

1982-911

KÖZZÉTÉTELI A PÉLDÁNY

1886/92

Hatóanyagként 2-(metoxi-imino)-karbonsav-metil-észter-származékot tartalmazó fungicid készítmény, valamint eljárás a hatóanyag és intermediere előállítására.

BAYER AG., Leverkusen, Németország

Bejelentés napja: 1991. 06. 14.

Elsőbbsége: 1990. 06. 16. (P 40 19 307.1)
Németország

58690

K i v o n a t

A találmány szerinti készítmény hatóanyagának (I) általános képletében

Ar jelentése (a), (b), (c) vagy (d) általános képletű csoport,

A jelentése $\text{-CH}_2\text{-}$, -CH- vagy -N- képletű csoport,
 CH_3 CH_3

az általános képletekben

Y jelentése -C-O- ; -C-NH- ; -C-N- ; -O-C- ; -NH-C- ;
 -N-C- ; $\text{-O-CH}_2\text{-}$; $\text{-CH}_2\text{-O-}$; $\text{-S-CH}_2\text{-}$; $\text{-S-CH}_2\text{-}$;
 H_3C O O O O
 $\text{-SO}_2\text{-CH}_2\text{-}$; -O- ; -CH=CH- vagy $\text{-CH}_2\text{-CH}_2\text{-}$ képletű csoport,

n értéke 0 vagy 1,

R jelentése alkil-, halogén-alkil-, alkenil-, halogén-alkenil-, adott esetben szubsztituált cikloalkil-, adott esetben szubsztituált aril-, vagy adott esetben szubsztituált heteroarilcsoport, és R jelentése lehet még halogénatom is azokat az eseteket kivéve, amikor $n=0$, és

x^1 , x^2 , x^3 és x^4 jelentése egymástól függetlenül hidrogénatom, halogénatom, hidroxil- vagy metoxicsoport, azzal a megkötéssel, hogy ha x^2 jelentése brómatom, x^3 egyidejűleg nem jelenthet hidroxil- vagy metoxicsoportot.

(421790)

(- II)

szubsztituált
heteroarilcsoport

A találmány szerinti eljárással előállíthatók az előzőekben értelmezett (I) általános képletű vegyületek, valamint ezek egy részének az előállításánál intermediereként alkalmazható, (V) általános képletű vegyületek, ez utóbbi képletben

R^1 hidrogénatomot vagy metilcsoportot jelent,

Ar^2 jelentése (a'') vagy (b'') általános képletű csoport, ezekben a képletekben

Z jelentése hidroxil-, amino- vagy N-metil-amino-csoport,

X^1, X^2, X^3 és X^4 jelentése hidrogén-, halogénatom, hidroxil- vagy metoxics csoport, azzal a megkötéssel, hogy ha X^2 jelentése brómatom, akkor X^3 jelentése hidroxil- vagy metoxics csoporttól eltérő.



1882-91

KÖZZÉTÉTELI
PÉLDÁNY

1000

NSZO⁵:

Képviselő:

DANUBIA SZABADALMI ÉS VÉDJEGY IRODA KFT

Budapest

58690

C 07 C 251/40
C 07 C 323/62
A 01 N 37/50
A 01 N 43/54
A 01 N 37/52
C 07 D 239/60
C 07 D 521/00

Hatanyagként 2-(ny (L-metil-) származékot
~~2-Metoxi-imino)-karbonsavészterek, ilyen vegyületeket tartalmazó~~
~~fungicid készítmény~~ ~~kártevőirtőszerek~~, valamint eljárás a ~~2-metoxi-imino-karbonsav~~
~~észterek~~ előállítására

BAYER AG., Leverkusen, Németország

Feltaláló(k):

KRÄMER Wolfgang, Burscheid,

Prof. Dr. BERG Dieter, Wuppertal,

Dr. DEHNE Heinz-Wilhelm, Monheim,

Dr. DUTZMANN Stefan, Hilden,

Németország

Bejelentés napja: 1991. 06. 14.

Elsőbbsége: 1990. 06. 16. (P 40 19 307.1)

Németország

72410-1174 OE/Hoj

A találmány új, 2-metoxi-imino-karbonsavészterekre, ezek előállítására szolgáló különböző eljárásokra, valamint az új 2-metoxi-imino-karbonsavésztereket hatóanyagként tartalmazó kártevőirtószerre vonatkozik.

Ismert, hogy bizonyos karbonsavészterek, így például a 3-metoxi-2-(2-metil-fenil)-akrilsav-metilészter fungicid hatása (lásd. 178826 számú európai szabadalmi leírás).

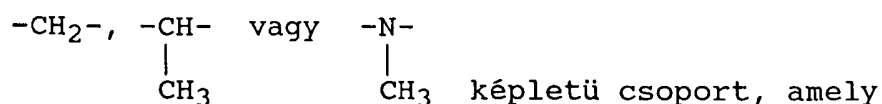
Ezen ismert vegyületek hatásossága azonban, különösen alacsonyabb felhasználási koncentrációknál nem minden területen kielégítő.

Ismertek továbbá bizonyos 2-metoxi-imino-karbonsav észterek is, ezek különböző kártevőkkel szembeni hatásosságáról és ily módon a különböző kártevőirtószerekben való felhasználásukra eddig még nem tettek említést (Tetrahedron Lett. 23, 3699-3702 (1982), Tetrahedron Lett. 22, 3247-3248 (1981), Austral. J. Chem. 34, 745-768 (1981); Tetrahedron Lett. 21, 2277-2280 (1980); J. Chem. Soc., Perkin Trans. 1, 1975, 2340-2348; Experientia 31, 756-757 (1975); J. Chem. Soc., Perkin Trans. 1, 1972, 18-24).

Azt találtuk, hogy az (I) általános képletnek megfelelő új, 2-metoxi-imino-karbonsavészterek kiváló kártevőkkel szembeni hatással rendelkeznek. Az (I) általános képletnek megfelelő vegyületekben

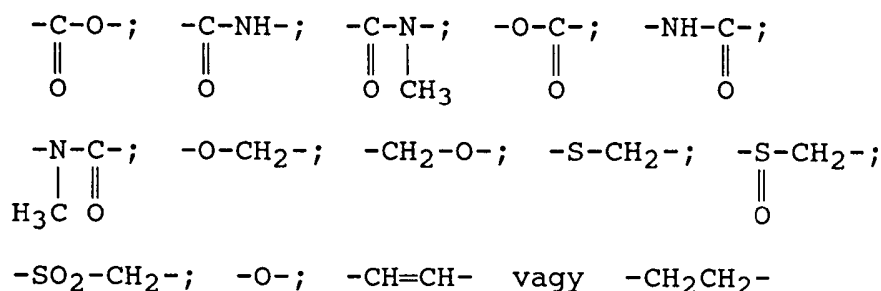
Ar jelentése a, b, c vagy d általános képletű csoport,

A jelentése



képletekben

Y jelentése valamely következő képletnek megfelelő csoport:



n értéke 0 vagy 1,

R jelentése alkil-, halogén-alkil-, alkenil-, halogén-alkenil-, adott esetben szubsztituált cikloalkil-, adott esetben szubsztituált aril-, vagy adott esetben szubsztituált heteroaril-csoport, és R jelentése lehet még halogénatom is azokat az eseteket kivéve, amikor $n=0$, és

X_1 , X_2 , X_3 és X_4 jelentése egymástól függetlenül hidrogénatom, halogénatom, hidroxil- vagy metoxycsoport, azzal a megkötéssel, hogy ha X_2 jelentése brómatom, X_3 egyidejűleg nem jelenthet hidroxil- vagy metoxycsoportot.

Az (I) általános képletű vegyületek geometriai izomerjeik vagy a különböző izomerek keverékének formájában is előfordulhatnak, ennek megfelelően a tiszta izomerek, valamint az izomerkeverékek egyaránt a találmány oltalmi körébe tartoznak.

Az (I) általános képletnek megfelelő új, 2-metoxi-iminokarbonsavésztereket - a képletben Ar és A jelentése a fenti - a

találmány szerinti eljárással úgy állítjuk elő, hogy

a) (Ia) általános képletű 2-metoxi-imino-karbonsavészterek előállítására -

a képletben

R_1 jelentése hidrogénatom, metilcsoport és

Ar jelentése a fenti -

egy (II) általános képletű akrilészter-származékot - a képletben R_1 és Ar jelentése a fenti - O-metil-hidroxil-amin savaddíciós sójával reagáltatjuk adott esetben higítószer, valamint adott esetben reakciót elősegítő szer jelenlétében, vagy

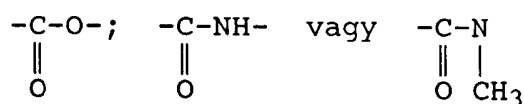
b) (Ib) általános képletű 2-metoxi-imino-karbonsavészterek előállítására - a képletben Ar jelentése a fenti - először egy (III) általános képletű aromás amint - a képletben Ar jelentése a fenti egy (IV) képletű 2-klór-2-hidroximino-ecetsav-metilészterrel reagáltatunk adott esetben higítószer és adott esetben savmegkötőszer jelenlétében, majd ezt követően a kapott vegyületet a hidroximino-csoporton adott esetben savmegkötőszer jelenlétében metilezzük, vagy

c) (Ic) általános képletű 2-metoxi-imino-karbonsavészterek előállítására - a képletben

R_1 jelentése hidrogénatom vagy metilcsoport, és

Ar_1 jelentése a' vagy b' általános képletű csoport, amely képletekben

Y jelentése valamely következő képletű csoport:



x^1 , x^2 , x^3 , x^4 és R jelentése a fenti -
egy (V) általános képletű vegyületet - a képletben
 R_1 jelentése hidrogénatom vagy metilcsoport, és
 Ar_2 jelentése a" vagy b" általános képletű csoport, amely
képletekben

Z jelentése hidrox-, amino- vagy N-metil-amino-
csoport, és

x^1 , x^2 , x^3 , és x^4 jelentése a fenti -
egy (VI) általános képletű savkloriddal - a képletben R
jelentése a fenti - reagáltatunk, adott esetben hígítószer
és adott esetben savmegkötőszer jelenlétében.

A fenti (I) általános képletnek megfelelő 2-metoxi-imino-
-karbonsavészterek különlegesen erős hatásuk különböző kárte-
vőkkel szemben.

Meglepetésszerűen azt találtuk, hogy az (I) általános kép-
letű 2-metoxi-imino-karbonsavészterek jelentősen jobb fungicid
hatásuk, mint a technika állása szerint ismert karbonsavész-
terek, így például mint a 3-metoxi-2-(2-metil-fenil)-akrilsav-
-metilészter, amely kémiailag és hatástanilag is a legközelebb
álló vegyület.

A fentiekben megadott (I) általános képletű vegyületekben
a szubsztituensek jelentése közelebbről a következő:

R jelentése előnyösen egyenes vagy elágazóláncu 1-8 szénato-
mos alkil-, egyenes vagy elágazó láncu 1-8 szénatomos
halogén-alkil-csoport, amely 1-9 azonos vagy különböző ha-
logénatomot tartalmaz, egyenes vagy elágazó láncu 2-8
szénatomos alkenil-, 2-8 szénatomos egyenes vagy elágazó
láncu halogén-alkenil-csoport, amely 1-9 azonos vagy kü-

lőnböző halogénatomot tartalmaz, adott esetben egy vagy többszörösen azonosan vagy különbözően halogénatommal és/vagy egyenes vagy elágzó láncu 1-6 szénatomos alkil-csoporttal szubsztituált 3-7 szénatomos cikloalkilcsoport vagy adott esetben egyszeresen vagy többszörösen azonosan vagy különbözően szubsztituált 2-9 szénatomot és 1-5 azonos vagy különböző heteroatomot - különösen nitrogén-, oxigén- és/vagy kénatomot - tartalmazó heteroaril-csoport, amelynél a szubsztituensek például a következők lehetnek: halogénatom, egyenes vagy elágzó láncu 1-6 szénatomos alkil- vagy alkoxics csoport,

- R jelentése lehet továbbá előnyösen még adott esetben egy vagy többszörösen, azonosan vagy különbözően szubsztituált 6-10 szénatomos arilcsoport, amely arilcsoportnál a szubsztituensek jelentése előnyösen a következő: halogénatom, ciano-, nitro-, 1-6 szénatomos egyenes vagy elágzó láncu alkil-, alkoxi-, alkil-tio-, alkil-szulfinil- vagy alkil-szulfonyl-csoport, egyenes vagy elágzó láncu 2-6 szénatomos alkenil-, alkinil-, alkenil-oxi-, alkinil-oxi-, alkenil-tio- vagy alkinil-tio-csoport, egyenes vagy elágzó láncu 1-6 szénatomot és 1-13 halogénatomot tartalmazó halogén-alkil-, halogén-alkoxi-, halogén-alkil-tio-, halogén-alkil-szulfinil- vagy halogén-alkil-szulfonyl-csoport, 2-6 szénatomot és 1-9 azonos vagy különböző halogénatomot tartalmazó egyenes vagy elágzó láncu halogén-alkenil-, halogén-alkinil-, halogén-alkenil-oxi-, halogén-alkinil-oxi-, halogén-alkenil-tio- vagy halogén-alkinil-tio-csoport, az alkilcsoporton 1-6 szénatomot tartalmazó

egyenes vagy elágazó láncu alkil-karbonil-, alkoxi-karbonil-, alkil-karbonil-oxi-, alkil-karbonil-amino-, alkil-karbonil-(N-alkil)-amino-, amino-karbonil-, N-alkil-amino-karbonil-, N,N-dialkil-amino-karbonil- vagy alkoxi-imino-alkil-csoport, adott esetben egyszresen vagy többszörösen, azonosan vagy különbözően szubsztituált 6-10 szénatomos aril-, aril-oxi-, aril-tio-, aril-karbonil-, aril-karbonil-oxi-, aril-karbonil-amino-, aril-karbonil-(N-1-6 szénatomos alkil)-amino-, aril-amino-karbonil-, N-aril-N-1-6 szénatomos alkil-amino-karbonil-, aril-1-6 szénatomos alkil- vagy aril-2-6 szénatomos alkenil-csoport, amely csoportoknál szubsztituensként az aril-csoporton a következő csoportok lehetnek jelen: halogénatom, ciano-, nitro-, 1-6 szénatomos egyenes vagy elágazó láncu alkil-, alkoxi-, alkil-tio-, alkil-szulfinil- vagy alkil-szulfonil-csoport, egyenes vagy elágazó láncu 2-6 szénatomos alkenil-, alkinil-, alkenil-oxi-, alkinil-oxi-, alkenil-tio- vagy alkinil-tio-csoport, egyenes vagy elágazó láncu 1-6 szénatomot és 1-13 azonos vagy különböző halogénatomot tartalmazó halogén-alkil-, halogén-alkoxi-, halogén-alkil-tio-, halogén-alkil-szulfinil-, halogén-alkil-szulfonil-csoport, egyenes vagy elágazó láncu 2-6 szénatomot és 2-9 azonos vagy különböző halogénatomot tartalmazó halogén-alkenil-, halogén-alkinil-, halogén-alkenil-oxi-, halogén-alkinil-oxi-, halogén-alkenil-tio- vagy halogén-alkinil-tio-csoport, egyenes vagy elágazó láncu az egyes alkilcsoportokban 1-6 szénatomot tartalmazó alkil-karbonil-, alkoxi-karbonil-,

alkilkarbonil-oxi-, alkil-karbonil-amino-, alkil-karbonil-(N-alkil-amino)-, amino-karbonil-, N-alkil-amino-karbonil-, N,N-dialkil-amino-karbonil- vagy alkoxi-imino-alkil-csoport, 6-10 szénatomos és adott esetben azon egyszeres vagy többszörösen azonosan vagy különbözően szubsztituált aril-, aril-oxi-, aril-tio-, aril-karbonil-, aril-karbonil-oxi-, aril-karbonil-amino-, aril-karbonil-(N-1-6 szénatomos alkil)-amino-, aril-amino-karbonil-, N-aril-N-1-6 szénatomos alkil-amino-karbonil-, aril-1-6 szénatomos alkil- vagy aril-2-6 szénatomos alkenil-csoport, amely arilcsoportok valamely következő szubsztituenssel lehetnek szubsztituálva: halogénatom, vagy 1-6 szénatomos egyenes vagy elágazó láncu alkil- vagy alkoxics csoport,

R jelentése előnyösen lehet továbbá még abban az esetben, ha $n=0$, fluor-, klór-, bróm- vagy jódatom.

Különösen előnyösek azok az (I) általános képletű vegyületek, amelyek képletében

R jelentése egyenes vagy elágazó láncu 1-6 szénatomos alkilcsoport, 1-6 szénatomos és 1-9 azonos vagy különböző halogénatomot tartalmazó egyenes vagy elágazó láncu halogén-alkil-csoport, egyenes vagy elágazó láncu 2-6 szénatomos alkenilcsoport, egyenes vagy elágazó 2-6 szénatomot és 1-9 azonos vagy különböző halogénatomot tartalmazó halogén-alkenil-csoport, 3-7 szénatomos és adott esetben 1-5-szörösen azonos vagy különböző 1-4 szénatomos egyenes vagy elágazó láncu alkilcsoporttal és/vagy halogénatommal szubsztituált cikloalkilcsoport,

adott esetben 1-3-szorosan azonosan vagy különbözően szubsztituált 2-9 szénatomot és 1-4 azonos vagy különböző heteroatomot - előnyösen nitrogén-, oxigén- és/vagy kénatomot - tartalmazó heteroaril-csoport, amely heteroaril-csoporton a szubsztituensek jelentése valamely következő csoport: fluor-, klór- vagy brómatom, egyenes vagy elágazó láncu 1-4 szénatomos alkil- vagy alkoxics csoport, jelentése lehet továbbá még adott esetben 1-5-szörösen azonosan vagy különbözően szubsztituált 6-10 szénatomos arilcsoport, amely arilcsoport szubsztituensei a következők lehetnek: fluor-, klór-, vagy brómatom, ciano- vagy nitrocsoport, egyenes vagy elágazó láncu 1-4 szénatomos alkil-, alkoxi-, alkil-tio-, alkil-szulfonil- vagy alkil-szulfonil-csoport, egyenes vagy elágazó láncu 2-4 szénatomos alkenil-, alkenil-oxi-, alkinil-oxi-, alkenil-tio- vagy alkinil-tio-csoport, egyenes vagy elágazó láncu 1-4 szénatomos és 1-9 azonos vagy különböző halogénatomot tartalmazó halogén-alkenil-, halogén-alkinil-, halogén-alkenil-oxi-, halogén-alkinil-oxi-, halogén-alkenil-tio- vagy halogén-alkinil-tio-csoport, az alkilcsoportokban 1-4 szénatomot tartalmazó alkil-karbonil-, alkoxi-karbonil-, alkil-karbonil-oxi-, alkil-karbonil-amino-, alkil-karbonil-(N-alkil)-amino-, amino-karbonil-, N-alkil-amino-karbonil-, N,N-dialkil-amino-karbonil- vagy alkoxi-imino-alkil-csoport, adott esetben egy vagy többszörösen azonosan vagy különbözően szubsztituált 6-10 szénatomos aril-, aril-oxi-, aril-tio-, aril-karbonil-, aril-karbonil-oxi-, aril-karbonil-amino-, aril-

-karbonil-(N-1-4 szénatomos alkil)-amino-, aril-amino-
 -karbonil-, N-aril-N-1-4 szénatomos alkil-amino-karbonil-,
 aril-1-4 szénatomos alkil- vagy aril-2-4 szénatomos
 alkenil-csoport, amely csoportokban az arilcsoport
 valamely következő szubsztituenssel lehet szubsztituálva:
 fluro-, klór-, brómatom, ciano- vagy nitrocsoport, egyenes
 vagy elágazó láncu 1-4 szénatomos alkil-, alkoxi-, alkil-
 -tio-, alkil-szulfinil- vagy alkil-szulfonil-csoport,
 egyenes vagy elágazó láncu 2-4 szénatomos alkenil-,
 alkinil-, alkenil-oxi-, alkinil-oxi-, alkenil-tio- vagy
 alkinil-tio-csoport, egyenes vagy elágazó láncu 1-4
 szénatomot és 1-9 azonos vagy különböző halogénatomot tar-
 talmazó halogén-alkil-, halogén-alkoxi-, halogén-alkil-
 -tio-, halogén-alkil-szulfinil- vagy halogén-alkil-szul-
 fonil-csoport, egyenes vagy elágazó láncu 2-4 szénatomot
 és 1-7 azonos vagy különböző halogénatomot tartalmazó
 halogén-alkenil-, halogén-alkinil-, halogén-alkenil-oxi-,
 -halogén-alkinil-oxi-, halogén-alkenil-tio- vagy halogén-
 -alkinil-tio-csoport, egyenes vagy elágazó láncu az alkil-
 csoporton 1-4 szénatomot tartalmazó alkil-karbonil-,
 alkoxi-karbonil-, alkil-karbonil-oxi-, alkil-karbonil-
 -amino-, alkil-karbonil-(N-1-4 szénatomos alkil)-amino-,
 amino-karbonil-, N-alkil-amino-karbonil-, N,N-dialkil-
 -amino-karbonil- vagy akoxi-imino-alkil-csoport, adott
 esetben egy vagy többszörösen azonosan vagy különbözően
 szubsztituált 6-10 szénatomos aril-, aril-oxi-, aril-tio-,
 aril-karbonil-, aril-karbonil-oxi-, aril-karbonil-amino-,
 aril-(-N-1-4 szénatomos alkil)-amino-, aril-amino-

-krabonil-, N-aril-N-1-4 szénatomos alkil-amino-karbonil-, aril-1-4 szénatomos alkil- vagy aril-2-4 szénatomos alkenil-csoport és az arilcsoporton a következő szubsztituensek lehetnek: fluoro-, klór- vagy brómatom, 1-4 szénatomos alkil- vagy alkoxics csoport,

R jelentése lehet még továbbá abban az esetben ha $n=0$ klór- vagy brómatom is.

Az (I) általános képletű vegyületekben X_1 , X_2 , X_3 és X_4 jelentése egymástól függetlenül előnyösen hidrogénatom, fluor-, klór-, bróm- vagy jódatom, vagy metoxics csoport, azzal a megkövetéssel, hogy ha X_2 jelentése brómatom, X_3 egyidejűleg nem lehet hidroxil vagy metoxics csoport.

Különösen előnyös vegyületeknél X_1 , X_2 , X_3 és X_4 jelentése egymástól függetlenül hidrogénatom, klór- vagy brómatom, hidroxil- vagy metoxics csoport, és abban az esetben, ha X_2 brómatomot jelent, X_3 nem lehet egyidejűleg hidroxil- vagy metoxics csoport.

Előnyösek azok az (I) általános képletű vegyületek, amelyek képletében Ar jelentése (b) általános képletű csoport, amely képletben R, Y, n, X_1 , X_2 , X_3 és X_4 jelentése a fenti.

A találmány szerinti eljárásnál, ha például kiindulási vegyületként 2-acetamido-3-[3-(4-klór-fenil)-fenil]-akrilsav-metilésztert és O-metil-hidroxil-amin-hidrokloridot alkalmazunk, akkor az a) eljárásváltozat szerinti reakció lefutása a A reakcióvázlaton látható.

Ha kiindulási anyagként a találmány szerinti b) eljárásnál például 2-klór-2-hidroxil-imino-ecetsav-metilésztert és N-metil-3-trifluor-metil-anilint, valamint metilezőszerként dimetil-

-szulfátot alkalmazunk, a reakció lefutása a B reakcióvázlat szerinti.

Ha a találmány szerinti c) eljárásnál kiindulási anyagként például 3-(3-hidroxi-fenil)-2-metoxi-imino-propionsav-metil-észtert és 3-klór-benzoil-kloridot alkalmazunk, a reakció lefutása a C reakcióvázlat szerinti.

A találmány szerinti a) eljárásnál felhasználásra kerülő akrilészter-származékokat a (II) általános képlettel írjuk le, amely képletben Ar jelentése előnyösen azonos az (I) általános képletű vegyületeknél előnyösként megadott jelentésekkel.

R jelentése előnyösen hidrogénatom vagy metilcsoport. A (II) általános képletű akrilészter-származékok ismertek (lásd pl. Synthesis 1989, 414-418; Jpn Kokai Tokkyo Koho JP 61218558; J. Labelled Comp. Radopharm. 21, 263-284 (1984); Liebigs Ann. Chem. 1984, 1205-1215), vagy ismert eljárásokkal analóg módon előállíthatók (lásd pl. Organic Reactions III. kötet, Azlactones S. 198-239), például oly módon, hogy egy (VII) általános képletű aromás aldehidet vagy ketont - a képletben R_1 és Ar jelentése a fenti - N-acetil-glicinnel reagáltatunk ecetsavanhidrid és nátrium-acetát, valamint adott esetben ecetsav jelenlétében 20 és 160°C közötti hőmérsékleten, majd egy következő lépésben az így kapott (VIII) általános képletű azlakton-vegyületet - a képletben R_1 és Ar jelentése a fenti - metanolban, adott esetben bázis, így például nátrium-hidroxid vagy nátrium-metilát jelenlétében 0-50°C közötti hőmérsékleten átalakítjuk.

A (VII) általános képletű aromás aldehidek és ketonok a szerves kémia általánosan ismert vegyületei, vagy ezeket ismert

eljárásokkal analóg módon előállíthatjuk.

A találmány szerinti b) eljárásnál kiindulási anyagként szükséges aromás aminokat a (III) általános képlettel írjuk le, amely képletben Ar jelentése előnyösen azonos a fentiekben az (I) általános képletű vegyületekkel kapcsolatban előnyösként megjelölt jelentésekkel.

A (III) általános képletű aromás aminok a szerves kémia ismert vegyületei.

A találmány szerinti b) eljárásnál kiindulási anyagként szintén szükséges 2-klór-2-hidroxi-imino-ecetsav-metilésztert a (IV) képlettel írjuk le, amely vegyület szintén ismert (lásd 19 63 061 számú német és 3 584 032 számú amerikai egyesült államokbeli szabadalmi leírás).

A találmány szerinti c) eljárásnál kiindulási anyagként szükséges fenol- és anilin-származékokat (V) általános képlettel írjuk le, amely képletben R_1 jelentése előnyösen hidrogénatom vagy metilcsoport és Ar^2 jelentése (a") vagy (b"), amely képletekben

Z jelentése hidroxi-, amino- vagy N-metil-amino-csoport és X_1 , X_2 , X_3 és X_4 jelentése előnyösen valamely olyan csoport, amelyet a fentiekben az (I) általános képletű vegyületeknél ezekre a szubsztituensekre előnyösként megjelöltünk.

A (V) általános képletű szubsztituált fenol- és anilin-származékok új vegyületek és szintén a találmány oltalmi körébe tartoznak.

A (V) általános képletű vegyületeket úgy állítjuk elő, hogy egy (IX) általános képletű azlaktón-vegyületet - a képletben

R_1 jelentése a fenti és

Ar^3 jelentése (a_1) vagy (b_1) általános képletű csoport, amely képletekben

Z^1 jelentése oxigénatom, vagy $NH-$ vagy $-N$

|

CH_3 -csoport, és

X_1, X_2, X_3 és X_4 jelentése a fenti -

metanollal kezelünk bázis, így például nátrium-hidroxid, ezt követően sav, előnyösen sósav jelenlétében $0-50^\circ C$ közötti hőmérsékleten, majd ezt követően a kapott (X) általános képletű vegyületet - a képletben

R_1 jelentése a fenti és

Ar_2 jelentése (a'') vagy (b'') általános képletű csoport, amely képletekben

Z jelentése hidroxil-, amino- vagy N-metil-amino-csoport, és

X_1, X_2, X_3 és X_4 jelentése a fenti -

O-metil-hidroxil-amin savaddíciós sójával, előnyösen O-metil-hidroxil-amin-hidrokloriddal reagáltatunk adott esetben higítószer, előnyösen metanol, és adott esetben reakció lefutást elősegítő szer, előnyösen kénsav jelenlétében $20-60^\circ C$ közötti hőmérsékleten, az előzőekben ismertetett a) eljárás szerint.

A (IX) általános képletű azlakton-vegyület ismertek (lásd (Takeda Kenkyushoho 43, 53-76 (1984); Izv, Akad. Nauk SSSR, Ser. Khim. 1984, 1090-1094; Izv. Akad. Nauk SSSR, Ser. Khim. 1980, 823-829; Tetrahedron Lett. 1979, 737-740; Bull. Soc. Chim. Belg. 83, (3/4), 117-132 (1974), továbbá 22 43 665

számu német, 715588 számu belga, valamint a ZA 6803 083 számu szabadalmi leírások), vagy ismert eljárásokkal analóg módon előállíthatók (Organic Reactions III. kötet, Azlactones, S. 108-239).

A találmány szerinti c) eljárásnál kiindulási anyagként felhasznált savkloridokat a (VI) általános képlettel írjuk le, amely képletben R jelentése előnyösen azonos az előzőekben az (I) általános képletnél megadott előnyös jelentésekkel.

A (VI) általános képletű vegyületek ismert vegyületei a szerves kémiának.

A találmány szerinti a) eljárásnál hígítószerként általában poláros szerves oldószereket vagy vizes rendszereket alkalmazunk. Így például felhasználhatók a következők: alkoholok, például metanol, etanol, vagy propanol, vagy ezek vízzel alkotott keveréke, továbbá tiszta víz is alkalmazható hígítószerként.

A találmány szerinti a) eljárásánál a reakció lefutást elősegítő szerként például erős ásványi savak, így például sósav, hidrogén-bromid vagy kénsav alkalmazhatók.

A találmány szerinti a) eljárásnál a reakcióhőmérséklet széles határok között mozoghat, általában 0 és 120°, előnyösen 20 és 60°C közötti hőmérsékleten dolgozunk.

A találmány szerinti a) eljárásnál 1 mól (II) általános képletű akrilészter-származéokra számolva általában 1-3 mól, előnyösen 1-1,5 mól O-metil-hidroxil-amin és adott esetben 1-3 mól, előnyösen 1-1,5 mól reakció lefutást elősegítő szert alkalmazunk.

A reakció lefutás, valamint a kapott reakciótermék feldol-

gozása és izolálása általánosan ismert módszerek szerint történik (lásd például az előállítási példákat is).

A találmány szerinti b) eljárásnál az első, valamint a második lépésnél is hígítószerként általában inert szerves oldószereket, így például a következőket alkalmazzuk: alifás, alikiklusos vagy aromás, adott esetben halogénezett szénhidrogének, így például benzin, benzol, toluol, xilol, klór-benzol, petroléter, hexán, ciklohexán, diklór-metán, tetraklór-etán, kloroform, szén-tetraklorid, éterek, így például dietil-éter, dioxán, tetrahydrofurán, vagy etilénglikol-dimetil- vagy dietil-éter, ketonok, így például aceton vagy butanon, nitrilek, így például acetonitril, vagy propionitril, amidok, így például dimetil-formamid, dimetil-acetamid, N-metil-formanilid, N-metil-pirrolidon, vagy hexametil-foszforsav-triamid, észterek, így például ecetsav-etilészter, vagy szulfoxidok, így például dimetil-szulfoxid.

A találmány szerinti b) eljárásnál adott esetben savmegkötőszereket is alkalmazunk. Erre a célra a reakció első, valamint második lépésénél egyaránt például szervetlen vagy szerves bázisokat alkalmazhatunk, így például valamely következő vegyületet: alkálifém-hidridek-, -hidroxidok, -amidok, -alkoholátok, -karbonátok, vagy -hidrogén-karbonátok, így például nátrium-hidrid, nátrium-amid, nátrium-hidroxid, nátrium-metilát, nátrium-etilát, kálium-terc-butilát, nátrium-karbonát vagy nátrium-hidrogén-karbonát, továbbá tercieraminok, így például trietil-amin, N,N-dimetil-anilin, piridin, N,N-dimetil-amino-piridin, diazabiciklo-oktán (DABCO), diazabiciklo-nonén, (DBN) vagy diazabiciklo-undecén (DBU). A találmány szerinti b)

eljárásnál a reakció első lépésénél a reakcióhőmérséklet széles határok között változhat, így például -20° és $+100^{\circ}\text{C}$, előnyösen 0 és 80°C közötti hőmérsékleten dolgozunk.

A találmány szerinti b) eljárás első lépésben 1 mól aromás aminoszármazékra számolva általában $1-1,5$ mól, előnyösen $1-1,2$ mól (IV) általános képletű 2-klór-2-hidroximino-ecetsav-metilészter és adott esetben $1-1,5$, előnyösen $1-1,2$ mól savmegkötőszert alkalmazunk. A reakcióvezetést, valamint a kapott termék feldolgozását és izolálását általában ismert módszerek szerint végezzük.

A találmány szerinti b) eljárás második lépésénél metilezőszerként általában ismert metilezőszereket alkalmazunk, így például valamely következő vegyületet: dimetil-szulfát, p-toluol-szulfonsav-metilészter, metil-jodid, vagy metil-bromid, előnyösen dimetil-szulfátot alkalmazunk.

A találmány szerinti b) eljárás második lépésénél a reakcióhőmérséklet széles határok között változhat, általában -20 és $+100^{\circ}\text{C}$, előnyösen 0 és 80°C közötti hőmérsékleten dolgozunk.

A találmány szerinti b) eljárás második lépésénél 1 mól hidroximino-kiindulási vegyületre számolva általában $1-1,5$ mól, előnyösen $1-1,2$ mól metilezőszert, és adott esetben $1-1,5$ mól, előnyösen $1-1,2$ mól savmegkötőszert alkalmazunk.

A reakcióvezetést, valamint a kapott termék feldolgozását és izolálását általában ismert módszerek szerint végezzük (lásd például az előállítási példákat is).

A találmány szerinti c) eljárásnál hígítószerként általában inert szerves oldószereket alkalmazunk, így például a kö-

vetkezőket: alifás, aliciklusos, vagy aromás, adott esetben halogénezett szénhidrogének, így például benzil, benzol, toluol, xilol, klór-benzol, pertoléter, hexán, ciklohexán, diklór-metán, kloroform, szén-tetraklorid, éterek, így például dietil-éter, dioxán, tetrahidrofurán, vagy etilénglikol-dimetil- vagy dietil-éter, ketonok, így például acetón, butanon, nitrilek, így például acetonitril vagy propionitril, amidok, így például dimetil-formamid, dimetil-acetamid, N-metil-formanilid, N-metil-pirrolidon vagy hexametil-foszforsav-triamid, észterek, így például ecetsav-etilészter, vagy szulfoxid, így például dimetil-szulfoxid.

A találmány szerinti c) eljárást előnyösen alkalmas savmegkötőszert jelenlétében végezzük. Erre a célra általában ismert szervetlen vagy szerves bázisokat, így például a következő vegyületeket alkalmazhatjuk: alkálifém-hidroxidok, így például nátrium- vagy kálium-hidroxid, alkálifém-karbonátok, így például nátrium- vagy kálium-karbonát, vagy nátrium-hidrogén-karbonát, továbbá tercieraminok, így például trietil-amin, N,N-dimetil-anilin, piridin, N,N-dimetil-amino-piridin, diazabiciklo-oktán (DABCO), diazabiciklo-nonén, (DBN) vagy diazabiciklo-undecén (DBU).

A találmány szerinti c) eljárásnál a reakcióhőmérséklet széles határok között váltokozhat, általában -20° és $+100^{\circ}\text{C}$, előnyösen 0 és 60°C közötti hőmérsékleten dolgozunk.

A találmány szerinti c) eljárásnál 1 mól fenol- vagy anilin-származékra számolva általában 1-1,5 mól, előnyösen 1-1,2 mól (VI) általános képletű savkloridot és adott esetben 1-1,5 mól, előnyösen 1,2 mól savmegkötőszert alkalmazunk.

A reakcióvezetést, valamint a kapott termék feldolgozását és izolálását általában ismert módszerek szerint végezzük (lásd például az előállítási példákat).

A találmány szerinti hatóanyagok igen erős kártevőirtó hatással rendelkeznek és ily módon felhasználhatók nemkívánatos káros organizmusok elpusztítására. A hatóanyagokat elsősorban növényvédőszerként, különösen fungicidként alkalmazzuk.

A találmány szerinti fungicid készítmények a növényvédelemben a következő kártevők ellen alkalmazhatók:

Plasmodiophoromycetes, Oomycetes, Chytridiomycetes, Zygomycetes, Ascomycetes, Basidiomycetes, Deuteromycetes.

A korlátozás szándéka nélkül a következőkben megemlítünk néhány gombás megbetegedést előidéző kártevőt, amelyek a fentiekben említett mikrororganizmusok közé tartoznak:

Pythium-fajok, így például *Pythium ultimum*,

Phytophthora-fajok, így például *Phytophthora infestans*;

Pseudoperonospora-fajok, így például *Pseudoperonospora humuli* vagy *Pseudoperonosporacubensis*;

Plasmopara-fajok, így például *Plasmopara viticola*;

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

Erysiphe-fajok, így például *Erysiphe graminis*;

Sphaerotheca-fajok, így például *Sphaerotheca fuliginea*;

Podosphaera-fajok, így például *Podosphaera leucotricha*;

Venturia-fajok, így például *Venturiainaequalis*;

Pyrenophora-fajok, így például *Pyrenophorateres* vagy *P. graminea*

(Konidienforma: *Drechslera*, Syn: *Helminthosporium*);

Cochliobolus-fajok, így például *Cochliobolus sativus*
(Konidienforma: *Drechslera*, Syn: *Helminthosporium*);
Uromyces-fajok, így például *Uromyces appendiculatus*;
Puccinia-fajok, így például *Puccinia recondita*;
Tilletia-fajok, így például *Tilletia caries*;
Ustilago-fajok, így például *Ustilago nuda* vagy *Ustilago avenae*;
Pellicularia-fajok, így például *Pellicularia sasakii*;
Pyricularia-fajok, így például *Pyricularia oryzae*;
Fusarium-fajok, így például *Fusarium culmorum*;
Botrytis-fajok, így például *Botrytis cinerea*;
Septoria-fajok, így például *Septoria nodorum*;
Leptosphaeria-fajok, így például *Leptosphaeria nodorum*;
Cercospora-fajok, így például *Cercospora canescens*;
Alternaria-fajok, így például *Alternaria brassicae*;
Pseudocercospora-fajok, így például *Pseudocercospora herpotrichoides*.

A találmány szerinti hatóanyagok jó növényi elviselhetősége lehetővé teszi, hogy a hatóanyagokat a különböző növénybetegségek leküzdésére szükséges koncentrációban a föld feletti növényi részekben, a palántákon és a vetőmagokon, valamint a talajon egyaránt alkalmazzuk.

A találmány szerinti hatóanyagok különösen jó eredménnyel alkalmazhatók gabona betegségeket előidéző kártevők ellen, így pl. árpánál vagy búzánál *Erysiphe graminis*, vagy árpánál *Pyrenophora teres*, vagy árpánál vagy búzánál *Cochliobolus sativus* vagy búzánál *Leptosphaeria nodurum* vagy *Fusarium nivale* ellen, továbbá különböző rozsbetegségek, így például

Pyricularia oryzae vagy különböző, gyümölcsösökben és zöldségekben előforduló betegségek, így pl. *Venturia inaequalis* esetében.

A találmány szerinti készítmények függően, a bennük alkalmazott hatóanyagtól, illetve a fizikai és/vagy kémiai tulajdonságaiktól, lehetnek például oldatok, emulziók, szuszpenziók, porok, habok, paszták, granulátumok, aeroszolok, polimer anyagu finomkapszulák, valamint különböző burkolt készítmények, továbbá lehetnek ULV-hideg- és meleg-ködkészítmények.

Ezeket a készítményeket ismert módon állítjuk elő, például oly módon, hogy a hatóanyagot a hordozó vagy szaporítóanyaggal, így például folyékony oldószerrel, nyomás alatt álló cseppfolyósított gázokkal és/vagy szilárd hordozóanyaggal, adott esetben felületaktív anyagokkal, így például emulgeáló és/vagy diszpergáló és/vagy habképzőszerekkel elkeverjük. Amennyiben hordozóanyagként vagy szaporítószerként vizet alkalmazunk, a víz mellett társoldószerként különböző szerves oldószerek is felhasználhatók. Folyékony oldószerként például a következőket alkalmazhatjuk: aromás szénhidrogének, így például xilol, toluol vagy alkil-naftalin, klórozott aromások, vagy klórozott alifás szénhidrogének, így például klór-benzol, klór-etilén vagy metilén-klorid, alifás szénhidrogének, így például ciklohexán vagy paraffinok, például különböző földgázfrakciók, alkoholok, így például butanol vagy glicerin, továbbá ezek étereai és észtereai, ketonok, így például aceton, metil-etil-keton, metil-izobutil-keton vagy ciklohexanon, erősen poláros oldószerek, így például dimetil-formamid, vagy dimetil-szulfoxid, továbbá víz; cseppfolyós, gázformájú hordozóanyagokon általában

olyan folyadékokat értünk, amelyek normál hőmérsékleten és normál nyomáson gázformájúak, ilyenek például az aeroszol-vivő-gázok, mint például a halogén-szénhidrogének, például bután, propán, továbbá nitrogén vagy szén-dioxid; szilárd hordozóanyagként például a következőket alkalmazhatjuk: természetes közetlisztek, így például kaolin, agyag, talkum, kréta, kvarcliszt, attapulgit, montmorillonit, vagy diatomaföld, továbbá szintetikus közetlisztek, így például nagy diszperzitású kovács, alumínium-oxid, vagy szilikátok; szilárd hordozóanyagok céljára granulátumként például a következők is alkalmazhatók: frakcionált természetes közetlisztek, így például kalcit, márvány, bárium-szulfát, szepiolit, dolomit, valamint szevetlen és szerves őrleményekből készült granulátumok, továbbá különböző szerves anyagokból, így például fűrészporból, kókuszdióhéjból, kukoricaszárból, vagy dohányszárból készült őrlemények; emulgeáló és/vagy habképzőszerként például a következők alkalmazhatók: például nemionos vagy anionos emulgeátorok, így például poli(etilén-oxi)-zsírsav-észterek, poli(etilén-oxi)-zsíralkohol-éterek, így például alkil-aril-poliglikoléter, alkil-szulfonátok, alkil-szulfátok, aril-szulfonátok, továbbá fehérje hidrolizátumok; diszpergálószerként például a következők alkalmazhatók: ligin-szennyvíz, valamint metil-cellulóz.

A találmány szeritni készítményeknél tapadást elősegítőszerként például a következők alkalmazhatók: karboxi-metil-cellulóz, természetes és szintetikus porított, szemcsés vagy latex formájú polimerek, így például gumi-arábikum, poli(vinil-alkohol), poli(vinil-acetát), továbbá természetes foszfolipi-

A növényi részek kezelésénél a hatóanyag koncentráció a különböző felhasználási formáktól függően széles határok között



változhat, a dózis általában 1-0,0001 tömeg%, előnyösen 0,5-0,001 tömeg%.

A vetőmag kezeléseknél általában 0,001-50 g hatóanyagot, előnyösen 0,01-10 g hatóanyagot alkalmazunk 1 kg vetőmagra.

A talajkezelésnél a hatóanyag koncentráció általában 0,00001-0,1 tömeg%, előnyösen 0,00001-0,02 tömeg% a felhasználás helyén.

Előállítási példák

1. példa

(1 képletű vegyület, a) eljárás)

130 g (0,395 mól) 2-acetamido-3-[3-(4-klór-fenil)-fenil]-akrilsav-metilésztert 500 ml metanolban szuszpendálunk hozzáadunk 36 g (0,435 mól) O-metil-hidroxil-amin-hidrokloridot és 43,5 ml (0,435 mól) koncentrált sósavat, a kapott keveréket 38 órán át visszafolyatás közben melegítjük, majd vákuumban betöményítjük, a visszamaradó anyagot 1 l diklór-metánban oldjuk, háromszor 500-500 ml vízzel mossuk, nátrium-szulfáton szárítjuk az oldószert vákuumban eltávolítjuk, és a visszamaradó anyagot kromatografáljuk (szilikagél, diklór-metán). Ily módon 104, 2 g (83%) cím szerinti 3-[3-(4-klór-fenil)-fenil]-2-metoxi-imino-propionsav-metilésztert nyerünk olajos anyag formájában, törésmutató $n_D^{23}=1,5919$.

Kiindulási anyagok előállítása

II-I példa

(2 képletű vegyület)

130 g (0,437 mól) 4-[3-(4-klór-fenil)-benzilidén]-2-metil-1,3-oxazolin-5-on-t 500 ml metanolban szuszpendálunk, hozzáadunk 1,7 ml (0,022 mól) 50%-os vizes nátrium-hidroxidot és 18

órán át 20°C hőmérsékleten keverjük. Ezután a kivált csapadékot leszivatjuk, 200 ml dietil-éterrel mossuk, majd szárítjuk. Ily módon 130 g (90%) 2-acetamid-3-[3-(4-klór-fenil)-fenil]-akril-sav-metilésztert nyerünk, op: 168°C

VIII-I példa

(3 képletű vegyület)

179 g (0,827 mól) 3-(4-klór-fenil)-benzaldehydet 1 l ecet-savanhidridben szuszpendálunk, hozzáadunk 117,1 g (1 mól) N-acetil-glicint és 80 g (1 mól) nátrium-acetátot és a kapott keveréket 18 órán át 130°C hőmérsékleten keverjük. A kapott termék kinyeréséhez az oldószert vizsugár szivattyú-vákuumban ledesztilláljuk, a visszamaradó anyagot 2 l diklór-metánban oldjuk, háromszor 1-1 l vízzel mossuk, nátrium-szulfáton szárítjuk és vákuumban betöményítjük. A visszamaradó anyagot 300 ml acetonitrillel elkeverve kikristályosítjuk, majd leszivatjuk és szárítjuk. Ily módon 115,9 g (47%) 4-[3-(4-klór-fenil)-benzilidén]-2-metil-1,3-oxazolin-5-ont nyerünk, op. 150°C.

2. példa

(4 képletű vegyület, b) eljárás)

0,5 g (0,0018 mól) 2-(hidroxí-imino)-2-[N-metil-N-(3-trifluor-metil-fenil)-amino]-ecetsav-metilésztert elkeverünk 30 ml tetrahidrofuránnal, hozzáadunk 0,3 g (0,0018 mól) kálium-karbonátot és 0,2 ml (0,0018 mól) dimetil-szulfátot, a keveréket 16 órán át 20°-on keverjük, majd a kivált csapadékot leszivatjuk, a szűrletet vizsugár vákuumban betöményítjük, a visszamaradó anyagot kromatografáljuk (szilikagél, toluol/ecetsav-etilészter =1/1). Ily módon 0,5 g (100%) 2-metoxi-imino-2-[N-metil-N-(3-

-trifluor-metil-fenil)-amino]-ecetsav-metilésztert nyerünk olajos anyag formájában.

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 /tetrametil-szilán):

$\delta = 4,12$ (3H,s); $3,66$ (3H,s); $3,22$ (3H,s)ppm

Kiindulási anyag előállítása

(5 képletű vegyület)

6,8 g (0,039 mól) N-metil-3-trifluor-metil-anilint elkeverünk 50 ml toluolban, hozzáadunk 5,4 ml (0,039 mól) trietil-amint, majd 5°C hőmérsékleten keverés közben cseppenként 17 g toluolban oldott 5,4 g (0,039 mól) 2-klór-2-hidroximino-ecetsav-metilésztert. A kapott keveréket 16 órán át szobahőmérsékleten állni hagyjuk, majd kétszer 50-50 ml vízzel mossuk, nátrium-szulfáton szárítjuk, vákuumban betöményítjük és a visszamaradó anyagot szilikagélen kromatografáljuk (toluol/ecetsav-etilészter=1/1). Ily módon 0,5 g (4,6%) 2-hidroximino-2-[N-metil-N-(3-trifluor-metil-fenil)-amino]-ecetsav-metilésztert nyerünk, op. 131°C .

3. példa

(6 képletű vegyület, c) eljárás)

4,4 g (0,02 mól) 3-(3-hidroxikfenil)-2-metoxi-imino-propionsav-metilésztert és 2,8 ml (0,02 mól) trietil-amint elkeverünk 20 ml ecetsav-etilészterben és cseppenként hozzáadagolunk 5 perc leforgása alatt szobahőmérsékleten 3,5 g (0,02 mól) 3-klór-benzoil-kloridot 10 ml ecetsav-etilészterben oldva, miközben a hőmérsékleten 30°C -ra emelkedik. A kapott keveréket szobahőmérsékleten 1 órán át keverjük, majd kétszer 100-100 ml vízzel mossuk, nátrium-szulfáton szárítjuk, vákuumban betöményítjük, és a visszamaradó anyagot 20 ml N-hexánnal elkeverve

kristályosítjuk, majd leszivatjuk és szárítjuk. Ily módon 5,2 g (72%) 3-[3-(3-klór-benzoil-oxi)-fenil]-2-metoxi-imino-propionsav-metilésztert nyerünk, op: 65°C.

Kiindulási vegyület előállítása

VI-I példa

(7 képletű vegyület)

142,9 g (0,61 mól) 3-(3-hidroxi-fenil)-2-acetamido-akrilsav-metilésztert elkeverünk 600 ml metanollal és hozzáadunk 50,6 g (0,61 mól) O-metil-hidroxiil-amin-hidrokloridot, majd cseppenként keverés közben 61 g (0,61 mól) koncentrált kénsavat miközben a hőmérséklet 35°C-ra emelkedik. A kapott keveréket 30 percen át szobahőmérsékleten keverjük, majd ezt követően 18 órán át visszafolyatási hőmérsékleten melegítjük. Ezután a keverékből az oldószert vizsugár vákuummal ledesztilláljuk, a visszamaradó anyagot 600 ml diklór-metánban oldjuk, kétszer 300-300 ml vízzel mossuk, nátrium-szulfáton szárítjuk, vákuumban betöményítjük és a visszamaradó anyagot kromatografáljuk (szilikagél, diklór-metán/metanol=100/2,5), majd a kapott anyagot 150 ml N-hexán/diizopropil-éter=9/1 elegyből kikristályosítjuk. Ily módon 77,9 g (57%) 3-(3-hidroxi-fenil)-2-metoxi-imino-propionsav-metilésztert nyerünk, op: 75°C.

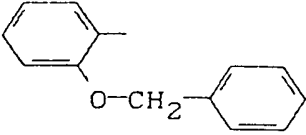
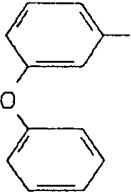
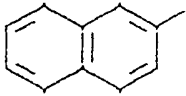
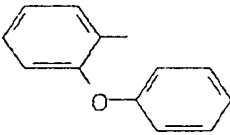
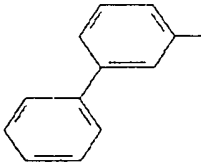
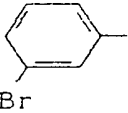
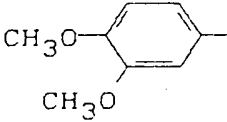
X-I példa

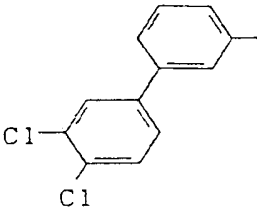
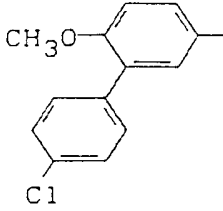
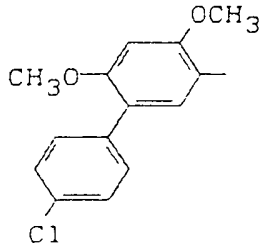
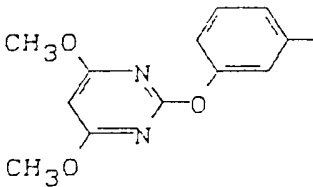
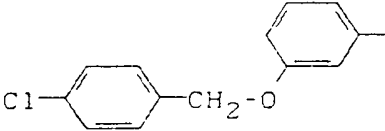
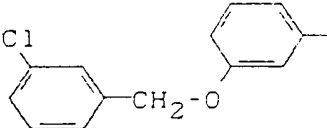
(8 képletű vegyület)

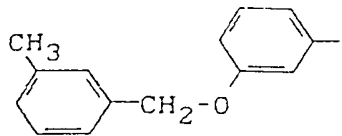
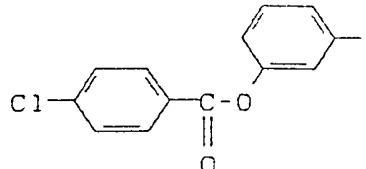
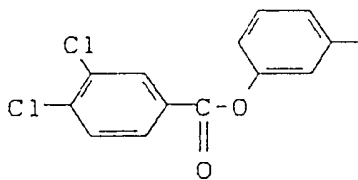
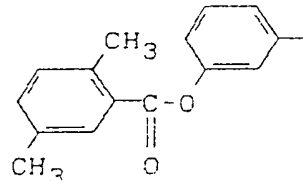
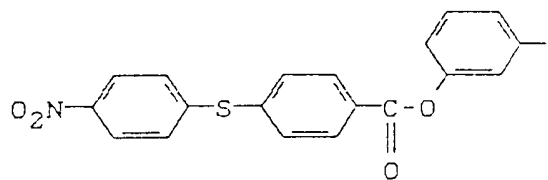
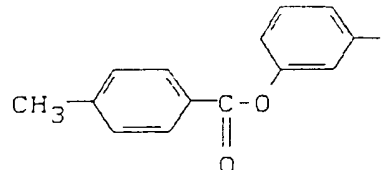
124,7 g (0,51 mól) 4-(3-acetoxikbenzilidén-2-metil-2-oxazolin-5-on-t (lásd 2 243 665 számú német szabadalmi leírás) elkeverünk 600 ml metanollal, hozzáadunk 0,44 ml (0,005 mól) 50%-os nátrium-hidroxidot, a kapott keveréket 3 órán át 65°-on keverjük, majd további 4 ml (0,045 mól) 50%-os nátronlugot ada-

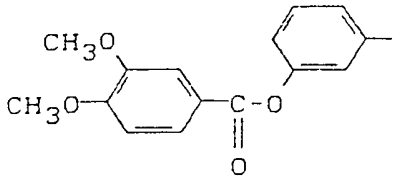
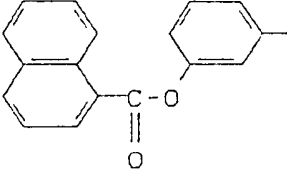
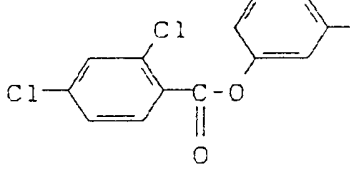
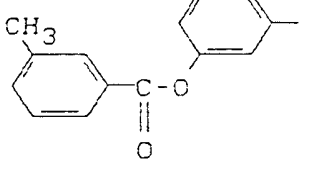
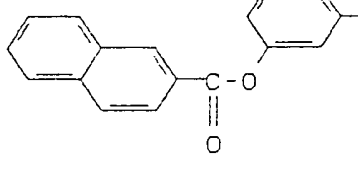
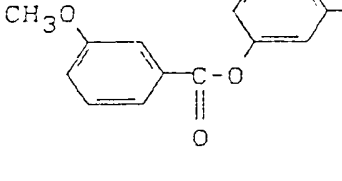
golunk hozzá és a keverést 16 órán át 20°-on még folytatjuk. Ezután a keverékhez 5 ml (0,05 mól) koncentrált sósavat adunk, az oldószert ledesztilláljuk, a maradékhoz 500 ml vizet adunk, a kiváló csapadékot leszivatjuk. Ily módon 102,7 g (86%) 3-(3-hidroxi-fenil)-2-acetamido-akrilsav-metilésztert nyerünk, op. 115°C.

A fentiek szerint, valamint az általánosan ismertetett előállítási módszerek szerint eljárva a következő táblázatokban összefoglalt (I) általános képletű 2-metoxi-amino-karbonsav-észtereket állítjuk elő.

Pld. száma	Ar	A	Fiz. adatok
4		-CH ₂ -	Op.: 55° C
5		-CH ₂ -	n_D^{23} : 1.5620
6		-CH ₂ -	Fp.: 60° C
7		-CH ₂ -	n_D^{23} : 1.5609
8		-CH ₂ -	n_D^{20} : 1.5822
9		-CH ₂ -	n_D^{20} : 1.5468
10		-CH ₂ -	Op.: 70° C

Pld. száma	Ar	A	Fiz. adatok
11		-CH ₂ -	Op.: 35° C
12		-CH ₂ -	Op.: 62° C
13		-CH ₂ -	Op.: 120° C
14		-CH ₂ -	Op.: 106° C
15		-CH ₂ -	n _D ²⁰ : 1.5641
16		-CH ₂ -	n _D ²⁰ : 1.5682

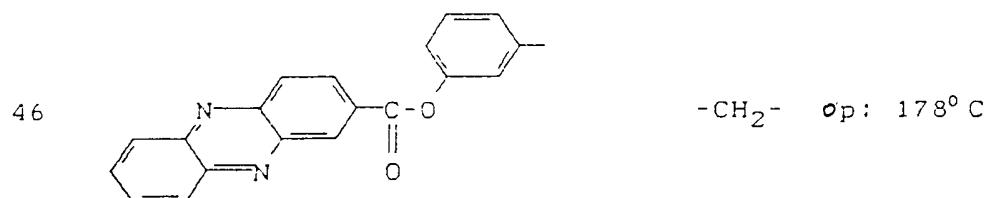
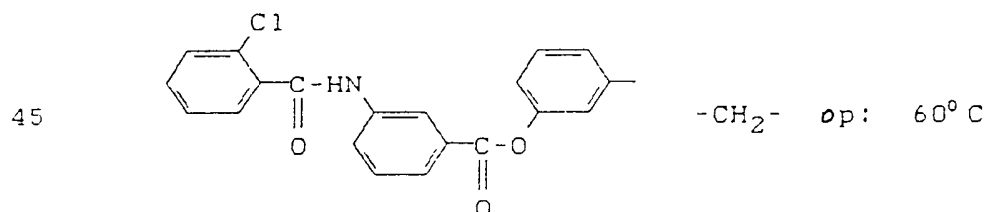
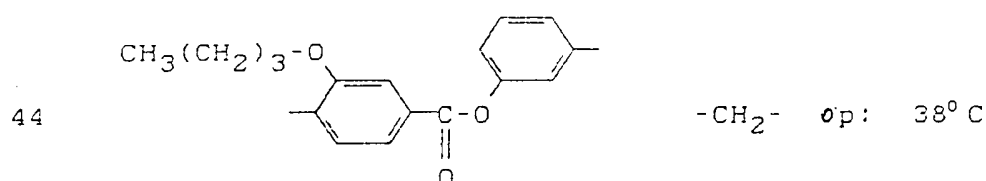
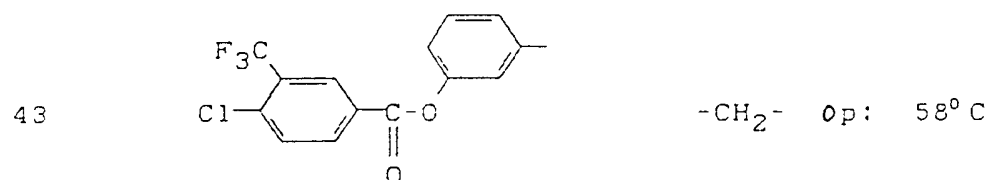
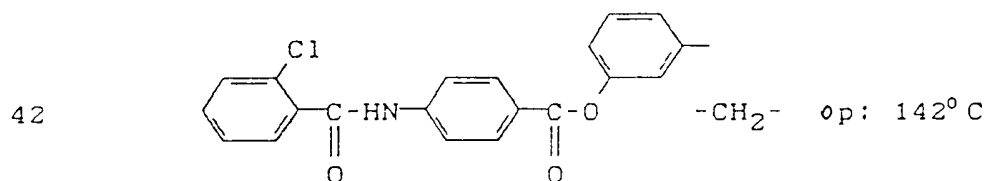
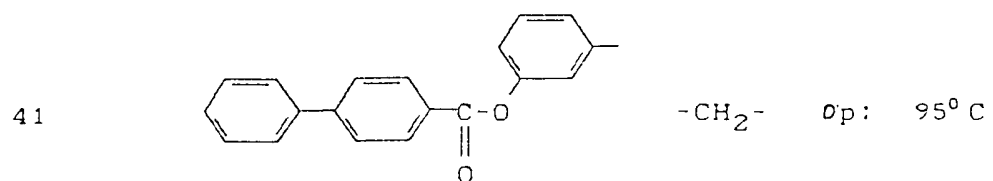
Pld. száma	Ar	A	Fiz. adatok
17		-CH ₂ -	n_D^{23} : 1.5579
18		-CH ₂ -	o.p.: 90° C
19		-CH ₂ -	o.p.: 104° C
20		-CH ₂ -	o.p.: 56° C
21		-CH ₂ -	n_D^{20} : 1.6261
22		-CH ₂ -	o.p.: 110° C

Pld. száma	Ar	A	Fiz. adatok
23		-CH ₂ -	op.: 100° C
24		-CH ₂ -	op.: 60° C
25		-CH ₂ -	op.: 70° C
26		-CH ₂ -	op.: 68° C
27		-CH ₂ -	op.: 96° C
28		-CH ₂ -	n _D ²⁰ : 1.5592

Pld. száma	Ar	A	Fiz. adatok
29		-CH ₂ -	n_D^{20} : 1.5448
30		-CH ₂ -	$\sigma p.$: 86° C
31		-CH ₂ -	n_D^{20} : 1.5699
32		-CH ₂ -	$\sigma p.$: 100° C
33		-N- CH ₃	n_D^{20} : 1.5753
34		-CH ₂ -	n_D^{23} : 1.5261
35		-CH ₂ -	$\sigma p.$: 60° C

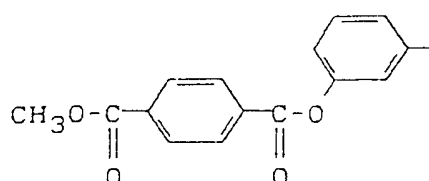
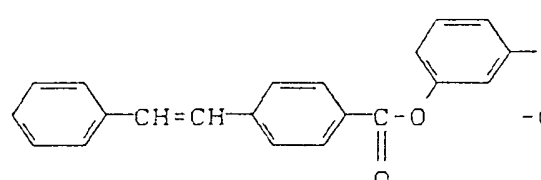
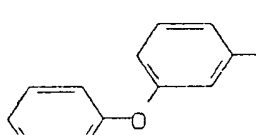
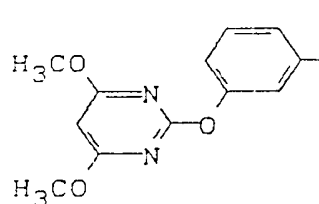
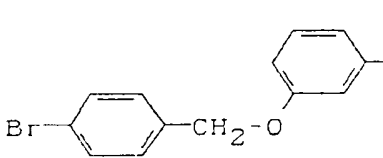
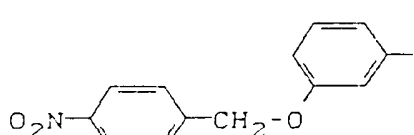
Pld. száma	Ar	A	Fiz. adatok
36		-CH ₂ -	n_D^{20} : 1.5738
37		-CH ₂ -	o.p.: 92° C
38		-CH ₂ -	o.p.: 130° C
39		-CH ₂ -	o.p.: 96° C
40		-CH ₂ -	o.p.: 154° C

Pld. száma	Ar	A	Fiz. adatok
------------	----	---	-------------

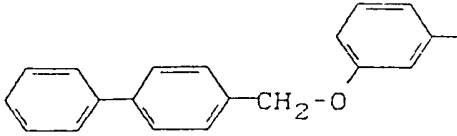
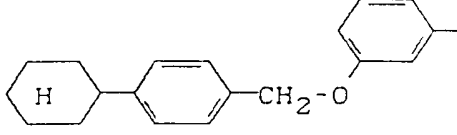
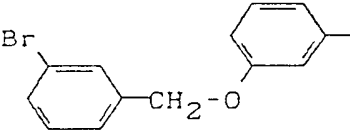
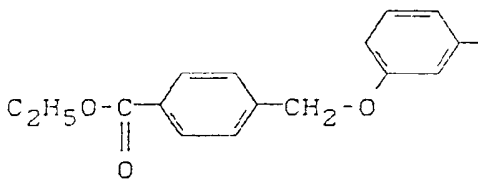
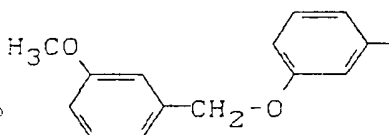
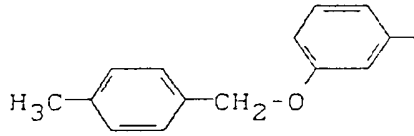


Pld. száma	Ar	A	Fiz. adatok
47		-CH ₂ -	op: 160° C
48		-N- CH ₃	op: 88°-92° C
49		-CH ₂ -	op: 78° C
50		-CH ₂ -	n _D ²⁰ : 1.5695
51		-CH ₂ -	n _D ²⁰ : 1.5471
52		-CH ₂ -	n _D ²⁰ : 1.5363
53		-CH ₂ -	n _D ²⁰ : 1.5598

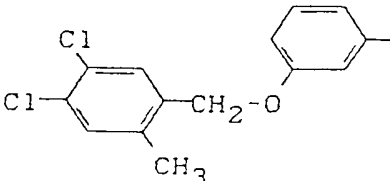
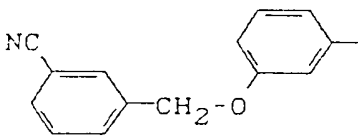
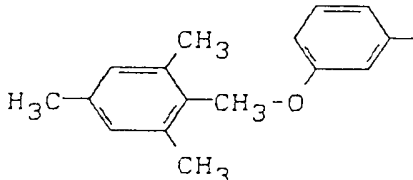
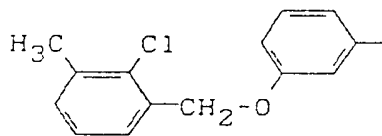
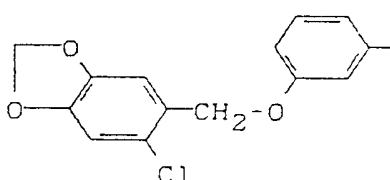
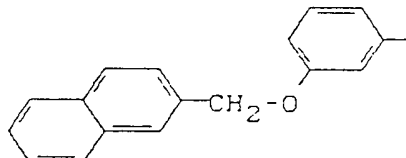
Pld. száma	Ar	A	Fiz. adatok
54		-CH ₂ -	n_D^{20} : 1,5394
55		-CH ₂ -	n_D^{20} : 1,5214
56		-CH ₂ -	n_D^{20} : 1,5233
57		-CH ₂ -	n_D^{20} : 1,5324
58		-CH ₂ -	n_D^{20} : 1,5711 (izomerkev.)
59		-CH ₂ -	op: 120° C

Pld. száma	Ar	A	Fiz. adatok
60		-CH ₂ -	p: 192° C
61		-CH ₂ -	p: 106° C
62		-N- CH ₃	
63		-CH ₂ -	p: 72° C
64		-CH ₂	p: 68° C
65		-CH ₂	p: 78° C

Pld. száma	Ar	A	Fiz. adatok
66		-CH ₂ -	θ_p : 71° C
67		-CH ₂ -	θ_p : 50° C
68		-CH ₂ -	n_D^{20} : 1.5679
69		-CH ₂ -	n_D^{20} : 1.5748 (izomerkev.)
70		-CH ₂ -	θ_p : 70° C
71		-CH ₂ -	n_D^{20} : 1.5978

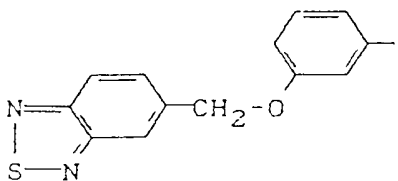
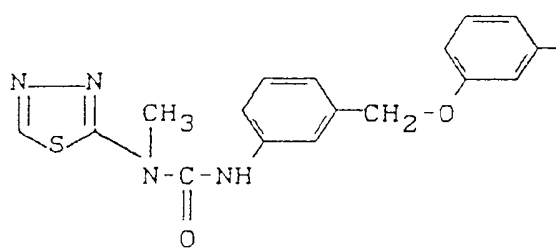
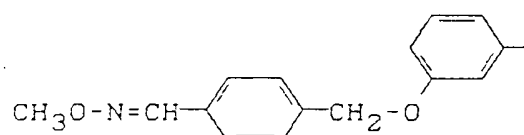
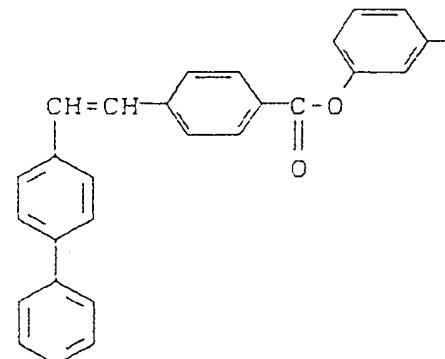
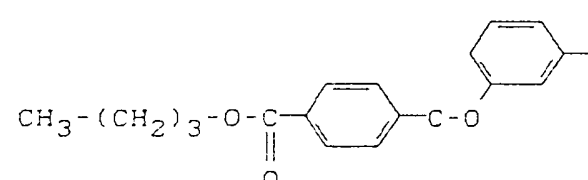
Pld. száma	Ar	A	Fiz. adatok
72		-CH ₂ -	ϱ_p : 80° C
73		-CH ₂ -	n_D^{20} : 1.5598
74		-CH ₂ -	n_D^{20} : 1.5807
75		-CH ₂ -	ϱ_p : 58° C
76		-CH ₂ -	n_D^{20} : 1.5648
77		-CH ₂ -	ϱ_p : 70° C

Pld. száma	Ar	A	Fiz. adatok
78		-CH ₂ -	n_D^{20} : 1.5603 (izomerkev.)
79		-CH ₂ -	n_D^{20} : 1.5579
80		-CH ₂ -	α_p : 58° C
81		-CH ₂ -	n_D^{20} : 1.5599
82		-CH ₂ -	n_D^{20} : 1.5830
83		-CH ₂ -	α_p : 86° C

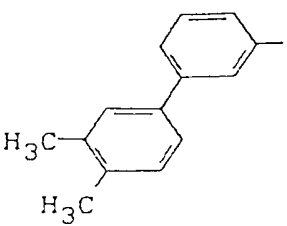
Pld. száma	Ar	A	Fiz. adatok
84		-CH ₂ -	op: 78° C
85		-CH ₂ -	op: 84° C
86		-CH ₂ -	n _D ²⁰ : 1.5710
87		-CH ₂ -	op: 86° C
88		-CH ₂ -	op: 76° C
89		-CH ₂	op: 84° C

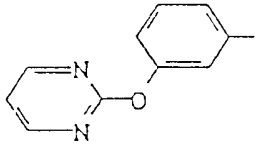
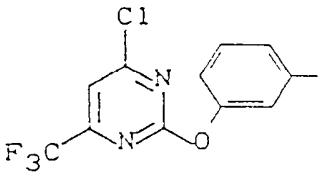
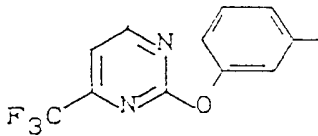
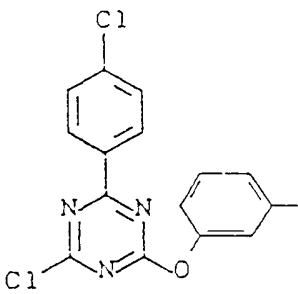
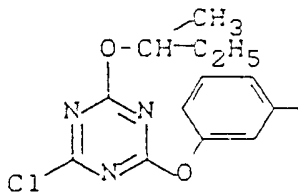
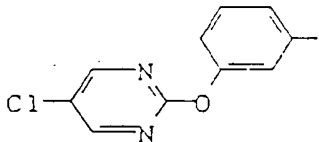
Pld. száma	Ar	A	Fiz. adatok
84		-CH ₂ -	o'p: 78° C
85		-CH ₂ -	o'p: 84° C
86		-CH ₂ -	n _D ²⁰ : 1.5710
87		-CH ₂ -	op: 86° C
88		-CH ₂ -	op: 76° C
89		-CH ₂	op: 84° C

Pld. száma	Ar	A	Fiz. adatok
90		-CH ₂	n_D^{20} : 1.6059
91		-CH ₂ -	n_D^{20} : 1.5707
92		-CH ₂	σ_p : 60° C
93		-CH ₂ -	n_D^{20} : 1.5162
94		-CH ₂ -	σ_p : 80° C
95		-CH ₂ -	n_D^{20} : 1.5871

Pld. száma	Ar	A	Fiz. adatok
96		-CH ₂ -	Op: 72° C
97		-CH ₂ -	Op: 110° C
98		-CH ₂ -	Op: 74° C
99		-CH ₂ -	Op: 196° C
100		-CH ₂ -	Op: 130° C

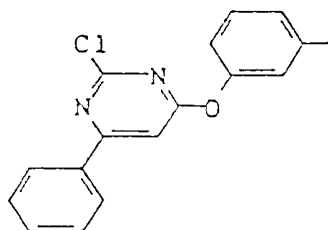
Pld. száma	Ar	A	Fiz. adatok
------------	----	---	-------------

101	 <chem>Cc1ccc(cc1)-c2ccc(C)cc2</chem>	$-\text{CH}_2-$	op: 80° C
-----	---	-----------------	-----------

Pld. száma	Ar	A	Fiz. adatok
102		-CH ₂ -	op.: 72° C
103		-CH ₂ -	op.: 68° C
104		-CH ₂ -	op.: 90° C
105		-CH ₂ -	op.: 120° C
106		-CH ₂ -	n _D ²⁰ : 1.5396
107		-CH ₂ -	op.: 104° C

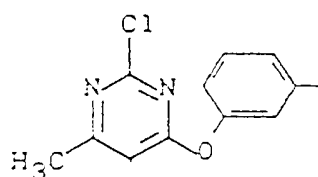
Pld. száma	Ar	A	Fiz. adatok
------------	----	---	-------------

108

-CH₂-

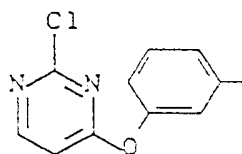
op.: 180° C

109

-CH₂-

op.: 94° C

110

-CH₂-

op.: 82° C

Biológiai példák

A következő biológiai példákban összehasonlító anyagként az A képletnek megfelelő 3-metoxi-2-(2-metil-fenil)-akrilsav-metilésztert alkalmaztuk, amely a 178826 számú európai szabadalmi leírásból ismert.

A példa

Pyrenophora teres-teszt (árpa)/protektív

Oldószer: 100 tömegrész dimetil-formamid

Emulgeátor: 0,25 tömegrész alkil-aril-poliglikol-éter

A vizsgálatokhoz szükséges hatóanyag készítmény előállításához 1 tömegrész hatóanyagot elkeverünk a fentiekben megadott oldószerrel és emulgeátorral és vízzel a kívánt koncentrációra higitjuk.

A protektív hatásosság vizsgálatához fiatal növényeket a fentiek szerinti hatóanyag készítménnyel cseppnedvesre permetezzük, majd száradás után *Pyrenophora teres* konidia szuszpenziójával beszórnjuk. Az így kezelt növényeket 48 órán át 20°C hőmérsékleten 100% relatív nedvességtartalom mellett inkubáljuk, majd a növényeket üvegházban tartjuk 20°C hőmérsékleten 80% relatív nedvességtartalom mellett.

7 nappal az inokulálás után végezzük a kiértékelést.

A technika állása szerint ismert hatóanyagot lényegesen felülmúlja a 9., 10. és 12. példa szerint előállított hatóanyagok hatása.

B példa

Erysiphe-teszt (búza)/protektív

Oldószer: 100 tömegrész dimetil-formamid

Emulgeátor: 0,25 tömegrész alkil-aril-poliglikol-éter

A vizsgáltához szükséges hatóanyagkészítmény előállításához 1 tömegrész hatóanyagot elkeverünk a fentiekben megadott oldószerrel és emulgeátorral és a kapott koncentrátumot vízzel a kívánt koncentrációra hígítjuk.

A protektív hatásosság vizsgálatához fiatal növényeket a fentiek szerinti készítménnyel cseppnedvesre permetezzük, majd száradás után a növényeket *Erysiphe graminis* f.sp. *tritici* spóráival beporozzuk. Az így kezelt növényeket ezután üvegházban 20°C hőmérsékleten 80% relatív légnedvesség mellett tartjuk a lisztharmat kifejlődése érdekében.

A kiértékelést 7 nappal az inokulálás után végezzük.

A technika állása szerint ismert hatóanyagot lényegesen felülmúló hatásosságot mutatnak a következő előállítási példák szerinti vegyületek: 1, 4, 5, 6, 8 és 11. példa.

C példa

Erysiphe-teszt (árpa)/protektív

Oldószer: 100 tömegrész dimetil-formamid

Emulgeátor: 0,25 tömegrész alkil-aril-poliglikol-éter

A vizsgáltához szükséges hatóanyagkészítmény előállításához 1 tömegrész hatóanyagot elkeverünk a fentiekben megadott oldószerrel és emulgeátorral és a kapott koncentrátumot vízzel a kívánt koncentrációra hígítjuk.

A protektív hatásosság vizsgálatához fiatal növényeket a fentiek szerinti készítménnyel cseppnedvesre permetezzük, majd száradás után a növényeket *Erysiphe graminis* f.sp. *tritici* spóráival beporozzuk. Az így kezelt növényeket ezután üvegházban 20°C hőmérsékleten 80% relatív légnedvesség mellett tartjuk a lisztharmat kifejlődése érdekében.

A kiértékelést 7 nappal az inokulálás után végezzük.

A technika állása szerinti ismert vegyülettel szemben jelentősen nagyobb hatást mutatnak a következő előállítási példák szerinti vegyületek: 1, 4, 5 és 11.

D példa

Venturia-teszt (alma)/protektív

Oldószer: 4,7 tömegrész aceton

Emulgeátor: 0,3 tömegrész alkil-aril-poliglikol-éter

A vizsgálathoz szükséges hatóanyag készítmény előállításához 1 tömegrész hatóanyagot a fentiekben megadott oldószerrel és emulgeátorral elkeverjük és vízzel a kívánt koncentrációra hígítjuk.

A protektív hatásosság vizsgálatához a fiatal növényeket a fentiek szerinti készítménnyel cseppnedvesre permetezzük, majd száradás után a növényeket *Venturia inaequalis* vizes konidia szuszpenziójával inokuláljuk, 1 napig 20°C hőmérsékleten és 100% relatív nedvességtartalom mellett inkubáljuk, majd üvegházban 20°C hőmérsékleten és kb. 70% relatív nedvességtartalom mellett tartjuk.

A kiértékelést 12 nappal az inokulálás után végezzük.

A technika állása szerint ismert vegyületeket jelentősen felülmúló hatást mutatnak a következő előállítási példák szerint nyert vegyületek: 1. és 11. példa

Szabadalmi igénypontok

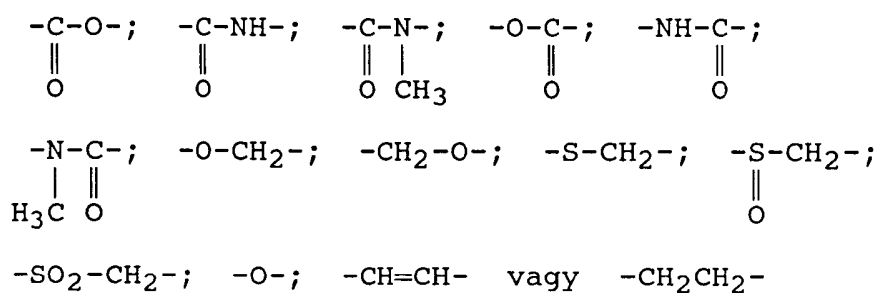
1. (I) általános képletnek megfelelő 2-metoxi-imino-karbonsavészterek - a képletben

Ar jelentése (a), (b), (c) vagy (d) általános képletű csoport,

A jelentése

$\text{-CH}_2\text{-}$, -CH- vagy -N-
 $\quad \quad \quad | \quad \quad \quad |$
 $\quad \quad \quad \text{CH}_3 \quad \quad \quad \text{CH}_3$ képletű csoport, amely
képletekben

Y jelentése valamely következő képletnek megfelelő csoport:



n értéke 0 vagy 1,

R jelentése alkil-, halogén-alkil-, alkenil-, halogén-alkenil-, adott esetben szubsztituált cikloalil-, adott esetben szubsztituált aril-, vagy adott esetben szubsztituált heteroaril-csoport, és R jelentése lehet még halogénatom is azokat az eseteket kivéve, amikor $n=0$, és

x^1 , x^2 , x^3 és x^4 jelentése egymástól függetlenül

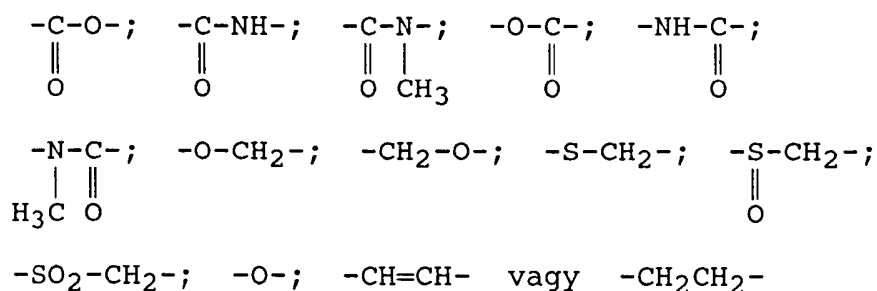
hidrogénatom, halogénatom, hidroxil- vagy metoxicso-

port, azzal a megkötéssel, hogy ha X^2 jelentése brómatom, X^3 egyidejűleg nem jelenthet hidroxil- vagy metoxycsoportot.

2. Az 1. igénypont szerinti (I) általános képletnek megfelelő 2-metoxi-imino-karbonsavészterek, amelyek képletében
 Ar jelentése (a), (b), (c) vagy (d) általános képletű csoport,
 A jelentése

$-CH_2-$, $-CH-$ vagy $-N-$
 $\quad \quad | \quad \quad \quad |$
 $\quad \quad CH_3 \quad \quad CH_3$ képletű csoport, amely
 képletekben

Y jelentése valamely következő képletnek megfelelő csoport:



n értéke 0 vagy 1,

R jelentése előnyösen egyenes vagy elágazó láncú 1-8 szénatomos alkil-, egyenes vagy elágazó láncú 1-8 szénatomos halogén-alkil-csoport, amely 1-9 azonos vagy különböző halogénatomot tartalmaz, egyenes vagy elágazó láncú 2-8 szénatomos alkenil-, 2-8 szénatomos egyenes vagy elágazó láncú halogén-alkenil-csoport, amely 1-9 azonos vagy különböző halogénatomot tartalmaz, adott esetben egy vagy többszörösen azonosan vagy különbözően halogénatommal

és/vagy egyenes vagy elágzó láncu 1-6 szénatomos alkil-csoporttal szubsztituált 3-7 szénatomos cikloalkilcsoport vagy adott esetben egyszeresen vagy többszörösen azonosan vagy különbözően szubsztituált 2-9 szénatomot és 1-5 azonos vagy különböző heteroatomot - különösen nitrogén-, oxigén- és/vagy kénatomot - tartalmazó heteroaril-csoport, amelynél a szubsztituensek például a következők lehetnek: halogénatom, egyenes vagy elágzó láncu 1-6 szénatomos alkil- vagy alkoxics csoport,

- R jelentése lehet továbbá előnyösen még adott esetben egy vagy többszörösen, azonosan vagy különbözően szubsztituált 6-10 szénatomos arilcsoport, amely arilcsoportnál a szubsztituensek jelentése előnyösen a következő: halogénatom, ciano-, nitro-, 1-6 szénatomos egyenes vagy elágzó láncu alkil-, alkoxi-, alkil-tio-, alkil-szulfinil- vagy alkil-szulfonil-csoport egyenes vagy elágzó láncu 2-6 szénatomos alkenil-, alkinil-, alkenil-oxi-, alkinil-oxi-, akenil-tio- vagy alkinil-tio-csoport, egyenes vagy elágzó láncu 1-6 szénatomot és 1-13 halogénatomot tartalmazó halogén-alkil-, halogén-alkoxi-, halogén-alkil-tio-, halogén-alkil-szulfinil- vagy halogén-alkil-szulfonil-csoport, 2-6 szénatomot és 1-9 azonos vagy különböző halogénatomot tartalmazó egyenes vagy elágzó láncu halogén-alkenil-, halogén-alkinil-, halogén-alkenil-oxi-, halogén-alkinil-oxi-, halogén-alkenil-tio- vagy halogén-alkinil-tio-csoport, az alkilcsoporton 1-6 szénatomot tartalmazó egyenes vagy elágzó láncu alkil-karbonil-, alkoxi-karbonil-, alkil-karbonil-oxi-, alkil-karbonil-amino-,

alkil-karbonil-(N-alkil)-amino-, amino-karbonil-, N-alkil-amino-karbonil-, N,N-dialkil-amino-karbonil- vagy alkoxi-imino-alkil-csoport, adott esetben egyszresen vagy többszörösen, azonosan vagy különbözően szubsztituált 6k10 szénatomos aril-, aril-oxi-, aril-tio-, aril-karbonil-, aril-karbonil-oxi-, aril-karbonil-amino-, aril-karbonil-(N-1-6 szénatomos alkil)-amino-, aril-amino-karbonil-, N-aril-N-1-6 szénatomos alkil-amino-karbonil-, aril-1-6 szénatomos alkil- vagy aril-2-6 szénatomos alkenil-csoport, amely csoportoknál szubsztituensként az aril-csoporton a következő csoportok lehetnek jelen: halogénatom, ciano-, nitro-, 1-6 szénatomos egyenes vagy elágazó láncu alkil-, alkoxi-, alkil-tio-, alkil-szulfinil- vagy alkil-szulfonil-csoport, egyenes vagy elágazó láncu 2-6 szénatomos alkenil-, alkinil-, alkenil-oxi-, alkinil-oxi-, alkenil-tio- vagy alkinil-tio-csoport, egyenes vagy elágazó láncu 1-6 szénatomot és 1-13 azonos vagy különböző halogénatomot tartalmazó halogén-alkil-, halogén-alkoxi-, halogén-alkil-tio-, halogén-alkil-szulfinil-, halogén-alkil-szulfonil-csoport, egyenes vagy elágazó láncu 2-6 szénatomot és 2-9 azonos vagy különböző halogénatomot tartalmazó halogén-alkenil-, halogén-alkinil-, halogén-alkenil-oxi-, halogén-alkinil-oxi-, halogén-alkenil-tio- vagy halogén-alkinil-tio-csoport, egyenes vagy elágazó láncu az egyes alkilcsoportokban 1-6 szénatomot tartalmazó alkil-karbonil-, alkoxi-karbonil-, alkilkkarbonil-oxi-, alkil-karbonil-amino-, alkil-karbonil-(N-alkil-amino)-, amino-karbonil-, N-alkil-

-amino-karbonil-, N,N-dialkil-amino-karbonil- vagy alkoxi-
 -imino-alkil-csoport, 6-10 szénatomos és adott esetben
 azon egyszeres vagy többszörösen azonosan vagy különbö-
 zően szubsztituált aril-, aril-oxi-, aril-tio-, aril-kar-
 bonil-, aril-karbonil-oxi-, aril-karbonil-amino-, aril-
 -karbonil-(N-1-6 szénatomos alkil)-amino-, aril-amino-
 -karbonil-, N-aril-N-1-6 szénatomos alkil-amino-karbonil-,
 aril-1-6 szénatomos alkil- vagy aril-2-6 szénatomos
 alkenil-csoport, amely arilcsoportok valamely következő
 szubsztituenssel lehetnek szubsztituálva: halogénatom,
 vagy 1-6 szénatomos egyenes vagy elágazó láncu alkil- vagy
 alkoxics csoport,

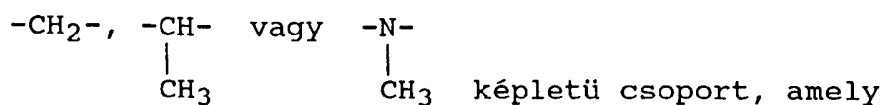
R jelentése előnyösen lehet továbbá még abban az esetben, ha
 n=0, fluor-, klór-, bróm- vagy jódatom, $\overset{|}{\text{Cl}}$

X^1, X^2, X^3 , és X^4 jelentése egymástól függetlenül hidrogénatom,
 fluor-, klór-, jód- vagy brómatom, hidroxil- vagy metoxi-
 csoport, azzal a megkötéssel, hogy ha X^2 jelentése
 brómatom, X^3 egyidejűleg hidroxil- vagy metoxics csoporttól
 eltérő kell hogy legyen.

3. Az 1. igénypont szerinti (I) általános képletű 2-
 -metoxi-imino-karbonsavészterek, amely képletében

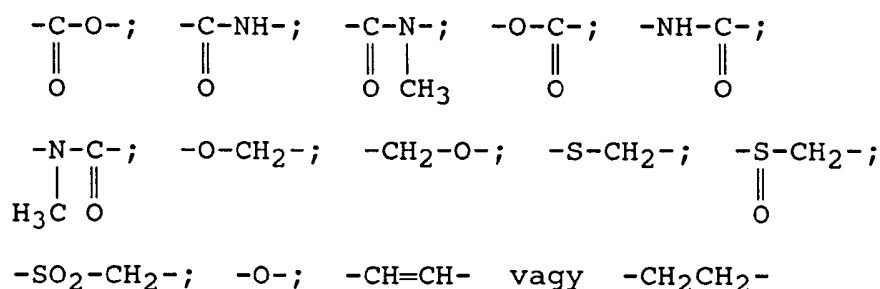
Ar jelentése (b) általános képletű csoport,

A jelentése



képletekben

Y jelentése valamely következő képletnek megfelelő csoport:



n értéke 0 vagy 1,

R jelentése egyenes vagy előgazóláncu 1-6 szénatomos alkilcsoport, 1-6 szénatomos és 1-9 azonos vagy különböző halogénatomot tartalmazó egyenes vagy elágazó láncu halogén-alkil-csoport, egyenes vagy elágazó láncu 2-6 szénatomos alkenilcsoport, egyenes vagy elágazó 2-6 szénatomot és 1-9 azonos vagy különböző halogénatomot tartalmazó halogén-alkenil-csoport, 3-7 szénatomos és adott esetben 1-5-szörösen azonos vagy különböző 1-4 szénatomos egyenes vagy elágazó láncu alkilcsoporttal és/vagy halogénatommal szubsztituált cikloalkilcsoport, adott esetben 1-3-szorosan azonosan vagy különbözően szubsztituált 2-9 szénatomot és 1-4 azonos vagy különböző heteroatomot - előnyösen nitrogén-, oxigén- és/vagy kén-atomot - tartalmazó heteroaril-csoport, amely heteroaril-csoporton a szubsztituensek jelentése valamely következő csoport: fluor-, klór- vagy brómatom, egyenes vagy előgazóláncu 1-4 szénatomos alkil- vagy alkoxics csoport,

R jelentése lehet továbbá még adott esetben 1-5-szörösen azonosan vagy különbözően szubsztituált 6-10 szénatomos arilcsoport, amely arilcsoport szubsztituenyei a következők lehetnek: fluor-, klór-, vagy brómatom, ciano- vagy nitrocsoport, egyenes vagy elágazó láncu 1-4 szénatomos alkil-, alkoxi-, alkil-tio-, alkil-szulfonil- vagy alkil-szulfonil-csoport, egyenes vagy elágazó láncu 2-4 szénatomos alkenil-, alkenil-oxi-, alkinil-oxi-, alkenil-tio- vagy alkinil-tio-csoport, egyenes vagy elágazó láncu 1-4 szénatomos és 1-9 azonos vagy különböző halogénatomot tartalmazó halogén-alkenil-, halogén-alkinil-, halogén-alkenil-oxi-, halogén-alkinil-oxi-, halogén-alkenil-tio- vagy halogén-alkinil-tio-csoport, az alkilcsoportokban 1-4 szénatomot tartalmazó alkil-karbonil-, alkoxi-karbonil-, alkil-karbonil-oxi-, alkil-karbonil-amino-, alkil-karbonil-(N-alkil)-amino-, amino-karbonil-, N-alkil-amino-karbonil-, N,N-dialkil-amino-karbonil- vagy alkoxi-imino-alkil-csoport, adott esetben egy vagy többszörösen azonosan vagy különbözően szubsztituált 6-10 szénatomos aril-, aril-oxi-, aril-tio-, aril-karbonil-, aril-karbonil-oxi-, aril-karbonil-amino-, aril-karbonil-(N-1-4 szénatomos alkil)-amino-, aril-amino-karbonil-, N-aril-N-1-4 szénatomos alkil-amino-karbonil-, aril-1-4 szénatomos alkil- vagy aril-2-4 szénatomos alkenil-csoport, amely csoportokban az arilcsoport valamely következő szubsztituenssel lehet szubsztituálva: fluoro-, klór-, brómatom, ciano- vagy nitrocsoport, egyenes vagy elágazó láncu 1-4 szénatomos alkil-, alkoxi-, alkil-

-tio-, alkil-szulfinil- vagy alkil-szulfonil-csoport, egyenes vagy elágazó láncu 2-4 szénatomos alkenil-, alkinil-, alkenil-oxi-, alkinil-oxi-, alkenil-tio- vagy alkinil-tio-csoport, egyenes vagy elágazó láncu 1-4 szénatomot és 1-9 azonos vagy különböző halogénatomot tartalmazó halogén-alkil-, halogén-alkoxi-, halogén-alkil-tio-, halogén-alkil-szulfinil- vagy halogén-alkil-szulfonil-csoport, egyenes vagy elágazó láncu 2-4 szénatomot és 1-7 azonos vagy különböző halogénatomot tartalmazó halogén-alkenil-, halogén-alkinil-, halogén-alkenil-oxi-, -halogén-alkinil-oxi-, halogén-alkenil-tio- vagy halogén-alkinil-tio-csoport, egyenes vagy elágazó láncu az alkil-csoporton 1-4 szénatomot tartalmazó alkil-karbonil-, alkoxi-karbonil-, alkil-karbonil-oxi-, alkil-karbonil-amino-, alkil-karbonil-(N-1-4 szénatomos alkil)-amino-, amino-karbonil-, N-alkil-amino-karbonil-, N,N-dialkil-amino-karbonil- vagy akoxi-imino-alkil-csoport, adott esetben egy vagy többszörösen azonosan vagy különbözően szubsztituált 6-10 szénatomos aril-, aril-oxi-, aril-tio-, aril-karbonil-, aril-karbonil-oxi-, aril-karbonil-amino-, aril-(-N-1-4 szénatomos alkil)-amino-, aril-amino-karbonil-, N-aril-N-1-4 szénatomos alkil-amino-karbonil-, aril-1-4 szénatomos alkil- vagy aril-2-4 szénatomos alkenil-csoport és az arilcsoporton a következő szubsztituensek lehetnek: fluro-, kloró- vagy brómatom, 1-4 szénatomos alkil- vagy alkoxicssoport,

R jelentése lehet még továbbá abban az esetben ha $n=0$, klór- vagy brómatom is,

X^1, X^2, X^3 , és X^4 jelentése egymástól függetlenül hidrogénatom, klór- vagy brómatom, hidroxil- vagy metoxycsoport, azzal a megkötéssel, hogy ha X^2 jelentése brómatom, X^3 jelentése hidroxil- vagy metoxycsoporttól eltérő kell hogy legyen.

4. Eljárás (I) általános képletű 2-metoxi-imino-karbonsav-észterek előállítására - a képletben

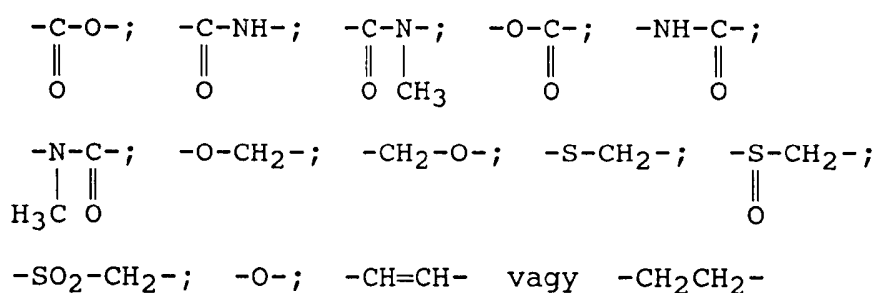
Ar jelentése (a), (b), (c) vagy (d) általános képletű csoport,

A jelentése

$$\begin{array}{ccc} -CH_2- & -CH- & \text{vagy} & -N- \\ & | & & | \\ & CH_3 & & CH_3 \end{array}$$

képletekben képletű csoport, amely

Y jelentése valamely következő képletnek megfelelő csoport:



n értéke 0 vagy 1,

R jelentése alkil-, halogén-alkil-, alkenil-, halogén-alkenil-, adott esetben szubsztituált cikloalil-, adott esetben szubsztituált aril-, vagy adott esetben szubsztituált heteroaril-csoport, és R jelentése lehet még halogénatom is azokat az eseteket kivéve, amikor $n=0$, és

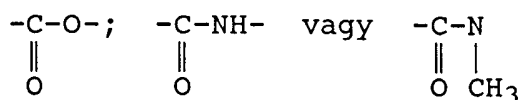
X^1, X^2, X^3 és X^4 jelentése egymástól függetlenül

hidrogénatom, halogénatom, hidroxil- vagy metoxycsoport, azzal a megkötéssel, hogy ha X^3 jelentése brómatom, X^2 egyidejűleg nem jelenthet hidroxil- vagy metoxycsoportot.

azzal jellemezve, hogy

- a) (Ia) általános képletű 2-metoxi-imino-karbonsavészterek előállítására -
a képletben
 R^1 jelentése hidrogénatom, metilcsoport és
Ar jelentése a fenti -
egy (II) általános képletű akrilészter-származékot - a képletben R^1 és Ar jelentése a fenti- O-metil-hidroxilamin savaddíciós sójával reagáltatjuk adott esetben higítószer, valamint adott esetben reakciót elősegítő szer jelenlétében, vagy
- b) (Ib) általános képletű 2-metoxi-imino-karbonsavészterek előállítására - a képletben Ar jelentése a fenti - először egy (III) általános képletű aromás amint - a képletben Ar jelentése a fenti egy (IV) képletű 2-klór-2-hidroximinoecetsav-metilészterrel reagáltatunk adott esetben higítószer és adott esetben savmegkötőszer jelenlétében, majd ezt követően a kapott vegyületet a hidroximino-csoporton adott esetben savmegkötőszer jelenlétében metilezzük, vagy
- c) (Ic) általános képletű 2-metoxi-imino-karbonsavészterek előállítására - a képletben
 R^1 jelentése hidrogénatom vagy metilcsoport, és
 Ar^1 jelentése (a') vagy (b') általános képletű csoport, amely képletekben

Y jelentése valamely következő képletű csoport:



x^1 , x^2 , x^3 , x^4 és R jelentése a fenti -

egy (V) általános képletű vegyületet - a képletben

R^1 jelentése hidrogénatom vagy metilcsoport, és

Ar^2 jelentése (a") vagy (b") általános képletű csoport, amely képletekben

Z jelentése hidroxí-, amino- vagy N-metil-amino-csoport, és

x^1 , x^2 , x^3 , és x^4 jelentése a fenti -

egy (VI) általános képletű savkloriddal - a képletben R

jelentése a fenti - reagáltatunk, adott esetben hígítószer és adott esetben savmegkötőszer jelenlétében.

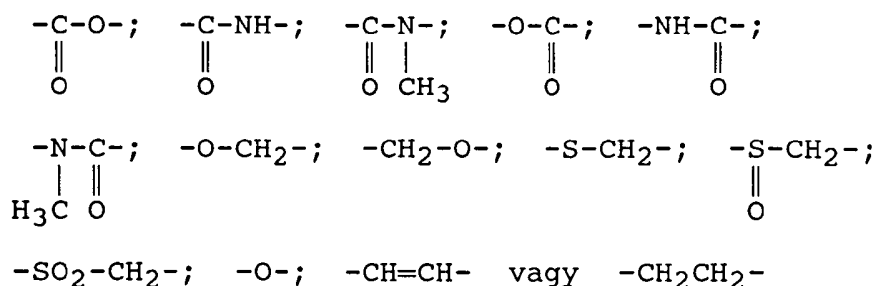
5. Kártevőirtószer **azzal jellemezve**, hogy hatóanyagként legalább egy (I) általános képletű 2-metoxi-imino-karbonsav-észtert tartalmaz - a képletben

Ar jelentése (a), (b), (c) vagy (d) általános képletű csoport,

A jelentése

$\begin{array}{ccc} \text{-CH}_2\text{-} & \text{-CH-} & \text{vagy} & \text{-N-} \\ & | & & | \\ & \text{CH}_3 & & \text{CH}_3 \end{array}$ képletű csoport, amely képletekben

Y jelentése valamely következő képletnek megfelelő csoport:



n értéke 0 vagy 1,

R jelentése alkil-, halogén-alkil-, alkenil-, halogén-alkenil-, adott esetben szubsztituált cikloalil-, adott esetben szubsztituált aril-, vagy adott esetben szubsztituált heteroaril-csoport, és R jelentése lehet még halogénatom is azokat az eseteket kivéve, amikor $n=0$, és

X^1 , X^2 , X^3 és X^4 jelentése egymástól függetlenül hidrogénatom, halogénatom, hidroxil- vagy metoxycsoport, azzal a megkötéssel, hogy ha X^2 jelentése brómatom, X^3 egyidejűleg nem jelenthet hidroxil- vagy metoxycsoportot,

ismert szilárd vagy folyékony és adott esetben ismert felület-aktív anyagokkal elkeverve.

6. Eljárás fitopatogén gombák elpusztítására **azzal jellemezve**, hogy (I) általános képletű 2-metoxi-imino-karbonsavésztert alkalmazunk a fitopatogén gombák megjelenési helyén.

7. (I) általános képletű 2-metoxi-imino-karbonsavészterek alkalmazása kártevők, különösen fitopatogén gombák elpusztítására.

8. Eljárás kártevőirtószerek előállítására **azzal**

jellemezve, hogy (I) általános képletű 2-metoxi-imino-karbonsavésztert hordozóanyagokkal és/vagy felületaktív anyagokkal elkeverünk.

9. Eljárás fungicid készítmények előállítására **azzal** jellemezve, hogy (I) általános képletű 2-metoxi-imino-karbonsavésztert hordozóanyaggal és/vagy felületaktív anyaggal elkeverünk.

10. (V) általános képletnek megfelelő vegyület, amely képletben

R^1 jelentése hidrogénatom vagy metilcsoport,

Ar^2 jelentése (a") vagy (b") általános képletű csoport, amely képletekben

Z jelentése hidrox-, amino- vagy N-metil-amino-csoport, és

X^1 , X^2 , X^3 és X^4 jelentése a egymástól függetlenül hidrogénatom, halogénatom, hidrox- vagy metoxi-csoport, azzal a megkötéssel, hogy ha X^2 jelentése brómatom, X^3 jelentése hidrox- vagy metoxicsoporttól eltérő.

+ 7 rajz



A meghatalmazott:

DANUBIA
Szabadalmi és Védjegy Iroda Kft.
11.

