

(19)



SUOMI - FINLAND

(FI)

PATENTTI- JA REKISTERIHALLITUS
PATENT- OCH REGISTERSTYRELSEN
FINNISH PATENT AND REGISTRATION OFFICE

(10) **FI 830559 A7**

(12) **JULKISEKSI TULLUT PATENTTIHAKEMUS
PATENTANSÖKAN SOM BLIVIT OFFENTLIG
PATENT APPLICATION MADE AVAILABLE TO THE
PUBLIC**

(21) Patentihakemus - Patentansökan - Patent application **830559**

(51) Kansainvälinen patenttiluokitus - Internationell patentklassifikation -
International patent classification
**C07C 43/164
C07C 59/66
A01N 31/04
A01N 37/36**

(22) Tekemispäivä - Ingivningsdag - Filing date **18.02.1983**

(23) Saapumispäivä - Ankomstdag - Reception date **18.02.1983**

(41) Tullut julkiseksi - Blivit offentlig - Available to the public **12.09.1983**

(43) Julkaisupäivä - Publiceringsdag - Publication date **12.06.2019**

(32) (33) (31) Etuokeus - Prioritet - Priority

11.03.1982 DE P_3209030.7

(71) Hakija - Sökande - Applicant

1 • Schering Aktiengesellschaft, M BRD, TOWN UNKNOWN, SAKSA, (DE)

(72) Keksijä - Uppfinnare - Inventor

1 • Kr, TOWN UNKNOWN, SAKSA, (DE)

2 • Krämer, Hansjörg, TOWN UNKNOWN, SAKSA, (DE)

3 • Puttner, Reinhold, BRD, SAKSA, (DE)

4 • Pieroh, Ernst Albrecht, BRD, SAKSA, (DE)

(74) Asiamies - Ombud - Agent

Kolster Oy Ab, Salmisaarenaukio 1, 00180 Helsinki

(54) Keksinnön nimitys - Uppfinningens benämning - Title of the invention

Pentitolienbentsyylietterijohdannaisia, menetelmä näiden yhdisteiden valmistamiseksi ja niitä sisältävät valmivalmisteet, joilla on kasvien kasvunsäätövaikutusta.

Benzyleterderivat av pentitol, förfarande för framställning av dessa föreningar och dessa innehållandprodukter med för växter växtreglerand e verkan.

Pentitolien bentsyylietterijohdannaisia, menetelmä näiden yhdisteiden valmistamiseksi ja niitä sisältävät valmisteet, joilla on kasvien kasvunsäätövaikutusta

5

Keksintö koskee uusia pentitolien bentsyylietterijohdannaisia, menetelmää näiden yhdisteiden valmistamiseksi ja niitä sisältäviä valmisteita, joilla on kasvien kasvunsäätövaikutusta.

10

Kasvien kasvunsäätövaikutusta omaavia yhdisteitä tunnetaan ennestään ja osittain niitä on myös jo käytössä.

15

Tunnetut tämänlaatuiset tuotteet, kuten trijodibentsoehappoon tai 2,3:4,6-di-0-isopropylideeni-~~L~~-L-ksyloheksulofuranuronihappoon ja sen natriumsuolaan perustuvat tuotteet eivät kuitenkaan ole vaikutuksen laadun kannalta osoittautuneet odotuksia vastaaviksi tai ne vaikuttavat vasta suurina käyttömäärinä.

20

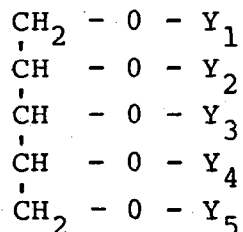
Lisäksi on tunnettua, että 2-bentsyylioksimetyylitetrahydrofuraania (DE-hakemusjulkaisu 2 724 677), joka fytotoksisuutensa ansiosta vahingoittaa kasveja, käytetään herbisidinä.

25

Keksinnön tarkoituksena on esittää valmiste, jolla on laajaspektristä kasvunsäätövaikutusta samalla, kun sen kasveja vaurioittava vaikutus on vähäinen.

Tämä saavutetaan valmisteella, jolle on tunnusomaista, että se sisältää ainakin yhtä yleisen kaavan I mukaista yhdistettä:

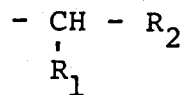
30



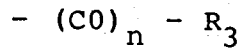
I

jossa yksi substituentista Y on ryhmä

35



ja neljä muuta substituenttia Y ovat samoja tai erilaisia kaavan



mukaisia ryhmiä, jossa kaavassa R_1 on vety tai C_1 - C_4 -alkyyli, R_2 on mahdollisesti substituoitu aromaattinen hiilivetyryhmä, jonka substituentteina on yksi tai useampi C_1 - C_6 -alkyyli ja/tai C_1 - C_6 -alkoksi ja/tai mahdollisesti substituoitu fenoksi ja/tai mahdollisesti substituoitu fenyyli ja/tai halogeeni ja/tai nitro- ja/tai trifluorimetyyliryhmä, R_3 on vety tai mahdollisesti substituoitu C_1 - C_4 -alkyyli, ja n on 0 tai 1.

Keksinnön mukaiset yhdisteet voivat olla optisina isomeereina ja mahdollisesti myös geometrisina isomeereina. Erilliset isomeerit ja niiden seokset kuuluvat myös keksinnön suojapiiriin.

Keksinnön mukaiset yhdisteet sopivat erittäin hyvin viljelykasvien kasvun säätämiseen ja ne ovat yllättäen vaikutusspektrinsä puolesta edellä mainittuja käytössä olevia, saman vaikutussuunnan omaavia tuotteita parempia, jolloin kasvit myös sietävät niitä hyvin.

Koska keksinnön mukaiset yhdisteet aiheuttavat kasveissa sekä kvalitatiivisia että kvantitatiivisia muutoksia että myös muutoksia kasvien metaboliassa, niiden on katsottava kuuluvan kasvien kasvunsäätäjiin, joita voidaan käyttää seuraaviin tarkoituksiin:

Puu- ja ruohovartisten kasvien vegetatiivisen kasvun estäminen esimerkiksi kadunvarsilla, raiteistoilla ym., joissa liiallinen kasvu on haittana. Viljelykasvien kasvunesto lakoutumisen tai katkeamisen ehkäisemiseksi ja puuvillan sadon parantamiseksi.

Koriste- ja viljelykasveilla vaikuttaminen vegetatiivisten ja generatiivisten elinten haarautumiseen vaikuttaminen kukintojen lisäämiseksi, tai tupakalla

ja tomaateilla varkaiden muodostumisen ehkäisyyn.

Hedelmien laadun parantaminen, esimerkiksi soke-
ripitoisuuden lisääminen sokeriruo'ossa, sokerijuurik-
kaissa tai hedelmissä, ja sadon saaminen tasaisemmin
5 kypsymään, millä saavutetaan parempi sato.

Ilmastollisten vaikutusten, kuten kylmyyden ja
kuivuuden kestäkyvyn paraneminen.

Vaikutus kumipuun lateksivirtaan.

Myös partenokarpisten hedelmien muodostukseen,
10 siitepölyn steriiliyteen ja vaikutus sukupuoleen ovat
käyttömahdollisuuksia.

Siementen itämisen tai silmujen puhkeamisen
säättö.

Lehtien pudotus tai vaikutus hedelmien putoa-
15 miseen sadonkorjuun helpottamiseksi.

Erityisen hyvin keksinnön mukaisilla yhdisteillä
voidaan vaikuttaa vegetatiivisen ja generatiiviseen
kasvuun joillakin hernekasveilla, kuten esimerkiksi
soijalla.

20 Käyttömäärät ovat käytön tarkoituksesta riippuen
yleensä 0,005-5 kg vaikuttavaa ainetta/ha, mutta myös
suurempia määriä voidaan käyttää.

Käytön ajankohta riippuu käyttötarkoituksesta ja
sääolosuhteista.

25 Keksinnön mukaisista yhdisteistä edellä kuvattu-
ja vaikutuksia on erityisesti sellaisilla kaavan I mu-
kaisilla yhdisteillä, joissa R_1 on vety tai C_1-C_4 -al-
kyyli, edullisesti metyyli, R_2 on fenyyli, 2-kloorife-
nyyli, 3-kloorifenyyli, 4-kloorifenyyli, 2,6-dikloorife-
30 nyyli, 2,4-dikloorifenyyli, 3,4-dikloorifenyyli, 2,4,6-
trikloorifenyyli, 4-bromifenyyli, 2,4-dibromifenyyli,
2,6-dibromifenyyli, 2,4,6-tribromifenyyli, 2-fluori-
fenyyli, 3-fluorifenyyli, 4-fluorifenyyli, 2,4-difluo-
rifenyli, 2-metyylifenyyli, 3-metyylifenyyli, 4-me-
35 tyylifenyyli, 3,4-dimetyylifenyyli, 2-metoksifenyyli,

3-metoksifenyyli, 4-metoksifenyyli, 3,4-dioksimety-
leenifenyyli, 2-fenoksifenyyli, 3-fenoksifenyyli, 2-
nitrofenyyli tai 3-nitrofenyyli, R_3 on vety, C_1-C_4 -
alkyyli, edullisesti metyyli, etyyli, propyyli tai kloo-
rimetyyli, ja n on 0 tai 1.

Keksinnön mukaisia yhdisteitä voidaan käyttää
joko yksinään tai seoksina toistensa tai muiden vaikut-
tavien aineiden kanssa. Haluttaessa voidaan toivotusta
tuloksesta riippuen lisätä lehtien putoamista edistä-
viä aineita, kasvinsuojeluaineita tai tuholaisten tor-
junta-aineita.

Milloin tarkoituksena on saada laajaspektrisempi
vaikutus, voidaan sekoittaa mukaan myös muita bioside-
ja. Esimerkiksi herbisidisesti vaikuttaviksi seoskom-
ponenteiksi sopivat seuraaviin ryhmiin kuuluvat yhdis-
teet: triatsiinit, aminotriatsolit, anilidit, diatsii-
nit, urasiilit, alifaattiset karboksyylihapot ja halo-
geenikarboksyylihapot, substituoidut bentsoehapot ja
aryylikarboksyylihapot, tällaisten karboksyylihappojen
hydratsidit, amidit, nitriilit ja esterit, karbamidi-
happo- ja tiokarbamidihappoesterit, karbamidit, 2,3,6-
triklooribentsyylipropaniili, rodaanipitoiset aineet
ja muut.

Muista lisäaineista voidaan esimerkkeinä mainita
myös fytotoksisesti vaikuttamattomat aineet, jotka saa-
vat aikaan herbisidien synergistisen vaikutuksen para-
nemisen; näitä ovat mm. kostutusaineet, emulgaattorit,
liuottimet ja öljymäiset lisäaineet.

Keksinnön mukaisia vaikuttavia aineita tai nii-
den seoksia käytetään tarkoituksenmukaisesti valmistei-
den muodossa, kuten jauheina, sirotteina, rakeina, liuok-
sina, emulsioina tai suspensioina, joihin on lisätty
nestemäistä ja/tai kiinteätä kantaja-ainetta tai lai-
mennusainetta ja mahdollisesti kostutus-kiinnitys-,
emulgointi ja/tai dispergointiapuainetta.

Sopivia nestemäisiä kantaja-aineita ovat esimerkiksi vesi, alifaattiset ja aromaattiset hiilivedyt, kuten bentseeni, tolueeni, ksyleeni, sykloheksanoni, isoforoni, dimetyylisulfoksidi, dimetyyliformamidi ja mineraaliöljyfraktiot.

Kiinteinä kantaja-aineina käytettäviksi sopivat mineraaliaineet, esimerkiksi tonsil, silikageeli, talkki, kaoliini, attaclay, kalkkikivi ja piihappo, ja kasvituotteet, esimerkiksi jauhot.

Pinta-aktiivisista aineista voidaan esimerkkeinä mainita kalsiumligniinisulfonaatti, polyoksietyleni-alkyyli-fenolieetterit, naftaleenisulfonihapot ja niiden suolat, fenolisulfonihapot ja niiden suolat, formaldehydikondensaatit, rasva-alkoholisulfaatit ja substituoitunut bentseenisulfonihapot ja niiden suolat.

Vaikuttavan aineen tai vaikuttavien aineiden osuus erilaisissa valmisteissa vaihtelee laajoissa rajoissa. Valmisteet voivat sisältää esimerkiksi noin 10-80 paino-% vaikuttavia aineita, noin 90-20 paino-% nestemäisiä tai kiinteitä kantaja-aineita ja mahdollisesti aina 20 paino-%:iin asti pinta-aktiivisia aineita.

Valmisteiden levitys voidaan suorittaa tavallisella tavalla, esimerkiksi käyttäen kantaja-aineena vettä suihkutusalustoissa, joita levitetään noin 100-1000 l/ha. Valmisteita voidaan käyttää myös ns. low-volume- ja ultra-low-volume-menetelmällä sekä myös ns. mikrorakeina.

Valmisteiden valmistukseen käytetään esimerkiksi seuraavia aineosia:

A. Suihkutusjauheet

a) 80 paino-% vaikuttavaa ainetta

15 paino-% kaoliinia

5 paino-% N-metyyli-N-oleyyli-tauriinin natrium-suolaan ja ligniinisulfonihapon kalsium-suolaan perustuvia pinta-aktiivisia aineita

b) 50 paino-% vaikuttavaa ainetta

40 paino-% savimineraaleja

5 paino-% sellupikeä

5 paino-% ligniinisulfonihapon kalsiumsuolan
ja alkyylifenolipolyglykolieetterin seok-
seen perustuvia pinta-aktiivisia aineita.

c) 20 paino-% vaikuttavaa ainetta

70 paino-% savimineraaleja

5 paino-% sellupikeä

5 paino-% ligniinisulfonihapon kalsiumsuolan
ja alkyylifenolipolyglykolieettereiden
seokseen perustuvia pinta-aktiivisia ainei-
ta.

d) 5 paino-% vaikuttavaa ainetta

80 paino-% tonsilia

10 paino-% sellupikeä

5 paino-% rasvahappokondensaatiotuotteisiin
perustuvia pinta-aktiivisia aineita.

B. Emulsiokonsentraatti

20 paino-% vaikuttavaa ainetta

40 paino-% ksyleeniä

35 paino-% dimetyylisulfoksidia

5 paino-% nonyyllifenyylipolyoksietyleni- tai
kalsiumdodekylibentseenisulfonaattiseosta.

C. Tahna

45 paino-% vaikuttavaa ainetta

5 paino-% natriumaluminiumsilikaattia

15 paino-% setyylipolyglykolieetteriä (8 EtO)

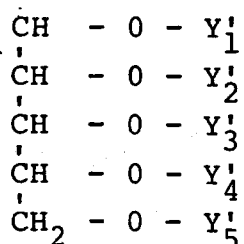
2 paino-% väärttinäöljyä

10 paino-% polyetyleeniglykolia

23 osaa vettä

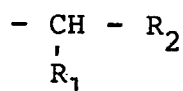
Uusia keksinnön mukaisia yhdisteitä voidaan val-
mistaa esimerkiksi siten, että

A) yhdiste, jonka yleinen kaava on



II

jossa yksi substituentista Y' on ryhmä



10 ja neljä muuta substituenttia Y' ovat vetyjä, saatetaan reagoimaan

a) yhdisteen kanssa, jonka yleinen kaava on



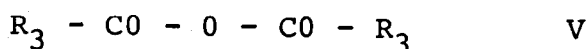
tai

15 b) yhdisteen kanssa, jonka yleinen kaava on



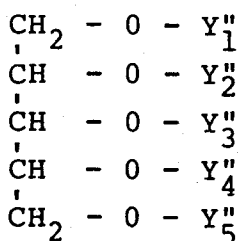
tai

b) yhdisteen kanssa, jonka yleinen kaava on



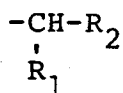
20 mahdollisesti happoa sitovan aineen ja/tai katalysaattorin läsnä ollessa, tai

B) yhdiste, jonka yleinen kaava on



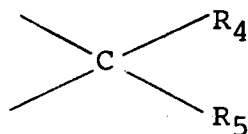
VI

jossa yksi substituentista Y'' on ryhmä



30

ja neljä muuta substituenttia Y'' muodostavat pareittain mahdollisesti substituoidun metyleeniryhmän



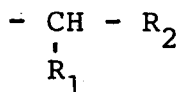
35

hydrolysoidaan, mahdollisesti orgaanisen liuottimen ja happamen katalysaattorin, kuten rikkihapon, p-tolueneisulfonihapon, kloorivetyhapon, ammoniumkloridin, fosforihapon, piihapon tai happamen ioninvaihtohartsin läsnä ollessa 0-100°C:ssa, edullisesti 40-80°C:ssa, jolloin R_1 , R_2 ja R_3 merkitsevät samaa kuin edellä, ja R_4 ja R_5 ovat samoja tai erilaisia ja ovat kumpikin vety, C_1 - C_{10} -alkyyli, substituoitu C_1 - C_{10} -alkyyli, mahdollisesti substituoitu aryyli- C_1C_3 -alkyyli, C_3 - C_8 -sykloalifaattinen hiilivetyryhmä, yhdellä tai useammalla C_1 - C_6 -alkyyllillä ja/tai halogeenilla ja/tai C_1 - C_6 -alkoksilla ja/tai nitroryhmällä ja/tai trifluorimetyyli-ryhmällä substituoitu aromaattinen hiilivetyryhmä, tai R_4 ja R_5 muodostavat yhdessä polymetyleeniryhmän $-(CH_2)_m$, X on halogeeni, edullisesti kloori, ja Z on halogeeni tai R_3OSO_2O- ja m on kokonaisluku 4 tai 5.

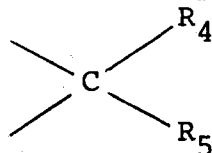
Substituoidun metyleeniryhmän substituentteina R_4 ja R_5 voivat olla esimerkiksi vety, C_1 - C_{10} -alkyyli, esimerkiksi metyyli, etyyli, propyyli, isopropyyli, n-butylyli, sek-butylyli, tert-butylyli, 2,2-dimetyyli-1-propyyli, n-pentylyli, n-heptylyli, n-oktylyli, n-dekyyli, substituoitu C_1 - C_{10} -alkyyli, esimerkiksi kloorimetyyli, bromimetyyli, fluorimetyyli, dikloorimetyyli, trifluorimetyyli, trikloorimetyyli, hydroksimetyyli, metoksimetyyli, etoksimetyyli, fenoksimetyyli, 4-kloorifenoksimetyyli, kloorietyyli, bromietyyli, 2-etoksietyyli, 2-fenoksietyyli, C_3 - C_8 -sykloalifaattisia hiilivetyjä, esimerkiksi syklopropyyli, syklopentyli, sykloheksyyli, aryyli- C_1 - C_3 -alkyyli, esimerkiksi bentsyyli, 2-fenylietyyli, aromaattisia hiilivetyryhmiä, esimerkiksi fenyyli, 2-kloorifenyyli, 3-kloorifenyyli, 4-kloorifenyyli, 3,4-dikloorifenyyli, 4-metoksifenyyli, 4-nitrofenyyli, 2,4-dikloorifenyyli.

Lähtöaineina käytettäviä edullisia pentitoli-johdannaisia VI ovat sellaiset, joissa

1) Y_1'' on ryhmä



ja Y_2'' ja Y_3'' yhdessä ja Y_4'' ja Y_5'' yhdessä muodostavat mahdollisesti substituoidun metyleeniryhmän

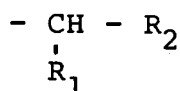


ja

2) Y_3'' on ryhmä $\begin{array}{c} -CH - R_2 \\ | \\ R_1 \end{array}$

ja Y_1'' ja Y_2'' yhdessä ja Y_4'' ja Y_5'' yhdessä muodostavat mahdollisesti substituoidun metyleeniryhmän, ja

3) Y_5'' on ryhmä



ja Y_1'' ja Y_2'' yhdessä ja Y_3'' ja Y_4'' yhdessä muodostavat mahdollisesti substituoidun metyleeniryhmän.

Reaktanttien välinen reaktio suoritetaan 0-150°C:ssa, tavallisesti kuitenkin huoneen lämpötilan ja reaktioseoksen palautusjäähdytyslämpötilan välisessä lämpötilassa.

Reaktioaika on 1-72 tuntia.

Keksinnön mukaisten yhdisteiden synteisiin käytetään reaktantteja noin ekvimolaarisina määrinä. Reaktioväliaineeksi sopii reaktanttien suhteen inertti liuotin. Liuottimen tai suspendointiaineen valinnassa tulee ottaa huomioon käytetty alkyyli- tai asyylihalogenidi ja dialkyyylisulfaatti ja käytetty happoa sitova aine. Sopivista liuottimista tai suspendointiaineista voidaan esimerkkeinä mainita eetterit, kuten dietyylieetteri, di-isopropyylieetteri, tetrahydrofuraani ja dioksaani, alifaattiset ja aromaattiset hiilivedyt, kuten petroli-eetteri, sykloheksaani, heksaani, heptaani, bentseeni, tolueeni ja ksyleeni, karboksyylihapponitriilit, kuten

asetonitriili, ja karboksyylihapoamidit, kuten dimetyyliformamidi.

Happoa sitovina aineina voidaan käyttää orgaanisia emäksiä, kuten esimerkiksi trietyyliamiinia, N,N-dimetyylianiiliinia ja pyridiiniemäksiä, tai epäorgaanisia emäksiä, kuten maa-alkali- ja alkalimetallien oksideja, hydroksideja ja karbonaatteja. Nestemäiset emäkset, kuten pyridiini, voivat samalla toimia liuottimena.

Menetelmävaihtoehdossa A sopivat katalysaattoreiksi onium-yhdisteet, kuten kvaternääriset ammonium-, fosfonium- ja arsoniumyhdisteet ja sulfoniumyhdisteet.

Käytettäväksi sopivat myös polyglykolieetterit, varsinkin sykliset, kuten 18-kruunu-6, ja tertiääriset amiinit, kuten tributyyliamiini. Edullisia ovat kvaternääriset ammoniumyhdisteet, kuten esimerkiksi bentsyylietrietyyliammoniumkloridi ja tetrabutyyliammoniumbromidi.

Edellä esitetyillä menetelmillä valmistetut keksinnön mukaiset yhdisteet voidaan eristää reaktioseoksesta tavanomaisin menetelmin, esimerkiksi tislamalla pois liuotin normaalipaineessa tai alennetussa paineessa, saostamalla vedellä tai uuttamalla. Suurempi puhtausaste voidaan tavallisesti saavuttaa puhdistamalla pylväskromatografisesti tai fraktiokiteytyksellä.

Keksinnön mukaiset yhdisteet ovat tavallisesti värittömiä ja hajuttomia nesteitä, jotka ovat niukka-liukoisia veteen, jossain määrin liukenevia alifaattisiin hiilivetyihin, kuten petrolieetteriin, heksaaniin, pentaaniin ja sykloheksaaniin, ja hyvin liukenevia halogenoituihin hiilivetyihin, kuten kloroformiin, metyleenikloridiin ja hiilitetrakloridiin, aromaattisiin hiilivetyihin, kuten bentseeniin, tolueeniin ja ksyleeniin, eettereihin, kuten dietyylieetteriin, tetrahydrofuraniin ja dioksaaniin, karboksyylihapponitriileihin, kuten asetonitriiliin, ketoneihin, kuten asetoniin, alkoholei-

hin, kuten metanoliin ja etanoliin, karboksyylihappami-
 deihin, kuten dimetyyliformamidiin, ja sulfoksideihin,
 kuten dimetyylisulfoksidiin; keksinnön mukaiset yhdis-
 teet voivat olla myös värittömiä ja hajuttomia kiteisiä
 5 aineita, jotka ovat niukkaliukoisia alifaattisiin ja
 aromaattisiin hiilivetyihin, kohtalaisen hyvin liukene-
 via halogenoituihin hiilivetyihin, kuten kloroformiin ja
 hiilitetrakloridiin, ketoneihin, kuten asetoniin, karbok-
 syylihappoamideihin, kuten dimetyyliformamidiin, sulfok-
 10 sideihin, kuten dimetyylisulfoksidiin, karboksyylihappo-
 nitrileihin, kuten asetonitriliin, alempiin alkoholei-
 hin, kuten metanoliin, etanoliin, ja veteen.

Uudelleen kiteyttämislouottimiksi sopivat erityi-
 sesti vesi, metanoli, asetonitrili ja etyyliasetatti.

15 Seuraavat esimerkit kuvaavat keksinnön mukaisten
 pentitolien bentsyylietterijohdannaisten valmistusta.

Esimerkki 1

5-0-(2,6-diklooribentsyyli)ksylitoli

277,0 g:aan (0,708 mol) 5-0-(2,6-diklooribent-
 20 syyli)-1,2:3,4-bis-0-isopropylideeniksylitolia lisätään
 sekoittaen 752,2 ml 1,5-n rikkihapoa. Reaktioseosta
 sekoitetaan 3 tuntia 70°C:ssa, sitten seos saa seistä
 yön yli huoneen lämpötilassa. Siihen lisätään sekoit-
 taen 25°C:ssa tipoitain 95 ml 32-%:ista natriumhydrok-
 25 sidiliuosta ja seos uutetaan etyyliasetaatilla (3 x 200
 ml). Uutteet pestään vedellä (2 x 100 ml), kuivataan
 magnesiumsulfaatilla, suodatetaan ja haihdutetaan vakuu-
 missa. Saatuja värittömiä kiteitä digeroidaan kylmässä
 dietyylietteri/di-isopropyylieetteriseoksessa 1:1,
 30 sitten ne kuivataan huoneen lämpötilassa 200 torrin
 paineessa, kunnes ne saavuttavat vakiopainon.
 Saanto: 202,0 g = 91,7 % teoreettisesta 5-0-(2,6-di-
 klooribentsyyli)-ksylitolia, sp. 82-83°C, ohutkerros-
 kromatografia: liuotin:kloroformi/metanoli 4:1,
 35 Rf-arvo: 0,34.

Analyysi, laskettu: C 46,32 % H 5,18 % Cl 22,79 %

saatu: C 46,48 % H 5,10 % Cl 22,37 %.

Esimerkki 2

3-0-(2,6-diklooribentsyyli)-1,2:4,5-tetra-0-metyyliadonitoli

3-0-(2,6-diklooribentsyyli)adonitolin (3,11 g, 0,01 mol), bentsyylietrietyyliammoniumkloridin (0,22 g, 0,001 mol) ja dimetyylisulfaatin (25,23 g, 0,2 mol) seokseen metyleenikloridissa (20 ml) tiputetaan voimakkaasti sekoittaen ja jäähdyttäen noin 30°C:ssa kaliumhydroksidin (14,0 g, 0,25 mol) liuos 15 ml:ssa vettä. 3 tunnin sekoittamisen jälkeen huoneen lämpötilassa seosta kuumennetaan tunnin ajan palautusjäähdyttäen. Seokseen lisätään 150 ml vettä, ja seos uutetaan etyyliasetaatilla (2 x 150 ml). Uute pestään vedellä, kuivataan magnesiumsulfaattilla, suodatetaan ja haihdutetaan. Jäännöksenä saatu öljy tislataan käyttäen pallojäähdytintä (hauteen lämpötila 200°C, 0,2 torr).

Saanto: 2,90 g = 79,1 % teoreettisesta 3-0-(2,6-diklooribentsyyli)-1,2:4,5-tetra-0-metyyliadonitolia; n_D^{20} : 1,5198; ohutkerroskromatografia: liuotin: tolueeni/etyyliasetatti, 1:1, Rf-arvo 0,29

Analyysi, laskettu: C 52,32 % H 6,58 % Cl 19,30 %

saatu: C 51,82 % H 6,48 % Cl 20,13 %.

Esimerkki 3

1-0-(2,6-diklooribentsyyli)-2,3,4,5-tetra-0-asetyyli-D-arabitoli

5,0 g (0,016 mol) 1-0-(2,6-diklooribentsyyli)-D-arabitolia sekoitetaan tunnin ajan pyridiinin (20 ml) ja asetanihydridin (20 ml) seoksessa. Reaktioseos saa seistä yön yli, sitten siihen lisätään 150 ml tolueenia, ja se haihdutetaan kuiviin vesisuihkupumppuvakuuissa. Jäännökseen lisätään jälleen 150 ml tolueenia, ja seos haihdutetaan uudelleen kuiviin vakuuissa. Jäännöksenä saatuun öljyyn lisätään annoksittain 300 ml etyyliase-

taattia, liuos pestään vedellä, kuivataan magnesiumsulfaatilla, suodatetaan ja haihdutetaan. Digeroimalla vähäisessä määrässä di-isopropyylietteriä öljymäinen jäännös saadaan kiteytymään.

5 Saanto: 5,80 g = 75,7 % teoreettisesta 1-0-(2,6-diklooribentsyyli)-2,3,4,5-tetra-0-asetyyli-D-arabitolia, sp. 89-90°C; ohutkerroskromatografia: liuotin: tolueeni/etyyliasetatti 1:1, Rf-arvo 0,47

Analyysi, laskettu: C 50,11 % H 5,49 % Cl 14,79 %

10 saatu: C 50,58 % H 5,49 % Cl 14,80 %.

Seuraavat keksinnön mukaiset yhdisteet valmistettiin analogisella tavalla:

Esimerkki Yhdisteen nimi no.		Fys. vakio
15	4 5-0-(2,4-diklooribentsyyli)ksylitoli	sp. 96-98°C
	5 5-0-(2klooribentsyyli)ksylitoli	sp. 52-54°C
	6 5-0-(2-metyylibentsyyli)ksylitoli	sp. 59-61°C
	7 1-0-(2,6-diklooribentsyyli)-L-arabitoli	sp.122-124°C
20	8 1-0-(2,6-diklooribentsyyli)-D-arabitoli	sp.124-126°C
	9 3-0-(2,6-diklooribentsyyli)adonitoli	sp.116-117°C
25	10 5-0-(2,4,6-tribromibentsyyli)ksylitoli	sp.132-133°C
	11 5-0-bentsyylikksylitoli	sp. 47-50°C
	12 5-0-(2,6-diklooribentsyyli)-1,2,3,4-tetra-0-asetyylikksylitoli	n_D^{20} 1,4876
30	13 5-0-(2,4,6-tribromibentsyyli)-1,2,3,4-tetra-0-asetyylikksylitoli	sp.106-107°C
	14 3-0-(2,4,6-tribromibentsyyli)-adonitoli	sp.132-134°C
	15 5-0-(4-klooribentsyyli)-ksylitoli	sp.109-109,5°C
35	16 5-0-(4-bromibentsyyli)ksylitoli	sp.110-112°C

	Esimerkki Yhdisteen nimi no.	Fys. vakio
	17 5-0-(3,4-diklooribentsyyli)ksyli- toli	sp. 122-123°C
5	18 5-0-(3-metyylibentsyyli)ksylitoli	sp. 54-56°C
	19 5-0-(4-metyylibentsyyli)ksylitoli	sp. 98-99°C
	20 5-0-(3,4-dimetyylibentsyyli)- ksylitoli	sp. 72-74°C
	21 5-0-(3-klooribentsyyli)ksylitoli	sp. 90-92°C
10	22 5-0-(4-syaanibentsyyli)ksylitoli	sp. 119-121°C
	23 3-0-(2,6-diklooribentsyyli)- 1,2,4,5-tetra-0-asetyyliadonitoli	n_D^{20} 1,4941
	24 5-0-(3-trifluorimetyylibentsyyli)- ksylitoli	sp. 61-63°C
15	25 5-0-(3-fluoribentsyyli)ksylitoli	sp. 72-74,5°C
	26 5-0-(4-fluoribentsyyli)ksylitoli	sp. 76-78°C
	27 1-0-(2,4,6-tribromibentsyyli)- D-arabitoli	sp. 156-157°C
	28 5-0-(2-fluoribentsyyli)ksylitoli	n_D^{20} 1,5243
20	29 5-0-(2,6-diklooribentsyyli)- 1,2,3,4-tetra-0-metyyliksylitoli	n_D^{20} 1,5186
	30 1-0-(2,6-diklooribentsyyli)- 2,3,4,5-tetra-0-metyyli-L-arabitoli	n_D^{20} 1,5201
	31 5-0-(2,4-diklooribentsyyli)- 1,2,3,4-tetra-0-metyyli-L-arabitoli	n_D^{20} 1,5177
25	32 1-0-(2,6-diklooribentsyyli)-2,3,- 4,5-tetra-0-metyyli-D-arabitoli	n_D^{20} 1,5205
	33 5-0-(2,4,6-tribromibentsyyli)- 1,2,3,4-tetra-0-metyyliksylitoli	n_D^{20} 1,5616
30	34 1-0-(2,4,6-tribromibentsyyli)-2,3,- 4,5-tetra-0-metyyli-D-arabitoli	n_D^{20} 1,5668
	35 5-0-(2-kloori-6-fluoribentsyyli)- ksylitoli	sp. 70-71°C
35	36 1-0-(2-kloori-6-fluoribentsyyli)- D-arabitoli	sp. 138-139°C

Esimerkki	Yhdisteen nimi	Fys. vakio
37	3-0-(2-kloori-6-fluoribentsyyli)-adonitoli	n_D^{20} 1,5297
38	5-0-(2-kloori-6-fluoribentsyyli)-1,2,3,4-tetra-0-asetyyliksylitoli	n_D^{20} 1,4809
39	5-0-(2-kloori-6-fluoribentsyyli)-1,2,3,4-tetra-0-metyyliksylitoli	n_D^{20} 1,4972

Keksinnön mukaisten yhdisteiden valmistuksessa käytettävät lähtöaineet ovat sinänsä tunnettuja tai voidaan valmistaa sinänsä tunnetuin menetelmin.

Seuraavat esimerkit valaisevat lähtöaineiden valmistusta.

Esimerkki 40

5-0-(2,6-diklooribentsyyli)-1,2:3,4-bis-0-isopropylideeniksylitoli

1,2:3,4-bis-0-isopropylideeniksylitolin (116,13 g, 0,5 mol), 2,6-diklooribentsyylibromidin (119,96 g, 0,5 mol) ja bentsyylietrietyyliammoniumkloridin (4,5 g, 0,019 mol) seokseen lisätään huoneen lämpötilassa voimakkaasti sekoittaen tipoittain natriumhydroksidin (100 g 2,5 mol) liuos 125 ml:ssa vettä, jolloin lämpötila kohoaa hitaasti 50°C:seen ja laskee jälleen noin tunnin kuluessa huoneen lämpötilaan. Lisäyksen päätyttyä seosta sekoitetaan vielä tunnin ajan 50°C:ssa, sitten seos laimennetaan 500 ml:lla jäävettä ja uutetaan 150 ml:lla etyyliasetaattia. Orgaaninen faasi pestään vedellä (2 x 300 ml), kuivataan magnesiumsulfaatilla, suodatetaan ja haihdutetaan kuiviin vakuuissa 40°C:ssa.

Jäännös fraktiotislataan.

Saanto: 150,0 g = 76,7 % teoreettisesta;

$k_{p0,1}$ torr 163°C; n_D^{20} 1,5080; ohutkerroskromatografia: liuotin tolueeni/etyyliasetaatti 4:1, Rf-arvo: 0,52.

Analyysi, laskettu: C 55,25 % H 6,18 % Cl 18,12 %
 saatu: C 55,66 % H 6,46 % Cl 18,03 %.

Esimerkki 41

5-0-(2,4,6-tribromibentsyyli)-1,2:3,4-bis-0-
isopropylideeniksyylitoli

1,2:3,4-bis-0-isopropylideeniksyylitolin (23,2 g, 0,1 mol) liuokseen 100 ml:ssa tolueenia tiputetaan hitaasti samalla sekoittaen natriumhydridin (2,88 g, 0,12 mol) suspensio 50 ml:ssa tolueenia. Lisäyksen
 10 päätyttyä seosta kuumennetaan palautusjäähdyttään 2 tuntia. Seokseen lisätään sitten tipoittain 2,4,6-tribromibentsyylibromidin (40,78 g, 0,1 mol) liuos 50 ml:ssa tolueenia, ja seosta kuumennetaan palautusjäähdyttään 8 tuntia. Seoksen jäähdyttyä se pestään varovasti vedellä (3 x 150 ml), orgaaninen faasi kuivataan magnesiumsulfaatilla, suodatetaan ja haihdutetaan vakuumissa 40°C:ssa. Jäännöksenä saatu öljy tislataan vakuumissa (80°C haudelämpötila, 0,1 torr) jäljellä olevan lähtöaineen erottamiseksi.

20 Saanto: 37,6 g = 67,25 % teoreettisesta; n_D^{20} 1,5516;
 ohutkerroskromatografia: liuotin: tolueeni/etyyliasetatti 1:1, RF-arvo 0,52.

Analyysi, laskettu: C 38,26 % H 4,14 %

saatu: C 37,99 % H 4,04 %.

25 Seuraavat lähtöaineet valmistetaan analogisella tavalla.

	Esimerkki no.	Yhdisteen nimi	Fys. vakio
5	42	3-0-(2,4-diklooribentsyyli)- 1,2:4,5-bis-0-(isopropylideeni)- adonitoli	n_D^{20} 1,5092
	43	1-0-(2,4-diklooribentsyyli)- 2,3:4,5-bis-0-(isopropylideeni)-L- arabitoli	n_D^{20} 1,5070
10	44	1-0-(2,4-diklooribentsyyli)- 2,3:4,5-bis-0-(isopropylideeni)- D-arabitoli	n_D^{20} 1,5071
	45	1-0-(2,6-diklooribentsyyli)- 2,3:4,5-bis-0-(isopropylideeni)- L-arabitoli	n_D^{20} 1,5075
15	46	1-0-(2,6-diklooribentsyyli)- 2,3:4,5-bis-0-(isopropylideeni)- D-arabitoli	n_D^{20} 1,5093
	47	3-0-(2,6-diklooribentsyyli)- 1,2:4,5-bis-0-(isopropylideeni)- adonitoli	n_D^{20} 1,5118
20	48	3-0-(2,4,6-tribromibentsyyli)- 1,2:4,5-bis-0-(isopropylideeni)- adonitoli	sp. 75°C
	49	1-0-(2,4,6-tribromibentsyyli)- 2,3:4,5-bis-0-(isopropylideeni)- D-arabitoli	n_D^{20} 1,5447
25	50	5-0-(2-kloori-6-fluoribentsyyli)- 1,2:3,4-bis-0-(isopropylideeni)- ksylitoli	n_D^{20} 1,4916
30	51	1-0-(2-kloori-6-fluoribentsyyli)- 2,3:4,5-bis-0-(isopropylideeni)- D-arabitoli	n_D^{20} 1,4901
35	52	3-0-(2-kloori-6-fluoribentsyyli)- 1,2:4,5-bis-0-(isopropylideeni)- adonitoli	n_D^{20} 1,4918

Seuraavat esimerkit valaisevat keksinnön mukais-
ten yhdisteiden käyttömahdollisuuksia, jolloin kokeet
on suoritettu edellä kuvatuilla valmisteilla.

Esimerkki 53

5 Soijan palkojen klorofyllipitoisuuden kohoaminen

Sojapavun taimia suihkutettiin kokeiltavien yh-
disteiden vesiemulsioilla (itämisen jälkeen käsittely).
Käyttömäärä oli 0,8 kg vaikuttavaa ainetta/ha. 4 viikon
10 kuluttua suihkutuksesta taimien toisesta lehdykästä
otettiin leikkaimella levyjä. Niistä uutettiin kloro-
fylli ja klorofylli a-pitoisuus määritettiin fotomet-
risesti.

Taulukossa on esitetty klorofylli a-pitoisuuksien
kohoaminen kontrolliin verrattuna. Lisäksi kasvien
15 palko- ja kukintamäärät määritettiin ja laskettiin %:ina
kontrollista. Nämä arvot on myös esitetty taulukossa.

Tulokset osoittavat, että keksinnön mukaisille
yhdisteille on ominaista, että kasvit kestävät niitä
paremmin kuin vertailuyhdisteitä, kasvien klorofylli-
20 pitoisuus, kukintojen ja palkojen määrä on suurempi
kuin vertailuyhdisteillä.

Taulukko

	Keksinnön mukainen yhdiste	Klorofyllipitoi- suuden koho- minen, %	Palkojen ja ku- kintojen määrän kasvu %:eina kontrollista
--	----------------------------	--	--

5	5-0-(2,6-diklooribentsyyli)- ksylitoli	63,8	202
	1-0-(2,6-diklooribentsyyli)- L-arabitoli	43,0	129
10	1-0-(2,6-diklooribentsyyli)- adonitoli	37,2	103
	3-0-(2,6-diklooribentsyyli)- adonitoli	39,3	129
<u>DE-hakemusjulkaisusta 2 724 677 tunnettu vertailuyhdiste</u>			
15	2-bentsyylioksimetyyllitetra- hydrofuraani	27,4	146
	2,6-diklooribentsyylioksi- metyyllitetrahydrofuraani*	60,9	90

* fytotoksinen, kasveilla syöpymisvaurioita.

Esimerkki 54

20 Peittauksen kasvunsäätövaikutus soi-japapuun ja
pensaspuun

Pensaspuja ja soi-japapuja peitattiin vaikutta-
vien aineiden jauhevalmisteilla käyttömäärien olles-
sa 10, 50 ja 100 g vaikuttavaa ainetta siemenen
25 100 kg:a kohti. Siemenet kylvettiin viljelyastioihin ja
taimet kasvatettiin kasvihuoneolosuhteissa, 3 viikon
viljelyn jälkeen vaikutukset arvioitiin käyttäen arvo-
asteikkoa 0-10. Asteikon luvut merkitsivät seuraavaa:
10 = ei muutosta käsittelemättömään kontrolliin verrattuna
30 5 = lyhentynyt, tummanvihreä, haarautunut
1 = erittäin vahvasti lyhentynyt, intensiivisen tumman-
vihreä, vahvasti haarautunut

Kuten tuloksista nähdään, keksinnön mukaisilla
vaikuttavilla aineilla on haluttu vaikutus, ja niiden
35 vaikutus on voimakkaampi kuin vertailuaineilla saadu
vaikutus.

Taulukko

	Keksinnön mukainen yhdiste	Käyttömäärä g/100 siementä	Arvopisteet	
			pensas- papu	soijapapu
5	5-0-(2,6-diklooribentsyyli)- ksylitoli	10	8	8
		50	3	5
		100	3	4
10	1-0-(2,6-diklooribentsyyli)- L-arabitoli	10	10	7
		50	5	4
		100	3	3
	1-0-(2,6-diklooribentsyyli)- D-arabitoli	10	8	8
		50	6	5
		100	3	4
15	3-0-(2,6-diklooribentsyyli)- adonitoli	10	9	8
		50	5	5
		100	3	5
20	5-0-(2,4,6-tribromibentsyyli)- ksylitoli	10	10	10
		50	9	9
		100	9	9
25	<u>Vertailuyhdiste</u>			
	2-bentsyylioksimetyyllitetra- hydrofuraani (DE-hakemusjulkaisun 2 724 677 mukainen yhdiste)	10	10	9
		50	10	9
		100	10	8
	2,3:4,6-di-O-isopropylideeni- L-ksyloheksulofuranuronihapon natriumsuola	10	10	8
		50	10	8
		100	10	7

Esimerkki 55Soijapavun sadon paraneminen

Soijapavun taimia (itämisen jälkeen käsittely) suihkutettiin kokeiltavien yhdisteiden vesiemulsioilla käyttömäärän ollessa 0,8 kg vaikuttavaa ainetta/ha. 4 viikon kuluttua suihkutuksesta määritettiin kukintojen ja palkojen määrä. Nämä arvot ovat kiintomittoina taulukossa. Tulokset on tällöin ilmoitettu %:eina kontrollista. Lisäksi taulukossa on kasvun prosentuaalinen estyminen. Tuloksista nähdään, että keksinnön mukaiset yhdisteet edistävät palkojen ja kukintojen muodostusta ja samalla pienentävät kasvien kokoa. Vertailuyhdisteillä saatiin tämä vaikutus vain heikosti, tai ne osoittautuivat jonkin verran fytotoksisiksi.

Taulukko

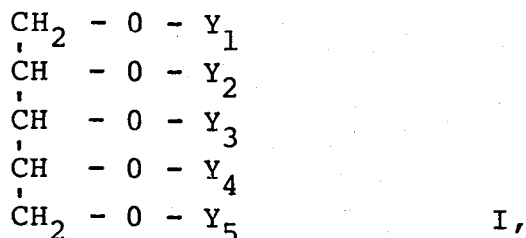
Keksinnön mukainen yhdiste

Kasvun esty-
minenPalkojen ja ku-
kintojen määrä
%:eina kontrol-
lista

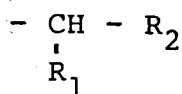
5	5-0-(2-klooribentsyyli)ksylitoli	28	142
	5-0-(2,6-diklooribentsyyli)-1,2,3,4-tetra-0-asetyyliksylitoli	59	219
	5-0-(2,4,6-tribromibentsyyli)-1,2,3,4-tetra-0-asetyyliksylitoli	44	173
10	1-0-(2,6-diklooribentsyyli)-2,3,4,5-tetra-0-asetyyli-D-arabitoli	59	215
	3-0-(2,4,6-tribromibentsyyli)adonitoli	49	188
	5-0-(4-klooribentsyyli)ksylitoli	44	165
	5-0-(4-bromibentsyyli)ksylitoli	49	185
	5-0-(3,4-diklooribentsyyli)ksylitoli	0	115
15	5-0-(3-metyylibentsyyli)ksylitoli	28	108
	5-0-(4-metyylibentsyyli)ksylitoli	33	204
	5-0-(3,4-dimetyylibentsyyli)ksylitoli	33	204
	5-0-(3-klooribentsyyli)ksylitoli	38	135
	5-0-(3-syaanibentsyyli)ksylitoli	28	150
20	0-asetyyliadonitoli	59	204
	5-0-(3-trifluorimetyylibentsyyli)ksylitoli	23	80
	5-0-(3-fluoribentsyyli)ksylitoli	33	204
	1-0-(2,4,6-tribromibentsyyli)-D-arabitoli	33	188
25	5-0-(2-fluoribentsyyli)ksylitoli	28	92
<u>Vertailuyhdiste</u>			
	2-bentsyylioksimetyylitetrahydrofuraani	28	135
30	(DE-hakemusjulkaisun 2 724 677 mukainen yhdiste)		
	Trijodibentsoehappo	69	73

Patenttivaatimukset

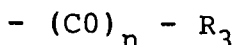
1. Pentitolien bentsyylieetterijohdannaiset,
t u n n e t t u siitä, että niiden yleinen kaava on



jossa yksi substituentaista Y on ryhmä



ja neljä muuta substituenttia Y ovat samoja tai erilaisia kaavan



mukaisia ryhmiä, jossa kaavassa R_1 on vety tai C_1 - C_4 -alkyyli, R_2 on mahdollisesti substituoitu aromaattinen hiilivetyryhmä, jonka substituentteina on yksi tai useampi C_1 - C_6 -alkyyli ja/tai C_1 - C_6 -alkoksi ja/tai mahdollisesti substituoitu fenoksi ja/tai mahdollisesti substituoitu fenyyli ja/tai halogeeni ja/tai nitro- ja/tai trifluorimetyyliryhmä, R_3 on vety tai mahdollisesti substituoitu C_1 - C_4 -alkyyli, ja n on 0 tai 1.

2. Patenttivaatimuksen 1 mukaiset pentitolien bentsyylieetterijohdannaiset, t u n n e t t u siitä, että R_1 on vety tai C_1 - C_4 -alkyyli, edullisesti metyyli, R_2 on fenyyli, 2-kloorifenyyli, 3-kloorifenyyli, 4-kloorifenyyli, 2,6-dikloorifenyyli, 2,4-dikloorifenyyli, 3,4-dikloorifenyyli, 2,4,6-trikloorifenyyli, 4-bromifenyyli, 2,4-dibromifenyyli, 2,6-dibromifenyyli, 2,4,6-tribromifenyyli, 2-fluorifenyyli, 3-fluorifenyyli, 4-fluorifenyyli, 2,4-difluorifenyyli, 2-metyylifenyyli, 3-metyylifenyyli, 4-metyylifenyyli, 3,4-dimetyylifenyyli, 2-metoksifenyyli, 3-metoksifenyyli, 4-metoksifenyyli, 3,4-dioksimetyleenifenyyli, 2-fenoksifenyyli, 3-

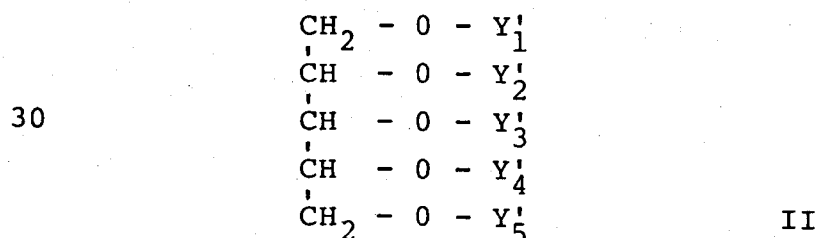
fenoksifenyyli, 2-nitrofenyyli tai 3-nitrofenyyli,
 R_3 on vety, C_1 - C_4 -alkyyli, edullisesti metyyli, etyyli,
 propyyli tai kloorimetyyli, ja n on 0 tai 1.

3. Patenttivaatimuksen 1 mukainen pentitolin
 5 bentsyylieetterijohdannainen, t u n n e t t u siitä,
 että se on
 5-0-(2,6-diklooribentsyyli)ksylitoli
 3-0-(2,6-diklooribentsyyli)-1,2,4,5-tetra-0-metyyli-
 adonitoli
 10 1-0-(2,6-diklooribentsyyli)-2,3,4,5-tetra-0-asetyyli-
 D-arabitoli
 5-0-(2,4-diklooribentsyyli)ksylitoli
 5-0-(2-klooribentsyyli)ksylitoli
 5-0-(2-metyylibentsyyli)ksylitoli
 15 1-0-(2,6-diklooribentsyyli)-1-arabitoli
 1-0-(2,6-diklooribentsyyli)-D-arabitoli
 3-0-(2,6-diklooribentsyyli)adonitoli
 5-0-(2,4,6-tribromibentsyyli)ksylitoli
 5-0-bentsyylikksylitoli
 20 5-0-(2,6-diklooribentsyyli)-1,2,3,4-tetra-0-asetyyli-
 ksylitoli
 5-0-(2,4,6-tribromibentsyyli)-1,2,3,4-tetra-0-asetyyli-
 ksylitoli
 3-0-(2,4,6-tribromibentsyyli)adonitoli
 25 5-0-(4-klooribentsyyli)ksylitoli
 5-0-(4-bromibentsyyli)ksylitoli
 5-0-(3,4-diklooribentsyyli)ksylitoli
 5-0-(3-metyylibentsyyli)ksylitoli
 5-0-(4-metyylibentsyyli)ksylitoli
 30 5-0-(3,4-dimetyylibentsyyli)ksylitoli
 5-0-(3-klooribentsyyli)ksylitoli
 5-0-4-syaanibentsyyli)ksylitoli
 3-0-(2,6-diklooribentsyyli)-1,2,4,5-tetra-0-asetyyli-
 adonitoli
 35 5-0-(3-trifluorimetyylibentsyyli)ksylitoli

- 5-0-(3-fluoribentsyyli)ksylitoli
 5-0-(4-fluoribentsyyli)ksylitoli
 1-0-(2,4,6-tribromibentsyyli)-D-arabitoli
 5-0-(2-fluoribentsyyli)ksylitoli
 5 5-0-(2,6-diklooribentsyyli)-1,2,3,4-tetra-0-metyyli-
 ksylitoli
 1-0-(2,6-diklooribentsyyli)-2,3,4,5-tetra-0-metyyli-L-
 arabitoli
 5-0-(2,4-diklooribentsyyli)-1,2,3,4-tetra-0-metyyli-
 10 ksylitoli
 1-0-(2,6-diklooribentsyyli)-2,3,4,5-tetra-0-metyyli-
 D-arabitoli
 5-0-(2,4,6-tribromibentsyyli)-1,2,3,4-tetra-0-metyyli-
 ksylitoli
 15 1-0-(2,4,6-tribromibentsyyli)-2,3,4,5-tetra-0-metyyli-
 D-arabitoli
 5-0-(2-kloori-6-fluoribentsyyli)ksylitoli
 1-0-(2-kloori-6-fluoribentsyyli)-D-arabitoli
 3-0-(2-kloori-6-fluoribentsyyli)adonitoli
 20 5-0-(2-kloori-6-fluoribentsyyli)-1,2,3,4-tetra-0-asetyy-
 liksylitoli
 5-0-(2-kloori-6-fluoribentsyyli)-1,2,3,4-tetra-0-metyy-
 liksylitoli.

4. Menetelmä patenttivaatimusten 1-3 mukaisten
 25 pentitolien bentsyylieetterijohdannaisten valmistamiseksi, t u n n e t t u siitä, että

A) yhdiste, jonka yleinen kaava on



jossa yksi substituentista Y' on ryhmä



ja neljä muuta substituenttia Y' ovat vetyjä, saatetaan reagoimaan

a) yhdisteen kanssa, jonka yleinen kaava on
 $R_3 - CO - X$ III

5 tai

b) yhdisteen kanssa, jonka yleinen kaava on
 $R_3 - Z$ IV

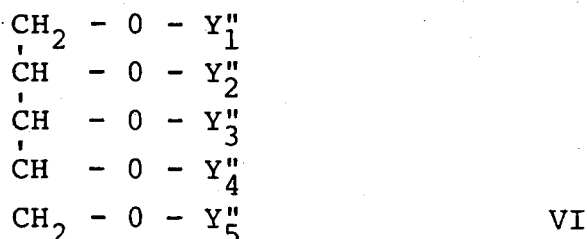
tai

c) yhdisteen kanssa, jonka yleinen kaava on
 $R_3 - CO - O - CO - R_3$ V

10

mahdollisesti happoa sitovan aineen ja/tai katalysaattorin läsnä ollessa, tai

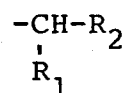
B) yhdiste, jonka yleinen kaava on



15

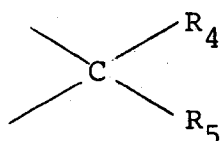
jossa yksi substitueista Y'' on ryhmä

20



ja neljä muuta substituenttia muodostavat pareittain mahdollisesti substituoidun metyleeniryhmän

25



hydrolysoidaan, mahdollisesti orgaanisen liuottimen ja happamen katalysaattorin läsnä ollessa 0-100°C:ssa, edullisesti 40-80°C:ssa, joissa kaavoissa R_1 , R_2 ja R_3 merkitsevät samaa kuin edellä ja R_4 ja R_5 ovat samoja tai erilaisia ja ovat kumpikin vety, C_1 - C_{10} -alkyyli, substituoitu C_1 - C_{10} -alkyyli, mahdollisesti substituoitu aryyli- C_1 - C_3 -alkyyli, C_3 - C_8 -sykloalifaattinen hiilivetyryhmä, yhdellä tai useammalla C_1 - C_6 -alkyyllillä ja/tai halogeenilla ja/tai C_1 - C_6 -alkoksilla ja/tai nitroryh-

35

mällä ja/tai trifluorimetyyliryhmällä substituoitu aro-
maattinen hiilivetyryhmä, tai R_4 ja R_5 muodostavat yh-
dessä polymetyleeniryhmän $-(CH_2)_m-$, X on halogeeni tai
 R_3OSO_2O- ja m on kokonaisluku 4 tai 5.

5 5. Valmiste, jolla on kasvien kasvunsäätövaiku-
tusta, t u n n e t t u siitä, että se sisältää ainakin
yhtä patenttivaatimusten 1-3 mukaista yhdistettä.

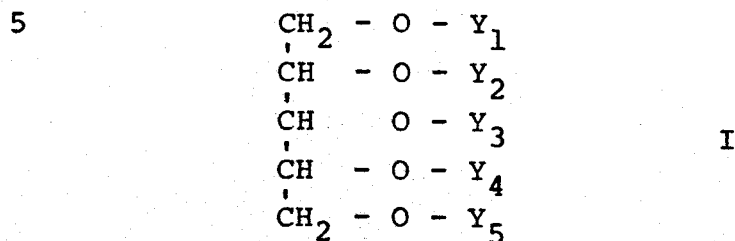
10 6. Patenttivaatimuksen 5 mukainen kasvien kasvun-
säätövaikutusta omaava valmiste, t u n n e t t u
siitä, että vaikuttava aine on seoksena kantaja- ja/tai
apuaaineiden kanssa.

15 7. Patenttivaatimusten 5 ja 6 mukaiset valmis-
teet, t u n n e t t u siitä, että ne vaikuttavat her-
nekasvien, varsinkin soijan vegetatiiviseen ja genera-
tiiviseen kasvuun.

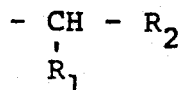
 8. Patenttivaatimuksen 7 mukaiset valmisteet
valmistettuina patenttivaatimuksen 4 mukaisella menetel-
mällä.

Patentkrav:

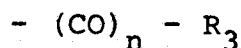
1. Bensyleterderivat av pentiter med den allmänna formeln



vari en av substituenterna Y betyder gruppen



och de fyra andra substituenterna är lika eller olika och i vart och ett fall betyder gruppen



vari R_1 betecknar väte eller en C_1 - C_4 -alkylrest, R_2 är en eventuellt en eller flera gånger med C_1 - C_6 -alkyl och/eller C_1 - C_6 -alkoxi och/eller eventuellt substituerad fenoxi och/eller eventuellt substituerad fenyl och/eller halogen och/eller nitrogruppen och/eller trifluormetylgruppen substituerad aromatisk kolväterest, R_3 är väte eller en eventuellt substituerad C_1 - C_4 -alkylrest och n betecknar 0 eller 1.

2. Bensyleterderivat av pentiter enligt patentkravet 1, k ä n n e t e c k n a d e därav, att R_1 är väte eller C_1 - C_4 -alkyl, företrädesvis metyl, R_2 är fenyl, 2-klorfenyl, 3-klorfenyl, 4-klorfenyl, 2,6-diklorfenyl, 2,4-diklorfenyl, 3,4-diklorfenyl, 2,4,6-triklorfenyl, 4-bromfenyl, 2,4-dibromfenyl, 2,6-dibromfenyl, 2,4,6-tribromfenyl, 2-fluorfenyl, 3-fluorfenyl, 4-fluorfenyl,

- 2,4-difluorfenyl, 2-metylfenyl, 3-metylfenyl, 4-metylfenyl, 3,4-dimetylfenyl, 2-metoxifenyl, 3-metoxifenyl, 4-metoxifenyl, 3,4-dioximetylenfenyl, 2-fenoxifenyl, 3-fenoxifenyl, 2-nitrofenyl eller 3-nitrofenyl, R_3 är
- 5 väte, C_1-C_4 -alkyl, företrädesvis metyl, etyl, propyl eller klormetyl och n är 0 eller 1.

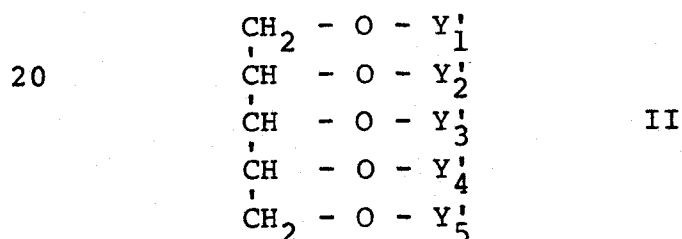
3. Bensyleterderivat av pentiter enligt patentkravet 1, k ä n n e t e c k n a t därav, att det består av

- 10 5-O-(2,6-diklorbensyl)-xylitol
 3-O-(2,6-diklorbensyl)-1,2,4,5-tetra-O-metyl-adonit
 1-O-(2,6-diklorbensyl)-2,3,4,5-tetra-O-acetyl-D-arabit
 5-O-(2,4-diklorbensyl)-xylitol
 5-O-(2-klorbensyl)-xylitol
- 15 5-O-(2-metylbensyl)-xylitol
 1-O-(2,6-diklorbenyl)-L-arabit
 1-O-(2,6-diklorbensyl)-D-arabit
 3-O-(2,6-diklorbensyl)-adonit
 5-O-(2,4,6-tribrombensyl)-xylitol
- 20 5-O-bensyl-xylit
 5-O-(2,6-diklorbensyl)-1,2,3,4-tetra-O-acetyl-xylitol
 5-O-(2,4,6-tribrombensyl)-1,2,3,4-tetra-O-actyl-xylitol
 3-O-(2,4,6-tribrombensyl)-adonit
 5-O-(4-klorbensyl)-adonit
- 25 5-O-(4-brombensyl)-xylitol
 5-O-(3,4-diklorbensyl)-xylitol
 5-O-(3-metylbensyl)-xylitol
 5-O-(4-metylbensyl)-xylitol
 5-O-(3,4-dimetylbensyl)-xylitol
- 30 5-O-(3-klorbensyl)-xylitol
 5-O-(4-cyanbensyl)-xylitol
 3-O-(2,6-diklorbensyl)-1,2,4,5-tetra-O-acetyl-adonit
 5-O-(3-trifluormetylbensyl)-xylitol
 5-O-(3-fluorbensyl)-xylitol
- 35 5-O-(4-fluorbensyl)-xylitol

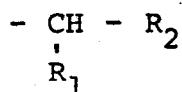
- 1-O-(2,4,6-tribrombensyl)-D-arabit
 5-O-(2-fluorbensyl)-xylitol
 5-O-(2,6-diklorbensyl)-1,2,3,4-tetra-O-metyl-xylitol
 1-O-(2,6-diklorbensyl)-2,3,4,5-tetra-O-metyl-L-arabit
 5 5-O-(2,4-diklorbensyl)-1,2,3,4-tetra-O-metyl-xylitol
 1-O-(2,6-diklorbensyl)-2,3,4,5-tetra-O-metyl-D-arabit
 5-O-(2,4,6-tribrombensyl)-1,2,3,4-tetra-O-metyl-xylitol
 1-O-(2,4,6-tribrombensyl)-2,3,4,5-tetra-O-metyl-D-arabit
 5-O-(2-klor-6-fluorbensyl)-xylitol
 10 1-O-(2-klor-6-fluorbensyl)-D-arabit
 3-O-(2-klor-6-fluorbensyl)-adonit
 5-O-(2-klor-6-fluorbensyl)-1,2,3,4-tetra-O-acetyl-xylitol
 5-O-(2-klor-6-fluorbensyl)-1,2,3,4-tetra-O-metyl-xylitol.

4. Förfarande för framställning av bensyleterder-
 15 rivat av pentiter enligt patentkraven 1-3, k ä n n e -
 t e c k n a t därav, att man

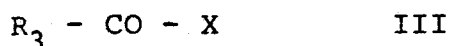
A) reagerar föreningar med den allmänna formeln



- 25 vari en av substituenterna Y' betyder gruppen



- 30 och de fyra andra substituenterna Y' betyder väte,
 a) med föreningar med den allmänna formeln



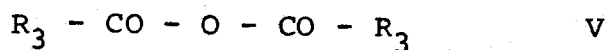
- 35 eller

b) med föreningar med den allmänna formeln



5 eller

c) med föreningar med den allmänna formeln

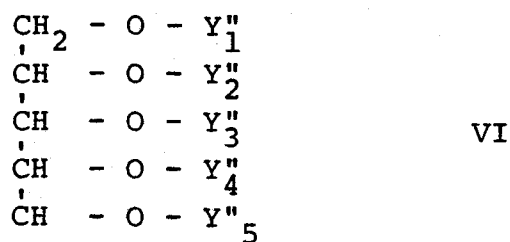


10

eventuellt i närvaro av syrabindande medel och/eller en katalysator, eller

B) hydrolyserar föreningar med den allmänna formeln

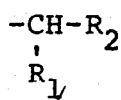
15



20

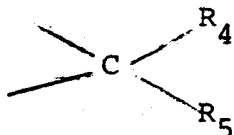
vari en av substituenterna U'' betyder gruppen

25



och de andra fyra substituenterna i vart och ett fall parvis betyder en eventuellt substituerad metylengrupp

30



eventuellt i närvaro av organiska lösningsmedel samt sura katalysatorer vid temperaturer av 0-100°C, företrädesvis av 40-80°C, varvid R_1 , R_2 och R_3 har ovan angivna betydelse
35 och R_4 och R_5 antingen är lika eller olika och står för

väte, en C_1-C_{10} -alkylrest, en substituerad C_1-C_{10} -alkylrest, en eventuellt substituerad aryl- C_1-C_3 -alkylrest, en cykloalifatisk C_3-C_8 -kolväterest, en eller flera gånger med C_1-C_6 -alkyl och/eller halogen och/eller C_1-C_6 -alkoxi och/eller nitrogruppen och/eller trifluormetylgruppen substituerad aromatisk kolväterest eller R_4 och R_5 bildar tillsammans en polymetylengrupp $-(CH_2)_m-$, X är en halogenatom, företrädesvis en kloratom, och Z är en halogenatom eller resten R_3OSO_2O- och m är heltalen 4 och 5.

5. Medel med tillväxtreglerande aktivitet för växter, k ä n n e t e c k n a t därav, att det innehåller åtminstone en förening enligt patentkraven 1-3.

6. Medel med tillväxtreglerande aktivitet för växter enligt patentkravet 5, k ä n n e t e c k n a t därav, att det föreligger i blandning med bärar- och/eller hjälpämnen.

7. Medel enligt patentkraven 5 och 6 för påverkan av den vegetativa och generativa tillväxten hos leguminösa växter, isynnerhet soja.

8. Medel med tillväxtreglerande aktivitet för växter enligt patentkravet 7, k ä n n e t e c k n a t därav, att det framställts medelst förfarandet enligt patentkravet 4.