

Herbicid hatású

**PIRAZIN-2-ON-SZÁRMAZÉKOK, EZEK ALKALMAZÁSA ÉS
ELŐÁLLÍTÁSUK SORÁN ALKALMAZHATÓ INTERMEDIEREK**

KIVONAT

A találmány szerinti vegyületek [1] általános képletében

R¹ jelentése hidrogénatom vagy alkilcsoport;

R² jelentése halogén-alkil-csoport;

R³ jelentése alkilcsoport, amely adott esetben egy vagy több halogénatommal szubsztituálva lehet, alkenilcsoport vagy alkinilcsoport;

Q jelentése adott esetben szubsztituált fenilcsoport.

A találmány kiterjed a fenti vegyületeket tartalmazó herbicid készítményekre, a fenti vegyületek előállítására, valamint a fenti vegyületek előállítása során kiindulási anyagként alkalmazott vegyületekre.

852 Jell. a. : (1)

A találmány pirazin-2-on-származékokra, ezek alkalmazására és előállításuk során alkalmazott intermedierekre vonatkozik.

A találmány feladata olyan vegyületek kidolgozása, amelyek kiváló herbicid hatékonysággal rendelkeznek. Azt találtuk, hogy az [1] általános képletű pirazin-2-on-származékok előnyös herbicid hatékonysággal rendelkeznek, és ezért a találmány tárgyát képezik.

A találmány tárgyát jelentik tehát az [1] általános képletű vegyületek, a képletben

R¹ jelentése hidrogénatom vagy 1-3 szénatomos alkilcsoport;

R² jelentése 1-3 szénatomos halogén-alkil-csoport;

R³ jelentése 1-6 szénatomos alkilcsoport, amely adott esetben egy vagy több halogénatommal szubsztituálva van, 3-6 szénatomos alkenilcsoport vagy 3-6 szénatomos alkinilcsoport;

Q jelentése adott esetben szubsztituált fenilcsoport,
(a továbbiakban találmány szerinti vegyületek).

A találmány tárgyát képezik továbbá a hatóanyagként fenti vegyületeket tartalmazó herbicid készítmények.

A találmány tárgya továbbá eljárás az [1] általános képletű vegyületek előállítására oly módon, hogy egy [2] általános képletű vegyületet - a képletben Q, R¹ és R² jelentése a fenti - egy [3] általános képletű vegyülettel

 R^3 -D

[3]

reagáltatunk, ahol a képletben D jelentése klóratom, brómatom, jódatom, metánszulfonil-oxi-csoport, trifluor-metánszulfonil-oxi-csoport vagy p-tolu-

olszulfonil-oxi-csoport, és R^3 jelentése a fenti.

A találmány tárgyát képezik továbbá a [2] általános képletű vegyületek - a képletben Q, R^1 és R^2 jelentése a fenti -, amelyek intermediereként alkalmazhatók a találmány szerinti vegyületek előállítása során.

A [2] általános képletű vegyületek egy tautomer formában is előfordulhatnak, amelyek a [2-1] képlettel ábrázolhatók, a képletben Q, R^1 és R^2 jelentése a fenti.

A találmány szerinti vegyületekben Q jelentése lehet [Q-1], [Q-2], [Q-3], [Q-4] vagy [Q-5] általános képletű csoport, ahol

X jelentése hidrogénatom vagy halogénatom;

Y jelentése halogénatom, nitrocsoporthat, cianocsoport vagy trifluor-metil-csoport;

Z¹ jelentése oxigénatom, kénatom, NH vagy metilén-csoport;

Z² jelentése oxigénatom vagy kénatom;

n értéke 0 vagy 1;

B jelentése hidrogénatom, halogénatom, nitrocsoporthat, cianocsoport, klór-szulfonil-csoport, $-OR^{10}$, $-SR^{10}$, $-SO_2-OR^{10}$, $-N(R^{10})R^{11}$, $-SO_2N(R^{11})R^{12}$, $-NR^{11}(COR^{13})$, $-NR^{11}(SO_2R^{14})$, $-N(SO_2R^{14})(SO_2R^{15})$, $-N(SO_2R^{14})(COR^{13})$, $-NR^{11}(COOR^{13})$, $-COOR^{13}$, $-CON(R^{11})R^{12}$, $-CSN(R^{11})R^{12}$, $-COR^{16}$, $-CR^{17}=CR^{18}CHO$, $-CR^{17}=CR^{18}COOR^{10}$, $-CR^{17}=CR^{18}CON(R^{11})R^{12}$, $-CH_2CHWCOOR^{13}$ vagy $-CH_2CHWCON(R^{11})R^{12}$ általános képletű csoport;

R⁴ jelentése hidrogénatom vagy 1-3 szénatomos alkilcsoport;

R⁵ jelentése hidrogénatom, 1-6 szénatomos alkilcsoport, 1-6 szénatomos halogén-alkil-csoport, 3-6 szénatomos alkenilcsoport, 3-6 szénatomos halogén-alkenil-csoport, 3-6 szénatomos alkinilcsoport, 3-6 szénatomos halogén-alkinil-csoport, 1-6 szénatomos ciano-alkil-csoport, 2-8 szénatomos alkoxi-alkil-csoport, 3-8 szénatomos alkoxi-alkoxi-alkil-cso-

port, 1-6 szénatomos karboxi-alkil-csoport, alkil részeiben 1-6 szénatomos alkoxi-karbonil-alkil-csoport, alkoxi részeiben 1-4 szénatomos és alkil részében 1-6 szénatomos alkoxi-alkoxi-karbonil-alkil-csoport, cikloalkil részében 3-8 szénatomos és alkil részében 1-6 szénatomos cikloalkoxi-karbonil-alkil-csoport, $-\text{CH}_2\text{CON}(\text{R}^{11})\text{R}^{12}$, $-\text{CH}_2\text{COON}(\text{R}^{11})\text{R}^{12}$, alkil részében 1-4 szénatomos $-\text{CH}(\text{alkil})\text{CON}(\text{R}^{11})\text{R}^{12}$, alkil részében 1-4 szénatomos $-\text{CH}(\text{alkil})\text{COON}(\text{R}^{11})\text{R}^{12}$ általános képletű csoport, 2-8 szénatomos alkil-tio-alkil-csoport, 1-6 szénatomos alkil-szulfonil-csoport, 1-6 szénatomos halogén-alkil-szulfonil-csoport, 1-8 szénatomos alkil-karbonil-csoport, 1-8 szénatomos alkoxi-karbonil-csoport vagy 1-6 szénatomos hidroxi-alkil-csoport;

R⁶ jelentése 1-6 szénatomos alkilcsoport, 1-6 szénatomos halogén-alkil-csoport, formilcsoport, cianocsoport, karboxilcsoport, 1-6 szénatomos hidroxi-alkil-csoport, alkil részeiben 1-6 szénatomos alkoxi-alkil-csoport, alkil részeiben 1-6 szénatomos alkoxi-alkoxi-alkil-csoport, alkil részeiben 1-6 szénatomos alkil-karbonil-oxi-alkil-csoport, alkil részeiben 1-6 szénatomos halogén-alkil-karbonil-oxi-alkil-csoport, 1-6 szénatomos alkoxi-karbonil-csoport vagy 1-6 szénatomos alkil-karbonil-csoport;

R⁷ jelentése hidrogénatom vagy 1-3 szénatomos alkilcsoport;

R⁸ jelentése 1-6 szénatomos alkilcsoport, 1-6 szénatomos halogén-alkil-csoport, 1-6 szénatomos hidroxi-alkil-csoport, 2-8 szénatomos alkoxi-alkil-csoport, 3-10 szénatomos alkoxi-alkoxi-alkil-csoport, alkil részeiben 1-6 szénatomos alkil-karbonil-oxi-alkil-csoport, alkil részeiben 1-6 szénatomos halogén-alkil-karbonil-oxi-alkil-csoport, karboxilcsoport, 1-6 szénatomos karboxi-alkil-csoport, 1-8 szénatomos alkoxi-karbonil-csoport, 1-6 szénatomos halogén-alkoxi-karbonil-csoport, 3-10 szénatomos cikloalkoxi-karbonil-csoport, 3-8 szénatomos alkenil-

- oxi-karbonil-csoport, 3-8 szénatomos alkinil-oxi-karbonil-csoport, amino-karbonil-csoport, 1-6 szénatomos alkil-amino-karbonil-csoport, alkil részeiben 1-6 szénatomos dialkil-amino-karbonil-csoport, alkil részeiben 1-6 szénatomos alkil-amino-karbonil-oxi-alkil-csoport vagy alkil részeiben 1-6 szénatomos dialkil-amino-karbonil-oxi-alkil-csoport;
- W** jelentése hidrogénatom, klóratom vagy brómatom;
- R¹⁰** jelentése hidrogénatom, 1-6 szénatomos alkilcsoport, 1-6 szénatomos halogén-alkil-csoport, 3-8 szénatomos cikloalkilcsoport, 3-6 szénatomos alkenilcsoport, 3-6 szénatomos halogén-alkenil-csoport, 3-6 szénatomos alkinilcsoport, 3-6 szénatomos halogén-alkinil-csoport, 1-6 szénatomos ciano-alkil-csoport, 2-8 szénatomos alkoxi-alkil-csoport, 2-8 szénatomos alkil-tio-alkil-csoport, 1-6 szénatomos karboxi-alkil-csoport, alkil részeiben 1-6 szénatomos alkoxi-karbonil-alkil-csoport, alkoxi részeiben 1-4 szénatomos és alkil részében 1-6 szénatomos alkoxi-alkoxi-karbonil-alkil-csoport, cikloalkil részében 3-8 szénatomos és alkil részében 1-6 szénatomos cikloalkoxi-karbonil-alkil-csoport, $-\text{CH}_2\text{CON}(\text{R}^{11})\text{R}^{12}$, $-\text{CH}_2\text{COON}(\text{R}^{11})\text{R}^{12}$, alkil részében 1-4 szénatomos $-\text{CH}(\text{alkil})\text{CON}(\text{R}^{11})\text{R}^{12}$ vagy alkil részében 1-4 szénatomos $-\text{CH}(\text{alkil})\text{COON}(\text{R}^{11})\text{R}^{12}$ általános képletű csoport;
- R¹¹** és **R¹²** egymástól függetlenül hidrogénatom, 1-6 szénatomos alkilcsoport, 1-6 szénatomos halogén-alkil-csoport, 3-6 szénatomos alkenilcsoport, 3-6 szénatomos alkinilcsoport, 1-6 szénatomos ciano-alkil-csoport, 2-8 szénatomos alkoxi-alkil-csoport, 2-8 szénatomos alkil-tio-alkil-csoport, 1-6 szénatomos karboxi-alkil-csoport, alkil részeiben 1-6 szénatomos alkoxi-karbonil-alkil-csoport vagy alkoxi részeiben 1-4 szénatomos és alkil részében 1-6 szénatomos alkoxi-alkoxi-karbonil-alkil-csoport; vagy **R¹¹** és **R¹²** jelentése együtt tetrametiléncsoport, penta-metiléncsoport vagy etilén-oxi-etilén-csoport;

R¹³ jelentése hidrogénatom, 1-6 szénatomos alkilcsoport, 1-6 szénatomos halogén-alkil-csoport vagy 3-8 szénatomos cikloalkilcsoport;

R¹⁴ és **R¹⁵** jelentése egymástól függetlenül 1-6 szénatomos alkilcsoport, 1-6 szénatomos halogén-alkil-csoport, vagy adott esetben metilcsoporttal vagy nitrocsoporttal szubsztituált fenilcsoport;

R¹⁶ jelentése hidrogénatom, 1-6 szénatomos alkilcsoport, 1-6 szénatomos halogén-alkil-csoport, 2-6 szénatomos alkenilcsoport, 2-6 szénatomos halogén-alkenil-csoport, 2-6 szénatomos alkinilcsoport, 2-6 szénatomos halogén-alkinil-csoport, 2-8 szénatomos alkoxi-alkil-csoport vagy 1-6 szénatomos hidroxi-alkil-csoport;

R¹⁷ és **R¹⁸** jelentése egymástól függetlenül hidrogénatom vagy 1-6 szénatomos alkilcsoport.

A fenti értelmezésben szerelő szubsztituensekre a következő példák említhetők:

Az **R¹** jelentésében szereplő 1-3 szénatomos alkilcsoport lehet például metilcsoport, etilcsoport és izopropilcsoport.

Az **R²** jelentésében szereplő 1-3 szénatomos halogén-alkil-csoport lehet például triklór-metil-csoport, trifluor-metil-csoport, difluor-metil-csoport, klór-difluor-metil-csoport és pentafluor-etil-csoport.

Az **R³** jelentésében szereplő, adott esetben egy vagy több halogénatommal szubsztituált 1-6 szénatomos alkilcsoport lehet például metilcsoport, etilcsoport, izopropilcsoport, difluor-metil-csoport és bróm-difluor-metil-csoport.

Az **R³** jelentésében szereplő 3-6 szénatomos alkenilcsoport lehet például allilcsoport és 1-metil-2-propenil-csoport.

Az **R³** jelentésében szereplő 3-6 szénatomos alkinilcsoport lehet például propargilcsoport és 1-metil-2-propinil-csoport.

A [Q-1], [Q-2], [Q-3], [Q-4] és [Q-5] általános képletű csoportok szubsztituenseire a következő példák említhetők:

Az X, Y és B jelentésében szereplő halogénatom lehet például klórom, fluoratom, brómatom vagy jódatom.

Az R^{10} jelentésében szereplő 1-6 szénatomos alkilcsoport lehet például metilcsoport, etilcsoport, izopropilcsoport, propilcsoport, izobutilcsoport, butilcsoport, terc-butil-csoport, amil-csoport, izoamil-csoport és terc-amil-csoport.

Az R^{10} jelentésében szereplő 1-6 szénatomos halogén-alkil-csoport lehet például difluor-metil-csoport, 1,1,2,2-tetrafluor-etil-csoport és 2,2,2-trifluor-etil-csoport.

Az R^{10} jelentésében szereplő 3-8 szénatomos cikloalkilcsoport lehet például ciklopropilcsoport, ciklobutilcsoport, ciklopentilcsoport és ciklohexilcsoport.

Az R^{10} jelentésében szereplő 3-6 szénatomos alkenilcsoport lehet például allilcsoport, 1-metil-2-propenil-csoport, 3-butenil-csoport, 2-butenil-csoport, 3-metil-2-butenil-csoport és 2-metil-3-butenil-csoport.

Az R^{10} jelentésében szereplő 3-6 szénatomos halogén-alkenil-csoport lehet például 2-klór-2-propenil-csoport és 3,3-diklór-2-propenil-csoport.

Az R^{10} jelentésében szereplő 3-6 szénatomos alkinilcsoport lehet például propargilcsoport, 1-metil-2-propinil-csoport, 2-butenil-csoport és 1,1-dimetil-2-propinil-csoport.

Az R^{10} jelentésében szereplő 3-6 szénatomos halogén-alkinil-csoport lehet például 3-bróm-2-propinil-csoport.

Az R^{10} jelentésében szereplő 1-6 szénatomos ciano-alkil-csoport lehet például ciano-metil-csoport.

Az R^{10} jelentésében szereplő 2-8 szénatomos alkoxi-alkil-csoport lehet például metoxi-metil-csoport, metoxi-etil-csoport, etoxi-metil-csoport és 1-

-etoxi-etil-csoport.

Az R^{10} jelentésében szereplő 2-8 szénatomos alkil-tio-alkil-csoport lehet például metil-tio-metil-csoport és 1-metil-tio-etil-csoport.

Az R^{10} jelentésében szereplő 1-6 szénatomos karboxi-alkil-csoport lehet például karboxi-metil-csoport, 1-karboxi-etil-csoport és 2-karboxi-etil-csoport.

Az R^{10} jelentésében szereplő alkil részeiben 1-6 szénatomos alkoxi-karbonil-alkil-csoport lehet például metoxi-karbonil-metil-csoport, etoxi-karbonil-metil-csoport, propoxi-karbonil-metil-csoport, izopropoxi-karbonil-metil-csoport, butoxi-karbonil-metil-csoport, izobutoxi-karbonil-metil-csoport, terc-butoxi-karbonil-metil-csoport, amil-oxi-karbonil-metil-csoport, izoamil-oxi-karbonil-metil-csoport, terc-amil-oxi-karbonil-metil-csoport, 1-metoxi-karbonil-etil-csoport, 1-etoxi-karbonil-etil-csoport, 1-propoxi-karbonil-etil-csoport, 1-izopropoxi-karbonil-etil-csoport, 1-butoxi-karbonil-etil-csoport, 1-izobutoxi-karbonil-etil-csoport, 1-terc-butoxi-karbonil-etil-csoport, 1-amil-oxi-karbonil-etil-csoport, 1-izoamil-oxi-karbonil-etil-csoport és 1-terc-amil-oxi-karbonil-etil-csoport.

Az R^{10} jelentésében szereplő, alkoxi részeiben 1-4 szénatomos és alkil részében 1-6 szénatomos alkoxi-alkoxi-karbonil-alkil-csoport lehet például metoxi-metoxi-karbonil-metil-csoport és 1-metoxi-metoxi-karbonil-etil-csoport.

Az R^{10} jelentésében szereplő, cikloalkil részében 3-8 szénatomos és alkil részében 1-6 szénatomos cikloalkoxi-karbonil-alkil-csoport lehet például ciklobutil-oxi-karbonil-metil-csoport, ciklopentil-oxi-karbonil-metil-csoport, ciklohexil-oxi-karbonil-metil-csoport, 1-ciklobutil-oxi-karbonil-etil-csoport, 1-ciklopentil-oxi-karbonil-metil-csoport és 1-ciklohexil-oxi-karbonil-etil-csoport.

Az R^{11} és R^{12} jelentésében szereplő 1-6 szénatomos alkilcsoport lehet például metilcsoport, etilcsoport, propilcsoport, butilcsoport, izopropilcsoport és izobutilcsoport.

Az R^{11} és R^{12} jelentésében szereplő 1-6 szénatomos halogén-alkil-csoport lehet például klór-etil-csoport és bróm-etil-csoport.

Az R^{11} és R^{12} jelentésében szereplő 3-6 szénatomos alkenilcsoport lehet például allilcsoport, 1-metil-2-propenil-csoport és 3-butenil-csoport.

Az R^{11} és R^{12} jelentésében szereplő 3-6 szénatomos alkinilcsoport lehet például propargilcsoport és 1-metil-2-propinil-csoport.

Az R^{11} és R^{12} jelentésében szereplő 1-6 szénatomos ciano-alkil-csoport lehet például ciano-metil-csoport.

Az R^{11} és R^{12} jelentésében szereplő 2-8 szénatomos alkoxi-alkil-csoport lehet például metoxi-metil-csoport és 1-metoxi-etil-csoport.

Az R^{11} és R^{12} jelentésében szereplő 2-8 szénatomos alkil-tio-alkil-csoport lehet például metil-tio-metil-csoport és 1-metil-tio-etil-csoport.

Az R^{11} és R^{12} jelentésében szereplő 1-6 szénatomos karboxi-alkil-csoport lehet például karboxi-metil-csoport és 1-karboxi-etil-csoport.

Az R^{11} és R^{12} jelentésében szereplő alkil részeiben 1-6 szénatomos alkoxi-karbonil-alkil-csoport lehet például metoxi-karbonil-metil-csoport, etoxi-karbonil-metil-csoport, propoxi-karbonil-metil-csoport, izopropoxi-karbonil-metil-csoport, butoxi-karbonil-metil-csoport, izobutoxi-karbonil-metil-csoport, terc-butoxi-karbonil-metil-csoport, amil-oxi-karbonil-metil-csoport, izoamil-oxi-karbonil-metil-csoport, terc-amil-oxi-karbonil-metil-csoport, 1-metoxi-karbonil-etil-csoport, 1-etoxi-karbonil-etil-csoport, 1-propoxi-karbonil-etil-csoport, 1-izopropoxi-karbonil-etil-csoport, 1-butoxi-karbonil-etil-csoport, 1-izobutoxi-karbonil-etil-csoport, 1-terc-butoxi-karbonil-etil-csoport, 1-amil-oxi-karbonil-etil-csoport, 1-izoamil-oxi-karbonil-etil-csoport és 1-terc-amil-oxi-karbonil-etil-csoport.

Az R^{11} és R^{12} jelentésében szereplő, alkoxi részeiben 1-4 szénatomos és alkil részében 1-6 szénatomos alkoxi-alkoxi-karbonil-alkil-csoport lehet például metoxi-metoxi-karbonil-metil-csoport és 1-metoxi-metoxi-karbonil-etil-csoport.

Az R^{13} jelentésében szereplő 1-6 szénatomos alkilcsoport lehet például metilcsoport, etilcsoport, propilcsoport, butilcsoport, amilcsoport, izopropilcsoport, izobutilcsoport és izoamilcsoport.

Az R^{13} jelentésében szereplő 1-6 szénatomos halogén-alkil-csoport lehet például 2,2,2-trifluor-etil-csoport, klór-metil-csoport, triklór-metil-csoport és bróm-metil-csoport.

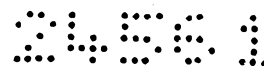
Az R^{13} jelentésében előforduló 3-8 szénatomos cikloalkilcsoport lehet például ciklopropilcsoport, ciklobutilcsoport, ciklopentilcsoport és ciklohexilcsoport.

Az R^{14} és R^{15} jelentésében előforduló 1-6 szénatomos alkilcsoport lehet például metilcsoport, etilcsoport, propilcsoport, butilcsoport és izopropilcsoport.

Az R^{14} és R^{15} jelentésében előforduló 1-6 szénatomos halogén-alkil-csoport lehet például trifluor-metil-csoport, 2,2,2-trifluor-etil-csoport, 2-klór-etil-csoport, klór-metil-csoport és trifluor-metil-csoport.

Az R^{14} és R^{15} jelentésében előforduló, adott esetben metilcsoporttal vagy nitrocsoporttal szubsztituált fenilcsoport lehet például fenilcsoport, 4-metil-fenil-csoport, 2-nitro-fenil-csoport, 3-nitro-fenil-csoport és 4-nitro-fenil-csoport.

Az R^{16} jelentésében előforduló 1-6 szénatomos alkilcsoport lehet például metilcsoport, etilcsoport, propilcsoport, butilcsoport, amilcsoport, izopropilcsoport, izobutilcsoport, terc-butil-csoport, izoamilcsoport és terc-amil-csoport.



Az R^{16} jelentésében előforduló 1-6 szénatomos halogén-alkil-csoport lehet például klór-metil-csoport, diklór-metil-csoport, bróm-metil-csoport, dibró-m-metil-csoport, 1-klór-etil-csoport, 1,1-diklór-etil-csoport, 1-bróm-etil-csoport és 1,1-dibró-m-etil-csoport.

Az R^{16} jelentésében előforduló 2-6 szénatomos alkenilcsoport lehet például vinilcsoport, allilcsoport, 1-propenil-csoport és 1-metil-2-propenil-csoport.

Az R^{16} jelentésében előforduló 2-6 szénatomos halogén-alkenil-csoport lehet például 3,3-diklór-2-propenil-csoport és 3,3-dibró-m-2-propenil-csoport.

Az R^{16} jelentésében előforduló 2-6 szénatomos alkinilcsoport lehet például etinilcsoport és 2-butinil-csoport.

Az R^{16} jelentésében előforduló 2-6 szénatomos halogén-alkinil-csoport lehet például 3-bróm-2-propinil-csoport.

Az R^{16} jelentésében előforduló 2-8 szénatomos alkoxi-alkil-csoport lehet például metoxi-metil-csoport, metoxi-etil-csoport és izopropoxi-metil-csoport.

Az R^{16} jelentésében előforduló 1-6 szénatomos hidroxil-alkil-csoport lehet például hidroxil-metil-csoport.

Az R^{17} és R^{18} jelentésében előforduló 1-6 szénatomos alkilcsoport lehet például metilcsoport.

Az R^4 jelentésében előforduló 1-3 szénatomos alkilcsoport lehet például metilcsoport.

Az R^5 jelentésében előforduló 1-6 szénatomos alkilcsoport lehet például metilcsoport, etilcsoport, propilcsoport, butilcsoport, amilcsoport, izopropilcsoport, izobutilcsoport és izoamilcsoport.

Az R^5 jelentésében előforduló 1-6 szénatomos halogén-alkil-csoport lehet például 2-klór-etil-csoport, 2-bróm-etil-csoport, 3-klór-butil-csoport, 3-bróm-butil-csoport, difluor-metil-csoport és bróm-difluor-metil-csoport.

Az R^5 jelentésében előforduló 3-6 szénatomos alkenilcsoport lehet például allilcsoport, 1-metil-2-propenil-csoport, 3-butenil-csoport, 2-butenil-csoport, 3-metil-2-butenil-csoport és 2-metil-3-butenil-csoport.

Az R^5 jelentésében előforduló 3-6 szénatomos halogén-alkenil-csoport lehet például 2-klór-2-propenil-csoport és 3,3-diklór-2-propenil-csoport.

Az R^5 jelentésében előforduló 3-6 szénatomos alkinilcsoport lehet például propargilcsoport, 1-metil-2-propinil-csoport, 2-butinil-csoport és 1,1-dimetil-2-propinil-csoport.

Az R^5 jelentésében előforduló 3-6 szénatomos halogén-alkinil-csoport lehet például 3-jód-2-propinil-csoport és 3-bróm-2-propinil-csoport.

Az R^5 jelentésében előforduló 1-6 szénatomos ciano-alkil-csoport lehet például ciano-metil-csoport.

Az R^5 jelentésében előforduló 2-8 szénatomos alkoxi-alkil-csoport lehet például metoxi-metil-csoport, etoxi-metil-csoport és 1-metoxi-etil-csoport.

Az R^5 jelentésében előforduló 3-8 szénatomos alkoxi-alkoxi-alkil-csoport lehet például metoxi-etoxi-metil-csoport.

Az R^5 jelentésében előforduló 1-6 szénatomos karboxi-alkil-csoport lehet például karboxi-metil-csoport, 1-karboxi-etil-csoport és 2-karboxi-etil-csoport.

Az R^5 jelentésében előforduló, alkil részeiben 1-6 szénatomos alkoxi-karbonil-alkil-csoport lehet például metoxi-karbonil-metil-csoport, etoxi-karbonil-metil-csoport, propoxi-karbonil-metil-csoport, izopropoxi-karbonil-metil-csoport, butoxi-karbonil-metil-csoport, izobutoxi-karbonil-metil-csoport, terc-butoxi-karbonil-metil-csoport, amil-oxi-karbonil-metil-csoport,

izoamil-oxi-karbonil-metil-csoport, terc-amil-oxi-karbonil-metil-csoport, 1-metoxi-karbonil-etil-csoport, 1-etoxi-karbonil-etil-csoport, 1-propoxi-karbonil-etil-csoport, 1-izopropoxi-karbonil-etil-csoport, 1-butoxi-karbonil-etil-csoport, 1-izobutoxi-karbonil-etil-csoport, 1-terc-butoxi-karbonil-etil-csoport, 1-amil-oxi-karbonil-etil-csoport, 1-izoamil-oxi-karbonil-etil-csoport és 1-terc-amil-oxi-karbonil-etil-csoport.

Az R^5 jelentésében előforduló, alkoxi részeiben 1-4 szénatomos és alkil részében 1-6 szénatomos alkoxi-alkoxi-karbonil-alkil-csoport lehet például metoxi-metoxi-karbonil-metil-csoport és 1-metoxi-metoxi-karbonil-etil-csoport.

Az R^5 jelentésében előforduló, cikloalkil részében 3-8 szénatomos és alkil részében 1-6 szénatomos cikloalkoxi-karbonil-alkil-csoport lehet például ciklobutil-oxi-karbonil-metil-csoport, ciklopentil-oxi-karbonil-metil-csoport, ciklohexil-oxi-karbonil-metil-csoport, 1-ciklobutil-oxi-karbonil-etil-csoport, 1-ciklopentil-oxi-karbonil-etil-csoport és 1-ciklohexil-oxi-karbonil-etil-csoport.

Az R^5 jelentésében előforduló 2-8 szénatomos alkil-tio-alkil-csoport lehet például metil-tio-metil-csoport és 1-metil-tio-etil-csoport.

Az R^5 jelentésében előforduló 1-6 szénatomos alkil-szulfonil-csoport lehet például metánszulfonil-csoport, etánszulfonil-csoport és izopropil-szulfonil-csoport.

Az R^5 jelentésében előforduló 1-6 szénatomos halogén-alkil-szulfonil-csoport lehet például trifluor-metánszulfonil-csoport, klór-metánszulfonil-csoport, diklór-metánszulfonil-csoport, 2-klór-etánszulfonil-csoport és 2,2,2-trifluor-etánszulfonil-csoport.

Az R^5 jelentésében előforduló 1-8 szénatomos alkil-karbonil-csoport lehet például acetyl csoport, etil-karbonil-csoport, propil-karbonil-csoport és izopropil-karbonil-csoport.

Az R^5 jelentésében előforduló 1-8 szénatomos alkoxi-karbonil-csoport lehet például metoxi-karbonil-csoport, etoxi-karbonil-csoport, propoxi-karbonil-csoport, butoxi-karbonil-csoport, amil-oxi-karbonil-csoport, izopropoxi-karbonil-csoport, izobutoxi-karbonil-csoport, terc-butoxi-karbonil-csoport, izoamil-oxi-karbonil-csoport és terc-amil-oxi-karbonil-csoport.

Az R^5 jelentésében előforduló 1-6 szénatomos hidroxi-alkil-csoport lehet például hidroxi-metil-csoport, hidroxi-etil-csoport és hidroxi-propil-csoport.

Az R^6 jelentésében előforduló 1-6 szénatomos alkilcsoport lehet például metilcsoport és etilcsoport.

Az R^6 jelentésében előforduló 1-6 szénatomos halogén-alkil-csoport lehet például bróm-metil-csoport, dibróm-metil-csoport, tribróm-metil-csoport, 1-bróm-etil-csoport, klór-metil-csoport, diklór-metil-csoport és triklór-metil-csoport.

Az R^6 jelentésében előforduló 1-6 szénatomos hidroxi-alkil-csoport lehet például hidroxi-metil-csoport.

Az R^6 jelentésében előforduló, alkil részeiben 1-6 szénatomos alkoxi-alkil-csoport lehet például metoxi-metil-csoport, etoxi-metil-csoport, propoxi-metil-csoport és izopropoxi-metil-csoport.

Az R^6 jelentésében előforduló és alkil részeiben 1-6 szénatomos alkoxi-alkoxi-alkil-csoport lehet például metoxi-metoxi-metil-csoport, metoxi-etoxi-metil-csoport és etoxi-metoxi-metil-csoport.

Az R^6 jelentésében előforduló, alkil részeiben 1-6 szénatomos alkil-karbonil-oxi-alkil-csoport lehet például acetil-oxi-metil-csoport, etil-karbonil-oxi-metil-csoport és izopropil-karbonil-oxi-metil-csoport.

Az R^6 jelentésében előforduló, alkil részeiben 1-6 szénatomos halogén-alkil-karbonil-oxi-alkil-csoport lehet például trifluor-acetil-oxi-metil-csoport, klór-acetil-oxi-metil-csoport és triklór-acetil-oxi-metil-csoport.

Az R^6 jelentésében előforduló 1-6 szénatomos alkoxi-karbonil-csoport lehet például metoxi-karbonil-csoport, etoxi-karbonil-csoport, propoxi-karbonil-csoport, butoxi-karbonil-csoport, amil-oxi-karbonil-csoport, izopropoxi-karbonil-csoport, izobutoxi-karbonil-csoport és izoamil-oxi-karbonil-csoport.

Az R^6 jelentésében előforduló 1-6 szénatomos alkil-karbonil-csoport lehet például metil-karbonil-csoport, etil-karbonil-csoport és izopropil-karbonil-csoport.

Az R^7 jelentésében előforduló 1-3 szénatomos alkilcsoport lehet például metilcsoport.

Az R^8 jelentésében előforduló 1-6 szénatomos alkilcsoport lehet például metilcsoport és etilcsoport.

Az R^8 jelentésében előforduló 1-6 szénatomos halogén-alkil-csoport lehet például klór-metil-csoport, bróm-metil-csoport és fluor-metil-csoport.

Az R^8 jelentésében előforduló 1-6 szénatomos hidroxil-alkil-csoport lehet például hidroxil-metil-csoport.

Az R^8 jelentésében előforduló 2-8 szénatomos alkoxi-alkil-csoport lehet például metoxi-metil-csoport, etoxi-metil-csoport, izopropoxi-metil-csoport, butoxi-metil-csoport és izobutoxi-metil-csoport.

Az R^8 jelentésében előforduló 3-10 szénatomos alkoxi-alkoxi-alkil-csoport lehet például metoxi-metoxi-metil-csoport, metoxi-etoxi-metil-csoport és etoxi-metoxi-metil-csoport.

Az R^8 jelentésében előforduló, alkil részeiben 1-6 szénatomos alkil-karbonil-oxi-alkil-csoport lehet például acetyl-oxi-metil-csoport, etil-karbonil-oxi-metil-csoport és izopropil-karbonil-oxi-metil-csoport.

Az R^8 jelentésében előforduló, alkil részeiben 1-6 szénatomos halogén-alkil-karbonil-oxi-alkil-csoport lehet például 2-klór-etil-karbonil-oxi-metil-

-csoport, trifluor-acetil-oxi-metil-csoport és pentafluor-etil-karbonil-oxi-metil-csoport.

Az R^8 jelentésében előforduló 1-6 szénatomos karboxi-alkil-csoport lehet például karboxi-metil-csoport és 1-karboxi-etil-csoport.

Az R^8 jelentésében előforduló 1-8 szénatomos alkoxi-karbonil-csoport lehet például metoxi-karbonil-csoport, etoxi-karbonil-csoport, propoxi-karbonil-csoport, butoxi-karbonil-csoport, amil-oxi-karbonil-csoport, izopropoxi-karbonil-csoport, izobutoxi-karbonil-csoport és izoamil-oxi-karbonil-csoport.

Az R^8 jelentésében előforduló 1-6 szénatomos halogén-alkoxi-karbonil-csoport lehet például 2-klór-etoxi-karbonil-csoport, 2-bróm-etoxi-karbonil-csoport, 3-klór-butoxi-karbonil-csoport, 1-klór-2-propoxi-karbonil-csoport, 1,3-diklór-2-propoxi-karbonil-csoport, 2,2-diklór-etoxi-karbonil-csoport, 2,2,2-trifluor-etoxi-karbonil-csoport, 2,2,2-triklór-etoxi-karbonil-csoport és 2,2,2-tribróm-etoxi-karbonil-csoport.

Az R^8 jelentésében előforduló 3-10 szénatomos cikloalkoxi-karbonil-csoport lehet például ciklobutil-oxi-karbonil-csoport, ciklopentil-oxi-karbonil-csoport és ciklohexil-oxi-karbonil-csoport.

Az R^8 jelentésében előforduló 3-8 szénatomos alkenil-oxi-karbonil-csoport lehet például allil-oxi-karbonil-csoport és 3-butenil-oxi-karbonil-csoport.

Az R^8 jelentésében előforduló 3-8 szénatomos alkinil-oxi-csoport lehet például propargil-oxi-karbonil-csoport, 3-butinil-oxi-karbonil-csoport és 1-metil-2-propinil-oxi-karbonil-csoport.

Az R^8 jelentésében előforduló 1-6 szénatomos alkil-amino-karbonil-csoport lehet például metil-amino-karbonil-csoport, etil-amino-karbonil-csoport és propil-amino-karbonil-csoport.

Az R^8 jelentésében előforduló, alkil részeiben 1-6 szénatomos dialkil-

-amino-karbonil-csoport lehet például dimetil-amino-karbonil-csoport, dietil-amino-karbonil-csoport és diizopropil-amino-karbonil-csoport.

Az R^8 jelentésében előforduló, alkil részeiben 1-6 szénatomos alkil-amino-karbonil-oxi-alkil-csoport lehet például metil-amino-karbonil-oxi-metil-csoport, etil-amino-karbonil-oxi-metil-csoport és propil-amino-karbonil-oxi-metil-csoport.

Az R^8 jelentésében előforduló, alkil részeiben 1-6 szénatomos dialkil-amino-karbonil-oxi-alkil-csoport lehet például dimetil-amino-karbonil-oxi-metil-csoport és dietil-amino-karbonil-oxi-metil-csoport.

Herbicid hatékonyságuk alapján előnyösek azok a találmány szerinti vegyületek, melyek képletében

R^1 jelentése hidrogénatom;

R^2 jelentése egy vagy több fluoratómmal szubsztituált metilcsoport, így trifluor-metil-csoport, difluor-metil-csoport vagy klór-difluor-metil-csoport, vagy egy vagy több fluoratómmal szubsztituált etilcsoport, így pentafluor-etil-csoport, különösen előnyösen trifluor-metil-csoport;

R^3 jelentése metilcsoport vagy etilcsoport, különösen előnyösen metilcsoport;

Q jelentése [Q-1], [Q-2], [Q-3] vagy [Q-4] általános képletű csoport;

Y jelentése halogénatom;

Z^1 jelentése oxigénatom vagy kénatom;

Z^2 jelentése oxigénatom;

B jelentése hidrogénatom, nitrocsoport, $-OR^{10}$, $-SR^{10}$, $-NHR^{10}$, $-NHSO_2R^{14}$, $-COOR^{13}$ vagy $-CH_2CHWCOOR^{13}$ általános képletű csoport, ahol

W jelentése hidrogénatom vagy klóratom;

R^{10} jelentése 1-6 szénatomos alkilcsoport, 3-6 szénatomos cikloalkil-csoport, 3-6 szénatomos alkenilcsoport, 3-6 szénatomos halogén-alkenil-csoport, 3-6 szénatomos alkinilcsoport, 1-6 szénatomos

ciano-alkil-csoport vagy alkil részeiben 1-6 szénatomos alkoxi-
-karbonil-alkil-csoport;

R¹³ jelentése 1-6 szénatomos alkilcsoport;

R¹⁴ jelentése 1-6 szénatomos alkilcsoport;

R⁵ jelentése 1-6 szénatomos alkilcsoport, 3-6 szénatomos alkenilcsoport
vagy 3-6 szénatomos alkinilcsoport;

R⁶ jelentése 1-6 szénatomos alkilcsoport, 1-6 szénatomos halogén-alkil-
-csoport, formilcsoport, hidroximetil-csoport, 1-6 szénatomos alkoxi-
-metil-csoport, 1-6 szénatomos alkil-karbonil-oxi-metil-csoport vagy
1-6 szénatomos alkoxi-karbonil-csoport;

R⁷ jelentése hidrogénatom vagy metilcsoport;

R⁸ jelentése metilcsoport, hidroximetil-csoport, 1-6 szénatomos alkoxi-
-metil-csoport, 1-5 szénatomos alkil-karbonil-oxi-metil-csoport, karbo-
xilcsoport vagy 1-6 szénatomos alkoxi-karbonil-csoport.

Herbicidek hatékonyságuk alapján előnyös példaként említhetők azok a
találmány szerinti vegyületek, amelyek a fent említett előnyös szubsztituen-
sek kombinációját tartalmazzák. Az ilyen vegyületek közül különösen elő-
nyösek azok, melyek képletében Q jelentése [Q-1] vagy [Q-2] általános
képletű csoport.

Ha Q jelentése [Q-1] általános képletű csoport, akkor B jelentése elő-
nyösen hidrogénatom, -OR¹⁰ vagy -NHR¹⁰ általános képletű csoport. Az
ilyen vegyületek közül különösen előnyösek azok, melyek képletében B je-
lentése -OR¹⁰ általános képletű csoport, ahol R¹⁰ jelentése 3-6 szénatomos
alkinilcsoport vagy alkil részeiben 1-6 szénatomos alkoxi-karbonil-alkil-cso-
port, vagy B jelentése -NHR¹⁰ általános képletű csoport, ahol R¹⁰ jelentése
alkil részeiben 1-6 szénatomos alkoxi-karbonil-alkil-csoport. Az ilyen ve-
gyületek közül különösen előnyösek azok, ahol R¹⁰ jelentése 3-4 szénato-
mos alkinilcsoport, 1-6 szénatomos alkoxi-karbonil-metil-csoport vagy 1-6

szénatomos 1-alkoxi-karbonil-etil-csoport. Az ilyen vegyületek közül különösen előnyösek azok, melyek képletében R^1 jelentése hidrogénatom, R^3 jelentése metilcsoport, X jelentése fluoratom és Y jelentése klóratom.

Ha Q jelentése [Q-2] általános képletű csoport, akkor Z^1 előnyös jelentése oxigénatom, n előnyös értéke 1, R^4 előnyös jelentése hidrogénatom és R^5 előnyös jelentése 3-6 szénatomos alkinilcsoport. Az ilyen vegyületek közül különösen előnyösek azok, amelyek képletében R^5 jelentése 3-4 szénatomos alkinilcsoport. Az ilyen vegyületek közül különösen előnyösek azok, melyek képletében R^1 jelentése hidrogénatom, R^3 jelentése metilcsoport és X jelentése fluoratom.

Külön kiemeljük azokat a találmány szerinti vegyületeket, melyek képletében R^1 jelentése hidrogénatom, R^2 jelentése trifluor-metil-csoport, R^3 jelentése metilcsoport, Q jelentése [Q-1] általános képletű csoport, X jelentése fluoratom, Y jelentése klóratom és B jelentése propargil-oxi-csoport, 1-(etoxi-karbonil)-etil-amino-csoport vagy hidrogénatom. Külön kiemeljük továbbá azokat a vegyületeket, amelyek képletében R^1 jelentése hidrogénatom, R^2 jelentése trifluor-metil-csoport, R^3 jelentése metilcsoport, Q jelentése [Q-2] általános képletű csoport, X jelentése fluoratom, Z^1 jelentése oxigénatom, n értéke 1, R^4 jelentése hidrogénatom és R^5 jelentése propargilcsoport.

Kultúrnövényekre vonatkozó szelektivitásuk miatt különösen előnyösek azok a találmány szerinti vegyületek, melyek képletében R^1 jelentése hidrogénatom, R^2 jelentése trifluor-metil-csoport, R^3 jelentése metilcsoport, Q jelentése [Q-1] általános képletű csoport, X jelentése klóratom, Y jelentése klóratom és B jelentése 1-(etoxi-karbonil)-etil-amino-csoport.

A találmány szerinti vegyületek egyes képviselői legalább egy aszimmetrikus szénatomot tartalmaznak, és ezért optikai izomerek formájában fordulhatnak elő. Az optalmi kör kiterjed az összes lehetséges optikai izo-

merre.

A találmány szerinti vegyületek előállítását az alábbi eljárásokkal ismertettjük.

1. eljárás

Ezt az eljárást az 1. reakcióvázlat szemlélteti, a képletekben R^1 , R^2 , R^3 , Q és D jelentése a fenti.

A reakciót általában bázis jelenlétében és oldószerben végezzük. A reakcióhőmérséklet általában $-20\text{ }^{\circ}\text{C}$ és $+250\text{ }^{\circ}\text{C}$ közötti, előnyösen $15-150\text{ }^{\circ}\text{C}$ közötti, különösen előnyösen $80-120\text{ }^{\circ}\text{C}$ közötti. A reakcióidő általában 1 perc és 72 óra közötti, előnyösen 48-72 óra. Az eljárás megvalósítása során 1 mol [2] általános képletű vegyületet általában 1 mol vagy feleslegben alkalmazott [3] általános képletű vegyülettel és 1 mol vagy feleslegben alkalmazott bázissal reagáltatunk.

Oldószerként alkalmazhatók ketonok, így aceton vagy metil-izobutil-keton; alifás szénhidrogének, így hexán, heptán, ligroin, ciklohexán és petroléter; aromás szénhidrogének, így benzol, toluol vagy xilol; halogénezett szénhidrogének, így klór-benzol vagy diklór-benzol; éterek, így dietil-éter, diizopropil-éter, dioxán, tetrahidrofurán, etilénlikol vagy dimetil-éter; nitro vegyületek, így nitro-metán vagy nitro-benzol; savamidok, így formamid, N,N-dimetil-formamid vagy acetamid; tercier aminok, így piridin, trietil-amin, diizopropil-etil-amin, N,N-dimetil-anilin, N,N-dietil-anilin vagy N-metil-morfolin; kénvegyületek, így dimetil-szulfoxid vagy szulfolán; alkoholok, így metanol, etanol, etilénlikol vagy izopropanol, valamint ezek elegyei. Előnyös az N,N-dimetil-formamid, acetamid és 1,2-diklór-etán.

Bázisként alkalmazhatók szervetlen bázisok, így nátrium-hidrid, kálium-hidrid, nátrium-hidroxid, kálium-hidroxid, nátrium-karbonát vagy kálium-karbonát; és szerves bázisok, így trietil-amin, diizopropil-etil-amin, piridin, 4-metil-amino-piridin, N,N-dimetil-anilin vagy N,N-dietil-anilin.



A reakció befejeződése után a reakcióelegyet vízre öntjük és a kívált kristályokat szűrjük, vagy a reakcióelegyet a szokásos utókezeléseknek vetjük alá, így szerves oldószerrel extraháljuk, bepároljuk és kívánt esetben a szokásos módon, például oszlopkromatográfiásan vagy átkristályosítással tisztítjuk. Így a kívánt találmány szerinti vegyületeket kapjuk.

Az eljárás során melléktermékként [I-1] általános képletű vegyületek keletkeznek, a képletben R^1 , R^2 , R^3 és Q jelentése a fenti, a reakciókörülményektől függően. Ezek a vegyületek a találmány szerinti vegyületekkel hasonló módon izolálhatók. A fenti vegyületek egyes képviselői szintén herbicid hatással rendelkeznek.

2. eljárás

Ezt az eljárást a 2. reakcióvázlat szemlélteti, ahol R^{19} jelentése 1-6 szénatomos alkilcsoport, R^{51} jelentése hidrogénatom kivételével valamely R^5 jelentésében megadott csoport, R^1 , R^2 , R^3 , R^4 és X jelentése a fenti.

[I-2] általános képletű vegyületek előállítása [I-1] általános képletű vegyületekből

A [I-2] általános képletű vegyületek előállíthatók a [I-1] általános képletű vegyületek nitrálásával, amit nitrálószerrel oldószerben végzünk. Nitrálószerként alkalmazható például salétromsav, melynek mennyisége 1 mol [I-1] általános képletű vegyületre számolva általában 1-10 mol. Oldószerként alkalmazható például kénsav. A reakcióhőmérséklet általában $-10\text{ }^{\circ}\text{C}$ és szobahőmérséklet közötti, a reakcióidő 1 perc és 24 óra közötti.

[I-3] általános képletű vegyületek előállítása [I-2] általános képletű vegyületekből

A [I-3] általános képletű vegyületek előállíthatók, ha a [I-2] általános képletű vegyületet egy [4] általános képletű vegyülettel reagáltatjuk, a képletben R^4 és R^{19} jelentése a fenti. A reakciót kálium-fluorid jelenlétében és oldószerben végezzük. A [4] általános képletű vegyületet általában 1-50 mol

mennyiségben, és a kálium-fluoridot általában 1-50 mol mennyiségben alkalmazunk 1 mol [I-2] általános képletű vegyületre vonatkoztatva. Oldószerként előnyösen alkalmazható az 1,4-dioxán. A reakciót szobahőmérséklet és az oldószer forráspontja közötti hőmérsékleten végezzük, a reakcióidő 1 perc és 96 óra közötti.

[I-4] általános képletű vegyületek előállítása [I-3] általános képletű vegyületekből

A [I-4] általános képletű vegyületek előállíthatók, ha [I-3] általános képletű vegyületet például vasporral redukálunk sav jelenlétében és oldószerben. A vasport általában 3 mol vagy ennél nagyobb mennyiségben alkalmazunk 1 mol [I-3] általános képletű vegyületre vonatkoztatva. Savként előnyösen alkalmazható az ecetsav. A sav mennyisége 1 mol [I-3] általános képletű vegyületre vonatkoztatva legalább 1 mol vagy ennél több. Oldószerként alkalmazható például víz vagy etil-acetát. A reakciót szobahőmérséklet és a reakcióelegy forráspontja közötti hőmérsékleten végezzük, a reakcióidő 1 perc és 24 óra közötti.

A [I-4] általános képletű vegyületek előállíthatók úgy is, hogy a [I-3] általános képletű vegyületeket katalizátor jelenlétében hidrogénatmoszférában redukáljuk oldószerben. Katalizátorként alkalmazható például palládium/szén katalizátor, melynek mennyisége 1 mol [I-3] általános képletű vegyületre vonatkoztatva 0,01-1 mol. Oldószerként alkalmazható például etil-acetát, ecetsav vagy ezek elegye. A reakcióhőmérséklet általában szobahőmérséklet és a reakcióelegy forráspontja közötti, a reakcióidő 1 perc és 24 óra közötti.

[I-5] általános képletű vegyületek előállítása [I-4] általános képletű vegyületekből

A [I-5] általános képletű vegyületek előállíthatók, ha a [I-4] általános képletű vegyületet [5] általános képletű vegyülettel reagáltatjuk,

$R^{51}-D$

[5]

a képletben R^{51} és D jelentése a fenti.

A reakciót általában bázis jelenlétében és oldószerben végezzük. A reakcióhőmérséklet általában $-20\text{ }^{\circ}\text{C}$ és $+150\text{ }^{\circ}\text{C}$ közötti, előnyösen $0-100\text{ }^{\circ}\text{C}$ közötti. A reakcióidő általában 1 perc és 72 óra közötti. A reakció megvalósításához 1 mol [I-4] általános képletű vegyületet általában 1 mol vagy feleslegben alkalmazott [5] általános képletű vegyülettel és 1 mol vagy feleslegben alkalmazott bázissal reagáltatunk.

Bázisként alkalmazhatók például szervetlen bázisok, így nátrium-hidrid, kálium-hidrid, nátrium-hidroxid, kálium-hidroxid, kálium-karbonát és nátrium-karbonát, valamint szerves bázisok, így trietil-amin, diizopropil-etil-amin, piridin, 4-dimetil-amino-piridin, N,N-dimetil-anilin és N,N-dietyl-anilin.

Oldószerként alkalmazhatók például ketonok, így aceton vagy metil-izobutil-keton; alifás szénhidrogének, így hexán, heptán, ligroin, ciklohexán vagy petroléter; aromás szénhidrogének, így benzol, toluol vagy xilol; halogénezett szénhidrogének, így klór-benzol vagy diklór-benzol; éterek, így dietyl-éter, diizopropil-éter, dioxán, tetrahydrofurán vagy etilén-glikol-dimetil-éter; nitro-vegyületek, így nitro-metán vagy nitro-benzol; savamidok, így formamid, N,N-dimetil-formamid vagy acetamid; terciér aminok, így piridin, trietyl-amin, diizopropil-etyl-amin, N,N-dimetil-anilin, N,N-dietyl-anilin vagy N-metil-morfolin; kén-vegyületek, így dimetil-szulfoxid vagy szulforán; alkoholok, így metanol, etanol, etilén-glikol vagy izopropanol, valamint ezek elegyei.

A reakció befejezése után a reakcióelegyet vízre öntjük, és kívánt esetben a szokásos utókezeléssel feldolgozzuk, így szerves oldószerrel extraháljuk és bepároljuk, majd kívánt esetben például oszlop-kromatográfián vagy átkristályosítással tisztítjuk. Így [I-5] általános képletű vegyületet kapunk.

A [I-3] általános képletű vegyületek előállíthatók továbbá a 2-1. reakcióvázlatban ábrázolt módon, ahol R^1 , R^2 , R^3 , R^4 , R^{19} és X jelentése a fenti.

[I-7] általános képletű vegyületek előállítása [I-6] általános képletű vegyületekből

A [I-7] általános képletű vegyületek előállíthatók, ha egy [I-6] általános képletű vegyületet egy [6] általános képletű vegyülettel reagáltatunk, a képletben R^4 és R^{19} jelentése a fenti, bázis jelenlétében, és oldószerben. A [6] általános képletű vegyületet 1-2 mol mennyiségben alkalmazzuk 1 mol [I-6] általános képletű vegyületre vonatkoztatva. Bázisként alkalmazható például nátrium-hidrid vagy kálium-karbonát. A bázist általában 1-5 mol mennyiségben alkalmazzuk 1 mol [I-6] általános képletű vegyületre vonatkoztatva. Oldószerként alkalmazható például 1,4-dioxán vagy N,N-dimetil-formamid. A reakcióhőmérséklet általában 0-100 °C, a reakcióidő 1 perc és 24 óra közötti.

[I-3] általános képletű vegyületek előállítása [I-7] általános képletű vegyületekből

A [I-3] általános képletű vegyületek előállíthatók, ha [I-7] általános képletű vegyületet nitrálószerrel reagáltatunk oldószerben. Nitrálószerként alkalmazható például salétromsav, melynek mennyisége 1 mol [I-7] általános képletű vegyületre számolva általában 1-10 mol. Oldószerként előnyösen alkalmazható a kénsav. A reakcióhőmérséklet általában -10 °C és szobahőmérséklet közötti, a reakcióidő 1 perc és 24 óra közötti.

[I-8] általános képletű vegyületek előállítása [I-6] általános képletű vegyületekből

A [I-8] általános képletű vegyületek előállíthatók, ha [I-6] általános képletű vegyületet nitrálószerrel reagáltatunk oldószerben. Nitrálószerként előnyösen alkalmazható a salétromsav, melynek mennyisége 1 mol [I-6] általános képletű vegyületre vonatkoztatva általában 1-10 mol. Oldószerként

előnyösen alkalmazható a kénsav. A reakcióhőmérséklet általában $-10\text{ }^{\circ}\text{C}$ és szobahőmérséklet közötti, a reakcióidő 1 perc és 24 óra közötti.

[I-3] általános képletű vegyületek előállítása [I-8] általános képletű vegyületekből

A [I-3] általános képletű vegyületek előállíthatók, ha [I-8] általános képletű vegyületet [6] általános képletű vegyülettel reagáltatunk bázis jelenlétében és oldószerben. A [6] általános képletű vegyületet 1-2 mol mennyiségben alkalmazzuk 1 mol [I-8] általános képletű vegyületre vonatkoztatva. Bázisként előnyösen alkalmazható a nátrium-hidrid vagy kálium-karbonát. A bázist általában 1-5 mol mennyiségben alkalmazzuk 1 mol [I-8] általános képletű vegyületre vonatkoztatva. Oldószerként előnyösen használható az 1,4-dioxán vagy N,N-dimetil-formamid. A reakcióhőmérséklet általában $0-100\text{ }^{\circ}\text{C}$ közötti, a reakcióidő 1 perc és 24 óra közötti.

3. eljárás

Ezt az eljárást a 3. reakcióvázlat szemlélteti, ahol X, R^1 , R^2 , R^3 és R^{51} jelentése a fenti.

[I-10] általános képletű vegyületek előállítása [I-9] általános képletű vegyületekből

A [I-10] általános képletű vegyületek előállíthatók, ha [I-9] általános képletű vegyületet például vasporral reagáltatunk sav jelenlétében és oldószerben. A vasport általában 3 mol vagy ennél nagyobb mennyiségben alkalmazzuk 1 mol [I-9] általános képletű vegyületre vonatkoztatva. Savként előnyösen alkalmazható az ecetsav, melynek mennyisége általában 1 mol vagy ennél több 1 mol [I-9] általános képletű vegyületre vonatkoztatva. Oldószerként előnyösen alkalmazható a víz vagy etil-acetát. A reakcióhőmérséklet általában szobahőmérséklet és a reakcióelegy forráspontja közötti, a reakcióidő 1 perc és 24 óra közötti.

[I-11] általános képletű vegyületek előállítása [I-10] általános képletű vegyületekből

A [I-11] általános képletű vegyületek előállíthatók, ha [I-10] általános képletű vegyületet nátrium-tiocianáttal vagy kálium-tiocianáttal reagáltatunk oldószerben, majd a kapott vegyületet brómmal vagy klórral reagáltatjuk oldószerben. A nátrium-tiocianátot vagy kálium-tiocianátot általában 1-10 mol mennyiségben alkalmazzuk 1 mol [I-10] általános képletű vegyületre vonatkoztatva. A brómot vagy klórt általában 1-10 mol mennyiségben alkalmazzuk 1 mol [I-10] általános képletű vegyületre vonatkoztatva. Oldószerként előnyösen alkalmazható a vizes sósav, vizes ecetsav vagy vizes kénsav. A reakcióhőmérséklet általában 0-50 °C közötti, a reakcióidő 1 perc és 150 óra közötti.

[I-12] általános képletű vegyületek előállítása [I-11] általános képletű vegyületekből

A [I-12] általános képletű vegyületek előállíthatók, ha 1) [I-11] általános képletű vegyületet nátrium-nitrittel vagy kálium-nitrittel reagáltatunk oldószerben, majd 2) savas oldatban melegítjük.

Az 1) reakciónál a nátrium-nitritet vagy kálium-nitritet általában 1-2 mol mennyiségben alkalmazzuk 1 mol [I-11] általános képletű vegyületre vonatkoztatva. Oldószerként előnyösen alkalmazható a vizes sósav vagy vizes kénsav. A reakcióhőmérséklet általában -10 °C és +10 °C közötti, a reakcióidő 1 perc és 5 óra közötti.

A 2) reakciónál savas oldatként előnyösen alkalmazható a vizes sósav vagy vizes kénsav. A reakcióhőmérséklet általában 70 °C és a reakcióelegy forráspontja közötti, a reakcióidő 1 perc és 24 óra közötti.

[I-13] általános képletű vegyületek előállítása [I-12] általános képletű vegyületekből

A [I-13] általános képletű vegyületek előállíthatók, ha [I-12] általános

képletű vegyületet [5] általános képletű vegyülettel reagáltatunk bázis jelenlétében és oldószerben. Az [5] általános képletű vegyületet 1-3 mol mennyiségben alkalmazzuk 1 mol [I-12] általános képletű vegyületre vonatkoztatva. Bázisként előnyösen alkalmazható a nátrium-hidrid vagy kálium-karbonát. A bázist általában 1-10 mol mennyiségben alkalmazzuk 1 mol [I-12] általános képletű vegyületre vonatkoztatva. Oldószerként előnyösen használható az 1,4-dioxán vagy N,N-dimetil-formamid. A reakcióhőmérséklet általában 0-100 °C közötti, a reakcióidő 1 perc és 48 óra közötti.

4. eljárás

Ezt az eljárást a 4. reakcióvázlat szemlélteti, ahol X, R¹, R², R³ és R⁵ jelentése a fenti.

[I-15] általános képletű vegyületek előállítása [I-14] általános képletű vegyületekből

A [I-15] általános képletű vegyületek előállíthatók, ha [I-14] általános képletű vegyületet például vasporral redukálunk sav jelenlétében és oldószerben. A vasport 3 mol vagy ennél nagyobb mennyiségben alkalmazzuk 1 mol [I-14] általános képletű vegyületre vonatkoztatva. Savként előnyösen alkalmazható az ecetsav, melynek mennyisége 1 mol vagy ennél nagyobb 1 mol [I-14] általános képletű vegyületre vonatkoztatva. Oldószerként előnyösen használható a víz vagy etil-acetát. A reakcióhőmérséklet általában szobahőmérséklet és a reakcióelegy forráspontja közötti, a reakcióidő 1 perc és 24 óra közötti.

[I-16] általános képletű vegyületek előállítása [I-15] általános képletű vegyületekből

A [I-16] általános képletű vegyületek előállíthatók, ha 1) a [I-15] általános képletű vegyületet egy nitritsóval oldószerben diazóniumsóvá alakítjuk, majd 2) a diazóniumsót magas hőmérsékleten és oldószerben ciklizáljuk.

Az 1) reakciónál nitrítsóként előnyösen alkalmazható a nátrium-nitrit vagy kálium-nitrit, melynek mennyisége 1 mol [I-15] általános képletű vegyületre vonatkoztatva 1-2 mol. Oldószerként előnyösen alkalmazható a vizes sósav vagy vizes kénsav. A reakcióhőmérséklet általában $-10\text{ }^{\circ}\text{C}$ és $+10\text{ }^{\circ}\text{C}$ közötti, a reakcióidő 1 perc és 5 óra közötti.

A 2) reakciónál oldószerként előnyösen alkalmazható vizes sósav vagy vizes kénsav, a reakcióhőmérséklet szobahőmérséklet és $80\text{ }^{\circ}\text{C}$ közötti, a reakcióidő 1 perc és 24 óra közötti.

5. eljárás

Ezt az eljárást az 5. reakcióvázlat szemlélteti, ahol Y^1 jelentése nitro-csoport kivételével valamely Y jelentésében megadott csoport, R^{101} jelentése hidrogénatom kivételével valamely R^{10} jelentésében megadott csoport, X, R^1 , R^2 és R^3 jelentése a fenti.

[I-18] általános képletű vegyületek előállítása [I-17] általános képletű vegyületekből

A [I-18] általános képletű vegyületek előállíthatók, ha [I-17] általános képletű vegyületet nitrálószerrel reagáltatunk oldószerben. Nitrálószerként előnyösen alkalmazható a salétromsav, melynek mennyisége 1 mol [I-17] általános képletű vegyületre vonatkoztatva általában 1-10 mol. Oldószerként előnyösen használható a kénsav. A reakcióhőmérséklet $-10\text{ }^{\circ}\text{C}$ és szobahőmérséklet közötti, a reakcióidő 1 perc és 24 óra közötti.

[I-19] általános képletű vegyületek előállítása [I-18] általános képletű vegyületekből

A [I-19] általános képletű vegyületek előállíthatók, ha [I-18] általános képletű vegyületet például vasporral redukálunk sav jelenlétében és oldószerben. A vasport általában 3 mol vagy ennél nagyobb mennyiségben alkalmazzuk 1 mol [I-18] általános képletű vegyületre vonatkoztatva. Savként előnyösen használható az ecetsav, melynek mennyisége 1 mol [I-18] által-

nos képletű vegyületre vonatkoztatva általában 1 mol vagy ennél nagyobb. Oldószerként előnyösen használható a víz vagy etil-acetát. A reakcióhőmérséklet általában szobahőmérséklet és a reakcióelegy forráspontja közötti, a reakcióidő 1 perc és 24 óra közötti.

[I-20] általános képletű vegyületek előállítása [I-19] általános képletű vegyületekből

A [I-20] általános képletű vegyületek előállíthatók, ha 1) [I-19] általános képletű vegyületet nitritsóval reagáltatunk oldószerben, majd 2) savas oldatban melegítjük.

Az 1) reakcióban nitritsóként előnyösen alkalmazható a nátrium-nitrit vagy kálium-nitrit, melynek mennyisége 1 mol [I-19] általános képletű vegyületre vonatkoztatva általában 1-2 mol. Oldószerként előnyösen használható a vizes sósav vagy vizes kénsav. A reakcióhőmérséklet általában -10 °C és +10 °C közötti, a reakcióidő 1 perc és 5 óra közötti.

A 2) reakcióban savas oldószerként előnyösen használható a vizes sósav vagy vizes kénsav, a reakcióhőmérséklet 70 °C és a reakcióelegy forráspontja közötti, a reakcióidő 1 perc és 24 óra közötti.

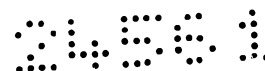
[I-21] általános képletű vegyületek előállítása [I-20] általános képletű vegyületekből

A [I-21] általános képletű vegyületek előállíthatók, ha [I-20] általános képletű vegyületet egy [7] általános képletű vegyülettel reagáltatunk,



a képletben R^{101} és D jelentése a fenti.

A reakciót általában bázis jelenlétében végezzük oldószerben. A reakcióhőmérséklet általában -20 °C és +150 °C közötti, előnyösen 0-50 °C közötti. A reakcióidő általában 1 perc és 48 óra közötti. A reakció megvalósí-



tásához 1 mol [I-20] általános képletű vegyületet általában 1-3 mol [7] általános képletű vegyülettel és 1-5 mol bázissal reagáltatunk.

Bázisként alkalmazhatók például szervetlen bázisok, így nátrium-hidrid, kálium-hidrid, nátrium-hidroxid, kálium-hidroxid, kálium-karbonát vagy nátrium-karbonát; és szerves bázisok, így trietil-amin, diizopropil-etil-amin, piridin, 4-dimetil-amino-piridin, N,N-dimetil-anilin vagy N,N-dietil-anilin.

Oldószerként alkalmazhatók például alifás szénhidrogének, így hexán, heptán, ligroin, ciklohexán vagy petroléter; aromás szénhidrogének, így benzol, toluol vagy xilol; halogénezett szénhidrogének, így klór-benzol vagy diklór-benzol; éterek, így dietil-éter, diizopropil-éter, dioxán, tetrahidrofurán vagy etilén-glikol-dimetil-éter; nitrovegyületek, így nitro-benzol; savamidok, így formamid, N,N-dimetil-formamid vagy acetamid; tercier aminok, így piridin, trietil-amin, diizopropil-etil-amin, N,N-dimetil-amin, N,N-dietil-anilin vagy N-metil-morfolin, valamint ezek elegyei.

A reakció befejezése után a reakcióelegyet vízre öntjük, és kívánt esetben a szokásos utókezelésekkel feldolgozzuk, így szerves oldószerrel extraháljuk és bepároljuk, majd kívánt esetben például oszlopkromatográfiásan vagy átkristályosítással tisztítjuk. Így [I-21] általános képletű vegyületet kapunk.

A [I-20] általános képletű vegyületek előállíthatók továbbá az 5-1. reakcióvázlat szerint, ahol X, Y, R¹, R² és R³ jelentése a fenti.

[I-20] általános képletű vegyületek előállítása [I-22] általános képletű vegyületekből

A [I-20] általános képletű vegyületek előállíthatók, ha a védőcsoportot a [I-22] általános képletű vegyületről hidrogén-bromid/ecetsav jelenlétében oldószer nélkül lehasítjuk. A hidrogén-bromid/ecetsav elegyet 10-100 mol mennyiségben alkalmazzuk 1 mol [I-22] általános képletű vegyületre vonatkoztatva. A reakcióhőmérséklet általában 10-150 °C közötti, a reakcióidő

1 perc és 24 óra közötti.

6. eljárás

Ezt az eljárást a 6. reakcióvázlat szemlélteti, ahol R^{20} és R^{21} jelentése egymástól függetlenül valamely R^{11} vagy R^{12} jelentésében megadott csoport, vagy $-COR^{13}$, $-SO_2R^{14}$, $-SO_2R^{15}$ vagy $-COOR^{13}$ általános képletű csoport, ahol R^{11} , R^{12} , R^{13} , R^{14} és R^{15} jelentése a fenti, X , Y^1 , R^1 , R^2 és R^3 jelentése a fenti.

[I-23] általános képletű vegyületek előállítása [I-19] általános képletű vegyületekből

A [I-23] általános képletű vegyületek előállíthatók, ha [I-19] általános képletű vegyületet egy [9] általános képletű vegyülettel reagáltatunk,



a képletben R^{20} és D jelentése a fenti.

A [I-23] általános képletű vegyületek előállíthatók továbbá, ha [I-19] általános képletű vegyületet egy [10] általános képletű savanhidriddel reagáltatunk,



a képletben R^{20} jelentése a fenti, adott esetben bázis jelenlétében, és adott esetben oldószer jelenlétében.

A [9] vagy [10] általános képletű vegyületet 1 mol vagy ennél nagyobb mennyiségben alkalmazzuk 1 mol [I-19] általános képletű vegyületre vonatkoztatva. Bázisként alkalmazható például szerves bázis, így piridin vagy trietil-amin, valamint szervetlen bázis, így kálium-karbonát vagy nátrium-hidrid. A bázist általában 1 mol vagy ennél nagyobb mennyiségben alkalmazzuk 1 mol [I-19] általános képletű vegyületre vonatkoztatva. Oldószerként előnyösen használható az N,N-dimetil-formamid, 1,4-dioxán vagy tetrahidrofu-

rán. A reakcióhőmérséklet általában 0-100 °C közötti, a reakcióidő 1 perc és 24 óra közötti.

[I-24] általános képletű vegyületek előállítása [I-23] általános képletű vegyületekből

A [I-24] általános képletű vegyületek előállíthatók, ha [I-23] általános képletű vegyületet egy [11] általános képletű vegyülettel reagáltatunk,



a képletben R^{21} és D jelentése a fenti.

A [I-24] általános képletű vegyületek előállíthatók továbbá, ha [I-23] általános képletű vegyületet egy [12] általános képletű savanhidriddel reagáltatunk,



a képletben R^{21} jelentése a fenti, adott esetben bázis jelenlétében és adott esetben oldószer jelenlétében.

A [11] vagy [12] általános képletű vegyületet általában 1 mol vagy ennél nagyobb mennyiségben alkalmazzuk 1 mol [I-23] általános képletű vegyületre vonatkoztatva. Bázisként alkalmazhatók szerves bázisok, így piridin vagy trietil-amin, valamint szervetlen bázisok, így kálium-karbonát vagy nátrium-hidrid. A bázist általában 1 mol vagy ennél nagyobb mennyiségben alkalmazzuk 1 mol [I-23] általános képletű vegyületre vonatkoztatva. Oldószerként használható N,N-dimetil-formamid, 1,4-dioxán vagy tetrahidrofuran. A reakcióhőmérséklet általában 0-100 °C közötti, a reakcióidő 1 perc és 24 óra közötti.

7. eljárás

Ezt az eljárást a 7. reakcióvázlat szemlélteti, ahol X, Y^1 , R^1 , R^2 , R^3 és R^{101} jelentése a fenti.

[I-25] általános képletű vegyületek előállítása [I-19] általános képletű vegyületekből

A [I-25] általános képletű vegyületek előállíthatók, ha 1) [I-19] általános képletű vegyületet egy nitritsóval reagáltatunk oldószerben, majd 2) a kapott vegyületet kálium-xantáttal reagáltatjuk oldószerben.

Az 1) reakciónál nitritsóként előnyösen alkalmazható a nátrium-nitrit vagy kálium-nitrit, melynek mennyisége 1 mol [I-19] általános képletű vegyületre vonatkoztatva általában 1-2 mol. Oldószerként előnyösen használható a vizes sósav vagy vizes kénsav. A reakcióhőmérséklet általában -10°C és $+10^{\circ}\text{C}$ közötti, a reakcióidő 1 perc és 5 óra közötti.

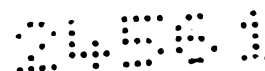
A 2) reakciónál a kálium-xantátot általában 1-2 mol mennyiségben alkalmazzuk 1 mol [I-19] általános képletű vegyületre vonatkoztatva. Oldószerként előnyösen használható a vizes sósav vagy vizes kénsav. A reakcióhőmérséklet általában $0-100^{\circ}\text{C}$ közötti, a reakcióidő 1 perc és 24 óra közötti. A reakciót lásd Org. Syn. Coll., 3, 809 (1955) irodalmi helyen.

[I-26] általános képletű vegyületek előállítása [I-25] általános képletű vegyületekből

A [I-26] általános képletű vegyületek előállíthatók, ha [I-25] általános képletű vegyületet hidrolizálunk bázis jelenlétében és oldószerben. Bázisként alkalmazhatók szervesetlen bázisok, így kálium-karbonát, melynek mennyisége 1 mol [I-25] általános képletű vegyületre vonatkoztatva általában 1-5 mol. Oldószerként előnyösen használhatók az alkoholok, így metanol vagy etanol. A reakcióhőmérséklet általában 0°C és a reakcióelegy forráspontja közötti, a reakcióidő 1 perc és 24 óra közötti. A reakciót lásd Org. Syn. Coll., 3, 809 (1955) irodalmi helyen.

[I-27] általános képletű vegyületek előállítása [I-26] általános képletű vegyületekből

A [I-27] általános képletű vegyületek előállíthatók, ha [I-26] általános



képletű vegyületet [7] általános képletű vegyülettel reagáltatunk bázis jelenlétében és oldószerben. A [7] általános képletű vegyületet általában 1 mol vagy ennél nagyobb mennyiségben alkalmazzuk 1 mol [I-26] általános képletű vegyületre vonatkoztatva.

Bázisként alkalmazhatók szervetlen bázisok, így kálium-karbonát, valamint szerves bázisok, így trietil-amin vagy piridin. A bázis mennyisége általában 1 mol vagy ennél nagyobb 1 mol [I-26] általános képletű vegyületre vonatkoztatva. Oldószerként előnyösen használható az 1,4-dioxán vagy N,N-dimetil-formamid. A reakcióhőmérséklet általában 0-100 °C közötti, a reakcióidő 1 perc és 24 óra közötti.

A [I-26] általános képletű vegyületek előállíthatók továbbá a 7-1. reakcióvázlatban szemléltetett módon, ahol X, Y¹, R¹, R² és R³ jelentése a fenti.

[I-28] általános képletű vegyületek előállítása [I-17] általános képletű vegyületekből

A [I-28] általános képletű vegyületek előállíthatók, ha [I-17] általános képletű vegyületet klór-szulfonsavval reagáltatunk, adott esetben oldószer jelenlétében. A klór-szulfonsavat 1 mol vagy ennél nagyobb mennyiségben alkalmazzuk 1 mol [I-17] általános képletű vegyületre vonatkoztatva. Oldószerként előnyösen használható a kénsav. A reakcióhőmérséklet általában 0-70 °C közötti, a reakcióidő 1 perc és 24 óra közötti. A reakciót lásd Org. Syn. Coll., 1, 8 (1941) irodalmi helyen.

[I-26] általános képletű vegyületek előállítása [I-28] általános képletű vegyületekből

A [I-26] általános képletű vegyületek előállíthatók, ha [I-28] általános képletű vegyületet redukálunk oldószerben. Redukálószerként alkalmazható például cink vagy ón-klorid, melynek mennyisége 3 mol vagy ennél nagyobb 1 mol [I-28] általános képletű vegyületre vonatkoztatva. Oldószerként előnyösen használható vizes ecetsav, vizes sósav vagy vizes kénsav. A reak-

cióhőmérséklet általában szobahőmérséklet és 100 °C közötti, a reakcióidő 1 perc és 24 óra közötti. A reakciót lásd az US 4 709 049 sz. irat 9. oszlopában.

8. eljárás

Ezt az eljárást a 8. reakcióvázlat szemlélteti, ahol R^{241} jelentése bróm-atom vagy jódatom, X, Y^1 , R^1 , R^2 , R^3 és R^{13} jelentése a fenti.

[I-29] általános képletű vegyületek előállítása [I-19] általános képletű vegyületekből

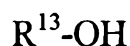
A [I-29] általános képletű vegyületek előállíthatók, ha 1) [I-19] általános képletű vegyületet nitritsóval reagáltatunk oldószerben, majd 2) a kapott vegyületet kálium-jodiddal vagy réz(I)-bromiddal reagáltatjuk oldószerben.

Az 1) reakciónál nitritsóként előnyösen alkalmazható a nátrium-nitrit vagy kálium-nitrit, melynek mennyisége 1 mol [I-19] általános képletű vegyületre vonatkoztatva 1-2 mol. Oldószerként előnyösen használható a vizes hidrogén-bromid vagy vizes kénsav. A reakcióhőmérséklet általában -10 °C és +10 °C közötti, a reakcióidő 1 perc és 5 óra közötti.

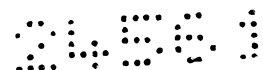
A 2) reakciónál a kálium-jodidot vagy réz(I)-bromidot 1 mol vagy ennél nagyobb mennyiségben alkalmazzuk 1 mol [I-19] általános képletű vegyületre vonatkoztatva. Oldószerként előnyösen használható a vizes hidrogén-bromid vagy vizes kénsav. A reakcióhőmérséklet általában 0-80 °C közötti, a reakcióidő 1 perc és 24 óra közötti. A reakciót lásd az Org. Syn. Coll., 2, 604 (1943) és 1, 136 (1941) irodalmi helyeken.

[I-30] általános képletű vegyületek előállítása [I-29] általános képletű vegyületekből

A [I-30] általános képletű vegyületek előállíthatók, ha [I-29] általános képletű vegyületet egy [13] általános képletű vegyülettel reagáltatunk,



[13]



a képletben R^{13} jelentése a fenti, átmenetifém katalizátor és bázis jelenlétében és oldószerben szén-monoxid atmoszférában. Katalizátorként alkalmazható például $PdCl_2(PPh_3)_2$, melynek mennyisége 1 mol [I-29] általános képletű vegyületre vonatkoztatva általában legfeljebb 0,5 mol. A [13] általános képletű vegyületet 1 mol vagy ennél nagyobb mennyiségben alkalmazzuk 1 mol [I-29] általános képletű vegyületre vonatkoztatva.

Bázisként alkalmazhatók szerves bázisok, így dietil-amin, melynek mennyisége 1 mol [I-29] általános képletű vegyületre vonatkoztatva általában 1-10 mol. Oldószerként használható például N,N-dimetil-formamid. A szén-monoxid nyomás általában 1-150 atm. A reakciót hőmérséklet általában 0-100 °C közötti, a reakcióidő 1 perc és 72 óra közötti. A reakciót lásd Bull. Chem. Soc. Jpn., 48, 2075 (1975) irodalmi helyen.

9. eljárás

Ezt az eljárást a 9. reakcióvázlat szemlélteti, ahol R^{131} jelentése hidrogén kivételével valamely R^{13} jelentésében megadott csoport, X , Y^1 , R^1 , R^2 , R^3 , R^{18} és R^{241} jelentése a fenti.

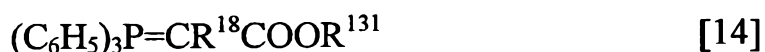
[I-31] általános képletű vegyületek előállítása [I-29] általános képletű vegyületekből

A [I-31] általános képletű vegyületek előállíthatók, ha [I-29] általános képletű vegyületet nátrium-formiáttal vagy kálium-formiáttal reagáltatunk átmenetifém katalizátor jelenlétében és oldószerben, szén-monoxid atmoszférában. A nátrium-formiátot vagy kálium-formiátot 1-10 mol mennyiségben alkalmazzuk 1 mol [I-29] általános képletű vegyületre vonatkoztatva. Oldószerként előnyösen használható az N,N-dimetil-formamid, katalizátorként előnyösen használható a $PdCl_2(PPh_3)_2$, melynek mennyisége általában legfeljebb 0,5 mol 1 mol [I-29] általános képletű vegyületre vonatkoztatva. A szén-monoxid nyomása általában 1-150 atm. A reakciót hőmérséklet általában

0-100 °C, a reakcióidő 1 perc és 72 óra közötti. A reakciót lásd Bull. Chem. Soc. Jpn., 67, 2329 (1994) irodalmi helyen.

[I-32] általános képletű vegyületek előállítása [I-31] általános képletű vegyületekből

A [I-32] általános képletű vegyületek előállíthatók, ha [I-31] általános képletű vegyületet [14] vagy [15] általános képletű vegyülettel reagáltatunk,



a képletekben R^{18} és R^{131} jelentése a fenti, oldószerben, és a [15] általános képletű vegyület esetén bázis jelenlétében.

A [14] vagy [15] általános képletű vegyületet általában 1-5 mol mennyiségben alkalmazzuk a [I-31] általános képletű vegyületre vonatkoztatva. Oldószerként előnyösen használható a tetrahidrofurán vagy toluol. Bázisként előnyösen használható a nátrium-hidrid, melynek mennyisége 1 mol [I-31] általános képletű vegyületre vonatkoztatva általában 1-5 mol. A reakcióhőmérséklet általában 0-50 °C, a reakcióidő 1 perc és 24 óra közötti.

10. eljárás

Ezt az eljárást a 10. reakcióvázlat szemlélteti, ahol R^{171} jelentése 1-6 szénatomos alkilcsoport, X, Y^1 , R^1 , R^2 , R^3 , R^{18} és R^{131} jelentése a fenti.

[I-33] általános képletű vegyületek előállítása [I-31] általános képletű vegyületekből

A [I-33] általános képletű vegyületek előállíthatók, ha [I-31] általános képletű vegyületet [16] vagy [17] általános képletű vegyülettel reagáltatunk,



a képletekben R^{171} jelentése a fenti, oldószer jelenlétében.

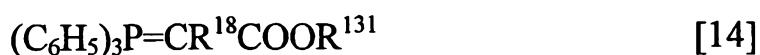
A [16] vagy [17] általános képletű vegyületet általában 1-2 mol mennyiségben alkalmazzuk 1 mol [I-31] általános képletű vegyületre vonatkoztatva. Oldószerként előnyösen alkalmazhatók az éterek, így tetrahidrofurán. A reakcióhőmérséklet $-78\text{ }^{\circ}\text{C}$ és szobahőmérséklet közötti, a reakcióidő 1 perc és 24 óra közötti.

[I-34] általános képletű vegyületek előállítása [I-33] általános képletű vegyületekből

A [I-34] általános képletű vegyületek előállíthatók, ha [I-33] általános képletű vegyületet oxidálunk, így krómsavval krómsav/kénsav, piridínium-klór-kromát vagy hasonló krómos oxidálószer segítségével vagy dimetil-szulfoxid/ecetsavanhidrid eleggyel vagy Swern-oxidálással.

[I-35] általános képletű vegyületek előállítása [I-34] általános képletű vegyületekből

A [I-35] általános képletű vegyületek előállíthatók, ha [I-34] általános képletű vegyületet [14] vagy [15] általános képletű vegyülettel reagáltatunk,



a képletekben R^{18} és R^{131} jelentése a fenti, oldószerben, és a [15] általános képletű vegyület esetén bázis jelenlétében.

A [14] vagy [15] általános képletű vegyületet általában 1-5 mol mennyiségben alkalmazzuk 1 mol [I-34] általános képletű vegyületre vonatkoztatva. Oldószerként előnyösen használható a tetrahidrofurán vagy toluol. Bázisként előnyösen használható a nátrium-hidrid, melynek mennyisége 1 mol [I-34] általános képletű vegyületre vonatkoztatva általában 1-5 mol. A reakcióhőmérséklet általában $0-50\text{ }^{\circ}\text{C}$, a reakcióidő 1 perc és 24 óra közötti.

11. eljárás

Ezt az eljárást a 11. reakcióvázlat szemlélteti, ahol W^2 jelentése klór-atom vagy brómatom, X, Y^1 , R^1 , R^2 , R^3 és R^{13} jelentése a fenti.

A [I-36] általános képletű vegyületek előállíthatók, ha [I-19] általános képletű vegyületet terc-butil-nitrittel vagy terc-amil-nitrittel, [18] általános képletű vegyülettel,



a képletben W^2 jelentése a fenti; és [19] általános képletű vegyülettel reagáltatunk,



a képletben R^{13} jelentése a fenti, oldószerben.

A terc-butil-nitritet vagy terc-amil-nitritet általában 1-2 mol mennyiségben alkalmazzuk 1 mol [I-19] általános képletű vegyületre vonatkoztatva. A [18] általános képletű vegyületet általában 1-2 mol mennyiségben alkalmazzuk 1 mol [I-19] általános képletű vegyületre vonatkoztatva. A [19] általános képletű vegyületet 10 mol vagy ennél nagyobb mennyiségben alkalmazzuk 1 mol [I-19] általános képletű vegyületre vonatkoztatva. Oldószerként előnyösen használható az acetonitril. A reakcióhőmérséklet általában 0-50 °C közötti, a reakcióidő 1 perc és 24 óra közötti. A reakció vonatkozásában lásd az EP 0 649 596 sz. irat 11. oldalát.

12. eljárás

Ezt az eljárást a 12. reakcióvázlat szemlélteti, ahol X, Y^1 , R^1 , R^2 , R^3 és R^{10} jelentése a fenti.

A [I-37] általános képletű vegyületek előállíthatók, ha [I-28] általános képletű vegyületet [20] általános képletű vegyülettel reagáltatunk,



a képletben R^{10} jelentése a fenti, bázis jelenlétében és adott esetben oldószerben. A [20] általános képletű vegyületet általában 1 mol vagy ennél nagyobb mennyiségben alkalmazzuk 1 mol [I-28] általános képletű vegyületre vonatkoztatva. Bázisként használható például szerves bázis, így trietil-amin, vagy szervetlen bázis, így kálium-karbonát. A bázis mennyisége általában 1 mol vagy ennél több 1 mol [I-28] általános képletű vegyületre vonatkoztatva. Oldószerként alkalmazható például N,N-dimetil-formamid vagy 1,4-dioxán. A reakcióhőmérséklet általában 0-100 °C közötti, a reakcióidő 1 perc és 24 óra közötti.

13. eljárás

Ezt az eljárást a 13. reakcióvázlat szemlélteti, ahol X, Y^1 , R^1 , R^2 , R^3 , R^{11} és R^{12} jelentése a fenti.

A [I-38] általános képletű vegyületek előállíthatók, ha [I-28] általános képletű vegyületet egy [21] általános képletű vegyülettel reagáltatunk,



a képletben R^{11} és R^{12} jelentése a fenti, adott esetben bázis jelenlétében és adott esetben oldószerben. A [21] általános képletű vegyületet általában 1 mol vagy ennél nagyobb mennyiségben alkalmazzuk 1 mol [I-28] általános képletű vegyületre vonatkoztatva.

Bázisként alkalmazhatók szerves bázisok, így trietil-amin, és szervetlen bázisok, így kálium-karbonát. A bázis mennyisége általában 1 mol vagy ennél több 1 mol [I-28] általános képletű vegyületre vonatkoztatva. Oldószerként előnyösen használható az N,N-dimetil-formamid vagy 1,4-dioxán. A reakcióhőmérséklet általában 0-100 °C közötti, a reakcióidő 1 perc és 24 óra közötti.

14. eljárás

Ezt az eljárást a 14. reakcióvázlat szemlélteti, ahol R^{61} jelentése metil-

csoport kivételével valamely R^6 jelentésében megadott csoport, X, Y, R^1 , R^2 és R^3 jelentése a fenti.

[I-40] általános képletű vegyületek előállítása [I-39] általános képletű vegyületekből

A [I-40] általános képletű vegyületek előállíthatók, ha [I-39] általános képletű vegyületet 2,3-diklór-propénnel reagáltatunk bázis jelenlétében és oldószerben. A 2,3-diklór-propént általában 1-3 mol mennyiségben alkalmazzuk 1 mol [I-39] általános képletű vegyületre vonatkoztatva.

Bázisként alkalmazhatók például szervesetlen bázisok, így kálium-karbonát. A bázis mennyisége általában 1-5 mol 1 mol [I-39] általános képletű vegyületre vonatkoztatva. Oldószerként előnyösen használható az N,N-dimetil-formamid. A reakcióhőmérséklet általában 0-100 °C, a reakcióidő 1 perc és 24 óra közötti.

[I-41] általános képletű vegyületek előállítása [I-40] általános képletű vegyületekből

A [I-41] általános képletű vegyületek előállíthatók, ha [I-40] általános képletű vegyületet melegítünk oldószerben. Oldószerként előnyösen használható az N,N-dimetil-formamid, N,N-dimetil-anilin, N,N-dietyl-anilin vagy p-diizopropil-benzol. A reakcióhőmérséklet általában 70-200 °C közötti, a reakcióidő 1 perc és 24 óra közötti.

[I-42] általános képletű vegyületek előállítása [I-41] általános képletű vegyületekből

A [I-42] általános képletű vegyületek előállíthatók, ha [I-41] általános képletű vegyületben a benzofurán gyűrű 2-helyzetében található metilcsoportot megfelelő szubsztituenssel helyettesítjük az US 5 308 829 sz. irat 2-11. oszlopában ismertetett módon.

15. eljárás

Ezt az eljárást a 15. reakcióvázlat szemlélteti, ahol X, Y, R^1 , R^2 , R^3 és

R^7 jelentése a fenti.

[I-43] általános képletű vegyületek előállítása [I-39] általános képletű vegyületekből

A [I-43] általános képletű vegyületek előállíthatók, ha [I-39] általános képletű vegyületet egy [22] általános képletű vegyülettel reagáltatunk,



a képletben W^2 és R^7 jelentése a fenti, bázis jelenlétében és oldószerben. A [22] általános képletű vegyületet általában 1-5 mol mennyiségben alkalmazzuk 1 mol [I-39] általános képletű vegyületre vonatkoztatva.

Bázisként alkalmazhatók például szervetlen bázisok, így kálium-karbonát, melynek mennyisége általában 1-5 mol 1 mol [I-39] általános képletű vegyületre vonatkoztatva. Oldószerként előnyösen használható az N,N-dimetil-formamid vagy 1,4-dioxán. A reakcióhőmérséklet általában 0-100 °C közötti, a reakcióidő 1 perc és 24 óra közötti.

[I-44] általános képletű vegyületek előállítása [I-43] általános képletű vegyületekből

A [I-44] általános képletű vegyületek előállíthatók, ha [I-43] általános képletű vegyületet melegítünk oldószerben. Oldószerként előnyösen használható az N,N-dimetil-anilin, N,N-diethyl-anilin vagy p-diizopropil-benzol. A reakcióhőmérséklet általában 100-200 °C közötti, a reakcióidő 1 perc és 24 óra közötti.

[I-45] általános képletű vegyületek előállítása [I-44] általános képletű vegyületekből

A [I-45] általános képletű vegyületek előállíthatók, ha [I-44] általános képletű vegyületet melegítünk sav jelenlétében és oldószerben. Savként alkalmazhatók például szerves savak, így p-toluolszulfonsav, valamint szervetlen savak, így kénsav, melynek mennyisége 1 mol [I-44] általános képletű

tű vegyületre vonatkoztatva legfeljebb 1 mol. Oldószerként előnyösen használható a toluol vagy xilol. A reakcióhőmérséklet általában 100-250 °C közötti, a reakcióidő 1 perc és 24 óra közötti.

16. eljárás

Ezt az eljárást a 16. reakcióvázlat szemlélteti, ahol R^{81} jelentése metil-csoport és hidroximetil-csoport kivételével valamely R^8 jelentésében megadott csoport, X, Y, R^1 , R^2 , R^3 és R^7 jelentése a fenti.

[I-46] általános képletű vegyületek előállítása [I-44] általános képletű vegyületekből

A [I-46] általános képletű vegyületek előállíthatók, ha [I-44] általános képletű vegyületet persavval reagáltatunk oldószerben. Persavként előnyösen használható az m-klór-perbenzoesav vagy perecetsav. A persav mennyisége 1 mol vagy ennél több 1 mol [I-44] általános képletű vegyületre vonatkoztatva. Oldószerként előnyösen használhatók a halogénezett szénhidrogének, így diklór-metán, valamint szerves savak, így ecetsav. A reakcióhőmérséklet általában -20 °C és szobahőmérséklet közötti, a reakcióidő 1 perc és 24 óra közötti.

[I-47] általános képletű vegyületek előállítása [I-46] általános képletű vegyületekből

A [I-47] általános képletű vegyületek előállíthatók, ha [I-46] általános képletű vegyületet bázissal reagáltatunk oldószerben. Bázisként előnyösen használható a kálium-karbonát, melynek mennyisége 1 mol [I-46] általános képletű vegyületre vonatkoztatva általában 1-2 mol. Oldószerként előnyösen használható a metanol vagy etanol. A reakcióhőmérséklet általában 0-50 °C közötti, a reakcióidő 1 perc és 5 óra közötti.

[I-48] általános képletű vegyületek előállítása [I-47] általános képletű vegyületekből

A [I-48] általános képletű vegyületek előállíthatók, ha [I-47] általános

képletű vegyületen a dihidro-benzofurán gyűrű 2-helyzetében található hidroxil-alkil-csoportot más szubsztituensre cseréljük az US 5 411 935 sz. irat 5-10. oszlopában leírt módon.

17. eljárás

Ezt az eljárást a 17. reakcióvázlat szemlélteti, ahol X, Y, R¹, R², R³, R¹¹, R¹², R¹³, R¹⁷ és R¹⁸ jelentése a fenti.

A [I-50] általános képletű vegyület előállítható, ha a [I-49] általános képletű vegyületet egy [21] általános képletű vegyülettel reagáltatjuk,



a képletben R¹¹ és R¹² jelentése a fenti, adott esetben bázis jelenlétében és adott esetben oldószerben. A [21] általános képletű vegyületet 1 mol vagy ennél nagyobb mennyiségben alkalmazzuk 1 mol [I-49] általános képletű vegyületre vonatkoztatva.

Bázisként alkalmazhatók például szerves bázisok, így trietil-amin, vagy szervetlen bázisok, így kálium-karbonát. A bázis mennyisége 1 mol [I-49] általános képletű vegyületre számolva általában 1 mol vagy ennél nagyobb. Oldószerként előnyösen használható az N,N-dimetil-formamid vagy 1,4-dioxán. A reakcióhőmérséklet általában 0-100 °C közötti, a reakcióidő 1 perc és 24 óra közötti.

18. eljárás

Ezt az eljárást a 18. reakcióvázlat szemlélteti, ahol X, Y, W, R¹, R², R³, R¹¹, R¹², R¹³, R¹⁷ és R¹⁸ jelentése a fenti.

[I-51] általános képletű vegyületek előállítása [I-49] általános képletű vegyületekből

A [I-51] általános képletű vegyületek előállíthatók, ha a [I-49] általános képletű vegyületet egy [23] általános képletű vegyülettel reagáltatjuk,



a képletben W jelentése a fenti, adott esetben katalizátor jelenlétében és adott esetben oldószerben. A [23] általános képletű vegyületet általában 1 mol vagy ennél nagyobb mennyiségben alkalmazzuk 1 mol [I-49] általános képletű vegyületre vonatkoztatva. Katalizátorként előnyösen használható az alumínium-klorid vagy alumínium-bromid. Oldószerként előnyösen használható a kloroform vagy ecetsav. A reakcióhőmérséklet általában -20 °C és +120 °C közötti, a reakcióidő 1 perc és 24 óra közötti.

[I-52] általános képletű vegyületek előállítása [I-51] általános képletű vegyületekből

A [I-52] általános képletű vegyületek előállíthatók, ha [I-51] általános képletű vegyületet egy [21] általános képletű vegyülettel reagáltatunk,



a képletben R^{11} és R^{12} jelentése a fenti, adott esetben bázis jelenlétében és adott esetben oldószerben. A [21] általános képletű vegyületet 1 mol vagy ennél nagyobb mennyiségben alkalmazzuk 1 mol [I-51] általános képletű vegyületre vonatkoztatva.

Bázisként alkalmazhatók például szerves bázisok, így trietil-amin, valamint szervetlen bázisok, így kálium-karbonát. A bázis mennyisége 1 mol [I-51] általános képletű vegyületre vonatkoztatva általában 1 mol vagy ennél több. Oldószerként előnyösen használható az N,N-dimetil-formamid vagy 1,4-dioxán. A reakcióhőmérséklet általában 0-100 °C közötti, a reakcióidő 1 perc és 24 óra közötti.

A találmány szerinti vegyületek előállítása során intermediereként alkalmazott [2] általános képletű vegyületek előállíthatók, ha egy [24] általános képletű vegyületet, a képletben Q jelentése a fenti, egy [25] általános képletű vegyülettel reagáltatunk, a képletben R^1 és R^2 jelentése a fenti.

A reakciót adott esetben oldószerben végezzük. A reakcióhőmérséklet

általában $-20\text{ }^{\circ}\text{C}$ és $+150\text{ }^{\circ}\text{C}$ közötti, előnyösen $0-60\text{ }^{\circ}\text{C}$ közötti. A reakcióidő általában 1 perc és 240 óra közötti.

A fenti reakció megvalósításához 1 mol [25] általános képletű vegyületet általában 1 mol [24] általános képletű vegyülettel reagáltatunk, de a reakciókörülményektől függően ettől eltérő molarányok is beállíthatók.

Oldószerként alkalmazhatók például alifás szénhidrogének, így hexán, heptán, ligroin, ciklohexán vagy petroléter; aromás szénhidrogének, így benzol, toluol vagy xilol, halogénezett szénhidrogének, így kloroform, szén-tetraklorid, diklór-metán, 1,2-diklór-etán, klór-benzol vagy diklór-benzol; éterek, így dietil-éter, diizopropil-éter, dioxán, tetrahydrofuran és etilén-glikol-dimetil-éter; nitrovegyületek, így nitro-metán vagy nitro-benzol; savamidok, így formamid, N,N-dimetil-formamid vagy acetamid; terciér aminok, így piridin, trietil-amin, diizopropil-etil-amin, N,N-dimetil-anilin, N,N-dietil-anilin vagy N-metil-morfolin; kénvegyületek, így dimetil-szulfoxid vagy szulfórán; alkoholok, így metanol, etanol, etilén-glikol vagy izopropanol; víz, valamint ezek elegyei.

A reakció befefejeződése után a reakcióelegyet vízre öntjük, kívánt esetben a szokásos utókezelési lépésekkel feldolgozzuk, így szerves oldószerrel extraháljuk és bepároljuk, vagy kívánt esetben például oszlopkromatográfián vagy átkristályosítással tisztítjuk. Így a kívánt terméket kapjuk.

A [2] általános képletű vegyületek előállítására alkalmas fent ismertetett eljárás reakciókörülményeit írja le például a Journal of the American Chemical Society, 71, 78-81 (1949).

Az R^1 helyén hidrogénatomot tartalmazó [2] általános képletű vegyületek előállíthatók továbbá, ha egy [26] általános képletű vegyületet - a képletben R^2 jelentése a fenti, V jelentése jódatom, brómatom vagy klór-atom - vízzel reagáltatunk bázis jelenlétében, melynek során [27] általános képletű vegyület - a képletben R^2 jelentése a fenti - vagy annak hidrátja ke-

letkezik (továbbiakban 1. reakció), és ezt [24] általános képletű vegyülettel reagáltatjuk.

Az 1. reakciót általában oldószerben valósítjuk meg. A reakcióhőmérséklet általában 20-100 °C közötti. A reakcióidő általában 1 perc és 10 óra közötti.

A reagensek molaránya reakciókörülményektől függően változtatható, előnyösen 2 mol vizet és 2 mol bázist alkalmazunk 1 mol [26] általános képletű vegyületre vonatkoztatva.

Bázisként alkalmazhatók szerves bázisok vagy szervetlen bázisok, így nátrium-acetát, kálium-acetát, nátrium-karbonát, nátrium-hidrogén-karbonát vagy kálium-karbonát.

Oldószerként alkalmazhatók alifás szénhidrogének, így hexán, heptán, ligroin, ciklohexán vagy petroléter; aromás szénhidrogének, így benzol, toluol vagy xilol; halogénezett szénhidrogének, így kloroform, szén-tetraklorid, diklór-metán, 1,2-diklór-etán, klór-benzol vagy diklór-benzol; éterek, így di-etil-éter, diizopropil-éter, dioxán, tetrahidrofurán vagy etilén-glikol-dimetil-éter; észterek, így etil-formiát, etil-acetát, butil-acetát vagy dietil-karbonát; nitrovegyületek, így nitro-metán vagy nitro-benzol; nitrilek, így acetonitril vagy izobutironitril; savamidok, így formamid, N,N-dimetil-formamid vagy acetamid; terciér aminok, így piridin, trietil-amin, diizopropil-etil-amin, N,N-dimetil-anilin, N,N-dietil-anilin vagy N-metil-morfolin; kénvegyületek, így dimetil-szulfoxid vagy szulforán; alkoholok, így metanol, etanol, etilén-glikol vagy izopropanol; víz vagy ezek elegyei.

A reakció során keletkező [27] általános képletű vegyület vagy annak hidrátja izolálás és tisztítás nélkül reagáltatható a [24] általános képletű vegyülettel.

A [25] általános képletű vegyületek előállíthatók például a megfelelő [28] általános képletű vegyületből - a képletben R^1 és R^2 jelentése a fenti -

az Organic Synthesis Collective Volume, 2, 363 (1943) vagy Organic Synthesis Collective Volume, 3, 20 (1955) szerint.

A [28] általános képletű vegyületek kereskedelmi forgalomban kapható anyagokból előállíthatók, például Shin-Jikken Kagaku Koza, 14, Chemical Society of Japan, Maruzen K.K., 751-875 szerint.

A [26] általános képletű vegyületek kereskedelmi forgalomban kapható anyagokból előállíthatók. Ennek során például egy [29] általános képletű vegyületet - a képletben R^2 jelentése a fenti - reagáltatunk a Journal of the American Chemical Society, 74, 3902 (1952) szerint.

A [24] általános képletű vegyületek előállíthatók a 19. reakcióvázlat szerint, ahol Q jelentése a fenti. Ennek során az (a-1) lépést az Organic Synthesis Collective Volume, 1, 21 (1941) szerint, és az (a-2) lépést a Journal of Organic Chemistry, 29, 1800 (1964) szerint valósítjuk meg.

A [30] általános képletű vegyületek előállíthatók a kereskedelmi forgalomban kapható vegyületekből. Ennek során például a 20. reakcióvázlatban bemutatott eljárásokat valósítjuk meg, ahol Q jelentése a fenti. A (b-1) lépést az Organic Synthesis Collective Volume, 1, 514 (1941) szerint, a (b-2) lépést Jikken Kagaku Koza, 21, Chemical Society of Japan, Maruzen K.K., 89-97 szerint, a (c-1) lépést Organic Synthesis, 40, 105 (1960) szerint, a (c-2) lépést a Bulletin of the Chemical Society of Japan, 67, 2329 (1994) szerint, a (d-1) lépést a Synthesis, 1000 (1983) szerint és a (d-2) lépést a Journal of Organic Chemistry, 33, 3277 (1968) szerint valósítjuk meg.

A [32] általános képletű vegyületek ismertek vagy előállíthatók az EP 61741, US 4 670 076, US 4 770 695, US 4 709 049, US 4 640 707, US 4 720 927, US 5 169 431 vagy JP 63-156787/1988 számú iratok szerint.

A [32] általános képletű vegyületek egyes képviselői előállíthatók a 21. reakcióvázlat szerint, ahol R^{25} jelentése $-COR^{26}$ vagy $-COOR^{13}$ általános

képletű csoport, R^{26} jelentése hidrogénatom vagy 1-6 szénatomos alkilcsoport, X, Y^1 és R^{13} jelentése a fenti.

[38] általános képletű vegyületek előállítása [37] általános képletű vegyületekből

A [38] általános képletű vegyületek előállíthatók, ha [37] általános képletű vegyületet nitrálószerrel reagáltatunk oldószerben. Nitrálószerként előnyösen alkalmazható a salétromsav, melynek mennyisége 1 mol [37] általános képletű vegyületre vonatkoztatva általában 1-10 mol. Oldószerként előnyösen használható a kénsav. A reakcióhőmérséklet általában $-10\text{ }^{\circ}\text{C}$ és szobahőmérséklet közötti, a reakcióidő 1 perc és 24 óra közötti.

[39] általános képletű vegyületek előállítása [38] általános képletű vegyületekből

A [39] általános képletű vegyületek előállíthatók, ha [38] általános képletű vegyületet például vasporral redukálunk sav jelenlétében és oldószerben. A vasport 1 mol [38] általános képletű vegyületre vonatkoztatva általában 3 mol vagy ennél nagyobb mennyiségben alkalmazzuk. Savként előnyösen használható az ecetsav, melynek mennyisége 1 mol [38] általános képletű vegyületre vonatkoztatva általában 1-10 mol. Oldószerként előnyösen használható a víz vagy etil-acetát. A reakcióhőmérséklet általában szobahőmérséklet és a reakcióelegy forráspontja közötti, a reakcióidő 1 perc és 24 óra közötti.

A találmány szerinti vegyületek kiváló herbicid hatással rendelkeznek, és ezek egyes képviselői szelektivitást mutatnak a kultúrnövények és a nemkívánt gyomok között. A találmány szerinti vegyületek herbicid hatékonyságuk alapján előnyösen alkalmazhatók a következő nemkívánatos gyomok ellen, amelyek problémát okozhatnak a kultúrnövények levélzetének és talajának kezelése során:

Polygonaceae-félék:

szulákkeserűfű (*Polygonum convolvulus*), bütykös keserűfű (*Polygonum lapathifolium*), pennszilvániai keserűfű (*Polygonum pensylvanicum*), baracklevelű keserűfű (*Polygonum persicaria*), göndör lórom (*Rumex crispus*), széleslevelű lórom (*Rumex obtusifolius*), japán keserűfű (*Polygonum cuspidatum*);

Portulacaceae-félék:

kövér porcsin (*Portulaca oleracea*);

Caryophyllaceae-félék:

tyúkhúr (*Stellaria media*);

Chenopodiaceae-félék:

fehér libatop (*Chenopodium album*), seprőfű (*Kochia scoparia*);

Amaranthaceae-félék:

szőrös disznóparéj (*Amaranthus retroflexus*), sima disznóparéj (*Amaranthus hybridus*);

Cruciferae-félék:

repcsénreték (*Raphanus raphanistrum*), vadrepce (*Sinapis arvensis*), pásztortáska (*Capsella bursa-pastoris*);

Leguminosae-félék:

kender (*Sesbania exaltata*), szenna (*Cassia obtusifolia*), floridai lóhere (*Desmodium tortuosum*), fehér here (*Trifolium repens*);

Malvaceae-félék:

selyemperje (*Abutilon theophrasti*), rostmályva (*Sida spinosa*);

Violaceae-félék:

mezei árvácska (*Viola arvensis*), háromszínű árvácska (*Viola tricolor*);

Rubiaceae-félék:

ragadós galaj (*Galium aparine*);

Convolvulaceae-félék:

borostyánlevelű hajnalka (*Ipomoea hederacea*), bíbor hajnalka (*Ipomoea purpurea*), teljeslevelű hajnalka (*Ipomoea heceracea* var. *integruscula*), foltos hajnalka (*Ipomoea lacunosa*), apró szulák (*Convolvulus arvensis*);

Labiatae-félék:

piros árvacsalán (*Lamium purpureum*), árvacsalán (*Lamium amplexicaule*);

Solanaceae-félék:

csattanó maszlag (*Datura stramonium*), fekete csucsor (*Solanum nigrum*);

Scrophulariaceae-félék:

perzsa veronika (*Veronica persica*), borostyánlevelű veronika (*Veronica hederifolia*);

Compositae-félék:

szerbtövis (*Xanthium pensylvanicum*), napraforgó (*Helianthus annuus*), szagtalan székfű (*Matricaria perforata* vagy *inodora*), vetési margitvirág (*Chrysanthemum segetum*), székfű (*Matricaria matricarioides*), közönséges parlagfű (*Ambrosia artemisiifolia*), óriás parlagfű (*Ambrosia trifida*), betyárkóró (*Erigeron canadensis*), japán üröm (*Artemisia princeps*), magas aranyvessző (*Solidago altissima*);

Boraginaceae-félék:

parlagi nefelejcs (*Myosotis arvensis*);

Asclepiadaceae-félék:

selyemkóró (*Asclepias syriaca*);

Euphorbiaceae-félék:

napraforgó kutyatej (*Euphorbia helioscopia*), foltos kutyatej (*Euphorbia maculata*);

Gramineae-félék:

kakaslábfű (*Echinochloa crus-galli*), zöld muhar (*Setaria viridis*), óriás muhar (*Setaria faberi*), pirókujjas muhar (*Digitaria sanguinalis*), aszályfű (*Eleusine indica*), nyári perje (*Poa annua*), parlagi ecsetpázsit (*Alopecurus myosuroides*), hélazab (*Avena fatua*), cirokfű (*Sorghum halepense*), közönséges tarackbúza (*Agropyron repens*), fedélrozsнок (*Bromus tectorum*), ujjas csillagpázsit (*Cynodon dactylon*), őszi köles (*Panicum dichotomiflorum*), texasi köles (*Panicum texanum*), buzogá-nyos cirok (*Sorghum vulgare*);

Commelinaceae-félék:

ölbenyíló kommelina (*Commelina communis*);

Equisetaceae-félék:

mezei zsurló (*Equisetum arvense*);

Cyperaceae-félék:

rizspalka (*Cyperus iria*), bíbor palka (*Cyperus rotundus*), éti palka (*Cyperus exculentus*).

A találmány szerinti vegyületek egyes képviselői nem váltanak ki jelentős fitotoxikus hatást egyes kultúrnövényekre, így kukoricára (*Zea mays*), búzára (*Triticum aestivum*), zabra (*Hordeum vulgare*), rizsre (*Oryza sativa*), cirokra (*Sorghum bicolor*), szójababra (*Glycine max*), gyapotra (*Gossypium* spp.), cukorrépára (*Beta vulgaris*), mogyoróra (*Arachis hypogaea*), napraforgóra (*Helianthus annuus*) és káposztára (*Brassica napus*), valamint kertészeti növényekre, így virágokra és dísznövényekre, továbbá zöldségfélékre.

A találmány szerinti vegyületek előnyösen alkalmazhatók a nemkívánatos gyomnövekedés gátlására szójabab (*Glycine max*), kukorica (*Zea mays*) és búza (*Triticum aestivum*) nem művelt ültetvényein. Ezenkívül, egyes vegyületek nem mutatnak jelentős fitotoxicitást a különböző gabonafélékre.

A találmány szerinti vegyületek továbbá herbicid hatást mutatnak a következő rizsföldi gyomokkal szemben:

Gramineae-félék:

rizsföldi kakaslábfű (*Echinochloa oryzicola*);

Scophulariaceae-félék:

hamistikszem (*Lindernia procumbens*);

Lythraceae-félék:

Rotala indica, *Ammania multiflora*;

Elatinaceae-félék:

áfonya (*Elatine triandra*);

Cyperaceae-félék:

ernyős palka (*Cyperus difformis*), keményszárú erdeikáka (*Scirpus juncooides*), csetkák (*Eleocharis acicularis*), *Cyperus serotinus*, *Eleocharis kuroguwai*;

Pontederiaceae-félék:

Monochoria vaginalis;

Alismataceae-félék:

Sagittaria pygmaea, *Sagittaria trifolia*, *Alisma canaliculatum*;

Potamogetonaceae-félék:

kereklevelű békaszőlő (*Potamogeton distinctus*);

Umbelliferae-félék:

jávai mételykóró (*Oenanthe javanica*).

A találmány szerinti vegyületek egyes képviselői nem mutatnak jelentős fitotoxicitást a beültetett rizspalántákra.

A találmány szerinti vegyületek felhasználhatók továbbá a nemkívánatos növényi növekedés gátlására ültetvényeken, mezőkön, pázsitokon, erdőkben, vízi utak mellett, csatornáknál és más nem művelt területeken.

A találmány szerinti vegyületek lényegében azonos jellemzőkkel rendelkeznek, mint a WO 95/34659 számú iratban ismertetett herbicid vegyületek. Ha az iratban ismertetett módon megfelelő gén bevitelével a herbicidekkel szemben tűrőképesebbé alakított kultúrnövényeket termesztünk, akkor a találmány szerinti vegyületek nagyobb dózisban adagolhatók, mint a szokásos tűrőképeséggel rendelkező kultúrnövények termesztése esetén, és így javítható a nemkívánt növényi növekedésre gyakorolt hatás.

Ezek a készítmények hatóanyagként általában 0,001-80 tömeg%, előnyösen 0,003-70 tömeg% találmány szerinti vegyületet tartalmaznak a készítmény össztömegére vonatkoztatva.

Szilárd hordozóanyagként vagy hígítóanyagként finoman porított anyag vagy granulátum formájában alkalmazhatók a következő anyagok: ásványi anyagok, így kaolin, attapulgit, bentonit, fehér föld, pirofillit, talkum, diatomaföld és kalcit, valamint szerves anyagok, így dióhéjörlemény; továbbá vízben oldható szerves anyagok, így karbamid; szervesetlen sók, így ammónium-szulfát és szintetikus, hidratált szilícium-dioxid. A folyékony hordozóanyagokra vagy hígítóanyagokra példaként említhetők az aromás szénhidrogének, így metil-naftalin, fenil-xilol-etán és alkil-benzolok, például xilol; alkoholok, így izopropanol, etanol vagy 2-etoxi-etanol; észterek, így ftálsav-

-dialkil-észter; ketonok, így aceton, ciklohexanon vagy izoforon; ásványolajok, így gépolaj; növényi olajok, így szójababolaj vagy gyapotmagolaj; továbbá dimetil-szulfoxid, N,N-dimetil-formamid, acetonitril, N-metil-pirroli-don vagy víz.

Az emulgeáló, diszpergáló és szélesítő hatású felületaktív anyagokra példaként említhetők az anionos felületaktív anyagok, így alkil-szulfátok, alkil-szulfonátok, alkil-aril-szulfonátok, dialkil-szulfoszukcinátok vagy poli(oxi-etilén)-alkil-aril-éterek foszfátjai, valamint nemionos felületaktív anyagok, így poli(oxi-etilén)-alkil-éterek, poli(oxi-etilén)-alkil-aril-éterek, poli(oxi-etilén)/poli(oxi-propilén) blokk kopolimerek, szorbitán zsírsavészterek és poli(oxi-etilén)-szorbitán zsírsavészterek.

A további segédanyagokra példaként említhetők a ligninszulfonátok, alginátok, poli(vinil-alkohol), gumiarábikum, karboxi-metil-cellulóz (CMC) és izopropilsav-foszfát (PAP).

A találmány szerinti vegyületeket előnyösen a fenti készítmények formájában preemergens vagy posztemergens kezeléssel alkalmazzuk a talaj vagy levélzet kezelésére. A talaj kezelése megvalósítható a talaj felületének kezelésével vagy a talajba történő bedolgozással. A levélzet kezelése megvalósítható a növény kezelésével vagy közvetlen kezeléssel, melynek során a vegyi anyagot a nemkívánt gyomokra juttatjuk ki a kultúrnövények kezelése nélkül.

A találmány szerinti vegyületek kívánt esetben más herbicid hatóanyagokkal kombinálhatók. Az ilyen kombinációkban alkalmazható vegyületekre példaként említhetők a Catalog 1995 Edition of Farm Chemicals Handbook (Meister Publishing Company), az AG Chem. New Compound Review, 13 (1995) (AG Chem. Information Service); Josouzai Kenkyo Souran (Hakuyusha) vagy Herbicide Handbook, 7. kiadás (Weed Science of America) irodalmakban ismertetett vegyületek. Az ilyen vegyületekre jellemző példaként

említhetők a következők: atrazin, cianazin, metribuzin, prometrin, simazin, klórtoluron, diuron, dimron, fluometuron, izoproturon, metabenzthiazuron, bromoxinil, ioxinil, pendimetalin, trufuralin, acifluorfen, acifluorfen-nátrium, klometoxinil, fomeszafen, laktofen, oxifluorfen, karfentrazo, flumiklorak-pentil, flumioxazin, flutiacet-metil, szulfentrazon, dikvat, parakvat, 2,4-D, 2,4-DB, DCPA, MCPA, MCPB, klomeprop, klopíralid, dikamba, di-tiopir, fluroxipir, mekoprop, naproanilid, kvinklorak, trikopir, acetoklór, di-etatil-etil, metolaklór, pretilaklór, benszulfuron-metil, klórszulfuron, klori-muron-etil, haloszulfuron-metil, metszulfuron-metil, nikoszulfuron, primi-szulfuron, pirazoszulfuron-etil, szulfometuron-metil, trifenszulfuron-metil, triaszulfuron, tribenuron-metil, azimszulfuron, klóranszulam-metil, ciklo-szulfamuron, flumetszulam, flupirszulfuron, flazaszulfuron, imazoszulfuron, metoszulam, proszulfuron, rimszulfuron, trifluszulfuron-metil, imazapir, ima-zakvin, imazetapir, imazamox, biszpiribak-nátrium, piritiobak-nátrium, kle-todim, szetoxidim, tralkoxidim, diklofop-metil, fenoxaprop-etil, fenoxaprop-p-etil, fluazifop-butil, fluazifop-p-butil, haloxifop-metil, kvizalofop-p-etil, cihalofop-butil, klodinafop-propargil, klomazon, diflufenikan, norflurazon, pirazolát, pirazoxifen, izoxaflutol, szulkotrión, glufozinát-ammónium, glifo-zát, bentazon, bromobutid, butamifosz, dimepiperát, dimeténamid, DSMA, mefenacet, molinát, MSMA, piributikarb, propanil, piridát, triallát, ka-fensztrol és tiafluamid.

A találmány szerinti vegyületek keverhetők továbbá inszekticid, akari-cid, nematocid, fungicid hatóanyagokkal, növényi növekedésszabályzókkal, műtrágyaanyagokkal és talajjavítókkal.

A találmány szerinti vegyületek felhasználási mennyisége általában 0,01-10000 g/ha, előnyösen 0,5-8000 g/ha, de az optimális érték függ a kör-nyezeti klímától, az időjárástól, a készítmény típusától, az adagolás idő-pontjától és módjától, a talaj típusától, a kezelt kultúrnövénytől és gyomnö-

vénytől. Emulgeálható koncentrátum, nedvesíthető porkészítmény, koncentrált emulzió vagy vízben diszpergálható granulátum esetében a készítményt az előírt mennyiségben vízzel hektáronként mintegy 10-1000 l mennyiségben hígítva alkalmazzuk kívánt esetben további segédanyag, így felületaktív anyag alkalmazása mellett. A granulátum formájában kiszerelt készítményt általában további hígítás nélkül közvetlenül alkalmazzuk.

Az adott esetben alkalmazott további segédanyagra példaként említhetők a fent felsorolt felületaktív anyagok, valamint poli(oxi-etilén) gyanta savak (vagy észterek), lignin-szulfonátok, dinaftil-metán-diszulfonátok, szilikon polimerek és növényi olajok, így szójababolaj, kukoricaolaj, gyapotmagolaj és napraforgóolaj.

A találmány szerinti vegyületek felhasználhatók továbbá a betakarítás megkönnyítésére defóliánsként és deszikkánsként például gyapot (*Gossypium* spp.) esetén és deszikkánsként burgonya (*Solanum tuberosum*) esetén. Ebben az esetben a találmány szerinti vegyületeket általában ugyanúgy szereljük ki, mint herbicidként történő alkalmazás esetén, és önmagukban vagy más betakarítást elősegítő hatóanyaggal kombinálva használjuk.

A találmányt közelebbről az alábbi példákkal mutatjuk be anélkül, hogy az oltalmi kör a példákra korlátozódna.

A következőkben a találmány szerinti vegyületek előállítását mutatjuk be a találmány szerinti vegyületeket tartalmazó 1-5. táblázatokban alkalmazott sorszám, valamint a kiindulási anyagokat tartalmazó 6-8. táblázatokban alkalmazott sorszám alapján.

1. előállítási példa

(1) 23,3 g 3-(2,4-difluor-fenil)-6-trifluor-metil-2-oxo-1,2-dihidropirazin (1-1004. vegyület) 150 ml acetonban felvett oldatához 17,5 g kálium-karbonátot és 14,3 g metil-jodidot adunk, és az elegyet 15 órán keresztül szobahőmérsékleten kevertetjük. A reakció befejeződése után az aceton fő tömegét

csökkentett nyomáson ledesztilláljuk, és a maradékot vízre öntjük, majd etil-acetáttal extraháljuk. A szerves fázist telített nátrium-klorid-oldattal mossuk, vízmentes magnézium-szulfáton szárítjuk, és bepároljuk. A maradékot szilikagélen hexán/etil-acetát 19 : 1 eleggyel eluálva oszlopkromatográfiásan tisztítjuk. Így 16,1 g 3-(2,4-difluor-fenil)-2-metoxi-6-trifluor-metil-pirazint (olvadáspont: 55,3 °C) kapunk korábban eluálódó O-metilezett vegyületként, és 7,13 g (kitermelés: 29 %) 3-(2,4-difluor-fenil)-1-metil-6-trifluor-metil-2-oxo-1,2-dihidropirazint kapunk (1-10. vegyület, olvadáspont: 73,0 °C) később eluálódó kívánt vegyületként.

(2) 85 ml koncentrált kénsavhoz 7,0 g 3-(2,4-difluor-fenil)-1-metil-6-trifluor-metil-2-oxo-1,2-dihidropirazint (1-10. vegyület) adunk 5 °C hőmérsékleten. Ezután 9 ml 70 tömeg%-os salétromsavat adunk hozzá, és az elegyet 8 órán keresztül 5-10 °C hőmérsékleten kevertetjük. A reakció befejeződése után a reakcióelegyet jeges vízre öntjük, és etil-acetáttal extraháljuk. A szerves fázist vízzel, majd telített nátrium-klorid-oldattal mossuk, vízmentes magnézium-szulfáton szárítjuk, és bepároljuk. A maradékot szilikagélen oszlopkromatográfiásan tisztítva 7,76 g (kitermelés: 96 %) 3-(2,4-difluor-5-nitro-fenil)-1-metil-6-trifluor-metil-2-oxo-1,2-dihidropirazint (1-16. vegyület, olvadáspont: 93,2 °C) kapunk.

(3) 7,61 g 3-(2,4-difluor-5-nitro-fenil)-1-metil-6-trifluor-metil-2-oxo-1,2-dihidropirazin (1-16. vegyület) 10 ml 1,4-dioxánban felvett oldatához 5,28 g kálium-fluoridot és 9,0 g butil-glikolátot adunk, és 1,5 órán keresztül visszafolyatás közben forraljuk. A reakció befejeződése után a reakcióelegyet hagyjuk szobahőmérsékletre hűlni, majd vízre öntjük, és etil-acetáttal extraháljuk. A szerves fázist telített nátrium-klorid-oldattal mossuk, vízmentes magnézium-szulfáton szárítjuk, és bepároljuk. A maradékot szilikagélen oszlopkromatográfiásan tisztítva 8,37 g (kitermelés: 82 %) 3-[4-(butoxi-karbonil-metoxi)-2-fluor-5-nitro-fenil]-1-metil-6-trifluor-metil-2-oxo-1,2-dihid-

ropirazint [(1/3) képletű vegyület, olvadáspont: 109,5 °C] kapunk.

(4) 2,8 g vasport adunk 5 ml ecetsav és 50 ml víz elegyéhez, és 50 °C hőmérsékletre melegítjük. Az elegyhez lassan 2,8 g 3-[4-(butoxi-karbonil-metoxi)-2-fluor-5-nitro-fenil]-1-metil-6-trifluor-metil-2-oxo-1,2-dihidropirazin [(1/3) képletű vegyület] 25 ml etil-acetát és 25 ml ecetsav elegyében felvett oldatát csepegtetjük. A reakcióelegyet 1 órán keresztül 60-70 °C belső hőmérsékleten kevertetjük. A reakció befejeződése után a reakcióelegyet jeges vízre öntjük, és etil-acetáttal extraháljuk. A szerves fázist telített nátrium-hidrogén-karbonát-oldattal, vízzel, majd telített nátrium-klorid-oldattal mossuk, vízmentes magnézium-szulfáton szárítjuk, és bepároljuk. Így 1,22 g 3-(7-fluor-3-oxo-2H-1,4-benzoxazin-6-il)-1-metil-6-trifluor-metil-2-oxo-1,2-dihidropirazint (2-49. vegyület, olvadáspont: 182,5 °C) kapunk.

(5) 1,22 g 3-(7-fluor-3-oxo-2H-1,4-benzoxazin-6-il)-1-metil-6-trifluor-metil-2-oxo-1,2-dihidropirazin (2-49. vegyület) 15 ml N,N-dimetil-formamidban felvett oldatához 0,59 g kálium-karbonátot és 0,47 g propargil-bromidot adunk, és 3 órán keresztül szobahőmérsékleten kevertetjük. A reakció befejeződése után a reakcióelegyet vízre öntjük, és etil-acetáttal extraháljuk. A szerves fázist telített nátrium-klorid-oldattal mossuk, vízmentes magnézium-szulfáton szárítjuk, és bepároljuk. A maradékot szilikagélen oszlopkromatográfiásan tisztítva 0,60 g [kitermelés a (4) és (5) lépésre együtt számolva: 25 %] 3-(7-fluor-3-oxo-4-propargil-2H-1,4-benzoxazin-6-il)-1-metil-6-trifluor-metil-2-oxo-1,2-dihidropirazint (2-61. vegyület, olvadáspont: 141,4 °C) kapunk.

2. előállítási példa

(1) 3,61 g 3-(2-fluor-5-metoxi-fenil)-6-trifluor-metil-2-oxo-1,2-dihidropirazin (1-1008. vegyület) 16 ml N,N-dimetil-formamidban felvett oldatához 2,35 g kálium-karbonátot és 1,39 ml metil-jodidot adunk, és az elegyet 2 napon keresztül 100 °C hőmérsékleten kevertetjük. A reakció befejeződése

után a reakcióelegyet vízre öntjük, és etil-acetáttal extraháljuk. A szerves fázist telített nátrium-klorid-oldattal mossuk, vízmentes magnézium-szulfáton szárítjuk, és bepároljuk. A maradékot szilikagélen hexán/etil-acetát 5 : 1 eleggyel eluálva oszlopkromatográfiásan tisztítjuk. Így 2,04 g (kitermelés: 55 %) 3-(4-klór-2-fluor-5-metoxi-fenil)-1-metil-6-trifluor-metil-2-oxo-1,2-dihidropirazint (1-144. vegyület, olvadáspont: 108,7 °C) kapunk.

(2) 2,04 g 3-(4-klór-2-fluor-5-metoxi-fenil)-1-metil-6-trifluor-metil-2-oxo-1,2-dihidropirazin (1-144. vegyület) és 35 ml 48 tömeg%-os hidrogén-bromid 12 ml ecetsavban felvett oldatát 1 órán keresztül 140 °C hőmérsékleten kevertetjük. A reakció befejeződése után a reakcióelegyet vízre öntjük, és etil-acetáttal extraháljuk. A szerves fázist telített nátrium-hidrogén-karbonát-oldattal, vízzel, majd telített nátrium-klorid-oldattal mossuk, vízmentes magnézium-szulfáton szárítjuk, és bepároljuk. A maradékot szilikagélen oszlopkromatográfiásan tisztítva 1,55 g (kitermelés: 79 %) 3-(4-klór-2-fluor-5-hidroxi-fenil)-1-metil-6-trifluor-metil-2-oxo-1,2-dihidropirazint (1-61. vegyület, olvadáspont: 188,1 °C) kapunk.

(3) 0,148 g 3-(4-klór-2-fluor-5-hidroxi-fenil)-1-metil-6-trifluor-metil-2-oxo-1,2-dihidropirazin (1-61. vegyület) 0,90 ml N,N-dimetil-formamidban felvett oldatához 0,097 g kálium-karbonátot és 57 µl metil-2-bróm-propionátot adunk, és 1 órán keresztül szobahőmérsékleten kevertetjük. A reakció befejeződése után a reakcióelegyet vízre öntjük, és etil-acetáttal extraháljuk. A szerves fázist telített nátrium-klorid-oldattal mossuk, vízmentes magnézium-szulfáton szárítjuk, és bepároljuk. A maradékot szilikagélen oszlopkromatográfiásan tisztítva 0,180 g (kitermelés: 96 %) 3-[4-klór-2-fluor-5-(1-metoxi-karbonil-etoxi)-fenil]-1-metil-6-trifluor-metil-2-oxo-1,2-dihidropirazint (1-173. vegyület) kapunk.

¹H-NMR spektrum (CDCl₃/TMS, 250 MHz, δ ppm): 1,68 (d, 3H, J = 6,8 Hz), 3,67 (s, 3H), 3,6 (s, 3H), 4,76 (q, 1H, J = 6,8 Hz), 7,2-7,3 (m,

2H), 7,83 (s, 1H).

3. előállítási példa

A 2. példa (3) lépésében leírt módon 0,184 g (kitermelés: 95 %) 3-[4-klór-2-fluor-5-(1-metoxi-karbonil-etoxi)-fenil]-1-metil-6-trifluor-metil-2-oxo-1,2-dihidropirazint (1-174. vegyület) állítunk elő 0,150 g 3-(4-klór-2-fluor-5-hidroxi-fenil)-1-metil-6-trifluor-metil-2-oxo-1,2-dihidropirazin (1-61. vegyület), 0,90 ml N,N-dimetil-formamid, 0,097 g kálium-karbonát és 73 µl etil-2-bróm-propionát alkalmazásával.

¹H-NMR spektrum (CDCl₃/TMS, 300 MHz, δ ppm): 1,26 (t, 3H, J = 7,1 Hz), 1,67 (d, 3H, J = 6,9 Hz), 3,67 (s, 3H), 4,22 (q, 2H, J = 7,1 Hz), 4,76 (q, 1H, J = 6,9 Hz), 7,2-7,3 (m, 2H), 7,82 (s, 1H).

4. előállítási példa

(1) 0,659 g 3-(4-fluor-fenil)-6-trifluor-metil-2-oxo-1,2-dihidropirazin (1-1001. vegyület) 3,8 ml N,N-dimetil-formamidban felvett oldatához 0,529 g kálium-karbonátot és 0,32 ml metil-jodidot adunk, és 1,5 napon keresztül 100 °C hőmérsékleten kevertetjük. A reakció befejeződése után a reakcióelegyet vízre öntjük, és etil-acetáttal extraháljuk. A szerves fázist telített nátrium-klorid-oldattal mossuk, vízmentes magnézium-szulfáton szárítjuk, és bepároljuk. A maradékot szilikagélen hexán/etil-acetát 8 : 1 eleggyel eluálva oszlopkromatográfiás tisztítjuk. Így 0,480 g (kitermelés: 69 %) 3-(4-fluor-fenil)-1-metil-6-trifluor-metil-2-oxo-1,2-dihidropirazint (1-4. vegyület, olvadáspont: 121,1 °C) kapunk.

(2) 2,5 ml koncentrált kénsavhoz 0,34 g 3-(4-fluor-fenil)-1-metil-6-trifluor-metil-2-oxo-1,2-dihidropirazint (1-4. vegyület) adunk 5 °C hőmérsékleten. Az elegyhez 0,13 ml 61 tömeg%-os salétromsavat adunk, és 1 órán keresztül szobahőmérsékleten kevertetjük. A reakció befejeződése után a reakcióelegyet jeges vízre öntjük, és etil-acetáttal extraháljuk. A szerves fázist vízzel, majd telített nátrium-klorid-oldattal mossuk, vízmentes magnézium-

(3) 1,10 g 3-(4-fluor-5-nitro-fenil)-1-metil-6-trifluor-metil-2-oxo-1,2-dihidropirazin (1-13. vegyület) 4,0 ml 1,4-dioxánban felvett oldatához 0,812 g kálium-fluoridot és 0,925 g butil-glikolátot adunk, és 1,5 órán keresztül visszafolytatás közben forraljuk. A reakció befejeződése után a reakcióelegyet hagyjuk szobahőmérsékletre hűlni. Ezután vízre öntjük, és etil-acetáttal extraháljuk. A szerves fázist telített nátrium-klorid-oldattal mossuk, vízmentes magnézium-szulfáton szárítjuk, és bepároljuk. A maradékot szilikagélen oszlopkromatográfiásan tisztítva 1,25 g (kitermelés: 83 %) 3-[4-(butoxi-karbonil-metoxi)-5-nitro-fenil]-1-metil-6-trifluor-metil-2-oxo-1,2-dihidropirazint [(4/3) képletű vegyület] kapunk.

(4) 0,24 g 10 tömeg%-os palládium/szén katalizátort adunk 1,25 g 3-[4-(butoxi-karbonil-metoxi)-5-nitro-fenil]-1-metil-6-trifluor-metil-2-oxo-1,2-dihidropirazin 36 ml etil-acetátban felvett oldatához nitrogén atmoszféra alatt, majd a nitrogént 1 atm nyomású hidrogénnel helyettesítjük, és az elegyet 2 órán keresztül szobahőmérsékleten kevertetjük. A reakció befejeződése után a reakcióelegyet celiten szűrjük, és bepároljuk. A nyers terméket 2,0 ml ecetsavban felvesszük, és 1 órán keresztül szobahőmérsékleten kevertetjük. A reakció befejeződése után a reakcióelegyet vízre öntjük, és etil-acetáttal extraháljuk. A szerves fázist telített nátrium-hidrogén-karbonát-oldattal, vízzel, majd telített nátrium-klorid-oldattal mossuk, vízmentes

magnézium-szulfáton szárítjuk, és bepároljuk. A maradékot szilikagélen oszlop-kromatográfiásan tisztítva 0,45 g (kitermelés: 48 %) 3-(3-oxo-2H-1,4-benzoxazin-6-il)-1-metil-6-trifluor-metil-2-oxo-1,2-dihidropirazint (2-1. vegyület, olvadáspont: 191,1 °C) kapunk.

(5) 0,15 g 3-(3-oxo-2H-1,4-benzoxazin-6-il)-1-metil-6-trifluor-metil-2-oxo-1,2-dihidropirazin (2-1. vegyület) 0,92 ml N,N-dimetil-formamidban felvett oldatához 0,127 g kálium-karbonátot és 70 µl propargil-bromidot adunk, és 2 órán keresztül 60 °C hőmérsékleten kevertetjük. A reakció befejeződése után a reakcióelegyet vízre öntjük és etil-acetáttal extraháljuk. A szerves fázist telített nátrium-klorid-oldattal mossuk, vízmentes magnézium-szulfáton szárítjuk, és bepároljuk. A maradékot szilikagélen oszlop-kromatográfiásan tisztítva 0,14 g (kitermelés: 74 %) 3-(3-oxo-4-propargil-2H-1,4-benzoxazin-6-il)-1-metil-6-trifluor-metil-2-oxo-1,2-dihidropirazint (2-13. vegyület, olvadáspont: 129,2 °C) kapunk.

5. előállítási példa

(1) 2,93 g 3-(4-klór-2-fluor-fenil)-6-trifluor-metil-2-oxo-1,2-dihidropirazin (1-1005. vegyület) 15 ml N,N-dimetil-formamidban felvett oldatához 2,07 g kálium-karbonátot és 1,25 ml metil-jodidot adunk, és 2 napon keresztül 100 °C hőmérsékleten kevertetjük. A reakció befejeződése után a reakcióelegyet vízre öntjük, és etil-acetáttal extraháljuk. A szerves fázist telített nátrium-klorid-oldattal mossuk, vízmentes magnézium-szulfáton szárítjuk, és bepároljuk. A maradékot szilikagélen hexán/etil-acetát 6 : 1 eleggyel eluálva oszlop-kromatográfiásan tisztítjuk. Így 1,98 g (kitermelés: 65 %) 3-(4-klór-2-fluor-fenil)-1-metil-6-trifluor-metil-2-oxo-1,2-dihidropirazint (1-11. vegyület, olvadáspont: 83,2 °C) kapunk.

(2) 3,3 ml koncentrált kénsavhoz 0,50 g 3-(4-klór-2-fluor-fenil)-1-metil-6-trifluor-metil-2-oxo-1,2-dihidropirazint (1-11. vegyület) adunk 5 °C hőmérsékleten. Ezután 0,17 ml 61 tömeg%-os salétromsavat adunk hozzá, és

az elegyet 1 órán keresztül szobahőmérsékleten kevertetjük. A reakció befejeződése után a reakcióelegyet jeges vízre öntjük, és etil-acetáttal extraháljuk. A szerves fázist vízzel, majd telített nátrium-klorid-oldattal mossuk, vízmentes magnézium-szulfáton szárítjuk, és bepároljuk. A maradékot szilikagélen oszlopkromatográfiásan tisztítva 0,55 g (kitermelés: 95 %) 3-(4-klór-2-fluor-5-nitro-fenil)-1-metil-6-trifluor-metil-2-oxo-1,2-dihidropirazint (1-17. vegyület, olvadáspont: 98,3 °C) kapunk.

(3) 0,37 g vasport adunk 5,3 ml ecetsav és 2,0 ml víz elegyéhez, és az elegyhez lassan 0,39 g 3-(4-klór-2-fluor-5-nitro-fenil)-1-metil-6-trifluor-metil-2-oxo-1,2-dihidropirazin (1-17. vegyület) 1,0 ml ecetsavban felvett oldatát csepegtetjük. A reakcióelegyet 3,5 órán keresztül szobahőmérsékleten kevertetjük. A reakció befejeződése után a reakcióelegyet vízre öntjük, és etil-acetáttal extraháljuk. A szerves fázist kétszer vízzel, majd telített nátrium-klorid-oldattal mossuk, vízmentes magnézium-szulfáton szárítjuk, és bepároljuk. Így 0,16 g (kitermelés: 46 %) 3-(5-amino-4-klór-2-fluor-fenil)-1-metil-6-trifluor-metil-2-oxo-1,2-dihidropirazint (1-23. vegyület) kapunk.

¹H-NMR spektrum (CDCl₃/TMS, 300 MHz, δ ppm): 3,66 (s, 3H), 4,1-4,5 (széles, 2H), 7,01 (d, 1H, J = 6,4 Hz), 7,11 (d, 1H, J = 9,5 Hz), 7,82 (s, 1H).

(4) 0,10 g 3-(5-amino-4-klór-2-fluor-fenil)-1-metil-6-trifluor-metil-2-oxo-1,2-dihidropirazin (1-23. vegyület) 0,62 ml piridinben felvett oldatához 36 µl metánszulfonil-kloridot csepegtetünk, és 5 órán keresztül szobahőmérsékleten kevertetjük. A reakció befejeződése után a reakcióelegyet vízre öntjük, és kloroformmal extraháljuk. A szerves fázist 2N sósavval, vízzel, telített nátrium-hidrogén-karbonát-oldattal, majd telített nátrium-klorid-oldattal mossuk, vízmentes magnézium-szulfáton szárítjuk, és bepároljuk. A maradékot szilikagélen oszlopkromatográfiásan tisztítva 91 mg (kitermelés: 73 %) 3-[4-klór-2-fluor-5-(metánszulfonil-amino)-fenil]-1-metil-6-trifluor-metil-2-oxo-

-1,2-dihidropirazint (1-37. vegyület, olvadáspont: 168,5 °C) kapunk.

6. előállítási példa

0,12 g 3-(5-amio-4-klór-2-fluor-fenil)-1-metil-6-trifluor-metil-2-oxo-1,2-dihidropirazin (1-23. vegyület) és 70 µl etil-2-bróm-propionát elegyét 3 órán keresztül 140 °C hőmérsékleten kevertetjük. A reakció befejeződése után a reakcióelegyet vízre öntjük, és etil-acetáttal extraháljuk. A szerves fázist telített nátrium-klorid-oldattal mossuk, vízmentes magnézium-szulfáton szárítjuk, és bepároljuk. A maradékot szilikagélen oszlopkromatográfián tisztítva 80 mg (kitermelés: 51 %) 3-{4-klór-5-[1-(etoxi-karbonil)-etil-amino]-2-fluor-fenil}-1-metil-6-trifluor-metil-2-oxo-1,2-dihidropirazint (1-90. vegyület) kapunk.

¹H-NMR spektrum (CDCl₃/TMS, 300 MHz, δ ppm): 1,26 (t, 3H, J = 7,1 Hz), 1,52 (d, 3H, J = 6,8 Hz), 3,67 (s, 3H), 4,1-4,3 (m, 3H), 4,7-4,8 (széles, 1H), 6,83 (d, 1H, J = 6,2 Hz), 7,17 (d, 1H, J = 9,6 Hz), 7,81 (s, 1H).

7. előállítási példa

(1) 79 mg 10 tömeg% palládium/szén katalizátort adunk 0,30 g 3-(4-fluor-5-nitro-fenil)-1-metil-6-trifluor-metil-2-oxo-1,2-dihidropirazin (1-13. vegyület) 12 ml etil-acetátban felvett oldatához nitrogén atmoszférában, majd a nitrogént 1 atm nyomású hidrogénnel helyettesítjük, és az elegyet 3 órán keresztül szobahőmérsékleten kevertetjük. A reakció befejeződése után a reakcióelegyet celiten szűrjük, és bepároljuk. A maradékot szilikagélen oszlopkromatográfián tisztítva 0,13 g (kitermelés: 47 %) 3-(5-amino-4-fluor-fenil)-1-metil-6-trifluor-metil-2-oxo-1,2-dihidropirazint (1-19. vegyület) kapunk.

¹H-NMR spektrum (CDCl₃/TMS, 250 MHz, δ ppm): 3,66 (s, 3H), 3,7-3,9 (széles, 2H), 7,05 (dd, 1H, J = 10,7 Hz, 8,7 Hz), 7,80 (s, 1H), 7,7-7,9 (m, 1H), 7,89 (dd, 1H, J = 8,9 Hz, 2,2 Hz).

(2) 0,12 g 3-(5-amino-4-fluor-fenil)-1-metil-6-trifluor-metil-2-oxo-1,2-dihidropirazin (1-19. vegyület) és 0,23 g etil-2-bróm-propionát elegyét 3 órán keresztül 130 °C hőmérsékleten kevertetjük. A reakció befejeződése után a reakcióelegyet vízre öntjük, és etil-acetáttal extraháljuk. A szerves fázist telített nátrium-klorid-oldattal mossuk, vízmentes magnézium-szulfáton szárítjuk, és bepároljuk. A maradékot szilikagélen oszlopkromatográfiásan tisztítva 52 mg (kitermelés: 32 %) 3-{5-[1-(etoxi-karbonil)-etil-amino]-4-fluor-fenil}-1-metil-6-trifluor-metil-2-oxo-1,2-dihidropirazint (1-355. vegyület, olvadáspont: 78,2 °C) kapunk.

8. előállítási példa

(1) 1,20 g 3-(2,4-diklór-fenil)-6-trifluor-metil-2-oxo-1,2-dihidropirazin (1-1007. vegyület) 6,0 ml N,N-dimetil-formamidban felvett oldatához 0,83 g kálium-karbonátot és 0,51 ml metil-jodidot adunk, és 2 napon keresztül 100 °C hőmérsékleten kevertetjük. A reakció befejeződése után a reakcióelegyet vízre öntjük, és etil-acetáttal extraháljuk. A szerves fázist telített nátrium-klorid-oldattal mossuk, vízmentes magnézium-szulfáton szárítjuk, és bepároljuk. A maradékot szilikagélen hexán/etil-acetát 5 : 1 eleggyel eluálva oszlopkromatográfiásan tisztítjuk. Így 0,81 g (kitermelés: 62 %) 3-(2,4-diklór-fenil)-1-metil-6-trifluor-metil-2-oxo-1,2-dihidropirazint (1-332. vegyület) kapunk.

¹H-NMR spektrum (CDCl₃/TMS, 250 MHz, δ ppm): 3,68 (s, 3H), 7,35 (dd, 1H, J = 8,3 Hz, 1,9 Hz), 7,42 (d, 1H, J = 8,3 Hz), 7,50 (d, 1H, J = 1,9 Hz), 7,84 (s, 1H).

(2) 1,7 ml koncentrált kénsavhoz 0,26 g 3-(2,4-diklór-fenil)-1-metil-6-trifluor-metil-2-oxo-1,2-dihidropirazint (1-332. vegyület) adunk 5 °C hőmérsékleten. Az elegyhez 85 µl 61 tömeg%-os salétromsavat adunk, és 1 órán keresztül szobahőmérsékleten kevertetjük. A reakció befejeződése után a reakcióelegyet jeges vízre öntjük, és kloroformmal extraháljuk. A szerves fá-

zist vízzel, majd telített nátrium-klorid-oldattal mossuk, vízmentes magnézium-szulfáton szárítjuk, és bepároljuk. A maradékot szilikagélen oszlopkromatográfiásan tisztítva 0,29 g (kitermelés: 95 %) 3-(2,4-diklór-5-nitro-fenil)-1-metil-6-trifluor-metil-2-oxo-1,2-dihidropirazint (1-333. vegyület, olvadáspont: 114,3 °C) kapunk.

(3) 0,59 g vasport adunk 5,3 ml ecetsav és 3,2 ml víz elegyéhez, és az elegyhez lassan 0,65 g 3-(2,4-diklór-5-nitro-fenil)-1-metil-6-trifluor-metil-2-oxo-1,2-dihidropirazin (1-333. vegyület) 1,6 ml ecetsavban felvett oldatát csepegtetjük, és 2 órán keresztül szobahőmérsékleten kevertetjük. A reakció befejeződése után a reakcióelegyet jeges vízre öntjük, és etil-acetáttal extraháljuk. A szerves fázist telített nátrium-hidrogén-karbonát-oldattal, vízzel, majd telített nátrium-klorid-oldattal mossuk, vízmentes magnézium-szulfáton szárítjuk, és bepároljuk. Így 0,49 g (kitermelés: 82 %) 3-(5-amino-2,4-diklór-fenil)-1-metil-6-trifluor-metil-2-oxo-1,2-dihidropirazint (1-334. vegyület, olvadáspont: 188,7 °C) kapunk.

(4) 0,15 g 3-(5-amino-2,4-diklór-fenil)-1-metil-6-trifluor-metil-2-oxo-1,2-dihidropirazin (1-334. vegyület) 0,88 ml piridinben felvett oldatához 52 µl metánszulfonil-kloridot csepegtetünk, és 5 órán keresztül szobahőmérsékleten kevertetjük. A reakció befejeződése után a reakcióelegyet vízre öntjük, és kloroformmal extraháljuk. A szerves fázist 2N sósavval, vízzel, telített nátrium-hidrogén-karbonát-oldattal, majd telített nátrium-klorid-oldattal mossuk, vízmentes magnézium-szulfáton szárítjuk, és bepároljuk. A maradékot szilikagélen oszlopkromatográfiásan tisztítva 45 mg (kitermelés: 25 %) 3-(2,4-diklór-5-metánszulfonil-amino-fenil)-1-metil-6-trifluor-metil-2-oxo-1,2-dihidropirazint (1-343. vegyület, olvadáspont: 189,2 °C) kapunk.

9. előállítási példa

0,15 g 3-(5-amino-2,4-diklór-fenil)-1-metil-6-trifluor-metil-2-oxo-1,2-dihidropirazin (1-334. vegyület) és 172 µl etil-2-bróm-propionát elegyét 3

órán keresztül 150 °C hőmérsékleten kevertetjük. A reakció befejeződése után a reakcióelegyet vízre öntjük, és etil-acetáttal extraháljuk. A szerves fázist telített nátrium-klorid-oldattal mossuk, vízmentes magnézium-szulfáton szárítjuk, és bepároljuk. A maradékot szilikagélen oszlopkromatográfiásan tisztítva 92 mg (kitermelés: 48 %) 3-{2,4-diklór-5-[1-(etoxi-karbonil)-etil-amino]-fenil}-1-metil-6-trifluor-metil-2-oxo-1,2-dihidropirazint (1-336. vegyület) kapunk.

¹H-NMR spektrum (CDCl₃/TMS, 300 MHz, δ ppm): 1,26 (t, 3H, J = 7,2 Hz), 1,51 (d, 3H, J = 7,0 Hz), 3,67 (s, 3H), 4,1-4,2 (m, 1H), 4,21 (dq, 2H, J = 7,2 Hz, 1,6 Hz), 4,94 (d, 1H, J = 7,7 Hz), 6,65(s, 1H), 7,40 (s, 1H), 7,81 (s, 1H).

10. előállítási példa

(1) 0,35 g 3-(5-amino-2,4-diklór-fenil)-1-metil-6-trifluor-metil-2-oxo-1,2-dihidropirazin (1-334. vegyület) és 3,1 ml etil-klór-formiát elegyét 2 órán keresztül 100 °C hőmérsékleten kevertetjük. A reakció befejeződése után a reakcióelegyet hagyjuk szobahőmérsékletre hűlni, és az etil-klór-formiát feleslegét csökkentett nyomáson ledesztilláljuk. A maradékot hexánból átkristályosítva 0,32 g (kitermelés: 79 %) 3-(2,4-diklór-5-etoxi-karbonil-amino-fenil)-1-metil-6-trifluor-metil-2-oxo-1,2-dihidropirazint (1-346. vegyület, olvadáspont: 116,2 °C) kapunk.

(2) 20 mg nátrium-hidrid (60 tömeg%-os, olajos) és 1,3 ml tetrahidrofuran elegyét 0 °C hőmérsékletre hűtjük. Az elegyhez 0,21 g 3-(2,4-diklór-5-etoxi-karbonil-amino-fenil)-1-metil-6-trifluor-metil-2-oxo-1,2-dihidropirazin (1-346. vegyület) 1,3 ml tetrahidrofuranban felvett oldatát csepegtetjük, és 10 percen keresztül 0 °C hőmérsékleten kevertetjük. Ezután 42 µl propargil-bromidot adunk hozzá, és 1 órán keresztül 0 °C hőmérsékleten kevertetjük. A reakció befejeződése után a reakcióelegyet telített ammónium-klorid-oldatra öntjük és dietil-éterrel extraháljuk. A szerves fázist vízmentes magné-

zium-szulfáton szárítjuk, és bepároljuk. A maradékot szilikagélen oszlop-kromatográfiásan tisztítva 36 mg (kitermelés: 16 %) 3-{2,4-diklór-5-[N-(etoxi-karbonil)-propargil-amino]-fenil}-1-metil-6-trifluor-metil-2-oxo-1,2-dihidropirazint (1-351. vegyület, olvadáspont: 132,3 °C) kapunk.

11. előállítási példa

0,15 g 3-(4-klór-2-fluor-5-hidroxi-fenil)-1-metil-6-trifluor-metil-2-oxo-1,2-dihidropirazin (1-61. vegyület) 0,50 ml N,N-dimetil-formamidban felvett oldatához 97 mg kálium-karbonátot és 48 µl metil-bróm-acetátot adunk, és 1 órán keresztül szobahőmérsékleten kevertetjük. A reakció befejeződése után a reakcióelegyet vízre öntjük, és etil-acetáttal extraháljuk. A szerves fázist telített nátrium-klorid-oldattal mossuk, vízmentes magnézium-szulfáton szárítjuk, és bepároljuk. A maradékot szilikagélen oszlop-kromatográfiásan tisztítva 97 mg (kitermelés: 53 %) 3-{4-klór-2-fluor-5-[(metoxi-karbonil)-metoxi]-fenil}-1-metil-6-trifluor-metil-2-oxo-1,2-dihidropirazint (1-165. vegyület, olvadáspont: 116,6 °C) kapunk.

12. előállítási példa

A 11. előállítási példában leírt módon 83 mg (kitermelés: 94 %) 3-{4-klór-2-fluor-5-[(etoxi-karbonil)-metoxi]-fenil}-1-metil-6-trifluor-metil-2-oxo-1,2-dihidropirazin (1-166. vegyület, olvadáspont: 87,5-87,9 °C) kapunk 70 mg 3-(4-klór-2-fluor-5-hidroxi-fenil)-1-metil-6-trifluor-metil-2-oxo-1,2-dihidropirazin (1-61. vegyület), 0,25 ml N,N-dimetil-formamid, 36 mg kálium-karbonát és 38 mg etil-bróm-acetát alkalmazásával.

13. előállítási példa

A 11. előállítási példában leírt módon 116 mg (kitermelés: 83 %) 3-{4-klór-2-fluor-5-[(pentoxi-karbonil)-metoxi]-fenil}-1-metil-6-trifluor-metil-2-oxo-1,2-dihidropirazint (1-169. vegyület) kapunk 100 mg 3-(4-klór-2-fluor-5-hidroxi-fenil)-1-metil-6-trifluor-metil-2-oxo-1,2-dihidropirazin (1-61. ve-

gyület), 0,60 ml N,N-dimetil-formamid, 64 mg kálium-karbonát és 56 mg pentil-klór-acetát alkalmazásával.

¹H-NMR spektrum (CDCl₃/TMS, 300 MHz, δ ppm): 0,88 (t, 3H, J = 6,9 Hz), 1,2-1,4 (m, 4H), 1,65 (tt, 2H, J = 7,0 Hz, 6,9 Hz), 3,68 (s, 3H), 4,20 (t, 2H, J = 6,9 Hz), 4,70 (s, 2H), 7,22 (d, 1H, J = 6,0 Hz), 7,27 (d, 1H, J = 9,4 Hz), 7,83 (s, 1H).

14. előállítási példa

A 11. előállítási példában leírt módon 130 mg (kitermelés: 96 %) 3-{4-klór-2-fluor-5-[(terc-butoxi-karbonil)-metoxi]-fenil}-1-metil-6-trifluor-metil-2-oxo-1,2-dihidropirazint (1-356. vegyület) kapunk 100 mg 3-(4-klór-2-fluor-5-hidroxi-fenil)-1-metil-6-trifluor-metil-2-oxo-1,2-dihidropirazin (1-61. vegyület), 0,60 ml N,N-dimetil-formamid, 64 mg kálium-karbonát és 66 mg terc-butyl-bróm-acetát alkalmazásával.

¹H-NMR spektrum (CDCl₃/TMS, 300 MHz, δ ppm): 1,48 (s, 9H), 3,68 (s, 3H), 4,59 (s, 2H), 7,20 (d, 1H, J = 6,2 Hz), 7,26 (d, 1H, J = 9,4 Hz), 7,82 (s, 1H).

15. előállítási példa

100 mg 3-{4-klór-2-fluor-5-[(metoxi-karbonil)-metoxi]-fenil}-1-metil-6-trifluor-metil-2-oxo-1,2-dihidropirazin (1-165. vegyület) 1,0 ml propanolban felvett oldatához 10 mg p-toluolszulfonsav-monohidrátot adunk, és 5 órán keresztül visszafolytatás közben forraljuk. A reakció befejeződése után a reakcióelegyet szobahőmérsékletre hűtjük, és a propanol feleslegét csökkentett nyomáson ledesztilláljuk. A maradékot szilikagélen oszlopkromatográfiásan tisztítva 76 mg (kitermelés: 71 %) 3-{4-klór-2-fluor-5-[(propoxi-karbonil)-metoxi]-fenil}-1-metil-6-trifluor-metil-2-oxo-1,2-dihidropirazint (1-167. vegyület) kapunk.

¹H-NMR spektrum (CDCl₃/TMS, 300 MHz, δ ppm): 0,92 (t, 3H, J = 7,4 Hz), 1,68 (tq, 2H, J = 7,4 Hz, 6,7 Hz), 3,67 (s, 3H), 4,16 (t, 2H, J = 6,7



Hz), 4,71 (s, 2H), 7,23 (d, 1H, $J = 6,2$ Hz), 7,26 (d, 1H, $J = 9,5$ Hz), 7,83 (s, 1H).

16. előállítási példa

70 mg 3-(4-klór-2-fluor-5-hidroxi-fenil)-1-metil-6-trifluor-metil-2-oxo-1,2-dihidropirazin (1-61. vegyület) 0,25 ml N,N-dimetil-formamidban felvett oldatához 36 mg kálium-karbonátot és 27 mg propargil-bromidot adunk, és 2 órán keresztül 50 °C hőmérsékleten kevertetjük. A reakció befejeződése után a reakcióelegyet vízre öntjük, és etil-acetáttal extraháljuk. A szerves fázist telített nátrium-klorid-oldattal mossuk, vízmentes magnézium-szulfáton szárítjuk, és bepároljuk. A maradékot szilikagélen oszlopkromatográfiásan tisztítva 76 mg (kitermelés: 96 %) 3-[4-klór-2-fluor-5-(propargil-oxi)-fenil]-1-metil-6-trifluor-metil-2-oxo-1,2-dihidropirazint (1-156. vegyület, olvadáspont: 106,9-107,1 °C) kapunk.

17. előállítási példa

100 mg 3-(4-klór-2-fluor-5-hidroxi-fenil)-1-metil-6-trifluor-metil-2-oxo-1,2-dihidropirazin (1-61. vegyület) 0,60 ml N,N-dimetil-formamidban felvett oldatához 64 mg kálium-karbonátot és 45 mg 3-bróm-1-butént adunk, és 1 órán keresztül 70 °C hőmérsékleten kevertetjük. A reakció befejeződése után a reakcióelegyet vízre öntjük, és etil-acetáttal extraháljuk. A szerves fázist telített nátrium-klorid-oldattal mossuk, vízmentes magnézium-szulfáton szárítjuk, és bepároljuk. A maradékot szilikagélen oszlopkromatográfiásan tisztítva 96 mg (kitermelés: 83 %) 3-[4-klór-2-fluor-5-(3-butin-2-il-oxi)-fenil]-1-metil-6-trifluor-metil-2-oxo-1,2-dihidropirazint (1-57. vegyület) kapunk.

¹H-NMR spektrum (CDCl₃/TMS, 300 MHz, δ ppm): 1,72 (d, 3H, $J = 6,7$ Hz), 2,52 (d, 1H, $J = 2,1$ Hz), 3,69 (s, 3H), 4,88 (dq, 1H, $J = 6,7$ Hz, 2,1 Hz), 7,25 (d, 1H, $J = 9,5$ Hz), 7,46 (d, 1H, $J = 6,2$ Hz), 7,84 (s, 1H).

18. előállítási példa

(1) 2,20 g 3-(2,4-diklór-5-metoxi-fenil)-6-trifluor-metil-2-oxo-1,2-dihidropirazin (1-1009. vegyület) 12 ml N,N-dimetil-formamidban felvett oldatához 1,34 g kálium-karbonátot és 0,81 ml metil-jodidot adunk, és 2 napon keresztül 100 °C hőmérsékleten kevertetjük. A reakció befejeződése után a reakcióelegyet vízre öntjük, és etil-acetáttal extraháljuk. A szerves fázist telített nátrium-klorid-oldattal mossuk, vízmentes magnézium-szulfáton szárítjuk, és bepároljuk. A maradékot szilikagélen hexán/etil-acetát 5 : 1 eleggyel eluálva oszlopkromatográfiásan tisztítjuk. Így 1,11 g (kitermelés: 48 %) 3-(2,4-diklór-5-metoxi-fenil)-1-metil-6-trifluor-metil-2-oxo-1,2-dihidropirazint (1-358. vegyület, olvadáspont: 130,6 °C) kapunk.

(2) 1,00 g 3-(2,4-diklór-5-metoxi-fenil)-1-metil-6-trifluor-metil-2-oxo-1,2-dihidropirazin (1-358. vegyület) és 16 ml 48 tömeg%-os hidrogén-bromid 5,7 ml ecetsavban felvett oldatát 1 órán keresztül 140 °C hőmérsékleten kevertetjük. A reakció befejeződése után a reakcióelegyet vízre öntjük, és etil-acetáttal extraháljuk. A szerves fázist telített nátrium-hidrogén-karbonát-oldattal, vízzel, majd telített nátrium-klorid-oldattal mossuk, vízmentes magnézium-szulfáton szárítjuk, és bepároljuk. A maradékot szilikagélen oszlopkromatográfiásan tisztítva 0,74 g (kitermelés: 77 %) 3-(2,4-diklór-5-hidroxifetil)-1-metil-6-trifluor-metil-2-oxo-1,2-dihidropirazint (1-357. vegyület, olvadáspont: 173,5 °C) kapunk.

(3) 0,15 g 3-(2,4-diklór-5-hidroxifetil)-1-metil-6-trifluor-metil-2-oxo-1,2-dihidropirazin (1-357. vegyület) 0,90 ml N,N-dimetil-formamidban felvett oldatához 0,092 g kálium-karbonátot és 54 µl metil-2-bróm-propionátot adunk, és 1 órán keresztül szobahőmérsékleten kevertetjük. A reakció befejeződése után a reakcióelegyet vízre öntjük, és etil-acetáttal extraháljuk. A szerves fázist telített nátrium-klorid-oldattal mossuk, vízmentes magnézium-szulfáton szárítjuk, és bepároljuk. A maradékot szilikagélen oszlopkroma-

tográfiasan tisztítva 0,184 g (kitermelés: 98 %) 3-[2,4-diklór-5-(1-metoxi-karbonil-etoxi)-fenil]-1-metil-6-trifluor-metil-2-oxo-1,2-dihidropirazint (1-387. vegyület) kapunk.

¹H-NMR spektrum (CDCl₃/TMS, 300 MHz, δ ppm): 1,68 (d, 3H, J = 6,8 Hz), 3,68 (s, 3H), 3,75 (s, 3H), 4,77 (q, 1H, J = 6,8 Hz), 6,99 (s, 1H), 7,51 (s, 1H), 7,83 (s, 1H).

19. előállítási példa

0,15 g 3-(2,4-diklór-5-hidroxi-fenil)-1-metil-6-trifluor-metil-2-oxo-1,2-dihidropirazin (1-357. vegyület) 0,90 ml N,N-dimetil-formamidban felvett oldatához 92 mg kálium-karbonátot és 82 mg etil-bróm-acetátot adunk, és 1 órán keresztül szobahőmérsékleten kevertetjük. A reakció befejeződése után a reakcióelegyet vízre öntjük, és etil-acetáttal extraháljuk. A szerves fázist telített nátrium-klorid-oldattal mossuk, vízmentes magnézium-szulfáton szárítjuk, és bepároljuk. A maradékot szilikagélen oszlopkromatográfiásan tisztítva 179 mg (kitermelés: 96 %) 3-{2,4-diklór-5-[(etoxi-karbonil)-metoxi]-fenil}-1-metil-6-trifluor-metil-2-oxo-1,2-dihidropirazint (1-380. vegyület) kapunk.

¹H-NMR spektrum (CDCl₃/TMS, 300 MHz, δ ppm): 1,28 (t, 3H, J = 7,4 Hz), 3,68 (s, 3H), 4,26 (q, 2H, J = 7,4 Hz), 4,69 (s, 2H), 7,00 (s, 1H), 7,52 (s, 1H), 7,83 (s, 1H).

20. előállítási példa

150 mg 3-(2,4-diklór-5-hidroxi-fenil)-1-metil-6-trifluor-metil-2-oxo-1,2-dihidropirazin (1-357. vegyület) 0,90 ml N,N-dimetil-formamidban felvett oldatához 92 mg kálium-karbonátot és 58 mg propargil-bromidot adunk, és 1 órán keresztül szobahőmérsékleten kevertetjük. A reakció befejeződése után a reakcióelegyet vízre öntjük, és etil-acetáttal extraháljuk. A szerves fázist telített nátrium-klorid-oldattal mossuk, vízmentes magnézium-szulfáton szárítjuk, és bepároljuk. A maradékot szilikagélen oszlopkromatográfiásan

tisztítva 160 mg (kitermelés: 96 %) 3-[2,4-diklór-5-(propargil-oxi)-fenil]-1-metil-6-trifluor-metil-2-oxo-1,2-dihidropirazint (1-370. vegyület, olvadáspont: 123,7 °C) kapunk.

¹H-NMR spektrum (CDCl₃/TMS, 250 MHz, δ ppm): 2,56 (t, 1H, J = 2,4 Hz), 3,69 (s, 3H), 4,78 (d, 2H, J = 2,4 Hz), 7,18 (s, 1H), 7,52 (s, 1H), 7,85 (s, 1H).

21. előállítási példa

150 mg 3-(2,4-diklór-5-hidroxi-fenil)-1-metil-6-trifluor-metil-2-oxo-1,2-dihidropirazin (1-357. vegyület) 0,90 ml N,N-dimetil-formamidban felvett oldatához 92 mg kálium-karbonátot és 65 mg 3-bróm-1-butint adunk, és 1 órán keresztül szobahőmérsékleten kevertetjük. A reakció befejeződése után a reakcióelegyet vízre öntjük, és etil-acetáttal extraháljuk. A szerves fázist telített nátrium-klorid-oldattal mossuk, vízmentes magnézium-szulfáton szárítjuk, és bepároljuk. A maradékot szilikagélen oszlopkromatográfiásan tisztítva 159 mg (kitermelés: 92 %) 3-[2,4-diklór-5-(3-butin-2-il-oxi)-fenil]-1-metil-6-trifluor-metil-2-oxo-1,2-dihidropirazint (1-371. vegyület) kapunk.

¹H-NMR spektrum (CDCl₃/TMS, 250 MHz, δ ppm): 1,72 (d, 3H, J = 6,6 Hz), 2,52 (d, 1H, J = 2,0 Hz), 3,69 (s, 3H), 4,87 (dq, 1H, J = 6,6 Hz, 2,0 Hz), 7,26 (s, 1H), 7,51 (s, 1H), 7,84 (s, 1H).

22. előállítási példa

0,12 g 3-(5-amino-4-klór-2-fluor-fenil)-1-metil-6-trifluor-metil-2-oxo-1,2-dihidropirazin (1-23. vegyület) és 247 mg metil-2-bróm-propionát elegyét 3 órán keresztül 140 °C hőmérsékleten kevertetjük. A reakció befejeződése után a reakcióelegyet vízre öntjük, és etil-acetáttal extraháljuk. A szerves fázist telített nátrium-klorid-oldattal mossuk, vízmentes magnézium-szulfáton szárítjuk, és bepároljuk. A maradékot szilikagélen oszlopkromatográfiásan tisztítva 125 mg (kitermelés: 83 %) 3-{4-klór-5-[1-(metoxi-kar-

bonil)-etil-amino]-2-fluor-fenil}-1-metil-6-trifluor-metil-2-oxo-1,2-dihidropi-razint (1-89. vegyület) kapunk.

¹H-NMR spektrum (CDCl₃/TMS, 300 MHz, δ ppm): 1,53 (d, 3H, J = 6,9 Hz), 3,67 (s, 3H), 3,75 (s, 3H), 4,1-4,2 (m, 1H), 4,7-4,8 (széles, 1H), 6,82 (d, 1H, J = 6,2 Hz), 7,17 (d, 1H, J = 9,5 Hz), 7,82 (s, 1H).

A fentiekkel analóg módon állíthatók elő az 1-5. táblázatokban megadott találmány szerinti vegyületek, ahol „n” jelentése normál, „i” jelentése izo, „c” jelentése ciklo és „t” jelentése tercier.

1. táblázat

(1a) általános képletű vegyületek

Vegyület száma	X	Y	R ¹	R ²	R ³	B
1 – 1.	H	F	H	CF ₃	C ₂ H ₅	H
1 – 2.	H	Cl	H	CF ₃	C ₂ H ₅	H
1 – 3.	H	Br	H	CF ₃	C ₂ H ₅	H

1. táblázat (folytatás)

Vegyület száma	X	Y	R ¹	R ²	R ³	B
1-4.	H	F	H	CF ₃	CH ₃	H
1-5.	H	Cl	H	CF ₃	CH ₃	H
1-6.	H	Br	H	CF ₃	CH ₃	H
1-7.	F	F	H	CF ₃	C ₂ H ₅	H
1-8.	F	Cl	H	CF ₃	C ₂ H ₅	H
1-9.	F	Br	H	CF ₃	C ₂ H ₅	H
1-10.	F	F	H	CF ₃	CH ₃	H
1-11.	F	Cl	H	CF ₃	CH ₃	H
1-12.	F	Br	H	CF ₃	CH ₃	H
1-13.	H	F	H	CF ₃	CH ₃	NO ₂
1-14.	H	Cl	H	CF ₃	CH ₃	NO ₂
1-15.	H	Br	H	CF ₃	CH ₃	NO ₂
1-16.	F	F	H	CF ₃	CH ₃	NO ₂
1-17.	F	Cl	H	CF ₃	CH ₃	NO ₂
1-18.	F	Br	H	CF ₃	CH ₃	NO ₂
1-19.	H	F	H	CF ₃	CH ₃	NH ₂
1-20.	H	Cl	H	CF ₃	CH ₃	NH ₂
1-21.	H	Br	H	CF ₃	CH ₃	NH ₂
1-22.	F	F	H	CF ₃	CH ₃	NH ₂
1-23.	F	Cl	H	CF ₃	CH ₃	NH ₂
1-24.	H	Cl	H	CF ₃	CH ₃	NHCH(CH ₃)COOCH ₃
1-25.	H	Cl	H	CF ₃	CH ₃	NHCH(CH ₃)COOC ₂ H ₅
1-26.	H	Cl	H	CF ₃	CH ₃	NHCH(CH ₃)COO ⁿ C ₃ H ₇

1. táblázat (folytatás)

Vegyület száma	X	Y	R ¹	R ²	R ³	B
1-27.	H	Cl	H	CF ₃	CH ₃	NHCH(CH ₃)COO ⁿ C ₄ H ₉
1-28.	H	Cl	H	CF ₃	CH ₃	NHCH(CH ₃)COO ⁿ C ₅ H ₁₁
1-29.	H	Cl	H	CF ₃	CH ₃	NHCH(CH ₃)COO ⁱ C ₃ H ₇
1-30.	H	Cl	H	CF ₃	CH ₃	NHCH(CH ₃)COO ^c C ₅ H ₉
1-31.	H	Cl	H	CF ₃	CH ₃	NHCH(CH ₃)COO ^c C ₆ H ₁₁
1-32.	F	Cl	H	CF ₃	CH ₃	NHCH ₃
1-33.	F	Cl	H	CF ₃	CH ₃	NHC ₂ H ₅
1-34.	F	Cl	H	CF ₃	CH ₃	NHCH ₂ CH=CH ₂
1-35.	F	Cl	H	CF ₃	CH ₃	NHCH ₂ C≡CH
1-36.	F	Cl	H	CF ₃	CH ₃	NHCH(CH ₃)C≡CH
1-37.	F	Cl	H	CF ₃	CH ₃	NHSO ₂ CH ₃
1-38.	F	Cl	H	CF ₃	CH ₃	NHSO ₂ C ₂ H ₅
1-39.	F	Cl	H	CF ₃	CH ₃	NHSO ₂ CH ₂ Cl
1-40.	F	Cl	H	CF ₃	CH ₃	NHSO ₂ CF ₃
1-41.	F	Cl	H	CF ₃	CH ₃	N(CH ₃)SO ₂ CH ₃
1-42.	F	Cl	H	CF ₃	CH ₃	N(CH ₂ C≡CH)SO ₂ CH ₃
1-43.	F	Cl	H	CF ₃	CH ₃	NHCOOCH ₃
1-44.	F	Cl	H	CF ₃	CH ₃	NHCOOC ₂ H ₅
1-45.	F	Cl	H	CF ₃	CH ₃	NHCOO ⁿ C ₃ H ₇
1-46.	F	Cl	H	CF ₃	CH ₃	NHCOO ⁱ C ₃ H ₇
1-47.	F	Cl	H	CF ₃	CH ₃	NHCOO ⁿ C ₄ H ₉
1-48.	F	Cl	H	CF ₃	CH ₃	NHCOO ⁿ C ₅ H ₁₁
1-49.	F	Cl	H	CF ₃	CH ₃	NHCH ₂ COOCH ₃

1. táblázat (folytatás)

Vegyület száma	X	Y	R ¹	R ²	R ³	B
1-50.	F	Cl	H	CF ₃	CH ₃	NHCH ₂ COOC ₂ H ₅
1-51.	F	Cl	H	CF ₃	CH ₃	NHCH ₂ COO ⁿ C ₃ H ₇
1-52.	F	Cl	H	CF ₃	CH ₃	NHCH ₂ COO ⁿ C ₄ H ₉
1-53.	F	Cl	H	CF ₃	CH ₃	NHCH ₂ COO ⁿ C ₅ H ₁₁
1-54.	F	Cl	H	CF ₃	CH ₃	NHCH ₂ COO ⁱ C ₃ H ₇
1-55.	F	Cl	H	CF ₃	CH ₃	NHCH ₂ COO ^c C ₅ H ₉
1-56.	F	Br	H	CF ₃	CH ₃	NH ₂
1-57.	H	F	H	CF ₃	CH ₃	OH
1-58.	H	Cl	H	CF ₃	CH ₃	OH
1-59.	H	Br	H	CF ₃	CH ₃	OH
1-60.	F	F	H	CF ₃	CH ₃	OH
1-61.	F	Cl	H	CF ₃	CH ₃	OH
1-62.	F	Br	H	CF ₃	CH ₃	OH
1-63.	H	Cl	H	CF ₃	CH ₃	NHCH ₃
1-64.	H	Cl	H	CF ₃	CH ₃	NHC ₂ H ₅
1-65.	H	Cl	H	CF ₃	CH ₃	NHCH ₂ CH=CH ₂
1-66.	H	Cl	H	CF ₃	CH ₃	NHCH ₂ C≡CH
1-67.	H	Cl	H	CF ₃	CH ₃	NHCH(CH ₃)C≡CH
1-68.	H	Cl	H	CF ₃	CH ₃	NHSO ₂ CH ₃
1-69.	H	Cl	H	CF ₃	CH ₃	NHSO ₂ C ₂ H ₅
1-70.	H	Cl	H	CF ₃	CH ₃	NHSO ₂ CH ₂ Cl
1-71.	H	Cl	H	CF ₃	CH ₃	NHSO ₂ CF ₃

1. táblázat (folytatás)

Vegyület száma	X	Y	R ¹	R ²	R ³	B
1-72.	H	Cl	H	CF ₃	CH ₃	N(CH ₃)SO ₂ CH ₃
1-73.	H	Cl	H	CF ₃	CH ₃	N(CH ₂ C≡CH)SO ₂ CH ₃
1-74.	H	Cl	H	CF ₃	CH ₃	NHCOOCH ₃
1-75.	H	Cl	H	CF ₃	CH ₃	NHCOOC ₂ H ₅
1-76.	H	Cl	H	CF ₃	CH ₃	NHCOO ⁿ C ₃ H ₇
1-77.	H	Cl	H	CF ₃	CH ₃	NHCOO ⁱ C ₃ H ₇
1-78.	H	Cl	H	CF ₃	CH ₃	NHCOO ⁿ C ₄ H ₉
1-79.	H	Cl	H	CF ₃	CH ₃	NHCOO ⁿ C ₅ H ₁₁
1-80.	H	Cl	H	CF ₃	CH ₃	NHCH ₂ COOCH ₃
1-81.	H	Cl	H	CF ₃	CH ₃	NHCH ₂ COOC ₂ H ₅
1-82.	H	Cl	H	CF ₃	CH ₃	NHCH ₂ COO ⁿ C ₃ H ₇
1-83.	H	Cl	H	CF ₃	CH ₃	NHCH ₂ COO ⁿ C ₄ H ₉
1-84.	H	Cl	H	CF ₃	CH ₃	NHCH ₂ COO ⁿ C ₅ H ₁₁
1-85.	H	Cl	H	CF ₃	CH ₃	NHCH ₂ COO ⁱ C ₃ H ₇
1-86.	H	Cl	H	CF ₃	CH ₃	NHCH ₂ COO ^c C ₅ H ₉
1-87.	H	Cl	H	CF ₃	CH ₃	NHCH ₂ COO ^c C ₆ H ₁₁
1-88.	F	Cl	H	CF ₃	CH ₃	NHCH ₂ COO ^c C ₆ H ₁₁
1-89.	F	Cl	H	CF ₃	CH ₃	NHCH(CH ₃)COOCH ₃
1-90.	F	Cl	H	CF ₃	CH ₃	NHCH(CH ₃)COOC ₂ H ₅
1-91.	F	Cl	H	CF ₃	CH ₃	NHCH(CH ₃)COO ⁿ C ₃ H ₇
1-92.	F	Cl	H	CF ₃	CH ₃	NHCH(CH ₃)COO ⁿ C ₄ H ₉
1-93.	F	Cl	H	CF ₃	CH ₃	NHCH(CH ₃)COO ⁿ C ₅ H ₁₁
1-94.	F	Cl	H	CF ₃	CH ₃	NHCH(CH ₃)COO ⁱ C ₃ H ₇

1. táblázat (folytatás)

Vegyület száma	X	Y	R ¹	R ²	R ³	B
1-95.	F	Cl	H	CF ₃	CH ₃	NHCH(CH ₃)COO ^c C ₅ H ₉
1-96.	F	Cl	H	CF ₃	CH ₃	NHCH(CH ₃)COO ^c C ₆ H ₁₁
1-97.	H	Cl	H	CF ₃	CH ₃	OCH ₃
1-98.	H	Cl	H	CF ₃	CH ₃	OC ₂ H ₅
1-99.	H	Cl	H	CF ₃	CH ₃	O ⁱ C ₃ H ₇
1-100.	H	Cl	H	CF ₃	CH ₃	O ⁿ C ₃ H ₇
1-101.	H	Cl	H	CF ₃	CH ₃	OCH ₂ CH ₂ Cl
1-102.	H	Cl	H	CF ₃	CH ₃	OCF ₂ CF ₂ H
1-103.	H	Cl	H	CF ₃	CH ₃	O ^c C ₅ H ₉
1-104.	H	Cl	H	CF ₃	CH ₃	O ^c C ₆ H ₁₁
1-105.	H	Cl	H	CF ₃	CH ₃	OCH ₂ CH=CH ₂
1-106.	H	Cl	H	CF ₃	CH ₃	OCH ₂ CCl=CH ₂
1-107.	H	Cl	H	CF ₃	CH ₃	OCH ₂ CCl=CHCl
1-108.	H	Cl	H	CF ₃	CH ₃	OCH(CH ₃)CH=CH ₂
1-109.	H	Cl	H	CF ₃	CH ₃	OCH ₂ C≡CH
1-110.	H	Cl	H	CF ₃	CH ₃	OCH(CH ₃)C≡CH
1-111.	H	Cl	H	CF ₃	CH ₃	OCH ₂ C≡CBr
1-112.	H	Cl	H	CF ₃	CH ₃	OCH ₂ C≡CCl
1-113.	H	Cl	H	CF ₃	CH ₃	OCH ₂ C≡CCH ₂ Cl
1-114.	H	Cl	H	CF ₃	CH ₃	OCH ₂ CN
1-115.	H	Cl	H	CF ₃	CH ₃	OCH ₂ OCH ₃
1-116.	H	Cl	H	CF ₃	CH ₃	OCH ₂ OC ₂ H ₅
1-117.	H	Cl	H	CF ₃	CH ₃	OCH ₂ SCH ₃

1. táblázat (folytatás)

Vegyület száma	X	Y	R ¹	R ²	R ³	B
1-118.	H	Cl	H	CF ₃	CH ₃	OCH ₂ COOCH ₃
1-119.	H	Cl	H	CF ₃	CH ₃	OCH ₂ COOC ₂ H ₅
1-120.	H	Cl	H	CF ₃	CH ₃	OCH ₂ COO ⁿ C ₃ H ₇
1-121.	H	Cl	H	CF ₃	CH ₃	OCH ₂ COO ⁿ C ₄ H ₉
1-122.	H	Cl	H	CF ₃	CH ₃	OCH ₂ COO ⁿ C ₅ H ₁₁
1-123.	H	Cl	H	CF ₃	CH ₃	OCH ₂ COO ⁱ C ₃ H ₇
1-124.	H	Cl	H	CF ₃	CH ₃	OCH ₂ COO ^c C ₅ H ₉
1-125.	H	Cl	H	CF ₃	CH ₃	OCH ₂ COO ^c C ₆ H ₁₁
1-126.	H	Cl	H	CF ₃	CH ₃	OCH(CH ₃)COOCH ₃
1-127.	H	Cl	H	CF ₃	CH ₃	OCH(CH ₃)COOC ₂ H ₅
1-128.	H	Cl	H	CF ₃	CH ₃	OCH(CH ₃)COO ⁿ C ₃ H ₇
1-129.	H	Cl	H	CF ₃	CH ₃	OCH(CH ₃)COO ⁿ C ₄ H ₉
1-130.	H	Cl	H	CF ₃	CH ₃	OCH(CH ₃)COO ⁿ C ₅ H ₁₁
1-131.	H	Cl	H	CF ₃	CH ₃	OCH(CH ₃)COO ⁱ C ₃ H ₇
1-132.	H	Cl	H	CF ₃	CH ₃	OCH(CH ₃)COO ^c C ₅ H ₉
1-133.	H	Cl	H	CF ₃	CH ₃	OCH(CH ₃)COO ^c C ₆ H ₁₁
1-134.	H	Cl	H	CF ₃	CH ₃	OCH ₂ CON(CH ₃) ₂
1-135.	H	Cl	H	CF ₃	CH ₃	OCH ₂ CON(C ₂ H ₅) ₂
1-136.	H	Cl	H	CF ₃	CH ₃	OCH ₂ CON(CH ₃)C ₂ H ₅
1-137.	H	Cl	H	CF ₃	CH ₃	OCH(CH ₃)CON(CH ₃) ₂
1-138.	H	Cl	H	CF ₃	CH ₃	OCH(CH ₃)CON(C ₂ H ₅) ₂
1-139.	H	Cl	H	CF ₃	CH ₃	OCH(CH ₃)CON(CH ₃)C ₂ H ₅
1-140.	H	Cl	H	CF ₃	CH ₃	OCH ₂ COON(CH ₃) ₂

1. táblázat (folytatás)

Vegyület száma	X	Y	R ¹	R ²	R ³	B
1-141.	H	Cl	H	CF ₃	CH ₃	OCH ₂ COON(C ₂ H ₅) ₂
1-142.	H	Cl	H	CF ₃	CH ₃	OCH(CH ₃)COON(CH ₃) ₂
1-143.	H	Cl	H	CF ₃	CH ₃	OCH(CH ₃)COON(C ₂ H ₅) ₂
1-144.	F	Cl	H	CF ₃	CH ₃	OCH ₃
1-145.	F	Cl	H	CF ₃	CH ₃	OC ₂ H ₅
1-146.	F	Cl	H	CF ₃	CH ₃	O ⁱ C ₃ H ₇
1-147.	F	Cl	H	CF ₃	CH ₃	O ⁿ C ₃ H ₇
1-148.	F	Cl	H	CF ₃	CH ₃	OCH ₂ CH ₂ Cl
1-149.	F	Cl	H	CF ₃	CH ₃	OCF ₂ CF ₂ H
1-150.	F	Cl	H	CF ₃	CH ₃	O ^c C ₅ H ₉
1-151.	F	Cl	H	CF ₃	CH ₃	O ^c C ₆ H ₁₁
1-152.	F	Cl	H	CF ₃	CH ₃	OCH ₂ CH ₂ =CH ₂
1-153.	F	Cl	H	CF ₃	CH ₃	OCH ₂ CCl=CH ₂
1-154.	F	Cl	H	CF ₃	CH ₃	OCH ₂ CCl=CHCl
1-155.	F	Cl	H	CF ₃	CH ₃	OCH(CH ₃)CH=CH ₂
1-156.	F	Cl	H	CF ₃	CH ₃	OCH ₂ C≡CH
1-157.	F	Cl	H	CF ₃	CH ₃	OCH(CH ₃)C≡CH
1-158.	F	Cl	H	CF ₃	CH ₃	OCH ₂ C≡CBr
1-159.	F	Cl	H	CF ₃	CH ₃	OCH ₂ C≡CCl
1-160.	F	Cl	H	CF ₃	CH ₃	OCH ₂ C≡CCH ₂ Cl
1-161.	F	Cl	H	CF ₃	CH ₃	OCH ₂ CN
1-162.	F	Cl	H	CF ₃	CH ₃	OCH ₂ OCH ₃

1. táblázat (folytatás)

Vegyület száma	X	Y	R ¹	R ²	R ³	B
1-163.	F	Cl	H	CF ₃	CH ₃	OCH ₂ OC ₂ H ₅
1-164.	F	Cl	H	CF ₃	CH ₃	OCH ₂ SCH ₃
1-165.	F	Cl	H	CF ₃	CH ₃	OCH ₂ COOCH ₃
1-166.	F	Cl	H	CF ₃	CH ₃	OCH ₂ COOC ₂ H ₅
1-167.	F	Cl	H	CF ₃	CH ₃	OCH ₂ COO ⁿ C ₃ H ₇
1-168.	F	Cl	H	CF ₃	CH ₃	OCH ₂ COO ⁿ C ₄ H ₉
1-169.	F	Cl	H	CF ₃	CH ₃	OCH ₂ COO ⁿ C ₅ H ₁₁
1-170.	F	Cl	H	CF ₃	CH ₃	OCH ₂ COO ⁱ C ₃ H ₇
1-171.	F	Cl	H	CF ₃	CH ₃	OCH ₂ COO ^c C ₅ H ₉
1-172.	F	Cl	H	CF ₃	CH ₃	OCH ₂ COO ^c C ₆ H ₁₁
1-173.	F	Cl	H	CF ₃	CH ₃	OCH(CH ₃) COOCH ₃
1-174.	F	Cl	H	CF ₃	CH ₃	OCH(CH ₃) COOC ₂ H ₅
1-175.	F	Cl	H	CF ₃	CH ₃	OCH(CH ₃) COO ⁿ C ₃ H ₇
1-176.	F	Cl	H	CF ₃	CH ₃	OCH(CH ₃) COO ⁿ C ₄ H ₉
1-177.	F	Cl	H	CF ₃	CH ₃	OCH(CH ₃) COO ⁿ C ₅ H ₁₁
1-178.	F	Cl	H	CF ₃	CH ₃	OCH(CH ₃) COO ⁱ C ₃ H ₇
1-179.	F	Cl	H	CF ₃	CH ₃	OCH(CH ₃) COO ^c C ₅ H ₉
1-180.	F	Cl	H	CF ₃	CH ₃	OCH(CH ₃) COO ^c C ₆ H ₁₁
1-181.	F	Cl	H	CF ₃	CH ₃	OCH ₂ CON(CH ₃) ₂
1-182.	F	Cl	H	CF ₃	CH ₃	OCH ₂ CON(C ₂ H ₅) ₂
1-183.	F	Cl	H	CF ₃	CH ₃	OCH ₂ CON(CH ₃) C ₂ H ₅
1-184.	F	Cl	H	CF ₃	CH ₃	OCH(CH ₃) CON(CH ₃) ₂
1-185.	F	Cl	H	CF ₃	CH ₃	OCH(CH ₃) CON(C ₂ H ₅) ₂

1. táblázat (folytatás)

Vegyület száma	X	Y	R ¹	R ²	R ³	B
1-186.	F	Cl	H	CF ₃	CH ₃	OCH(CH ₃)CON(CH ₃)C ₂ H ₅
1-187.	F	Cl	H	CF ₃	CH ₃	OCH ₂ COON(CH ₃) ₂
1-188.	F	Cl	H	CF ₃	CH ₃	OCH ₂ COON(C ₂ H ₅) ₂
1-189.	F	Cl	H	CF ₃	CH ₃	OCH(CH ₃)COON(CH ₃) ₂
1-190.	F	Cl	H	CF ₃	CH ₃	OCH(CH ₃)COON(C ₂ H ₅) ₂
1-191.	H	F	H	CF ₃	CH ₃	SH
1-192.	H	Cl	H	CF ₃	CH ₃	SH
1-193.	H	Br	H	CF ₃	CH ₃	SH
1-194.	F	F	H	CF ₃	CH ₃	SH
1-195.	F	Cl	H	CF ₃	CH ₃	SH
1-196.	F	Br	H	CF ₃	CH ₃	SH
1-197.	H	Cl	H	CF ₃	CH ₃	SCH ₃
1-198.	H	Cl	H	CF ₃	CH ₃	SC ₂ H ₅
1-199.	H	Cl	H	CF ₃	CH ₃	S ⁱ C ₃ H ₇
1-200.	H	Cl	H	CF ₃	CH ₃	SCH ₂ CH ₂ Cl
1-201.	H	Cl	H	CF ₃	CH ₃	S ^c C ₅ H ₉
1-202.	H	Cl	H	CF ₃	CH ₃	S ^c C ₆ H ₁₁
1-203.	H	Cl	H	CF ₃	CH ₃	SCH ₂ CH=CH ₂
1-204.	H	Cl	H	CF ₃	CH ₃	SCH ₂ CCl=CH ₂
1-205.	H	Cl	H	CF ₃	CH ₃	SCH ₂ CCl=CHCl
1-206.	H	Cl	H	CF ₃	CH ₃	SCH(CH ₃)CH=CH ₂
1-207.	H	Cl	H	CF ₃	CH ₃	SCH ₂ C≡CH
1-208.	H	Cl	H	CF ₃	CH ₃	SCH(CH ₃)C≡CH

1. táblázat (folytatás)

Vegyület száma	X	Y	R ¹	R ²	R ³	B
1-209.	H	Cl	H	CF ₃	CH ₃	SCH ₂ COOCH ₃
1-210.	H	Cl	H	CF ₃	CH ₃	SCH ₂ COOC ₂ H ₅
1-211.	H	Cl	H	CF ₃	CH ₃	SCH ₂ COO ⁿ C ₃ H ₇
1-212.	H	Cl	H	CF ₃	CH ₃	SCH ₂ COO ⁿ C ₄ H ₉
1-213.	H	Cl	H	CF ₃	CH ₃	SCH ₂ COO ⁿ C ₅ H ₁₁
1-214.	H	Cl	H	CF ₃	CH ₃	SCH ₂ COO ⁱ C ₃ H ₇
1-215.	H	Cl	H	CF ₃	CH ₃	SCH ₂ COO ^c C ₅ H ₉
1-216.	H	Cl	H	CF ₃	CH ₃	SCH ₂ COO ^c C ₆ H ₁₁
1-217.	H	Cl	H	CF ₃	CH ₃	SCH(CH ₃) COOCH ₃
1-218.	H	Cl	H	CF ₃	CH ₃	SCH(CH ₃) COOC ₂ H ₅
1-219.	H	Cl	H	CF ₃	CH ₃	SCH(CH ₃) COO ⁿ C ₃ H ₇
1-220.	H	Cl	H	CF ₃	CH ₃	SCH(CH ₃) COO ⁿ C ₄ H ₉
1-221.	H	Cl	H	CF ₃	CH ₃	SCH(CH ₃) COO ⁿ C ₅ H ₁₁
1-222.	H	Cl	H	CF ₃	CH ₃	SCH(CH ₃) COO ⁱ C ₃ H ₇
1-223.	H	Cl	H	CF ₃	CH ₃	SCH(CH ₃) COO ^c C ₅ H ₉
1-224.	H	Cl	H	CF ₃	CH ₃	SCH(CH ₃) COO ^c C ₆ H ₁₁
1-225.	H	Cl	H	CF ₃	CH ₃	SCH ₂ CON(CH ₃) ₂
1-226.	H	Cl	H	CF ₃	CH ₃	SCH ₂ CON(C ₂ H ₅) ₂
1-227.	H	Cl	H	CF ₃	CH ₃	SCH ₂ CON (tetrametilén)
1-228.	H	Cl	H	CF ₃	CH ₃	SCH ₂ CON (pentametilén)
1-229.	H	Cl	H	CF ₃	CH ₃	SCH ₂ CON (etilén-oxi-etilén)
1-230.	H	Cl	H	CF ₃	CH ₃	SCH(CH ₃) CON(CH ₃) ₂

1. táblázat (folytatás)

Vegyület száma	X	Y	R ¹	R ²	R ³	B
1-231.	H	Cl	H	CF ₃	CH ₃	SCH(CH ₃)CON(C ₂ H ₅) ₂
1-232.	H	Cl	H	CF ₃	CH ₃	SCH(CH ₃)CON (tetrametilén)
1-233.	H	Cl	H	CF ₃	CH ₃	SCH(CH ₃)CON (pentametilén)
1-234.	F	Cl	H	CF ₃	CH ₃	SCH ₃
1-235.	F	Cl	H	CF ₃	CH ₃	SC ₂ H ₅
1-236.	F	Cl	H	CF ₃	CH ₃	S ⁱ C ₃ H ₇
1-237.	F	Cl	H	CF ₃	CH ₃	SCH ₂ CH ₂ Cl
1-238.	F	Cl	H	CF ₃	CH ₃	S ^c C ₅ H ₉
1-239.	F	Cl	H	CF ₃	CH ₃	S ^c C ₆ H ₁₁
1-240.	F	Cl	H	CF ₃	CH ₃	SCH ₂ CH=CH ₂
1-241.	F	Cl	H	CF ₃	CH ₃	SCH ₂ CCl=CH ₂
1-242.	F	Cl	H	CF ₃	CH ₃	SCH ₂ CCl=CHCl
1-243.	F	Cl	H	CF ₃	CH ₃	SCH(CH ₃)CH=CH ₂
1-244.	F	Cl	H	CF ₃	CH ₃	SCH ₂ C≡CH
1-245.	F	Cl	H	CF ₃	CH ₃	SCH(CH ₃)C≡CH
1-246.	F	Cl	H	CF ₃	CH ₃	SCH ₂ COOCH ₃
1-247.	F	Cl	H	CF ₃	CH ₃	SCH ₂ COOC ₂ H ₅
1-248.	F	Cl	H	CF ₃	CH ₃	SCH ₂ COO ⁿ C ₃ H ₇
1-249.	F	Cl	H	CF ₃	CH ₃	SCH ₂ COO ⁿ C ₄ H ₉
1-250.	F	Cl	H	CF ₃	CH ₃	SCH ₂ COO ⁿ C ₅ H ₁₁

1. táblázat (folytatás)

Vegyület száma	X	Y	R ¹	R ²	R ³	B
1-251.	F	Cl	H	CF ₃	CH ₃	SCH ₂ COO ⁱ C ₃ H ₇
1-252.	F	Cl	H	CF ₃	CH ₃	SCH ₂ COO ^c C ₅ H ₉
1-253.	F	Cl	H	CF ₃	CH ₃	SCH ₂ COO ^c C ₆ H ₁₁
1-254.	F	Cl	H	CF ₃	CH ₃	SCH(CH ₃)COOCH ₃
1-255.	F	Cl	H	CF ₃	CH ₃	SCH(CH ₃)COOC ₂ H ₅
1-256.	F	Cl	H	CF ₃	CH ₃	SCH(CH ₃)COO ⁿ C ₃ H ₇
1-257.	F	Cl	H	CF ₃	CH ₃	SCH(CH ₃)COO ⁿ C ₄ H ₉
1-258.	F	Cl	H	CF ₃	CH ₃	SCH(CH ₃)COO ⁿ C ₅ H ₁₁
1-259.	F	Cl	H	CF ₃	CH ₃	SCH(CH ₃)COO ⁱ C ₃ H ₇
1-260.	F	Cl	H	CF ₃	CH ₃	SCH(CH ₃)COO ^c C ₅ H ₉
1-261.	F	Cl	H	CF ₃	CH ₃	SCH(CH ₃)COO ^c C ₆ H ₁₁
1-262.	F	Cl	H	CF ₃	CH ₃	SCH ₂ CON(CH ₃) ₂
1-263.	F	Cl	H	CF ₃	CH ₃	SCH ₂ CON(C ₂ H ₅) ₂
1-264.	F	Cl	H	CF ₃	CH ₃	SCH ₂ CON (tetrametilén)
1-265.	F	Cl	H	CF ₃	CH ₃	SCH ₂ CON (pentametilén)
1-266.	F	Cl	H	CF ₃	CH ₃	SCH ₂ CON (etilén-oxi-etilén)
1-267.	F	Cl	H	CF ₃	CH ₃	SCH(CH ₃)CON(CH ₃) ₂
1-268.	F	Cl	H	CF ₃	CH ₃	SCH(CH ₃)CON(C ₂ H ₅) ₂
1-269.	F	Cl	H	CF ₃	CH ₃	SCH(CH ₃)CON (tetrametilén)
1-270.	F	Cl	H	CF ₃	CH ₃	SCH(CH ₃)CON (pentametilén)

1. táblázat (folytatás)

Vegyület száma	X	Y	R ¹	R ²	R ³	B
1-271.	H	F	H	CF ₃	CH ₃	SO ₂ Cl
1-272.	H	Cl	H	CF ₃	CH ₃	SO ₂ Cl
1-273.	H	Br	H	CF ₃	CH ₃	SO ₂ Cl
1-274.	F	F	H	CF ₃	CH ₃	SO ₂ Cl
1-275.	F	Cl	H	CF ₃	CH ₃	SO ₂ Cl
1-276.	F	Br	H	CF ₃	CH ₃	SO ₂ Cl
1-277.	H	Cl	H	CF ₃	CH ₃	SO ₂ OCH ₃
1-278.	H	Cl	H	CF ₃	CH ₃	SO ₂ OC ₂ H ₅
1-279.	H	Cl	H	CF ₃	CH ₃	SO ₂ O ⁱ C ₃ H ₇
1-280.	H	Cl	H	CF ₃	CH ₃	SO ₂ OCH ₂ CH=CH ₂
1-281.	F	Cl	H	CF ₃	CH ₃	SO ₂ OCH ₃
1-282.	F	Cl	H	CF ₃	CH ₃	SO ₂ OC ₂ H ₅
1-283.	F	Cl	H	CF ₃	CH ₃	SO ₂ O ⁱ C ₃ H ₇
1-284.	F	Cl	H	CF ₃	CH ₃	SO ₂ OCH ₂ CH=CH ₂
1-285.	H	Cl	H	CF ₃	CH ₃	SO ₂ N(CH ₃) ₂
1-286.	H	Cl	H	CF ₃	CH ₃	SO ₂ N(C ₂ H ₅) ₂
1-287.	F	Cl	H	CF ₃	CH ₃	SO ₂ N(CH ₃) ₂
1-288.	F	Cl	H	CF ₃	CH ₃	SO ₂ N(C ₂ H ₅) ₂
1-289.	H	Cl	H	CF ₃	CH ₃	COOH
1-290.	H	Cl	H	CF ₃	CH ₃	COOCH ₃
1-291.	H	Cl	H	CF ₃	CH ₃	COOC ₂ H ₅
1-292.	H	Cl	H	CF ₃	CH ₃	COO ⁿ C ₃ H ₇
1-293.	H	Cl	H	CF ₃	CH ₃	COO ⁿ C ₄ H ₉

1. táblázat (folytatás)

Vegyület száma	X	Y	R ¹	R ²	R ³	B
1-294.	H	Cl	H	CF ₃	CH ₃	COO ⁿ C ₅ H ₁₁
1-295.	H	Cl	H	CF ₃	CH ₃	COO ⁱ C ₃ H ₇
1-296.	H	Cl	H	CF ₃	CH ₃	COOCH ₂ CH ₂ Cl
1-297.	H	Cl	H	CF ₃	CH ₃	COOCH ₂ CH ₂ Br
1-298.	H	Cl	H	CF ₃	CH ₃	CON(CH ₃) ₂
1-299.	H	Cl	H	CF ₃	CH ₃	CONHCH ₃
1-300.	H	Cl	H	CF ₃	CH ₃	CON(C ₂ H ₅) ₂
1-301.	H	Cl	H	CF ₃	CH ₃	CONHC ₂ H ₅
1-302.	H	Cl	H	CF ₃	CH ₃	COCH ₃
1-303.	H	Cl	H	CF ₃	CH ₃	COC ₂ H ₅
1-304.	H	Cl	H	CF ₃	CH ₃	COCH ₂ Cl
1-305.	H	Cl	H	CF ₃	CH ₃	CHO
1-306.	H	Cl	H	CF ₃	CH ₃	CH=CHCOOCH ₃
1-307.	H	Cl	H	CF ₃	CH ₃	CH=CHCOOC ₂ H ₅
1-308.	H	Cl	H	CF ₃	CH ₃	CH ₂ CH ₂ COOCH ₃
1-309.	H	Cl	H	CF ₃	CH ₃	CH ₂ CH ₂ COOC ₂ H ₅
1-310.	F	Cl	H	CF ₃	CH ₃	COOH
1-311.	F	Cl	H	CF ₃	CH ₃	COOCH ₃
1-312.	F	Cl	H	CF ₃	CH ₃	COOC ₂ H ₅
1-313.	F	Cl	H	CF ₃	CH ₃	COO ⁿ C ₃ H ₇
1-314.	F	Cl	H	CF ₃	CH ₃	COO ⁿ C ₄ H ₉
1-315.	F	Cl	H	CF ₃	CH ₃	COO ⁿ C ₅ H ₁₁
1-316.	F	Cl	H	CF ₃	CH ₃	COO ⁱ C ₃ H ₇

1. táblázat (folytatás)

Vegyület száma	X	Y	R ¹	R ²	R ³	B
1-317.	F	Cl	H	CF ₃	CH ₃	COOCH ₂ CH ₂ Cl
1-318.	F	Cl	H	CF ₃	CH ₃	COOCH ₂ CH ₂ Br
1-319.	F	Cl	H	CF ₃	CH ₃	CON(CH ₃) ₂
1-320.	F	Cl	H	CF ₃	CH ₃	CONHCH ₃
1-321.	F	Cl	H	CF ₃	CH ₃	CON(C ₂ H ₅) ₂
1-322.	F	Cl	H	CF ₃	CH ₃	CONHC ₂ H ₅
1-323.	F	Cl	H	CF ₃	CH ₃	COCH ₃
1-324.	F	Cl	H	CF ₃	CH ₃	COC ₂ H ₅
1-325.	F	Cl	H	CF ₃	CH ₃	COCH ₂ Cl
1-326.	F	Cl	H	CF ₃	CH ₃	CHO
1-327.	F	Cl	H	CF ₃	CH ₃	CH=CHCOOCH ₃
1-328.	F	Cl	H	CF ₃	CH ₃	CH=CHCOOC ₂ H ₅
1-329.	F	Cl	H	CF ₃	CH ₃	CH ₂ CH ₂ COOCH ₃
1-330.	F	Cl	H	CF ₃	CH ₃	CH ₂ CH ₂ COOC ₂ H ₅
1-331.	Cl	Cl	H	CF ₃	C ₂ H ₅	H
1-332.	Cl	Cl	H	CF ₃	CH ₃	H
1-333.	Cl	Cl	H	CF ₃	CH ₃	NO ₂
1-334.	Cl	Cl	H	CF ₃	CH ₃	NH ₂
1-335.	Cl	Cl	H	CF ₃	CH ₃	NHCH(CH ₃)COOCH ₃
1-336.	Cl	Cl	H	CF ₃	CH ₃	NHCH(CH ₃)COOC ₂ H ₅
1-337.	Cl	Cl	H	CF ₃	CH ₃	NHCH(CH ₃)COO ⁿ C ₃ H ₇
1-338.	Cl	Cl	H	CF ₃	CH ₃	NHCH(CH ₃)COO ⁿ C ₄ H ₉

1. táblázat (folytatás)

Vegyület száma	X	Y	R ¹	R ²	R ³	B
1-339.	Cl	Cl	H	CF ₃	CH ₃	NHCH(CH ₃)COO ⁿ C ₅ H ₁₁
1-340.	Cl	Cl	H	CF ₃	CH ₃	NHCH(CH ₃)COO ⁱ C ₃ H ₇
1-341.	Cl	Cl	H	CF ₃	CH ₃	NHCH(CH ₃)COO ^c C ₅ H ₉
1-342.	Cl	Cl	H	CF ₃	CH ₃	NHCH(CH ₃)COO ^c C ₆ H ₁₁
1-343.	Cl	Cl	H	CF ₃	CH ₃	NHSO ₂ CH ₃
1-344.	Cl	Cl	H	CF ₃	CH ₃	NHSO ₂ C ₂ H ₅
1-345.	Cl	Cl	H	CF ₃	CH ₃	NHCOOCH ₃
1-346.	Cl	Cl	H	CF ₃	CH ₃	NHCOOC ₂ H ₅
1-347.	Cl	Cl	H	CF ₃	CH ₃	NHCOO ⁿ C ₃ H ₇
1-348.	Cl	Cl	H	CF ₃	CH ₃	NHCOO ⁱ C ₃ H ₇
1-349.	Cl	Cl	H	CF ₃	CH ₃	NHCOO ⁿ C ₄ H ₉
1-350.	Cl	Cl	H	CF ₃	CH ₃	NHCOO ⁿ C ₅ H ₁₁
1-351.	Cl	Cl	H	CF ₃	CH ₃	N (CH ₂ C≡CH) COOC ₂ H ₅
1-352.	Cl	Cl	H	CF ₃	CH ₃	NHCH ₂ C≡CH
1-353.	Cl	Cl	H	CF ₃	CH ₃	NHCH(CH ₃)C≡CH
1-354.	H	F	H	CF ₃	CH ₃	NHCH(CH ₃)COOCH ₃
1-355.	H	F	H	CF ₃	CH ₃	NHCH(CH ₃)COOC ₂ H ₅
1-356.	F	Cl	H	CF ₃	CH ₃	OCH ₂ COO ⁱ C ₄ H ₉

1. táblázat (folytatás)

Vegyület száma	X	Y	R ¹	R ²	R ³	B
1-357.	Cl	Cl	H	CF ₃	CH ₃	OH
1-358.	Cl	Cl	H	CF ₃	CH ₃	OCH ₃
1-359.	Cl	Cl	H	CF ₃	CH ₃	OC ₂ H ₅
1-360.	Cl	Cl	H	CF ₃	CH ₃	O ⁱ C ₃ H ₇
1-361.	Cl	Cl	H	CF ₃	CH ₃	O ⁿ C ₃ H ₇
1-362.	Cl	Cl	H	CF ₃	CH ₃	OCH ₂ CH ₂ Cl
1-363.	Cl	Cl	H	CF ₃	CH ₃	OCF ₂ CF ₂ H
1-364.	Cl	Cl	H	CF ₃	CH ₃	O ^c C ₅ H ₉
1-365.	Cl	Cl	H	CF ₃	CH ₃	O ^c C ₆ H ₁₁
1-366.	Cl	Cl	H	CF ₃	CH ₃	OCH ₂ CH=CH ₂
1-367.	Cl	Cl	H	CF ₃	CH ₃	OCH ₂ CCl=CH ₂
1-368.	Cl	Cl	H	CF ₃	CH ₃	OCH ₂ CCl=CHCl
1-369.	Cl	Cl	H	CF ₃	CH ₃	OCH(CH ₃)CH=CH ₂
1-370.	Cl	Cl	H	CF ₃	CH ₃	OCH ₂ C≡CH
1-371.	Cl	Cl	H	CF ₃	CH ₃	OCH(CH ₃)C≡CH
1-372.	Cl	Cl	H	CF ₃	CH ₃	OCH ₂ C≡CBr
1-373.	Cl	Cl	H	CF ₃	CH ₃	OCH ₂ C≡CCl
1-374.	Cl	Cl	H	CF ₃	CH ₃	OCH ₂ C≡CCH ₂ Cl
1-375.	Cl	Cl	H	CF ₃	CH ₃	OCH ₂ CN
1-376.	Cl	Cl	H	CF ₃	CH ₃	OCH ₂ OCH ₃
1-377.	Cl	Cl	H	CF ₃	CH ₃	OCH ₂ OC ₂ H ₅
1-378.	Cl	Cl	H	CF ₃	CH ₃	OCH ₂ SCH ₃

1. táblázat (folytatás)

Vegyület száma	X	Y	R ¹	R ²	R ³	B
1-379.	Cl	Cl	H	CF ₃	CH ₃	OCH ₂ COOCH ₃
1-380.	Cl	Cl	H	CF ₃	CH ₃	OCH ₂ COOC ₂ H ₅
1-381.	Cl	Cl	H	CF ₃	CH ₃	OCH ₂ COO ⁿ C ₃ H ₇
1-382.	Cl	Cl	H	CF ₃	CH ₃	OCH ₂ COO ⁿ C ₄ H ₉
1-383.	Cl	Cl	H	CF ₃	CH ₃	OCH ₂ COO ⁿ C ₅ H ₁₁
1-384.	Cl	Cl	H	CF ₃	CH ₃	OCH ₂ COO ⁱ C ₃ H ₇
1-385.	Cl	Cl	H	CF ₃	CH ₃	OCH ₂ COO ^c C ₅ H ₉
1-386.	Cl	Cl	H	CF ₃	CH ₃	OCH ₂ COO ^c C ₆ H ₁₁
1-387.	Cl	Cl	H	CF ₃	CH ₃	OCH(CH ₃)COOCH ₃
1-388.	Cl	Cl	H	CF ₃	CH ₃	OCH(CH ₃)COOC ₂ H ₅
1-389.	Cl	Cl	H	CF ₃	CH ₃	OCH(CH ₃)COO ⁿ C ₃ H ₇
1-390.	Cl	Cl	H	CF ₃	CH ₃	OCH(CH ₃)COO ⁿ C ₄ H ₉
1-391.	Cl	Cl	H	CF ₃	CH ₃	OCH(CH ₃)COO ⁿ C ₅ H ₁₁
1-392.	Cl	Cl	H	CF ₃	CH ₃	OCH(CH ₃)COO ⁱ C ₃ H ₇
1-393.	Cl	Cl	H	CF ₃	CH ₃	OCH(CH ₃)COO ^c C ₅ H ₉
1-394.	Cl	Cl	H	CF ₃	CH ₃	OCH(CH ₃)COO ^c C ₆ H ₁₁
1-395.	Cl	Cl	H	CF ₃	CH ₃	OCH ₂ CON(CH ₃) ₂
1-396.	Cl	Cl	H	CF ₃	CH ₃	OCH ₂ CON(C ₂ H ₅) ₂
1-397.	Cl	Cl	H	CF ₃	CH ₃	OCH ₂ CON(CH ₃)C ₂ H ₅
1-398.	Cl	Cl	H	CF ₃	CH ₃	OCH(CH ₃)CON(CH ₃) ₂
1-399.	Cl	Cl	H	CF ₃	CH ₃	OCH(CH ₃)CON(C ₂ H ₅) ₂
1-400.	Cl	Cl	H	CF ₃	CH ₃	OCH(CH ₃)CON(CH ₃)C ₂ H ₅
1-401.	Cl	Cl	H	CF ₃	CH ₃	OCH ₂ COON(CH ₃) ₂

1. táblázat (folytatás)

Vegyület száma	X	Y	R ¹	R ²	R ³	B
1-402.	Cl	Cl	H	CF ₃	CH ₃	OCH ₂ COON(C ₂ H ₅) ₂
1-403.	Cl	Cl	H	CF ₃	CH ₃	OCH(CH ₃) COON(CH ₃) ₂
1-404.	Cl	Cl	H	CF ₃	CH ₃	OCH(CH ₃) COON(C ₂ H ₅) ₂
1-405.	H	Cl	H	CF ₃	CH ₃	CH ₂ CHClCOOCH ₃
1-406.	H	Cl	H	CF ₃	CH ₃	CH ₂ CHClCOOC ₂ H ₅
1-407.	H	Cl	H	CF ₃	CH ₃	CH ₂ CHClCOO " C ₃ H ₇
1-408.	H	Cl	H	CF ₃	CH ₃	CH ₂ CHBrCOOCH ₃
1-409.	H	Cl	H	CF ₃	CH ₃	CH ₂ CHBrCOOC ₂ H ₅
1-410.	H	Cl	H	CF ₃	CH ₃	CH ₂ CHBrCOO " C ₃ H ₇
1-411.	F	Cl	H	CF ₃	CH ₃	CH ₂ CHClCOOCH ₃
1-412.	F	Cl	H	CF ₃	CH ₃	CH ₂ CHClCOOC ₂ H ₅
1-413.	F	Cl	H	CF ₃	CH ₃	CH ₂ CHClCOO " C ₃ H ₇
1-414.	F	Cl	H	CF ₃	CH ₃	CH ₂ CHBrCOOCH ₃
1-415.	F	Cl	H	CF ₃	CH ₃	CH ₂ CHBrCOOC ₂ H ₅
1-416.	F	Cl	H	CF ₃	CH ₃	CH ₂ CHBrCOO " C ₃ H ₇
1-417.	Cl	Cl	H	CF ₃	CH ₃	CH ₂ CHClCOOCH ₃
1-418.	Cl	Cl	H	CF ₃	CH ₃	CH ₂ CHClCOOC ₂ H ₅
1-419.	Cl	Cl	H	CF ₃	CH ₃	CH ₂ CHClCOO " C ₃ H ₇
1-420.	Cl	Cl	H	CF ₃	CH ₃	CH ₂ CHBrCOOCH ₃
1-421.	Cl	Cl	H	CF ₃	CH ₃	CH ₂ CHBrCOOC ₂ H ₅
1-422.	Cl	Cl	H	CF ₃	CH ₃	CH ₂ CHBrCOO " C ₃ H ₇
1-423.	Cl	Cl	H	CF ₃	CH ₃	COOH
1-424.	Cl	Cl	H	CF ₃	CH ₃	COOCH ₃
1-425.	Cl	Cl	H	CF ₃	CH ₃	COOC ₂ H ₅

1. táblázat (folytatás)

Vegyület száma	X	Y	R ¹	R ²	R ³	B
1 - 426.	Cl	Cl	H	CF ₃	CH ₃	COO ⁿ C ₃ H ₇
1 - 427.	Cl	Cl	H	CF ₃	CH ₃	COO ⁿ C ₄ H ₉
1 - 428.	Cl	Cl	H	CF ₃	CH ₃	COO ⁿ C ₅ H ₁₁
1 - 429.	Cl	Cl	H	CF ₃	CH ₃	COO ¹ C ₃ H ₇
1 - 430.	Cl	Cl	H	CF ₃	CH ₃	COOCH ₂ CH ₂ Cl
1 - 431.	Cl	Cl	H	CF ₃	CH ₃	COOCH ₂ CH ₂ Br
1 - 432.	Cl	Cl	H	CF ₃	CH ₃	CON(CH ₃) ₂
1 - 433.	Cl	Cl	H	CF ₃	CH ₃	CONHCH ₃
1 - 434.	Cl	Cl	H	CF ₃	CH ₃	CON(C ₂ H ₅) ₂
1 - 435.	Cl	Cl	H	CF ₃	CH ₃	CONHC ₂ H ₅
1 - 436.	Cl	Cl	H	CF ₃	CH ₃	COCH ₃
1 - 437.	Cl	Cl	H	CF ₃	CH ₃	COC ₂ H ₅
1 - 438.	Cl	Cl	H	CF ₃	CH ₃	COCH ₂ Cl
1 - 439.	Cl	Cl	H	CF ₃	CH ₃	CHO
1 - 440.	Cl	Cl	H	CF ₃	CH ₃	CH=CHCOOCH ₃
1 - 441.	Cl	Cl	H	CF ₃	CH ₃	CH=CHCOOC ₂ H ₅
1 - 442.	Cl	Cl	H	CF ₃	CH ₃	CH ₂ CH ₂ COOCH ₃
1 - 443.	Cl	Cl	H	CF ₃	CH ₃	CH ₂ CH ₂ COOC ₂ H ₅

1. táblázat (folytatás)

Vegyület száma	X	Y	R ¹	R ²	R ³	B
1 - 444.	F	F	CH ₃	CF ₃	CH ₃	H
1 - 445.	F	F	CH ₃	CF ₃	CH ₃	NO ₂
1 - 446.	F	F	CH ₃	CF ₃	CH ₃	NH ₂
1 - 447.	F	Cl	CH ₃	CF ₃	CH ₃	H
1 - 448.	F	Cl	CH ₃	CF ₃	CH ₃	NO ₂
1 - 449.	F	Cl	CH ₃	CF ₃	CH ₃	NH ₂
1 - 450.	F	Cl	CH ₃	CF ₃	CH ₃	NHCH(CH ₃)COOCH ₃
1 - 451.	F	Cl	CH ₃	CF ₃	CH ₃	NHCH(CH ₃)COOC ₂ H ₅
1 - 452.	F	Cl	CH ₃	CF ₃	CH ₃	NHCH(CH ₃)COO ⁿ C ₃ H ₇
1 - 453.	F	Cl	CH ₃	CF ₃	CH ₃	NHCH(CH ₃)COO ⁿ C ₄ H ₉
1 - 454.	F	Cl	CH ₃	CF ₃	CH ₃	NHCH(CH ₃)COO ⁿ C ₅ H ₁₁
1 - 455.	F	Cl	CH ₃	CF ₃	CH ₃	NHCH(CH ₃)COO ⁱ C ₃ H ₇
1 - 456.	F	Cl	CH ₃	CF ₃	CH ₃	NHCH ₃
1 - 457.	F	Cl	CH ₃	CF ₃	CH ₃	NHC ₂ H ₅
1 - 458.	F	Cl	CH ₃	CF ₃	CH ₃	NHCH ₂ CH=CH ₂
1 - 459.	F	Cl	CH ₃	CF ₃	CH ₃	NHCH ₂ C≡CH
1 - 460.	F	Cl	CH ₃	CF ₃	CH ₃	NHCH ₂ COOCH ₃
1 - 461.	F	Cl	CH ₃	CF ₃	CH ₃	NHCH ₂ COOC ₂ H ₅
1 - 462.	F	Cl	CH ₃	CF ₃	CH ₃	NHCH(CH ₃)C≡CH
1 - 463.	F	Cl	CH ₃	CF ₃	CH ₃	NHCOOCH ₃
1 - 464.	F	Cl	CH ₃	CF ₃	CH ₃	NHCOOC ₂ H ₅
1 - 465.	F	Cl	CH ₃	CF ₃	CH ₃	NHSO ₂ CH ₃

1. táblázat (folytatás)

Vegyület száma	X	Y	R ¹	R ²	R ³	B
1 - 466.	F	Cl	CH ₃	CF ₃	CH ₃	NHSO ₂ C ₂ H ₅
1 - 467.	F	Cl	CH ₃	CF ₃	CH ₃	NHSO ₂ CH ₂ Cl
1 - 468.	F	Cl	CH ₃	CF ₃	CH ₃	NHSO ₂ CF ₃
1 - 469.	F	Cl	CH ₃	CF ₃	CH ₃	OH
1 - 470.	F	Cl	CH ₃	CF ₃	CH ₃	OCH ₃
1 - 471.	F	Cl	CH ₃	CF ₃	CH ₃	OC ₂ H ₅
1 - 472.	F	Cl	CH ₃	CF ₃	CH ₃	O ¹ C ₃ H ₇
1 - 473.	F	Cl	CH ₃	CF ₃	CH ₃	O ^c C ₅ H ₉
1 - 474.	F	Cl	CH ₃	CF ₃	CH ₃	OCH ₂ CH=CH ₂
1 - 475.	F	Cl	CH ₃	CF ₃	CH ₃	OCH ₂ C(CH ₃)CH=CH ₂
1 - 476.	F	Cl	CH ₃	CF ₃	CH ₃	OCH ₂ C≡CH
1 - 477.	F	Cl	CH ₃	CF ₃	CH ₃	OCH(CH ₃)C≡CH
1 - 478.	F	Cl	CH ₃	CF ₃	CH ₃	OCH ₂ COOCH ₃
1 - 479.	F	Cl	CH ₃	CF ₃	CH ₃	OCH ₂ COOC ₂ H ₅
1 - 480.	F	Cl	CH ₃	CF ₃	CH ₃	OCH ₂ COO ⁿ C ₃ H ₇
1 - 481.	F	Cl	CH ₃	CF ₃	CH ₃	OCH ₂ COO ⁿ C ₄ H ₉
1 - 482.	F	Cl	CH ₃	CF ₃	CH ₃	OCH ₂ COO ⁿ C ₅ H ₁₁
1 - 483.	F	Cl	CH ₃	CF ₃	CH ₃	OCH ₂ COO ¹ C ₃ H ₇
1 - 484.	F	Cl	CH ₃	CF ₃	CH ₃	OCH(CH ₃)COOCH ₃
1 - 485.	F	Cl	CH ₃	CF ₃	CH ₃	OCH(CH ₃)COOC ₂ H ₅
1 - 486.	F	Cl	CH ₃	CF ₃	CH ₃	OCH(CH ₃)COO ⁿ C ₃ H ₇
1 - 487.	F	Cl	CH ₃	CF ₃	CH ₃	OCH(CH ₃)COO ⁿ C ₄ H ₉

1. táblázat (folytatás)

Vegyület száma	X	Y	R ¹	R ²	R ³	B
1 - 488.	F	Cl	CH ₃	CF ₃	CH ₃	OCH(CH ₃)COO ⁿ C ₅ H ₁₁
1 - 489.	F	Cl	CH ₃	CF ₃	CH ₃	OCH(CH ₃)COO ⁱ C ₃ H ₇
1 - 490.	F	Cl	CH ₃	CF ₃	CH ₃	COOH
1 - 491.	F	Cl	CH ₃	CF ₃	CH ₃	COOCH ₃
1 - 492.	F	Cl	CH ₃	CF ₃	CH ₃	COOC ₂ H ₅
1 - 493.	F	Cl	CH ₃	CF ₃	CH ₃	COO ⁿ C ₃ H ₇
1 - 494.	F	Cl	CH ₃	CF ₃	CH ₃	COO ⁿ C ₄ H ₉
1 - 495.	F	Cl	CH ₃	CF ₃	CH ₃	COO ⁿ C ₅ H ₁₁
1 - 496.	F	Cl	CH ₃	CF ₃	CH ₃	COO ⁱ C ₃ H ₇
1 - 497.	F	Cl	CH ₃	CF ₃	CH ₃	COOCH ₂ CH ₂ Cl
1 - 498.	F	Cl	CH ₃	CF ₃	CH ₃	COOCH ₂ CH ₂ Br
1 - 499.	F	Cl	CH ₃	CF ₃	CH ₃	CON(CH ₃) ₂
1 - 500.	F	Cl	CH ₃	CF ₃	CH ₃	CONHCH ₃
1 - 501.	F	Cl	CH ₃	CF ₃	CH ₃	CON(C ₂ H ₅) ₂
1 - 502.	F	Cl	CH ₃	CF ₃	CH ₃	CONHC ₂ H ₅
1 - 503.	F	Cl	CH ₃	CF ₃	CH ₃	COCH ₃
1 - 504.	F	Cl	CH ₃	CF ₃	CH ₃	COC ₂ H ₅
1 - 505.	F	Cl	CH ₃	CF ₃	CH ₃	COCH ₂ Cl
1 - 506.	F	Cl	CH ₃	CF ₃	CH ₃	CHO
1 - 507.	F	Cl	CH ₃	CF ₃	CH ₃	CH=CHCOOCH ₃
1 - 508.	F	Cl	CH ₃	CF ₃	CH ₃	CH=CHCOOC ₂ H ₅
1 - 509.	F	Cl	CH ₃	CF ₃	CH ₃	CH ₂ CH ₂ COOCH ₃

1. táblázat (folytatás)

Vegyület száma	X	Y	R ¹	R ²	R ³	B
1-510.	F	Cl	CH ₃	CF ₃	CH ₃	CH ₂ CH ₂ COOC ₂ H ₅
1-511.	F	Cl	CH ₃	CF ₃	CH ₃	CH ₂ CHClCOOCH ₃
1-512.	F	Cl	CH ₃	CF ₃	CH ₃	CH ₂ CHClCOOC ₂ H ₅
1-513.	F	Cl	CH ₃	CF ₃	CH ₃	CH ₂ CHBrCOOCH ₃
1-514.	F	Cl	CH ₃	CF ₃	CH ₃	CH ₂ CHBrCOOC ₂ H ₅
1-515.	Cl	Cl	CH ₃	CF ₃	CH ₃	H
1-516.	Cl	Cl	CH ₃	CF ₃	CH ₃	NO ₂
1-517.	Cl	Cl	CH ₃	CF ₃	CH ₃	NH ₂
1-518.	Cl	Cl	CH ₃	CF ₃	CH ₃	NHCH(CH ₃)COOCH ₃
1-519.	Cl	Cl	CH ₃	CF ₃	CH ₃	NHCH(CH ₃)COOC ₂ H ₅
1-520.	Cl	Cl	CH ₃	CF ₃	CH ₃	NHCH(CH ₃)COO ⁿ C ₃ H ₇
1-521.	Cl	Cl	CH ₃	CF ₃	CH ₃	NHCH(CH ₃)COO ⁿ C ₄ H ₉
1-522.	Cl	Cl	CH ₃	CF ₃	CH ₃	NHCH(CH ₃)COO ⁿ C ₅ H ₁₁
1-523.	Cl	Cl	CH ₃	CF ₃	CH ₃	NHCH(CH ₃)COO ¹ C ₃ H ₇
1-524.	Cl	Cl	CH ₃	CF ₃	CH ₃	NHCH ₃
1-525.	Cl	Cl	CH ₃	CF ₃	CH ₃	NHC ₂ H ₅
1-526.	Cl	Cl	CH ₃	CF ₃	CH ₃	NHCH ₂ CH=CH ₂
1-527.	Cl	Cl	CH ₃	CF ₃	CH ₃	NHCH ₂ C≡CH
1-528.	Cl	Cl	CH ₃	CF ₃	CH ₃	NHCH ₂ COOCH ₃
1-529.	Cl	Cl	CH ₃	CF ₃	CH ₃	NHCH ₂ COOC ₂ H ₅
1-530.	Cl	Cl	CH ₃	CF ₃	CH ₃	NHCH(CH ₃)C≡CH
1-531.	Cl	Cl	CH ₃	CF ₃	CH ₃	NHCOOCH ₃

1. táblázat (folytatás)

Vegyület száma	X	Y	R ¹	R ²	R ³	B
1 - 532.	Cl	Cl	CH ₃	CF ₃	CH ₃	NHCOOC ₂ H ₅
1 - 533.	Cl	Cl	CH ₃	CF ₃	CH ₃	NHSO ₂ CH ₃
1 - 534.	Cl	Cl	CH ₃	CF ₃	CH ₃	NHSO ₂ C ₂ H ₅
1 - 535.	Cl	Cl	CH ₃	CF ₃	CH ₃	NHSO ₂ CH ₂ Cl
1 - 536.	Cl	Cl	CH ₃	CF ₃	CH ₃	NHSO ₂ CF ₃
1 - 537.	Cl	Cl	CH ₃	CF ₃	CH ₃	OH
1 - 538.	Cl	Cl	CH ₃	CF ₃	CH ₃	OCH ₃
1 - 539.	Cl	Cl	CH ₃	CF ₃	CH ₃	OC ₂ H ₅
1 - 540.	Cl	Cl	CH ₃	CF ₃	CH ₃	O ¹ C ₃ H ₇
1 - 541.	Cl	Cl	CH ₃	CF ₃	CH ₃	OCH ₂ CH=CH ₂
1 - 542.	Cl	Cl	CH ₃	CF ₃	CH ₃	OCH ₂ C(CH ₃)CH=CH ₂
1 - 543.	Cl	Cl	CH ₃	CF ₃	CH ₃	OCH ₂ C≡CH
1 - 544.	Cl	Cl	CH ₃	CF ₃	CH ₃	OCH(CH ₃)C≡CH
1 - 545.	Cl	Cl	CH ₃	CF ₃	CH ₃	OCH ₂ COOCH ₃
1 - 546.	Cl	Cl	CH ₃	CF ₃	CH ₃	OCH ₂ COOC ₂ H ₅
1 - 547.	Cl	Cl	CH ₃	CF ₃	CH ₃	OCH ₂ COO ⁿ C ₃ H ₇
1 - 548.	Cl	Cl	CH ₃	CF ₃	CH ₃	OCH ₂ COO ⁿ C ₄ H ₉
1 - 549.	Cl	Cl	CH ₃	CF ₃	CH ₃	OCH ₂ COO ⁿ C ₅ H ₁₁
1 - 550.	Cl	Cl	CH ₃	CF ₃	CH ₃	OCH ₂ COO ¹ C ₃ H ₇
1 - 551.	Cl	Cl	CH ₃	CF ₃	CH ₃	OCH(CH ₃)COOCH ₃
1 - 552.	Cl	Cl	CH ₃	CF ₃	CH ₃	OCH(CH ₃)COOC ₂ H ₅
1 - 553.	Cl	Cl	CH ₃	CF ₃	CH ₃	OCH(CH ₃)COO ⁿ C ₃ H ₇

1. táblázat (folytatás)

Vegyület száma	X	Y	R ¹	R ²	R ³	B
1 - 554.	Cl	Cl	CH ₃	CF ₃	CH ₃	OCH(CH ₃)COO ⁿ C ₄ H ₉
1 - 555.	Cl	Cl	CH ₃	CF ₃	CH ₃	OCH(CH ₃)COO ⁿ C ₅ H ₁₁
1 - 556.	Cl	Cl	CH ₃	CF ₃	CH ₃	OCH(CH ₃)COO ⁱ C ₃ H ₇
1 - 557.	Cl	Cl	CH ₃	CF ₃	CH ₃	COOH
1 - 558.	Cl	Cl	CH ₃	CF ₃	CH ₃	COOCH ₃
1 - 559.	Cl	Cl	CH ₃	CF ₃	CH ₃	COOC ₂ H ₅
1 - 560.	Cl	Cl	CH ₃	CF ₃	CH ₃	COO ⁿ C ₃ H ₇
1 - 561.	Cl	Cl	CH ₃	CF ₃	CH ₃	COO ⁿ C ₄ H ₉
1 - 562.	Cl	Cl	CH ₃	CF ₃	CH ₃	COO ⁿ C ₅ H ₁₁
1 - 563.	Cl	Cl	CH ₃	CF ₃	CH ₃	COO ⁱ C ₃ H ₇
1 - 564.	Cl	Cl	CH ₃	CF ₃	CH ₃	COOCH ₂ CH ₂ Cl
1 - 565.	Cl	Cl	CH ₃	CF ₃	CH ₃	COOCH ₂ CH ₂ Br
1 - 566.	Cl	Cl	CH ₃	CF ₃	CH ₃	CON(CH ₃) ₂
1 - 567.	Cl	Cl	CH ₃	CF ₃	CH ₃	CONHCH ₃
1 - 568.	Cl	Cl	CH ₃	CF ₃	CH ₃	CON(C ₂ H ₅) ₂
1 - 569.	Cl	Cl	CH ₃	CF ₃	CH ₃	CONHC ₂ H ₅
1 - 570.	Cl	Cl	CH ₃	CF ₃	CH ₃	COCH ₃
1 - 571.	Cl	Cl	CH ₃	CF ₃	CH ₃	COC ₂ H ₅
1 - 572.	Cl	Cl	CH ₃	CF ₃	CH ₃	COCH ₂ Cl
1 - 573.	Cl	Cl	CH ₃	CF ₃	CH ₃	CHO
1 - 574.	Cl	Cl	CH ₃	CF ₃	CH ₃	CH=CHCOOCH ₃
1 - 575.	Cl	Cl	CH ₃	CF ₃	CH ₃	CH=CHCOOC ₂ H ₅

1. táblázat (folytatás)

Vegyület száma	X	Y	R ¹	R ²	R ³	B
1 - 576.	Cl	Cl	CH ₃	CF ₃	CH ₃	CH ₂ CH ₂ COOCH ₃
1 - 577.	Cl	Cl	CH ₃	CF ₃	CH ₃	CH ₂ CH ₂ COOC ₂ H ₅
1 - 578.	Cl	Cl	CH ₃	CF ₃	CH ₃	CH ₂ CHClCOOCH ₃
1 - 579.	Cl	Cl	CH ₃	CF ₃	CH ₃	CH ₂ CHClCOOC ₂ H ₅
1 - 580.	Cl	Cl	CH ₃	CF ₃	CH ₃	CH ₂ CHBrCOOCH ₃
1 - 581.	Cl	Cl	CH ₃	CF ₃	CH ₃	CH ₂ CHBrCOOC ₂ H ₅

2. táblázat

(1b) általános képletű vegyületek

Vegyület száma	X	Z	n	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵
2-1.	H	O	1	H	CF ₃	CH ₃	H	H
2-2.	H	O	1	H	CF ₃	CH ₃	H	CH ₃
2-3.	H	O	1	H	CF ₃	CH ₃	H	C ₂ H ₅
2-4.	H	O	1	H	CF ₃	CH ₃	H	ⁿ C ₃ H ₇
2-5.	H	O	1	H	CF ₃	CH ₃	H	ⁱ C ₃ H ₇
2-6.	H	O	1	H	CF ₃	CH ₃	H	ⁱ C ₄ H ₉
2-7.	H	O	1	H	CF ₃	CH ₃	H	ⁿ C ₄ H ₉
2-8.	H	O	1	H	CF ₃	CH ₃	H	CH ₂ CH ₂ Cl
2-9.	H	O	1	H	CF ₃	CH ₃	H	CH ₂ CH ₂ Br
2-10.	H	O	1	H	CF ₃	CH ₃	H	CH ₂ CH=CH ₂
2-11.	H	O	1	H	CF ₃	CH ₃	H	CH(CH ₃)CH=CH ₂
2-12.	H	O	1	H	CF ₃	CH ₃	H	CH ₂ CCl=CH ₂
2-13.	H	O	1	H	CF ₃	CH ₃	H	CH ₂ C≡CH
2-14.	H	O	1	H	CF ₃	CH ₃	H	CH(CH ₃)C≡CH
2-15.	H	O	1	H	CF ₃	CH ₃	H	CH ₂ CN

2. táblázat (folytatás)

Vegyület száma	X	Z	n	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵
2-16.	H	O	1	H	CF ₃	CH ₃	H	CH ₂ OCH ₃
2-17.	H	O	1	H	CF ₃	CH ₃	H	CH ₂ OC ₂ H ₅
2-18.	H	O	1	H	CF ₃	CH ₃	H	CH ₂ COOH
2-19.	H	O	1	H	CF ₃	CH ₃	H	CH ₂ COOCH ₃
2-20.	H	O	1	H	CF ₃	CH ₃	H	CH ₂ COOC ₂ H ₅
2-21.	H	O	1	H	CF ₃	CH ₃	H	CH ₂ COO ⁿ C ₃ H ₇
2-22.	H	O	1	H	CF ₃	CH ₃	H	CH ₂ COO ⁿ C ₄ H ₉
2-23.	H	O	1	H	CF ₃	CH ₃	H	CH ₂ COO ⁿ C ₅ H ₁₁
2-24.	H	O	1	H	CF ₃	CH ₃	H	CH ₂ COO ⁱ C ₃ H ₇
2-25.	H	O	1	H	CF ₃	CH ₃	H	CH ₂ COO ^c C ₅ H ₉
2-26.	H	O	1	H	CF ₃	CH ₃	H	CH ₂ COO ^c C ₆ H ₁₁
2-27.	H	O	1	H	CF ₃	CH ₃	H	CH(CH ₃)COOH
2-28.	H	O	1	H	CF ₃	CH ₃	H	CH(CH ₃)COOCH ₃
2-29.	H	O	1	H	CF ₃	CH ₃	H	CH(CH ₃)COOC ₂ H ₅
2-30.	H	O	1	H	CF ₃	CH ₃	H	CH(CH ₃)COO ⁿ C ₃ H ₇
2-31.	H	O	1	H	CF ₃	CH ₃	H	CH(CH ₃)COO ⁿ C ₄ H ₉
2-32.	H	O	1	H	CF ₃	CH ₃	H	CH(CH ₃)COO ⁿ C ₅ H ₁₁
2-33.	H	O	1	H	CF ₃	CH ₃	H	CH(CH ₃)COO ⁱ C ₃ H ₇
2-34.	H	O	1	H	CF ₃	CH ₃	H	CH(CH ₃)COO ^c C ₅ H ₉
2-35.	H	O	1	H	CF ₃	CH ₃	H	CH(CH ₃)COO ^c C ₆ H ₁₁
2-36.	H	O	1	H	CF ₃	CH ₃	CH ₃	H
2-37.	H	O	1	H	CF ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃
2-38.	H	O	1	H	CF ₃	CH ₃	CH ₃	C ₂ H ₅

2. táblázat (folytatás)

Vegyület száma	X	Z	n	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵
2-39.	H	O	1	H	CF ₃	CH ₃	CH ₃	ⁿ C ₃ H ₇
2-40.	H	O	1	H	CF ₃	CH ₃	CH ₃	ⁱ C ₃ H ₇
2-41.	H	O	1	H	CF ₃	CH ₃	CH ₃	ⁱ C ₄ H ₉
2-42.	H	O	1	H	CF ₃	CH ₃	CH ₃	ⁿ C ₄ H ₉
2-43.	H	O	1	H	CF ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₂ CH=CH ₂
2-44.	H	O	1	H	CF ₃	CH ₃	CH ₃	CH(CH ₃)CH=CH ₂
2-45.	H	O	1	H	CF ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₂ C≡CH
2-46.	H	O	1	H	CF ₃	CH ₃	CH ₃	CH(CH ₃)C≡CH
2-47.	H	O	1	H	CF ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₂ OCH ₃
2-48.	H	O	1	H	CF ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₂ OC ₂ H ₅
2-49.	F	O	1	H	CF ₃	CH ₃	H	H
2-50.	F	O	1	H	CF ₃	CH ₃	H	CH ₃
2-51.	F	O	1	H	CF ₃	CH ₃	H	C ₂ H ₅
2-52.	F	O	1	H	CF ₃	CH ₃	H	ⁿ C ₃ H ₇
2-53.	F	O	1	H	CF ₃	CH ₃	H	ⁱ C ₃ H ₇
2-54.	F	O	1	H	CF ₃	CH ₃	H	ⁱ C ₄ H ₉
2-55.	F	O	1	H	CF ₃	CH ₃	H	ⁿ C ₄ H ₉
2-56.	F	O	1	H	CF ₃	CH ₃	H	CH ₂ CH ₂ Cl
2-57.	F	O	1	H	CF ₃	CH ₃	H	CH ₂ CH ₂ Br
2-58.	F	O	1	H	CF ₃	CH ₃	H	CH ₂ CH=CH ₂
2-59.	F	O	1	H	CF ₃	CH ₃	H	CH(CH ₃)CH=CH ₂
2-60.	F	O	1	H	CF ₃	CH ₃	H	CH ₂ CCl=CH ₂
2-61.	F	O	1	H	CF ₃	CH ₃	H	CH ₂ C≡CH

2. táblázat (folytatás)

Vegyület száma	X	Z'	n	R'	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵
2-62.	F	O	1	H	CF ₃	CH ₃	H	CH(CH ₃)C≡CH
2-63.	F	O	1	H	CF ₃	CH ₃	H	CH ₂ CN
2-64.	F	O	1	H	CF ₃	CH ₃	H	CH ₂ OCH ₃
2-65.	F	O	1	H	CF ₃	CH ₃	H	CH ₂ OC ₂ H ₅
2-66.	F	O	1	H	CF ₃	CH ₃	H	CH ₂ COOH
2-67.	F	O	1	H	CF ₃	CH ₃	H	CH ₂ COOCH ₃
2-68.	F	O	1	H	CF ₃	CH ₃	H	CH ₂ COOC ₂ H ₅
2-69.	F	O	1	H	CF ₃	CH ₃	H	CH ₂ COO ⁿ C ₃ H ₇
2-70.	F	O	1	H	CF ₃	CH ₃	H	CH ₂ COO ⁿ C ₄ H ₉
2-71.	F	O	1	H	CF ₃	CH ₃	H	CH ₂ COO ⁿ C ₅ H ₁₁
2-72.	F	O	1	H	CF ₃	CH ₃	H	CH ₂ COO ⁱ C ₃ H ₇
2-73.	F	O	1	H	CF ₃	CH ₃	H	CH ₂ COO ^c C ₅ H ₉
2-74.	F	O	1	H	CF ₃	CH ₃	H	CH ₂ COO ^c C ₆ H ₁₁
2-75.	F	O	1	H	CF ₃	CH ₃	H	CH(CH ₃)COOH
2-76.	F	O	1	H	CF ₃	CH ₃	H	CH(CH ₃)COOCH ₃
2-77.	F	O	1	H	CF ₃	CH ₃	H	CH(CH ₃)COOC ₂ H ₅
2-78.	F	O	1	H	CF ₃	CH ₃	H	CH(CH ₃)COO ⁿ C ₃ H ₇
2-79.	F	O	1	H	CF ₃	CH ₃	H	CH(CH ₃)COO ⁿ C ₄ H ₉
2-80.	F	O	1	H	CF ₃	CH ₃	H	CH(CH ₃)COO ⁿ C ₅ H ₁₁
2-81.	F	O	1	H	CF ₃	CH ₃	H	CH(CH ₃)COO ⁱ C ₃ H ₇
2-82.	F	O	1	H	CF ₃	CH ₃	H	CH(CH ₃)COO ^c C ₅ H ₉
2-83.	F	O	1	H	CF ₃	CH ₃	H	CH(CH ₃)COO ^c C ₆ H ₁₁

2. táblázat (folytatás)

Vegyület száma	X	Z	n	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵
2-84.	F	O	1	H	CF ₃	CH ₃	CH ₃	H
2-85.	F	O	1	H	CF ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃
2-86.	F	O	1	H	CF ₃	CH ₃	CH ₃	C ₂ H ₅
2-87.	F	O	1	H	CF ₃	CH ₃	CH ₃	ⁿ C ₃ H ₇
2-88.	F	O	1	H	CF ₃	CH ₃	CH ₃	¹ C ₃ H ₇
2-89.	F	O	1	H	CF ₃	CH ₃	CH ₃	¹ C ₄ H ₉
2-90.	F	O	1	H	CF ₃	CH ₃	CH ₃	ⁿ C ₄ H ₉
2-91.	F	O	1	H	CF ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₂ CH=CH ₂
2-92.	F	O	1	H	CF ₃	CH ₃	CH ₃	CH(CH ₃)CH=CH ₂
2-93.	F	O	1	H	CF ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₂ C≡CH
2-94.	F	O	1	H	CF ₃	CH ₃	CH ₃	CH(CH ₃)C≡CH
2-95.	F	O	1	H	CF ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₂ OCH ₃
2-96.	F	O	1	H	CF ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₂ OC ₂ H ₅
2-97.	H	S	0	H	CF ₃	CH ₃	—	H
2-98.	H	S	0	H	CF ₃	CH ₃	—	CH ₃
2-99.	H	S	0	H	CF ₃	CH ₃	—	C ₂ H ₅
2-100.	H	S	0	H	CF ₃	CH ₃	—	ⁿ C ₃ H ₇
2-101.	H	S	0	H	CF ₃	CH ₃	—	ⁿ C ₄ H ₉
2-102.	H	S	0	H	CF ₃	CH ₃	—	¹ C ₃ H ₇
2-103.	H	S	0	H	CF ₃	CH ₃	—	¹ C ₄ H ₉
2-104.	H	S	0	H	CF ₃	CH ₃	—	CH ₂ CH ₂ Cl
2-105.	H	S	0	H	CF ₃	CH ₃	—	CH ₂ CH ₂ Br
2-106.	H	S	0	H	CF ₃	CH ₃	—	CH ₂ CH=CH ₂

2. táblázat (folytatás)

Vegyület száma	X	Z ¹	n	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵
2-107.	H	S	0	H	CF ₃	CH ₃	—	CH(CH ₃)CH=CH ₂
2-108.	H	S	0	H	CF ₃	CH ₃	—	CH ₂ CCl=CH ₂
2-109.	H	S	0	H	CF ₃	CH ₃	—	CH ₂ C≡CH
2-110.	H	S	0	H	CF ₃	CH ₃	—	CH(CH ₃)C≡CH
2-111.	H	S	0	H	CF ₃	CH ₃	—	CH ₂ CN
2-112.	H	S	0	H	CF ₃	CH ₃	—	CH ₂ OCH ₃
2-113.	H	S	0	H	CF ₃	CH ₃	—	CH ₂ OC ₂ H ₅
2-114.	H	S	0	H	CF ₃	CH ₃	—	CH ₂ COOH
2-115.	H	S	0	H	CF ₃	CH ₃	—	CH ₂ COOCH ₃
2-116.	H	S	0	H	CF ₃	CH ₃	—	CH ₂ COOC ₂ H ₅
2-117.	H	S	0	H	CF ₃	CH ₃	—	CH ₂ COO ⁿ C ₃ H ₇
2-118.	H	S	0	H	CF ₃	CH ₃	—	CH ₂ COO ⁿ C ₄ H ₉
2-119.	H	S	0	H	CF ₃	CH ₃	—	CH ₂ COO ⁿ C ₅ H ₁₁
2-120.	H	S	0	H	CF ₃	CH ₃	—	CH ₂ COO ⁱ C ₃ H ₇
2-121.	H	S	0	H	CF ₃	CH ₃	—	CH ₂ COO ^c C ₅ H ₉
2-122.	H	S	0	H	CF ₃	CH ₃	—	CH ₂ COO ^c C ₆ H ₁₁
2-123.	H	S	0	H	CF ₃	CH ₃	—	CH(CH ₃)COOH
2-124.	H	S	0	H	CF ₃	CH ₃	—	CH(CH ₃)COOCH ₃
2-125.	H	S	0	H	CF ₃	CH ₃	—	CH(CH ₃)COOC ₂ H ₅
2-126.	H	S	0	H	CF ₃	CH ₃	—	CH(CH ₃)COO ⁿ C ₃ H ₇
2-127.	H	S	0	H	CF ₃	CH ₃	—	CH(CH ₃)COO ⁿ C ₄ H ₉
2-128.	H	S	0	H	CF ₃	CH ₃	—	CH(CH ₃)COO ⁿ C ₅ H ₁₁
2-129.	H	S	0	H	CF ₃	CH ₃	—	CH(CH ₃)COO ⁱ C ₃ H ₇

2. táblázat (folytatás)

Vegyület száma	X	Z'	n	R'	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵
2-130.	H	S	0	H	CF ₃	CH ₃	—	CH(CH ₃)COO ^c C ₅ H ₉
2-131.	H	S	0	H	CF ₃	CH ₃	—	CH(CH ₃)COO ^c C ₆ H ₁₁
2-132.	F	S	0	H	CF ₃	CH ₃	—	H
2-133.	F	S	0	H	CF ₃	CH ₃	—	CH ₃
2-134.	F	S	0	H	CF ₃	CH ₃	—	C ₂ H ₅
2-135.	F	S	0	H	CF ₃	CH ₃	—	ⁿ C ₃ H ₇
2-136.	F	S	0	H	CF ₃	CH ₃	—	ⁿ C ₄ H ₉
2-137.	F	S	0	H	CF ₃	CH ₃	—	ⁱ C ₃ H ₇
2-138.	F	S	0	H	CF ₃	CH ₃	—	ⁱ C ₄ H ₉
2-139.	F	S	0	H	CF ₃	CH ₃	—	CH ₂ CH ₂ Cl
2-140.	F	S	0	H	CF ₃	CH ₃	—	CH ₂ CH ₂ Br
2-141.	F	S	0	H	CF ₃	CH ₃	—	CH ₂ CH=CH ₂
2-142.	F	S	0	H	CF ₃	CH ₃	—	CH(CH ₃)CH=CH ₂
2-143.	F	S	0	H	CF ₃	CH ₃	—	CH ₂ CCl=CH ₂
2-144.	F	S	0	H	CF ₃	CH ₃	—	CH ₂ C≡CH
2-145.	F	S	0	H	CF ₃	CH ₃	—	CH(CH ₃)C≡CH
2-146.	F	S	0	H	CF ₃	CH ₃	—	CH ₂ CN
2-147.	F	S	0	H	CF ₃	CH ₃	—	CH ₂ OCH ₃
2-148.	F	S	0	H	CF ₃	CH ₃	—	CH ₂ OC ₂ H ₅
2-149.	F	S	0	H	CF ₃	CH ₃	—	CH ₂ COOH
2-150.	F	S	0	H	CF ₃	CH ₃	—	CH ₂ COOCH ₃
2-151.	F	S	0	H	CF ₃	CH ₃	—	CH ₂ COOC ₂ H ₅
2-152.	F	S	0	H	CF ₃	CH ₃	—	CH ₂ COO ⁿ C ₃ H ₇

2. táblázat (folytatás)

Vegyület száma	X	Z'	n	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵
2-153.	F	S	0	H	CF ₃	CH ₃	—	CH ₂ COO ⁿ C ₄ H ₉
2-154.	F	S	0	H	CF ₃	CH ₃	—	CH ₂ COO ⁿ C ₅ H ₁₁
2-155.	F	S	0	H	CF ₃	CH ₃	—	CH ₂ COO ⁱ C ₃ H ₇
2-156.	F	S	0	H	CF ₃	CH ₃	—	CH ₂ COO ^c C ₅ H ₉
2-157.	F	S	0	H	CF ₃	CH ₃	—	CH ₂ COO ^c C ₆ H ₁₁
2-158.	F	S	0	H	CF ₃	CH ₃	—	CH(CH ₃) COOH
2-159.	F	S	0	H	CF ₃	CH ₃	—	CH(CH ₃) COOCH ₃
2-160.	F	S	0	H	CF ₃	CH ₃	—	CH(CH ₃) COOC ₂ H ₅
2-161.	F	S	0	H	CF ₃	CH ₃	—	CH(CH ₃) COO ⁿ C ₃ H ₇
2-162.	F	S	0	H	CF ₃	CH ₃	—	CH(CH ₃) COO ⁿ C ₄ H ₉
2-163.	F	S	0	H	CF ₃	CH ₃	—	CH(CH ₃) COO ⁿ C ₅ H ₁₁
2-164.	F	S	0	H	CF ₃	CH ₃	—	CH(CH ₃) COO ⁱ C ₃ H ₇
2-165.	F	S	0	H	CF ₃	CH ₃	—	CH(CH ₃) COO ^c C ₅ H ₉
2-166.	F	S	0	H	CF ₃	CH ₃	—	CH(CH ₃) COO ^c C ₆ H ₁₁
2-167.	H	O	0	H	CF ₃	CH ₃	—	H ₂
2-168.	H	O	0	H	CF ₃	CH ₃	—	CH ₃
2-189.	H	O	0	H	CF ₃	CH ₃	—	C ₂ H ₅
2-170.	H	O	0	H	CF ₃	CH ₃	—	ⁿ C ₃ H ₇
2-171.	H	O	0	H	CF ₃	CH ₃	—	ⁿ C ₄ H ₉
2-172.	H	O	0	H	CF ₃	CH ₃	—	ⁱ C ₃ H ₇
2-173.	H	O	0	H	CF ₃	CH ₃	—	ⁱ C ₄ H ₉
2-174.	H	O	0	H	CF ₃	CH ₃	—	CH ₂ CH=CH ₂

2. táblázat (folytatás)

Vegyület száma	X	Z ¹	n	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵
2-175.	H	O	0	H	CF ₃	CH ₃	—	CH(CH ₃)CH=CH ₂
2-176.	H	O	0	H	CF ₃	CH ₃	—	CH ₂ C≡CH
2-177.	H	O	0	H	CF ₃	CH ₃	—	CH(CH ₃)C≡CH
2-178.	H	O	0	H	CF ₃	CH ₃	—	CH ₂ OCH ₃
2-179.	H	O	0	H	CF ₃	CH ₃	—	CH ₂ OC ₂ H ₅
2-180.	F	O	0	H	CF ₃	CH ₃	—	H
2-181.	F	O	0	H	CF ₃	CH ₃	—	CH ₃
2-182.	F	O	0	H	CF ₃	CH ₃	—	C ₂ H ₅
2-183.	F	O	0	H	CF ₃	CH ₃	—	ⁿ C ₃ H ₇
2-184.	F	O	0	H	CF ₃	CH ₃	—	ⁿ C ₄ H ₉
2-185.	F	O	0	H	CF ₃	CH ₃	—	CH ₂ CH=CH ₂
2-186.	F	O	0	H	CF ₃	CH ₃	—	CH(CH ₃)CH=CH ₂
2-187.	F	O	0	H	CF ₃	CH ₃	—	CH ₂ C≡CH
2-188.	F	O	0	H	CF ₃	CH ₃	—	CH(CH ₃)C≡CH
2-189.	F	O	0	H	CF ₃	CH ₃	—	CH ₂ OCH ₃
2-190.	F	O	0	H	CF ₃	CH ₃	—	CH ₂ OC ₂ H ₅

2. táblázat (folytatás)

Vegyület száma	X	Z'	n	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵
2-191.	H	O	1	CH ₃	CF ₃	CH ₃	H	H
2-192.	H	O	1	CH ₃	CF ₃	CH ₃	H	CH ₃
2-193.	H	O	1	CH ₃	CF ₃	CH ₃	H	C ₂ H ₅
2-194.	H	O	1	CH ₃	CF ₃	CH ₃	H	ⁿ C ₃ H ₇
2-195.	H	O	1	CH ₃	CF ₃	CH ₃	H	¹ C ₃ H ₇
2-196.	H	O	1	CH ₃	CF ₃	CH ₃	H	ⁿ C ₄ H ₉
2-197.	H	O	1	CH ₃	CF ₃	CH ₃	H	CH ₂ CH ₂ Cl
2-198.	H	O	1	CH ₃	CF ₃	CH ₃	H	CH ₂ CH ₂ Br
2-199.	H	O	1	CH ₃	CF ₃	CH ₃	H	CH ₂ CH=CH ₂
2-200.	H	O	1	CH ₃	CF ₃	CH ₃	H	CH(CH ₃)CH=CH ₂
2-201.	H	O	1	CH ₃	CF ₃	CH ₃	H	CH ₂ CCl=CH ₂
2-202.	H	O	1	CH ₃	CF ₃	CH ₃	H	CH ₂ C≡CH
2-203.	H	O	1	CH ₃	CF ₃	CH ₃	H	CH(CH ₃)C≡CH
2-204.	H	O	1	CH ₃	CF ₃	CH ₃	H	CH ₂ CN
2-205.	H	O	1	CH ₃	CF ₃	CH ₃	H	CH ₂ COOH
2-206.	H	O	1	CH ₃	CF ₃	CH ₃	H	CH ₂ COOCH ₃
2-207.	H	O	1	CH ₃	CF ₃	CH ₃	H	CH ₂ COOC ₂ H ₅
2-208.	H	O	1	CH ₃	CF ₃	CH ₃	H	CH ₂ COO ⁿ C ₃ H ₇
2-209.	H	O	1	CH ₃	CF ₃	CH ₃	H	CH ₂ COO ⁿ C ₄ H ₉
2-210.	H	O	1	CH ₃	CF ₃	CH ₃	H	CH ₂ COO ⁿ C ₅ H ₁₁
2-211.	H	O	1	CH ₃	CF ₃	CH ₃	H	CH(CH ₃)COOH
2-212.	H	O	1	CH ₃	CF ₃	CH ₃	H	CH(CH ₃)COOCH ₃

2. táblázat (folytatás)

Vegyület száma	X	Z ¹	n	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵
2-213.	H	O	1	CH ₃	CF ₃	CH ₃	H	CH(CH ₃)COOC ₂ H ₅
2-214.	H	O	1	CH ₃	CF ₃	CH ₃	H	CH(CH ₃)COO ⁿ C ₃ H ₇
2-215.	H	O	1	CH ₃	CF ₃	CH ₃	H	CH(CH ₃)COO ⁿ C ₄ H ₉
2-216.	H	O	1	CH ₃	CF ₃	CH ₃	H	CH(CH ₃)COO ⁿ C ₅ H ₁₁
2-217.	F	O	1	CH ₃	CF ₃	CH ₃	H	H
2-218.	F	O	1	CH ₃	CF ₃	CH ₃	H	CH ₃
2-219.	F	O	1	CH ₃	CF ₃	CH ₃	H	C ₂ H ₅
2-220.	F	O	1	CH ₃	CF ₃	CH ₃	H	ⁿ C ₃ H ₇
2-221.	F	O	1	CH ₃	CF ₃	CH ₃	H	¹ C ₃ H ₇
2-222.	F	O	1	CH ₃	CF ₃	CH ₃	H	ⁿ C ₄ H ₉
2-223.	F	O	1	CH ₃	CF ₃	CH ₃	H	CH ₂ CH ₂ Cl
2-224.	F	O	1	CH ₃	CF ₃	CH ₃	H	CH ₂ CH ₂ Br
2-225.	F	O	1	CH ₃	CF ₃	CH ₃	H	CH ₂ CH=CH ₂
2-226.	F	O	1	CH ₃	CF ₃	CH ₃	H	CH(CH ₃)CH=CH ₂
2-227.	F	O	1	CH ₃	CF ₃	CH ₃	H	CH ₂ CCl=CH ₂
2-228.	F	O	1	CH ₃	CF ₃	CH ₃	H	CH ₂ C≡CH
2-229.	F	O	1	CH ₃	CF ₃	CH ₃	H	CH(CH ₃)C≡CH
2-230.	F	O	1	CH ₃	CF ₃	CH ₃	H	CH ₂ CN
2-231.	F	O	1	CH ₃	CF ₃	CH ₃	H	CH ₂ COOH
2-232.	F	O	1	CH ₃	CF ₃	CH ₃	H	CH ₂ COOCH ₃
2-233.	F	O	1	CH ₃	CF ₃	CH ₃	H	CH ₂ COOC ₂ H ₅
2-234.	F	O	1	CH ₃	CF ₃	CH ₃	H	CH ₂ COO ⁿ C ₃ H ₇

2. táblázat (folytatás)

Vegyület száma	X	Z'	n	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵
2-235.	F	O	1	CH ₃	CF ₃	CH ₃	H	CH ₂ COO ⁿ C ₄ H ₉
2-236.	F	O	1	CH ₃	CF ₃	CH ₃	H	CH ₂ COO ⁿ C ₅ H ₁₁
2-237.	F	O	1	CH ₃	CF ₃	CH ₃	H	CH(CH ₃)COOH
2-238.	F	O	1	CH ₃	CF ₃	CH ₃	H	CH(CH ₃)COOCH ₃
2-239.	F	O	1	CH ₃	CF ₃	CH ₃	H	CH(CH ₃)COOC ₂ H ₅
2-240.	F	O	1	CH ₃	CF ₃	CH ₃	H	CH(CH ₃)COO ⁿ C ₃ H ₇
2-241.	F	O	1	CH ₃	CF ₃	CH ₃	H	CH(CH ₃)COO ⁿ C ₄ H ₉
2-242.	F	O	1	CH ₃	CF ₃	CH ₃	H	CH(CH ₃)COO ⁿ C ₅ H ₁₁

3. táblázat

(1c) általános képletű vegyületek

Vegyület száma	X	Y	Z ²	R ¹	R ²	R ³	R ⁶
3-1.	H	F	O	H	CF ₃	C ₂ H ₅	CH ₃
3-2.	H	Cl	O	H	CF ₃	C ₂ H ₅	CH ₃
3-3.	H	Br	O	H	CF ₃	C ₂ H ₅	CH ₃
3-4.	F	F	O	H	CF ₃	C ₂ H ₅	CH ₃
3-5.	F	Cl	O	H	CF ₃	C ₂ H ₅	CH ₃
3-6.	F	Br	O	H	CF ₃	C ₂ H ₅	CH ₃
3-7.	H	F	O	H	CF ₃	CH ₃	CH ₃
3-8.	H	Cl	O	H	CF ₃	CH ₃	CH ₃
3-9.	H	Br	O	H	CF ₃	CH ₃	CH ₃
3-10.	F	F	O	H	CF ₃	CH ₃	CH ₃
3-11.	F	Cl	O	H	CF ₃	CH ₃	CH ₃
3-12.	F	Br	O	H	CF ₃	CH ₃	CH ₃
3-13.	H	F	O	H	CF ₃	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅
3-14.	H	Cl	O	H	CF ₃	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅
3-15.	H	Br	O	H	CF ₃	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅

3. táblázat (folytatás)

Vegyület száma	X	Y	Z ²	R ¹	R ²	R ³	R ⁶
3-16.	F	F	O	H	CF ₃	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅
3-17.	F	Cl	O	H	CF ₃	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅
3-18.	F	Br	O	H	CF ₃	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅
3-19.	H	F	O	H	CF ₃	CH ₃	C ₂ H ₅
3-20.	H	Cl	O	H	CF ₃	CH ₃	C ₂ H ₅
3-21.	H	Br	O	H	CF ₃	CH ₃	C ₂ H ₅
3-22.	F	F	O	H	CF ₃	CH ₃	C ₂ H ₅
3-23.	F	Cl	O	H	CF ₃	CH ₃	C ₂ H ₅
3-24.	F	Br	O	H	CF ₃	CH ₃	C ₂ H ₅
3-25.	H	F	O	H	CF ₃	CH ₃	CH ₂ Br
3-26.	H	F	O	H	CF ₃	CH ₃	CHBr ₂
3-27.	H	F	O	H	CF ₃	CH ₃	CBr ₃
3-28.	H	F	O	H	CF ₃	CH ₃	CHO
3-29.	H	F	O	H	CF ₃	CH ₃	CN
3-30.	H	F	O	H	CF ₃	CH ₃	COOH
3-31.	H	F	O	H	CF ₃	CH ₃	CH ₂ OH
3-32.	H	F	O	H	CF ₃	CH ₃	CH ₂ OCH ₃
3-33.	H	F	O	H	CF ₃	CH ₃	CH ₂ OC ₂ H ₅
3-34.	H	F	O	H	CF ₃	CH ₃	CH ₂ O ¹ C ₃ H ₇
3-35.	H	F	O	H	CF ₃	CH ₃	CH ₂ OCH ₂ OCH ₃
3-36.	H	F	O	H	CF ₃	CH ₃	CH ₂ OCH ₂ OC ₂ H ₅
3-37.	H	F	O	H	CF ₃	CH ₃	CH ₂ OCOCH ₃
3-38.	H	F	O	H	CF ₃	CH ₃	CH ₂ OCOC ₂ H ₅

3. táblázat (folytatás)

Vegyület száma	X	Y	Z ²	R ¹	R ²	R ³	R ⁶
3-39.	H	F	O	H	CF ₃	CH ₃	CH ₂ OCO ⁱ C ₃ H ₇
3-40.	H	F	O	H	CF ₃	CH ₃	CH ₂ OCOCH ₂ Cl
3-41.	H	F	O	H	CF ₃	CH ₃	CH ₂ OCOCCl ₃
3-42.	H	F	O	H	CF ₃	CH ₃	CH ₂ OCOCF ₃
3-43.	H	F	O	H	CF ₃	CH ₃	COOCH ₃
3-44.	H	F	O	H	CF ₃	CH ₃	COOC ₂ H ₅
3-45.	H	F	O	H	CF ₃	CH ₃	COO ⁿ C ₃ H ₇
3-46.	H	F	O	H	CF ₃	CH ₃	COO ⁿ C ₄ H ₉
3-47.	H	F	O	H	CF ₃	CH ₃	COO ⁿ C ₅ H ₁₁
3-48.	H	F	O	H	CF ₃	CH ₃	COO ⁱ C ₃ H ₇
3-49.	H	F	O	H	CF ₃	CH ₃	COCH ₃
3-50.	H	F	O	H	CF ₃	CH ₃	COC ₂ H ₅
3-51.	H	Cl	O	H	CF ₃	CH ₃	CH ₂ Br
3-52.	H	Cl	O	H	CF ₃	CH ₃	CHBr ₂
3-53.	H	Cl	O	H	CF ₃	CH ₃	CBr ₃
3-54.	H	Cl	O	H	CF ₃	CH ₃	CHO
3-55.	H	Cl	O	H	CF ₃	CH ₃	CN
3-56.	H	Cl	O	H	CF ₃	CH ₃	COOH
3-57.	H	Cl	O	H	CF ₃	CH ₃	CH ₂ OH
3-58.	H	Cl	O	H	CF ₃	CH ₃	CH ₂ OCH ₃
3-59.	H	Cl	O	H	CF ₃	CH ₃	CH ₂ OC ₂ H ₅
3-60.	H	Cl	O	H	CF ₃	CH ₃	CH ₂ O ⁱ C ₃ H ₇
3-61.	H	Cl	O	H	CF ₃	CH ₃	CH ₂ OCH ₂ OCH ₃

3. táblázat (folytatás)

Vegyület száma	X	Y	Z ²	R ¹	R ²	R ³	R ⁶
3-62.	H	Cl	O	H	CF ₃	CH ₃	CH ₂ OCH ₂ OC ₂ H ₅
3-63.	H	Cl	O	H	CF ₃	CH ₃	CH ₂ OCOCH ₃
3-64.	H	Cl	O	H	CF ₃	CH ₃	CH ₂ OCOC ₂ H ₅
3-65.	H	Cl	O	H	CF ₃	CH ₃	CH ₂ OCO ⁱ C ₃ H ₇
3-66.	H	Cl	O	H	CF ₃	CH ₃	CH ₂ OCOCH ₂ Cl
3-67.	H	Cl	O	H	CF ₃	CH ₃	CH ₂ OCOCCl ₃
3-68.	H	Cl	O	H	CF ₃	CH ₃	CH ₂ OCOCF ₃
3-69.	H	Cl	O	H	CF ₃	CH ₃	COOCH ₃
3-70.	H	Cl	O	H	CF ₃	CH ₃	COOC ₂ H ₅
3-71.	H	Cl	O	H	CF ₃	CH ₃	COO ⁿ C ₃ H ₇
3-72.	H	Cl	O	H	CF ₃	CH ₃	COO ⁿ C ₄ H ₉
3-73.	H	Cl	O	H	CF ₃	CH ₃	COO ⁿ C ₅ H ₁₁
3-74.	H	Cl	O	H	CF ₃	CH ₃	COO ⁱ C ₃ H ₇
3-75.	H	Cl	O	H	CF ₃	CH ₃	COCH ₃
3-76.	H	Cl	O	H	CF ₃	CH ₃	COC ₂ H ₅
3-77.	F	F	O	H	CF ₃	CH ₃	CH ₂ Br
3-78.	F	F	O	H	CF ₃	CH ₃	CHBr ₂
3-79.	F	F	O	H	CF ₃	CH ₃	CBr ₃
3-80.	F	F	O	H	CF ₃	CH ₃	CHO
3-81.	F	F	O	H	CF ₃	CH ₃	CN
3-82.	F	F	O	H	CF ₃	CH ₃	COOH
3-83.	F	F	O	H	CF ₃	CH ₃	CH ₂ OH

3. táblázat (folytatás)

Vegyület száma	X	Y	Z ²	R ¹	R ²	R ³	R ⁶
3-84.	F	F	O	H	CF ₃	CH ₃	CH ₂ OCH ₃
3-85.	F	F	O	H	CF ₃	CH ₃	CH ₂ OC ₂ H ₅
3-86.	F	F	O	H	CF ₃	CH ₃	CH ₂ O ¹ C ₃ H ₇
3-87.	F	F	O	H	CF ₃	CH ₃	CH ₂ OCH ₂ OCH ₃
3-88.	F	F	O	H	CF ₃	CH ₃	CH ₂ OCH ₂ OC ₂ H ₅
3-89.	F	F	O	H	CF ₃	CH ₃	CH ₂ OCOCH ₃
3-90.	F	F	O	H	CF ₃	CH ₃	CH ₂ OCOC ₂ H ₅
3-91.	F	F	O	H	CF ₃	CH ₃	CH ₂ OCO ¹ C ₃ H ₇
3-92.	F	F	O	H	CF ₃	CH ₃	CH ₂ OCOCH ₂ Cl
3-93.	F	F	O	H	CF ₃	CH ₃	CH ₂ OCOCCl ₃
3-94.	F	F	O	H	CF ₃	CH ₃	CH ₂ OCOCF ₃
3-95.	F	F	O	H	CF ₃	CH ₃	COOCH ₃
3-96.	F	F	O	H	CF ₃	CH ₃	COOC ₂ H ₅
3-97.	F	F	O	H	CF ₃	CH ₃	COO ⁿ C ₃ H ₇
3-98.	F	F	O	H	CF ₃	CH ₃	COO ⁿ C ₄ H ₉
3-99.	F	F	O	H	CF ₃	CH ₃	COO ⁿ C ₅ H ₁₁
3-100.	F	F	O	H	CF ₃	CH ₃	COO ¹ C ₃ H ₇
3-101.	F	F	O	H	CF ₃	CH ₃	COCH ₃
3-102.	F	F	O	H	CF ₃	CH ₃	COC ₂ H ₅
3-103.	F	Cl	O	H	CF ₃	CH ₃	CH ₂ Br
3-104.	F	Cl	O	H	CF ₃	CH ₃	CHBr ₂
3-105.	F	Cl	O	H	CF ₃	CH ₃	CBr ₃
3-106.	F	Cl	O	H	CF ₃	CH ₃	CHO

3. táblázat (folytatás)

Vegyület száma	X	Y	Z ²	R ¹	R ²	R ³	R ⁶
3-107.	F	Cl	O	H	CF ₃	CH ₃	CN
3-108.	F	Cl	O	H	CF ₃	CH ₃	COOH
3-109.	F	Cl	O	H	CF ₃	CH ₃	CH ₂ OH
3-110.	F	Cl	O	H	CF ₃	CH ₃	CH ₂ OCH ₃
3-111.	F	Cl	O	H	CF ₃	CH ₃	CH ₂ OC ₂ H ₅
3-112.	F	Cl	O	H	CF ₃	CH ₃	CH ₂ O ⁱ C ₃ H ₇
3-113.	F	Cl	O	H	CF ₃	CH ₃	CH ₂ OCH ₂ OCH ₃
3-114.	F	Cl	O	H	CF ₃	CH ₃	CH ₂ OCH ₂ OC ₂ H ₅
3-115.	F	Cl	O	H	CF ₃	CH ₃	CH ₂ OCOCH ₃
3-116.	F	Cl	O	H	CF ₃	CH ₃	CH ₂ OCOC ₂ H ₅
3-117.	F	Cl	O	H	CF ₃	CH ₃	CH ₂ OCO ⁱ C ₃ H ₇
3-118.	F	Cl	O	H	CF ₃	CH ₃	CH ₂ OCOCH ₂ Cl
3-119.	F	Cl	O	H	CF ₃	CH ₃	CH ₂ OCOCCl ₃
3-120.	F	Cl	O	H	CF ₃	CH ₃	CH ₂ OCOCF ₃
3-121.	F	Cl	O	H	CF ₃	CH ₃	COOCH ₃
3-122.	F	Cl	O	H	CF ₃	CH ₃	COOC ₂ H ₅
3-123.	F	Cl	O	H	CF ₃	CH ₃	COO ⁿ C ₃ H ₇
3-124.	F	Cl	O	H	CF ₃	CH ₃	COO ⁿ C ₄ H ₉
3-125.	F	Cl	O	H	CF ₃	CH ₃	COO ⁿ C ₅ H ₁₁
3-126.	F	Cl	O	H	CF ₃	CH ₃	COO ⁱ C ₃ H ₇
3-127.	F	Cl	O	H	CF ₃	CH ₃	COCH ₃
3-128.	F	Cl	O	H	CF ₃	CH ₃	COC ₂ H ₅

4. táblázat

(1d) általános képletű vegyületek

Vegyület száma	X	Y	R ¹	R ²	R ³	R ⁷	R ⁸
4-1.	H	F	H	CF ₃	C ₂ H ₅	H	CH ₃
4-2.	H	Cl	H	CF ₃	C ₂ H ₅	H	CH ₃
4-3.	H	Br	H	CF ₃	C ₂ H ₅	H	CH ₃
4-4.	H	F	H	CF ₃	C ₂ H ₅	H	CH ₂ OH
4-5.	H	Cl	H	CF ₃	C ₂ H ₅	H	CH ₂ OH
4-6.	H	Br	H	CF ₃	C ₂ H ₅	H	CH ₂ OH
4-7.	H	F	H	CF ₃	C ₂ H ₅	CH ₃	CH ₃
4-8.	H	Cl	H	CF ₃	C ₂ H ₅	CH ₃	CH ₃
4-10.	H	Br	H	CF ₃	C ₂ H ₅	CH ₃	CH ₃
4-11.	H	F	H	CF ₃	C ₂ H ₅	CH ₃	CH ₂ OH
4-12.	H	Cl	H	CF ₃	C ₂ H ₅	CH ₃	CH ₂ OH
4-13.	H	Br	H	CF ₃	C ₂ H ₅	CH ₃	CH ₂ OH
4-14.	F	F	H	CF ₃	C ₂ H ₅	H	CH ₃
4-15.	F	Cl	H	CF ₃	C ₂ H ₅	H	CH ₃
4-16.	F	Br	H	CF ₃	C ₂ H ₅	H	CH ₃

4. táblázat (folytatás)

Vegyület száma	X	Y	R ¹	R ²	R ³	R ⁷	R ⁸
4-17.	F	F	H	CF ₃	C ₂ H ₅	H	CH ₃ OH
4-18.	F	Cl	H	CF ₃	C ₂ H ₅	H	CH ₂ OH
4-19.	F	Br	H	CF ₃	C ₂ H ₅	H	CH ₂ OH
4-20.	F	F	H	CF ₃	C ₂ H ₅	CH ₃	CH ₃
4-21.	F	Cl	H	CF ₃	C ₂ H ₅	CH ₃	CH ₃
4-22.	F	Br	H	CF ₃	C ₂ H ₅	CH ₃	CH ₃
4-23.	F	F	H	CF ₃	C ₂ H ₅	CH ₃	CH ₂ OH
4-24.	F	Cl	H	CF ₃	C ₂ H ₅	CH ₃	CH ₂ OH
4-25.	F	Br	H	CF ₃	C ₂ H ₅	CH ₃	CH ₂ OH
4-26.	H	Cl	H	CF ₃	CH ₃	H	CH ₂ Cl
4-27.	H	Cl	H	CF ₃	CH ₃	H	CH ₂ Br
4-28.	H	Cl	H	CF ₃	CH ₃	H	CH ₂ OCH ₃
4-29.	H	Cl	H	CF ₃	CH ₃	H	CH ₂ OC ₂ H ₅
4-30.	H	Cl	H	CF ₃	CH ₃	H	CH ₂ OCH ₂ OCH ₃
4-31.	H	Cl	H	CF ₃	CH ₃	H	CH ₂ OCH ₂ OC ₂ H ₅
4-32.	H	Cl	H	CF ₃	CH ₃	H	CH ₂ OCOCH ₃
4-33.	H	Cl	H	CF ₃	CH ₃	H	CH ₂ OCOC ₂ H ₅
4-34.	H	Cl	H	CF ₃	CH ₃	H	CH ₂ OCO ¹ C ₃ H ₇
4-35.	H	Cl	H	CF ₃	CH ₃	H	CH ₂ OCOCH ₂ Cl
4-36.	H	Cl	H	CF ₃	CH ₃	H	CH ₂ OCOCCl ₃
4-37.	H	Cl	H	CF ₃	CH ₃	H	CH ₂ OCOCF ₃
4-38.	H	Cl	H	CF ₃	CH ₃	H	COOH
4-39.	H	Cl	H	CF ₃	CH ₃	H	COOCH ₃

4. táblázat (folytatás)

Vegyület száma	X	Y	R ¹	R ²	R ³	R ⁷	R ⁸
4-40.	H	Cl	H	CF ₃	CH ₃	H	COOC ₂ H ₅
4-41.	H	Cl	H	CF ₃	CH ₃	H	COO ⁿ C ₃ H ₇
4-42.	H	Cl	H	CF ₃	CH ₃	H	COO ⁿ C ₄ H ₉
4-43.	H	Cl	H	CF ₃	CH ₃	H	COO ⁿ C ₅ H ₁₁
4-44.	H	Cl	H	CF ₃	CH ₃	H	COO ⁱ C ₃ H ₇
4-45.	H	Cl	H	CF ₃	CH ₃	H	COO ^c C ₅ H ₉
4-46.	H	Cl	H	CF ₃	CH ₃	H	COO ^c C ₆ H ₁₁
4-47.	H	Cl	H	CF ₃	CH ₃	H	COOCH ₂ CH=CH ₂
4-48.	H	Cl	H	CF ₃	CH ₃	H	COOCH ₂ C≡CH
4-49.	H	Cl	H	CF ₃	CH ₃	H	CONH ₂
4-50.	H	Cl	H	CF ₃	CH ₃	H	CONHCH ₃
4-51.	H	Cl	H	CF ₃	CH ₃	H	CONHC ₂ H ₅
4-52.	H	Cl	H	CF ₃	CH ₃	H	CON(CH ₃) ₂
4-53.	H	Cl	H	CF ₃	CH ₃	H	CON(C ₂ H ₅) ₂
4-54.	F	Cl	H	CF ₃	CH ₃	H	CH ₂ Cl
4-55.	F	Cl	H	CF ₃	CH ₃	H	CH ₂ Br
4-56.	F	Cl	H	CF ₃	CH ₃	H	CH ₂ OCH ₃
4-57.	F	Cl	H	CF ₃	CH ₃	H	CH ₂ OC ₂ H ₅
4-58.	F	Cl	H	CF ₃	CH ₃	H	CH ₂ OCH ₂ OCH ₃
4-59.	F	Cl	H	CF ₃	CH ₃	H	CH ₂ OCH ₂ OC ₂ H ₅
4-60.	F	Cl	H	CF ₃	CH ₃	H	CH ₂ OCOCH ₃
4-61.	F	Cl	H	CF ₃	CH ₃	H	CH ₂ OCOC ₂ H ₅
4-62.	F	Cl	H	CF ₃	CH ₃	H	CH ₂ OCO ⁱ C ₃ H ₇

4. táblázat (folytatás)

Vegyület száma	X	Y	R ¹	R ²	R ³	R ⁷	R ⁸
4-63.	F	Cl	H	CF ₃	CH ₃	H	CH ₂ OCOCH ₂ Cl
4-64.	F	Cl	H	CF ₃	CH ₃	H	CH ₂ OCOCCl ₃
4-65.	F	Cl	H	CF ₃	CH ₃	H	CH ₂ OCOCF ₃
4-66.	F	Cl	H	CF ₃	CH ₃	H	COOH
4-67.	F	Cl	H	CF ₃	CH ₃	H	COOCH ₃
4-68.	F	Cl	H	CF ₃	CH ₃	H	COOC ₂ H ₅
4-69.	F	Cl	H	CF ₃	CH ₃	H	COO ⁿ C ₃ H ₇
4-70.	F	Cl	H	CF ₃	CH ₃	H	COO ⁿ C ₄ H ₉
4-71.	F	Cl	H	CF ₃	CH ₃	H	COO ⁿ C ₅ H ₁₁
4-72.	F	Cl	H	CF ₃	CH ₃	H	COO ⁱ C ₃ H ₇
4-73.	F	Cl	H	CF ₃	CH ₃	H	COO ^c C ₅ H ₉
4-74.	F	Cl	H	CF ₃	CH ₃	H	COO ^c C ₆ H ₁₁
4-75.	F	Cl	H	CF ₃	CH ₃	H	COOCH ₂ CH=CH ₂
4-76.	F	Cl	H	CF ₃	CH ₃	H	COOCH ₂ C≡CH
4-77.	F	Cl	H	CF ₃	CH ₃	H	CONH ₂
4-78.	F	Cl	H	CF ₃	CH ₃	H	CONHCH ₃
4-79.	F	Cl	H	CF ₃	CH ₃	H	CONHC ₂ H ₅
4-80.	F	Cl	H	CF ₃	CH ₃	H	CON(CH ₃) ₂
4-81.	F	Cl	H	CF ₃	CH ₃	H	CON(C ₂ H ₅) ₂
4-82.	H	Cl	H	CF ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₂ Cl
4-83.	H	Cl	H	CF ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₂ Br
4-84.	H	Cl	H	CF ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₂ OCH ₃

4. táblázat (folytatás)

Vegyület száma	X	Y	R ¹	R ²	R ³	R ⁷	R ⁸
4-85.	H	Cl	H	CF ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₂ OC ₂ H ₅
4-86.	H	Cl	H	CF ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₂ OCH ₂ OCH ₃
4-87.	H	Cl	H	CF ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₂ OCH ₂ OC ₂ H ₅
4-88.	H	Cl	H	CF ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₂ OCOCH ₃
4-89.	H	Cl	H	CF ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₂ OCOC ₂ H ₅
4-90.	H	Cl	H	CF ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₂ OCO ⁱ C ₃ H ₇
4-91.	H	Cl	H	CF ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₂ OCOCH ₂ Cl
4-92.	H	Cl	H	CF ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₂ OCOCCl ₃
4-93.	H	Cl	H	CF ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₂ OCOCF ₃
4-94.	H	Cl	H	CF ₃	CH ₃	CH ₃	COOH
4-95.	H	Cl	H	CF ₃	CH ₃	CH ₃	COOCH ₃
4-96.	H	Cl	H	CF ₃	CH ₃	CH ₃	COOC ₂ H ₅
4-97.	H	Cl	H	CF ₃	CH ₃	CH ₃	COO ⁿ C ₃ H ₇
4-98.	H	Cl	H	CF ₃	CH ₃	CH ₃	COO ⁿ C ₄ H ₉
4-99.	H	Cl	H	CF ₃	CH ₃	CH ₃	COO ⁿ C ₅ H ₁₁
4-100.	H	Cl	H	CF ₃	CH ₃	CH ₃	COO ⁱ C ₃ H ₇
4-101.	H	Cl	H	CF ₃	CH ₃	CH ₃	COO ^c C ₅ H ₉
4-102.	H	Cl	H	CF ₃	CH ₃	CH ₃	COO ^c C ₆ H ₁₁
4-103.	H	Cl	H	CF ₃	CH ₃	CH ₃	COOCH ₂ CH=CH ₂
4-104.	H	Cl	H	CF ₃	CH ₃	CH ₃	COOCH ₂ C≡CH
4-105.	H	Cl	H	CF ₃	CH ₃	CH ₃	CONH ₂
4-106.	H	Cl	H	CF ₃	CH ₃	CH ₃	CONHCH ₃
4-107.	H	Cl	H	CF ₃	CH ₃	CH ₃	CONHC ₂ H ₅

4. táblázat (folytatás)

Vegyület száma	X	Y	R ¹	R ²	R ³	R ⁷	R ⁸
4-108.	H	Cl	H	CF ₃	CH ₃	CH ₃	CON(CH ₃) ₂
4-109.	H	Cl	H	CF ₃	CH ₃	CH ₃	CON(C ₂ H ₅) ₂
4-110.	F	Cl	H	CF ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₂ Cl
4-111.	F	Cl	H	CF ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₂ Br
4-112.	F	Cl	H	CF ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₂ OCH ₃
4-113.	F	Cl	H	CF ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₂ OC ₂ H ₅
4-114.	F	Cl	H	CF ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₂ OCH ₂ OCH ₃
4-115.	F	Cl	H	CF ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₂ OCH ₂ OC ₂ H ₅
4-116.	F	Cl	H	CF ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₂ OCOCH ₃
4-117.	F	Cl	H	CF ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₂ OCOC ₂ H ₅
4-118.	F	Cl	H	CF ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₂ OCO ⁱ C ₃ H ₇
4-119.	F	Cl	H	CF ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₂ OCOCH ₂ Cl
4-120.	F	Cl	H	CF ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₂ OCOCCl ₃
4-121.	F	Cl	H	CF ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₂ OCOCF ₃
4-122.	F	Cl	H	CF ₃	CH ₃	CH ₃	COOH
4-123.	F	Cl	H	CF ₃	CH ₃	CH ₃	COOCH ₃
4-124.	F	Cl	H	CF ₃	CH ₃	CH ₃	COOC ₂ H ₅
4-125.	F	Cl	H	CF ₃	CH ₃	CH ₃	COO ⁿ C ₃ H ₇
4-126.	F	Cl	H	CF ₃	CH ₃	CH ₃	COO ⁿ C ₄ H ₉
4-127.	F	Cl	H	CF ₃	CH ₃	CH ₃	COO ⁿ C ₅ H ₁₁
4-128.	F	Cl	H	CF ₃	CH ₃	CH ₃	COO ⁱ C ₃ H ₇
4-129.	F	Cl	H	CF ₃	CH ₃	CH ₃	COO ^c C ₅ H ₉
4-130.	F	Cl	H	CF ₃	CH ₃	CH ₃	COO ^c C ₆ H ₁₁

4. táblázat (folytatás)

Vegyület száma	X	Y	R ¹	R ²	R ³	R ⁷	R ⁸
4-131.	F	Cl	H	CF ₃	CH ₃	CH ₃	COOCH ₂ CH=CH ₂
4-132.	F	Cl	H	CF ₃	CH ₃	CH ₃	COOCH ₂ C≡CH
4-133.	F	Cl	H	CF ₃	CH ₃	CH ₃	CONH ₂
4-134.	F	Cl	H	CF ₃	CH ₃	CH ₃	CONHCH ₃
4-135.	F	Cl	H	CF ₃	CH ₃	CH ₃	CONHC ₂ H ₅
4-136.	F	Cl	H	CF ₃	CH ₃	CH ₃	CON(CH ₃) ₂
4-137.	F	Cl	H	CF ₃	CH ₃	CH ₃	CON(C ₂ H ₅) ₂

5. táblázat

(1e) általános képletű vegyületek

Vegyület száma	X	R ¹	R ²	R ³	R ⁵
5-1.	H	H	CF ₃	CH ₃	CH ₃
5-2.	H	H	CF ₃	CH ₃	C ₂ H ₅
5-3.	H	H	CF ₃	CH ₃	¹ C ₃ H ₇
5-4.	H	H	CF ₃	CH ₃	ⁿ C ₃ H ₇
5-5.	H	H	CF ₃	CH ₃	¹ C ₄ H ₉
5-6.	H	H	CF ₃	CH ₃	CH ₂ CH=CH ₂
5-7.	H	H	CF ₃	CH ₃	CH(CH ₃)CH=CH ₂
5-8.	H	H	CF ₃	CH ₃	CH ₂ C≡CH
5-9.	H	H	CF ₃	CH ₃	CH(CH ₃)C≡CH
5-10.	F	H	CF ₃	CH ₃	CH ₃
5-11.	F	H	CF ₃	CH ₃	C ₂ H ₅
5-12.	F	H	CF ₃	CH ₃	¹ C ₃ H ₇
5-13.	F	H	CF ₃	CH ₃	¹ C ₄ H ₉
5-14.	F	H	CF ₃	CH ₃	CH ₂ CH=CH ₂
5-15.	F	H	CF ₃	CH ₃	CH(CH ₃)CH=CH ₂

5. táblázat (folytatás)

Vegyület száma	X	R ¹	R ²	R ³	R ⁵
5-16.	F	H	CF ₃	CH ₃	CH ₂ C ≡ CH
5-17.	F	H	CF ₃	CH ₃	CH(CH ₃) C ≡ CH

A továbbiakban a találmány szerinti vegyületek intermedierjeként szolgáló [2] általános képletű vegyületek előállítását mutatjuk be.

1. intermedier előállítási példa

121 g nátrium-karbonát 400 ml vízben felvett oldatához kevertetés közben 77,1 g 1,1-dibróm-3,3,3-trifluor-acetont csepegtetünk olyan sebességgel, hogy a reakcióelegy hőmérséklete 55 °C alatt maradjon. Az adagolás befejezése után a reakcióelegyet 30 percen keresztül szobahőmérsékleten kevertetjük, majd 500 ml vízzel hígítjuk, és 40 g 2-amino-2-(2,4-difluor-fenil)-acetamidot adunk hozzá, és 2 órán keresztül 60 °C hőmérsékleten reagáltatjuk. A reakció befejeződése után a reakcióelegyet 10 °C vagy ennél alacsonyabb hőmérsékletre hűtjük, 80 ml koncentrált sósavval megsavanyítjuk, és etil-acetáttal extraháljuk. A szerves fázist vízzel, majd telített nátrium-klorid-oldattal mossuk, vízmentes magnézium-szulfáton szárítjuk, és bepároljuk. A maradékot szilikagélen hexán/etil-acetát 4 : 1 eleggyel eluálva oszlopkromatográfiásan tisztítjuk. Így 23,3 g (kitermelés: 39 %) 3-(2,4-difluor-fenil)-6-trifluor-metil-2-oxo-1,2-dihidropirazint (1-1004. vegyület, olvadáspont: 178,9 °C) kapunk. Az eluálást a fenti oldószerkeleggyel folytatva 13,2 g konfigurációs izomert, vagyis 3-(2,4-difluor-fenil)-5-trifluor-metil-2-oxo-1,2-dihidropirazint (olvadáspont: 164,6 °C) kapunk.

2. intermedier előállítási példa

17,2 g nátrium-karbonát 61 ml vízben felvett oldatához kevertetés közben 10,9 g 1,1-dibróm-3,3,3-trifluor-acetont csepegtetünk olyan sebességgel, hogy a reakcióelegy hőmérséklete 55 °C alatt maradjon. Az adagolás befejezése után az elegyet 30 percen keresztül szobahőmérsékleten kevertetjük, majd 84 ml vízzel hígítjuk, és 7,10 g 2-amino-2-(4-klór-2-fluor-5-metoxi-fenil)-acetamidot adunk hozzá, és 2 órán keresztül 60 °C hőmérsékleten reagáltatjuk. A reakció befejeződése után a reakcióelegyet 10 °C vagy ennél kisebb hőmérsékletre hűtjük, 9,2 ml koncentrált sósavval megsavanyítjuk, és



etil-acetáttal extraháljuk. A szerves fázist vízzel, majd telített nátrium-klorid-oldattal mossuk, vízmentes magnézium-szulfáton szárítjuk, és bepároljuk. A maradékot szilikagélen hexán/etil-acetát 4 : 1 eleggyel eluálva oszlopkromatográfiásan tisztítjuk. Így 3,61 g (kitermelés: 37 %) 3-(4-klór-2-fluor-5-metoxi-fenil)-6-trifluor-metil-2-oxo-1,2-dihidropirazint (1-1008. vegyület) kapunk.

¹H-NMR spektrum (CDCl₃/TMS, 250 MHz, δ ppm): 3,93 (s, 3H), 7,18 (d, 1H, J = 6,1 Hz), 7,27 (d, 1H, J = 10,0 Hz), 8,55 (s, 1H).

3. intermediér előállítás példája

28 g nátrium-karbonát 100 ml vízben felvett oldatához kevertetés közben 18,0 g 1,1-dibróm-3,3,3-trifluor-acetont csepegtetünk olyan sebességgel, hogy a reakcióelegy hőmérséklete 55 °C alatt maradjon. Az adagolás befejezése után az elegyet 30 percen keresztül szobahőmérsékleten kevertetjük, majd 125 ml vízzel hígítjuk, és 8,4 g 2-amino-2-(4-fluor-fenil)-acetamidot adunk hozzá, és 2 órán keresztül 60 °C hőmérsékleten reagáltatjuk. A reakció befejeződése után a reakcióelegyet 10 °C vagy ennél alacsonyabb hőmérsékletre hűtjük, 20 ml koncentrált sósavval megsavanyítjuk, és etil-acetáttal extraháljuk. A szerves fázist vízzel, majd telített nátrium-klorid-oldattal mossuk, vízmentes magnézium-szulfáton szárítjuk, és bepároljuk. A maradékot szilikagélen hexán/etil-acetát 5 : 1 eleggyel eluálva oszlopkromatográfiásan tisztítjuk. Így 2,45 g (kitermelés: 19 %) 3-(4-fluor-fenil)-6-trifluor-metil-2-oxo-1,2-dihidropirazint (1-1001. vegyület) kapunk.

¹H-NMR spektrum (CDCl₃/TMS, 300 MHz, δ ppm): 7,1-7,3 (m, 2H), 8,3-8,4 (m, 2H), 8,48 (s, 1H).

4. intermediér előállítás példája

35,5 g nátrium-karbonát 120 ml vízben felvett oldatához kevertetés közben 22,7 g 1,1-dibróm-3,3,3-trifluor-acetont csepegtetünk olyan sebességgel, hogy a reakcióelegy hőmérséklete 55 °C alatt maradjon. Az adagolás

befejezése után az elegyet 30 percen keresztül szobahőmérsékleten kevertetjük, majd 150 ml vízzel hígítjuk, és 12,8 g 2-amino-2-(4-klór-2-fluor-fenil)-acetamidot adunk hozzá, és 2 órán keresztül 60 °C hőmérsékleten reagáltatjuk. A reakció befejeződése után a reakcióelegyet 10 °C vagy ennél alacsonyabb hőmérsékletre hűtjük, 20 ml koncentrált sósavval megsavanyítjuk, és etil-acetáttal extraháljuk. A szerves fázist vízzel, majd telített nátrium-klorid-oldattal mossuk, vízmentes magnézium-szulfáton szárítjuk, és bepároljuk. A maradékot szilikagélen hexán/etil-acetát 4 : 1 eleggyel eluálva oszlopkromatográfiásan tisztítjuk. Így 5,83 g (kitermelés: 32 %) 3-(4-klór-2-fluor-fenil)-6-trifluor-metil-2-oxo-1,2-dihidropirazint (1-1005. vegyület, olvadáspont: 83,2 °C) kapunk. Az eluálást a fenti eleggyel folytatva 4,32 g konfigurációs izomert, vagyis 3-(4-klór-2-fluor-fenil)-5-trifluor-metil-2-oxo-1,2-dihidropirazint kapunk.

5. intermedier előállítási példa

7,9 g nátrium-karbonát 31 ml vízben felvett oldatához kevertetés közben 5,1 g 1,1-dibróm-3,3,3-trifluor-acetont csepegtetünk olyan sebességgel, hogy a reakcióelegy hőmérséklete 55 °C alatt maradjon. Az adagolás befejezése után az elegyet 30 percen keresztül szobahőmérsékleten kevertetjük, majd 39 ml vízzel hígítjuk, és 3,1 g 2-amino-2-(2,4-diklór-fenil)-acetamidot adunk hozzá, és 2 órán keresztül 60 °C hőmérsékleten reagáltatjuk. A reakció befejeződése után a reakcióelegyet 10 °C vagy ennél alacsonyabb hőmérsékletre hűtjük, 5,4 ml koncentrált sósavval megsavanyítjuk, és etil-acetáttal extraháljuk. A szerves fázist vízzel, majd telített nátrium-klorid-oldattal mossuk, vízmentes magnézium-szulfáton szárítjuk, és bepároljuk. A maradékot szilikagélen hexán/etil-acetát 4 : 1 eleggyel eluálva oszlopkromatográfiásan tisztítjuk. Így 1,54 g (kitermelés: 35 %) 3-(2,4-diklór-fenil)-6-trifluor-metil-2-oxo-1,2-dihidropirazint (1-1007. vegyület, olvadáspont: 192,8 °C) kapunk. Az eluálást a fenti eleggyel tovább folytatva 0,53 g konfigurációs

izomert, vagyis 3-(2,4-diklór-fenil)-5-trifluor-metil-2-oxo-1,2-dihidropirazint (olvadáspont: 131,7 °C) kapunk.

6. intermedier előállítási példa

16,7 g nátrium-karbonát 60 ml vízben felvett oldatához kevertetés közben 10,6 g 1,1-dibróm-3,3,3-trifluor-acetont csepegtetünk olyan sebességgel, hogy a reakcióelegy hőmérséklete 55 °C alatt maradjon. Az adagolás befejezése után az elegyet 30 percen keresztül szobahőmérsékleten kevertetjük, majd 80 ml vízzel hígítjuk, és 7,42 g 2-amino-2-(2,4-diklór-5-metoxi-fenil)-acetamidot adunk hozzá, és 2 órán keresztül 60 °C hőmérsékleten reagáltatjuk. A reakció befejeződése után a reakcióelegyet 10 °C vagy ennél alacsonyabb hőmérsékletre hűtjük, 9,0 ml koncentrált sósavval megsavanyítjuk, és etil-acetáttal extraháljuk. A szerves fázist vízzel, majd telített nátrium-klorid-oldattal mossuk, vízmentes magnézium-szulfáton szárítjuk, és bepároljuk. A maradékot szilikagélen hexán/etil-acetát 4 : 1 eleggyel eluálva oszlopkromatográfiásan tisztítjuk. Így 2,2 g (kitermelés: 22 %) 3-(2,4-diklór-5-metoxi-fenil)-6-trifluor-metil-2-oxo-1,2-dihidropirazint (1-1009. vegyület) kapunk.

¹H-NMR spektrum (CDCl₃/TMS, 300 MHz, δ ppm): 3,90 (s, 3H), 7,03 (s, 1H), 7,53 (s, 1H), 8,58 (s, 1H).

A továbbiakban a találmány szerinti vegyületek előállítása során kiindulási anyagként alkalmazott [24] általános képletű vegyületek előállítását mutatjuk be.

1. referenciapélda

(1) 20,7 g nátrium-cianid, 31 ml koncentrált vizes ammónia (28 %), 27 ml víz és 30,8 g ammónium-klorid elegyét 1 órán keresztül 15 °C hőmérsékleten kevertetjük, majd ezen a hőmérsékleten 20 ml éterrel hígítjuk. Ezután 2,5-4 °C hőmérsékletre hűtjük, és 50 g 2,4-difluor-benzaldehidet adunk hozzá. Ezután -0,5 °C és +1 °C közötti hőmérsékleten ammóniagázt veze-



tünk a reakcióelegybe 3 órán keresztül, majd 2 órán keresztül ezen a hőmérsékleten és egy éjszakán keresztül szobahőmérsékleten kevertetjük. A reakció befejeződése után a reakcióelegyet éterrel extraháljuk, és a szerves fázist vízzel, majd telített nátrium-klorid-oldattal mossuk, vízmentes magnézium-szulfáton szárítjuk, és bepároljuk. A kivált terméket átkristályosítva 47,1 g (kitermelés: 80 %) 2-amino-2-(2,4-difluor-fenil)-acetonitrilt kapunk, olvadáspont: 52,0 °C.

(2) 51 g koncentrált kénsavat adunk 2,67 g vízhez, és az elegyhez jeges hűtés mellett 40 g 2-amino-2-(2,4-difluor-fenil)-acetonitrilt adunk, és 3 órán keresztül 50-60 °C hőmérsékleten kevertetjük. A reakció befejeződése után a reakcióelegyet 250 ml koncentrált vizes ammóniára öntjük jeges hűtés mellett olyan sebességgel, hogy a reakcióelegy hőmérséklete 20 °C alatt maradjon. A kivált kristályokat szűrjük, és a szűrletet etil-acetáttal extraháljuk. A szerves fázist telített nátrium-klorid-oldattal mossuk, vízmentes magnézium-szulfáton szárítjuk, és bepároljuk. A maradékot a korábban szűrt kristályokkal egyesítjük, és átkristályosítjuk. Így 27,2 g (kitermelés: 61 %) 2-amino-2-(2,4-difluor-fenil)-acetamidot kapunk, olvadáspont: 142,9 °C.

2. referenciapélda

(1) 39 g koncentrált kénsav és 149 ml víz elegyéhez 34,2 g 4-klór-2-fluor-5-metoxi-anilin 30 ml dietil-éterben felvett oldatát csepegtetjük szobahőmérsékleten, és 50 percen keresztül 40-50 °C hőmérsékleten kevertetjük. A dietil-étert ezen a hőmérsékleten ledesztilláljuk, és a reakcióelegyet 0 °C hőmérsékletre hűtjük, majd 14,8 g nátrium-nitrit 33 ml vízben felvett oldatát adjuk hozzá olyan sebességgel, hogy a reakcióelegy hőmérséklete 10 °C alatt maradjon. Ezután ezen a hőmérsékleten celitágyon szűrjük, és a szűrletet 64,7 g kálium-jodid 100 ml vízben felvett oldatához csepegtetjük olyan sebességgel, hogy a reakcióelegy hőmérséklete 10 °C alatt maradjon. Ezzel egyidejűleg 100 ml hexánnal és 100 ml dietil-éterrel hígítjuk, és 2 órán ke-

resztül ezen a hőmérsékleten kevertetjük. A reakció befejeződése után a reakcióelegyet dietil-éterrel extraháljuk. A szerves fázist telített nátrium-tioszulfát-oldattal mossuk, vízmentes magnézium-szulfáton szárítjuk, és bepároljuk. A maradékot szilikagélen oszlopkromatográfiásan tisztítva 25,7 g (kitermelés: 47 %) 2-klór-4-fluor-5-jód-1-metoxi-benzolt kapunk.

¹H-NMR spektrum (CDCl₃/TMS, 250 MHz, δ ppm): 3,88 (s, 3H), 7,12 (d, 1H, $J = 7,2$ Hz), 7,22 (d, 1H, $J = 5,4$ Hz).

(2) 36,3 g 2-klór-4-fluor-5-jód-1-metoxi-benzol, 12,9 g nátrium-formiát, 1,78 g diklór-bisz(trifenil-foszfin)-palládium és 113 ml N,N-dimetil-formamid elegyét 12 órán keresztül 90-100 °C hőmérsékleten kevertetjük szén-monoxid bevezetése mellett. A reakció befejeződése után a reakcióelegyet szobahőmérsékletre hűtjük, hígított sósavval elegyítjük, és etil-acetáttal extraháljuk. A szerves fázist telített nátrium-klorid-oldattal mossuk, vízmentes magnézium-szulfáton szárítjuk, és bepároljuk. A maradékot szilikagélen oszlopkromatográfiásan tisztítva 7,09 g (kitermelés: 30 %) 4-klór-2-fluor-5-metoxi-benzaldehydet kapunk.

¹H-NMR spektrum (CDCl₃/TMS, 250 MHz, δ ppm): 3,94 (s, 3H), 7,27 (d, 1H, $J = 9,4$ Hz), 7,35 (d, 1H, $J = 5,9$ Hz), 10,30 (s, 1H).

(3) 4,4 g nátrium-cianid, 6,6 ml koncentrált vizes ammónia (28 %), 5,3 ml víz és 6,6 g ammónium-klorid elegyét 1 órán keresztül 15 °C hőmérsékleten kevertetjük, majd ezen a hőmérsékleten 4,3 ml éterrel hígítjuk. A reakcióelegyet 2,5-4 °C hőmérsékletre hűtjük, és ezen a hőmérsékleten 14,2 g 4-klór-2-fluor-5-metoxi-benzaldehyd 13,1 ml metanolban felvett oldatát adjuk hozzá. Ezután 3 órán keresztül -0,5 °C és +1 °C közötti hőmérsékleten ammóniagázt vezetünk a reakcióelegybe, majd 2 órán keresztül ezen a hőmérsékleten, és egy éjszakán keresztül szobahőmérsékleten kevertetjük. A reakció befejeződése után a reakcióelegyet éterrel extraháljuk, és a szerves fázist vízzel, majd telített nátrium-klorid-oldattal mossuk, vízmentes

magnézium-szulfáton szárítjuk, és bepároljuk. A csapadékot átkristályosítva 15,3 g (kitermelés: 95 %) 2-amino-2-(4-klór-2-fluor-5-metoxi)-acetonitrilt kapunk.

¹H-NMR spektrum (CDCl₃/TMS, 300 MHz, δ ppm): 3,9-2,1 (széles, 2H), 3,93 (s, 3H), 5,10 (t, 1H, $J = 6,7$ Hz), 7,09 (d, 1H, $J = 6,5$ Hz), 7,20 (d, 1H, $J = 9,3$ Hz).

(4) 3,6 g koncentrált kénsavat adunk 0,33 g vízhez, majd jeges hűtés közben 3,6 g 2-amino-2-(4-klór-2-fluor-5-metoxi-fenil)-acetonitrilt adunk hozzá, és 3 órán keresztül 50-60 °C hőmérsékleten kevertetjük. A reakció befejeződése után a reakcióelegyet 15 ml koncentrált vizes ammóniára öntjük jeges hűtés mellett olyan sebességgel, hogy a reakcióelegy hőmérséklete 20 °C alatt maradjon. A kivált kristályokat szűrjük, és a szűrletet etil-acetáttal extraháljuk. A szerves fázist telített nátrium-klorid-oldattal mossuk, vízmentes magnézium-szulfáton szárítjuk, és bepároljuk. A maradékot egyesítjük a szűrt kristályokkal és átkristályosítjuk. Így 2,45 g (kitermelés: 68 %) 2-amino-2-(4-klór-2-fluor-5-metoxi-fenil)-acetamidot kapunk, olvadáspont: 161,7 °C.

3. referenciapélda

(1) 9,5 g nátrium-cianid, 14,1 ml koncentrált vizes ammónia (28 %), 10,6 ml víz és 14,1 g ammónium-klorid elegyét 1 órán keresztül 15 °C hőmérsékleten kevertetjük, majd ezen a hőmérsékleten 20 ml éterrel hígítjuk. Ezután 2,5-4 °C hőmérsékletre hűtjük, és ezen a hőmérsékleten 20 g 4-fluor-benzaldehidet adunk hozzá. Ezután -0,5 °C és +1 °C közötti hőmérsékleten 3 órán keresztül ammóniagázt vezetünk a reakcióelegybe, majd 2 órán keresztül ezen a hőmérsékleten, és egy éjszakán keresztül szobahőmérsékleten kevertetjük. A reakció befejeződése után a reakcióelegyet éterrel extraháljuk, és a szerves fázist vízzel, majd telített nátrium-klorid-oldattal mossuk, vízmentes magnézium-szulfáton szárítjuk, és bepároljuk. A csapadékot át-

kristályosítva 20 g (kitermelés: 83 %) 2-amino-2-(4-fluor-fenil)-acetonitrilt kapunk, olvadáspont: 77,9 °C.

(2) 30 g koncentrált kénsavat adunk 1,45 g vízhez, majd jeges hűtés közben 20 g 2-amino-2-(4-fluor-fenil)-acetonitrilt adunk hozzá, és 3 órán keresztül 50-60 °C hőmérsékleten kevertetjük. A reakció befejeződése után a reakcióelegyet 200 ml koncentrált vizes ammóniára öntjük jeges hűtés közben olyan sebességgel, hogy a reakcióelegy hőmérséklete 20 °C alatt maradjon. A kivált kristályokat szűrjük, és a szűrletet etil-acetáttal extraháljuk. A szerves fázist telített nátrium-klorid-oldattal mossuk, vízmentes magnézium-szulfáton szárítjuk, és bepároljuk. A maradékot kombináljuk a korábban szűrt kristályokkal, és átkristályosítjuk. Így 8,4 g (kitermelés: 38 %) 2-amino-2-(4-fluor-fenil)-acetamidot kapunk.

4. referenciapélda

(1) 18,5 g nátrium-cianid, 23 ml koncentrált vizes ammónia (28 %), 24 ml víz és 27,6 g ammónium-klorid elegyét 1 órán keresztül 15 °C hőmérsékleten kevertetjük, majd ezen a hőmérsékleten 18 ml éterrel hígítjuk. A reakcióelegyet 2,5-4 °C hőmérsékletre hűtjük, és ezen a hőmérsékleten 50 g 4-klór-2-fluor-benzaldehidet adunk hozzá. Ezután 3 órán keresztül -0,5 °C és +1 °C közötti hőmérsékleten ammóniagázt vezetünk az elegybe, végül 2 órán keresztül ezen a hőmérsékleten és egy éjszakán keresztül szobahőmérsékleten kevertetjük. A reakció befejeződése után a reakcióelegyet éterrel extraháljuk, és a szerves fázist vízzel, majd telített nátrium-klorid-oldattal mossuk, vízmentes magnézium-szulfáton szárítjuk, és bepároljuk. A maradékot szilikagélen oszlopkromatográfiásan tisztítva 32,9 g (kitermelés: 57 %) 2-amino-2-(4-klór-2-fluor-fenil)-acetonitrilt kapunk.

¹H-NMR spektrum (CDCl₃/TMS, 250 MHz, δ ppm): 1,5-1,7 (széles, 1H), 1,9-2,1 (széles, 1H), 5,0-5,1 (széles, 1H), 7,16 (d, 1H, J = 10,2 Hz), 7,22 (dd, 1H, J = 8,2 Hz, 2,7 Hz), 7,51 (dd, 1H, J = 8,2 Hz, 8,0 Hz).

(2) 20 g koncentrált kénsavat adunk 1,03 g vízhez, és az elegyhez 17 g 2-amino-2-(4-klór-2-fluor-fenil)-acetonitrilt adunk jeges hűtés közben, majd 3 órán keresztül 50-60 °C hőmérsékleten kevertetjük. A reakció befejeződése után a reakcióelegyet 100 ml koncentrált vizes ammóniára öntjük jeges hűtés közben olyan sebességgel, hogy a reakcióelegy hőmérséklete 20 °C alatt maradjon. A kivált kristályokat szűrjük, és a szűrletet etil-acetáttal extraháljuk. A szerves fázist telített nátrium-klorid-oldattal mossuk, vízmentes magnézium-szulfáton szárítjuk, és bepároljuk. A maradékot egyesítjük a korábban szűrt kristályokkal, és átkristályosítjuk. Így 15,3 g (kitermelés: 82 %) 2-amino-2-(4-klór-2-fluor-fenil)-acetamidot kapunk.

¹H-NMR spektrum (CDCl₃/TMS, 250 MHz, δ ppm): 1,7-2,0 (széles, 2H), 4,70 (s, 1H), 5,8-6,0 (széles, 1H), 6,9-7,1 (széles, 1H), 7,10 (d, 1H, J = 10,2 Hz), 7,15 (dd, 1H, J = 6,5 Hz, 2,2 Hz), 7,31 (dd, 1H, J = 8,6 Hz, 6,5 Hz).

5. referenciapélda

(1) 33,6 g nátrium-cianid, 50 ml koncentrált vizes ammónia (28 %), 50 ml víz és 50,1 g ammónium-klorid elegyét 1 órán keresztül 15 °C hőmérsékleten kevertetjük, majd ezen a hőmérsékleten 33 ml éterrel hígítjuk. Ezután 2,5-4 °C hőmérsékletre hűtjük, és ezen a hőmérsékleten 100 g 2,4-diklór-benzaldehidet adunk hozzá. Ezután 3 órán keresztül -0,5 °C és +1 °C közötti hőmérsékleten ammóniagázt vezetünk az elegybe, majd 2 órán keresztül ezen a hőmérsékleten és egy éjszakán keresztül szobahőmérsékleten kevertetjük. A reakció befejeződése után a reakcióelegyet éterrel extraháljuk, és a szerves fázist vízzel, majd telített nátrium-klorid-oldattal mossuk, vízmentes magnézium-szulfáton szárítjuk, és bepároljuk. A kivált csapadékot átkristályosítva 97,5 g (kitermelés: 85 %) 2-amino-2-(2,4-diklór-fenil)-acetonitrilt kapunk, olvadáspont: 70,8 °C.

(2) 11,2 g koncentrált kénsavat adunk 0,54 g vízhez, majd 10,1 g 2-amino-2-(2,4-diklór-fenil)-acetonitrilt adunk hozzá jeges hűtés közben, és 3 órán keresztül 50-60 °C hőmérsékleten kevertetjük. A reakció befejeződése után a reakcióelegyet 30 ml koncentrált vizes ammóniára öntjük jeges hűtés közben olyan sebességgel, hogy a reakcióelegy hőmérséklete 20 °C alatt maradjon. A kivált kristályokat szűrjük és a szűrletet etil-acetáttal extraháljuk. A szerves fázist telített nátrium-klorid-oldattal mossuk, vízmentes magnézium-szulfáton szárítjuk, és bepároljuk. A maradékot egyesítjük a korábban szűrt kristályokkal, és átkristályosítjuk. Így 6,14 g (kitermelés: 57 %) 2-amino-2-(2,4-diklór-fenil)-acetamidot kapunk, olvadáspont: 113,8 °C.

6. referenciapélda

(1) 37 g koncentrált kénsav és 141 ml víz elegyéhez 34,4 g 2,4-diklór-5-metoxi-anilin 28 ml dietil-éterben felvett oldatát csepegtetjük szobahőmérsékleten, és 50 percen keresztül 40-50 °C hőmérsékleten kevertetjük. A dietil-étert ezen a hőmérsékleten ledesztilláljuk, és a reakcióelegyet 0 °C hőmérsékletre hűtjük. 13,8 g nátrium-nitrit 31 ml vízben felvett oldatát adjuk hozzá olyan sebességgel, hogy a reakcióelegy hőmérséklete 10 °C alatt maradjon. Ezután ezen a hőmérsékleten celitágyon szűrjük. A szűrletet 59,5 g kálium-jodid 95 ml vízben felvett oldatához csepegtetjük olyan sebességgel, hogy a reakcióelegy hőmérséklete 10 °C alatt maradjon. Ezzel egyidejűleg 100 ml hexánnal és 100 ml dietil-éterrel hígítjuk, és 2 órán keresztül ezen a hőmérsékleten kevertetjük. A reakció befejeződése után a reakcióelegyet dietil-éterrel extraháljuk. A szerves fázist telített nátrium-tioszulfát-oldattal mossuk, vízmentes magnézium-szulfáton szárítjuk, és bepároljuk. A maradékot szilikagélen oszlopkromatográfiásan tisztítva 22,6 g (kitermelés: 41 %) 2,4-diklór-5-jód-1-metoxi-benzolt kapunk.

¹H-NMR spektrum (CDCl₃/TMS, 300 MHz, δ ppm): 3,88 (s, 3H), 7,32 (s, 1H), 7,43 (s, 1H).

(2) 22,6 g 2,4-diklór-5-jód-1-metoxi-benzol, 7,61 g nátrium-formiát, 1,05 g diklór-bisz(trifenil-foszfin)-palládium és 60 ml N,N-dimetil-formamid elegyét 12 órán keresztül 90-100 °C hőmérsékleten kevertetjük szén-monoxid bevezetése mellett. A reakció befejeződése után a reakcióelegyet hagyjuk szobahőmérsékletre hűlni, hígított sósavval elegyítjük, és etil-acetáttal extraháljuk. A szerves fázist telített nátrium-klorid-oldattal mossuk, vízmentes magnézium-szulfáton szárítjuk, és bepároljuk. A maradékot szilikagélen oszlopkromatográfiásan tisztítva 6,75 g (kitermelés: 44 %) 2,4-diklór-5-metoxi-benzaldehidet kapunk.

¹H-NMR spektrum (CDCl₃/TMS, 300 MHz, δ ppm): 3,95 (s, 3H), 7,44 (s, 1H), 7,49 (s, 1H), 10,39 (s, 1H).

(3) 3,86 g nátrium-cianid, 5,74 ml koncentrált vizes ammónia (28 %), 4,65 ml víz és 5,78 g ammónium-klorid elegyét 1 órán keresztül 15 °C hőmérsékleten kevertetjük, majd ezen a hőmérsékleten 3,8 ml éterrel hígítjuk. Ezután 2,5-4 °C hőmérsékletre hűtjük, és ezen a hőmérsékleten 13,5 g 2,4-diklór-5-metoxi-benzaldehid 40 ml metanolban felvett oldatát adjuk hozzá. Ezután -0,5 °C és +1 °C közötti hőmérsékleten 3 órán keresztül ammóniagázt vezetünk az elegybe, és 2 órán keresztül ezen a hőmérsékleten, majd egy éjszakán keresztül szobahőmérsékleten kevertetjük. A reakció befejeződése után a reakcióelegyet éterrel extraháljuk, és a szerves fázist vízzel, majd telített nátrium-klorid-oldattal mossuk, vízmentes magnézium-szulfáton szárítjuk, és bepároljuk. A csapadékot átkristályosítva 15,0 g (kitermelés: 99 %) 2-amino-2-(2,4-diklór-5-metoxi)-acetonitrilt kapunk.

¹H-NMR spektrum (CDCl₃/TMS, 300 MHz, δ ppm): 1,99 (d, 2H, J = 6,7 Hz), 3,96 (s, 3H), 5,21 (t, 1H, J = 6,7 Hz), 7,22 (s, 1H), 7,45 (s, 1H).

(4) 3,6 g koncentrált kénsavat adunk 0,33 g vízhez, és 15,0 g 2-amino-2-(2,4-diklór-5-metoxi-fenil)-acetonitrilt adunk hozzá jeges hűtés közben, és 3 órán keresztül 50-60 °C hőmérsékleten kevertetjük. A reakció befeje-

ződése után a reakcióelegyet 15 ml koncentrált vizes ammóniára öntjük jeges hűtés közben olyan sebességgel, hogy a reakcióelegy hőmérséklete 20 °C alatt maradjon. A kivált kristályokat szűrjük, és a szűrletet etil-acetáttal extraháljuk. A szerves fázist telített nátrium-klorid-oldattal mossuk, vízmentes magnézium-szulfáton szárítjuk, és bepároljuk. A maradékot egyesítjük a korábban szűrt kristályokkal, és átkristályosítjuk. Így 7,42 g (kitermelés: 46 %) 2-amino-2-(2,4-diklór-5-metoxi-fenil)-acetamidot kapunk.

¹H-NMR spektrum (CDCl₃/TMS, 300 MHz, δ ppm): 3,90 (s, 3H), 4,85 (s, 1H), 6,97 (s, 1H), 7,41 (s, 1H).

A fent leírt módon állíthatók elő a 6-8. táblázatokban felsorolt [2] általános képletű vegyületek.

6. táblázat

(2a) általános képletű vegyületek

Vegyület száma	X	Y	R ¹	R ²	B
1-1001.	H	F	H	CF ₃	H
1-1002.	H	Cl	H	CF ₃	H
1-1003.	H	Br	H	CF ₃	H
1-1004.	F	F	H	CF ₃	H
1-1005.	F	Cl	H	CF ₃	H
1-1006.	F	Br	H	CF ₃	H
1-1007.	Cl	Cl	H	CF ₃	H
1-1008.	F	Cl	H	CF ₃	OCH ₃
1-1009.	Cl	Cl	H	CF ₃	OCH ₃
1-1010.	H	F	CH ₃	CF ₃	H
1-1011.	H	Cl	CH ₃	CF ₃	H
1-1012.	H	Br	CH ₃	CF ₃	H
1-1013.	F	F	CH ₃	CF ₃	H
1-1014.	F	Cl	CH ₃	CF ₃	H
1-1015.	F	Br	CH ₃	CF ₃	H
1-1016.	F	Cl	CH ₃	CF ₃	OCH ₃
1-1017.	Cl	Cl	CH ₃	CF ₃	H
1-1018.	Cl	Cl	CH ₃	CF ₃	OCH ₃

7. táblázat

(2b) általános képletű vegyületek

Vegyület száma	X	Y	Z ²	R ¹	R ²	R ⁶
3-1001.	H	F	O	H	CF ₃	CH ₃
3-1002.	H	Cl	O	H	CF ₃	CH ₃
3-1003.	H	Br	O	H	CF ₃	CH ₃
3-1004.	F	F	O	H	CF ₃	CH ₃
3-1005.	F	Cl	O	H	CF ₃	CH ₃
3-1006.	F	Br	O	H	CF ₃	CH ₃
3-1007.	H	F	O	H	CF ₃	C ₂ H ₅
3-1008.	H	Cl	O	H	CF ₃	C ₂ H ₅
3-1009.	H	Br	O	H	CF ₃	C ₂ H ₅
3-1010.	F	F	O	H	CF ₃	C ₂ H ₅
3-1011.	F	Cl	O	H	CF ₃	C ₂ H ₅
3-1012.	F	Br	O	H	CF ₃	C ₂ H ₅

8. táblázat

(2c) általános képletű vegyületek

Vegyület száma	X	Y	R ¹	R ²	R ⁷	R ⁸
4-1001.	H	F	H	CF ₃	H	CH ₃
4-1002.	H	Cl	H	CF ₃	H	CH ₃
4-1003.	H	Br	H	CF ₃	H	CH ₃
4-1004.	H	F	H	CF ₃	H	CH ₂ OH
4-1005.	H	Cl	H	CF ₃	H	CH ₂ OH
4-1006.	H	Br	H	CF ₃	H	CH ₂ OH
4-1007.	H	F	H	CF ₃	CH ₃	CH ₃
4-1008.	H	Cl	H	CF ₃	CH ₃	CH ₃
4-1009.	H	Br	H	CF ₃	CH ₃	CH ₃
4-1010.	H	F	H	CF ₃	CH ₃	CH ₂ OH
4-1011.	H	Cl	H	CF ₃	CH ₃	CH ₂ OH
4-1012.	H	Br	H	CF ₃	CH ₃	CH ₂ OH
4-1013.	F	F	H	CF ₃	H	CH ₃
4-1014.	F	Cl	H	CF ₃	H	CH ₃
4-1015.	F	Br	H	CF ₃	H	CH ₃

8. táblázat (folytatás)

Vegyület száma	X	Y	R ¹	R ²	R ⁷	R ⁸
4-1016.	F	F	H	CF ₃	H	CH ₂ OH
4-1017.	F	Cl	H	CF ₃	H	CH ₂ OH
4-1018.	F	Br	H	CF ₃	H	CH ₂ OH
4-1019.	F	F	H	CF ₃	CH ₃	CH ₃
4-1020.	F	Cl	H	CF ₃	CH ₃	CH ₃
4-1021.	F	Br	H	CF ₃	CH ₃	CH ₃
4-1022.	F	F	H	CF ₃	CH ₃	CH ₂ OH
4-1023.	F	Cl	H	CF ₃	CH ₃	CH ₂ OH
4-1024.	F	Br	H	CF ₃	CH ₃	CH ₂ OH

A továbbiakban a készítmények előállítását mutatjuk be, melynek során a találmány szerinti vegyületeket az 1-5. táblázatokban szereplő számok alapján azonosítjuk.

1. készítmény előállítási példa

Egyenként 50 tömegrész 1-1. – 1-581., 2-1. – 2-242., 3-1. – 3-128., 4-1. – 4-137. és 5-1. – 5-17. vegyületet elkeverünk 3 tömegrész kalcium-lignin-szulfonáttal, 2 tömegrész nátrium-lauril-szulfáttal és 45 tömegrész szintetikus és hidratált szilícium-oxiddal, és a keveréket porítjuk. Így minden hatóanyagból nedvesíthető porkészítményt kapunk.

2. készítmény előállítási példa

Egyenként 10 tömegrész 1-1. – 1-581., 2-1. – 2-242., 3-1. – 3-128., 4-1. – 4-137. és 5-1. – 5-17. vegyületet elkeverünk 14 tömegrész poli(oxi-etilén)-sztiril-fenil-éterrel, 6 tömegrész kalcium-dodecil-benzolszulfonáttal, 35 tömegrész xilollal és 35 tömegrész ciklohexanonnal, és jól összekeverjük. Így minden hatóanyagból emulgeálható koncentrátumot kapunk.

3. készítmény előállítási példa

Egyenként 2 tömegrész 1-1. – 1-581., 2-1. – 2-242., 3-1. – 3-128., 4-1. – 4-137. és 5-1. – 5-17. vegyületet elkeverünk 2 tömegrész szintetikus és hidratált szilícium-oxiddal, 2 tömegrész kalcium-lignin-szulfonáttal, 30 tömegrész bentonittal és 64 tömegrész kaolin agyaggal, és a keveréket porítjuk, majd vízzel hígítjuk és jól összegyúrjuk. Granulálás után minden hatóanyagból granulátum készítményt kapunk.

4. készítmény előállítási példa

Egyenként 25 tömegrész 1-1. – 1-581., 2-1. – 2-242., 3-1. – 3-128., 4-1. – 4-137. és 5-1. – 5-17. vegyületet elkeverünk 50 tömegrész 10 tömeg%-os vizes poli(vinil-alkohol)-oldattal és 25 tömegrész vízzel, és a keveréket legfeljebb 5 µm átlagos szemcseméretig őröljük. Így minden hatóanyagból könnyen folyó készítményt kapunk.

5. készítmény előállítási példa

Egyenként 5 tömegrész 1-1. – 1-581., 2-1. – 2-242., 3-1. – 3-128., 4-1. – 4-137. és 5-1. – 5-17. vegyületet elkeverünk 40 tömegrész 10 tömeg%-os vizes poli(vinil-alkohol)-oldattal és az emulziót egy homogenizátorban legfeljebb 10 µm átlagos szemcseméret eléréséig diszpergáljuk, majd 55 tömegrész vízzel hígítjuk. Így minden hatóanyagból koncentrált emulzió készítményt kapunk.

A következő vizsgálatok igazolják a találmány szerinti vegyületek herbicid hatását. A vegyületeket az 1-5. táblázatokban alkalmazott számok alapján azonosítjuk.

A herbicid hatékonyságot 6 szinten 0-5 közötti, vagyis 0, 1, 2, 3, 4 vagy 5 számokkal értékeljük, ahol 0 azt jelenti, hogy semmilyen vagy csak kismértékű különbség van a kezelt és a kezeletlen növények csírázásában és növekedésében, és 5 azt jelenti, hogy a kezelt növény elpusztul vagy csírázása és növekedése teljes mértékben gátolva van. A herbicid hatékonyság kiváló a 4 vagy 5 szinten, de nem kielégítő a 3 vagy ennél alacsonyabb szinten.

1. vizsgálati példa

Levélzet kezelése hegyvidéki földeken

10 cm átmérőjű és 10 cm mélységű hengeres műanyagcserepekbe talajt töltünk, és beültetjük az *Abutilon theophrasti* és *Ipomoea hederacea* magjaival, és a vizsgálati növényeket 15 napon keresztül üvegházi körülmények között növesztjük. A vizsgált hatóanyagokat a 2. készítmény előállítási példa szerinti emulgeálható koncentrátum formájában használjuk, amit felületaktív anyagot tartalmazó vízzel hígítunk a kívánt koncentrációra. A készítményt 1000 l/ha mennyiségben egyenletesen permetezzük a vizsgált növények levélzetére. Kezelés után a növényeket 19 napon keresztül üvegházi körülmények között növesztjük, majd meghatározzuk a herbicid hatékonys-

ságot. A mérési eredményeket a 9. táblázatban adjuk meg.

9. táblázat

Vizsgált hatóanyag száma	Felhasználási mennyiség (g/ha)	Herbicide hatékonyság	
		<i>Abutilon t.</i>	<i>Ipomoea h.</i>
1-10.	2000	5	5
1-11.	2000	5	5
1-17.	2000	5	5
1-37.	2000	5	5
1-61.	2000	5	5
1-90.	2000	5	5
1-144.	2000	5	5
1-156.	2000	5	5
1-157.	2000	5	5
1-165.	2000	5	5
1-166.	2000	5	5
1-167.	2000	5	5
1-169.	2000	5	5
1-173.	2000	5	5
1-174.	2000	5	5
1-332.	2000	5	5
1-336.	2000	5	5
1-343.	2000	5	5
1-346.	2000	5	5
1-351.	2000	5	5
1-355.	2000	5	5
1-356.	2000	5	5
1-358.	2000	5	5
1-370.	2000	5	5
1-371.	2000	5	5
1-380.	2000	5	5
1-387.	2000	5	5
2-13.	2000	5	5
2-61.	2000	5	5

2. vizsgálati példa

Talaj felületi kezelése hegyvidéki területeken

10 cm átmérőjű és 10 cm mélységű hengeres műanyagcserepekbe talajt töltünk, és beültetjük az *Abutilon theophrasti* és *Ipomoea hederacea* magjaival. A vizsgált hatóanyagokat a 2. készítmény előállítási példa szerinti emulgeálható koncentrátum formájában használunk, amit vízzel a meghatározott koncentrációra hígítunk. A készítményt 1000 l/ha mennyiségben egyenletesen permetezzük a talaj felületére. Kezelés után a növényeket 19 napon keresztül üvegházi körülmények között növesztjük, majd meghatározzuk a herbicid hatékonyságot. A mérési eredményeket a 10. táblázatban adjuk meg.

10. táblázat

Vizsgált hatóanyag száma	Felhasználási mennyiség (g/ha)	Herbicidek hatékonyság	
		<i>Abutilon t.</i>	<i>Ipomoea h.</i>
1-10.	2000	5	5
1-11.	2000	5	5
1-37.	2000	5	5
1-90.	2000	5	5
1-144.	2000	5	5
1-156.	2000	5	5
1-165.	2000	5	5
1-166.	2000	5	5
1-169.	2000	5	5
1-174.	2000	5	5
1-332.	2000	5	5
1-336.	2000	5	5
1-343.	2000	5	5
1-358.	2000	5	5
1-370.	2000	5	5
1-371.	2000	5	5
1-380.	2000	5	5
2-13.	2000	5	5
2-61.	2000	5	5

3. vizsgálati példa

Rizsföldi növények kezelése

9 cm átmérőjű és 11 cm mélységű hengeres műanyagcserepekbe talajt töltünk, és beültetjük az *Echinochloa oryzicola* magjaival. A cserepeket vízzel elárasztjuk és a növényeket 7 napon keresztül üvegházi körülmények között növesztjük. A vizsgált hatóanyagokat a 2. készítmény előállítási példa szerinti emulgeálható koncentrátum formájában használjuk, amit vízzel a kívánt koncentrációra hígítunk. A készítményt 50 l/ha mennyiségben hordjuk ki a víz felületére. Kezelés után a növényeket 19 napon keresztül üvegházi

körülmények között növesztjük, majd meghatározzuk a herbicid hatékonyságot. Az eredményeket a 11. táblázatban adjuk meg.

11. táblázat

Vizsgált hatóanyag száma	Felhasználási mennyiség (g/ha)	Herbicid aktivitás <i>Echinochloa o.</i>
1-10.	4000	5
1-11.	4000	5
1-17.	4000	5
1-37.	4000	5
1-61.	4000	5
1-90.	4000	5
1-144.	4000	5
1-156.	4000	5
1-157.	4000	5
1-165.	4000	5
1-166.	4000	5
1-167.	4000	5
1-169.	4000	5
1-173.	4000	5
1-174.	4000	5
1-332.	4000	5
1-336.	4000	5
1-343.	4000	5
1-346.	4000	5
1-351.	4000	5
1-355.	4000	5
1-356.	4000	5
1-358.	4000	5
1-370.	4000	5
1-371.	4000	5
1-380.	4000	5
1-387.	4000	5
2-1.	4000	5
2-13.	4000	5
2-61.	4000	5



SZABADALMI IGÉNYPONTOK

1. [1] általános képletű vegyületek, a képletben

R¹ jelentése hidrogénatom vagy 1-3 szénatomos alkilcsoport;

R² jelentése 1-3 szénatomos halogén-alkil-csoport;

R³ jelentése 1-6 szénatomos alkilcsoport, amely adott esetben egy vagy több halogénatommal szubsztituálva lehet, 3-6 szénatomos alkenilcsoport vagy 3-6 szénatomos alkinilcsoport;

Q jelentése adott esetben szubsztituált fenilcsoport.

2. Az 1. igénypont szerinti vegyület, mely képletében

Q jelentése [Q-1], [Q-2], [Q-3], [Q-4] vagy [Q-5] általános képletű csoport, ahol

X jelentése hidrogénatom vagy halogénatom;

Y jelentése halogénatom, nitrocsoport, cianocsoport vagy trifluor-metil-csoport;

Z¹ jelentése oxigénatom, kénatom, NH vagy metilén-csoport;

Z² jelentése oxigénatom vagy kénatom;

n értéke 0 vagy 1;

B jelentése hidrogénatom, halogénatom, nitrocsoport, cianocsoport, klór-szulfonil-csoport, $-OR^{10}$, $-SR^{10}$, $-SO_2-OR^{10}$, $-N(R^{10})R^{11}$, $-SO_2N(R^{11})R^{12}$, $-NR^{11}(COR^{13})$, $-NR^{11}(SO_2R^{14})$, $-N(SO_2R^{14})(SO_2R^{15})$, $-N(SO_2R^{14})(COR^{13})$, $-NR^{11}(COOR^{13})$, $-COOR^{13}$, $-CON(R^{11})R^{12}$, $-CSN(R^{11})R^{12}$, $-COR^{16}$, $-CR^{17}=CR^{18}CHO$, $-CR^{17}=CR^{18}COOR^{10}$, $-CR^{17}=CR^{18}CON(R^{11})R^{12}$, $-CH_2CHWCOOR^{13}$ vagy $-CH_2CHWCON(R^{11})R^{12}$ általános képletű csoport;

R⁴ jelentése hidrogénatom vagy 1-3 szénatomos alkilcsoport;

R⁵ jelentése hidrogénatom, 1-6 szénatomos alkilcsoport, 1-6 szénatomos halogén-alkil-csoport, 3-6 szénatomos alkenilcsoport, 3-6

szénatomos halogén-alkenil-csoport, 3-6 szénatomos alkinilcsoport, 3-6 szénatomos halogén-alkinil-csoport, 1-6 szénatomos ciano-alkil-csoport, 2-8 szénatomos alkoxi-alkil-csoport, 3-8 szénatomos alkoxi-alkoxi-alkil-csoport, 1-6 szénatomos karboxi-alkil-csoport, alkil részeiben 1-6 szénatomos alkoxi-karbonil-alkil-csoport, alkoxi részeiben 1-4 szénatomos és alkil részében 1-6 szénatomos alkoxi-alkoxi-karbonil-alkil-csoport, cikloalkil részében 3-8 szénatomos és alkil részében 1-6 szénatomos cikloalkoxi-karbonil-alkil-csoport, $-\text{CH}_2\text{CON}(\text{R}^{11})\text{R}^{12}$, $-\text{CH}_2\text{COON}(\text{R}^{11})\text{R}^{12}$, alkil részében 1-4 szénatomos $-\text{CH}(\text{alkil})\text{CON}(\text{R}^{11})\text{R}^{12}$, alkil részében 1-4 szénatomos $-\text{CH}(\text{alkil})\text{COON}(\text{R}^{11})\text{R}^{12}$ általános képletű csoport, 2-8 szénatomos alkil-tio-alkil-csoport, 1-6 szénatomos alkil-szulfonil-csoport, 1-6 szénatomos halogén-alkil-szulfonil-csoport, 1-8 szénatomos alkil-karbonil-csoport, 1-8 szénatomos alkoxi-karbonil-csoport vagy 1-6 szénatomos hidroxil-alkil-csoport;

R⁶ jelentése 1-6 szénatomos alkilcsoport, 1-6 szénatomos halogén-alkil-csoport, formilcsoport, cianocsoport, karboxilcsoport, 1-6 szénatomos hidroxil-alkil-csoport, alkil részeiben 1-6 szénatomos alkoxi-alkil-csoport, alkil részeiben 1-6 szénatomos alkoxi-alkoxi-alkil-csoport, alkil részeiben 1-6 szénatomos alkil-karbonil-oxi-alkil-csoport, alkil részeiben 1-6 szénatomos halogén-alkil-karbonil-oxi-alkil-csoport, 1-6 szénatomos alkoxi-karbonil-csoport vagy 1-6 szénatomos alkil-karbonil-csoport;

R⁷ jelentése hidrogénatom vagy 1-3 szénatomos alkilcsoport;

R⁸ jelentése 1-6 szénatomos alkilcsoport, 1-6 szénatomos halogén-alkil-csoport, 1-6 szénatomos hidroxil-alkil-csoport, 2-8 szénatomos alkoxi-alkil-csoport, 3-10 szénatomos alkoxi-alkoxi-alkil-csoport, alkil részeiben 1-6 szénatomos alkil-karbonil-oxi-alkil-csoport, al-



alkil részeiben 1-6 szénatomos halogén-alkil-karbonil-oxi-alkil-csoport, karboxilcsoport, 1-6 szénatomos karboxi-alkil-csoport, 1-8 szénatomos alkoxi-karbonil-csoport, 1-6 szénatomos halogén-alki-oxi-karbonil-csoport, 3-10 szénatomos cikloalkoxi-karbonil-csoport, 3-8 szénatomos alkenil-oxi-karbonil-csoport, 3-8 szénatomos alkinil-oxi-karbonil-csoport, amino-karbonil-csoport, 1-6 szénatomos alkil-amino-karbonil-csoport, alkil részeiben 1-6 szénatomos dialkil-amino-karbonil-csoport, alkil részeiben 1-6 szénatomos alkil-amino-karbonil-oxi-alkil-csoport vagy alkil részeiben 1-6 szénatomos dialkil-amino-karbonil-oxi-alkil-csoport;

W jelentése hidrogénatom, klóratom vagy brómatom;

R¹⁰ jelentése hidrogénatom, 1-6 szénatomos alkilcsoport, 1-6 szénatomos halogén-alkil-csoport, 3-8 szénatomos cikloalkilcsoport, 3-6 szénatomos alkenilcsoport, 3-6 szénatomos halogén-alkenil-csoport, 3-6 szénatomos alkinilcsoport, 3-6 szénatomos halogén-alkinil-csoport, 1-6 szénatomos ciano-alkil-csoport, 2-8 szénatomos alkoxi-alkil-csoport, 2-8 szénatomos alkil-tio-alkil-csoport, 1-6 szénatomos karboxi-alkil-csoport, alkil részeiben 1-6 szénatomos alkoxi-karbonil-alkil-csoport, alkoxi részeiben 1-4 szénatomos és alkil részében 1-6 szénatomos alkoxi-alkoxi-karbonil-alkil-csoport, cikloalkil részében 3-8 szénatomos és alkil részében 1-6 szénatomos cikloalkoxi-karbonil-alkil-csoport, $-\text{CH}_2\text{CON}(\text{R}^{11})\text{R}^{12}$, $-\text{CH}_2\text{COON}(\text{R}^{11})\text{R}^{12}$, alkil részében 1-4 szénatomos $-\text{CH}(\text{alkil})\text{CON}(\text{R}^{11})\text{R}^{12}$ vagy alkil részében 1-4 szénatomos $-\text{CH}(\text{alkil})\text{COON}(\text{R}^{11})\text{R}^{12}$ általános képletű csoport;

R¹¹ és **R¹²** egymástól függetlenül hidrogénatom, 1-6 szénatomos alkil-csoport, 1-6 szénatomos halogén-alkil-csoport, 3-6 szénatomos alkenilcsoport, 3-6 szénatomos alkinilcsoport, 1-6 szénatomos cia-



no-alkil-csoport, 2-8 szénatomos alkoxi-alkil-csoport, 2-8 szénatomos alkil-tio-alkil-csoport, 1-6 szénatomos karboxi-alkil-csoport, alkil részeiben 1-6 szénatomos alkoxi-karbonil-alkil-csoport vagy alkoxi részeiben 1-4 szénatomos és alkil részében 1-6 szénatomos alkoxi-alkoxi-karbonil-alkil-csoport; vagy R^{11} és R^{12} jelentése együtt tetrametiléncsoport, pentametiléncsoport vagy etilén-oxi-etilén-csoport;

R^{13} jelentése hidrogénatom, 1-6 szénatomos alkilcsoport, 1-6 szénatomos halogén-alkil-csoport vagy 3-8 szénatomos cikloalkilcsoport;

R^{14} és R^{15} jelentése egymástól függetlenül 1-6 szénatomos alkilcsoport, 1-6 szénatomos halogén-alkil-csoport, vagy adott esetben metilcsoporttal vagy nitrocsoporttal szubsztituált fenilcsoport;

R^{16} jelentése hidrogénatom, 1-6 szénatomos alkilcsoport, 1-6 szénatomos halogén-alkil-csoport, 2-6 szénatomos alkenilcsoport, 2-6 szénatomos halogén-alkenil-csoport, 2-6 szénatomos alkinilcsoport, 2-6 szénatomos halogén-alkinil-csoport, 2-8 szénatomos alkoxi-alkil-csoport vagy 1-6 szénatomos hidroxi-alkil-csoport;

R^{17} és R^{18} jelentése egymástól függetlenül hidrogénatom vagy 1-6 szénatomos alkilcsoport.

3. A 2. igénypont szerinti vegyületek, melyek képletében

Q jelentése [Q-1], [Q-2], [Q-3] vagy [Q-4] általános képletű csoport, ahol

Y jelentése halogénatom;

Z^1 jelentése oxigénatom vagy kénatom;

Z^2 jelentése oxigénatom;

B jelentése hidrogénatom, nitrocsoport, $-OR^{10}$, $-SR^{10}$, $-N(R^{10})R^{11}$, $-NHSO_2R^{14}$, $-COOR^{13}$ vagy $-CH_2CHWCOOR^{13}$ általános képletű csoport;

- R⁵** jelentése 1-6 szénatomos alkilcsoport, 3-6 szénatomos alkenilcsoport vagy 3-6 szénatomos alkinilcsoport;
- R⁶** jelentése 1-6 szénatomos alkilcsoport, 1-6 szénatomos halogén-alkil-csoport, formilcsoport, hidroximetil-csoport, 1-6 szénatomos alkoximetil-csoport, 1-6 szénatomos alkil-karbonil-oximetil-csoport vagy 1-6 szénatomos alkoxikarbonil-csoport;
- R⁷** jelentése hidrogénatom vagy metilcsoport;
- R⁸** jelentése metilcsoport, hidroximetil-csoport, 1-6 szénatomos alkoximetil-csoport, 1-5 szénatomos alkil-karbonil-oximetil-csoport, karboxilcsoport vagy 1-6 szénatomos alkoxikarbonil-csoport;
- W** jelentése hidrogénatom vagy klóratom;
- R¹⁰** jelentése 1-6 szénatomos alkilcsoport, 3-8 szénatomos cikloalkilcsoport, 3-6 szénatomos alkenilcsoport, 3-6 szénatomos halogén-alkenil-csoport, 3-6 szénatomos alkinilcsoport, 1-6 szénatomos cianoalkil-csoport vagy alkil részeiben 1-6 szénatomos alkoxikarbonilalkil-csoport;
- R¹³** jelentése 1-6 szénatomos alkilcsoport;
- R¹⁴** jelentése 1-6 szénatomos alkilcsoport.

4. Az 1., 2. vagy 3. igénypont szerinti vegyületek, melyek képletében **R²** jelentése trifluor-metil-csoport.

5. A 2. igénypont szerinti vegyületek, melyek képletében **Q** jelentése [Q-1] általános képletű csoport.

6. A 2. igénypont szerinti vegyületek, melyek képletében **Q** jelentése [Q-2] általános képletű csoport.

7. A 2. igénypont szerinti vegyületek, melyek képletében **Q** jelentése [Q-3] általános képletű csoport.

8. A 2. igénypont szerinti vegyületek, melyek képletében Q jelentése [Q-4] általános képletű csoport.

9. A 3. igénypont szerinti vegyületek, melyek képletében Q jelentése [Q-1] általános képletű csoport.

10. A 3. igénypont szerinti vegyületek, melyek képletében Q jelentése [Q-2] általános képletű csoport.

11. A 3. igénypont szerinti vegyületek, melyek képletében Q jelentése [Q-3] általános képletű csoport.

12. A 3. igénypont szerinti vegyületek, melyek képletében Q jelentése [Q-4] általános képletű csoport.

13. A 3. igénypont szerinti vegyületek, melyek képletében Q jelentése [Q-1] általános képletű csoport és R^2 jelentése trifluor-metil-csoport.

14. A 3. igénypont szerinti vegyületek, melyek képletében Q jelentése [Q-2] általános képletű csoport és R^2 jelentése trifluor-metil-csoport.

15. A 3. igénypont szerinti vegyületek, melyek képletében Q jelentése [Q-3] általános képletű csoport és R^2 jelentése trifluor-metil-csoport.

16. A 3. igénypont szerinti vegyületek, melyek képletében Q jelentése [Q-4] általános képletű csoport és R^2 jelentése trifluor-metil-csoport.

17. A 3. igénypont szerinti vegyületek, melyek képletében Q jelentése [Q-1] általános képletű csoport, R^2 jelentése trifluor-metil-csoport és B jelentése $-OR^{10}$ általános képletű csoport.

18. A 3. igénypont szerinti vegyületek, melyek képletében Q jelentése [Q-1] általános képletű csoport, R^2 jelentése trifluor-metil-csoport és B jelentése $-NHR^{10}$ általános képletű csoport.

19. A 3. igénypont szerinti vegyületek, melyek képletében Q jelentése [Q-1] általános képletű csoport, R^2 jelentése trifluor-metil-csoport, B jelentése $-OR^{10}$ általános képletű csoport és R^{10} jelentése 3-6 szénatomos alkinil-csoport.

20. A 3. igénypont szerinti vegyületek, melyek képletében Q jelentése [Q-1] általános képletű csoport, R^2 jelentése trifluor-metil-csoport, B jelentése $-OR^{10}$ általános képletű csoport és R^{10} jelentése alkil részeiben 1-6 szénatomos alkoxi-karbonil-alkil-csoport.

21. A 3. igénypont szerinti vegyületek, melyek képletében Q jelentése [Q-1] általános képletű csoport, R^2 jelentése trifluor-metil-csoport, B jelentése $-OR^{10}$ általános képletű csoport és R^{10} jelentése 1-6 szénatomos 1-alkoxi-karbonil-etil-csoport.

22. A 3. igénypont szerinti vegyületek, melyek képletében Q jelentése [Q-1] általános képletű csoport, R^2 jelentése trifluor-metil-csoport, B jelentése $-OR^{10}$ általános képletű csoport és R^{10} jelentése 1-6 szénatomos alkoxi-karbonil-metil-csoport.

23. A 3. igénypont szerinti vegyületek, melyek képletében Q jelentése [Q-1] általános képletű csoport, R^2 jelentése trifluor-metil-csoport, B jelentése $-NHR^{10}$ általános képletű csoport és R^{10} jelentése alkil részeiben 1-6 szénatomos alkoxi-karbonil-alkil-csoport.

24. A 3. igénypont szerinti vegyületek, melyek képletében Q jelentése [Q-2] általános képletű csoport, R^2 jelentése trifluor-metil-csoport, Z^1 jelentése oxigénatom, n értéke 1, R^4 jelentése hidrogénatom és R^5 jelentése 3-6 szénatomos alkinilcsoport.

25. A 2. igénypont szerinti vegyületek, melyek képletében R^1 jelentése hidrogénatom, R^2 jelentése trifluor-metil-csoport, R^3 jelentése metilcsoport, Q jelentése [Q-1] általános képletű csoport, X jelentése fluoratom, Y jelentése klóratom és B jelentése hidrogénatom.

26. A 2. igénypont szerinti vegyületek, melyek képletében R^1 jelentése hidrogénatom, R^2 jelentése trifluor-metil-csoport, R^3 jelentése metilcsoport, Q jelentése [Q-1] általános képletű csoport, X jelentése fluoratom, Y jelentése klóratom és B jelentése propargil-oxi-csoport.

27. A 2. igénypont szerinti vegyületek, melyek képletében R^1 jelentése hidrogénatom, R^2 jelentése trifluor-metil-csoport, R^3 jelentése metilcsoport, Q jelentése [Q-1] általános képletű csoport, X jelentése klóratom, Y jelentése klóratom és B jelentése 1-(etoxi-karbonil)-etil-amino-csoport.

28. A 2. igénypont szerinti vegyületek, melyek képletében R^1 jelentése hidrogénatom, R^2 jelentése trifluor-metil-csoport, R^3 jelentése metilcsoport, Q jelentése [Q-2] általános képletű csoport, X jelentése fluoratom, Z^1 jelentése oxigénatom, n értéke 1, R^4 jelentése hidrogénatom és R^5 jelentése propargilcsoport.

29. Eljárás az 1. igénypont szerinti vegyületek előállítására, **a z z a l j e l l e m e z v e**, hogy egy [2] általános képletű vegyületet, a képletben R^1 jelentése hidrogénatom vagy 1-3 szénatomos alkilcsoport; R^2 jelentése 1-3 szénatomos halogén-alkil-csoport; és Q jelentése adott esetben szubsztituált fenilcsoport; egy [3] általános képletű vegyülettel reagáltatunk,

R^3 -D

[3]

a képletben

R^3 jelentése 1-6 szénatomos alkilcsoport, amely adott esetben egy vagy több halogénatommal szubsztituálva lehet, 3-6 szénatomos alkenilcsoport vagy 3-6 szénatomos alkinilcsoport;

D jelentése klóratom, brómatom, jódatom, metánszulfonil-oxi-csoport, trifluor-metánszulfonil-oxi-csoport vagy p-toluolszulfonil-oxi-csoport.

30. Herbicid készítmény, **a z z a l j e l l e m e z v e**, hogy hatóanyagként herbicid szempontból hatékony mennyiségben 1. igénypont szerinti vegyületet tartalmaz inert hordozóanyag vagy hígítóanyag mellett.

31. Eljárás nemkívánt növényi növekedés szabályozására, **a z z a l j e l l e m e z v e**, hogy a nemkívánt növényekre vagy azok életterébe herbi-

cid szempontból hatékony mennyiségben 1. igénypont szerinti vegyületet juttatunk ki.

32. Az 1. igénypont szerinti vegyületek herbicidként történő alkalmazása.

33. [2] általános képletű vegyületek, a képletben

R^1 jelentése hidrogénatom vagy 1-3 szénatomos alkilcsoport;

R^2 jelentése 1-3 szénatomos halogén-alkil-csoport; és

Q jelentése adott esetben szubsztituált fenilcsoport.

34. A 33. igénypont szerinti vegyületek, melyek képletében Q jelentése valamely 2. igénypontban definiált [Q-1], [Q-2], [Q-3], [Q-4] vagy [Q-5] általános képletű csoport.

35. A 33. vagy 34. igénypont szerinti vegyületek, melyek képletében R^2 jelentése trifluor-metil-csoport.

36. A 34. igénypont szerinti vegyületek, melyek képletében Q jelentése [Q-1] általános képletű csoport.

37. A 33. vagy 34. igénypont szerinti vegyületek, melyek képletében R^1 jelentése hidrogénatom és R^2 jelentése trifluor-metil-csoport.

+14 lap mjr

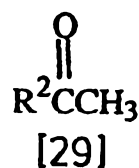
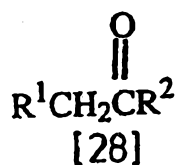
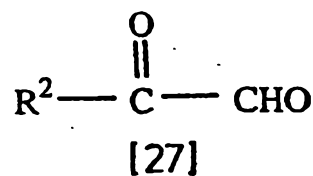
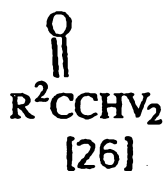
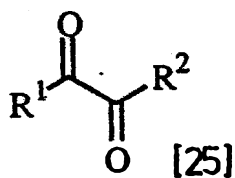
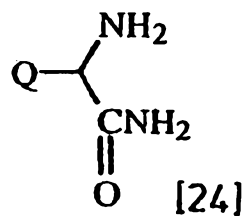
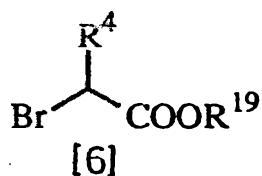
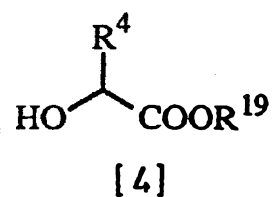
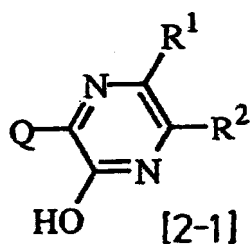
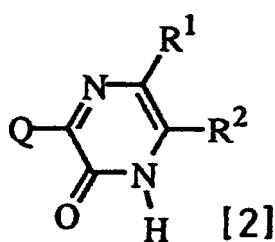
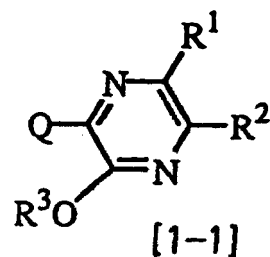
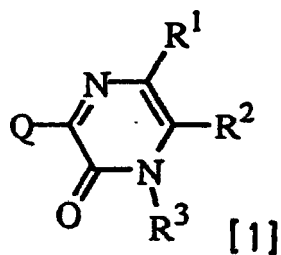
EL

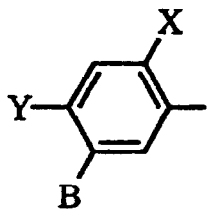
A meghatalmazott:

DANUBIA
Szabadalmi és Védjegy Iroda Kft.

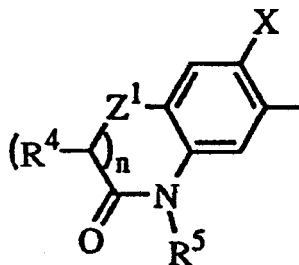
dr. Valyonné T. Elvira

szabadalmi ügyvivő

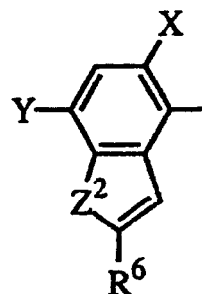




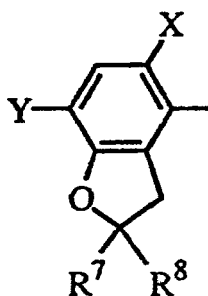
[Q-1]



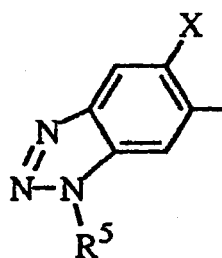
[Q-2]



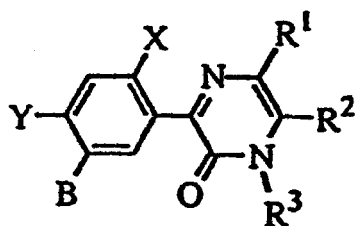
[Q-3]



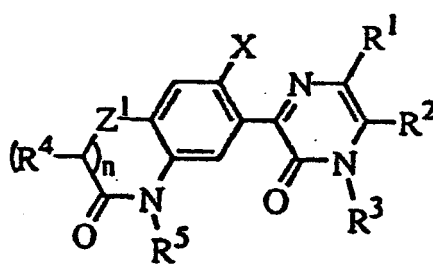
[Q-4]



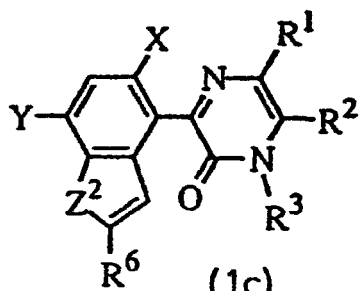
[Q-5]



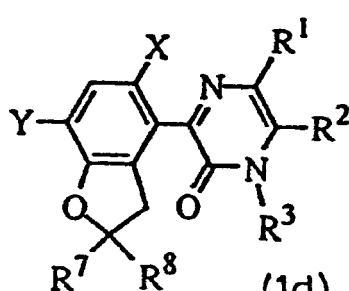
(1a)



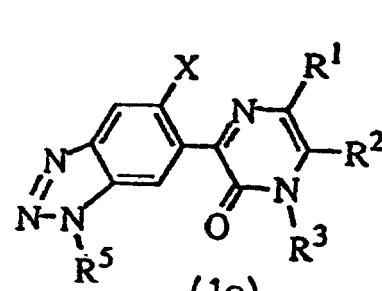
(1b)



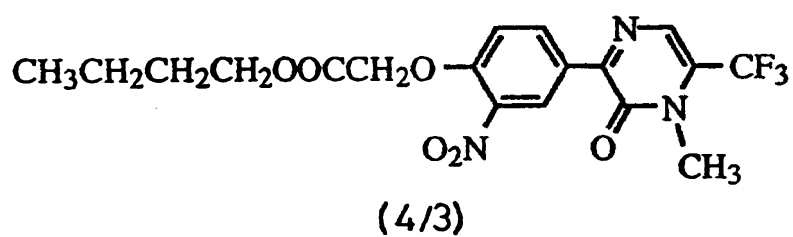
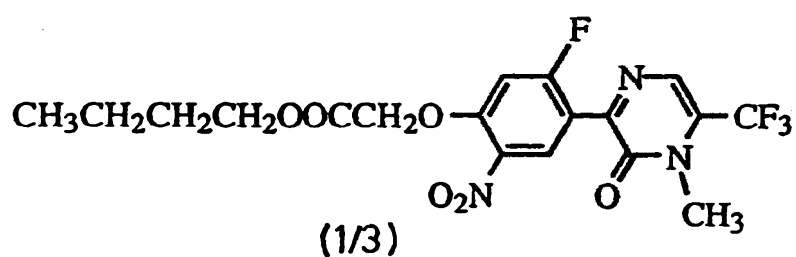
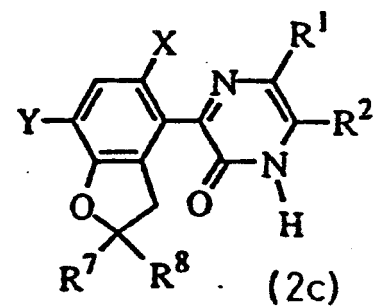
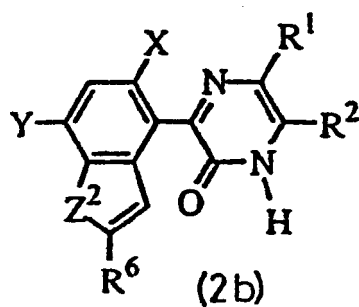
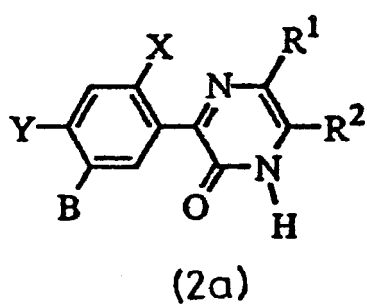
(1c)



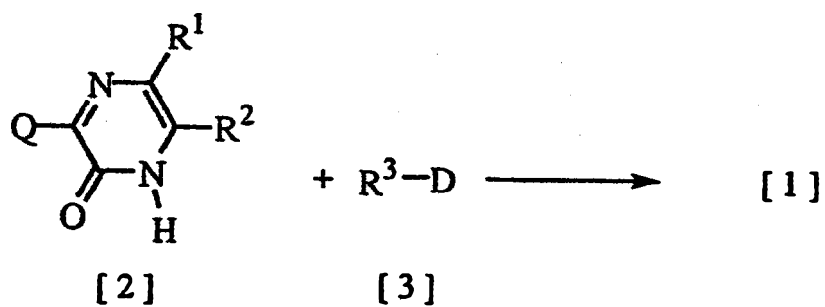
(1d)



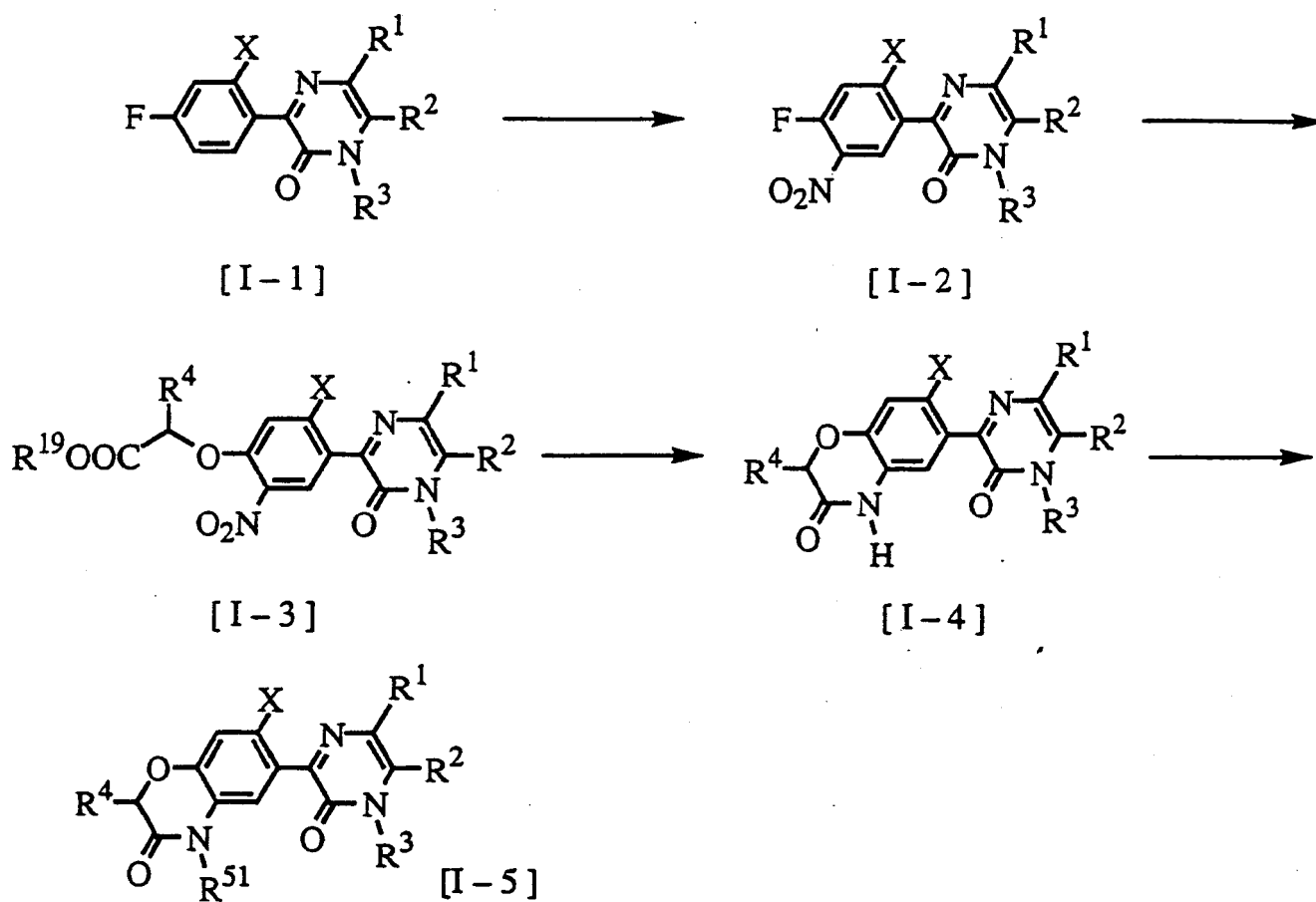
(1e)



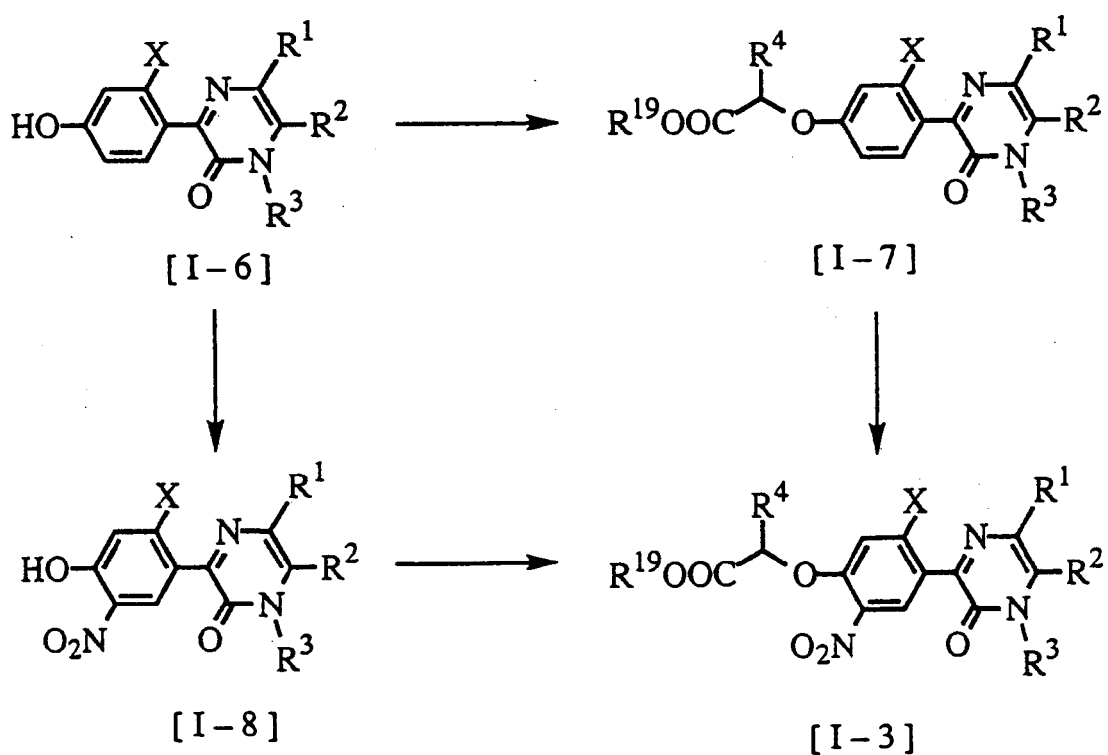
1. reakcióvázlat



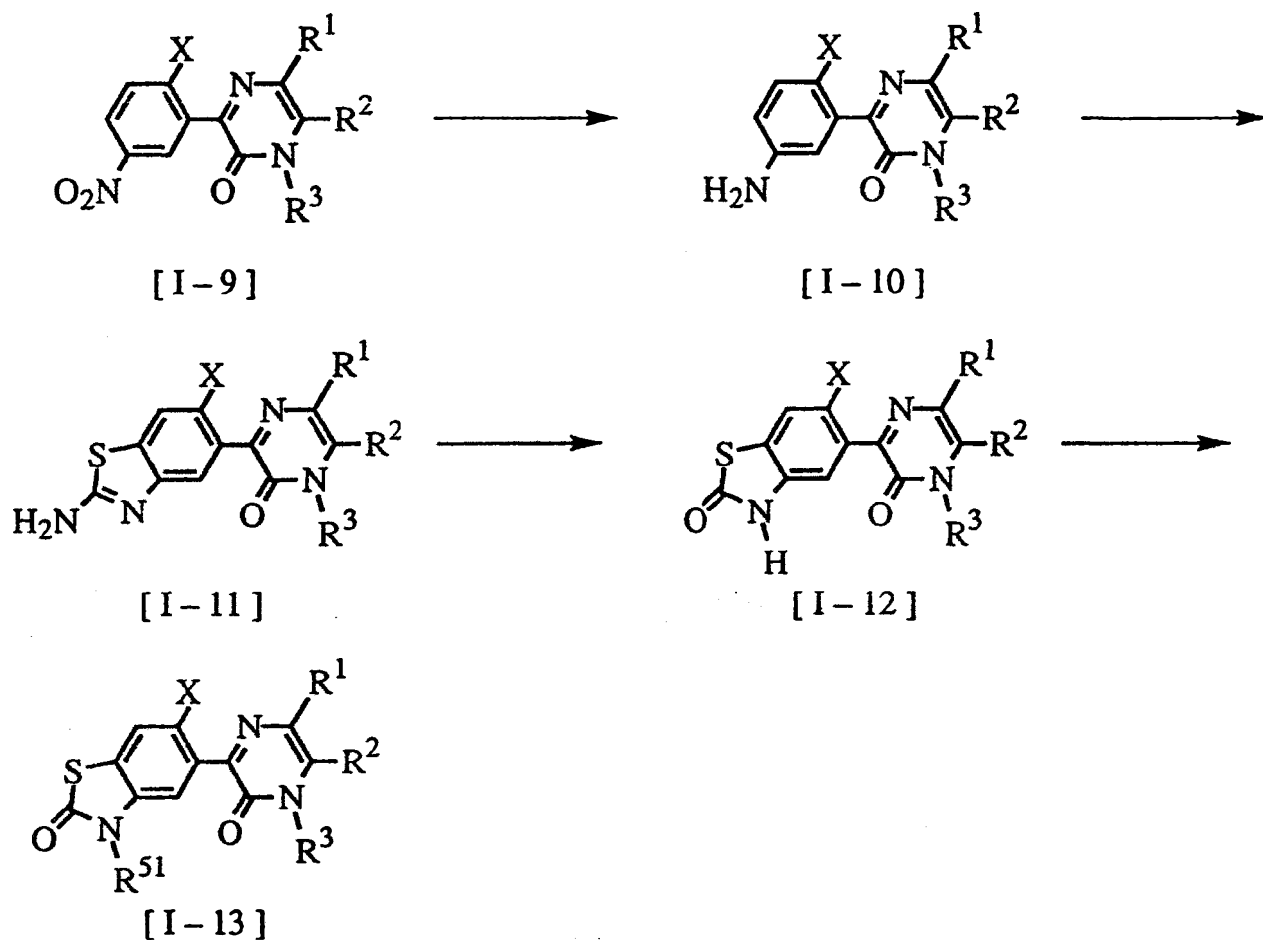
2. reakcióvázlat



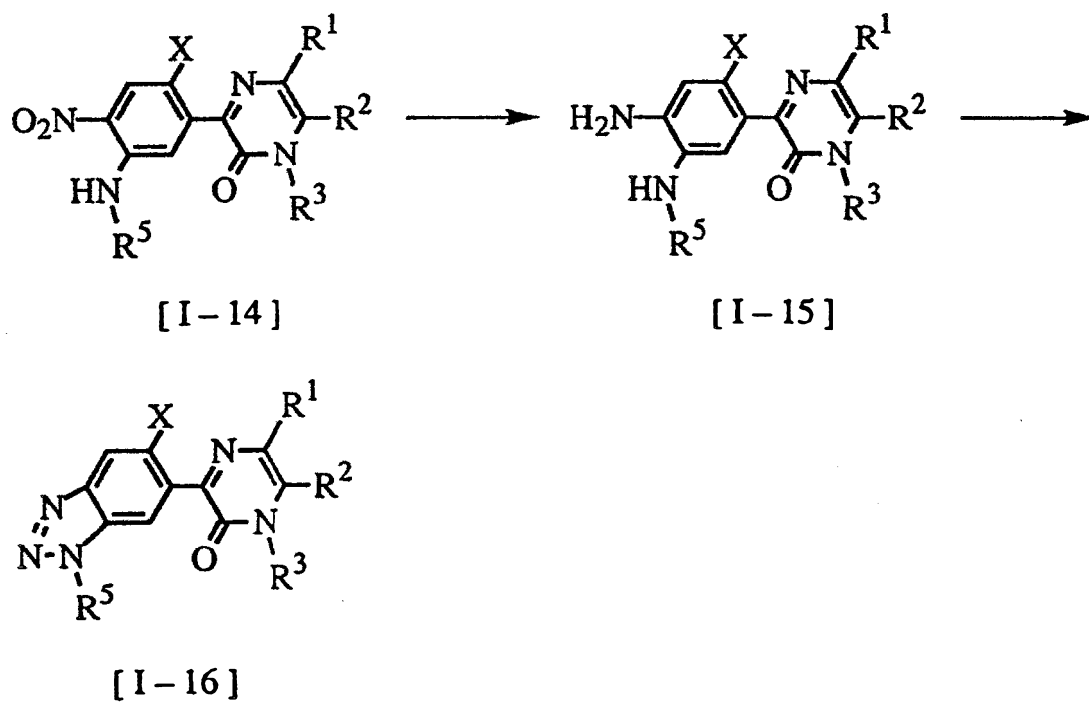
2-1. reakcióvázlat



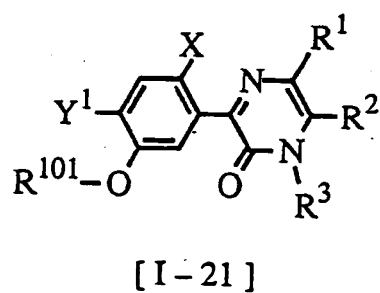
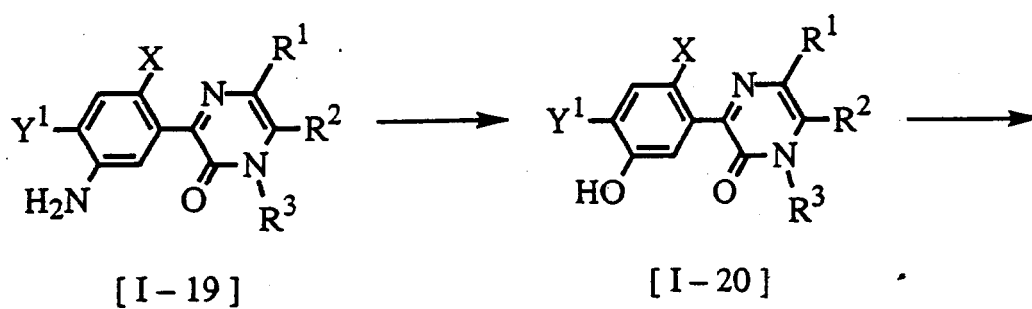
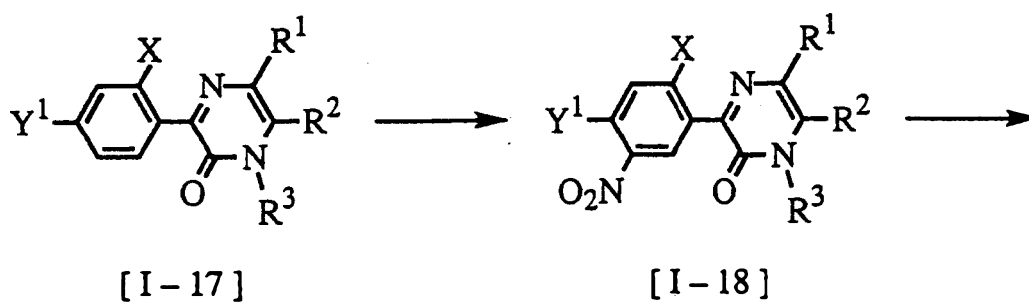
3. reakcióvázlat



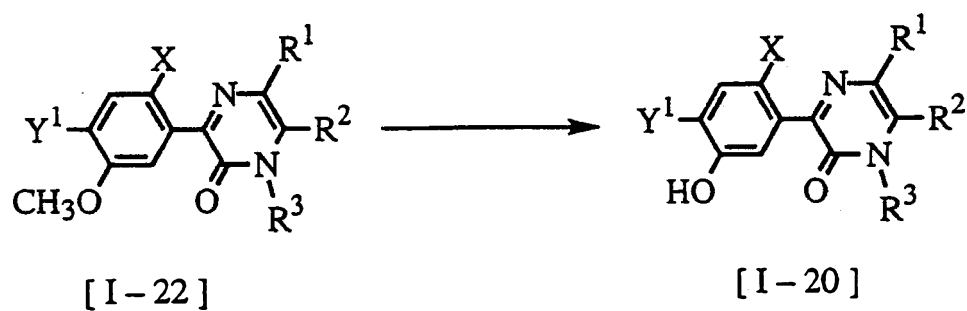
4. reakcióvázlat



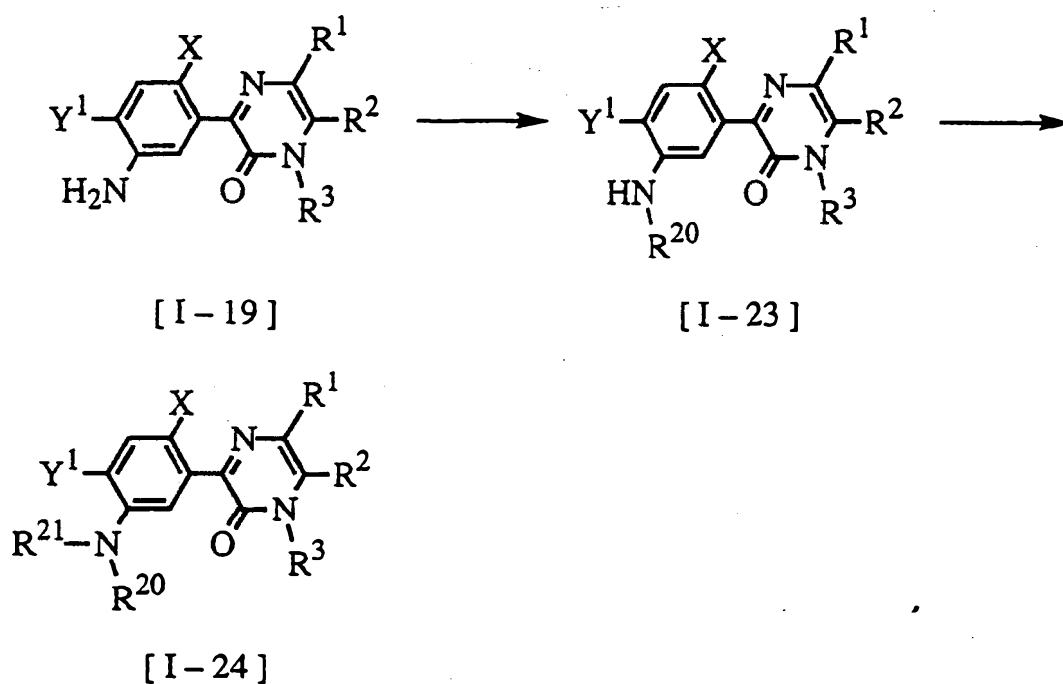
5. reakcióvázlat



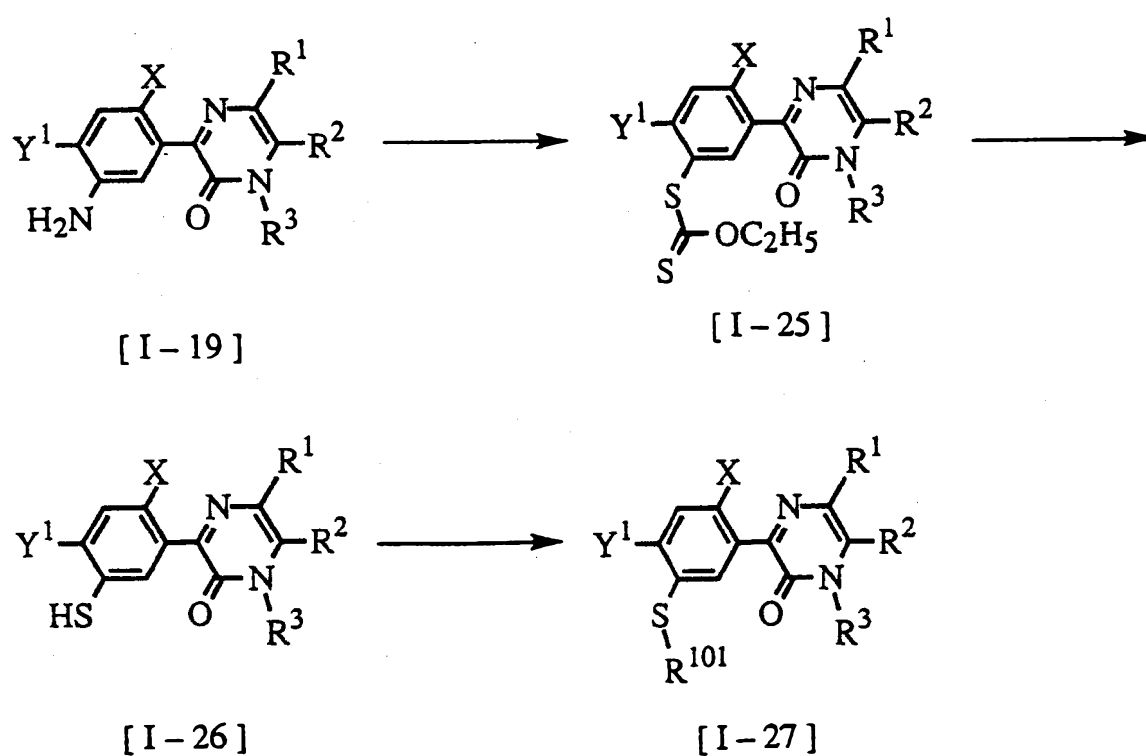
5-1. reakcióvázlat



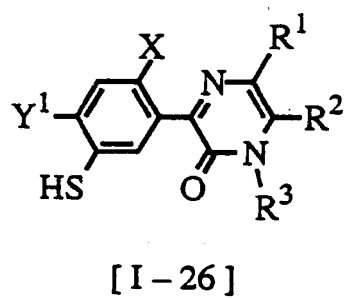
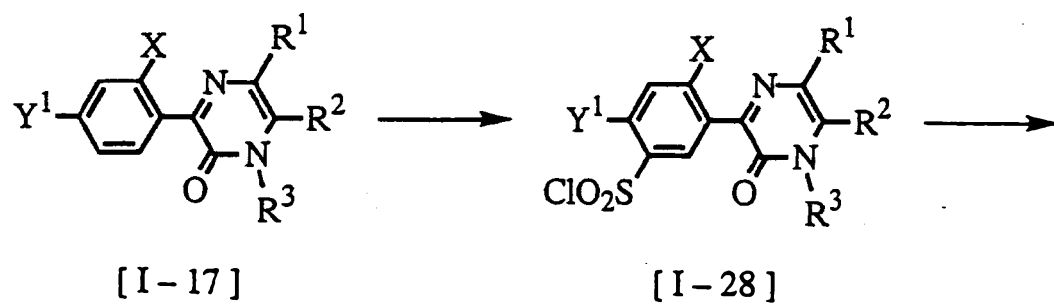
6. reakcióvázlat



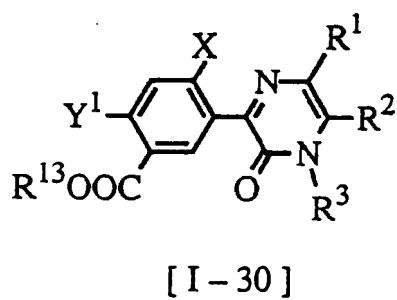
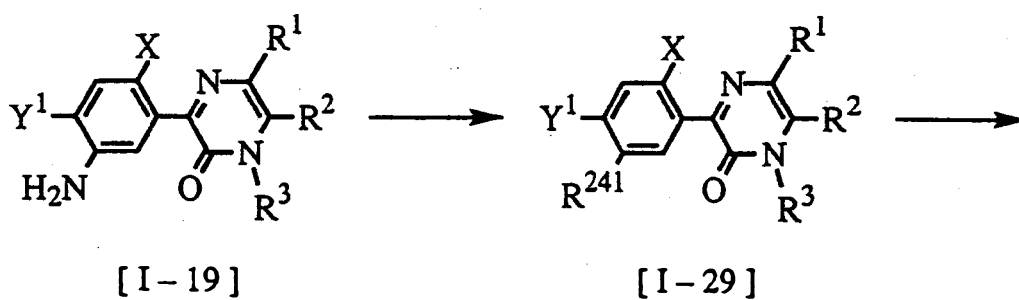
7. reakcióvázlat



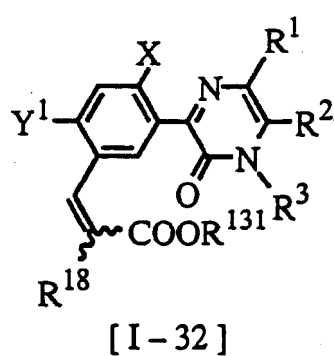
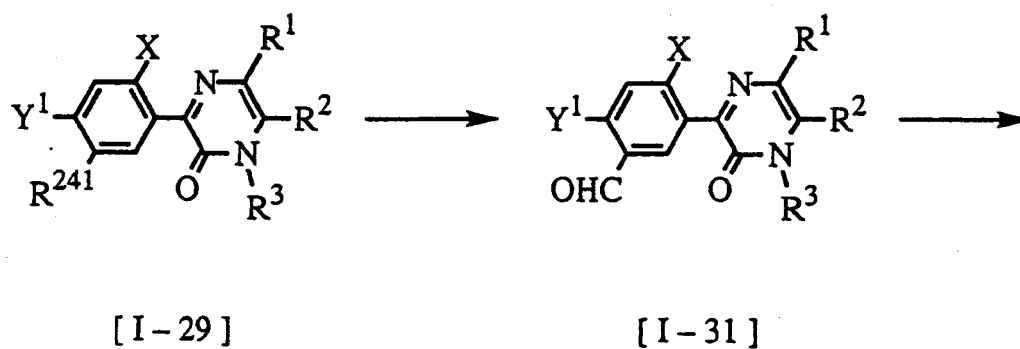
7-1. reakcióvázlat



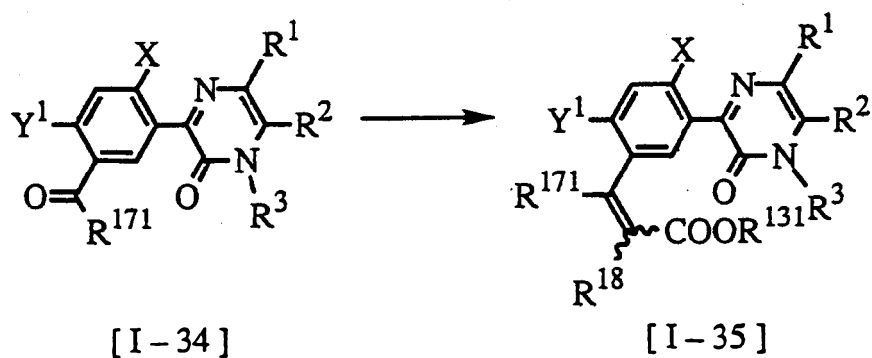
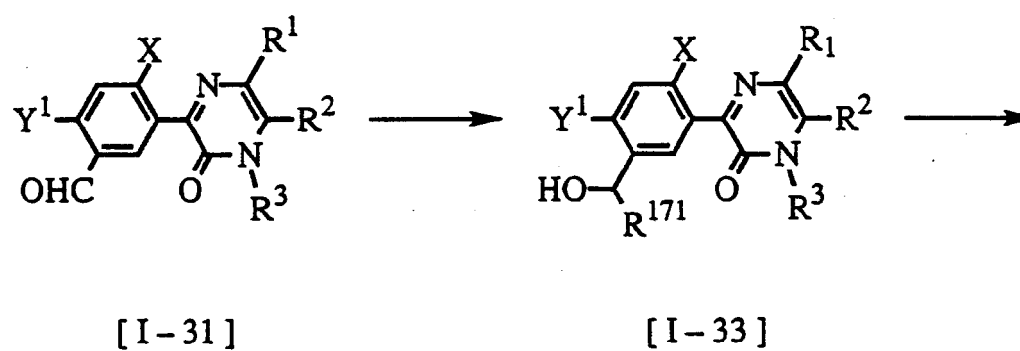
8. reakcióvázlat



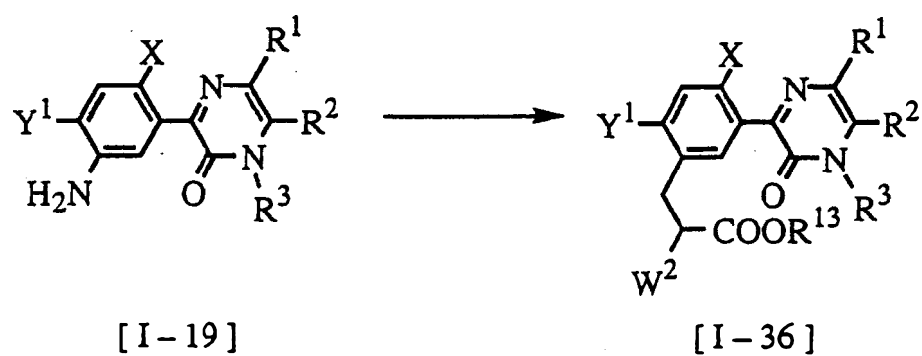
9. reakcióvázlat



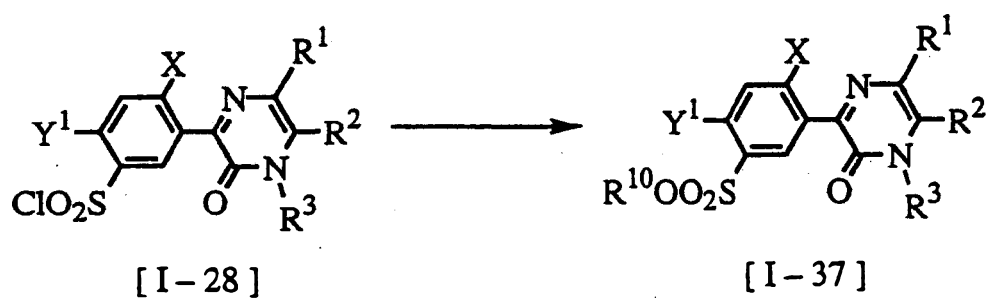
10. reakcióvázlat



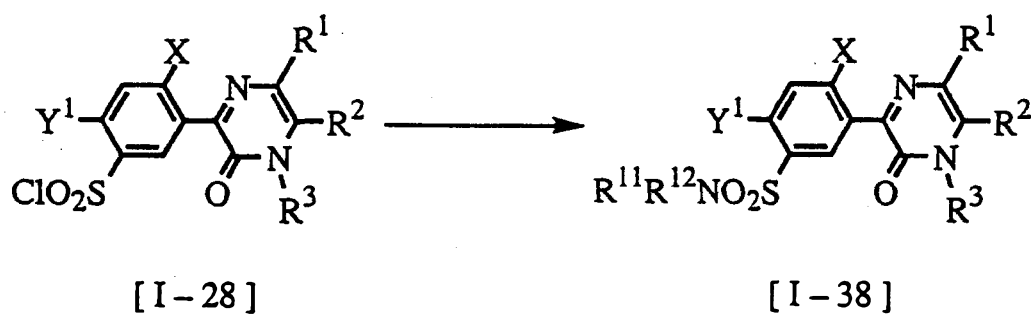
11. reakcióvázlat



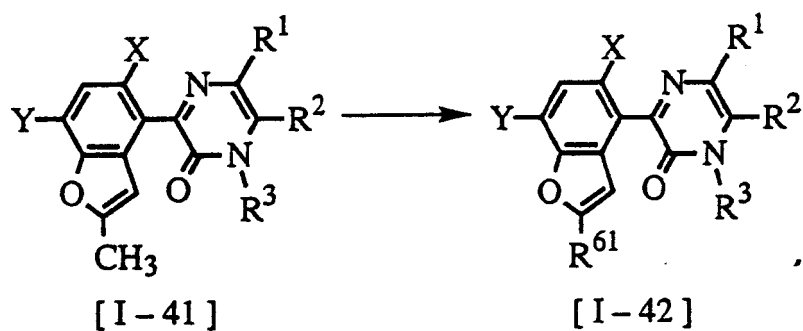
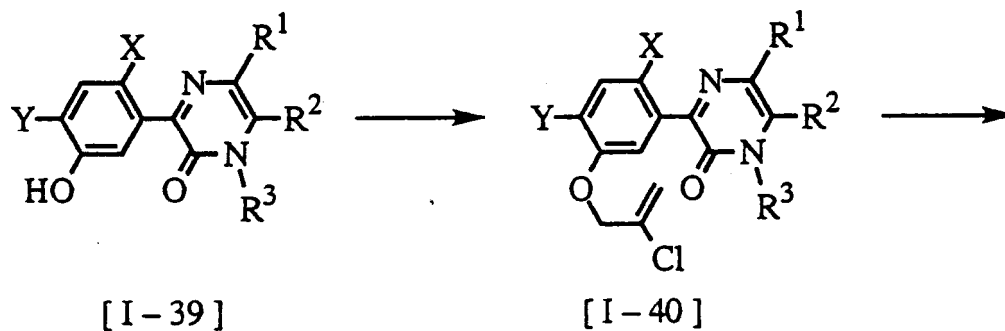
12. reakcióvázlat



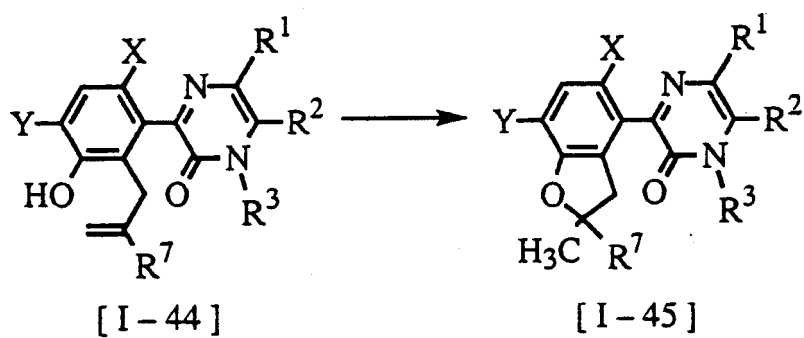
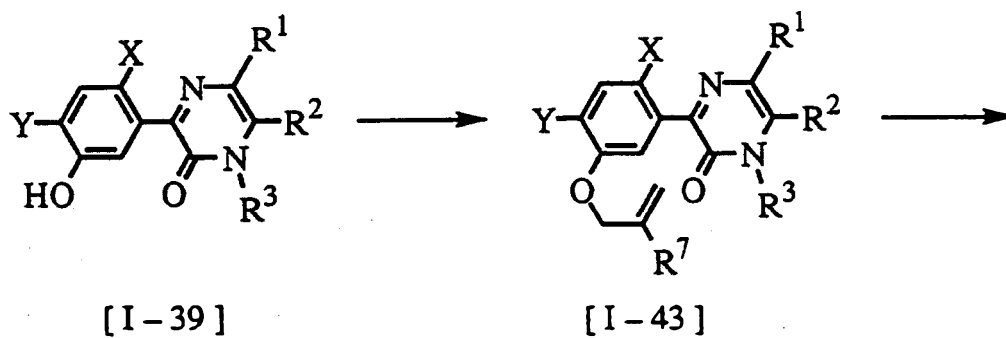
13. reakcióvázlat



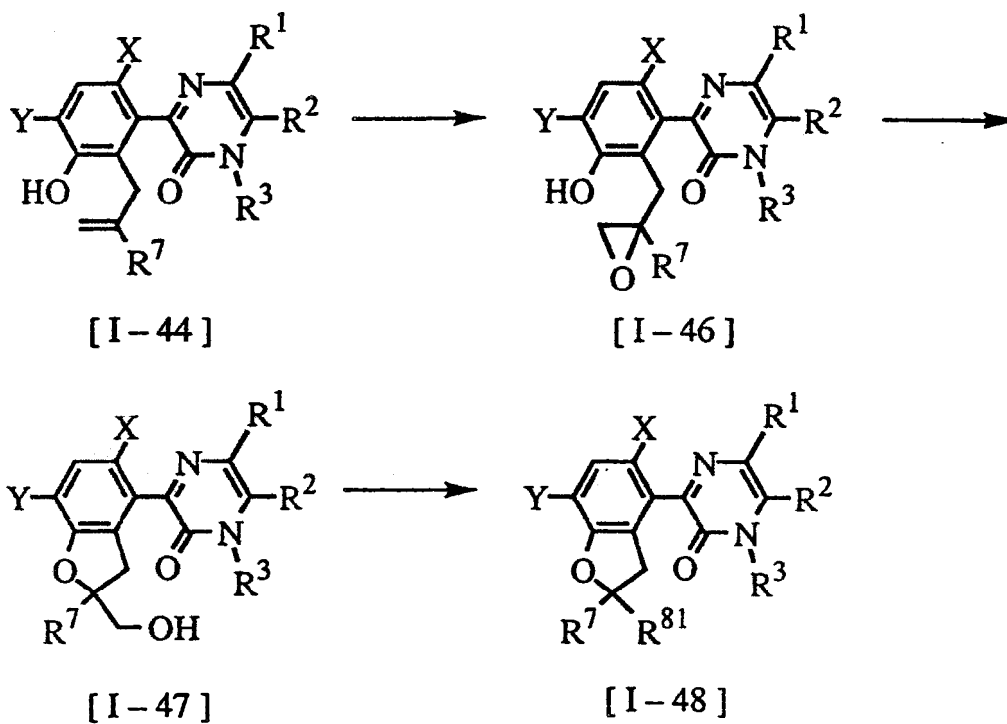
14. reakcióvázlat



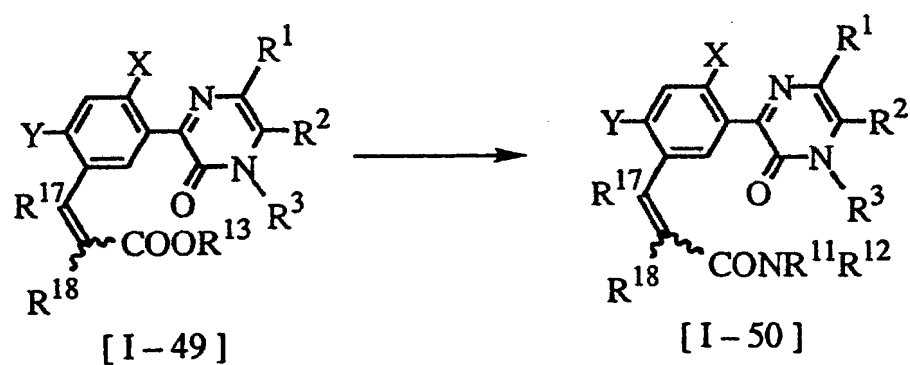
15. reakcióvázlat



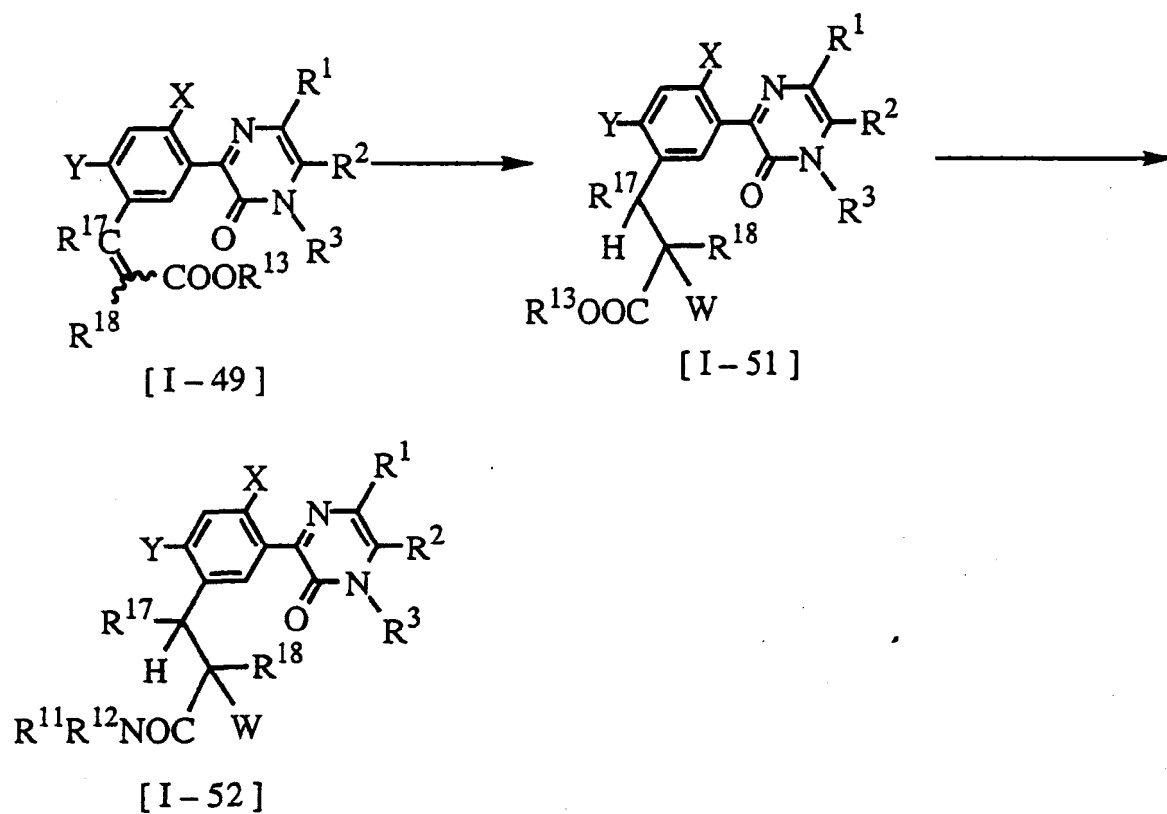
16. reakcióvázlat



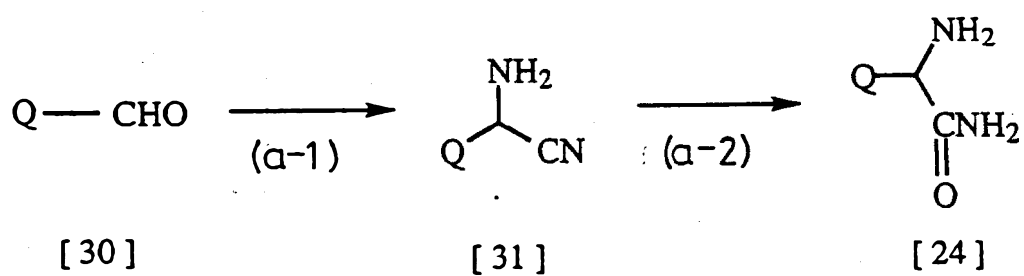
17. reakcióvázlat



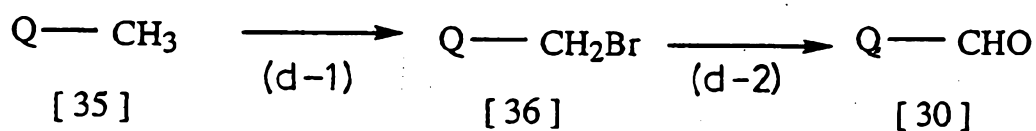
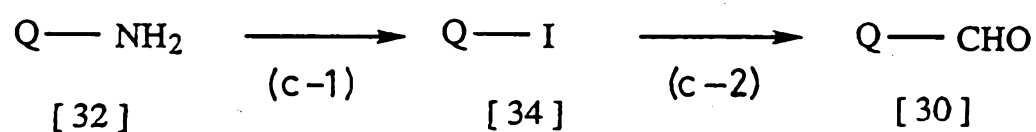
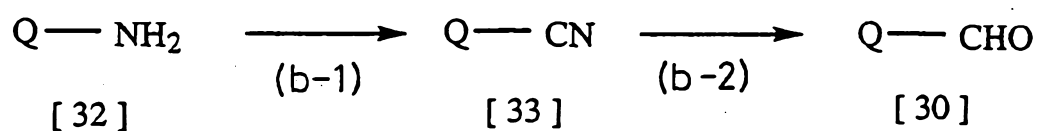
18. reakcióvázlat



19. reakcióvázlat



20. reakcióvázlat



21. reakcióvázlat

