

972196

A
KÖZZÉTETEL
PÉLDÁNY



74606

**Új 1,3-oxazin-4-on-származékok, a vegyületeket tartalmazó
herbicidek készítmények és a vegyületek előállítására szolgáló
közbeneső termékek**

KIVONAT

A találmány (I) általános képletű új 1,3-oxazin-4-on-származékokra vonatkozik, ahol

R¹ rövid szénláncú alkil-, rövid szénláncú alkenil-, rövid szénláncú alkinilcsoport vagy arilcsoport lehet, amely szubsztituálva lehet, vagy szubsztituált aralkilcsoport is lehet,

R² jelentése rövid szénláncú halogén-alkil-, rövid szénláncú hidroxi-alkil-, rövid szénláncú alkoxi-alkil-, rövid szénláncú aciloxi-alkil-, formil-, hidroxi-imino-metil-, rövid szénláncú alkoxi-imino-metil-, rövid szénláncú aciloxi-imino-metil- vagy cianocsoport, vagy rövid szénláncú alkoxi-karbonil-csoport;

R³ jelentése rövid szénláncú alkil- vagy adott esetben szubsztituált arilcsoport, vagy adott esetben szubsztituált aralkilcsoport,

R⁴ és R⁵ egymástól függetlenül rövid szénláncú alkilcsoportot jelent, vagy R⁴ és R⁵ együtt a szénatommal, melyhez kapcsolódnak, 3 - 8-tagú karbociklusos csoportot képeznek, amely rövid szénláncú alkilcsoport elágazást tartalmazhat.

A találmány kiterjed a vegyületeket tartalmazó herbicidek készítményekre, a vegyületek előállítására és intermedierjeire.

972/96

A
KÖZZÉTETELI
PÉLDÁNY



Képviselő:

Danubia Szabadalmi és

Védjegy Iroda Kft.

Budapest

**Új 1,3-oxazin-4-on-származékok, a vegyületeket tartalmazó
herbicidek készítmények és a vegyületek előállítására szolgáló
közberső termékek**

A találmány új 1,3-oxazin-4-on-származékokra vonatkozik, melyek korábbi publikációkban nem szerepelnek, valamint kiterjed a találmány a vegyületeket tartalmazó herbicidek készítményekre, a vegyületek előállítására és a vegyületek előállítására szolgáló közberső termékekre.

Bizonyos típusú 4H-2,3-dihidro-1,3-oxazin-4-on-származékokat leírták például a Tetrahedron Lett. (33), 2905 (1976), Heterocycles, 17, 298 (1982), Chem. Pharm. Bull., 35(5), 1871(1987) irodalmi helyeken. Így ezek ismert vegyületek, azonban a fenti publikációkban leírt vegyületek annyiban különböznek a találmány szerinti vegyületektől, hogy egyikük sem tartalmaz a 3-helyzetben terciér-alkil- vagy -aralkil szubsztituenst, és a vegyületek herbicidek vagy növényi növekedést szabályzó hatásáról sem történt említés.

Az 5 006 157 számú amerikai egyesült államokbeli szabadalmi leírásban 1-(1-metil-1-fenil-etil)-3-fenil-1,2,5,6-tetrahidropiridin-2-on-származékok szerepelnek, valamint ezen vegyületek

83627-3035B-KY/KmO



tek herbicidként történő alkalmazása. A szabadalmi leírásban azonban egyáltalán nem említették a 4H-2,3-dihidro-1,3-oxazin-4-on-származékokat és herbicid hatásukat.

Ezen kívül a leírásban szereplő vegyületek nem elég hatékony herbicidek és nem elég szelektívek.

A jelen találmánnyal azt találtuk, hogy bizonyos típusú 1,3-oxazin-4-on-származékok alacsony dózisban különböző gyomok ellen a haszonnövényekre gyakorolt káros hatás nélkül mutatnak herbicid hatást.

A találmány az (I) általános képletű 1,3-oxazin-4-on-származékokra vonatkozik, ahol

- R¹ rövid szénláncú alkil-, rövid szénláncú alkenil-, rövid szénláncú alkinilcsoport vagy arilcsoport lehet, amely szubsztituálva lehet, vagy szubsztituált aralkilcsoport is lehet,
- R² jelentése rövid szénláncú halogén-alkil-, rövid szénláncú hidroxil-alkil-, rövid szénláncú alkoxil-alkil-, rövid szénláncú aciloxil-alkil-, formil-, hidroxil-imino-metil-, rövid szénláncú alkoxil-imino-metil-, rövid szénláncú aciloxil-imino-metil- vagy cianocsoport, vagy rövid szénláncú alkoxil-karbonil-csoport;
- R³ jelentése rövid szénláncú alkil- vagy adott esetben szubsztituált arilcsoport, vagy adott esetben szubsztituált aralkilcsoport,
- R⁴ és R⁵ egymástól függetlenül rövid szénláncú alkilcsoportot jelent, vagy R⁴ és R⁵ együtt a szénatommal, melyhez kapcsolódnak, 3 - 8-tagú karbociklusos csoportot képeznek, amely rövid szénláncú alkilcsoport elágazást tartalmazhat.



A találmány további tárgya herbicid készítmények, amelyek egy vagy több (I) általános képletű vegyületet tartalmaznak hatóanyagként.

R^1 , R^2 , R^3 , R^4 és R^5 csoportokra példaképpen a következőket nevezzük meg:

"rövid szénláncú alkilcsoport" lehet egyenes vagy elágazó láncú, 1 - 6 szénatomos, és ide tartoznak például a metil-, etil-, n-propil-, izopropil-, n-butyl-, izobutil-szek-butyl-, terc-butyl-, n-pentil-, neopentil-, terc-pentil- vagy hexilcsoport stb.

A "rövid szénláncú alkenilcsoport" 2 - 6 szénatomos alkenilcsoportot jelent, és ide tartoznak például az alkil-, 2-metil-2-propenil, 2-butenil-, 3-butenil-, 3-metil-2-butenil-csoport.

A "rövid szénláncú alkinilcsoport" 2 - 6 szénatomos alkinilcsoport, amely lehet 2-propinil-, 1-metil-2-propinil-, 2-butenil-, 3-butenil-csoport stb.

A "rövid szénláncú halogén-alkil" jelentése 1 - 4 szénatomos halogén-alkil-csoport, és lehet például bróm-metil-, diklór-metil-, trifluor-metil-, 1-klór-etil-, 2-jód-etil-, 3-klór-propil-, 2-metil-2-klór-propil-, 2,2,2-trifluor-etil-csoport stb.

A "rövid szénláncú hidroxil-alkil-csoport" 1 - 4 szénatomos lehet, és például lehet hidroxil-metil- vagy 2-hidroxil-etil-csoport.

A "rövid szénláncú alkoxil-alkil- vagy aciloxil-alkil-csoport" 1 - 4 szénatomos, és 1 - 4 szénatomos rövid szénláncú alkoxilcsoporttal van szubsztituálva, vagy rövid szénláncú 2 - 5 szénatomos acilcsoporttal lehet szubsztituálva, például metoxil-metil-, etoxil-metil- vagy acetil-oxil-metil-csoport.

A "rövid szénláncú alkoxil-imino-metil- vagy rövid szénláncú aciloxil-imino-metil-csoport" 1 - 4 szénatomos alkoxilcsoporttal

szubsztituált imino-metil-csoport vagy 2 - 5 szénatomos acilcsoporttal szubsztituált imino-metil-csoport, és például lehet metoxi-imino-metil-, etoxi-imino-metil- vagy acetiloxi-imino-metil-csoport.

A "rövid szénláncú alkoxi-karbonil-csoport" 2 - 6 szénatomos és lehet például metoxi-karbonil-, etoxi-karbonil- vagy izopropoxi-karbonil-csoport.

Az "adott esetben szubsztituált arilcsoport" lehet például fenil-, naftilcsoport, amely szubsztituálva lehet halogénatommal, rövid szénláncú alkil- vagy alkoxicssoporttal, rövid szénláncú halogén-alkil- vagy halogén-alkoxi-csoporttal, nitrocsoporttal, például fenil-, 2-naftil-, 2-fluor-fenil-, 2-tolil-, 3-nitro-fenil-, 4-klór-2-naftil-, 3,5-diklór-fenil-, 3,5-dimetoxi-fenil-, 3,5-bisz(difluor-metoxi)-fenil-, vagy 3,5-diklór-4-metil-fenil-csoport.

Az "adott esetben szubsztituált aralkilcsoport" tartalmazhat egy adott esetben szubsztituált arilcsoportot, amelyet fent definiáltunk, és lehet például benzil-, (2-klór-fenil)-metil-, 1-(3-klór-fenil)-etil-, 2-fenil-etil-, 1-metil-1-fenil-etil-, 1-metil-2-fenil-etil-, 1-etil-2-(3-trifluor-metil-fenil)-etil- vagy (2-difluor-metoxi-fenil)-metil- vagy 3-fenil-propil-csoport.

A "3-8 tagú karbociklusos csoport, amely rövid szénláncú alkilcsoport elágazást tartalmazhat", lehet ciklopropán, ciklobután, ciklopentán, ciklohexán, cikloheptán, ciklooktán, 2,2'-dimetil-ciklopropán, vagy 3,5-dietil-ciklohexán-csoport stb.

A halogénatom, a rövid szénláncú alkoxicssoport, a rövid szénláncú halogén-alkil- vagy halogén-alkoxi-csoport és a rövid szénláncú acilcsoport magyarázata a következő:

A halogénatom lehet fluor-, klór-, bróm- vagy jódatom.



A rövid szénláncú alkoxicsoport olyan alkoxicsoport, amely az alkilcsoport helyzetében a fenti rövid szénláncú alkoxicsoportot tartalmazza, például metoxi-, etoxi-, propoxi-, izopropoxi-, butoxi- vagy pentoxicsoport.

A rövid szénláncú halogén-alkil-csoport olyan csoport, amelynek egy vagy több hidrogénatomja szubsztituálva van a fenti halogénatomokkal, és lehet például bróm-metil-, diklór-metil-, trifluor-metil-, 1-klór-etil-, 2-jód-etil-, 3-klór-propil-, 2-metil-2-klór-propil-, 2,2,2-trifluor-etil- stb. csoport.

A rövid szénláncú halogén-alkoxi-csoport olyan csoport, amely az alkilcsoport fenti helyzetében halogén-alkil-csoportot tartalmaz, például triflor-metoxi-, difluor-metoxi-, klór-difluor-metoxi-, 2-klór-etoxi-, 1,1,2,2-tetrafluor-etoxi-, 3-klór-propoxi-, 2,2,3,3,3-pentafluor-propoxi-csoport.

A rövid szénláncú acilcsoport lehet például acetil-, propionil-, butiril- vagy izobutirilcsoport.

A részletesebben nem leírt csoportokat a már leírt atomokból vagy csoportokból lehet megválasztani kombinációval vagy ismert módon.

A találmány szerinti (I) általános képletű vegyületek közül előnyösek a következők, ahol

R^1 jelentése elágazó láncú alkilcsoport, például izobutil- vagy izopropil-csoport, vagy adott esetben szubsztituált fenil-csoport, ahol a szubsztituens halogénatom vagy rövid szénláncú alkilcsoport;

R^3 jelentése fenil- vagy 2-naftilcsoport, amely adott esetben szubsztituálva lehet egy vagy két halogénatommal, rövid szénláncú halogén-alkil- vagy halogén-alkoxi-csoporttal;

R^4 és R^5 egymástól függetlenül metilcsoport.



Még előnyösebbek a következő (I-1) általános képletű vegyületek:

ahol R^2 jelentése a fenti, X jelentése halogénatom vagy rövid szénláncú alkilcsoport, Y jelentése halogénatom vagy rövid szénláncú halogén-alkil-csoport, n értéke 0 vagy 1 és m értéke 0, 1 vagy 2.

A találmány szerinti vegyületekhez tartoznak a következő (II-2) általános képletű vegyületek, amelyek a találmány szerinti vegyületek intermedierjei, és ahol R^1 jelentése adott esetben szubsztituált arilcsoport és R^2 jelentése acetil-oxi-metil-csoport.

R^6 jelentése adott esetben szubsztituált arilcsoport.

A vegyületeket a (II-1) általános képlettel jellemezhetjük, amelyeket a (II-2) általános képletű vegyületekből származtathatunk, ahol R^6 adott esetben szubsztituált arilcsoport, R^7 jelentése hidroxil-metil- vagy formilcsoport. Ezen vegyületek újak, és ezért a találmányhoz tartoznak.

A találmány tehát kiterjed a (II) általános képletű 1,3-dioxin-4-on-származékokra is, ahol R^6 jelentése adott esetben szubsztituált arilcsoport, R^7 jelentése hidroxil-metil- vagy acetil-oxi-metil- vagy formilcsoport.

Az R^6 jelentésében az adott esetben szubsztituált arilcsoport jelentése fenil- vagy naftilcsoport, vagy olyan arilcsoport, amely szubsztituálva van halogénatommal, rövid szénláncú alkil-, alkoxi-, halogén-alkil- vagy nitrocsoporttal. A fenilcsoport előnyösen a 2-heyzetben van szubsztituálva.

A fenti (II) általános képletben R^6 jelentése a fent megadott.

Az (I) általános képletű vegyületek példáit az 1. táblázatban és a (II) általános képletű vegyületek példáit a 2. táblázatban adjuk meg.

A táblázatokban lévő rövidítések:

Me metilcsoport,

Pr propilcsoport,

Bu butilcsoport,

Ac acetylcs csoport,

Et etilcsoport,

iPr izopropil-csoport,

tBu terc-butyl-csoport,

- nincs szubsztituens.

(A), (B), (C), (E), (F), (a), (b), (c), (d) általános képletű vegyületek.

1. táblázat
(I) általános képletű vegyületek

A vegy. száma	R ¹		R ²	R ³		R ⁴	R ⁵
	(A)	(X) _n		(a)	(Y) _m		
1	(A)	—	CH ₂ F	(a)	—	Me	Me
2	(A)	—	CH ₂ F	(a)	3-F	Me	Me
3	(A)	—	CH ₂ F	(a)	3-Cl	Me	Me
4	(A)	—	CH ₂ F	(a)	3-Cl, 5-Cl	Me	Me
5	(A)	—	CH ₂ F	(a)	3-Me	Me	Me
6	(A)	—	CH ₂ F	(a)	3-CF ₃	Me	Me
7	(A)	2-F	CH ₂ F	(a)	—	Me	Me
8	(A)	2-F	CH ₂ F	(a)	3-Cl, 5-Cl	Me	Me
9	(A)	2-Cl	CH ₂ F	(a)	—	Me	Me
10	(A)	2-Cl	CH ₂ F	(a)	3-Cl, 5-Cl	Me	Me
11	(A)	2-Me	CH ₂ F	(a)	—	Me	Me
12	(A)	3-Me	CH ₂ F	(a)	—	Me	Me
13	(A)	2-CF ₃	CH ₂ F	(a)	—	Me	Me
14	(A)	—	CH ₂ F	(b)	—	Me	Me
15	(A)	—	CH ₂ F	(b)	4-Cl	Me	Me
16	(A)	—	CH ₂ F	(c)	—	Me	Me
17	(B)	—	CH ₂ F	(a)	—	Me	Me
18	(B)	—	CH ₂ F	(a)	3-Cl	Me	Me
19	(B)	—	CH ₂ F	(a)	3-Cl, 5-Cl	Me	Me
20	(C)	—	CH ₂ F	(a)	—	Me	Me
21	(C)	—	CH ₂ F	(a)	3-Cl	Me	Me

1. táblázat (folytatás)

A vegy. száma	R ¹		R ²	R ³		R ⁴	R ⁵
		(X) _n			(Y) _m		
22	(A)	—	CH ₂ F		Me	Me	Me
23	(A)	—	CH ₂ F		Et	Me	Me
24	(A)	—	CH ₂ F		Pr	Me	Me
25	(A)	—	CH ₂ F		tBu	Me	Me
26		Me	CH ₂ F	(a)	—	Me	Me
27		Me	CH ₂ F	(a)	3-Cl, 5-Cl	Me	Me
28		Et	CH ₂ F	(a)	—	Me	Me
29		Et	CH ₂ F	(a)	3-Cl, 5-Cl	Me	Me
30		iPr	CH ₂ F	(a)	—	Me	Me
31		iPr	CH ₂ F	(a)	3-Cl, 5-Cl	Me	Me
32		Bu	CH ₂ F	(a)	—	Me	Me
33		Bu	CH ₂ F	(a)	3-Cl, 5-Cl	Me	Me
34	(A)	—	CHF ₂	(a)	—	Me	Me
35	(A)	—	CHF ₂	(a)	3-Cl	Me	Me
36	(A)	—	CHF ₂	(a)	3-Cl, 5-Cl	Me	Me
37	(A)	2-F	CHF ₂	(a)	—	Me	Me
38	(A)	2-Cl	CHF ₂	(a)	—	Me	Me
39	(A)	2-Me	CHF ₂	(a)	—	Me	Me
40	(A)	—	CHF ₂	(b)	—	Me	Me
41	(A)	—	CHF ₂	(c)	—	Me	Me
42	(B)	—	CHF ₂	(a)	—	Me	Me
43	(C)	—	CHF ₂	(a)	—	Me	Me
44	(A)	—	CHF ₂		Me	Me	Me
45	(A)	—	CHF ₂		Et	Me	Me
46		Me	CHF ₂	(a)	—	Me	Me

1. táblázat (folytatás)

A vegy. száma	R ¹		R ²	R ³		R ⁴	R ⁵
	(X) _n			(Y) _m			
47		Me	CHF ₂	(a)	3-Cl, 5-Cl	Me	Me
48	(A)	—	CF ₃	(a)	—	Me	Me
49	(A)	—	CF ₃	(a)	3-Cl, 5-Cl	Me	Me
50	(A)	—	CF ₃	(b)	—	Me	Me
51	(A)	—	CF ₃	(c)	—	Me	Me
52	(A)	—	CF ₃		Me	Me	Me
53	(A)	—	CH ₂ OH	(a)	—	Me	Me
54	(A)	—	CH ₂ OH	(a)	3-Cl	Me	Me
55	(A)	—	CH ₂ OH	(a)	3-Cl, 5-Cl	Me	Me
56	(A)	—	CH ₂ OH	(b)	—	Me	Me
57	(A)	—	CH ₂ OH	(c)	—	Me	Me
58	(B)	—	CH ₂ OH	(a)	—	Me	Me
59	(C)	—	CH ₂ OH	(a)	—	Me	Me
60	(A)	—	CH ₂ OH		Me	Me	Me
61	(A)	—	CH ₂ OH		Et	Me	Me
62		Me	CH ₂ OH	(a)	—	Me	Me
63		Et	CH ₂ OH	(a)	—	Me	Me
64		iPr	CH ₂ OH	(a)	—	Me	Me
65		Bu	CH ₂ OH	(a)	—	Me	Me
66	(A)	—	CH ₂ OAc	(a)	—	Me	Me
67	(A)	—	CH ₂ OAc	(a)	3-F	Me	Me
68	(A)	—	CH ₂ OAc	(a)	3-Cl	Me	Me
69	(A)	—	CH ₂ OAc	(a)	3-Cl, 5-Cl	Me	Me
70	(A)	—	CH ₂ OAc	(a)	3-Me	Me	Me
71	(A)	—	CH ₂ OAc	(a)	3-CF ₃	Me	Me



1. táblázat (folytatás)

A vegy. száma	R ¹		R ²	R ³		R ⁴	R ⁵
		(X) _n			(Y) _m		
72	(A)	—	CH ₂ OAc	(a)	3-OMe	Me	Me
73	(A)	2-F	CH ₂ OAc	(a)	—	Me	Me
74	(A)	2-F	CH ₂ OAc	(a)	3-Cl, 5-Cl	Me	Me
75	(A)	2-Cl	CH ₂ OAc	(a)	—	Me	Me
76	(A)	2-Cl	CH ₂ OAc	(a)	3-Cl, 5-Cl	Me	Me
77	(A)	3-Cl	CH ₂ OAc	(a)	—	Me	Me
78	(A)	3-Cl	CH ₂ OAc	(a)	3-Cl, 5-Cl	Me	Me
79	(A)	2-Me	CH ₂ OAc	(a)	—	Me	Me
80	(A)	2-Me	CH ₂ OAc	(a)	3-Cl, 5-Cl	Me	Me
81	(A)	3-Me	CH ₂ OAc	(a)	—	Me	Me
82	(A)	3-Me	CH ₂ OAc	(a)	3-Cl, 5-Cl	Me	Me
83	(A)	—	CH ₂ OAc	(b)	—	Me	Me
84	(A)	—	CH ₂ OAc	(b)	4-Cl	Me	Me
85	(A)	—	CH ₂ OAc	(c)	—	Me	Me
86	(A)	—	CH ₂ OAc	(c)	3-Cl	Me	Me
87	(A)	—	CH ₂ OAc	(d)	—	Me	Me
88	(A)	—	CH ₂ OAc	(d)	2-Cl	Me	Me
89	(A)	—	CH ₂ OAc	(d)	2-Me	Me	Me
90	(B)	—	CH ₂ OAc	(a)	—	Me	Me
91	(B)	—	CH ₂ OAc	(a)	3-Cl, 5-Cl	Me	Me
92	(C)	—	CH ₂ OAc	(a)	—	Me	Me
93	(C)	—	CH ₂ OAc	(a)	3-Cl, 5-Cl	Me	Me
94	(E)	—	CH ₂ OAc	(a)	—	Me	Me
95	(E)	—	CH ₂ OAc	(a)	3-Cl, 5-Cl	Me	Me
96	(F)	—	CH ₂ OAc	(a)	—	Me	Me

1. táblázat (folytatás)

A vegy. száma	R ¹		R ²	R ³		R ⁴	R ⁵
	(F)	(X) _n		(a)	(Y) _m		
97	(F)	—	CH ₂ OAc	(a)	3-Cl, 5-Cl	Me	Me
98	(A)	—	CH ₂ OAc		Me	Me	Me
99	(A)	—	CH ₂ OAc		Et	Me	Me
100	(A)	—	CH ₂ OAc		Pr	Me	Me
101	(A)	—	CH ₂ OAc		iPr	Me	Me
102	(A)	—	CH ₂ OAc		Bu	Me	Me
103	(A)	—	CH ₂ OAc		tBu	Me	Me
104		Me	CH ₂ OAc	(a)	—	Me	Me
105		Me	CH ₂ OAc	(a)	3-Cl, 5-Cl	Me	Me
106		Et	CH ₂ OAc	(a)	—	Me	Me
107		Et	CH ₂ OAc	(a)	3-Cl, 5-Cl	Me	Me
108		CH=CH ₂	CH ₂ OAc	(a)	—	Me	Me
109		CH=CH ₂	CH ₂ OAc	(a)	3-Cl, 5-Cl	Me	Me
110		CH ₂ CH=CH ₂	CH ₂ OAc	(a)	—	Me	Me
111		CH ₂ CH=CH ₂	CH ₂ OAc	(a)	3-Cl, 5-Cl	Me	Me
112		C≡CH	CH ₂ OAc	(a)	—	Me	Me
113		C≡CH	CH ₂ OAc	(a)	3-Cl, 5-Cl	Me	Me
114	(A)	—	CH ₂ OAc	(a)	—	Me	Me
115	(A)	—	CH ₂ OAc	(a)	3-Cl	Me	Me
116	(A)	—	CH ₂ OAc	(a)	3-Cl, 5-Cl	Me	Me
117	(A)	—	CH ₂ OAc	(b)	—	Me	Me
118	(A)	—	CH ₂ OAc	(c)	—	Me	Me
119	(A)	—	CH ₂ OAc		Me	Me	Me
120	(A)	—	CH ₂ OAc		Et	Me	Me

1. táblázat (folytatás)

A vegy. száma	R ¹		R ²	R ³		R ⁴	R ⁵
		(X) _n			(Y) _m		
121	(A)	—	CHO	(a)	—	Me	Me
122	(A)	—	CHO	(a)	3-Cl, 5-Cl	Me	Me
123	(A)	—	CHO	(b)	—	Me	Me
124	(A)	—	CHO	(c)	—	Me	Me
125	(A)	—	CHO	(d)	—	Me	Me
126	(B)	—	CHO	(a)	—	Me	Me
127	(B)	—	CHO	(a)	3-Cl, 5-Cl	Me	Me
128	(C)	—	CHO	(a)	—	Me	Me
129	(A)	—	CHO	Me		Me	Me
130	(A)	—	CHO	Et		Me	Me
131	(A)	—	CHO	Pr		Me	Me
132		Me	CHO	(a)	—	Me	Me
133		Et	CHO	(a)	—	Me	Me
134	(A)	—	CH=NOH	(a)	—	Me	Me
135	(A)	—	CH=NOH	(a)	3-Cl, 5-Cl	Me	Me
136	(A)	—	CH=NOH	(b)	—	Me	Me
137	(A)	—	CH=NOH	(c)	—	Me	Me
138	(B)	—	CH=NOH	(a)	—	Me	Me
139	(C)	—	CH=NOH	(a)	—	Me	Me
140	(A)	—	CH=NOH	Me		Me	Me
141	(A)	—	CH=NOH	Et		Me	Me
142	(A)	—	CH=NOH	Pr		Me	Me
143	(A)	—	CH=NOH	iPr		Me	Me
144		Me	CH=NOH	(a)	—	Me	Me
145	(A)	—	CH=NOAc	(a)	—	Me	Me
146	(A)	—	CH=NOAc	(a)	3-Cl	Me	Me
147	(A)	—	CH=NOAc	(a)	3-Cl, 5-Cl	Me	Me

1. táblázat (folytatás)

A vegy. száma	R ¹		R ²	R ³		R ⁴	R ⁵
	(A)	(X) _n		(a)	(Y) _m		
148	(A)	2-F	CH=NOAc	(a)	-	Me	Me
149	(A)	2-F	CH=NOAc	(a)	3-Cl, 5-Cl	Me	Me
150	(A)	2-Cl	CH=NOAc	(a)	-	Me	Me
151	(A)	2-Cl	CH=NOAc	(a)	3-Cl, 5-Cl	Me	Me
152	(A)	2-Me	CH=NOAc	(a)	-	Me	Me
153	(A)	2-Me	CH=NOAc	(a)	3-Cl, 5-Cl	Me	Me
154	(A)	-	CH=NOAc	(b)	-	Me	Me
155	(A)	-	CH=NOAc	(c)	-	Me	Me
156	(A)	-	CH=NOAc		Me	Me	Me
157	(A)	-	CH=NOAc		Et	Me	Me
158	(A)	-	CH=NO ₂	(a)	-	Me	Me
159	(A)	-	CH=NO ₂	(a)	3-Cl	Me	Me
160	(A)	-	CH=NO ₂	(a)	3-Cl, 5-Cl	Me	Me
161	(A)	-	CH=NO ₂	(b)	-	Me	Me
162	(A)	-	CH=NO ₂		Me	Me	Me
163	(A)	-	CH=NO ₂		Et	Me	Me
164	(A)	-	CN	(a)	-	Me	Me
165	(A)	-	CN	(a)	3-F	Me	Me
166	(A)	-	CN	(a)	3-Cl	Me	Me
167	(A)	-	CN	(a)	3-Cl, 5-Cl	Me	Me
168	(A)	-	CN	(a)	3-Me	Me	Me
169	(A)	-	CN	(a)	3-CF ₃	Me	Me
170	(A)	-	CN	(b)	-	Me	Me
171	(A)	-	CN	(c)	-	Me	Me
172	(B)	-	CN	(a)	-	Me	Me
173	(B)	-	CN	(a)	3-Cl, 5-Cl	Me	Me
174	(A)	-	CN		Me	Me	Me



1. táblázat (folytatás)

A vegy. száma	R ¹		R ²	R ³		R ⁴	R ⁵
	(A)	(X) _n		(a)	(Y) _m		
175	(A)	—	CN		Et	Me	Me
176	(A)	—	COOMe	(a)	—	Me	Me
177	(A)	—	COOMe	(a)	3-Cl, 5-Cl	Me	Me
178	(A)	—	COOMe	(b)	—	Me	Me
179	(A)	—	COOMe		Me	Me	Me
180	(A)	—	COOMe		Et	Me	Me
181	(A)	—	COOEt	(a)	—	Me	Me
182	(A)	—	COOEt	(a)	3-Cl, 5-Cl	Me	Me
183	(A)	—	COOEt	(b)	—	Me	Me
184	(A)	—	COOEt		Me	Me	Me
185	(A)	—	COOEt		Et	Me	Me
186	(A)	—	CH ₂ F	(a)	—	Me	Et
187	(A)	—	CHF ₂	(a)	—	Me	Et
188	(A)	—	CF ₃	(a)	—	Me	Et
189	(A)	—	CH ₂ OH	(a)	—	Me	Et
190	(A)	—	CH ₂ OH	(a)	3-Cl	Me	Et
191	(A)	—	CH ₂ OH	(a)	3-Cl, 5-Cl	Me	Et
192	(A)	—	CH ₂ OAc	(a)	—	Me	Et
193	(A)	—	CH ₂ OMe	(a)	—	Me	Et
194	(A)	—	CHO	(a)	—	Me	Et
195	(A)	—	CHO	(a)	3-Cl	Me	Et
196	(A)	—	CHO	(a)	3-Cl, 5-Cl	Me	Et
197	(A)	—	CH=NOH	(a)	—	Me	Et
198	(A)	—	CH=NOAc	(a)	—	Me	Et
199	(A)	—	CH=NOMe	(a)	—	Me	Et

1. táblázat (folytatás)

A vegy. száma	R ¹		R ²	R ³		R ⁴		R ⁵
	(A)	(X) _n		(a)	(Y) _m			
200	(A)	—	CN	(a)	—	Me	Et	
201	(A)	—	COOMe	(a)	—	Me	Et	
202	(A)	—	CH ₂ F	(a)	—	—CH ₂ CH ₂ —		
203	(A)	—	CHF ₂	(a)	—	—CH ₂ CH ₂ —		
204	(A)	—	CF ₃	(a)	—	—CH ₂ CH ₂ —		
205	(A)	—	CH ₂ OH	(a)	—	—CH ₂ CH ₂ —		
206	(A)	—	CH ₂ OAc	(a)	—	—CH ₂ CH ₂ —		
207	(A)	—	CHO	(a)	—	—CH ₂ CH ₂ —		
208	(A)	—	CN	(a)	—	—CH ₂ CH ₂ —		
209	(A)	—	CH ₂ F	(a)	—	—CH ₂ CH ₂ CH ₂ —		
210	(A)	—	CHF ₂	(a)	—	—CH ₂ CH ₂ CH ₂ —		
211	(A)	—	CF ₃	(a)	—	—CH ₂ CH ₂ CH ₂ —		
212	(A)	—	CH ₂ OH	(a)	—	—CH ₂ CH ₂ CH ₂ —		
213	(A)	—	CH ₂ OAc	(a)	—	—CH ₂ CH ₂ CH ₂ —		
214	(A)	—	CHO	(a)	—	—CH ₂ CH ₂ CH ₂ —		
215	(A)	—	CN	(a)	—	—CH ₂ CH ₂ CH ₂ —		
216	(A)	—	CH ₂ F	(a)	—	—CH ₂ (CH ₂) ₂ CH ₂ —		
217	(A)	—	CHF ₂	(a)	—	—CH ₂ (CH ₂) ₂ CH ₂ —		
218	(A)	—	CF ₃	(a)	—	—CH ₂ (CH ₂) ₂ CH ₂ —		
219	(A)	—	CH ₂ OH	(a)	—	—CH ₂ (CH ₂) ₂ CH ₂ —		
220	(A)	—	CH ₂ OH	(a)	3-Cl	—CH ₂ (CH ₂) ₂ CH ₂ —		
221	(A)	—	CH ₂ OAc	(a)	—	—CH ₂ (CH ₂) ₂ CH ₂ —		
222	(A)	—	CH ₂ OAc	(a)	3-Cl	—CH ₂ (CH ₂) ₂ CH ₂ —		
223	(A)	—	CHO	(a)	—	—CH ₂ (CH ₂) ₂ CH ₂ —		

1. táblázat (folytatás)

A vegy- száma	R ¹		R ²	R ³		R ⁴	R ⁵
	(A)	(X) _n		(a)	(Y) _m		
224	(A)	—	CHO	(a)	3-Cl	—CH ₂ (CH ₂) ₂ CH ₂ —	
225	(A)	—	CN	(a)	—	—CH ₂ (CH ₂) ₂ CH ₂ —	
226	(A)	—	CH ₂ F	(a)	—	—CH ₂ (CH ₂) ₃ CH ₂ —	
227	(A)	—	CHF ₂	(a)	—	—CH ₂ (CH ₂) ₃ CH ₂ —	
228	(A)	—	CF ₃	(a)	—	—CH ₂ (CH ₂) ₃ CH ₂ —	
229	(A)	—	CH ₂ OH	(a)	—	—CH ₂ (CH ₂) ₃ CH ₂ —	
230	(A)	—	CH ₂ OH	(a)	3-Cl	—CH ₂ (CH ₂) ₃ CH ₂ —	
231	(A)	—	CH ₂ OAc	(a)	—	—CH ₂ (CH ₂) ₃ CH ₂ —	
232	(A)	—	CH ₂ OAc	(a)	3-Cl	—CH ₂ (CH ₂) ₃ CH ₂ —	
233	(A)	—	CHO	(a)	—	—CH ₂ (CH ₂) ₃ CH ₂ —	
234	(A)	—	CHO	(a)	3-Cl	—CH ₂ (CH ₂) ₃ CH ₂ —	
235	(A)	—	CN	(a)	—	—CH ₂ (CH ₂) ₃ CH ₂ —	

2. táblázat
(II) általános képletű vegyületek

A vegy száma	R		R ⁷
		(X) _n	
236	(A)	—	CH ₂ OH
237	(A)	2-F	CH ₂ OH
238	(A)	2-Cl	CH ₂ OH
239	(A)	2-Me	CH ₂ OH
240	(B)	—	CH ₂ OH
241	(A)	—	CH ₂ OAc
242	(A)	2-F	CH ₂ OAc
243	(A)	2-Cl	CH ₂ OAc
244	(A)	2-Me	CH ₂ OAc
245	(B)	—	CH ₂ OAc
246	(A)	—	CHO
247	(A)	2-F	CHO

A találmány szerinti (I) általános képletű vegyületeket például az 1. reakcióvázlat szerint állíthatjuk elő.

A módszer

Az (I) általános képletű vegyületeket úgy állíthatjuk elő, hogy (II') képletű vegyületeket (III) általános képletű vegyületekkel reagáltatunk megfelelő oldószerben vagy oldószer nélkül.

A reakció hőmérsékletét adott esetben 90-160 °C közé állítjuk, vagy pedig a használt oldószer forráspontja körüli hőmérsékleten dolgozunk.

Oldószerként használhatunk bármilyen inert oldószert, azonban előnyös a reakció hőmérséklete szempontjából magas forráspontú oldószerek alkalmazása, mint amilyenek például a toluol, xilol vagy mezitilén stb.

Bár a reakcióidő a reakciókörülmények függvényében változhat, a reakciót 1 - 120 perc alatt befejezhetjük.

Továbbá, nincs szigorú korlátozás a (III) és (II') általános képletű vegyületek egymáshoz viszonyított arányát illetően, és előnyös, ha a (III) általános képletű vegyületeket 0,5 - 2 mól, különösen 0,9 - 1,1 mól tartományban használjuk 1 mól (II') általános képletű vegyületekre vonatkoztatva.

A kapott (I) általános képletű vegyületek elválasztását és tisztítását ismert módon hajthatjuk végre, például átkristályosítással és oszlopkromatografálással.

A (II') általános képletű vegyületeket, melyeket kiindulási anyagként használhatunk a fenti reakcióhoz, ugyanolyan módon állíthatjuk elő, mint a találmány szerinti (II) általános képletű vegyületeket, ezek előállítását a továbbiakban részletezzük.

A kiindulási anyagként használt (III) általános képletű vegyületeket ismert módon állíthatjuk elő, például a 2 582 128 számú amerikai egyesült államokbeli szabadalmi leírásban található módszerekkel, vagy ahhoz hasonlóan.

Azt találtuk, hogy a (III) általános képletű vegyületek többnyire egyensúlyi állapotban a 6. reakcióvázlatban feltüntetett trimerekkel szobahőmérsékleten, és néha elegy formájában fordulnak elő, vagy bizonyos esetekben a trimerek önállóan léteznek, bár ez a szubsztitúciók függvényében némileg változhat.

A 6. reakcióvázlatban R^3 , R^4 és R^5 jelentése a fenti.

Ezért, bár a (III) általános képletű vegyületek nemcsak monomereket tartalmaznak, hanem a fenti trimerek és a monomerek elegyeit is, egyszerűség kedvéért a monomerek szerkezetét és nevét használjuk.

B módszer

A (II') általános képletű vegyületek helyett használhatunk (IV) általános képletű vegyületeket is, ahol R^1 , R^2 jelentése a fenti, és R jelentése rövid szénláncú alkilcsoport.

Az (I) általános képletű vegyületeket tehát a 2. reakcióvázlat szerint is előállíthatjuk, ahol R^1 , R^2 , R^3 , R^4 és R^5 jelentése a fenti, R jelentése rövid szénláncú alkilcsoport.

A találmány szerinti (I) általános képletű vegyületeket úgy állíthatjuk elő, hogy (IV) általános képletű vegyületet (III) általános képletű vegyülettel reagáltatunk megfelelő oldószerben vagy oldószer nélkül.

A reakció lényegében az A módszer szerinti eljárásnak felel meg, azzal az eltéréssel, hogy a (II') általános képletű vegyületek helyett (IV) általános képletű vegyületeket használunk.

A (IV) általános képletű vegyületeket ismert módon állíthatjuk elő.

C módszer

Ezen kívül további módszer létezik az (I) általános képletű vegyületek előállítására. Az (I-2) általános képletű vegyületek acetil-oxi-metil-csoportját lépésenként a C módszer szerint a 3. reakcióvázlatnak megfelelően alakítjuk át, ahol R^1 , R^3 , R^4 és R^5 jelentése a fenti, A1 rövid szénláncú alkil-, A2 rövid szénláncú alkil- vagy acilcsoport.

Az (I-2) általános képletű vegyületeket például az A módszerrel állíthatjuk elő a (II-2) általános képletű vegyületekből a fenti leírt módon.

A (II) általános képletű vegyületek előállítása például a következőképpen történhet.

A (II) általános képletű vegyületek közül a (II-2) képletű vegyületeket a 4. reakcióvázlat szerint állíthatjuk elő, ahol R^6 jelentése adott esetben szubsztituált arilcsoport és Z jelentése halogénatom, M pedig alkálifém.

A (VI) általános képletű vegyületeket úgy állíthatjuk elő, hogyha az (V) általános képletű vegyületeket halogénezzük oldószerben vagy oldószer nélkül. A reakció hőmérsékletét adott esetben jeges hűtés hőmérséklete és a használt oldószer forráspontja közötti tartományban választjuk meg.

Bár a reakcióidő más reakciókörülmények függvényében változhat, rendszerint 1 - 24 óra hosszát tart.

Halogénezőszerként használhatunk például klórt, brómot, N-klór-szukcinimidet vagy N-bróm-szukcinimidet.

Oldószerként használhatunk bármilyen, lényegében inert oldószert, például szén-tetrakloridot, kloroformot vagy ecetsavat.

A halogénezőszer és az (V) általános képletű vegyületek egymáshoz viszonyított arányát illetően nincsen szigorú korlátozás. Előnyös, ha a halogénezőszert 0,5 - 2 mól mennyiségben használjuk 1 mól (V) általános képletű vegyületre.

A kémiai reakciót katalizátorok hozzáadásával vagy megvilágítással gyorsíthatjuk.

A (VI) általános képletű terméket a reakcióelegyből izolálhatjuk, és ismert módon tisztíthatjuk, például átkristályosítással és oszlopkromatografálással.

Ezt követően a találmány szerinti (II-2) általános képletű vegyületeket úgy állíthatjuk elő, hogy a fent előállított (VI) általános képletű vegyületeket ecetsav alkálifémsójjával, például nátrium-acetáttal reagáltatjuk oldószerben. A reakció hőmérsékletét adott esetben szobahőmérséklettől a használt oldószer forráspontjáig terjedő tartományban állíthatjuk be.

Bár a reakcióidő a többi reakciókörülmény függvényében változhat, rendszerint 1 - 12 óra hosszat folytatjuk a reakciót.

Oldószerként bármilyen, lényegében a reakció alatt inert oldószert használhatunk.

Bár az ecetsav alkálifémsója és a (VI) általános képletű vegyületek egymáshoz viszonyított arányát illetően nincs szigorú korlátozás, előnyös, ha az ecetsav alkálifémsóját 0,5 - 5 mól mennyiségben használjuk 1 mól (VI) általános képletű vegyületre.

A (II-2) általános képletű termékeket a reakcióelegyből ismert módon izolálhatjuk, és átkristályosítással és oszlopkromatografálással tisztíthatjuk.

Az (V) általános képletű vegyületeket, melyeket kiindulási anyagként használunk, ismert módon állíthatjuk elő, például a Chem. Pharm. Bull. 31, (6), 1895 (1983) szakirodalmi helyen leírt módszerrel.

Az előzőleg leírt (II) általános képletű vegyületek közül a (II-1) általános képletű vegyületeket úgy állíthatjuk elő, hogyha lépésenként a (II-2) általános képletű vegyületek acetiloxi-metil-csoportját hidroximetil- és formilcsoporttá alakítjuk ismert módon az 5. reakcióvázlat szerint, ahol R⁶ adott esetben szubsztituált arilcsoport.

A (II-1-a) általános képletű vegyületeket a (II-2) általános képletű vegyületekből állíthatjuk elő úgy, hogy megfelelő oldószerben vagy anélkül reagáltatjuk például hidrolízissel bázis jelenlétében, vagy észtercserével rövid szénláncú alkohol segítségével.

Ezenkívül a (II-1-b) képletű vegyületeket úgy állíthatjuk elő a (II-1-a) képletű vegyületekből, hogy oxidálószerrel reagáltatjuk megfelelő oldószerben, és szükség esetén katalizátort alkalmazunk.

Oxidálószerként használhatunk króm-oxidot, kromátot, dikromátot, mangán-dioxidot, oxigént, dimetil-szulfoxidot.

Az (I) általános képletű új vegyületek herbicid hatással rendelkeznek, és ezért előállíthatunk (I) általános képletű vegyületeket hatóanyagként tartalmazó új herbicideket.

Ha a vegyületeket herbicidként alkalmazzuk, akkor összekeverjük hordozóval, hígítóval, adalékkal és segédanyaggal, ez

ismert módon történhet, és készítménnyé formálhatjuk, amely a szokásos mezőgazdasági vegyszerként elfogadható. Ilyenek például a porok, granulátumok, nedvesíthető porok, emulgeálható koncentrátumok, oldható porok, folyékony porok, stb. Ezeket elegyként vagy más mezőgazdasági vegszerrel kombinálva használhatjuk, például fungiciddal, inszekticiddal, akariciddal, herbiciddal, növényi növekedés szabályzóval, trágyával, talaj kondicionálóval együtt alkalmazhatjuk.

A találmány szerinti vegyületeket különösen más herbicidekkel kombinálva nemcsak a dózis csökkenthető, hanem csökkenthető a munkaerő is, és ezen kívül a herbicid spektrum szélesíthető és tovább javítható a hatás, amely mindkét szer szinergetikus hatásának tudható be.

A készítmények előállításához használt hordozók vagy hígítók általában szilárd vagy folyékony hígítók vagy hordozók.

A szilárd hordozókra vagy hígítókra példaképpen megemlíthetők az agyagok, például kaolinit, montmorillonit, illit, poligroszkit, stb., közelebbről a pirofillit, attapulgit, szepiolit, kaolinit, bentonit, vermikulit, csillám, talkum, stb., továbbá más szerves anyagok, például gipsz, kalcium-karbonát, dolomit, diatómaföld, magnézium agyag, foszfor agyag, zeolit, kvasav-anhidrid, szintetikus kalcium-szilikát, stb. Növényi eredetű szerves anyagok, például szójababliszt, dohányliszt, dióliszt, búzaliszt, fűrészpor, keményítő, kristályos cellulóz, stb., szintetikus vagy természetes polimerek, például kumaron gyanta, petróleum gyanta, alkid gyanta, polivinil-klorid, polialkilén-glikol, keton gyanta, észter gumi, kopál gyanta, dammár gyanta, stb.; viaszok, például karnauba viasz, méhviasz stb.; vagy karbamid.

Folyékony hordozóként használhatunk például paraffint vagy naftin szénhidrogént, például kerozint, ásványolajat, orsóolajat, fehér olajat, stb., aromás szénhidrogéneket, például xilolt, etil-benzolt, kumént, metil-naftalint, stb.; klórozott szénhidrogéneket, például triklór-etilént, monoklór-benzolt, o-klór-toluolt; étereket, például dioxánt, tetrahidrofuránt; ketonokat, például acetont, metil-etil-ketont, diizobutil-ketont, ciklohexanont, acetofenont, izoforont, észtereket, például etil-acetátot, amil-acetátot, etilén-glikol-acetátot, dietilén-glikol-acetátot, dibutil-maleátot, dietil-szukcinátot, stb.; alkoholokat, például metanolt, n-hexanolt, etilén-glikolt, dietilén-glikolt, ciklohexanolt, benzil-alkoholt, stb.; éter-alkoholokat, például etilén-glikol-etil-étert, dietilén-glikol-butyl-étert, stb.; poláros oldószereket, például dimetil-formamidot, dimetil-szulfoxidot, stb. vagy vizet.

Ezen kívül használhatunk különböző célokra felületaktív anyagokat és más segédanyagokat, például emulgeálásra, diszpergálásra, nedvesítésre, szétterítésre, hígításra, kombinációira, bomlás szabályozásra, stabilizálásra, folyékonyság javítására, korrózió megelőzésére, fagyásgátlásra, stb.

Felületaktív anyagként használhatunk bármilyen nemionos, anionos, kationos vagy amfoter felületaktív anyagot. Rendszerint nemionos és/vagy anionos felületaktív anyagokat használunk.

A nemionos felületaktív anyagokra például megemlíthetők az etilén-oxid és hosszú szénláncú alkoholok, például lauril-alkohol, sztearil-alkohol vagy oleil-alkohol; additív polimerizációs termékei, vagy etilén-oxid és alkil-naftolok, például butil-naftol, oktil-naftol additív polimerizációs termékei; valamint

etilén-oxid és hosszúszenlácú zsírsavak, például palmitinsav, sztearinsav, oleinsav additív polimerizációs termékei; és hosszú szénlácú zsírsavak és többértékű alkoholok észterei, például szorbitán és etilén-oxid ezekkel képezett additív polimerizációs termékei, stb.

Anionos felületaktív anyagként használhatunk például alkil-kénsav-észter-sókat, például nátrium-lauril-szulfátot, oleil-alkohol kénsav-észter aminsóit, például alkil-szulfonát-sókat, például nátrium-dioktil-szulfoszukcinátot, nátrium-2-etil-hexén-szulfonátot, vagy aril-szulfonát-sókat, például nátrium-izopropil-naftalin-szulfonátot, nátrium-metilén-bisz-naftalin-szulfonátot stb.

A készítmények tulajdonságainak javítására fokozhatjuk a hatást például úgy, hogy a találmány szerinti herbicideket polimerekkel és más segédanyagokkal, például kazeinrel, zselatinrel, albuminnal, ragasztóval, nátrium-algináttal, karboxi-metil-cellulózzal, metil-cellulózzal, hidroxil-etil-cellulózzal vagy polivinil-alkohollal kombináljuk.

A fenti hordozókat vagy különböző segédanyagokat önmagukban vagy másokkal kombinálva használhatjuk attól függően, hogy milyen célt kell hogy szolgáljon, például formálási formák vagy alkalmazási körülmények függvényében változtathatók.

A találmány szerinti hatóanyagok tartalma különböző készítményekben széles körben változhat a formálási forma függvényében, és a megfelelő hatóanyag-tartalom rendszerint 0,1 - 99 tömeg%, előnyösen 1 - 80 tömeg% között változik.

A nedvesíthető pornál a készítmény 25 - 90 % hatóanyagot tartalmaz, és a maradék szilárd hordozó és diszpergáló ned-

vesítőszer. Szükség esetén kolloid védőanyagot, habzásgátló is hozzáadhatunk.

A granulátum esetében a készítmény 1 - 35 tömeg% hatóanyagot tartalmaz rendszerint, és a maradék szilárd hordozó és felületaktív anyag. A találmány szerinti hatóanyagokat egyenletesen elkeverhetjük a szilárd hordozókkal, vagy szilárd hordozók felületére rögzíthetjük vagy adszorbeálhatjuk egységesen. Előnyös, ha a granulátumok átmérője 0,2 - 1,5 mm között van.

Emulgeálható koncentrátum esetében a készítmény rendszerint 5 - 30 tömeg% hatóanyagot tartalmaz. Ezen kívül 5 - 20 tömeg% emulgeálószer, és a maradék folyékony hordozó. Szükség esetén terület elősegítő szert és korróziógátlót is hozzáadhatunk.

Folyékony készítmény esetében a készítmény rendszerint 5 - 50 tömeg% hatóanyagot, 3-10 tömeg% diszpergáló nedvesítőszert és vizet tartalmaz. Szükség esetén hozzáadhatunk még védő koloidszert, konzerválószert és habzásgátlót, stb.

A találmány szerinti vegyületeket herbicidként úgy használhatjuk, ahogy vannak, vagy pedig a fent leírt kiszerelt formákban.

A találmány szerinti herbicideket hatékony mennyiségben visszük fel a különböző védendő területekre, például farmokra, például rizsföldekre és hegyvidéki földekre, vagy nem-termőföldre, mielőtt a gyomok kicsíráznának, vagy pedig gyomokra visszük fel a csírázás előtti állapottól a növekvő állapotig.

A dózis általában 0,1 - 10 000 g/ha, előnyösen 1 - 5000 g/ha között van. Az alkalmazási dózis változhat a gyomok fajtájától és növekedési állapotuktól, az alkalmazás helyétől és az időjárástól és egyéb tényezőktől függően.

6-Acetil-oxi-metil-3-[1-metil-1-(3,5-diklór-fenil)-etil]-5-fenil-2,3-dihidro-4H-1,3-oxazin-4-on előállítása (69. számú vegyület)

17,1 g 241. sz. 6-acetil-oxi-metil-2,2-dimetil-5-fenil-2H,4H-1,3-dioxin-4-ont összekeverünk 14,7 g N-metilén-1-metil-1-(3,5-diklór-fenil)-etil-aminnal és 120 ml xilolt adunk hozzá. 1 óra hosszat melegítjük visszafolyató hűtő alatt, majd az oldószert lepároljuk, és a nyersterméket hexán és etil-acetát elegyből átkristályosítva 22,83 g cím szerinti vegyületet kapunk 85 %-os termeléssel.

6-Fluor-metil-3-[1-metil-1-(3,5-diklór-fenil)-etil]-5-fenil-2,3-dihidro-4H-1,3-oxazin-4-on (4. számú vegyület) előállítása

0,60 g dietil-amino-szulfát-trifluoridot feloldunk 3 ml diklór-metánban, és -63 °C-on hozzácsepegtetünk 1,40 g 55. számú 6-hidroxi-metil-3-[1-metil-1-(3,5-diklór-fenil)-etil]-5-fenil-2,3-dihidro-4H-1,3-oxazin-4-ont 7 ml diklór-metános oldat formájában.

Felmelegítjük szobahőmérsékletre, miközben 30 percig keverjük, és a reakcióelegyet frakcionáljuk, a szerves fázist vízzel öblítjük, magnézium-szulfonáttal szárítjuk. Az oldószert lepárolva eltávolítjuk, a nyersterméket szilikagél kromatografálással tisztítjuk, 0,99 g (70 %) kívánt vegyületet kapunk.

6-Acetil-oxi-imino-metil-3-[1-metil-1-(3,5-diklór-fenil)-etil]-5-fenil-2,3-dihidro-4H-1,3-oxazin-4-on (147. számú vegyület) előállítása

0,60 g, 135. számú 6-hidroxi-imino-metil-3-[1-metil-1-(3,5-diklór-fenil)-etil]-5-fenil-2,3-dihidro-4H-1,3-oxazin-4-on és 2 ml

vízmentes ecetsav elegyét szobahőmérsékleten 4 óra hosszat keverjük, majd vízbe öntjük és etil-acetáttal extraháljuk. A szerves fázist telített fiziológiás sóoldattal öblítjük, magnézium-szulfonáttal szárítjuk. Az oldószert lepárolva eltávolítjuk, a nyersterméket szilikagélen kromatografálva tisztítjuk, 0,54 g, 94 % cím szerinti vegyületet kapunk.

6-Ciano-3-[1-metil-1-(3,5-diklór-fenil)-etil]-5-fenil-2,3-dihidro-4H-1,3-oxazin-4-on (167. számú vegyület) előállítás

0,50 g, 135. számú 6-hidroxi-imino-metil-3-[1-metil-1-(3,5-diklór-fenil)-etil]-5-fenil-2,3-dihidro-4H-1,3-oxazin-4-ont, 0,33 g trifenil-foszfint és 0,19 g szén-tetrakloridot, valamint 0,13 g trietil-amint összekeverünk és hozzáadunk 5 ml diklór-metánt. Az elegyet 2,5 óra hosszat visszafolyató hűtő alatt melegítjük, majd a reakcióelegyet vízzel öblítjük, magnézium-szulfonáttal szárítjuk, az oldószert lepárolva a nyersterméket szilikagélen kromatografálással tisztítjuk. 0,39 g, 82 % cím szerinti vegyületet kapunk.

6-Trifluor-metil-3-[1-(3,5-diklór-fenil)-etil]-5-fenil-2,3-dihidro-4H-1,3-oxazin-4-on (49. számú vegyület) előállítása (B módszer)

1,30 g 2-trifluor-acetil-2-fenil-etil-acetátot és 1,19 g N-metilén-1-metil-1-(3,5-diklór-fenil)-etil-amint összekeverünk, és hozzáadunk 10 ml xilolt. Az elegyet 30 percig visszafolyató hűtő alatt forralva reagáltatjuk, az oldószert lepároljuk, a nyersterméket hexán és etil-acetát elegyéből átkristályosítva 1,80 g cím szerinti vegyületet kapunk 84 %-os termeléssel.

**6-Hidroxi-metil-2,2-dimetil-5-fenil-2H,4H-1,3-dioxán-4-on
(236. számú vegyület) előállítása**

7,46 g, 241. számú 6-acetiloxi-metil-2,2-dimetil-5-fenil-2H,4H-1,3-dioxin-4-ont jéggel hűtünk, és hozzáadunk lassan 27 ml, 2,42 g kálium-karbonátból készített vizes oldatot.

30 percig keverjük, majd a metanolt lepároljuk, a maradékot 2 n sósavval megsavanyítjuk és leszűrjük. A nyersterméket hexán és etil-acetát elegyből átkristályosítva 3,84 g cím szerinti vegyületet kapunké 61 %-os termeléssel.

6-Formil-2,2-dimetil-5-fenil-2H,4H-1,3-dioxin-4-on előállítás (246. számú vegyület)

1,29 g piridinium-klór-kromátot 8 ml diklór-metánban szuszpendálunk, hozzáadunk 3 ml diklór-metánban szuszpendált 0,70 g, 236 számú 6-hidroxi-metil-2,2-dimetil-5-fenil-2H,4H-1,3-dioxin-4-on-t szobahőmérsékleten. 5 óra hosszat keverjük, majd nagy mennyiségű étert adunk hozzá, és dekantálással extraháljuk. A szerves fázist magnézium-szulfonáttal szárítjuk, az oldószert lepároljuk, a nyersterméket szilikagélen kromatografálással tisztítjuk, 0,43 g, 67 % cím szerinti vegyületet kapunk.

Az előző példákban és hasonlóan előállított vegyületek olvadáspontjait és H-NMR δ értékeit a 3. táblázatban foglaljuk össze.

3. táblázat

Vegyület száma	¹ H-NMR δ (ppm) Oldószer CDCl ₃ , TMS = 0 ppm	Olvadáspont (°C)
1.	1,84 (s, 6H); 4,81 (d, 2H); 5,18 (s, 2H); 7,23-7,44 (m, 10H);	82,4-85,0
4.	1,75 (s, 6H); 4,84 (d, 2H); 5,37 (s, 2H); 7,20-7,38 (m, 8H);	96,1-99,5
34.	1,84 (s, 6H); 5,24 (s, 2H); 6,01 (t, 1H); 7,22-7,43 (m, 10H);	78,3-80,3
36.	1,76 (s, 6H); 5,43 (s, 2H); 6,03 (t, 1H); 7,20-7,39 (m, 8H);	112,5-115,8
48.	1,85 (s, 6H); 5,21 (s, 2H); 7,23-7,43 (m, 10H);	olajos anyag
49.	1,76 (s, 6H); 5,42 (s, 2H); 7,21-7,25 (m, 5H); 7,32-7,38 (m, 3H);	121,6-123,9
53.	1,84 (s, 6H); 4,17 (d, 2H); 5,15 (s, 2H); 7,21-7,44 (m, 10H);	156,5-159,5
55.	1,74 (s, 6H); 4,19 (s, 2H); 5,34 (s, 2H); 7,19-7,36 (m, 8H);	132,4-136,7
66.	1,83 (s, 6H); 2,03 (s, 3H); 4,61 (s, 2H); 5,14 (s, 2H); 7,21-7,43 (m, 10H);	olajos anyag
69.	1,74 (s, 6H); 3,33 (s, 3H); 3,98 (s, 2H); 5,35 (s, 2H); 7,19-7,36 (m, 8H);	115,0-117,0
114.	1,83 (s, 6H); 3,30 (s, 3H); 3,95 (s, 2H); 5,17 (s, 2H); 7,20-7,43 (m, 10H);	olajos anyag
116.	1,74 (s, 6H); 3,33 (s, 3H); 3,98 (s, 2H); 5,36 (s, 2H); 7,20-7,36 (m, 8H);	olajos anyag

Vegyület száma	¹ H-NMR δ (ppm) Oldószer CDCl ₃ , TMS = 0 ppm	Olvadáspont (°C)
121.	1,85 (s, 6H); 5,23 (s, 2H); 7,22-7,46 (m, 10H); 9,36 (s, 1H);	94,0-97,7
122.	1,77 (s, 6H); 5,40 (s, 2H); 7,22 (s, 3H); 7,41 (s, 5H); 9,38 (s, 1H);	98,9-102,0
134.	1,85 (s, 6H); 5,23 (s, 2H); 7,21-7,43 (m, 10H); 7,55 (s, 1H); 8,06 (s, 1H);	176,0-181,5 (bomlás)
135.	1,76 (s, 6H); 5,41 (s, 2H); 7,20-7,38 (m, 8H); 7,57 (s, 1H); 8,15 (s, 1H);	187,0-197,0 (bomlás)
147.	1,76 (s, 6H); 2,16 (s, 3H); 5,45 (s, 2H); 7,20-7,40 (m, 8H); 7,78 (s, 1H);	177,7-180,0
160.	1,75 (s, 6H); 4,00 (s, 3H); 5,43 (s, 2H); 7,20-7,35 (m, 8H); 7,51 (s, 1H);	129,5-132,5
164.	1,84 (s, 6H); 5,20 (s, 2H); 7,26-7,47 (m, 10H);	141,5-145,2
167.	1,76 (s, 6H); 5,38 (s, 2H); 7,22 (s, 3H); 7,41 (s, 5H);	123,3-127,5
236.	1,82 (s, 6H); 1,89 (t, 1H); 4,20 (d, 2H); 7,28-7,43 (m, 5H);	94,0-96,5
241.	1,79 (s, 6H); 2,05 (s, 3H); 4,62 (s, 2H); 7,25-7,42 (m, 5H);	olajos anyag
246.	1,84 (s, 6H); 7,40-7,50 (m, 5H); 9,46 (s, 1H);	78,0-80,8

A találmány szerinti vegyületek formálását a következőképpen hajthatjuk végre. A következő készítményekben valamennyi "részén" tömegrészt értünk.

1. Formálási példa

Emulgeálható koncentrátum

	rész
147. sz. vegyület	20
xilol	50
ciklohexán	20
kalcium-dodecil- -benzolszulfonát	5
polioxi-etilén-sztiril-fenil- -éter	5

A fenti anyagokat összekeverjük és egyenletesen feloldjuk, így 100 rész emulgeálható koncentrátumot kapunk.

2. Formálási példa

Nedvesíthető por

	rész
147. sz. vegyület	20
agyag	70
kalcium-ligninszulfonát	7
alkil-naftalin-szulfonsav és formaldehid kondenzátum	3

A fenti anyagokat összekeverjük és jet malomban porítjuk, így 100 rész nedvesíthető por készítményt kapunk.

3. Formálási példa

Folyékony készítmény

	rész
147. sz. vegyület	20
nátrium-di(2-etil-hexil)- -szulfoszukcinát	2

poli-oxi-etilén-nonil-fenil-	2
-éter	
habzágátló szer	0,5
propilén-glikol	5
víz	70,5

A fenti anyagokat összekeverjük és egyenletesen porítjuk egy nedves golyós malomban. 100 rész folyékony készítményt kapunk.

A fenti példákhoz hasonló formálási módszerekkel kapjuk a találmány szerinti herbicid készítményeket.

A találmány szerinti vegyületek herbicid hatását a következő teszt példákkal világítjuk meg.

1. Teszt példa

Rizsföld talaj kezelés

Megfelelő mennyiségű vizet és műtrágyát adunk a rizsföld talajhoz. Ezt 130 cm²-es műanyag cserepekbe töltjük, majd összegyűrjük, hogy átalakítsuk rizsföld állapotúvá, amelybe rizs palántákat (Koshihikari fajta) ültetünk. Két palántából álló párt növesztünk már előzőleg melegházban kétlevelű állapotig, és ezeket ültetjük az egyes cserepekbe, cserepenként egy készlet populációt. Továbbá minden cserépbe előre meghatározott mennyiségű magvakat vetünk a következő fajtákból: Nobie (*Echinochloa orizicola*), Konagi (*Monochoria vaginalis* var. *plantaginea*), Azena (*Lindernia procumbens*) és Hotarui (*Scirpus juncooides* var. *hotarui*), és 3 cm mélyre vizet töltünk. A következő napon nedvesíthető por készítményeket állítunk elő a 2. formálási példa szerint, és megfelelő mennyiségű vízzel addig

hígítjuk, hogy a hatóanyag koncentrációja hektáronként 5 kg vagy 1 kg legyen. A hígított készítményt pipettával csepegtetve visszük fel.

A vegyszer alkalmazása utáni 21 nap múlva minden gyomon kiértékeljük a herbicid hatást és a rizs palántákon a fitotoxicitást a következő kritériumok szerint. Az eredményeket a 4. táblázat tartalmazza.

Értékelési kritériumok (11 fokozat)

Pontszám	Herbicid hatás: kiirtott gyom aránya a kontrollhoz képest (%)	Haszonnövényre gyakorolt fitotoxicitás: sérült növé- nyek aránya a kontrollal összevetve (%)
0	0	ugyanaz, mint a baloldali oszlopban
1	0 - 10 felett	
2	10 - 20 felett	
3	20 - 30 felett	
4	30 - 40 felett	
5	40 - 50 felett	
6	50 - 60 felett	
7	60 - 70 felett	
8	70 - 80 felett	
9	80 - 90 felett	
10	90 - 100 felett (elhervadt)	

4. táblázat

A vegyület száma	Hatóanyag dózis	Herbicid hatás				Fitotoxicitás rizs növény
		g hatóanyag/ha	Nobie	Konagi	Azena	
	1000	10	10	10	10	2
4.	5000	10	10	10	10	10
	1000	10	10	10	10	0
34.	5000	10	10	10	10	2
	1000	10	10	10	10	0
49.	5000	10	10	10	10	0
	1000	10	10	10	10	10
69.	5000	10	10	10	10	10
	1000	10	10	10	10	6
147.	5000	10	10	10	10	7

Lábjegyzet:

Note: *Echinochloa orizicola*

Konagi: *Monochoria vaginalis* var. *plantaginea*

Azena: *Lindernia procumbens*

Hotarui: *Scirpus juncooides* var. *hotarui*

2. Teszt példa (rizsföld lomb alkalmazás)

Rizsföld talajt töltünk 130 cm²-s műanyag cserepekbe, hozzáadunk megfelelő mennyiségű vizet és műtrágyát, és összegyúrjuk, hogy rizsföldi állapotba vigyük. A rizsföld rizspalántákat ültetünk minden cserépbe (fajta: Koshihikari), amely 2 palántából álló párból áll, melyeket előzőleg melegházban kétlevelű állapotig neveltünk, és minden cserépbe egy készlet

populációt helyezünk, továbbá minden cserépbe előre meghatározott mennyiségben helyeztük el a következő fajták magvait: Nobie (*Echinochloa orizicola*), Konagi (*Monochoria vaginalis* var. *plantaginea*), Azena (*Lindernia procumbens*) és Hotarui (*Scirpus juncoides* var. *hotarui*), továbbá 3 cm mélyre vizet töltöttünk.

Miután melegházban növesztettük a növényeket, ameddig a Nobie (*Echinochloa orizicola*) elérte a 1,5 leveles állapotot, a 2. formálási példa szerint nedvesíthető por készítményt állítottunk elő, és megfelelő mennyiségű vízzel hígítottuk úgy, hogy a hatóanyag koncentráció elérje az 5 kg vagy 1 kg/hektárt. A hígított készítményt pipettával csepegtetve alkalmaztuk.

A vegyszeres kezelés után 21 nappal kiértékeljük a gyomokon és a rizs palántákon a herbicid, illetve fitotoxikus hatást az 1. teszt példában megadott kritériumok szerint. Az eredményeket az 5. táblázat mutatja.

5. táblázat

A vegyület száma	Hatóanyag dózis	Herbicid hatás				Fitotoxicitás rizs növény
		Nobie	Konagi	Azena	Hotarui	
	g hatóanyag/ha					
	1000	10	10	10	9	3
4.	5000	10	10	10	9	8
	1000	9	9	10	10	0
34.	5000	10	10	10	10	0
	1000	10	4	10	10	0
49.	5000	10	9	10	10	0

A vegyület száma	Hatóanyag dózis	Herbicid hatás				Fitotoxicitás
		Nobie	Konagi	Azena	Hotarui	rizs növény
	g hatóanyag/ha					
	1000	10	10	10	10	10
69.	5000	10	10	10	10	10
	1000	10	10	10	10	3
147.	5000	10	10	10	10	8

Lábjegyzet:

Note: *Echinochloa orizicola*

Konagi: *Monochoria vaginalis* var. *plantaginea*

Azena: *Lindernia procumbens*

Hotarui: *Scirpus juncooides* var. *hotarui*

3. Teszt példa

Hegyvidéki talaj alkalmazás

Hegyvidéki talajt töltünk 130 cm²-es műanyag cserepekbe, amelyekbe előre meghatározott mennyiségű magvakat ültetünk a következő fajtákból: Nobie (*Echinochloa crus-galli*), Mehisbiba (*Digitaria ciliaris*) és Enokorogusa (*Setaria viridis*), és a talajt 1 cm-es vastagságban ráhelyezzük.

A vetést követő napon a nedvesíthető por készítményeket a 2. formálási példa szerint állítottuk elő, és ezeket megfelelő mennyiségű vízzel hígítjuk a hatóanyag 5 kg vagy 1 kg/ha koncentrációjáig. A hígított készítményt egyenletesen permetezzük a talaj felületére.

A vegyszeres alkalmazás után 21 nappal kiértékeljük az 1. teszt példában leírt kritériumok alapján a gyomokon tapasztalt herbicid hatást. Az eredményeket a 6. táblázat mutatja.

6. táblázat

A vegyület száma	Hatóanyag dózis	Herbicid hatás		
		g hatóanyag/ha	Nobie	Mehishiba
	1000	10	10	9
4.	5000	10	10	10
34.	5000	10	10	10
49.	5000	8	10	10
	1000	10	10	10
69.	5000	10	10	10
	1000	10	10	10
147.	5000	10	10	10

Lábjegyzet:

Nobie: *Echinochloa crus-galli* (közönséges kakaslábfű)

Mehisbia: *Digitaria ciliaris* (pillás ujjasmuhar)

Enokorogusa: *Setaria viridis* (zöld muhar)

A találmány szerinti (I) általános képletű vegyületek kiváló herbicid hatást mutatnak igen alacsony dózisban a gyomok széles skálája ellen a rizs évelő gyomok csírázásától a növekedési stádiumig a következő egynyári gyomok ellen: Hie (*Echinochloa orizicola*), Tamagayatsuri (*Cyperus difformis*), Konagi (*Monochoria vaginalis* var. *plantaginea*), Kikashigusa (*Rotala indica* var. *uliginosa*), Azena (*Lindernia procumbens*), Abunome (*Dopatrium junceum*), valamint a következő évelő rizs gyomok ellen: Hotarui (*Scirpus juncoides* var. *hotarui*), Matsubai (*Eleocharis acicularis* var. *longiseta*), Heraomodaka (*Alisma canaliculatum*), Mizugayatsuri (*Cyperus serotinus*), és igen

nagyfokú biztonságot nyújtanak az ültetett rizsnövényekre és a közvetlenül vetett rizspalántákra akár a rizsföldön, akár a hegyvidéki földön.

Ezenkívül igen jó herbicid hatást mutatnak talajban vagy lomb alkalmazással különböző hegyvidéki széleslevelű gyomok ellen, például Tade (*Parsicaria longiseta*), Aobiyu (*Amaranthus viridies*), Shiroza (*Cenopodium album*, fehér libatop), stb., egynyári és évelő *Cyperus* gyomok ellen, például Hamasuge (*Cyperus rotundus*), Kihamasuge (*Cyperus esculantus*), Himekugu (*Cyperus brevifolius* var. *leiolepis*), Kayatsurigusa (*Cyperus microiria*), Kogomewgayatsuri (*Cyperus iria*), stb., és hegyvidéki fűszerű gyomok ellen, például hie (*Echinochloa crus-galli* (közönséges kakaslábű)), Mehishiba (*Digitaria ciliaris* (pillás ujjasmuhar)), Enokorogusa (*Setaria viridis* (zöld muhar)), Suzumenokatabira (*Poa annua* (nyári perje)), Johnsongrass (*Sorghum halepense*), Héla zab (*Avena sativa*), Suzumenoteppo (*Alopecurus aequalis* var. *amurensis*) stb. ellen, és jellegzetes nagyfokú biztonságot jelentenek a haszonnövények számára, például szójabab, gyapot, cukorrépa, repce, napraforgó, kukorica és hegyvidéki rizs, valamint búza esetében.

A találmány szerinti vegyületeket használhatjuk rizsföldeken és hegyvidéki földeken, ezen kívül gyümölcsösben, szeder földön, pázsiton, nem-termő földön. Ezen kívül a találmány szerinti vegyületeket már ismert vegyületekkel összekeverve nehezen irtható gyomok ellen kiváló herbicid hatást mutatnak olyankor, amikor az egyedül alkalmazott vegyületeknél nem sikerült ezt elérni, és különböző gyomokra hatékonyan alkalmazhatók a szinergetikus hatású herbicidek olyan dózisban, amelynél az egyes vegyület nem fejt ki a kívánt hatást. Ezenkívül a talál-

mány szerinti vegyületek nagyfokú biztonsággal alkalmazhatók haszonnövényeknél, mint amilyen a rizs, szójabab, gyapot, cukorrépa, repce, napraforgó, kukorica, hegyvidéki rizs, búza, stb., ezért ezek a herbicidek igen hasznosak a mezőgazdaságban.

Szabadalmi igénypontok

1. (I) általános képletű 1,3-oxazin-4-on-származékok, ahol
- R¹ rövid szénláncú alkil-, rövid szénláncú alkenil-, rövid szénláncú alkinilcsoport vagy arilcsoport lehet, amely szubsztituálva lehet, vagy szubsztituált aralkilcsoport is lehet,
- R² jelentése rövid szénláncú halogén-alkil-, rövid szénláncú hidroxil-alkil-, rövid szénláncú alkoxi-alkil-, rövid szénláncú aciloxi-alkil-, formil-, hidroxil-imino-metil-, rövid szénláncú alkoxi-imino-metil-, rövid szénláncú aciloxi-imino-metil- vagy cianocsoport, vagy rövid szénláncú alkoxi-karbonil-csoport;
- R³ jelentése rövid szénláncú alkil- vagy adott esetben szubsztituált arilcsoport, vagy adott esetben szubsztituált aralkilcsoport,
- R⁴ és R⁵ egymástól függetlenül rövid szénláncú alkilcsoportot jelent, vagy R⁴ és R⁵ együtt a szénatommal, melyhez kapcsolódnak, 3 - 8-tagú karbociklusos csoportot képeznek, amely rövid szénláncú alkilcsoport elágazást tartalmazhat.
2. Az 1. igénypont szerinti 1,3-oxazin-4-on-származékok, ahol
- R¹ jelentése elágazó láncú alkilcsoport, előnyösen izobutil- vagy izopropil-csoport, vagy fenilcsoport, amely szubsztituálva lehet vagy nincs szubsztituálva, és a szubsztituens lehet halogénatom vagy rövid szénláncú alkilcsoport;
- R² jelentése a fenti,

R^3 jelentése adott esetben szubsztituált fenil- vagy 2-naftilcsoport, ahol a szubsztituens egy vagy két halogénatom, rövid szénláncú halogén-alkil- vagy halogén-alkoxi-csoport,

R^4 és R^5 egymástól függetlenül metilcsoport.

3. A 2. igénypont szerinti (I-1) általános képletű vegyületek, ahol

R^2 a 2. igénypont szerinti,

X jelentése halogénatom vagy rövid szénláncú alkilcsoport,

Y jelentése halogénatom vagy rövid szénláncú halogén-alkil-csoport,

n értéke 0 vagy 1,

m értéke 0, 1 vagy 2.

4. Eljárás az 1. igénypont szerinti (I) általános képletű vegyületek előállítására, azzal jellemezve, hogy egy (II') általános képletű vegyületet (III) általános képletű vegyülettel reagáltatunk, ahol $R^1 - R^5$ jelentése az 1. igénypont szerinti.

5. A 4. igénypont szerinti eljárás, ahol a (III) általános képletű vegyületet 0,5 - 2 mól, előnyösen 0,9 - 1,1 mól mennyiségben használjuk 1 mól (II') általános képletű vegyületre.

6. Eljárás az 1. igénypont szerinti (I) általános képletű vegyületek előállítására, azzal jellemezve, hogy egy (IV) általános képletű vegyületet (III) általános képletű vegyülettel reagáltatunk, ahol $R^1 - R^5$ jelentése az 1. igénypont szerinti.

7. Eljárás az 1. igénypont szerinti (I) általános képletű vegyületek előállítására, azzal jellemezve, hogy egy (I-2) általános képletű vegyületet, amely olyan (I) általános képletű vegyület, ahol R^2 jelentése acetil-metoxi-csoport, egy másik (I) általános képletű vegyületté alakítunk, ahol R^1 és R^3-R^5 jelenté-

se az 1. igénypont szerinti, A1 rövid szénláncú alkil- és A2 rövid szénláncú alkil- vagy acilcsoport.

8. Herbicid készítmény, azzal jellemezve, hogy hatóanyagként legalább egy (I) általános képletű 1,3-oxazin-4-on-származékot tartalmaz, ahol

R^1 rövid szénláncú alkil-, rövid szénláncú alkenil-, rövid szénláncú alkinilcsoport vagy arilcsoport lehet, amely szubsztituálva lehet, vagy szubsztituált aralkilcsoport is lehet,

R^2 jelentése rövid szénláncú halogén-alkil-, rövid szénláncú hidroxil-alkil-, rövid szénláncú alkoxil-alkil-, rövid szénláncú aciloxil-alkil-, formil-, hidroxil-imino-metil-, rövid szénláncú alkoxil-imino-metil-, rövid szénláncú aciloxil-imino-metil- vagy cianocsoport, vagy rövid szénláncú alkoxil-karbonil-csoport;

R^3 jelentése rövid szénláncú alkil- vagy adott esetben szubsztituált arilcsoport, vagy adott esetben szubsztituált aralkilcsoport,

R^4 és R^5 egymástól függetlenül rövid szénláncú alkilcsoportot jelent, vagy R^4 és R^5 együtt a szénatommal, melyhez kapcsolódnak, 3 - 8-tagú karbociklusos csoportot képeznek, amely rövid szénláncú alkilcsoport elágazást tartalmazhat, mezőgazdaságilag elfogadható hordozókkal összekeverve.

9. A 8. igénypont szerinti készítmény, azzal jellemezve, hogy az (I) általános képletű vegyületet 0,1 - 99 tömeg%, előnyösen 1 - 80 tömeg% mennyiségben tartalmazza.

10. A 9. igénypont szerinti készítmény, azzal jellemezve, hogy a készítmény nedvesíthető por formájú, ahol az (I) ál-

talános képletű hatóanyag-tartalom 25 - 90 tömeg%, és a maradék szilárd hordozó- és diszpergáló nedvesítőszer.

11. A 9. igénypont szerinti készítmény, azzal jellemezve, hogy a készítmény granulátum, ahol a hatóanyag-tartalom 1 - 35 tömeg% (I) általános képletű hatóanyag, és a maradék szilárd hordozó- és felületaktív anyag.

12. A 9. igénypont szerinti készítmény, azzal jellemezve, hogy a készítmény emulgeálható koncentrátum, ahol az (I) általános képletű hatóanyag tartalma 5 - 30 tömeg%, és a készítmény tartalmaz még 5 - 20 tömeg% emulgeálószeret és a maradék szilárd hordozó.

13. A 9. igénypont szerinti készítmény, azzal jellemezve, hogy a készítmény folyékony, ahol a hatóanyag-tartalom 5 - 50 tömeg% (I) általános képletű vegyület, és a készítmény tartalmaz még 3 - 10 tömeg% diszpergáló-nedvesítőszeret, és a maradék víz.

14. Eljárás gyomok irtására, azzal jellemezve, hogy egy 1-3. igénypont szerinti vegyület hatékony mennyiségét, vagy a 8-13. igénypont szerinti készítményt a védendő földre visszük, amely föld lehet termelő föld, például rizsföld vagy hegvidéki földek, vagy nem-gazdálkodó földek.

15. A 14. igénypont szerinti eljárás, azzal jellemezve, hogy az alkalmazást a gyomok csírázása előtt végezzük, vagy pedig a csírázás előttől a növekvő stádiumig terjedő stádiumban.

16. A 14. vagy 15. igénypont szerinti eljárás, azzal jellemezve, hogy az (I) általános képletű vegyületet 0,1 - 10 000 g/ha, előnyösen 1 - 5000 g/ha dózisban alkalmazzuk.

17. A 14-16. igénypontok bármelyike szerinti eljárás, azzal jellemezve, hogy a gyomokat a következő haszonnövényekben irtjuk: rizsföld, szójabab, gyapot, cukorrépa, repce, napraforgó, kukorica, hegyvidéki rizs, búza.

18. A 14-16. igénypontok bármelyike szerinti eljárás, azzal jellemezve, hogy a gyomirtást gyümölcsösben, szeder földeken, gyepen és nem-termő földeken végezzük.

19. (II) általános képletű 1,3-dioxin-4-on-származékok, ahol R^6 adott esetben szubsztituált arilcsoport, R^7 hidroximetil-, acetoximetil- vagy formilcsoport.

A oldal rajzzal

A meghatalmazott:

1996. 10. 31

PK.

**Danubia Szabadalmi és
Védjegy Iroda Kft.**

[Signature]
Kerény Judit

szabadalmi ügyvivő

h

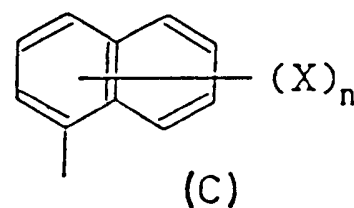
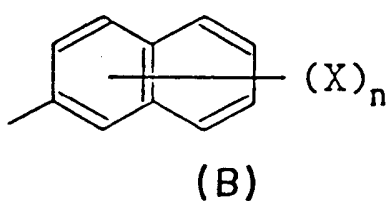
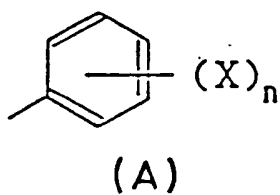
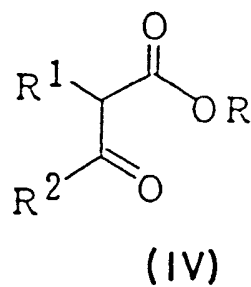
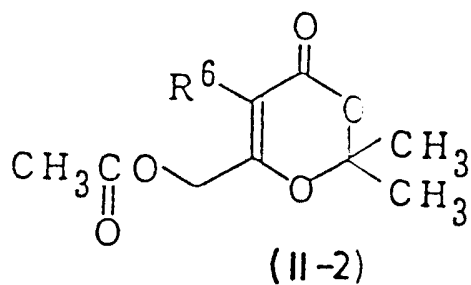
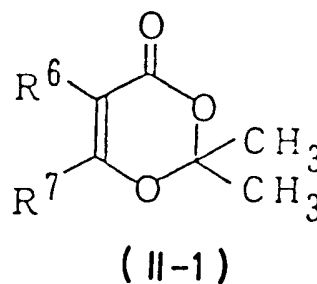
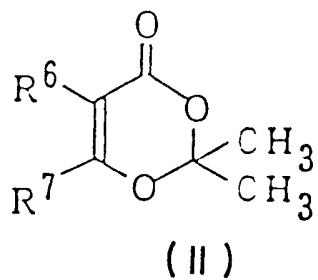
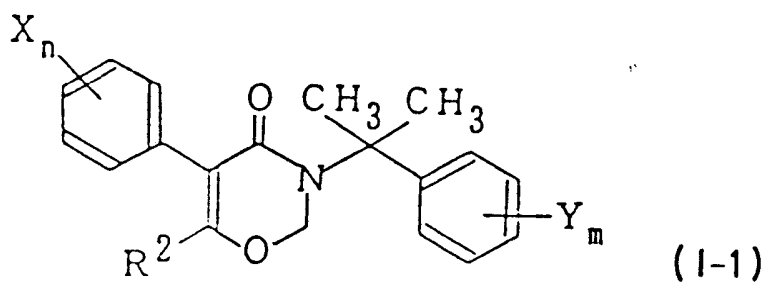
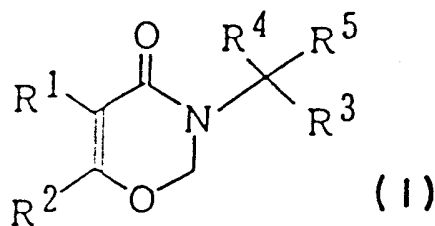
972/96

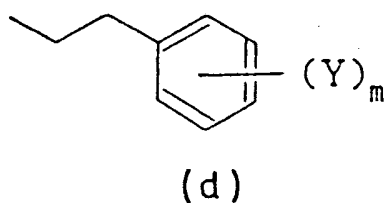
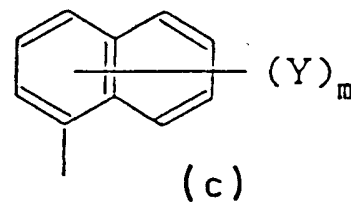
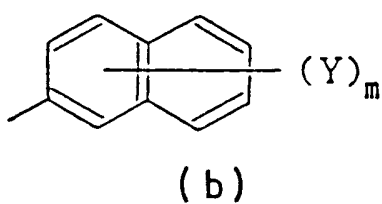
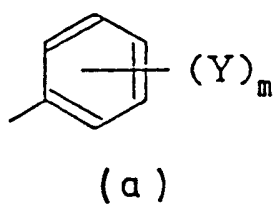
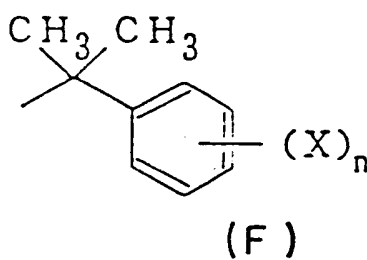
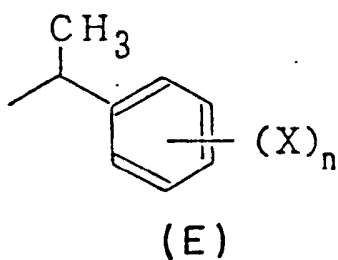
A
KÖZZETETELI
PÉLDÁNY



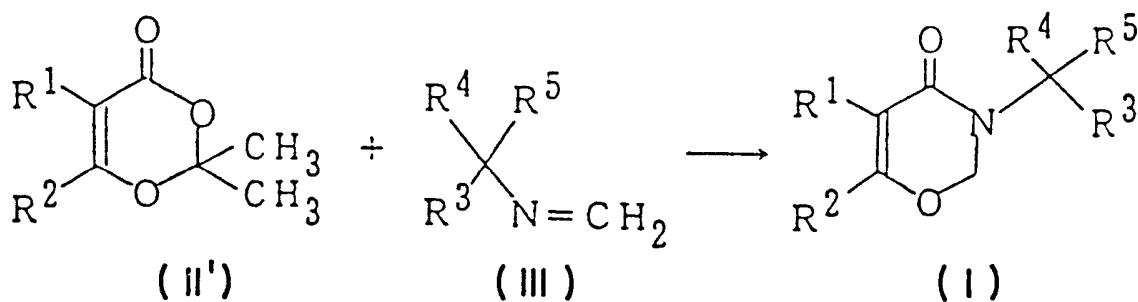
74606

1/4

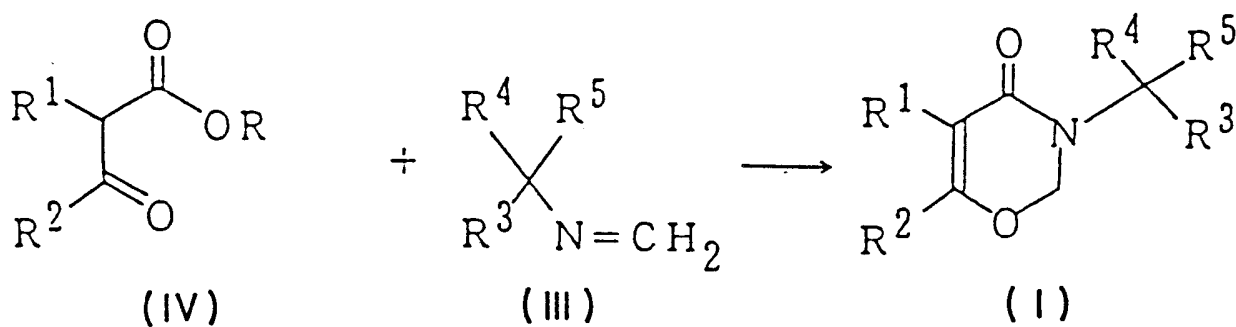




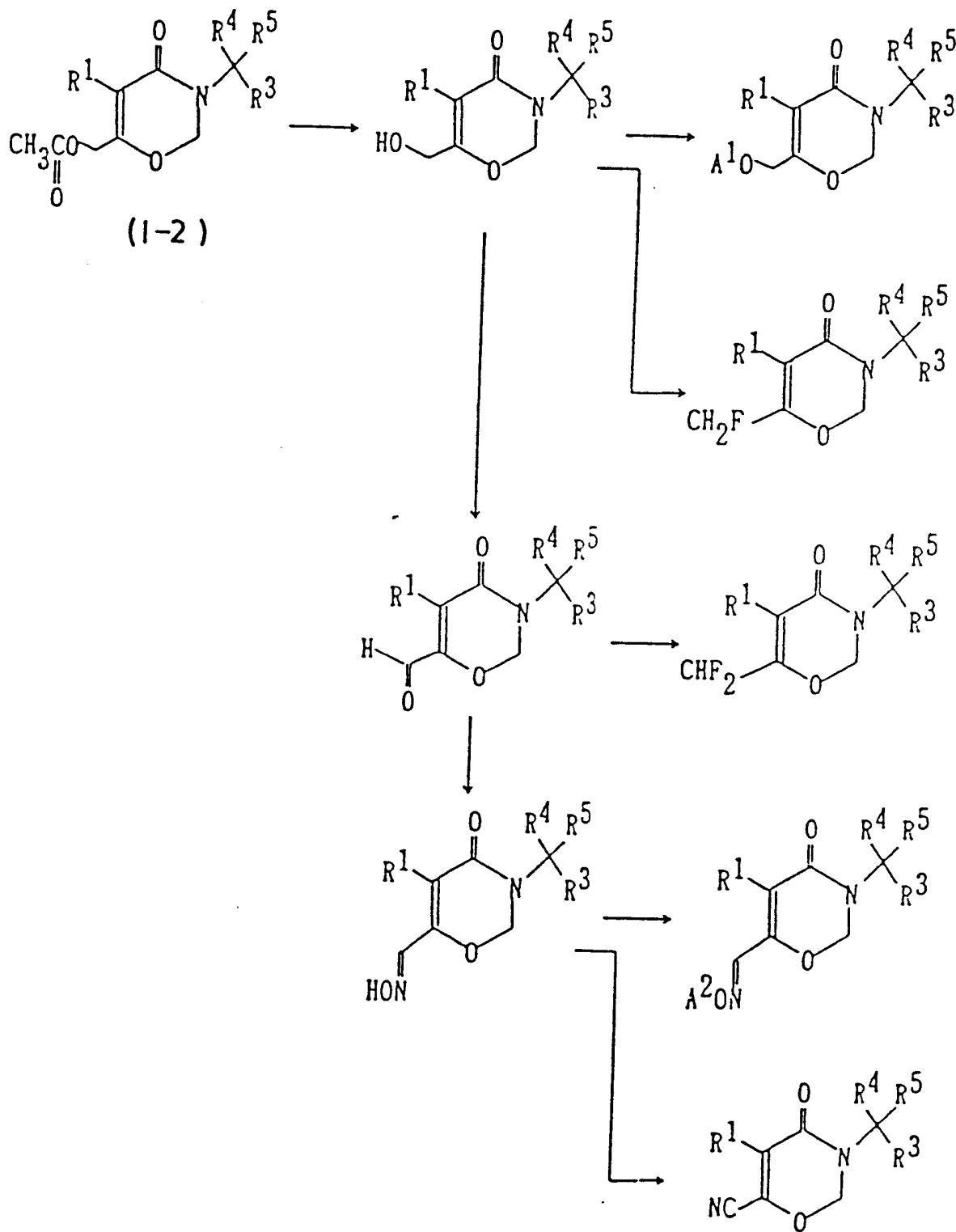
1. reakcióvázlat



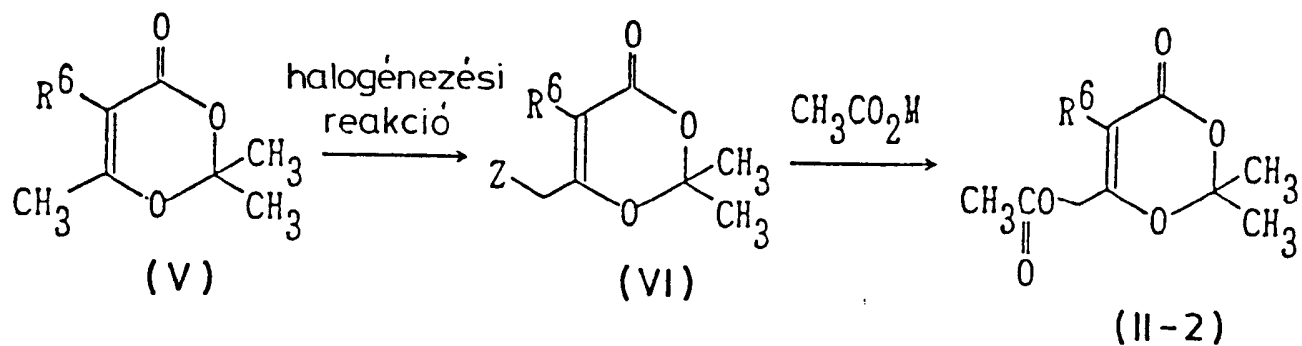
2. reakcióvázlat



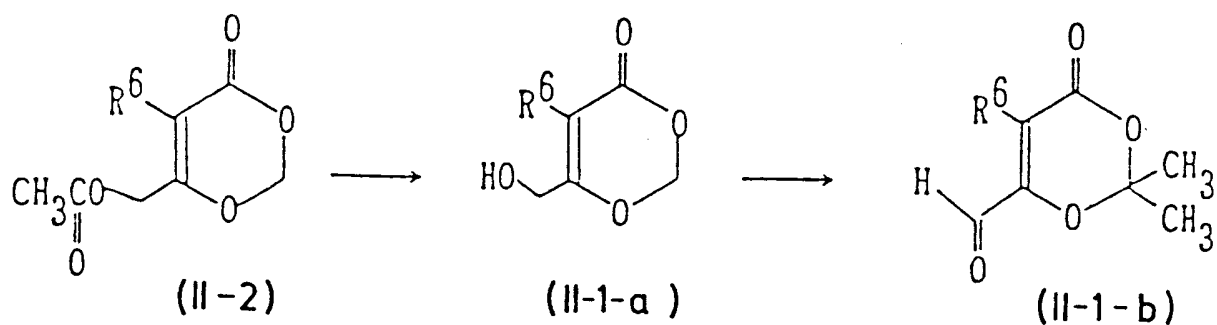
3. reakcióvázlat



4. reakcióvázlat



5. reakcióvázlat



6. reakcióvázlat

