c-77    | Cl              | CF <sub>3</sub> | 6-Cl              | CH <sub>3</sub>                 |        |
| I c-78    | Cl              | Cl              | H                 | C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>   |        |
| I c-79    | Cl              | H               | 6-F               | C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>   |        |
| I c-80    | Cl              | H               | 6-Cl              | C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>   |        |
| I c-81    | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H                 | C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>   |        |
| I c-82    | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | 6-CH <sub>3</sub> | C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>   |        |
| I c-83    | Cl              | Cl              | H                 | i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub> |        |
| I c-84    | Cl              | H               | 6-F               | i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub> |        |
| I c-85    | Cl              | H               | 6-Cl              | i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub> |        |
| I c-86    | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H                 | i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub> |        |
| I c-87    | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | 6-CH <sub>3</sub> | i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub> |        |
| I c-88    | Cl              | CF <sub>3</sub> | 6-Cl              | i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub> |        |
| I c-89    | Cl              | Cl              | H                 | s-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub> |        |
| I c-90    | Cl              | H               | 6-F               | s-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub> |        |
| I c-91    | Cl              | H               | 6-Cl              | s-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub> |        |
| I c-92    | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H                 | s-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub> |        |
| I c-93    | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | 6-CH <sub>3</sub> | s-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub> |        |
| I c-94    | Cl              | CF <sub>3</sub> | 6-Cl              | s-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub> |        |
| I c-95    | Cl              | Cl              | H                 | Phenyl                          |        |
| I c-96    | Cl              | H               | 6-F               | Phenyl                          |        |
| I c-97    | Cl              | H               | 6-Cl              | Phenyl                          |        |
| I c-98    | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H                 | Phenyl                          |        |
| I c-99    | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | 6-CH <sub>3</sub> | Phenyl                          |        |

3c táblázat (folytatás)

| példaszám | X               | Y               | Z <sub>n</sub>    | R <sup>2</sup> | Fp. °C |
|-----------|-----------------|-----------------|-------------------|----------------|--------|
| I c-100   | Cl              | CF <sub>3</sub> | 6-Cl              | Phenyl         |        |
| I c-101   | Cl              | Cl              | H                 | Benzyl         |        |
| I c-102   | Cl              | H               | 6-F               | Benzyl         |        |
| I c-103   | Cl              | H               | 6-Cl              | Benzyl         |        |
| I c-104   | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H                 | Benzyl         |        |
| I c-105   | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | 6-CH <sub>3</sub> | Benzyl         |        |
| I c-106   | Cl              | CF <sub>3</sub> | 6-Cl              | Benzyl         |        |

3d táblázat

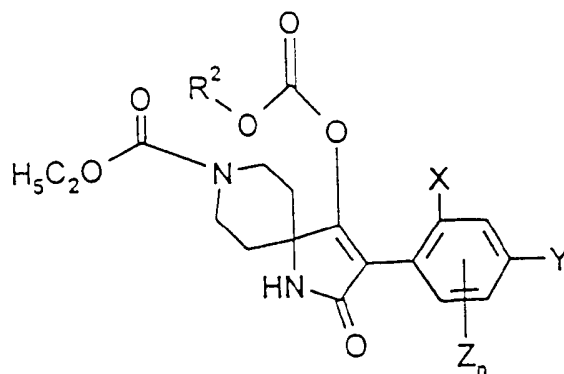


| példaszám | X               | Y               | Z <sub>n</sub>    | R <sup>2</sup>                | Fp. °C |
|-----------|-----------------|-----------------|-------------------|-------------------------------|--------|
| I c-107   | Cl              | Cl              | H                 | CH <sub>3</sub>               |        |
| I c-108   | Cl              | H               | 6-F               | CH <sub>3</sub>               |        |
| I c-109   | Cl              | H               | 6-Cl              | CH <sub>3</sub>               |        |
| I c-110   | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H                 | CH <sub>3</sub>               |        |
| I c-111   | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | 6-CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>               |        |
| I c-112   | Cl              | CF <sub>3</sub> | 6-Cl              | CH <sub>3</sub>               |        |
| I c-113   | Cl              | Cl              | H                 | C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> |        |

3d táblázat (folytatás)

| példaszám | X               | Y               | Z <sub>n</sub>    | R <sup>2</sup>                  | Fp. °C |
|-----------|-----------------|-----------------|-------------------|---------------------------------|--------|
| I c-114   | Cl              | H               | 6-F               | C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>   |        |
| I c-115   | Cl              | H               | 6-Cl              | C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>   |        |
| I c-116   | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H                 | C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>   |        |
| I c-117   | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | 6-CH <sub>3</sub> | C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>   | 216    |
| I c-118   | Cl              | Cl              | H                 | i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub> |        |
| I c-119   | Cl              | H               | 6-F               | i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub> |        |
| I c-120   | Cl              | H               | 6-Cl              | i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub> |        |
| I c-121   | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H                 | i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub> |        |
| I c-122   | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | 6-CH <sub>3</sub> | i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub> |        |
| I c-123   | Cl              | CF <sub>3</sub> | 6-Cl              | i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub> |        |
| I c-124   | Cl              | Cl              | H                 | s-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub> |        |
| I c-125   | Cl              | H               | 6-F               | s-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub> |        |
| I c-126   | Cl              | H               | 6-Cl              | s-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub> |        |
| I c-127   | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H                 | s-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub> |        |
| I c-128   | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | 6-CH <sub>3</sub> | s-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub> |        |
| I c-129   | Cl              | CF <sub>3</sub> | 6-Cl              | s-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub> |        |
| I c-130   | Cl              | Cl              | H                 | Phenyl                          |        |
| I c-131   | Cl              | H               | 6-F               | Phenyl                          |        |
| I c-132   | Cl              | H               | 6-Cl              | Phenyl                          |        |
| I c-133   | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H                 | Phenyl                          |        |
| I c-134   | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | 6-CH <sub>3</sub> | Phenyl                          |        |
| I c-135   | Cl              | CF <sub>3</sub> | 6-Cl              | Phenyl                          |        |
| I c-136   | Cl              | Cl              | H                 | Benzyl                          |        |
| I c-137   | Cl              | H               | 6-F               | Benzyl                          |        |
| I c-138   | Cl              | H               | 6-Cl              | Benzyl                          |        |
| I c-139   | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H                 | Benzyl                          |        |
| I c-140   | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | 6-CH <sub>3</sub> | Benzyl                          |        |
| I c-141   | Cl              | CF <sub>3</sub> | 6-Cl              | Benzyl                          |        |

3e táblázat

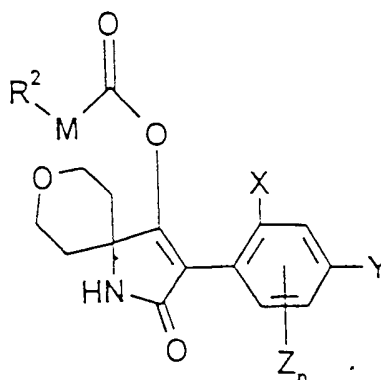


| példaszám | X               | Y               | Z <sub>n</sub>    | R <sup>2</sup>                  | Fp. °C |
|-----------|-----------------|-----------------|-------------------|---------------------------------|--------|
| I c-142   | Cl              | Cl              | H                 | CH <sub>3</sub>                 |        |
| I c-143   | Cl              | H               | 6-F               | CH <sub>3</sub>                 |        |
| I c-144   | Cl              | H               | 6-Cl              | CH <sub>3</sub>                 |        |
| I c-145   | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H                 | CH <sub>3</sub>                 |        |
| I c-146   | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | 6-CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>                 |        |
| I c-147   | Cl              | CF <sub>3</sub> | 6-Cl              | CH <sub>3</sub>                 |        |
| I c-148   | Cl              | Cl              | H                 | C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>   |        |
| I c-149   | Cl              | H               | 6-F               | C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>   |        |
| I c-150   | Cl              | H               | 6-Cl              | C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>   |        |
| I c-151   | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H                 | C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>   |        |
| I c-152   | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | 6-CH <sub>3</sub> | C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>   |        |
| I c-153   | Cl              | Cl              | H                 | i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub> |        |
| I c-154   | Cl              | H               | 6-F               | i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub> |        |
| I c-155   | Cl              | H               | 6-Cl              | i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub> |        |
| I c-156   | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H                 | i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub> |        |
| I c-157   | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | 6-CH <sub>3</sub> | i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub> |        |
| I c-158   | Cl              | CF <sub>3</sub> | 6-Cl              | i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub> |        |
| I c-159   | Cl              | Cl              | H                 | s-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub> |        |
| I c-160   | Cl              | H               | 6-F               | s-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub> |        |

3e táblázat (folytatás)

| példaszám | X               | Y               | Z <sub>n</sub>    | R <sup>2</sup>                  | Fp. °C |
|-----------|-----------------|-----------------|-------------------|---------------------------------|--------|
| I c-161   | Cl              | H               | 6-Cl              | s-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub> |        |
| I c-162   | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H                 | s-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub> |        |
| I c-163   | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | 6-CH <sub>3</sub> | s-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub> |        |
| I c-164   | Cl              | CF <sub>3</sub> | 6-Cl              | s-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub> |        |
| I c-165   | Cl              | Cl              | H                 | Phenyl                          |        |
| I c-166   | Cl              | H               | 6-F               | Phenyl                          |        |
| I c-167   | Cl              | H               | 6-Cl              | Phenyl                          |        |
| I c-168   | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H                 | Phenyl                          |        |
| I c-169   | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | 6-CH <sub>3</sub> | Phenyl                          |        |
| I c-170   | Cl              | CF <sub>3</sub> | 6-Cl              | Phenyl                          |        |
| I c-171   | Cl              | Cl              | H                 | Benzyl                          |        |
| I c-172   | Cl              | H               | 6-F               | Benzyl                          |        |
| I c-173   | Cl              | H               | 6-Cl              | Benzyl                          |        |
| I c-174   | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H                 | Benzyl                          |        |
| I c-175   | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | 6-CH <sub>3</sub> | Benzyl                          |        |
| I c-176   | Cl              | CF <sub>3</sub> | 6-Cl              | Benzyl                          |        |

3f táblázat



3f táblázat (folytatás)

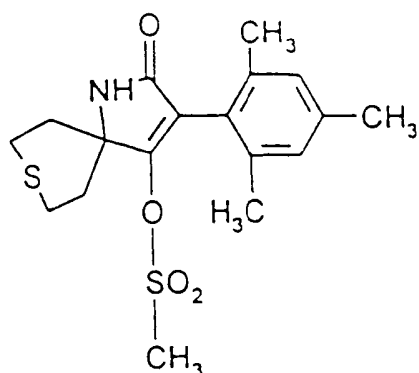
| példaszám | X               | Y               | Z <sub>n</sub>    | R <sup>2</sup>                  | M | Fp. °C  |
|-----------|-----------------|-----------------|-------------------|---------------------------------|---|---------|
| I c-177   | Cl              | Cl              | H                 | CH <sub>3</sub>                 | O |         |
| I c-178   | Cl              | H               | 6-F               | CH <sub>3</sub>                 | O |         |
| I c-179   | Cl              | H               | 6-Cl              | CH <sub>3</sub>                 | O |         |
| I c-180   | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H                 | CH <sub>3</sub>                 | O |         |
| I c-181   | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | 6-CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>                 | O | 191     |
| I c-182   | Cl              | CF <sub>3</sub> | 6-Cl              | CH <sub>3</sub>                 | O |         |
| I c-183   | Cl              | Cl              | H                 | C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>   | O | 194-196 |
| I c-184   | Cl              | H               | 6-F               | C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>   | O |         |
| I c-185   | Cl              | H               | 6-Cl              | C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>   | O |         |
| I c-186   | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H                 | C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>   | O | 188     |
| I c-187   | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | 6-CH <sub>3</sub> | C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>   | O | 193-195 |
| I c-188   | Cl              | Cl              | H                 | i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub> | O |         |
| I c-189   | Cl              | H               | 6-F               | i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub> | O |         |
| I c-190   | Cl              | H               | 6-Cl              | i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub> | O |         |
| I c-191   | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H                 | i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub> | O | 177     |
| I c-192   | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | 6-CH <sub>3</sub> | i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub> | O | 197     |
| I c-193   | Cl              | CF <sub>3</sub> | 6-Cl              | i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub> | O |         |
| I c-194   | Cl              | Cl              | H                 | s-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub> | O | 203-205 |
| I c-195   | Cl              | H               | 6-F               | s-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub> | O |         |
| I c-196   | Cl              | H               | 6-Cl              | s-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub> | O |         |
| I c-197   | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H                 | s-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub> | O | 151     |
| I c-198   | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | 6-CH <sub>3</sub> | s-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub> | O | 215-218 |
| I c-199   | Cl              | CF <sub>3</sub> | 6-Cl              | s-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub> | O |         |
| I c-200   | Cl              | Cl              | H                 | Phenyl                          | O |         |
| I c-201   | Cl              | H               | 6-F               | Phenyl                          | O |         |
| I c-202   | Cl              | H               | 6-Cl              | Phenyl                          | O |         |
| I c-203   | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H                 | Phenyl                          | O |         |
| I c-204   | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | 6-CH <sub>3</sub> | Phenyl                          | O | > 220   |

3f táblázat (folytatás)

| példaszám | X               | Y               | Z <sub>n</sub>    | R <sup>2</sup>                                                                      | M | Fp. °C  |
|-----------|-----------------|-----------------|-------------------|-------------------------------------------------------------------------------------|---|---------|
| I c-205   | Cl              | CF <sub>3</sub> | 6-Cl              | Phenyl                                                                              | O |         |
| I c-206   | Cl              | Cl              | H                 | Benzyl                                                                              | O |         |
| I c-207   | Cl              | H               | 6-F               | Benzyl                                                                              | O |         |
| I c-208   | Cl              | H               | 6-Cl              | Benzyl                                                                              | O |         |
| I c-209   | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H                 | Benzyl                                                                              | O | > 220   |
| I c-210   | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | 6-CH <sub>3</sub> | Benzyl                                                                              | O | 215     |
| I c-211   | Cl              | CF <sub>3</sub> | 6-Cl              | Benzyl                                                                              | O |         |
| I c-212   | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H                 | $\text{H}_3\text{C}_4-\text{CH}-\text{CH}_2-$<br> <br>C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> | O | 218     |
| I c-213   | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H                 | i-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>                                                     | O | 178     |
| I c-214   | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | 6-CH <sub>3</sub> | (CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> CH-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -                | S | 185-190 |
| I c-215   | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | 6-CH <sub>3</sub> | i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>                                                     | S | 210-215 |
| I c-216   | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | 6-CH <sub>3</sub> | t-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>                                                     | S | 220-225 |
| I c-217   | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | 6-CH <sub>3</sub> | i-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>                                                     | O | 188     |
| I c-218   | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | 6-CH <sub>3</sub> | $\text{H}_3\text{C}_4-\text{CH}-\text{CH}_2-$<br> <br>C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> | O | 198     |

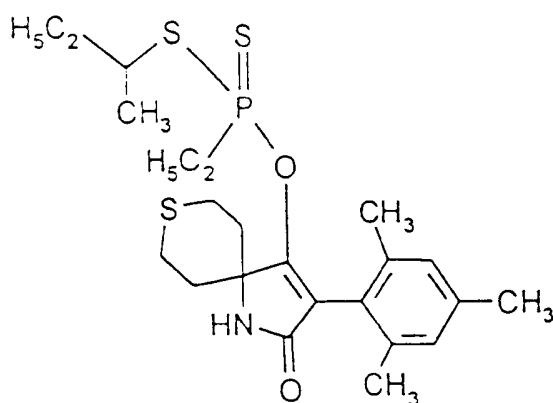
I d - 1. példa:

5,8 g az Ia - 11. példa szerint előállított vegyületet 70 ml vízmentes metilén-kloridban 2,8 ml trietil-ammal elegyítünk, és 0 - 10 °C-on 1,7 g metánszulfonsav-kloridot adunk hozzá 5 ml vízmentes metilén-kloridban. A reakcióelegyet kétszer 200 ml 0,5 N nátronlúggal mossuk, magnézium-szulfáton szárítjuk és az oldószert ledesztilláljuk. Így 3,2 g (56%) anyagot kapunk, cp.: 220 °C.



Id - 1. példa

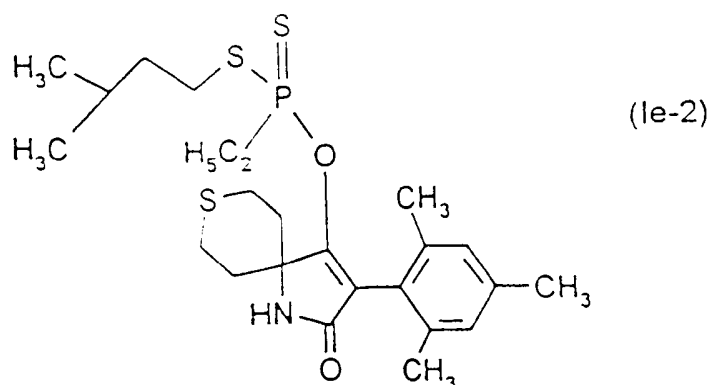
Ie - 1. példa:



(Ie-1)

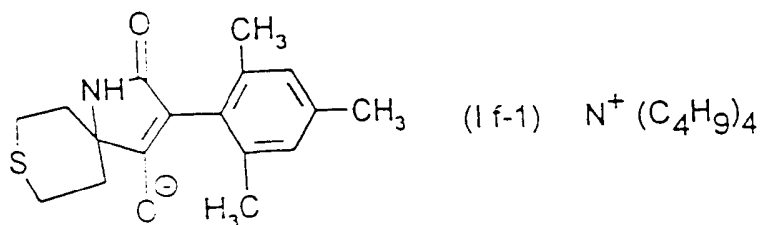
3 g az Ia - 11. példa szerinti előállított vegyület 20 ml vízmentes tetrahidrofuránban készített elegyéhez 1,5 ml trietil-amint, majd 2,1 g etántio-foszfonsav-klorid-sek-butiltioésztert adunk. A reakcióelegyet 1 napig kevertetjük 50 °C-on, az oldószert leszívjuk és a maradékot Kiesel-gélen, hexán/aceton 9:1 arányú eluenssel kromatografáljuk. Az oldószert eltávolítása után 1,1 g (az elméleti 23%-a) fenti képletű vegyületet kapunk, op.: 216 °C.

Analóg módon kapjuk az Ie-2. példa vegyületét (op.: 208°C):



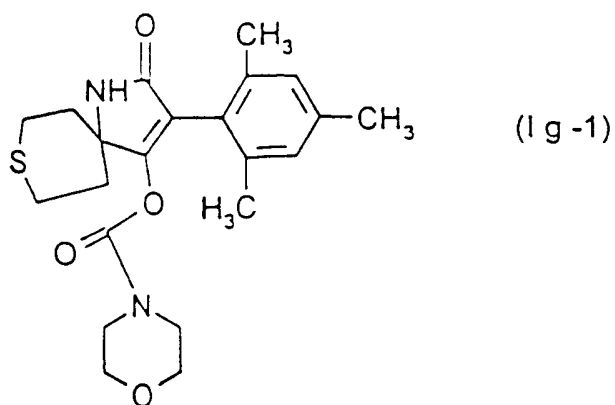
If - 1. példa:

5,8 g az Ia - 11. példa szerint előállított vegyületet 70 ml vizmentes metilén-kloridban 6,24 ml tetrabutil-ammónium-hidroxiddal (40%-os vizes oldat formájában) elegyítünk, és 0-10 °C-on 15 percig kevertetjük. A reakcióelegyet bepároljuk, és a maradékot diisopropil-éter hozzáadásával kritályosítjuk. A csapadékot szűrjük, így 5,4 g (99%) anyagot kapunk, op.: 110 °C.



Ig - 1. példa:

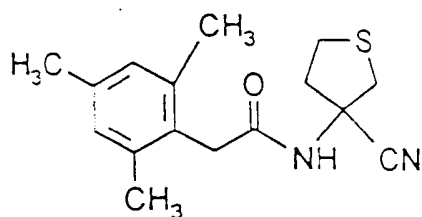
5,8 g az Ia - 11. példa szerint előállított vegyületet 70 ml vizmentes metilénkloridban 2,8 ml trietil-aminnal elegyítünk, és 0 - 10 °C-on 1,76 ml morfolin-karbamidsav-kloridot adunk hozzá 5 ml vizmentes metilén-kloridban. A reakcióelegyet kétszer 200 ml 0,5 N nátronlúggal mossuk, magnézium-szulfáton szárítjuk és az oldószert ledesztilláljuk. Így 1,2 g (19%) anyagot kapunk, op.: 198°C.



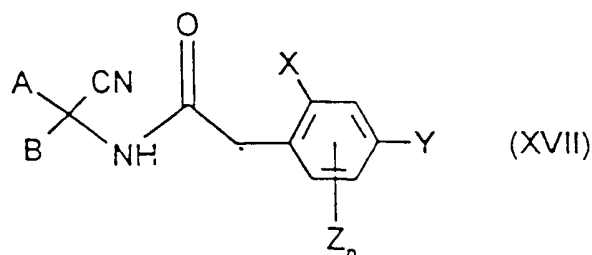
A (XVII) képletű köztitermékek előállításai példái:

XVII - 1. példa:

51,2 g 3-amino-3-ciano-tiolán 600 ml vízmentes tetrahidrofuranban készített elegyéhez 56 ml trietil-amint adunk és 0°C-on 78,6 g meztitilén-ecetsav-klorid 80 ml vízmentes tetrahidrofuranos oldatát csepegtetjük hozzá. A reakcióelegyet 1,2 l jegesvizbe öntjük, 200 ml 1N sósavval megsavanyítjuk, a keletkező csapadékot kiszűrjük és szárítjuk. Így 89,5 g (78%) alábbi képletű vegyületet kapunk, op.: 174-175 °C.



Analóg eljárással állítjuk elő a következő (XVII) képletű vegyületeket:



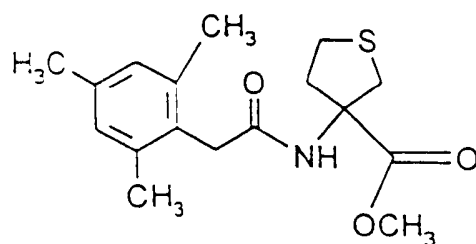
| példaszám | X               | X               | Z <sub>n</sub>    | A                                                                                                                                | B | Fp.     |
|-----------|-----------------|-----------------|-------------------|----------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|---|---------|
| XVII-2    | Cl              | Cl              | H                 | -(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -S-CH <sub>2</sub> -                                                                            |   | 131-133 |
| XVII-3    | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | 6-CH <sub>3</sub> | -(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -S-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -                                                            |   | >220    |
| XVII-4    | Cl              | Cl              | H                 | -(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -O-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -                                                            |   | 198-199 |
| XVII-5    | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | 6-CH <sub>3</sub> | -(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -O-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -                                                            |   | 182-183 |
| XVII-6    | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | 6-CH <sub>3</sub> | $\begin{array}{c} \text{---}(\text{CH}_2)_2\text{---N---}(\text{CH}_2)_2\text{---} \\   \\ \text{CH}_3 \end{array}$              |   | 176     |
| XVII-7    | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | 6-CH <sub>3</sub> | $\begin{array}{c} \text{---}(\text{CH}_2)_2\text{---N---}(\text{CH}_2)_2\text{---} \\   \\ \text{CO-CH}_3 \end{array}$           |   | 206     |
| XVII-8    | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | 6-CH <sub>3</sub> | $\begin{array}{c} \text{---}(\text{CH}_2)_2\text{---N---}(\text{CH}_2)_2\text{---} \\   \\ \text{CO-C}_6\text{H}_5 \end{array}$  |   | 120     |
| XVII-9    | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | 6-CH <sub>3</sub> | $\begin{array}{c} \text{---}(\text{CH}_2)_2\text{---N---}(\text{CH}_2)_2\text{---} \\   \\ \text{CO-OC}_2\text{H}_5 \end{array}$ |   | 161     |
| XVII-10   | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H                 | -(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -O-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -                                                            |   | 152     |

A (II) képletű köztermékek előállításai példái:

II - 1. példa:

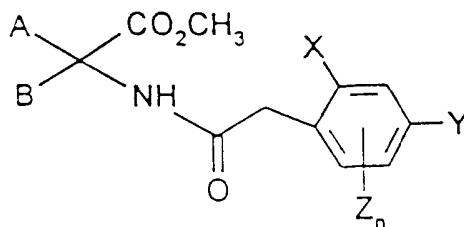
A XVII-1. példa szerinti vegyület 500 ml metilén-kloridban készített szuszpenziójához 152,4 g konc. kénsavat adunk, 2 órán át kevertetjük az elegyet, és 40 °C-on becsepegtetünk 218 ml metanolt, majd hat órán át továbbkevertetjük 40-70 °C-on. A reakcióelegyet 1,5 l jégre öntjük, 500 ml metilén-kloriddal extraháljuk, a metilén-kloridos fázist szárítjuk és az oldószert ledestilláljuk. Így 65 g (65%) alábbi képletű

vegyületet kapunk, op.: 111-113 °C.



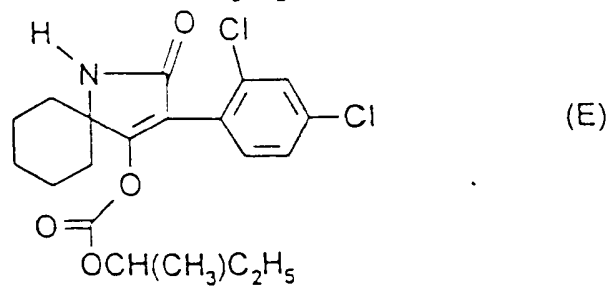
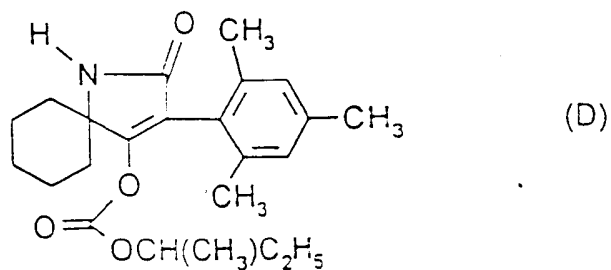
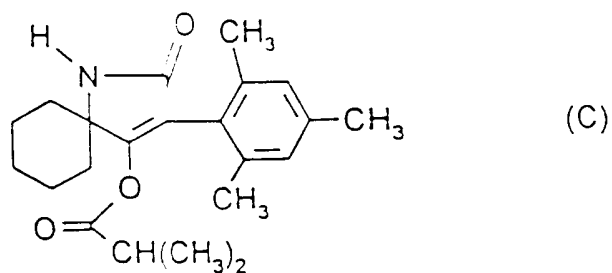
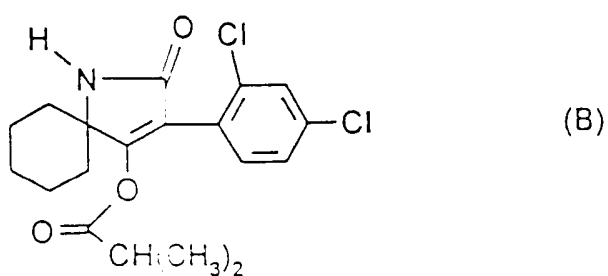
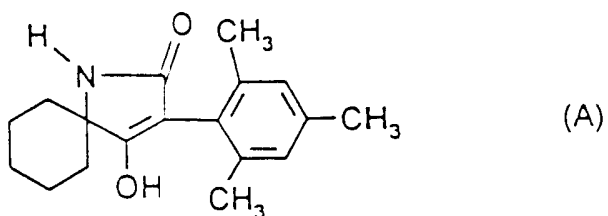
II-1 példa

Analóg módon kapjuk a következő (II) képletű vegyületeket:



| példaszám | X               | X               | Z <sub>n</sub>    | A                                                                                                              | B | Fp.     |
|-----------|-----------------|-----------------|-------------------|----------------------------------------------------------------------------------------------------------------|---|---------|
| II-2      | Cl              | Cl              | H                 | -(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -S-CH <sub>2</sub> -                                                          |   | 133-135 |
| II-3      | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | 6-CH <sub>3</sub> | -(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -S-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -                                          |   | 158     |
| II-4      | Cl              | Cl              | H                 | -(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -O-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -                                          |   | 130-131 |
| II-5      | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | 6-CH <sub>3</sub> | -(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -O-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -                                          |   | 153-154 |
| II-6      | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | 6-CH <sub>3</sub> | -(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -N-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -<br> <br>CH <sub>3</sub>                  |   | 128-130 |
| II-7      | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | 6-CH <sub>3</sub> | -(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -N-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -<br> <br>CO-CH <sub>3</sub>               |   | 148-150 |
| II-8      | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | 6-CH <sub>3</sub> | -(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -N-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -<br> <br>CO-C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> |   | Oel     |
| II-9      | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H                 | -(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -O-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -                                          |   | 119     |

Az alkalmazási példákban a technika állásából ismert alábbi összehasonlító vegyületeket alkalmaztuk:



(mind ismert az EP 0 456 063 iratból)

# **Biológiai példák:**

## **A példa:**

Myzus-teszt

Oldószer: 7 tömegrész dimetil-formamid

Emulgeátor: 1 tömegrész alkil-aril-poliglikol-éter

Alkalmas hatóanyag-készítmény előállítása céljából 1 tömegrész hatóanyagot adott mennyiségű oldószerrel és adott mennyiségű emulgeátorral összekeverünk, és a koncentrátumot vízzel a kívánt koncentrációra hígítjuk.

Káposztaleveleket (*Brassica oleracea*), amelyek erősen fertőzöttek baracklevéltetűvel (*Myzus persicae*), a kívánt koncentrációjú hatóanyag-készítménnyel permetezéssel kezelünk.

Megadott idő után meghatározzuk a pusztulás fokát, amelyet %-ban adunk meg. A 100% azt jelenti, hogy az összes levéltetű elpusztult; a 0% azt jelenti, hogy egyetlen levéltetű sem pusztult el.

Ebben a tesztben például az Ia-17. és Ib-128. előállítási példa szerinti vegyületek 0,01 % hatóanyag-koncentrációban 6 nap után legalább 90 %-os pusztulást okoznak, míg a technika állásából ismert (A) vegyület semmiféle pusztulást nem okoz, és a technika állásából ugyancsak ismert (B) vegyület 0,1 % hatóanyag-koncentrációban csak 20 %-os pusztulást.

# **B példa:**

Plutella-teszt

Oldószer: 7 tömegrész dimetil-formamid

Emulgeátor: 1 tömegrész alkil-aril-poliglikol-éter

Alkalmas hatóanyag-készítmény előállítása céljából 1 tömegrész hatóanyagot megadott mennyiségű oldószerrel és megadott mennyiségű emulgeátorral összekeverünk és a koncentrátumot vízzel a kívánt koncentrációra hígítjuk.

Káposztaleveleket (*Brassica oleracea*) a kívánt koncentrációjú hatóanyag-készítménnyel permetezéssel kezelünk, és a káposztabogár hernyóival (*Plutella maculipennis*) beborítjuk mindaddig, amíg a levelek még nedvesek.

Megadott idő után meghatározzuk a pusztulás fokát, amelyet %-ban adunk meg. A 100 % azt jelenti, hogy az összes hernyó elpusztult; a 0 % azt jelenti, hogy egyetlen hernyó sem pusztult el.

Ebben a tesztben például az Ib-132. előállítási példa vegyülete 0,1 % hatóanyag-koncentrációban úgy hat, hogy 3 nap után 100 %-os pusztulást okoz.

### C példa:

Nephotettix-teszt

Oldószer: 7 tömegrész dimetil-formamid

Emulgeátor: 1 tömegrész alkil-aril-poliglikol-éter

Alkalmas hatóanyag-készítmény előállítása céljából 1 tömegrész hatóanyagot megadott mennyiségű oldószerrel és megadott mennyiségű emulgeátorral összekeverünk és a koncentrátumot vízzel a kívánt koncentrációra hígítjuk.

Rizs-csirákat (*Oryza sativa*) a kívánt koncentrációjú hatóanyag-készítménnyel permetezéssel kezelünk, és a zöld rizskabóca lárváival (*Nephotettix cincticeps*) beborítjuk mindaddig, amíg a csirák még nedvesek.

Megadott idő után meghatározzuk a pusztulás fokát, amelyet %-ban adunk meg. A 100 % azt jelenti, hogy az összes kabóca elpusztult; a 0 % azt jelenti, hogy egyetlen kabóca sem pusztult el.

Ebben a tesztben például az Ic-194. és Ic-198. előállítási példák vegyülete hatásosnak bizonyult 0,01 % hatóanyag-koncentrációban 100 %-os pusztulást okozva.

# **D példa:**

Tetranychus-teszt (CP-rezisztens)

Oldószer: 3 tömegrész dimetil-formamid

Emulgeátor: 1 tömegrész alkil-aril-poliglikol-éter

Alkalmas hatóanyag-készítmény előállítása céljából 1 tömegrész hatóanyagot megadott mennyiségű oldószerrel és megadott mennyiségű emulgeátorral összekeverünk és a koncentrátumot vízzel a kívánt koncentrációra hígítjuk.

Babnövényeket (*Phaseolus vulgaris*), amelyek erősen fertőzöttek a közönséges fonóatka (*Tetranychus urticae*) minden fejlődési fokozatával, a kívánt koncentrációjú hatóanyag-készítménnyel bepermetezzük.

Megadott idő után meghatározzuk a pusztulás fokát, amelyet %-ban adunk meg. A 100 % azt jelenti, hogy az összes fonóatka elpusztult; a 0 % azt jelenti, hogy egyetlen fonóatka sem pusztult el.

Ebben a tesztben például az Ia-17., Ib-132. és Ic-198. előállítási példák vegyületei hatásosnak bizonyultak 14 nap után 100 %-os pusztulást okozva.

**E példa:**

Panonychus-teszt

Oldószer: 3 tömegrész dimetil-formamid

Emulgeátor: 1 tömegrész alkil-aril-poliglikol-éter

Alkalmas hatóanyag-készítmény előállítása céljából 1 tömegrész hatóanyagot megadott mennyiségű oldószerrel és megadott mennyiségű emulgeátorral összekeverünk és a koncentrátumot vízzel a kívánt koncentrációra hígítjuk.

Körülbelül 30 cm magas szilvafácskát (*Prunus domestica*), amely erősen fertőzött a gyümölcsfa-fonóatka (*Panonychus ulmi*) minden fejlődési fokozatával, a kívánt koncentrációjú hatóanyag-készítménnyel bepermetezünk.

Megadott idő után meghatározzuk a pusztulás fokát, amelyet %-ban adunk meg. A 100 % azt jelenti, hogy az összes fonóatka elpusztult; a 0 % azt jelenti, hogy egyetlen fonóatka sem pusztult el.

Ebben a tesztben például az Ia-17., Ib-132. és Ic-198. előállítási példák vegyületei 0,02 %-os hatóanyag-koncentrációban 14 nap után 100 %-os pusztulást okoznak.

### Szabadalmi igénypontok

1. (I) általános képletű szubsztituált spirociklusos 1-H-3-  
 aril-pirrolidin-2,4-dion-származékok, mely képletben

A és B együttes jelentése a szomszédos szénatommal együtt,  
 amelyhez kapcsolódnak, legalább egy heteroatom  
 által megszakított szubsztituálatlan vagy szubsztituált 5-6 tagú ciklus,

X jelentése alkilcsoport, halogénatom vagy alkoxics csoport,

Y jelentése hidrogén- vagy halogénatom, alkil-, alkoxi-  
 vagy halogén-alkilcsoport,

Z jelentése alkilcsoport, halogénatom vagy alkoxics csoport,

n jelentése 0, 1, 2 vagy 3,

G jelentése (a) hidrogénatom vagy (b), (c), (d), (e), (f)  
 vagy (g) általános képletű csoportok, ahol a képletekben

E jelentése egyvegyértéknyi fémion vagy ammóniumion,

L és M jelentése oxigén- vagy kénatom,

R<sup>1</sup> jelentése adott esetben halogénatommal szubsztituált alkil-, alkenil-, alkoxi-alkil-, alkil-tio-alkil-, poli(alkoxi-alkil-) vagy cikloalkil-csoport, amely heteroatomot is tartalmazhat, továbbá R<sup>1</sup> jelentése adott esetben szubsztituált fenil-, fenil-alkil-, hetero-aril-, fenoxi-alkil- vagy hetero-aril-oxi-alkilcsoport,

R<sup>2</sup> jelentése adott esetben szubsztituált alkil-, cikloalkil-, alkenil-, alkoxi-alkil-, poli(alkoxi-alkil-) vagy adott esetben szubsztituált fenil- vagy

benzilcsoport,

$R^3$ ,  $R^4$  és  $R^5$  jelentése egymástól függetlenül adott esetben halogénatommal szubsztituált alkil-, alkoxi-, alkil-amino-, dialkil-amino-, alkil-tio-, alkenil-tio, cikloalkil-tio- vagy adott esetben szubsztituált fenil-, fenoxi- vagy fenil-tio-csoport,

$R^6$  és  $R^7$  jelentése egymástól függetlenül hidrogénatom, adott esetben halogénatommal szubsztituált alkil-, cikloalkil-, alkenil-, alkoxi-, alkoxi-alkil-, adott esetben szubsztituált fenil- vagy benzilcsoport, vagy

$R^6$  és  $R^7$  a N-atommal együttesen, amelyhez kötődnek, egy, adott esetben oxigén- vagy kénatomot tartalmazó ciklust jelentenek.

2. Az 1. igénypont szerinti (Ia) - (Ig) általános képletű szubsztituált spirociklusos 1-H-3-aryl-pirrolidin-2,4-dion-származékok, ahol a képletben

A, B, E, L, M, X, Y, Z,  $R^1$ ,  $R^2$ ,  $R^3$ ,  $R^4$ ,  $R^5$ ,  $R^6$ ,  $R^7$  és n jelentése az 1. igénypontban megadott.

3. Az 1. igénypont szerinti (I) általános képletű szubsztituált spirociklusos 1H-3-aryl-pirrolidin-2,4-dion-származékok, mely képletben

A, B és a szénatom, amelyhez kapcsolódnak, jelentése egy 5-6-tagú spirociklus, amely az

N - R<sup>9</sup>

képletű csoportot és/vagy oxigénatomot és/vagy kénatomot tartalmaz, és amely szubsztituálatlan vagy egy vagy több alkil-, cikloalkil-, haloalkil-, alkoxi-, tioalkil- vagy fenilcsoporttal vagy halogénatommal szubsztituált lehet,

X jelentése 1-6 szénatomos alkilcsoport, halogénatom vagy 1-6 szénatomos alkoxics csoport,

Y jelentése hidrogén- vagy halogénatom, 1-6 szénatomos alkil-, 1-6 szénatomos alkoxi- vagy 1-3 szénatomos halogén-alkilcsoport,

Z jelentése 1-6 szénatomos alkilcsoport, halogénatom vagy 1-6 szénatomos alkoxics csoport,

G jelentése (a) hidrogénatom vagy (b) - (g) képletű csoport, ahol a képletekben

E jelentése egyvegyértéknyi fémion vagy ammóniumion,  
L és M jelentése oxigén- vagy kénatom,

R<sup>-</sup> jelentése adott esetben halogénatommal szubsztituált 1-20 szénatomos alkil-, 2-10 szénatomos alkenil-, (1-8 szénatomos alkoxi)-(1-8 szénatomos alkil)-, (1-8 szénatomos alkil)-tio-(1-8 szénatomos alkil)-, (1-8 szénatomos polialkoxi)-(1-8 szénatomos alkil)- vagy 3-8 gyűrűatomot tartalmazó cikloalkilcsoport, amely oxigén-

és/vagy kénatommal lehet megszakítva és egy 1-6 szénatomos alkilcsoporttal lehet helyettesítve,

adott esetben halogénatommal, nitro-, 1-6 szénatomos alkil-, 1-6 szénatomos alkoxi-, 1-6 szénatomos halogén-alkil- vagy 1-6 szénatomos halogén-alkoxicssoporttal szubsztituált fenilcsoport,

adott esetben halogénatommal, nitro-, 1-6 szénatomos alkil-, 1-6 szénatomos alkoxi-, 1-6 szénatomos halogén-alkil- vagy 1-6 szénatomos halogén-alkoxicssoporttal szubsztituált fenil-(1-6 szénatomos alkil)-csoport,

adott esetben halogénatommal és/vagy 1-6 szénatomos alkilcsoporttal szubsztituált heteroarilcsoport,

adott esetben halogénatommal és/vagy 1-6 szénatomos alkilcsoporttal szubsztituált fenoxi-(1-6 szénatomos alkil)-csoport vagy

adott esetben halogénatommal, amino- és/vagy 1-6 szénatomos alkilcsoporttal szubsztituált heteroaril-oxi-(1-6 szénatomos alkil)-csoport,

R<sup>2</sup> jelentése adott esetben halogénatommal szubsztituált 1-20 szénatomos alkil-, 3-10 szénatomos alkenil-, (1-8 szénatomos alkoxi)-(2-8 szénatomos alkil)-, (1-8 szénatomos polialkoxi)-(2-8 szénatomos alkil)-csoport,

adott esetben halogénatommal vagy 1-6 szénatomos alkil-csoporttal szubsztituált 3-6 szénatomos cikloalkilcsoport vagy

adott esetben halogénatommal, nitro-, 1-6 szénatomos alkil-, 1-6 szénatomos alkoxi- vagy 1-6 szénatomos halogén-alkilcsoporttal szubsztituált fenil-vagy benzil-csoport,

R<sup>3</sup>, R<sup>4</sup> és R<sup>5</sup> jelentése egymástól függetlenül adott esetben halogénatommal szubsztituált 1-8 szénatomos alkil-, 1-8 szénatomos alkoxi-, 1-8 szénatomos alkil-amino-, di(1-8 szénatomos alkil)-amino-, 1-8 szénatomos alkil-tio-, 3-5 szénatomos alkenil-tio-, 3-7 szénatomos cikloalkil-tio-, továbbá adott esetben halogénatommal, nitro-, ciano-, 1-4 szénatomos alkoxi-, 1-4 szénatomos halogénalkoxi-, 1-4 szénatomos alkil-tio-, 1-4 szénatomos halogénalkil-tio-, 1-4 szénatomos alkil-, 1-4 szénatomos halogénalkil-csoporttal szubsztituált fenil-, fenoxi- vagy fenil-tiocsoport,

R<sup>6</sup> és R<sup>7</sup> jelentése egymástól függetlenül hidrogénatom, adott esetben halogénatommal szubsztituált 1-10 szénatomos alkil-, 3-10 szénatomos cikloalkil-, 1-10 szénatomos alkoxi-, 3-8 szénatomos alkenil-, (1-8 szénatomos alkoxi)-(1-8 szénatomos alkil)-csoport, adott esetben halogénatommal, 1-8 szénatomos halogénalkil-, 1-8 szénatomos alkil- vagy 1-8 szénatomos alkoxicssoporttal szubsztitu-

ált fenil- vagy benzilcsoport, vagy a N-atommal együtt, amelyhez kötődnek egy, adott esetben oxigén- vagy kén-atommal megszakított 3-7-tagú gyűrű,

$R^9$  jelentése hidrogénatom,  $R^1$ ,  $COR^1$ ,  $CO_2R^2$ , ahol  $R^1$  illetőleg  $R^2$  jelentése a 3. igénypontban  $R^1$ -re illetve  $R^2$ -re megadott jelentésekkel azonos lehet és

$n$  jelentése 0, 1, 2 vagy 3.

4. Az 1. igénypont szerinti (I) általános képletű szubsztituált spirociklusos 1H-3-aryl-pirrolidin-2,4-dion-származékok, mely képletben

A és B jelentése azzal szénatommal együtt, amelyhez kapcsolódnak, egy 5-6-tagú spirociklus, amely az

$N - R^9$

képletű csoportot és/vagy oxigénatomot és/vagy kénatomot tartalmaz, és amely szubsztituátlan vagy egy vagy több 1-6 szénatomos alkil-, 1-8 szénatomos cikloalkil-, 1-3 szénatomos haloalkil-, 1-4 szénatomos alkoxi-, 1-4 szénatomos tioalkil-csoporttal, fluor- vagy klóratommal vagy fenilcsoporttal szubsztituált lehet,

X jelentése 1-4 szénatomos alkilcsoport, halogénatom vagy 1-4 szénatomos alkoxicssoport,

Y jelentése hidrogén- vagy halogénatom, 1-4 szénatomos alkil-, 1-4 szénatomos alkoxi- vagy 1-2 szénatomos halogén-alkilcsoport,

Z jelentése 1-4 szénatomos alkilcsoport, halogénatom vagy 1-4 szénatomos alkoxics csoport,

G jelentése (a) hidrogénatom vagy (b) - (g) képletű csoport, ahol

E jelentése egyvegyértéknyi fémion vagy ammóniumion,

L és M jelentése oxigén- vagy kénatom,

R<sup>1</sup> jelentése adott esetben halogénatommal szubsztituált 1-16 szénatomos alkil-, 2-8 szénatomos alkenil-, (1-6 szénatomos alkoxi)-(1-6 szénatomos alkil)-, (1-6 szénatomos alkil)-tio-(1-6 szénatomos alkil)-, (1-6 szénatomos polialkoxi)-(1-6 szénatomos alkil)- vagy 3-7 gyűrűatomot tartalmazó cikloalkilcsoport, amely 1-2 oxigén- és/vagy kénatommal lehet megszakítva és egy 1-4 szénatomos alkilcsoporttal lehet helyettesítve,

adott esetben halogénatommal, nitro-, 1-4 szénatomos alkil-, 1-4 szénatomos alkoxi-, 1-3 szénatomos halogén-alkil- vagy 1-3 szénatomos halogén-alkoxics csoporttal szubsztituált fenilcsoport,

adott esetben halogénatommal, 1-4 szénatomos alkil-, 1-4 szénatomos alkoxi-, 1-3 szénatomos halogénalkil- vagy 1-

3 szénatomos halogén-alkoxicsoporttal szubsztituált fenil-(1-4 szénatomos alkil)-csoport,

adott esetben fluor-, klór-, brómatommal és/vagy 1-4 szénatomos alkilcsoporttal szubsztituált furanil-, tienil-, piridil-, pirimidil-, tiazolil- vagy pirazolil-csoport,

adott esetben fluor-, klór-, brómatommal és/vagy 1-4 szénatomos alkilcsoporttal szubsztituált fenoxi-(1-5 szénatomos alkil)-csoport vagy

adott esetben fluor-, klór-, brómatommal és/vagy 1-4 szénatomos alkilcsoporttal szubsztituált piridiloxi-(1-6 szénatomos alkil)-, pirimidiloxi-(1-6 szénatomos alkil)- vagy tiazoliloxi-(1-6 szénatomos alkil)-csoport,

R<sup>2</sup> jelentése adott esetben halogénatommal szubsztituált 1-16 szénatomos alkil-, 3-8 szénatomos alkenil-, (1-6 szénatomos alkoxi)-(2-6 szénatomos alkil)-, (1-6 szénatomos polialkoxi)-(2-6 szénatomos alkil)-csoport,

adott esetben fluor-, klóratommal vagy 1-4 szénatomos alkilcsoporttal szubsztituált 3-6 szénatomos cikloalkil-csoport vagy

adott esetben halogénatommal, nitro-, 1-4 szénatomos alkil-, 1-3 szénatomos alkoxi- vagy 1-3 szénatomos

halogén-alkilcsoporttal szubsztituált fenil-vagy benzil-csoport,

$R^3$ ,  $R^4$  és  $R^5$  jelentése egymástól függetlenül adott esetben halogénatommal szubsztituált 1-6 szénatomos alkil-, 1-6 szénatomos alkoxi-, 1-6 szénatomos alkil-amino-, di(1-6 szénatomos alkil)-amino-, 1-6 szénatomos alkil-tio-, 3-4 szénatomos alkenil-tio-, 3-6 szénatomos cikloalkil-tio-, továbbá adott esetben fluor-, klór- vagy brómmal, nitro-, ciano-, 1-3 szénatomos alkoxi-, 1-3 szénatomos halogénalkoxi-, 1-3 szénatomos alkil-tio-, 1-3 szénatomos halogénalkil-tio-, 1-3 szénatomos alkil-, 1-3 szénatomos halogénalkil-csoporttal szubsztituált fenil-, fenoxi- vagy fenil-tiocsoport,

$R^6$  és  $R^7$  jelentése egymástól függetlenül hidrogénatom, adott esetben halogénatommal szubsztituált 1-8 szénatomos alkil-, 3-8 szénatomos cikloalkil-, 1-8 szénatomos alkoxi-, 3-6 szénatomos alkenil-, (1-6 szénatomos alkoxi)-(1-6 szénatomos alkil)-csoport, adott esetben halogénatommal, 1-5 szénatomos halogénalkil-, 1-5 szénatomos alkil- vagy 1-5 szénatomos alkoxicssoporttal szubsztituált fenil- vagy benzilcsoport, vagy a N-atommal együtt, amelyhez kötődnek egy, adott esetben oxigén- vagy kénatommal megszakított 4-7-tagú gyűrű,

$R^9$  jelentése hidrogénatom,  $COR^{1'}$ ,  $CO_2R^{1'}$ , ahol  $R^{1'}$  jelentése 1-6 szénatomos alkil-, fenil- vagy benzilcsoport,

n jelentése 0, 1 vagy 2.

5. Az 1. igénypont szerinti (I) általános képletű szubsztituált spirociklusos 1H-3-aryl-pirrolidin-2,4-dion-származékok, mely képletben

A, B és a szénatom, amelyhez kapcsolódnak, együttes jelentése egy 5-6-tagú spirociklus, amely az

N - R<sup>9</sup>

képletű csoportot és/vagy oxigénatomot és/vagy kénatomot tartalmaz, és amely szubsztituálatlan vagy egy vagy több metil-, etil-, propil-, izopropil-, butil-, izobutil-, szek-butil-, terc-butil-, ciklohexil-, trifluor-metil-, metoxi-, metiltio- vagy fenilcsoporttal, fluor- vagy klóratommal szubsztituált lehet,

X jelentése metil-, etil-, propil-, 2-propilcsoport, klór- vagy brómatom, metoxi-vagy etoxi-csoport,

Y jelentése hidrogén-, fluor-, klór- vagy brómatom, metil-, etil-, propil-, i-propil-, butil-, i-butil-, terc-butil-, metoxi-, etoxi- vagy trifluor-metilcsoport,

Z jelentése metil-, etil-, propil-, i-propil-, butil-, i-butil-, terc-butilcsoport, fluor-, klór- vagy brómatom, metoxi- vagy etoxicssoport,

G jelentése (a) hidrogénatom vagy (b) - )g) képletű csoport, ahol a képletekben

E jelentése egyvegyértéknyi fémion vagy ammóniumion és

L és M jelentése oxigén- vagy kénatom,

R<sup>1</sup> jelentése adott esetben fluor- vagy klóratommal szubsztituált 1-14 szénatomos alkil-, 2-6 szénatomos alkenil-, (1-4 szénatomos alkoxi)-(1-6 szénatomos alkil)-, (1-4 szénatomos alkil)-tio-(1-6 szénatomos alkil)-, (1-4 szénatomos polialkoxi)-(1-4 szénatomos alkil)- vagy 3-6 gyűrűatomot tartalmazó cikloalkilcsoport, amely 1-2 oxigén- és/vagy kénatommal lehet megszakítva és metil- vagy etilcsoporttal lehet helyettesítve,

adott esetben fluor-, klór- vagy brómatommal, metil-, etil-, propil-, i-propil-, metoxi-, etoxi-, trifluor-metil-, trifluor-metoxi- vagy nitrocsoporttal szubsztituált fenilcsoport,

adott esetben fluor-, klór- vagy brómatommal, metil-, etil-, propil-, i-propil-, metoxi-, etoxi-, trifluor-metil- vagy trifluor-metoxi-csoporttal szubsztituált fenil-(1-3 szénatomos alkil)-csoport,

adott esetben fluor-, klór-, brómatommal, metil- vagy etilcsoporttal szubsztituált furanil-, tienil-, piridil-, pirimidil-, tiazolil- vagy pirazolil-csoport,

adott esetben fluor-, klóratommal, metil- vagy etilcsoporttal szubsztituált fenoxi-(1-4 szénatomos alkil)-csoport vagy

adott esetben fluor-, klóratommal, metil- vagy etilcsoporttal szubsztituált piridiloxi-(1-4 szénatomos alkil)-pirimidiloxi-(1-4 szénatomos alkil)- vagy tiazoliloxi-(1-4 szénatomos alkil)-csoport,

R<sup>2</sup> jelentése adott esetben fluor- vagy klóratommal szubsztituált 1-14 szénatomos alkil-, 3-6 szénatomos alkenil-, (1-4 szénatomos alkoxi)-(2-6 szénatomos alkil)-, (1-4 szénatomos polialkoxi)-(2-6 szénatomos alkil)-csoport, adott esetben fluor- vagy klóratommal, metil- vagy etilcsoporttal szubsztituált 3-6 szénatomos ciklo-alkilcsoport vagy

adott esetben fluor- vagy klóratommal, nitro-, metil-, etil-, propil-, i-propil-, metoxi-, etoxi- vagy trifluor-metilcsoporttal szubsztituált fenil- vagy benzilcsoport,

R<sup>3</sup>, R<sup>4</sup> és R<sup>5</sup> jelentése egymástól függetlenül adott esetben fluor- vagy klóratommal szubsztituált 1-4 szénatomos alkil-, 1-4 szénatomos alkoxi-, 1-4 szénatomos alkil-amino-, di(1-4 szénatomos alkil)-amino-, 1-4 szénatomos alkil-tio-, továbbá adott esetben fluor-, klór- vagy brómatommal, nitro-, ciano-, 1-2 szénatomos alkoxi-, 1-2

szénatomos fluoralkoxi-, 1-2 szénatomos alkil-tio-, 1-2 szénatomos fluoralkil-tio-, 1-3 szénatomos alkilcsoporttal szubsztituált fenil-, fenoxi- vagy fenil-tiocsoport,

$R^6$  és  $R^7$  jelentése egymástól függetlenül hidrogénatom, adott esetben fluor-, klór vagy brómatommal szubsztituált 1-6 szénatomos alkil-, 3-6 szénatomos cikloalkil-, 1-6 szénatomos alkoxi-, (1-6 szénatomos alkoxi)-(1-4 szénatomos alkil)-csoport, adott esetben fluor-, klór- vagy brómatommal, 1-4 szénatomos halogénalkil-, 1-4 szénatomos alkil- vagy 1-4 szénatomos alkoxicsoporttal szubsztituált fenil- vagy benzil-csoport, vagy a N-atommal együtt, amelyhez kötődnek egy, adott esetben oxigén- vagy kénatommal megszakított 5-7-tagú gyűrű,

$R^9$  jelentése hidrogénatom,  $COR^{1'}$ ,  $CO_2R^{1'}$ , ahol  $R^{1'}$  jelentése 1-4 szénatomos alkil-, fenil- vagy benzilcsoport és

$n$  jelentése 0 vagy 1.

6. Eljárás az 1. igénypont szerinti (I) általános képletű spirociklusos szubsztituált 1H-3-aryl-pirrolidin-2,4-dion-származékok előállítására, azzal jellemezve, hogy

(A) az (Ia) általános képletű 1H-3-aryl-pirrolidin-2,4-dionokat vagy ezek enoljait, ahol  
A, B, X, Y, Z és  $n$  jelentése a fentiekben megadott, úgy állítjuk elő, hogy egy (II) általános képletű

N-acil-aminosavésztert, ahol

A, B, X, Y, Z és n jelentése a fenti és  $R^8$  jelentése alkilcsoport,

higitószer és egy bázis jelenlétében intramolekulárisan kondenzálunk,

vagy

(B) az (Ib) általános képletű vegyületeket, ahol

A, B, X, Y, Z,  $R^1$  és n jelentése a fentiekben megadott, úgy kapjuk meg, hogy egy (Ia) általános képletű vegyületet, ahol

A, B, X, Y, Z és n jelentése a fenti,

$\alpha$ ) egy (III) általános képletű savhalogeniddel, ahol

$R^1$  jelentése a fentiekben megadott és

Hal jelentése halogén-, különösen klór- vagy bróm-atom,

adott esetben higitószer és adott esetben egy savmegkötőszer jelenlétében reagáltatunk,

vagy

$\beta$ ) egy (IV) általános képletű karbonsavanhidriddel,

ahol

$R^1$  jelentése a fenti,

adott esetben higitószer és adott esetben egy savmegkötőszer jelenlétében reagáltatunk;

vagy

(C) az (Ic) általános képletű vegyületeket, ahol

A, B, X, Y, Z,  $R^2$  és n jelentése a fentiekben megadott,  
és M jelentése oxigén- vagy kénatom,  
úgy állíthatjuk elő, hogy egy (Ia) általános képletű  
vegyületet, ahol

A, B, X, Y, Z és n jelentése a fenti,  
egy (V) általános képletű klór-hangyasav-észterrel vagy  
klór-hangyasav-tiolészterrel, ahol  
 $R^2$  és M jelentése a fenti,  
adott esetben egy higitószer és adott esetben egy sav-  
megkötőszer jelenlétében reagáltatunk;  
vagy

- (D) az (Ic-2) általános képletű vegyületek előállítására,  
ahol A, B,  $R^2$ , X, Y, Z és n jelentése a fenti és  
M jelentése oxigén- vagy kénatom,  
egy (Ia) általános képletű vegyületet, ahol  
A, B, X, Y, Z és n jelentése a fentiekben megadott,  
 $\alpha$ ) egy (VI) általános képletű klór-monotio-hangyasav-  
észterrel vagy klór-ditio-hangyasavészterrel, ahol  
M és  $R^2$  jelentése a fenti,  
adott esetben higitószer és adott esetben egy  
savmegkötőszer jelenlétében reagáltatunk;  
vagy  
 $\beta$ ) szénkénnel és végül egy (VII) általános képletű  
alkil-halogeniddel, ahol  
 $R^2$  jelentése a fenti és  
Hal jelentése klór-, bróm vagy jódatom,

adott esetben higitószer és adott esetben egy bázis jelenlétében reagáltatunk;

vagy

- (E) az (Id) képletű vegyületeket, ahol  
A, B, X, Y, Z,  $R^3$  és n jelentése a fenti,  
úgy kapjuk meg, hogy egy (Ia) képletű vegyületet, ahol  
A, B, X, Y, Z és jelentése a fentiekben megadott,  
egy (VIII) általános képletű szulfonsav-kloriddal, ahol  
 $R^3$  jelentése a fenti,  
adott esetben higitószer és adott esetben egy savmeg-  
kötőszer jelenlétében reagáltatunk;  
vagy
- (F) az (Ie) általános képletű 3-aril-pirrolidin-2,4-dionokat  
ahol A, B, X, Y, Z,  $R^4$ ,  $R^5$  és n jelentése a fenti,  
úgy állítjuk elő, hogy egy (Ia) képletű 1-H-3-aril-  
pirrolidin-2,4-diont illetve ennek enolját, ahol  
A, B, X, Y, Z és n jelentése a fenti,  
egy (IX) általános képletű foszfor-vegyülettel, ahol  
L,  $R^4$  és  $R^5$  jelentése a fenti és  
Hal jelentése halogénatom,  
adott esetben higitószer és adott esetben egy savmeg-  
kötőszer jelenlétében reagáltatunk;  
vagy
- (G) az (If) általános képletű vegyületeket, ahol  
A, B, X, Y, Z és n jelentése a fenti és

E egyvegyértéknyi fémiont vagy ammóniumiont jelent,  
 úgy állítjuk elő, hogy egy (Ia) képletű vegyületet, ahol  
 A, B, X, Y, Z és n jelentése a fenti,  
 egy (X) képletű fémvegyülettel vagy (XI) képletű amin-  
 nal, ahol

Me jelentése egy- vagy kétértékű fémion,

t jelentése 1 vagy 2,

$R^{10}$ ,  $R^{11}$  és  $R^{12}$  jelentése egymástól függetlenül hidro-  
 génatom vagy alkilcsoport és

$R^{13}$  jelentése hidrogénatom, hidroxil- vagy 1-4 szénato-  
 mos alkoxi-csoport,

adott esetben higitószer jelenlétében reagáltatunk,

(H) az (Ig) általános képletű vegyületeket, ahol

A, B, X, Y, Z,  $R^6$ ,  $R^7$  és n jelentése a fenti,

úgy kapjuk meg, hogy egy (Ia) képletű vegyületet, ahol

A, B, X, Y, Z és n jelentése a fenti,

$\alpha$ ) egy (XII) képletű vegyülettel, ahol

L és  $R^6$  jelentése a fenti,

adott esetben higitószer és adott esetben egy ka-  
 talizátor jelenlétében reagáltatunk,

vagy

$\beta$ ) egy (XIII) képletű karbamidsav-kloriddal vagy tio-  
 karbamidsav-kloriddal, ahol

L,  $R^6$  és  $R^7$  jelentése a fenti,

adott esetben higitószer és adott esetben egy sav-  
 megkötőszer jelenlétében reagáltatunk.

7. (XVII) általános képletű vegyületek, ahol  
A, B, X, Y, Z és n jelentése az 1. igénypontban megadott.
8. Eljárás a 7. igénypont szerinti (XVII) általános képletű vegyületek előállítására, azzal jellemezve, hogy  
egy (XVI) általános képletű vegyületet, ahol  
A és B jelentése az 1. igénypontban megadott,  
egy (XV) általános képletű fenil-ecetsav-halogeniddel, ahol  
X, Y, Z és n jelentése az 1. igénypontban megadott és  
Hal jelentése klór- vagy brómatom, reagáltatunk.
9. (II) általános képletű vegyületek, ahol a képletben  
A, B, X, Y, Z és n jelentése az 1. igénypontban megadott  
és R<sup>8</sup> jelentése alkilcsoport.
10. Eljárás a (II) általános képletű vegyületek előállítására, azzal jellemezve, hogy  
egy (XIV) általános képletű aminosav-származékot, ahol  
R<sup>8'</sup> jelentése hidrogénatom (XIVa) vagy alkilcsoport (XIVb)  
és A jelentése az 1. igénypontban megadott,  
egy (XV) általános képletű fenil-ecetsav-halogeniddel, ahol  
X, Y, Z és n jelentése az 1. igénypontban megadott és  
Hal jelentése klór- vagy brómatom,  
acilezzük, és adott esetben az így keletkezett (IIa) általános képletű (R<sup>8'</sup> = hidrogénatom) acil-aminosavat, ahol  
A, B, X, Y, Z és n jelentése az 1. igénypontban megadott,  
észterezzük vagy egy 7. igénypont szerinti (XVII) képletű vegyületet kénsavas alkoholizisnek vetünk alá.

11. Kártevők elleni szer és herbicid, azzal jellemezve, hogy legalább egy 1. igénypont szerinti (I) általános képletű szubsztituált spirociklusos 1-H-3-aril-pirrolidin-2,4-dion-származékot tartalmaz.

12. Az 1. igénypont szerinti (I) általános képletű szubsztituált spirociklusos 1-H-3-aril-pirrolidin-2,4-dion-származékok alkalmazása kártevők és nemkívántos növényi benővések irtására.

13. Eljárás kártevők irtására, azzal jellemezve, hogy az 1. igénypont szerinti (I) általános képletű szubsztituált spirociklusos 1-H-3-aril-pirrolidin-2,4-dion-származékokat a kártevőkön, nemkívánt növényi benővéseken és/vagy ezek életterében hatni engedjük.

14. Eljárás kártevőirtó szerek és herbicidek előállítására, azzal jellemezve, hogy az 1. igénypont szerinti (I) általános képletű szubsztituált spirociklusos 1-H-3-aril-pirrolidin-2,4-dion-származékokat hordozóanyagokkal és/vagy felületaktív szerekkel összekeverjük.

+ lekap  
Rm

A meghatalmazott:

DANUBIA  
Szabadalmi és védjegy iroda Kft.  
6.



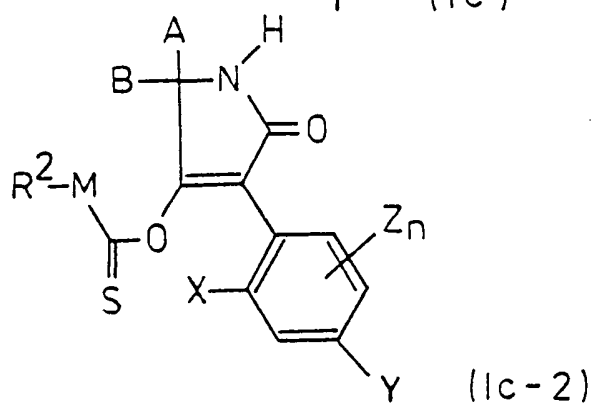
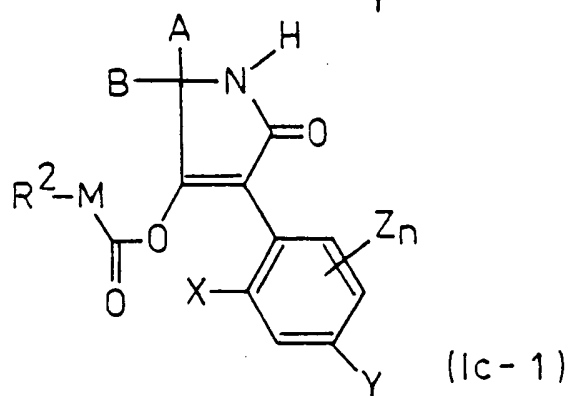
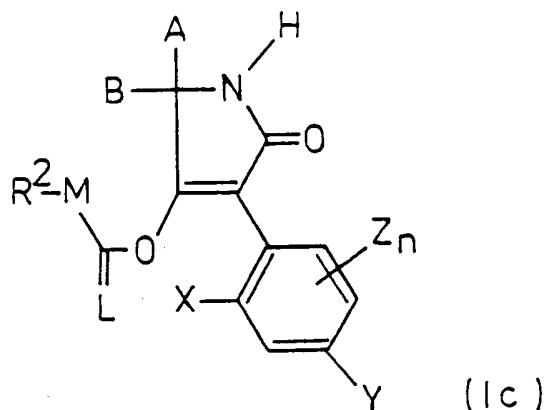
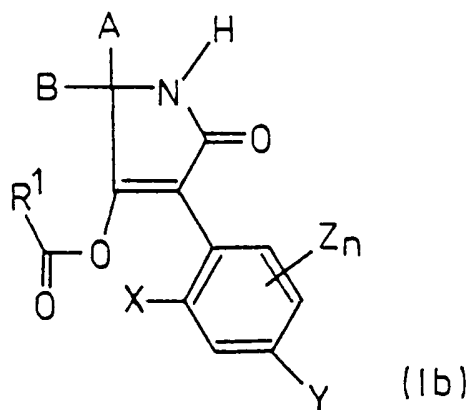
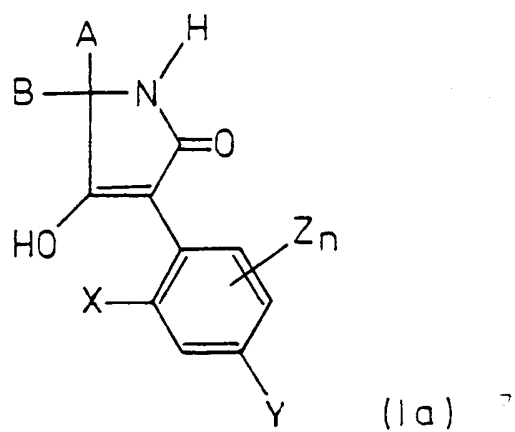
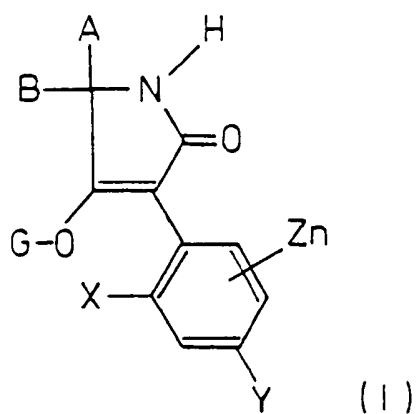
P450392

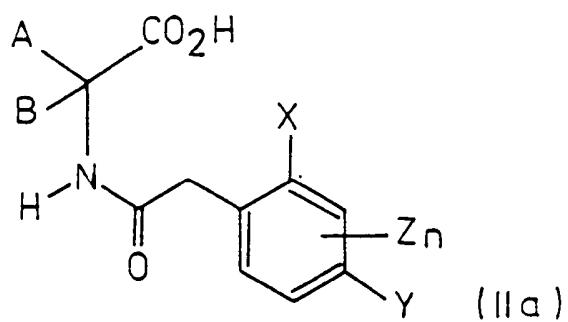
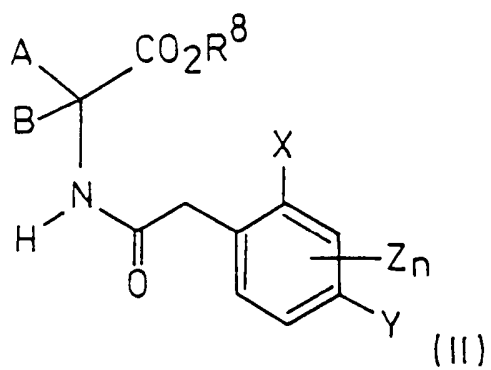
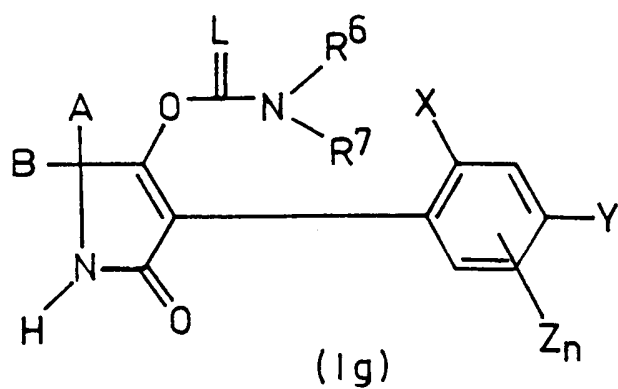
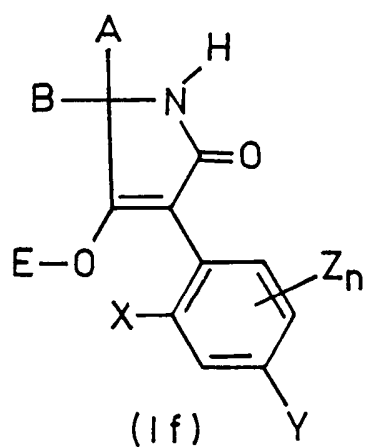
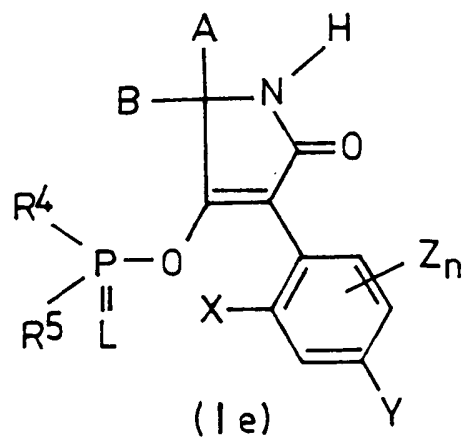
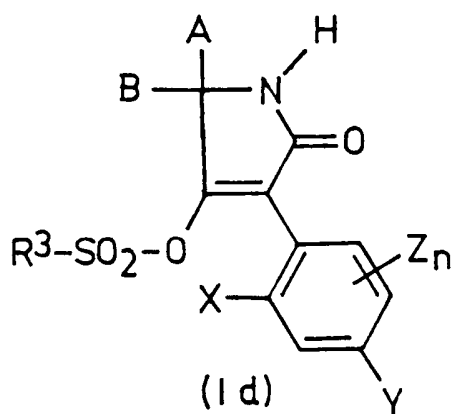
74311

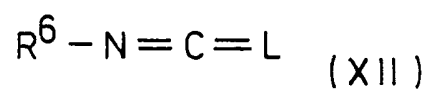
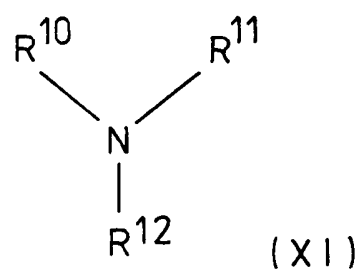
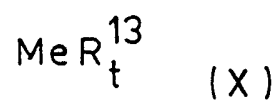
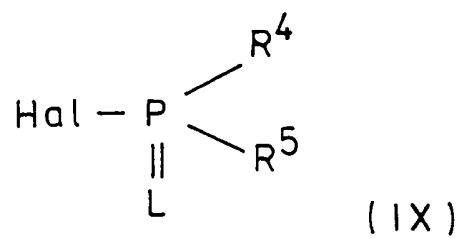
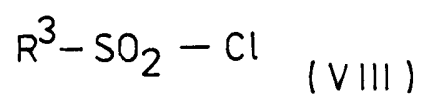
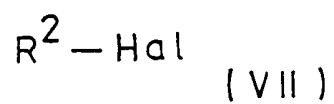
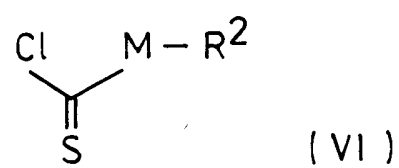
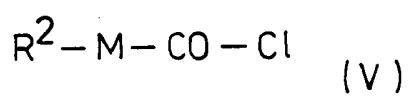
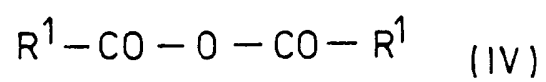
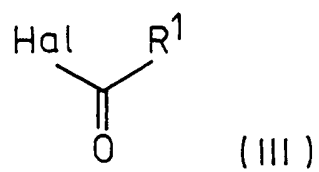
1/10

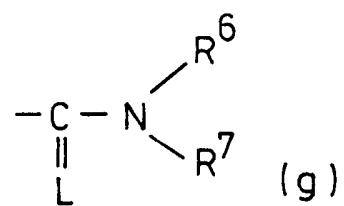
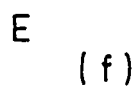
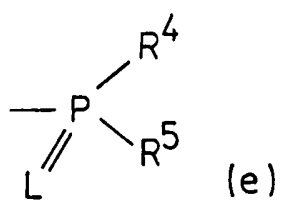
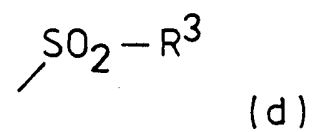
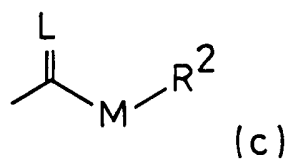
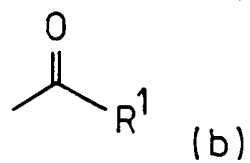
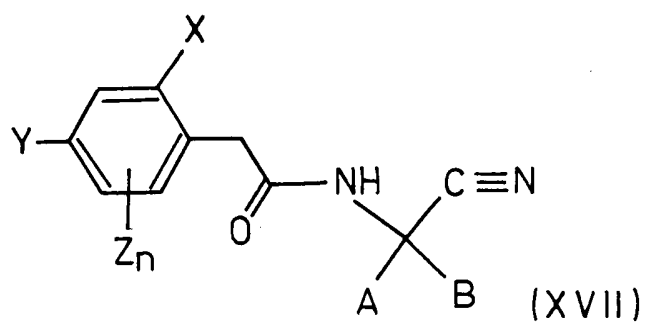
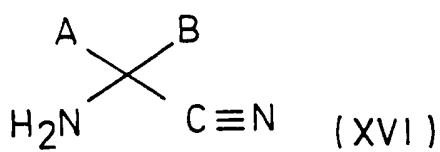
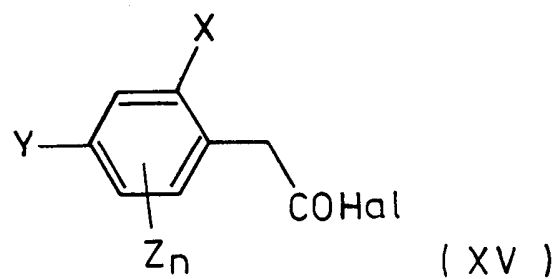
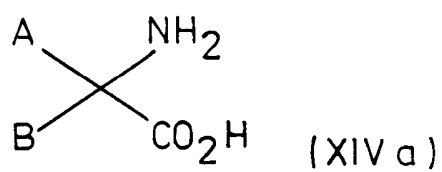
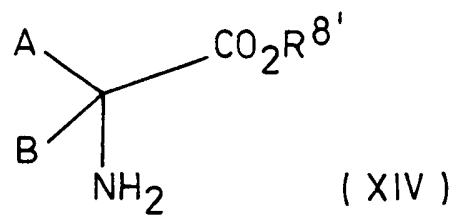
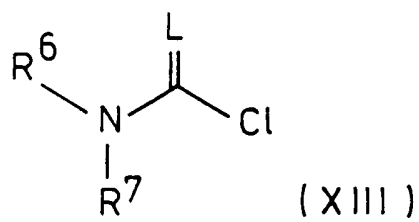
A

Chemical structure

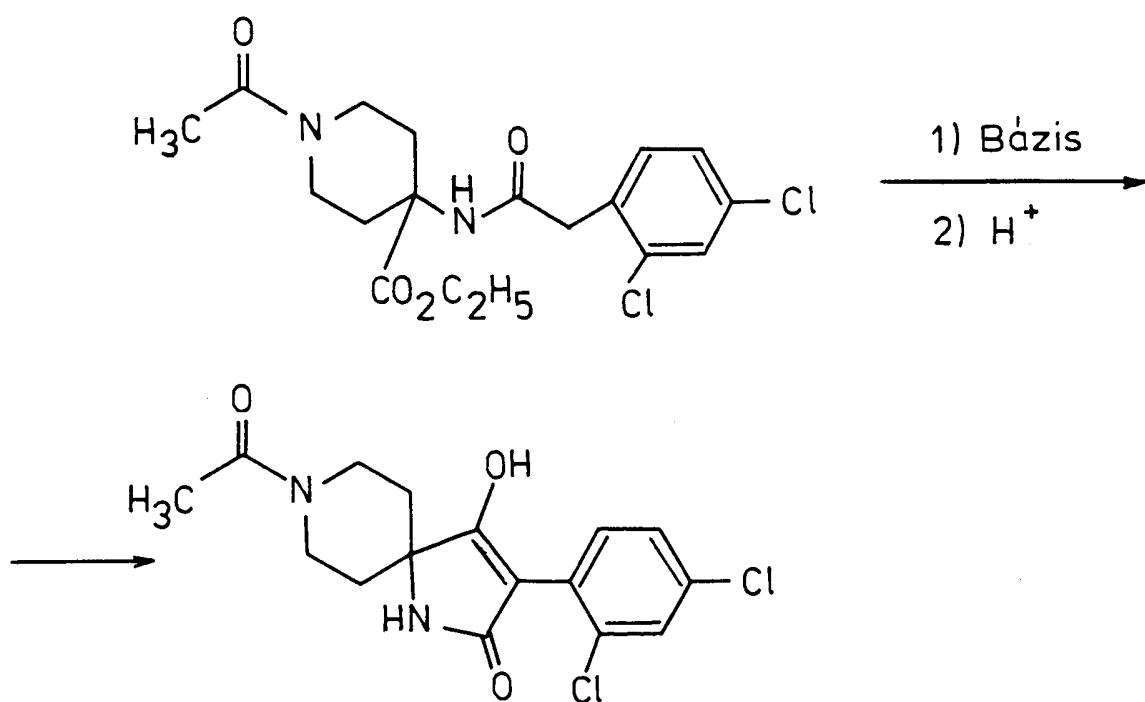




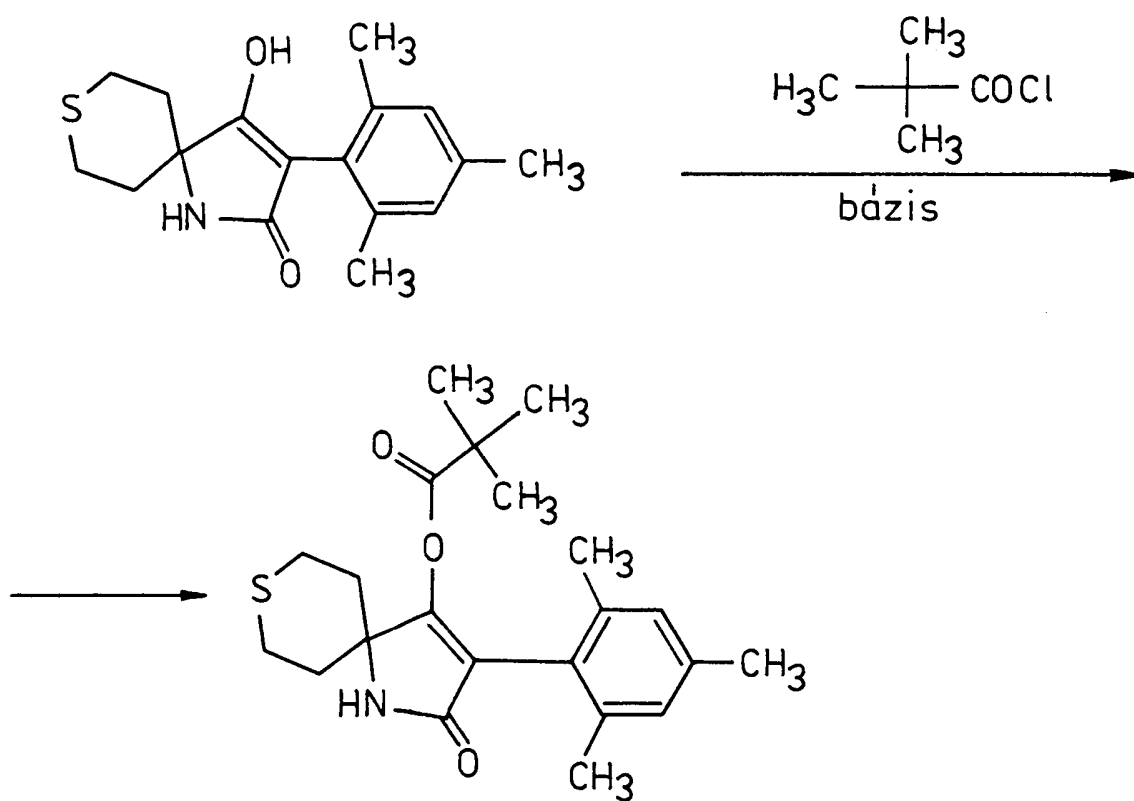




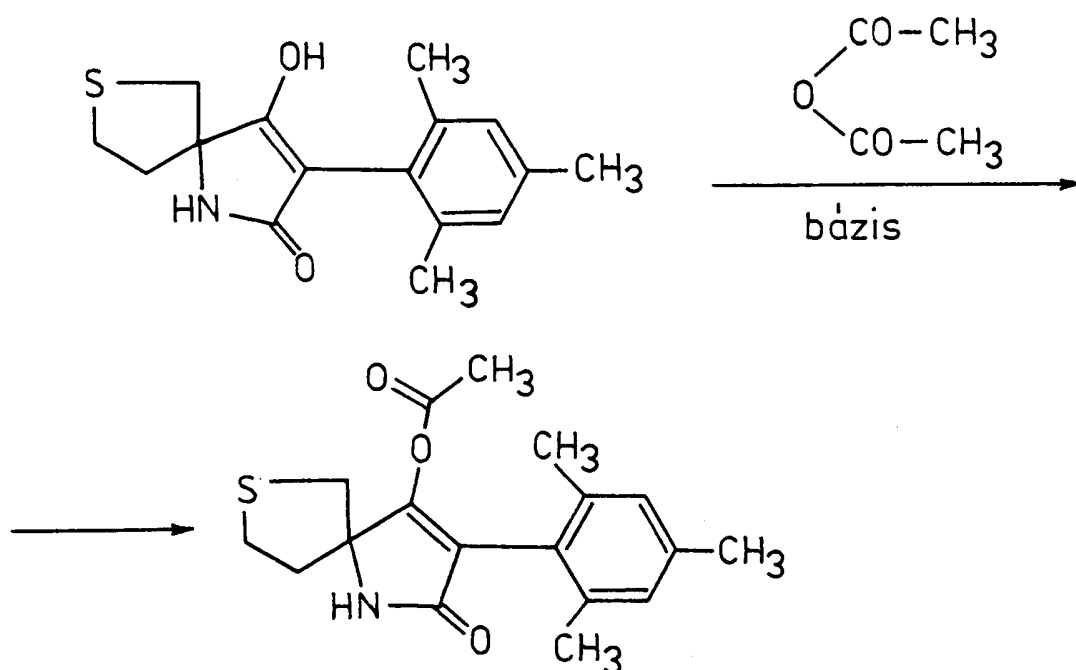
1. reakcióvázlat



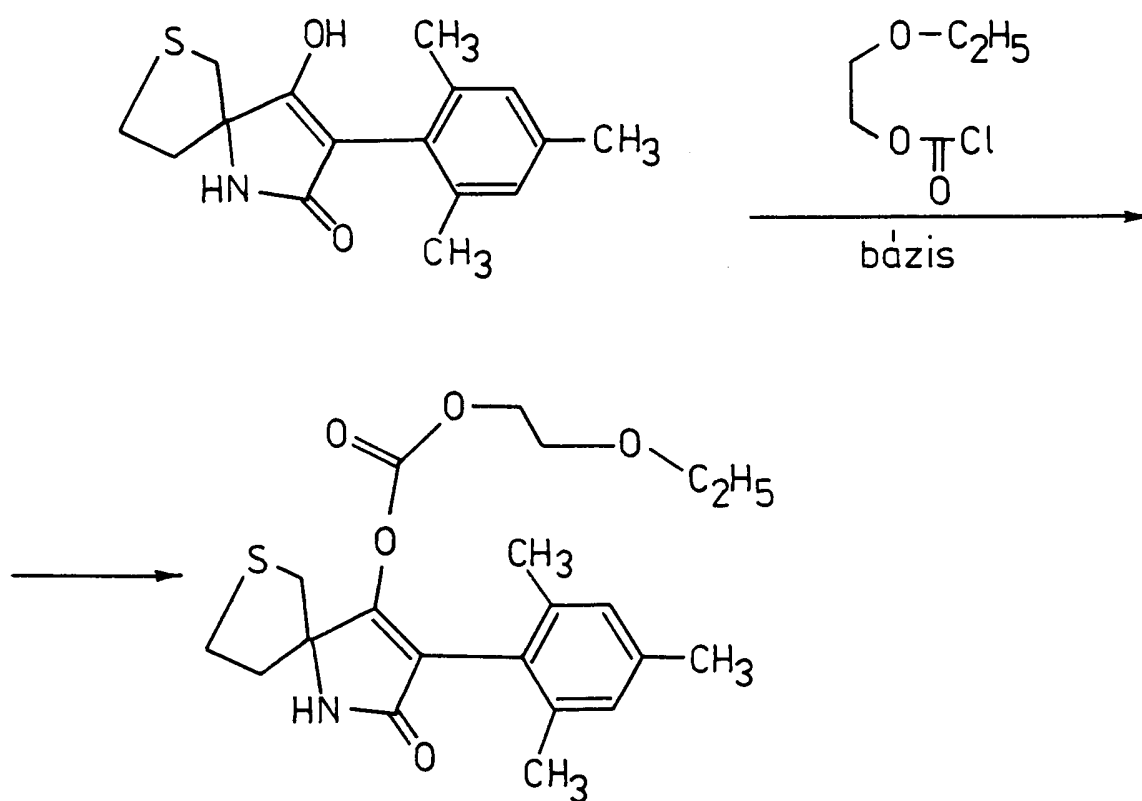
2. reakcióvázlat



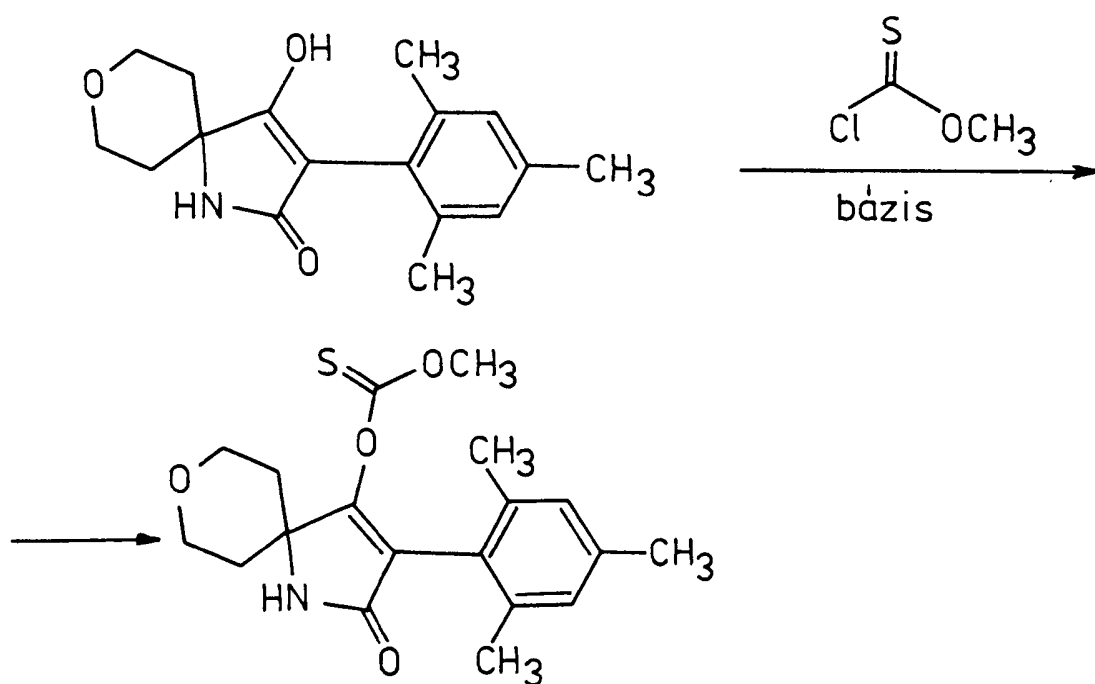
## 3. reakcióvázlat



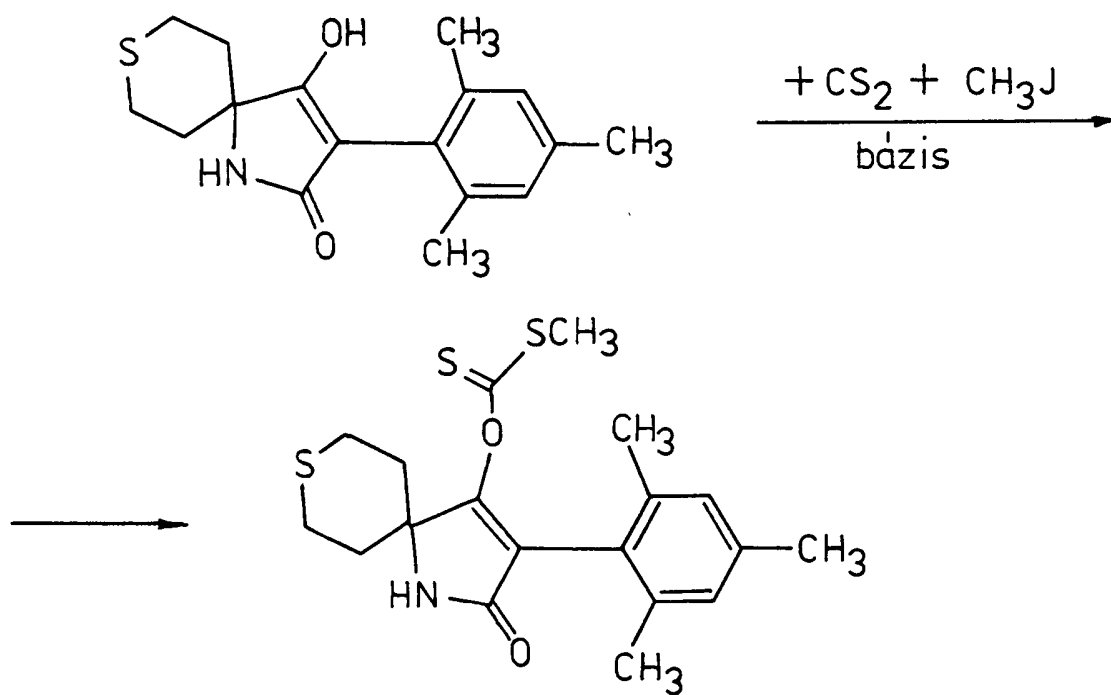
## 4. reakcióvázlat



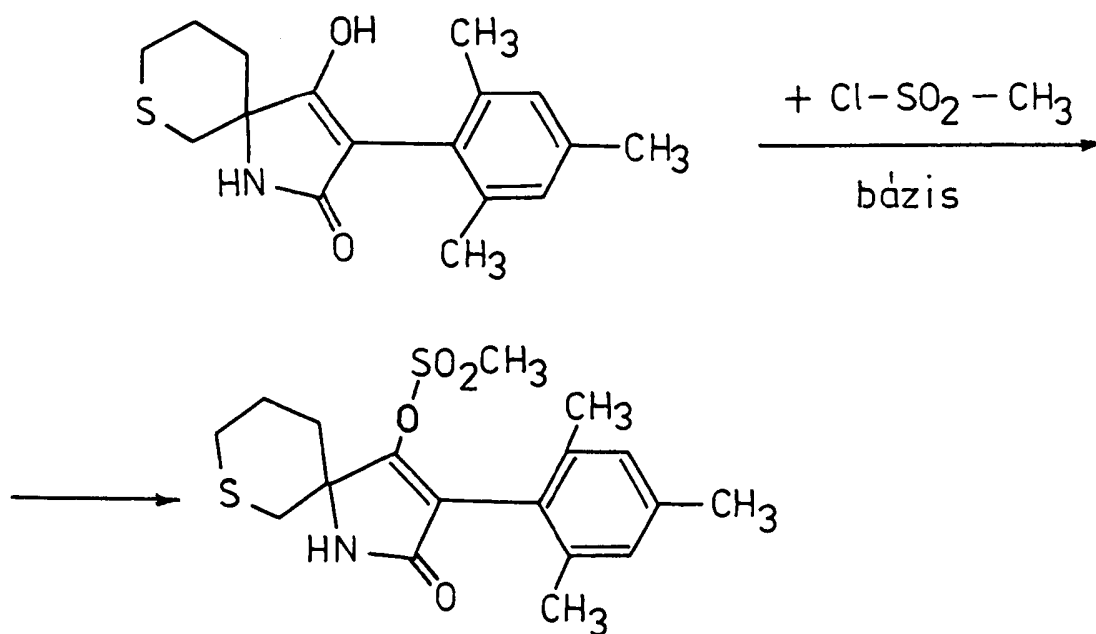
## 5. reakcióvázlat



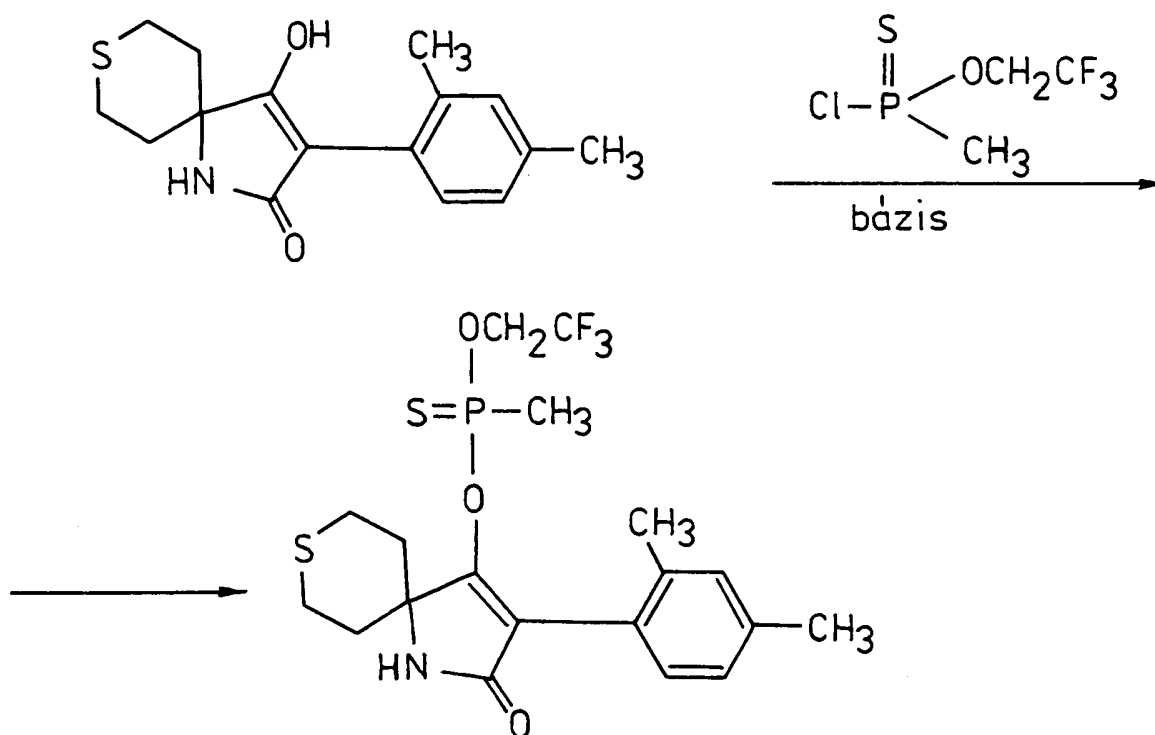
## 6. reakcióvázlat



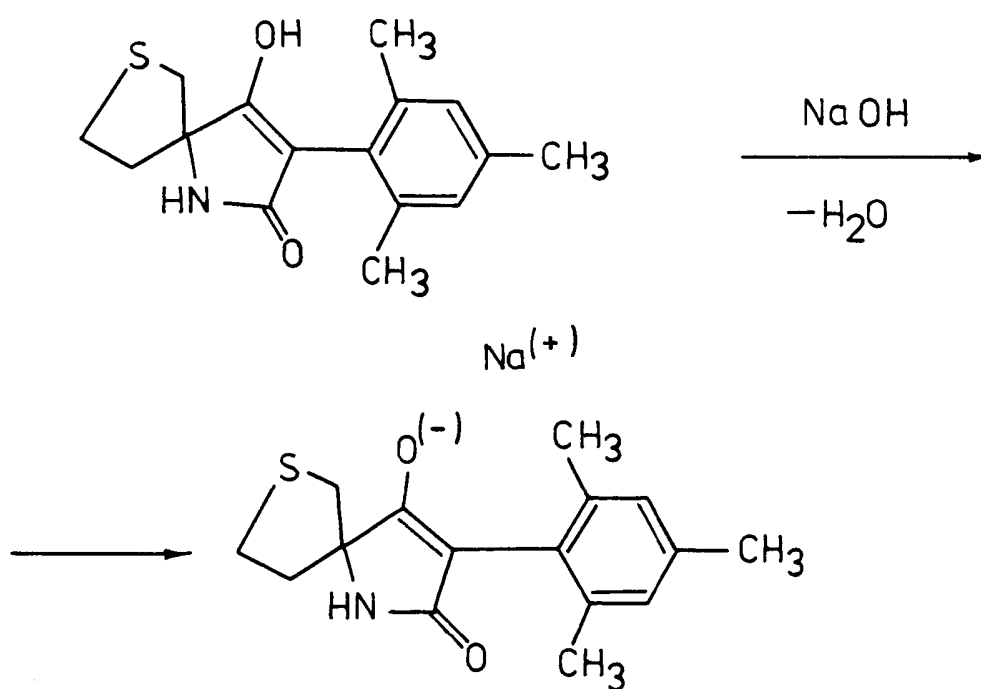
## 7. reakcióvázlat



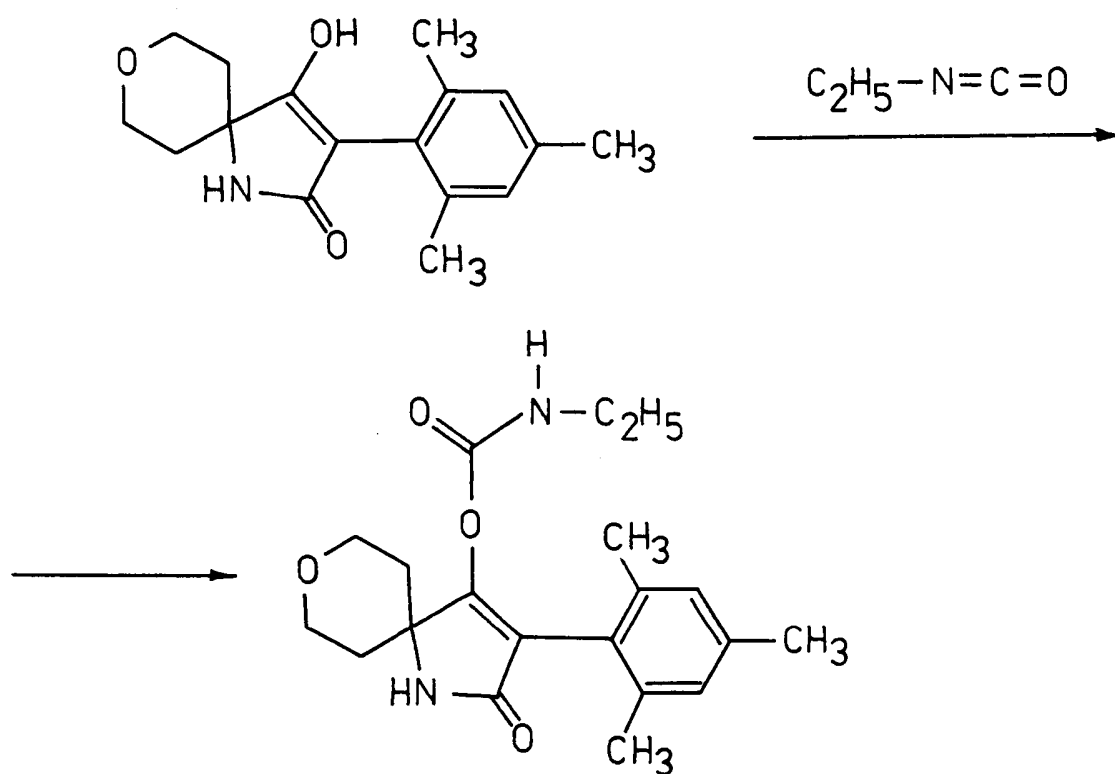
## 8. reakcióvázlat



## 9. reakcióvázlat



## 10. reakcióvázlat



## 11. reakcióvázlat

