

PATENTOVÝ SPIS

(11) Číslo dokumentu:

295 148

(19)
ČESKÁ
REPUBLIKA



ÚŘAD
PRŮMYSLOVÉHO
VLASTNICTVÍ

(21) Číslo přihlášky: **1998-3891**
 (22) Přihlášeno: **06.05.1997**
 (30) Právo přednosti: **29.05.1996 DE 1996/19621522**
 (40) Zveřejněno: **14.04.1999**
 (**Věstník č. 04/1999**)
 (47) Uděleno: **06.04.05**
 (24) Oznámení o udělení ve Věstníku: **15.06.2005**
 (**Věstník č. 6/2005**)
 (86) PCT číslo: **PCT/EP1997/002305**
 (87) PCT číslo zveřejnění: **WO 1997/045016**

(13) Druh dokumentu: **B6**

(51) Int. Cl. :⁷

A 01 N 41/06 C 07 D 333/38
A 01 N 43/08 C 07 D 307/68
A 01 N 43/10
A 01 N 43/36
C 07 C 311/51
C 07 C 323/62
C 07 C 333/08
C 07 D 207/26

(73) Majitel patentu:

HOECHST SCHERING AGREVO GMBH, Berlin, DE

(72) Původce:

Ziemer Frank, Kriftel, DE
Haaf Klaus, Kelkheim, DE
Willms Lothar, Hofheim, DE
Bauer Klaus, Hanau, DE
Bieringer Hermann, Eppstein, DE
Rosinger Christopher, Hofheim, DE

(74) Zástupce:

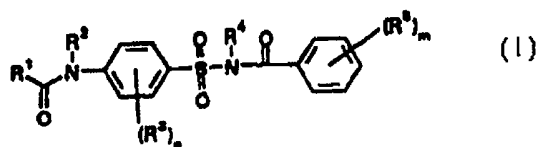
JUDr. Miloš Všečeka, Hálkova 2, Praha 2, 12000

(54) Název vynálezu:

N-Acylsulfonamidy a jejich použití pro ochranu kulturních rostlin

(57) Anotace:

Použití sloučenin obecného vzorce I jako safenerů pro ochranu kulturních rostlin před fytotoxickými vedlejšími účinky pesticidů. Dále jsou popsány nové sloučeniny obecného vzorce I, vyjma konkrétních sloučenin obecného vzorce I.



CZ 295148 B6

N-Acylsulfonamidy a jejich použití pro ochranu kulturních rostlin

Oblast techniky

Vynález se týká technické oblasti prostředků pro ochranu rostlin, konkrétně použití safenerů proti fytotoxickým vedlejším účinkům pesticidů, obzvláště herbicidů, u kulturních rostlin. Obzvláště se týká použití kombinací účinná látka–antidotum (=účinná látka–safener), které jsou obzvláště vhodné proti konkurujícím škodlivým rostlinám v kulturách užitkových rostlin.

Dosavadní stav techniky

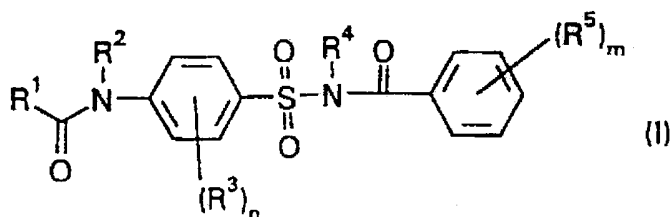
Při použití prostředků pro ošetření rostlin, obzvláště herbicidů proti škodlivým rostlinám v kulturách rostlin, se mohou vyskytovat nežádoucí poškození kulturních rostlin. Obzvláště když nejsou herbicidy pro kulturní rostliny úplně přijatelné (selektivní), dají se tyto herbicidy použít pouze omezeně. Nemohou proto být používány v mnohých kulturách vůbec, nebo pouze v tak malých aplikačních množstvích, že není zajištěn požadovaný herbicidní účinek vůči škodlivým rostlinám. Speciálně se nemůže použít mnoho herbicidů z řady sulfonylmočoviny dostatečně selektivně proti škodlivým rostlinám v kukuřici, rýži a obilí. Je proto žádoucí fytotoxicitu herbicidů na kulturních rostlinách pokud možno vyloučit nebo snížit. Sloučeniny, které jsou vhodné k redukci fytotoxických vedlejších účinků herbicidů na kulturních rostlinách se nazývají safenery nebo antidota.

Z US 3 498 780 jsou známy 1,4-substituované arylsulfonamidy a jejich herbicidní účinek při postupu před vzejitím. US 4 266 078 popisuje použití N-acylsulfonamidů jako safenerů pro thio-karbamátové a halogenacetanilidové herbicidy, používané při postupu před vzejitím; použití jako safeneru pro herbicidy, účinné při postupu po vzejití, nejsou z tohoto spisu známy. V US 4 434 000 jsou popsány N-benzensulfonylkarbamáty jako safenery pro močovinné herbicidy. Z EP-A 365 484, EP-A 597 807 a EP-A 600 836 jsou známy N-acylsulfamoylfenylmočoviny a jejich použití jako safenerů pro diverzní třídy herbicidů.

Podstata vynálezu

Zcela neočekávaně nové experimentální práce nyní ukázaly, že N-(acylsulfamoylfenyl)alkan-amidy jsou výborně vhodné k tomu zřetelně snížit nebo zcela potlačit fytotoxické vedlejší účinky pesticidů, například herbicidů, používaných při postupu po vzejití, například sulfonylmočoviny nebo imidazolinonů, působících jako inhibitory acetolaktátsyntetázy (ALS-inhibitory), nebo inhibitorů biosyntézy mastných kyselin, jako jsou deriváty (hetero)aryloxyfenoxycarboxylových kyselin, na kulturní rostliny, jako je kukuřice, rýže a obilí.

Předmětem předloženého vynálezu tedy je použití sloučenin obecného vzorce I



ve kterém

- 5 R^1 značí vodíkový atom, uhlovodíkový zbytek s až 12 uhlíkovými atomy, uhlovodíkoxyzbytek s až 8 uhlíkovými atomy nebo uhlovodíktiozbytek s až 8 uhlíkovými atomy, přičemž každý z posledně jmenovaných tří zbytků je nesubstituovaný nebo substituovaný jedním nebo více stejnými nebo různými zbytky ze skupiny zahrnující atom halogenu, kyanoskupinu, nitroskupinu, aminoskupinu, hydroxyskupinu, karboxyskupinu, formylovou skupinu, karbonamidovou skupinu, sulfonamidovou skupinu a zbytky vzorce $-Z^a-R^a$,
- R^2 značí vodíkový atom nebo alkylovou skupinu s 1 až 4 uhlíkovými atomy, nebo
- 10 R^1 a R^2 společně se skupinou vzorce $-\text{CO}-\text{N}-$ značí zbytek tříčlenného až osmičlenného nasyceného nebo nenasyčeného kruhu,
- 15 R^3 značí v případě, že $n = 1$, nebo nezávisle na sobě, když n je větší než 1, atom halogenu, kyanoskupinu, nitroskupinu, aminoskupinu, hydroxyskupinu, karboxyskupinu formylovou skupinu, skupinu CONH_2 , skupinu SO_2NH_2 nebo zbytek $-Z^b-R^b$,
- R^4 značí vodíkový atom nebo alkylovou skupinu s 1 až 4 uhlíkovými atomy,
- 20 R^5 značí v případě, že $n = 1$, nebo nezávisle na sobě, když m je větší než 1, atom halogenu, kyanoskupinu, nitroskupinu, aminoskupinu, hydroxyskupinu, karboxyskupinu, skupinu CHO , skupinu CONH_2 , skupinu SO_2NH_2 nebo zbytek $-Z^c-R^c$,
- 25 R^a značí uhlovodíkový zbytek nebo heterocyklylový zbytek, přičemž každý z obou zbytků může být nesubstituovaný nebo substituovaný jedním nebo více stejnými nebo různými substituenty ze skupiny zahrnující atom halogenu, kyanoskupinu, nitroskupinu, aminoskupinu, hydroxyskupinu, alkylaminoskupinu a dialkylaminoskupinu s 1 až 4 uhlíkovými atomy v každém alkylu, nebo značí alkylový zbytek, ve kterém je více nesousedících methylenových skupin nahrazeno kyslíkovým atomem,
- 30 R^b a R^c značí nezávisle na sobě uhlovodíkový zbytek nebo heterocyklylový zbytek, přičemž každý z obou zbytků může být nesubstituovaný nebo substituovaný jedním nebo více stejnými nebo různými substituenty ze skupiny zahrnující atom halogenu, kyanoskupinu, nitroskupinu, aminoskupinu, hydroxyskupinu, fosforylovou skupinu, halogenalkoxyskupinu s 1 až 4 uhlíkovými atomy, alkylaminoskupinu a dialkylaminoskupinu s 1 až 4 uhlíkovými atomy v každém alkylu, nebo značí alkylový zbytek, ve kterém je více nesousedících methylenových skupin nahrazeno kyslíkovým atomem,
- 35 Z^a značí divalentní skupinu vzorce $-\text{O}-$, $-\text{S}-$, $-\text{CO}-$, $-\text{CS}-$, $-\text{CO}-\text{O}-$, $-\text{CO}-\text{S}-$, $-\text{O}-\text{CO}-$, $-\text{S}-\text{CO}-$, $-\text{SO}-$, $-\text{SO}_2-$, $-\text{NR}^*-$, $-\text{CO}-\text{NR}^*-$, $-\text{NR}^*-\text{CO}-$, $-\text{SO}_2-\text{NR}^*-$ nebo $-\text{NR}^*-\text{SO}_2-$, přičemž vpravo uváděná vazba odpovídající divalentní skupiny je vazba ke zbytku R^a a přičemž R^* v posledně jmenovaných pěti zbytcích značí nezávisle na sobě vodíkový atom, alkylovou skupinu s 1 až 4 uhlíkovými atomy nebo halogenalkylovou skupinu s 1 až 4 uhlíkovými atomy,
- 40 Z^b a Z^c značí nezávisle na sobě přímou vazbu nebo divalentní skupinu vzorce $-\text{O}-$, $-\text{S}-$, $-\text{CO}-$, $-\text{CS}-$, $-\text{CO}-\text{O}-$, $-\text{CO}-\text{S}-$, $-\text{O}-\text{CO}-$, $-\text{S}-\text{CO}-$, $-\text{SO}-$, $-\text{SO}_2-$, $-\text{NR}^*-$, $-\text{CO}-\text{NR}^*-$, $-\text{NR}^*-\text{CO}-$, $-\text{SO}_2-\text{NR}^*-$ nebo $-\text{NR}^*-\text{SO}_2-$, přičemž vpravo uváděná vazba odpovídající divalentní skupiny je vazba ke zbytku R^b , popřípadě R^c a přičemž R^* v posledně jmenovaných pěti zbytcích značí nezávisle na sobě vodíkový atom, alkylovou skupinu s 1 až 4 uhlíkovými atomy nebo
- 45 halogenalkylovou skupinu s 1 až 4 uhlíkovými atomy,
- 50 n značí celé číslo 0 až 4 a
- m značí celé číslo 0 až 5,
- 55

nebo jejich soli jako safenerů pro ochranu kulturních rostlin před fyto toxickými vedlejšími účinky pesticidů.

Alkylová skupina, alkoxy skupina, halogenalkylová skupina, halogenalkoxy skupina, alkylamino skupina a alkylthio skupina, jakož i odpovídající nenasycené a/nebo substituované skupiny v uhlíkové kostře, uváděné v obecném vzorci I a v dále používaných obecných vzorcích, mohou být vždy lineární nebo rozvětvené. Když není speciálně udáno, jsou u těchto zbytků výhodné nižší uhlíkové struktury, například s 1 až 4 uhlíkovými atomy, popřípadě u nenasycených skupin se 2 až 4 uhlíkovými atomy. Alkylové zbytky, také ve složených významech, jako je například alkoxy skupina, halogenalkylová skupina a podobně, značí například methylovou skupinu, ethylovou skupinu, n-propylovou skupinu, i-propylovou skupinu, n-butylovou skupinu, i-butylovou skupinu, t-butylovou skupinu, 2-butylovou skupinu, pentylové skupiny, hexylové skupiny, jako je n-hexylová skupina, i-hexylová skupina a 1,3-dimethylbutylová skupina a heptylové skupiny, jako je n-heptylová skupina, 1-methylhexylová skupina a 1,4-dimethylpentylová skupina; cykloalkylová skupina značí karbocyklický nasycený kruhový systém, například se 3 až 8 uhlíkovými atomy, například cyklopropylovou, cyklobutylovou, cyklopentylovou, cyklohexylovou skupinu a podobně; alkenylové, alkinylové a cykloalkenylové skupiny mají význam k alkylům a cykloalkylům odpovídajících možných nenasycených zbytků; alkenyl značí například allyl, 1-methylprop-2-en-1-yl, 2-methylprop-2-en-1-yl, but-2-en-1-yl, but-3-en-1-yl, 1-methylbut-3-en-1-yl a 1-methylbut-2-en-1-yl; alkynyl značí například propargylovou skupinu, but-2-in-1-yl, but-3-in-1-yl a 1-methylbut-3-in-1-yl a cykloalkenyl je například cyklopentenyl nebo cyklohexenyl. Alkenylová skupina ve formě „(C₃-C₄)-alkenyl“ nebo „(C₃-C₆)-alkenyl“ značí výhodně alkenylový zbytek se 3 až 4, popřípadě se 3 až 6 uhlíkovými atomy, u kterého dvojná vazba není na uhlíkovém atomu, který je spojen s ostatní částí molekuly sloučeniny obecného vzorce I („yl“-poloha). Odpovídající platí pro (C₃-C₄)-alkynyl a podobně.

Halogen značí například fluor, chlor, brom nebo jod. Halogenalkylová, halogenalkenylová a halogenalkinylová skupina značí halogenem, výhodně fluorem, chlorem a/nebo bromem, obzvláště fluorem nebo chlorem, částečně nebo úplně substituovanou alkylovou, alkenylovou, popřípadě alkinylovou skupinu, jako je například -CF₃, -CHF₂, -CH₂F, -CF₂CF₃, -CH₂FCHCl₂, -CCl₃, -CHCl₂, -CH₂CH₂Cl; halogenalkoxy skupina je například -OCF₃, -OCHF₂, -OCH₂F, -OCF₂CF₃, -OCH₂CF₃ a -OCH₂CH₂Cl. Odpovídající platí pro halogenalkenylové skupiny a jiné halogeny substituované zbytky.

Uhlovodíkový zbytek je přímý, rozvětvený nebo cyklický a nasycený nebo nenasycený, alifatický nebo aromatický uhlovodíkový zbytek, například alkylová, alkenylová, alkinylová, cykloalkylová, cykloalkenylová nebo arylová skupina, výhodně alkylová, alkenylová nebo alkinylová skupina s až 12 uhlíkovými atomy, cykloalkylová skupina se 3 až 6 atomy v kruhu nebo fenylová skupina. Odpovídající platí pro uhlovodíkoxy skupinu a uhlovodíkthio skupinu.

Arylová skupina značí monocyklický, bicyklický nebo polycyklický aromatický systém, například fenylovou skupinu, naftylovou skupinu, tetrahydronaftylovou skupinu, indenylovou skupinu, indanylovou skupinu, pentalenylovou skupinu, fluorenylovou skupinu a podobně, výhodně fenylovou skupinu; aryloxy skupina značí výhodně oxyzbytek, odpovídající uvedené arylové skupině, obzvláště fenoxyskupinu.

Heteroarylový nebo heteroaromatický zbytek značí monocyklický, bicyklický nebo polycyklický aromatický systém, ve kterém alespoň jeden kruh obsahuje jeden nebo více heteroatomů, jako je například pyridylová, pyrimidinylová, pyridazinylová, pyrazinylová, thienylová, thiazolylová, oxazolylová, furylová, pyrrolylová, pyrazolylová a imidazolylová skupina. V případě substituce jsou zde zahrnuty také obzvláště bicyklickými nebo polycyklickými aromatickými nebo cykloalifatickými kruhy anelované sloučeniny, například chinolinylová skupina, benzoxazolylová skupina a podobně. Heteroarylový zbytek zahrnuje také heteroaromatický kruh, který je výhodně pětičlenný nebo šestičlenný a obsahuje 1, 2 nebo 3 heteroatomy, obzvláště ze skupiny, zahrnující

dusík, kyslík a síru. V substituovaném případě může být heteroaromatický kruh také benzo-kondenzovaný.

Heterocyklický zbytek (heterocyklyl) nebo kruh (heterocyklus) může být nasycený, nenasycený nebo heteroaromatický; obsahuje výhodně jeden nebo více heteroatomů v kruhu, výhodně ze skupiny, zahrnující dusík, kyslík a síru; výhodně je to alifatický heterocyklylový zbytek 3 až 7 atomů v kruhu a s až 3 heteroatomy v kruhu, nebo heteroaromatický zbytek s 5 nebo 6 atomy v kruhu a obsahuje 1, 2 nebo 3 heteroatomy. Zbytek může být například výše definovaný heteroaromatický zbytek nebo kruh, nebo je to parciálně hydrogenovaný zbytek, jako je oxiranylová skupina, pyrrolidylová skupina, piperidylová skupina, piperazinylová skupina, dioxolanylová skupina, morfolinylová skupina a tetrahydrofurylová skupina. Jako substituenty pro substituovaný heterocyklický zbytek přicházejí v úvahu dále uváděné substituenty a dodatečně také oxoskupina. Oxoskupina se může také vyskytovat na heteroatomech kruhu, které mohou existovat v různých oxidačních stupních, například u dusíku a síry.

Když jsou substituce definované jako „jedním nebo více zbytky ze skupiny zahrnující“, zahrnuje toto jak substituci jedním nebo více stejnými zbytky, tak také jednoduchou nebo vícenásobnou substituci různými zbytky.

Substituované zbytky, jako jsou substituované uhlovodíkové zbytky, například substituovaná alkylová skupina, alkenylová skupina, alkinylová skupina, arylová skupina, fenylová skupina nebo benzylová skupina, nebo substituovaná heterocyklylová skupina, značí například substituované zbytky, odvozené od nesubstituovaného základního skeletu, přičemž substituenty mohou být například jeden nebo více, výhodně 1, 2 nebo 3 zbytky, ze skupiny zahrnující atom halogenu, alkoxykupinu, halogenalkoxykupinu, alkythioskupinu, hydroxykupinu, aminoskupinu, nitroskupinu, kyanoskupinu, azidovou skupinu, alkoxykarbonylovou skupinu, alkylkarbonylovou skupinu, formylovou skupinu, karbamoylovou skupinu, monoalkylaminokarbonylovou skupinu, dialkylaminokarbonylovou skupinu, substituovanou aminoskupinu, jako je acylaminoskupina, alkylaminoskupina a dialkylaminoskupina, alkylsulfinylovou skupinu, halogenalkylsulfinylovou skupinu, alkylsulfonylovou skupinu, halogenalkylsulfonylovou skupinu a v případě cyklických zbytků také alkylovou a halogenalkylovou skupinu, jakož i uvedeným nasyceným uhlovodíky obsahujícím nasyceným zbytkům odpovídající nenasyčené alifatické zbytky, jako je alkenylová skupina, alkinylová skupina, alkenyloxyskupina, alkinyloxyskupina a podobně. U zbytků s uhlíkovými atomy jsou výhodné zbytky s 1 až 4 uhlíkovými atomy, obzvláště s 1 nebo 2 uhlíkovými atomy. Výhodné jsou při tom zpravidla substituenty ze skupiny zahrnující halogeny, například fluor a chlor, alkylovou skupinu s 1 až 4 uhlíkovými atomy, především metylovou a ethylovou skupinu, halogenalkylovou skupinu s 1 až 4 uhlíkovými atomy, především trifluor-metylovou skupinu, alkoxykupinu s 1 až 4 uhlíkovými atomy, především methoxykupinu nebo ethoxykupinu, halogenalkoxykupinu s 1 až 4 uhlíkovými atomy, nitroskupinu a kyanoskupinu. Obzvláště výhodné jsou při tom jako substituenty metylová skupina, methoxykupina a atom chloru. Popřípadě substituovaná fenylová skupina je výhodně fenylová skupina, která je nesubstituovaná nebo jednou nebo vícekrát, výhodně až třikrát substituovaná stejnými nebo různými zbytky ze skupiny zahrnující atom halogenu, alkylovou skupinu s 1 až 4 uhlíkovými atomy, alkoxykupinu s 1 až 4 uhlíkovými atomy, halogenalkylovou skupinu s 1 až 4 uhlíkovými atomy, halogenalkoxykupinu s 1 až 4 uhlíkovými atomy a nitroskupinu, například o-, m- a p-tolylová skupina, dimethylfenylové skupiny, 2-, 3- a 4-chlorfenylová skupina, 2-, 3- a 4-trifluorfenylová a -trichlorfenylová skupina, 2,4-, 3,5-, 2,5- a 2,3-dichlorfenylová skupina a o-, m- a p-methoxyfenylová skupina.

Monosubstituovaná nebo disubstituovaná aminoskupina značí chemicky stabilní zbytek ze skupiny zahrnující substituované aminoskupiny, které jsou N-substituované jedním, popřípadě dvěma stejnými nebo různými zbytky ze skupiny zahrnující alkylovou skupinu, alkoxykupinu, acylovou skupinu a arylovou skupinu; výhodně značí monoalkylaminoskupinu, dialkylaminoskupinu, acylaminoskupinu, arylaminoskupinu, N-alkyl-N-arylamino skupinu, jakož i N-heterocyklen; při tom jsou výhodné alkylové zbytky s 1 až 4 uhlíkovými atomy; arylová skupina je při tom

výhodně fenylová skupina nebo substituovaná fenylová skupina; pro acylovou skupinu platí dále uvedená definice, výhodná je alkanoylová skupina s 1 až 4 uhlíkovými atomy. Totéž platí pro hydroxylaminoskupinu a hydrazinoskupinu.

- 5 Předmětem předloženého vynálezu jsou také všechny stereoizomery, které jsou zahrnuty v obecném vzorci I a jejich směsi. Takové sloučeniny obecného vzorce I obsahují jeden nebo více asymetrických uhlíkových atomů nebo také dvojných vazeb, které nejsou v obecném vzorci I zvláště uváděny. Možné stereoizomery, definované svojí specifickou prostorovou formou, jako jsou enantiomery, diastereomery a Z- a E-izomery, jsou všechny zahrnuté v obecném vzorci I
10 a mohou se získat pomocí obvyklých metod ze směsí stereoizomerů nebo se mohou vyrobit také pomocí stereoselektivních reakcí v kombinaci s použitím stereochemicky čistých výchozích látek.

- Sloučeniny obecného vzorce I mohou tvořit soli, u kterých je vodíkový atom skupiny $-\text{SO}_2-\text{NH}$,
15 to znamená v případě, že $\text{R}^4 = \text{H}$, nebo také jiné kyselé vodíkové atomy (například z COOH a podobně), nahrazené kationtem, vhodným pro zemědělství. Tyto soli jsou například kovové soli, výhodně soli s alkalickými kovy nebo s kovy alkalických zemin, obzvláště sodné a draselné soli, nebo také soli amonné nebo soli s organickými aminy. Rovněž může tvorba solí probíhat navázáním kyseliny na bazické skupiny, jako je například aminoskupina a alkylaminoskupina.
20 Vhodnými kyselinami jsou pro to silné anorganické a organické kyseliny, například kyselina chlorovodíková, kyselina bromovodíková, kyselina sírová nebo kyselina dusičná.

- Z hlediska vyššího ochranného účinku a/nebo lepší vyrobitelnosti jsou zvláště zajímavé sloučeniny podle předloženého vynálezu a jejich soli obecného vzorce I, ve kterém
25

- R^1 značí vodíkový atom, alkylovou skupinu s 1 až 12 uhlíkovými atomy, alkenylovou skupinu se 2 až 8 uhlíkovými atomy, alkinylovou skupinu se 2 až 8 uhlíkovými atomy, cykloalkylovou skupinu se 3 až 8 uhlíkovými atomy, cykloalkenylovou skupinu se 3 až 8 uhlíkovými atomy, alkoxykupinu s 1 až 8 uhlíkovými atomy, alkenyloxykupinu se 2 až 8 uhlíkovými atomy, alkinyloxykupinu se 2 až 8 uhlíkovými atomy, cykloalkoxykupinu se 3 až 8 uhlíkovými atomy, cykloalkenyloxykupinu se 3 až 8 uhlíkovými atomy, alkylthioskupinu s 1 až 8 uhlíkovými atomy, alkenylthioskupinu se 2 až 8 uhlíkovými atomy, alkynylthioskupinu se 2 až 8 uhlíkovými atomy, cykloalkylthioskupinu se 3 až 8 uhlíkovými atomy, cykloalkenylthioskupinu se 3 až 8 uhlíkovými atomy, arylovou skupinu nebo heterocyklylovou skupinu se 3 až 8 atomy v kruhu a 1 až 3 heteroatomy kruhu ze skupiny zahrnující dusík, kyslík a síru, přičemž každý ze 17 posledně jmenovaných zbytků je nesubstituovaný nebo substituovaný jedním nebo více stejnými nebo různými zbytky ze skupiny zahrnující atom halogenu, kyanoskupinu, nitroskupinu, aminoskupinu, hydroxyskupinu, karboxyskupinu, formylovou skupinu, karbonamidovou skupinu, sulfonamidovou skupinu a zbytky vzorce $-\text{Z}^a\text{R}^a$,
40

- R^2 značí vodíkový atom nebo alkylovou skupinu s 1 až 4 uhlíkovými atomy, výhodně vodíkový atom, nebo

- 45 R^1 a R^2 značí společně se skupinou vzorce $-\text{CO}-\text{N}-$ zbytek tříčlenného až osmičlenného, nasyceného nebo nenasyčeného heterocyklického kruhu, který vedle dusíkového atomu skupiny vzorce $-\text{CO}-\text{N}-$ může obsahovat ještě jeden nebo dva heteroatomy ze skupiny zahrnující dusík, kyslík a síru,

- 50 R^3 značí v případě, že $n = 1$, nebo nezávisle na sobě, když n je větší než 1, atom halogenu, kyanoskupinu, nitroskupinu, aminoskupinu, hydroxyskupinu, fosforylovou skupinu, karboxyskupinu, formylovou skupinu, skupinu CONH_2 , skupinu SO_2NH_2 nebo zbytek $-\text{Z}^b-\text{R}^b$,

- R^4 značí vodíkový atom nebo alkylovou skupinu s 1 až 4 uhlíkovými atomy, výhodně vodíkový atom,
- 5 R^5 značí v případě, že $m = 1$, nebo nezávisle na sobě, když m je větší než 1, atom halogenu, kyanoskupinu, nitroskupinu, aminoskupinu, hydroxyskupinu, karboxyskupinu, fosforylovou skupinu, skupinu CHO, skupinu CONH₂, skupinu SO₂NH₂ nebo zbytek $-Z^c-R^c$,
- 10 R^a značí alkylovou skupinu s 1 až 8 uhlíkovými atomy, cykloalkylovou skupinu se 3 až 6 uhlíkovými atomy, alkenylovou skupinu se 2 až 8 uhlíkovými atomy, cykloalkenylovou skupinu se 3 až 6 uhlíkovými atomy, alkinylovou skupinu se 2 až 8 uhlíkovými atomy, fenylovou skupinu nebo heterocyklylový zbytek se 3 až 6 atomy kruhu a s 1 až 3 heteroatomy kruhu ze skupiny zahrnující dusík, kyslík a síru, přičemž každý ze 7 posledně jmenovaných zbytků může být nesubstituovaný nebo substituovaný jedním nebo více stejnými nebo různými substituenty ze skupiny zahrnující atom halogenu, kyanoskupinu, nitroskupinu, amino-
- 15 skupinu, hydroxyskupinu, alkylaminoskupinu a dialkylaminoskupinu s 1 až 4 uhlíkovými atomy v každém alkylu, nebo značí alkylový zbytek, ve kterém je několik, výhodně 2 nebo 3, nesousedících methylenových skupin, nahrazeno kyslíkovým atomem,
- 20 R^b a R^c značí nezávisle na sobě alkylovou skupinu s 1 až 8 uhlíkovými atomy, cykloalkylovou skupinu se 3 až 6 uhlíkovými atomy, alkenylovou skupinu se 2 až 8 uhlíkovými atomy, cykloalkenylovou skupinu se 3 až 6 uhlíkovými atomy, alkinylovou skupinu se 2 až 8 uhlíkovými atomy, fenylovou skupinu nebo heterocyklylový zbytek se 3 až 6 atomy kruhu a s 1 až 3 heteroatomy kruhu ze skupiny zahrnující dusík, kyslík a síru, přičemž každý ze
- 25 7 posledně jmenovaných zbytků může být nesubstituovaný nebo substituovaný jedním nebo více stejnými nebo různými substituenty ze skupiny zahrnující atom halogenu, kyano-
- 30 skupinu, nitroskupinu, aminoskupinu, hydroxyskupinu, fosforylovou skupinu, halogenalkoxyskupinu s 1 až 4 uhlíkovými atomy, alkylaminoskupinu a dialkylaminoskupinu s 1 až 4 uhlíkovými atomy v každém alkylu, nebo značí alkylový zbytek, ve kterém je několik, výhodně 2 nebo 3, nesousedících methylenových skupin, nahrazeno kyslíkovým atomem,
- 35 Z^a značí divalentní skupinu vzorce $-O-$, $-S-$, $-CO-$, $-CS-$, $-CO-O-$, $-CO-S-$, $-O-CO-$, $-S-CO-$, $-SO-$, $-SO_2-$, $-NR^*-$, $-CO-NR^*-$ nebo $-NR^*-CO-$, přičemž vpravo uváděná vazba odpovídající divalentní skupiny je vazba ke zbytku R^a a přičemž R^* v posledně jmenovaných zbytcích značí nezávisle na sobě vodíkový atom, alkylovou skupinu s 1 až 4 uhlíkovými atomy nebo halogenalkylovou skupinu s 1 až 4 uhlíkovými atomy,
- 40 Z^b a Z^c značí nezávisle na sobě přímou nebo vazbu nebo divalentní skupinu vzorce $-O-$, $-S-$, $-CO-$, $-CS-$, $-CO-O-$, $-CO-S-$, $-O-CO-$, $-S-CO-$, $-SO-$, $-SO_2-$, $-NR^*-$, $-CO-NR^*-$, $-NR^*-CO-$, $-SO_2-NR^*-$ nebo $-NR^*-SO_2-$, přičemž vpravo uváděná vazba odpovídající divalentní skupiny je vazba ke zbytku R^b , popřípadě R^c a přičemž R^* v posledně jmenovaných pěti zbytcích značí nezávisle na sobě vodíkový atom, alkylovou skupinu s 1 až 4 uhlíkovými atomy nebo halogenalkylovou skupinu s 1 až 4 uhlíkovými atomy.
- 45 Obzvláště významné jsou safenery obecného vzorce I podle předloženého vynálezu nebo jejich soli, přičemž
- 50 R^1 značí vodíkový atom, alkylovou skupinu s 1 až 12 uhlíkovými atomy, alkenylovou skupinu se 2 až 8 uhlíkovými atomy, alkinylovou skupinu se 2 až 8 uhlíkovými atomy, cykloalkylovou skupinu se 3 až 8 uhlíkovými atomy, cykloalkenylovou skupinu se 3 až 8 uhlíkovými atomy, alkoxy-
- 55 skupinu s 1 až 8 uhlíkovými atomy, alkenyloxyskupinu se 2 až 8 uhlíkovými atomy, alkinyloxyskupinu se 2 až 8 uhlíkovými atomy, cykloalkoxy-
- skupinu se 3 až 8 uhlíkovými atomy, cykloalkenyloxyskupinu se 3 až 8 uhlíkovými atomy, alkylthioskupinu s 1 až 8 uhlíkovými atomy, alkenylthioskupinu se 2 až 8 uhlíkovými atomy, alkinylthioskupinu se 2 až 8 uhlíkovými atomy, cykloalkylthioskupinu se 3 až 8 uhlíkovými atomy, cykloalkenylthioskupinu se 3 až 8 uhlíkovými atomy, fenylovou skupinu nebo hetero-

cyklylovou skupinu se 3 až 6 atomy kruhu a 1 až 3 heteroatomy kruhu ze skupiny zahrnující dusík, kyslík a síru, přičemž každý z předchozích uhlík obsahujících zbytků je nesubstituovaný nebo substituovaný jedním nebo více, výhodně až třemi, stejnými nebo různými zbytky ze skupiny zahrnující atom halogenu, kyanoskupinu, nitroskupinu, aminoskupinu, hydroxyskupinu, alkoxy skupinu s 1 až 8 uhlíkovými atomy, ve které jedna nebo více, výhodně až tři nesousedící methylenové skupiny mohou být nahrazené kyslíkovým atomem, alkylthioskupinu s 1 až 8 uhlíkovými atomy, alkylsulfinylovou skupinu s 1 až 6 uhlíkovými atomy, alkylsulfonylovou skupinu s 1 až 6 uhlíkovými atomy, alkenyloxyskupinu se 2 až 8 uhlíkovými atomy, alkenylthioskupinu se 2 až 8 uhlíkovými atomy, alkinyloxyskupinu se 2 až 8 uhlíkovými atomy, alkinylthioskupinu se 2 až 8 uhlíkovými atomy, cykloalkylovou skupinu se 3 až 7 uhlíkovými atomy, cykloalkenylovou skupinu se 3 až 7 uhlíkovými atomy, cykloalkoxy skupinu se 3 až 7 uhlíkovými atomy, cykloalkenyloxyskupinu se 3 až 7 uhlíkovými atomy, alkylaminovou a dialkylaminovou skupinu s 1 až 4 uhlíkovými atomy v každém alkylu, alkoxykarbonylovou skupinu s 1 až 8 uhlíkovými atomy v alkoxyly, alkenyloxykarbonylovou skupinu se 2 až 8 uhlíkovými atomy v alkenylu, alkinyloxykarbonylovou skupinu se 2 až 8 uhlíkovými atomy v alkynylu, alkylthiokarbonylovou skupinu s 1 až 8 uhlíkovými atomy v alkylu, alkylkarbonylovou skupinu s 1 až 8 uhlíkovými atomy v alkylu, alkenylkarbonylovou skupinu se 2 až 8 uhlíkovými atomy v alkenylu, alkinylkarbonylovou skupinu se 2 až 8 uhlíkovými atomy v alkynylu, fenylovou skupinu, fenylalkoxy skupinu s 1 až 6 uhlíkovými atomy v alkoxyly, heterocyklylovou skupinu se 3 až 6 atomy kruhu a s 1 až 3 heteroatomy kruhu ze skupiny zahrnující dusík, kyslík a síru a v případě cyklických zbytků jsou také substituované alkylovou skupinou s 1 až 6 uhlíkovými atomy, přičemž každý ze 25 posledně jmenovaných zbytků je nesubstituovaný nebo substituovaný jedním nebo více zbytky ze skupiny zahrnující atom halogenu, nitroskupinu, aminoskupinu, kyanoskupinu a hydroxyskupinu,

- 25 R^2 značí vodíkový atom nebo alkylovou skupinu s 1 až 4 uhlíkovými atomy, výhodně vodíkový atom, nebo
- 30 R^1 a R^2 značí společně se skupinou vzorce $-\text{CO}-\text{N}-$ zbytek tříčlenného až šestičlenného, nasyceného nebo nenasyčeného heterocyklického kruhu, který vedle dusíkového atomu skupiny vzorce $-\text{CO}-\text{N}-$ může obsahovat ještě jeden heteroatom ze skupiny zahrnující dusík, kyslík a síru a
- 35 R^3 a R^5 jsou stejné nebo různé zbytky, které nezávisle na sobě značí atom halogenu, nitroskupinu, aminoskupinu, hydroxyskupinu, kyanoskupinu, sulfamoylovou skupinu, alkylovou skupinu s 1 až 8 uhlíkovými atomy, cykloalkylovou skupinu se 3 až 6 uhlíkovými atomy, alkenylovou skupinu se 2 až 8 uhlíkovými atomy, alkinylovou skupinu se 2 až 8 uhlíkovými atomy, alkoxy skupinu s 1 až 8 uhlíkovými atomy, alkenyloxyskupinu se 2 až 8 uhlíkovými atomy, alkinyloxyskupinu se 2 až 8 uhlíkovými atomy, alkylaminosulfonylovou a dialkylaminosulfonylovou skupinu s 1 až 4 uhlíkovými atomy v každém alkylu, alkylthioskupinu s 1 až 8 uhlíkovými atomy, alkylsulfinylovou skupinu s 1 až 8 uhlíkovými atomy, alkylsulfonylovou s 1 až 8 uhlíkovými atomy, alkoxykarbonylovou skupinu s 1 až 8 uhlíkovými atomy v alkoxyly, alkylthiokarbonylovou skupinu s 1 až 8 uhlíkovými atomy v alkylu, alkylkarbonylovou skupinu s 1 až 8 uhlíkovými atomy v alkylu, přičemž každý z posledně jmenovaných 15 zbytků je nesubstituovaný nebo substituovaný jedním nebo více, výhodně až třemi, stejnými nebo různými zbytky ze skupiny zahrnující atom halogenu, halogenalkoxy skupinu s 1 až 6 uhlíkovými atomy, fosforylovou skupinu, nitroskupinu, aminoskupinu, kyanoskupinu, hydroxyskupinu, alkoxy skupinu s 1 až 8 uhlíkovými atomy, ve které mohou být jedna nebo více, výhodně až tři nesousedící methylenové skupiny nahrazené kyslíkem a v případě cyklických zbytků také alkylovou skupinou s 1 až 4 uhlíkovými atomy a halogenalkylovou skupinou s 1 až 4 uhlíkovými atomy.
- 50

Obzvláště významné jsou safenery obecného vzorce I podle předloženého vynálezu nebo jejich soli, přičemž

- 5 R^1 značí vodíkový atom, alkylovou skupinu s 1 až 8 uhlíkovými atomy, alkenylovou skupinu se 2 až 6 uhlíkovými atomy, alkinylovou skupinu se 2 až 6 uhlíkovými atomy, cykloalkylovou skupinu se 3 až 6 uhlíkovými atomy, cykloalkenylovou skupinu s 5 až 6 uhlíkovými atomy, cykloalkenylovou skupinu s 5 až 6 uhlíkovými atomy, alkoxy skupinu s 1 až 6 uhlíkovými atomy, alkenyloxyskupinu se 2 až 6 uhlíkovými atomy, alkinyloxyskupinu se 2 až 6 uhlíkovými atomy, cykloalkoxy skupinu se 3 až 6 uhlíkovými atomy, cykloalkenyloxyskupinu s 5 až 6 uhlíkovými atomy, alkylthioskupinu s 1 až 6 uhlíkovými atomy, alkenylthioskupinu se 2 až 6 uhlíkovými atomy, alkinylthioskupinu se 2 až 6 uhlíkovými atomy, cykloalkylthioskupinu se 3 až 6 uhlíkovými atomy, cykloalkenylythioskupinu s 5 až 6 uhlíkovými atomy, fenylovou skupinu nebo heterocyklylovou skupinu se 3 až 6 atomy kruhu a 1 až 3 heteroatomy kruhu ze skupiny zahrnující dusík, kyslík a síru, přičemž každý z předchozích 17 zbytků je nesubstituovaný nebo substituovaný jedním nebo více stejnými nebo různými zbytky ze skupiny zahrnující atom halogenu, kyanoskupinu, alkoxy skupinu s 1 až 6 uhlíkovými atomy, alkylthioskupinu s 1 až 6 uhlíkovými atomy, alkylsulfonylovou skupinu s 1 až 4 uhlíkovými atomy, alkylsulfonylovou skupinu s 1 až 4 uhlíkovými atomy, alkenyloxyskupinu se 2 až 4 uhlíkovými atomy, alkenylthioskupinu se 2 až 4 uhlíkovými atomy, alkinyloxyskupinu se 2 až 4 uhlíkovými atomy, alkinylthioskupinu se 2 až 4 uhlíkovými atomy, cykloalkylovou skupinu se 3 až 6 uhlíkovými atomy, cykloalkenylovou skupinu se 3 až 6 uhlíkovými atomy, cykloalkoxy skupinu se 3 až 6 uhlíkovými atomy, cykloalkenyl-oxyskupinu s 5 až 6 uhlíkovými atomy, alkylaminovou a dialkylaminovou skupinu s 1 až 4 uhlíkovými atomy v každém alkylu, alkoxykarbonylovou skupinu s 1 až 6 uhlíkovými atomy v alkoxyly, alkylthiokarbonylovou skupinu s 1 až 6 uhlíkovými atomy v alkylu, alkylkarbonylovou skupinu s 1 až 6 uhlíkovými atomy v alkylu, fenylovou skupinu, fenyl-alkoxy skupinu s 1 až 4 uhlíkovými atomy v alkoxyly, heterocyklylovou skupinu s 5 až 6 atomy kruhu a s 1 až 3 heteroatomy kruhu ze skupiny zahrnující dusík, kyslík a síru a v případě cyklických zbytků jsou také substituované alkylovou skupinou s 1 až 4 uhlíkovými atomy, přičemž každý ze 21 posledně jmenovaných zbytků je nesubstituovaný nebo substituovaný jedním nebo více zbytky ze skupiny zahrnující atom halogenu a kyanoskupinu a v případě cyklických zbytků také alkylovou skupinu s 1 až 4 uhlíkovými atomy,
- 35 R^2 značí vodíkový atom nebo alkylovou skupinu s 1 až 4 uhlíkovými atomy, nebo
- R^1 a R^2 značí společně se skupinou vzorce $-\text{CO}-\text{N}-$ zbytek pětičlenného až šestičlenného, nasyceného nebo nenasyčeného heterocyklického kruhu, který vedle dusíkového atomu skupiny vzorce $-\text{CO}-\text{N}-$ neobsahuje žádný další heteroatom a
- 40 R^3 a R^5 jsou stejné nebo různé zbytky, které nezávisle na sobě značí atom halogenu, nitroskupinu, aminoskupinu, hydroxyskupinu, kyanoskupinu, sulfamoylovou skupinu, alkylovou skupinu s 1 až 6 uhlíkovými atomy, cykloalkylovou skupinu se 3 až 6 uhlíkovými atomy, alkenylovou skupinu se 2 až 6 uhlíkovými atomy, alkinylovou skupinu se 2 až 6 uhlíkovými atomy, alkoxy skupinu s 1 až 6 uhlíkovými atomy, alkenyloxyskupinu se 2 až 6 uhlíkovými atomy, alkinyloxyskupinu se 2 až 6 uhlíkovými atomy, alkylaminosulfonylovou a dialkylaminosulfonylovou skupinu s 1 až 4 uhlíkovými atomy v každém alkylu, alkylthioskupinu s 1 až 6 uhlíkovými atomy, alkylsulfonylovou skupinu s 1 až 6 uhlíkovými atomy, alkylsulfonylovou skupinu s 1 až 6 uhlíkovými atomy, alkoxykarbonylovou skupinu s 1 až 6 uhlíkovými atomy v alkoxyly, alkylthiokarbonylovou skupinu s 1 až 6 uhlíkovými atomy v alkylu, alkylkarbonylovou skupinu s 1 až 6 uhlíkovými atomy v alkylu, přičemž každý z posledně jmenovaných 15 zbytků je nesubstituovaný nebo substituovaný jedním nebo více stejnými nebo různými zbytky ze skupiny zahrnující atom halogenu, halogenalkoxy skupinu s 1 až 4 uhlíkovými atomy, kyanoskupinu, alkoxy skupinu s 1 až 4 uhlíkovými atomy a v případě cyklických zbytků také alkylovou skupinou s 1 až 4 uhlíkovými atomy a halogenalkylovou skupinou s 1 až 4 uhlíkovými atomy.
- 55

Výhodné jsou jako safenery takové sloučeniny obecného vzorce I podle předloženého vynálezu nebo jejich soli, ve kterém

- 5 R^1 značí vodíkový atom, alkylovou skupinu s 1 až 6 uhlíkovými atomy, alkenylovou skupinu se 2 až 6 uhlíkovými atomy, cykloalkylovou skupinu se 3 až 6 uhlíkovými atomy, cykloalkenylovou skupinu s 5 až 6 uhlíkovými atomy, alkoxy skupinu s 1 až 6 uhlíkovými atomy, fenylovou skupinu nebo heterocyklylovou skupinu se 3 až 6 atomy kruhu a 1 až 3 heteroatomy kruhu, výhodně s 1 nebo 2 heteroatomy kruhu ze skupiny zahrnující dusík, kyslík a síru, přičemž každý z posledně jmenovaných 7 zbytků je nesubstituovaný nebo
10 substituovaný jedním nebo více stejnými nebo různými zbytky ze skupiny zahrnující atom halogenu, alkoxy skupinu s 1 až 6 uhlíkovými atomy, přičemž jedna nebo více methylenových skupin může být nahrazena kyslíkovým atomem, halogenalkoxy skupinu s 1 až 6 uhlíkovými atomy, alkylsulfinylovou skupinu s 1 až 2 uhlíkovými atomy, alkylsulfonylovou skupinu s 1 až 2 uhlíkovými atomy, cykloalkylovou skupinu se 3 až 6 uhlíkovými
15 atomy, alkoxykarbonylovou skupinu s 1 až 4 uhlíkovými atomy v alkoxyly, alkylkarbonylovou skupinu s 1 až 4 uhlíkovými atomy v alkylu a fenylovou skupinu, a v případě cyklických zbytků jsou také substituované alkylovou skupinou s 1 až 4 uhlíkovými atomy a halogenalkylovou skupinou s 1 až 4 uhlíkovými atomy,
20 R^2 značí vodíkový atom,

 R^3 značí atom halogenu, halogenalkylovou skupinu s 1 až 4 uhlíkovými atomy, halogenalkoxy skupinu s 1 až 4 uhlíkovými atomy, alkylovou skupinu s 1 až 4 uhlíkovými atomy, alkoxy skupinu s 1 až 4 uhlíkovými atomy, alkylsulfonylovou skupinu s 1 až 4 uhlíkovými atomy,
25 alkoxykarbonylovou skupinu s 1 až 4 uhlíkovými atomy v alkoxyly nebo alkylkarbonylovou skupinu s 1 až 4 uhlíkovými atomy v alkylu,

 R^4 značí vodíkový atom,
30 R^5 značí vodík halogenu, alkylovou skupinu s 1 až 4 uhlíkovými atomy, halogenalkylovou skupinu s 1 až 4 uhlíkovými atomy, halogenalkoxy skupinu s 1 až 4 uhlíkovými atomy, cykloalkylovou skupinu se 3 až 6 uhlíkovými atomy, fenylovou skupinu, alkoxy skupinu s 1 až 4 uhlíkovými atomy, kyanoskupinu, alkylthioskupinu s 1 až 4 uhlíkovými atomy,
35 alkylsulfinylovou skupinu s 1 až 4 uhlíkovými atomy, alkylsulfonylovou skupinu s 1 až 4 uhlíkovými atomy, alkoxykarbonylovou skupinu s 1 až 4 uhlíkovými atomy v alkoxyly nebo alkylkarbonylovou skupinu s 1 až 4 uhlíkovými atomy v alkylu,

 n značí číslo 0, 1 nebo 2 a
40 m značí číslo 1 nebo 2.

Obzvláště výhodné jsou jako safenery takové sloučeniny obecného vzorce I podle předloženého vynálezu nebo jejich soli, ve kterém

- 45 R^1 značí vodíkový atom, alkylovou skupinu s 1 až 6 uhlíkovými atomy, cykloalkylovou skupinu se 3 až 6 uhlíkovými atomy, furanylovou skupinu nebo thienylovou skupinu, přičemž každý z posledně jmenovaných 4 zbytků je nesubstituovaný nebo substituovaný jedním nebo více stejnými nebo různými zbytky ze skupiny zahrnující atom halogenu, alkoxy skupinu s 1 až 4 uhlíkovými atomy, halogenalkoxy skupinu s 1 až 6 uhlíkovými atomy a alkylthio skupinu s 1 až 4 uhlíkovými atomy a v případě cyklických zbytků jsou také substituované alkylovou skupinou s 1 až 4 uhlíkovými atomy a halogenalkylovou skupinou s 1 až 4 uhlíkovými atomy,
50 R^2 značí vodíkový atom,
55

R^3 značí atom halogenu, halogenalkylovou skupinu s 1 až 4 uhlíkovými atomy, halogenalkoxy-
skupinu s 1 až 4 uhlíkovými atomy, alkylovou skupinu s 1 až 4 uhlíkovými atomy, alkoxy-
skupinu s 1 až 4 uhlíkovými atomy, alkylsulfonylovou skupinu s 1 až 4 uhlíkovými atomy,
5 alkoxykarbonylovou skupinu s 1 až 4 uhlíkovými atomy v alkoxyly nebo alkylkarbonylovou
skupinu s 1 až 4 uhlíkovými atomy v alkylu, výhodně atom halogenu, halogenalkylovou
skupinu s 1 až 4 uhlíkovými atomy, jako je trifluormethylová skupina, alkoxy skupina s 1 až
4 uhlíkovými atomy, halogenalkoxyskupinu s 1 až 4 uhlíkovými atomy, alkoxykarbony-
lovou skupinu s 1 až 4 uhlíkovými atomy v alkoxyly nebo alkylsulfonylovou skupinu s 1 až
10 4 uhlíkovými atomy,

R^4 značí vodíkový atom,

R^5 značí atom halogenu, alkylovou skupinu s 1 až 4 uhlíkovými atomy, halogenalkylovou
skupinu s 1 až 4 uhlíkovými atomy, halogenalkoxyskupinu s 1 až 4 uhlíkovými atomy,
15 cykloalkylovou skupinu se 3 až 6 uhlíkovými atomy, fenylovou skupinu, alkoxy skupinu
s 1 až 4 uhlíkovými atomy, kyanoskupinu, alkylthioskupinu s 1 až 4 uhlíkovými atomy,
alkylsulfinylovou skupinu s 1 až 4 uhlíkovými atomy, alkylsulfonylovou skupinu s 1 až 4
uhlíkovými atomy, alkoxykarbonylovou skupinu s 1 až 4 uhlíkovými atomy v alkoxyly nebo
20 alkylkarbonylovou skupinu s 1 až 4 uhlíkovými atomy v alkylu, výhodně atom halogenu,
alkylovou skupinu s 1 až 4 uhlíkovými atomy, halogenalkylovou skupinu s 1 až 4 uhlíko-
vými atomy, jako je trifluormethylová skupina, halogenalkoxyskupinu s 1 až 4 uhlíkovými
atomy, alkoxy skupinu s 1 až 4 uhlíkovými atomy nebo alkylthioskupinu s 1 až 4 uhlíkovými
atomy,

n značí číslo 0, 1 nebo 2 a

m značí číslo 1 nebo 2.

30 Sloučeniny obecného vzorce I jsou zčásti známé, jejich safenerový účinek však nebyl dosud
zveřejněn; viz US 2 411 495, US 2 423 976, US 2 423 976, US 2 503 820, CH-242 291, Bull.
Chem. Soc. Jpn. 61 (1988) 3999 až 4003, srv. a4; Chem. Abstr. 55: 461g; Chem. Abstr. 104:
125043; Chem. Abstr. 52: 9206i až 9207a; Seydel a kol., Arzneimittelvorschung 14 (1964) 705,
kde jsou popsány některé sloučeniny obecného vzorce I jako meziprodukty pro farmaceutické
35 sulfonamidy.

Známé jsou sloučeniny obecného vzorce I, ve kterém

a) $R^2 = H$, $n = 0$ a

40 a1) $R^1 = CH_3$ a
 $m = 0$ nebo $(R^5)_m = 2-$, $3-$ nebo $4-CH_3$, $4-C_2H_5$, $4-n-C_3H_7$, $4-i-C_3H_7$, $4-OCH_3$,
 $4-i-OC_3H_7$, $4-NH_2$, $4-Cl$, $4-NO_2$, $2,3-(CH_3)_2$, $2,4-(CH_3)_2$, $3,4-(CH_3)_2$, $2,5-(CH_3)_2$,
2,4,5- $(CH_3)_3$, $2,4,6-(CH_3)_3$, $2,3,4,5,6-(CH_3)_5$, $3-CH_3-4-OCH_3$, $3-CH_3-4-SCH_3$,
45 2,4- $(OCH_3)_2$, $2,5-(OCH_3)_2$, $3,4,5-(OCH_3)_3$, $2-OCH_3-4-NH_2$, $2-OCH_3-4-NO_2$ nebo
dva zbytky R^3 společně značí skupinu $-OCH_2O-$,

a2) $R^1 = H$, $n-C_3H_7$, $n-C_6H_{13}$, cyklohexyl nebo 2-methylpentenyl a $(R^5)_m = 2-CH_3$,

50 a3) $R^1 = n-C_5H_{11}$ a
 $m = 0$ nebo $(R^5)_m = 2-CH_3$, $3-NO_2$, $4-NO_2$, $2,3-(CH=CH-CH=CH)$,

a4) $R^1 = n-C_9H_{19}$ a $m = 0$,

55 a5) $R^1 = OCH_3$, $(R^5)_m = 2-i-OC_3H_7$,

- a6) $R^1 = \text{OC}_2\text{H}_5$, $(R^5)_m = 2\text{-OCH}_3$, 2-COOH , $3,5\text{-(CH}_3)_2$,
 a7) $R^1 = \text{CH}_2\text{CH}_2\text{COOH}$ a
 5 $m = 0$ nebo $(R^5)_m = 4\text{-i-OC}_3\text{H}_7$,
 a8) $R^1 = \text{CH=CHCOOH}$ a $(R^5)_m = 2\text{-CH}_3$ nebo $4\text{-i-OC}_3\text{H}_7$,
 a9) $R^1 = 4\text{-methoxyfenyl}$ a $(R^5)_m = 4\text{-OCH}_3$,
 10 a10) $R^1 = 4\text{-nitrofenyl}$ a $(R^5)_m = 4\text{-NO}_2$,
 a11) $R^1 = \text{benzdioxol-6-yl}$ a $(R^5)_m = 3,4\text{-(-OCH}_2\text{O-)}$,
 15 a12) $R^1 = 3,5\text{-dimethyl-1-fenyl-pyrazol-4-yl}$ nebo $2,3\text{-dimethyl-1-fenyl-5-oxo-pyrazol-4-yl}$ a
 $(R^5)_m = 4\text{-i-OC}_3\text{H}_7$,
 a13) $R^1 = \text{C}_{11}\text{H}_{23}$, CH_2Cl , CH_2Br , CH_2J , CHCl_2 , CCl_3 nebo CH_2F a
 20 $(R^5)_m = 3,4\text{-(CH}_3)_2$; nebo
 b) $R^1 = \text{H}$, $R^2 = \text{H}$, $R^4 = \text{CH}_3$, $n = m = 0$,
 c) $R^1 = \text{CH}_3$, $R^2 = \text{H}$, $(R^3)_n = \text{anelovaný benzenový kruh v poloze 2,3-}$ a $m = 0$ nebo
 25 d) $R^1 = \text{fenyl}$, $R^2 = R^4 = \text{H}$, $(R^2)_n = 3\text{-fenylkarbonyloxy}$ a $m = 0$.

Pesticidní prostředky mohou obsahovat účinný obsah

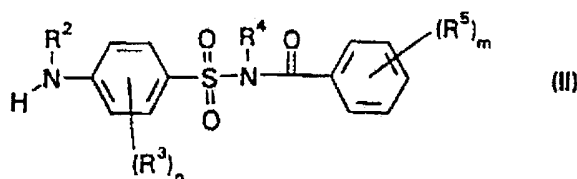
- 30 A) jedné nebo více pesticidních účinných látek a
 B) jednoho nebo více safeneru obecného vzorce I nebo jeho solí podle předloženého vynálezu.
 Jako pesticidní účinné látky přicházejí v úvahu například herbicidy, insekticidy, fungicidy, akari-
 35 cidy a nematicidy, které při svém samotném použití způsobují fytotoxické škody na kulturních
 rostlinách. Obzvláště zajímavé jsou odpovídající pesticidní účinné látky ze skupiny herbicidů.
 Výhodné jsou herbicidní prostředky s obsahem
 40 A) alespoň jedné herbicidní účinné látky ze skupiny, obsahující ALS-inhibitory a inhibitory
 biosyntézy mastných kyselin a
 B) alespoň jednoho safeneru obecného vzorce I nebo jeho soli podle předloženého vynálezu.
 45 Způsob ochrany kulturních rostlin, výhodně rostlin obilí, jako je kukuřice, rýže, pšenice
 a ječmen, před fytotoxickými vedlejšími účinky herbicidů, obzvláště ze skupiny sulfonyl-
 močovín, spočívá v aplikaci účinného množství jedné nebo více sloučenin obecného vzorce I
 před, po nebo současně s výše uvedenými herbicidně účinnými látkami na rostliny, semena
 50 rostlin nebo osevní plochu.

Sloučeniny obecného vzorce I a jejich předprodukty se dají vyrobit pomocí všeobecně známých
 způsobů (viz například Kojima a kol., J. Pharm. Soc. Jpn., 71 (1951), 626; A. D. B. Sloan, Chem.
 Ind., 1969, 1305; Bretschneider a kol., Monatsch. Chemie 87, (1956), 47; K. Takatori a kol.,
 J. Pharm. Soc. Jpn., 78, (1958), 546).

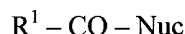
55

Tak se může výroba sloučenin podle předloženého vynálezu obecného vzorce I provádět tak, že se

1. sloučenina obecného vzorce II

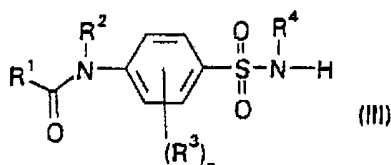


ve kterém mají R^2 , R^3 , R^4 , R^5 , n a m významy, definované u obecného vzorce I, nechá reagovat s acylačním činidlem obecného vzorce

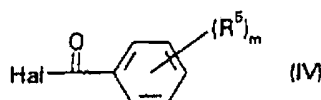


ve kterém je Nuc odštěpitelná skupina, například s acylačním činidlem jako je halogenid karboxylové kyseliny nebo anhydrid karboxylové kyseliny $R^1-CO-Cl$ nebo $R^1-CO-O-CO-R^1$, přičemž R^1 má význam, definovaný u obecného vzorce I;

2. sloučenina obecného vzorce III



ve kterém mají R^1 , R^2 , R^3 , R^4 a n významy, definované u obecného vzorce I, nechá reagovat s benzoylhalogenidem obecného vzorce IV



ve kterém má R^5 u vzorce I uvedený význam.

Reakce podle varianty 1 a 2 se provádějí výhodně v inertním organickém rozpouštědle za přítomnosti kyseliny vázajícího činidla. Jako rozpouštědla jsou vhodná například aprotická polární rozpouštědla, například ethery, jako je tetrahydrofuran nebo dioxan, ketony, jako je acetonitril a amidy, jako je dimethylformamid. Jako báze se používají výhodně organické báze, například substituované aminy, jako je triethylamin, pyridin nebo dimethylaminopyridin.

Reakční teploty jsou výhodně v rozmezí $-20\text{ }^{\circ}\text{C}$ až $120\text{ }^{\circ}\text{C}$.

Když se safenery obecného vzorce I podle předloženého vynálezu aplikují v subtoxických koncentracích společně s herbicidními účinnými látkami nebo také v libovolném pořadí, tak jsou schopné redukovat, popřípadě úplně potlačit fyto toxické vedlejší účinky těchto herbicidů, bez toho, že by se však snížila účinnost těchto herbicidů proti škodlivým rostlinám. Vhodné herbicidy, které se mohou kombinovat se safenery podle předloženého vynálezu, jsou například herbicidy ze skupiny sulfonylmočovin, imidazolinonů, derivátů (hetero)aryloxy-fenoxyalkan-karboxylových kyselin, cyklohexandionů, benzoylcyklohexandionů, triazolopyrimidinsulfonamidů derivátů pyrimidinyloxy-pyrimidinkarboxylové kyseliny a pyrimidinyloxy-benzoové kyseliny a esterů kyseliny S-(N-aryl-N-alkylkarbamoylmethyl)-dithiofosforečné.

Vhodnými herbicidy z řady sulfonylmočoviny jsou například pyrimidinyl- nebo triazinyl-amino-karbonyl-[benzen-, pyridin-, pyrazol-, thiofen- a (alkylsulfonyl)alkylamino-]-sulfamidy. Jako substituenty na pyrimidinovém kruhu nebo triazinovém kruhu jsou výhodné alkoxykupina, alkylová skupina, halogenalkoxykupina, halogenalkylová skupina, atom halogenu nebo di-methylaminoskupina, přičemž všechny substituenty jsou nezávisle na sobě kombinovatelné. Výhodné substituenty v benzenové, pyridinové, pyrazolové, thiofenové nebo (alkylsulfonyl)-alkylaminové části, jsou alkylová skupina, alkoxykupina, atom halogenu, nitroskupina, alkoxy-karbonylová skupina, aminokarbonylová skupina, alkylaminokarbonylová skupina, dialkyl-aminokarbonylová skupina, alkoxyaminokarbonylová skupina, halogenalkoxykupina, halogen-alkylová skupina, alkylkarbonylová skupina, alkoxyalkylová skupina a (alkansulfonyl)alkyl-aminoskupina. Vhodné sulfonylmočoviny jsou například:

- 1) Fenylsulfonylmočoviny, benzylsulfonylmočoviny a příbuzné sloučeniny, například:
 - 15 1-(2-chlorfenylsulfonyl)-3-(4-methoxy-6-methyl-1,3,5-triazin-2-yl)-močovina, (chlorsulfuron)-1-(2-ethoxykarbonylfenylsulfonyl)-3-(4-chlor-6-methoxypyrimidin-2-yl)-močovina (chlorium-uron-ethyl), 1-(2-methoxyfenylsulfonyl)-3-(4-methoxy-6-methyl-1,3,5-triazin-2-yl)-močovina (methan-sulfuron-methyl),
 - 20 1-(2-chlorethoxyfenylsulfonyl)-3-(4-methoxy-6-methyl-1,3,5-triazin-2-yl)-močovina (triasulfuron), 1-(2-methoxykarbonylfenylsulfonyl)-3-(4,6-dimethyl-pyrimidin-2-yl)-močovina (sulfo-meturon-methyl), 1-(2-methoxykarbonylfenylsulfonyl)-3-(4-methoxy-6-methyl-1,3,5-triazin-2-yl)-3-methyl-močovina (triben-uron-methyl),
 - 25 1-(2-methoxykarbonylbenzylsulfonyl)-3-(4,6-dimethoxypyrimidin-2-yl)-močovina (bensul-furon-methyl), 1-(2-methoxykarbonylfenylsulfonyl)-3-[4,6-bis-(difluormethoxy)-pyrimidin-2-yl]-močovina (pyrimidinsulfuron-methyl),
 - 30 3-(4-ethyl-6-methoxy-1,3,5-triazin-2-yl)-1-(2,3-dihydro-1,1-dioxo-2-methylbenzo[b]-thiofen-7-sulfonyl)močovina (viz EP-A-79 683), 3-(4-ethoxy-6-ethyl-1,3,5-triazin-2-yl)-1-(2,3-dihydro-1,1-dioxo-2-methylbenzo[b]thiofen-7-sulfonyl)-močovina (viz EP-A-79 683), 3-(4-ethoxy-6-methyl-1,3,5-triazin-2-yl)-1-(2-methoxykarbonyl-5-jod-fenylsulfonyl)-močovina (viz WO 92/13845),
 - 35 DPX-66037, trisulfuron-methyl (viz Brighton Crop Prot. Conf. – Weeds-1995, str. 853), CGA-277476, (viz Brighton Crop Prot. Conf. – Weeds-1995, str. 79), methyl-2-[3-(4,6-dimethoxypyrimidin-2-yl)-ureidosulfonyl]-4-methansulfonamido-methyl-benzoát (viz WO 95/10507) a
 - 40 N,N-dimethyl-2-[3-(4,6-dimethoxypyrimidin-2-yl)-ureidosulfonyl]-4-formylaminobenzamid (viz PCT/EP 95/01344);
- 2) Thienylsulfonylmočoviny, například:
 - 45 1-(2-methoxykarbonylthiofen-3-yl)-3-(4-methoxy-6-methyl-1,3,5-triazin-2-yl)-močovina (thifensulfuron-methyl);
- 3) Pyrazolylsulfonylmočoviny, například:
 - 1-(4-ethoxykarbonyl-1-methylpyrazol-5-yl-sulfonyl)-3-(4,6-dimethoxypyrimidin-2-yl)-močovina (pyrazosulfuron-methyl),
 - 50 methyl-3-chlor-5-(4,6-dimethoxypyrimidin-2-yl)-karbamoylsulfamoyl)-1-methylpyrazol-4-karboxylát (viz EP 282 613),

methylester kyseliny 5-(4,6-dimethoxypyrimidin-2-yl-karbamoylsulfamoyl)-1-(2-pyridyl)-pyrazol-4-karboxylové (NC-330, viz Brighton Corp. Prot. Conference – Weeds – 1991, Vol. 1, str. 45 a další) a

DPX-A8947, azimsulfuron, (viz Brighton Corp. Prot. Conference – Weeds – 1995, str. 65);

5

4) Deriváty sulfonamidu, například:

3-(4,6-dimethoxypyrimidin-2-yl)-1-(N-methyl-N-methylsulfonylamino-sulfonyl)-močovina (amidosulfuron) a

10 strukturní analogy (viz EP-A-131 258 a Z. Pfl. Krankh. Pfl. Schutz, Sonderheft XII, 489-497 (1990));

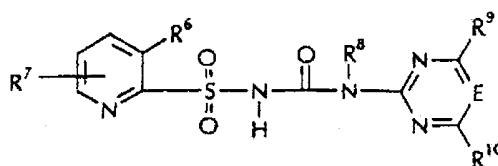
5) Pyridylsulfonylmočoviny, například

1-(3-N,N-dimethylaminokarbonylpyridin-2-yl-sulfonyl)-3-(4,6-dimethoxypyrimidin-2-yl)-močovina (nicosulfuron),

15 1-(3-ethylsulfonylpyridin-2-yl-sulfonyl)-3-(4,6-dimethoxypyrimidin-2-yl)-močovina (rimsulfuron),

methylester kyseliny 2-[3-(4,6-dimethoxypyrimidin-2-yl)-ureidosulfonyl]-6-trifluormethyl-3-pyridinkarboxylové, sodná sůl (DPX-KE459, flupyrsulfuron, viz Brighton Corp. Prot. Conf. – Weeds – 1995, str. 49) a

20 pyridylsulfonylmočoviny, které jsou popsány v DE-A-40 00 503 a DE-A-40 30 577, výhodně sloučeniny obecného vzorce



25 ve kterém

E značí skupinu CH nebo N, výhodně CH,

R⁶ značí jod nebo skupinu NR¹¹R¹², přičemž

30

R¹¹ značí alkylovou skupinu s 1 až 4 uhlíkovými atomy a

R¹² značí alkylsulfonylovou skupinu, nebo

35 R¹¹ a R¹² značí společně řetězec vzorce -(CH₂)₃SO₂- nebo -(CH₂)₄SO₂-,

R⁷ značí vodíkový atom, atom halogenu, alkylovou skupinu s 1 až 3 uhlíkovými atomy, alkoxy-skupinu s 1 až 3 uhlíkovými atomy, halogenalkylovou skupinu s 1 až 3 uhlíkovými atomy, halogenalkoxyskupinu s 1 až 3 uhlíkovými atomy, alkylthioskupinu s 1 až 3 uhlíkovými atomy, alkoxyalkylovou skupinu s 1 až 3 uhlíkovými atomy v alkylu i alkoxyly, alkoxy-karbonylovou skupinu s 1 až 3 uhlíkovými atomy v alkoxyly, alkylaminovou nebo dialkyl-aminovou skupinu s 1 až 3 uhlíkovými atomy v každém alkylu, alkylsulfinylovou skupinu s 1 až 3 uhlíkovými atomy, alkylsulfonylovou skupinu s 1 až 3 uhlíkovými atomy, skupinu SO₂-NR^aR^b nebo skupinu CO-NR^aR^b, obzvláště vodíkový atom, přičemž

45

R^a a R^b značí nezávisle na sobě vodíkový atom, alkylovou skupinu s 1 až 3 uhlíkovými atomy, alkenylovou skupinu s 1 až 3 uhlíkovými atomy, alkinylovou skupinu s 1 až 3 uhlíkovými atomy nebo společně skupinu -(CH₂)₄-, -(CH₂)₅- nebo -(CH₂)₂-O-(CH₂)₂-,

R⁸ značí vodíkový atom nebo methylovou skupinu,

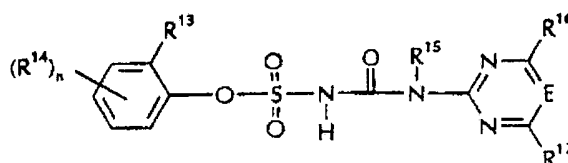
5 R⁹ značí atom halogenu, alkylovou skupinu s 1 až 2 uhlíkovými atomy, alkoxykupinu s 1 nebo 2 uhlíkovými atomy, halogenalkylovou skupinu s 1 nebo 2 uhlíkovými atomy, výhodně trifluormethylovou skupinu, halogenalkoxykupinu s 1 nebo 2 uhlíkovými atomy, výhodně difluormethoxykupinu nebo skupinu OCH₂CF₃ a

10 R¹⁰ značí alkylovou skupinu s 1 až 2 uhlíkovými atomy, halogenalkoxykupinu s 1 až 2 uhlíkovými atomy, výhodně difluormethoxykupinu, nebo alkoxykupinu s 1 až 2 uhlíkovými atomy,

například 3-(4,6-dimethoxypyrimid-2-yl)-1-[3-(N-methylsulfonyl-N-methylamino)-pyridin-2-yl-sulfonyl]-močovina, nebo její soli;

15

6) Alkoxyfenoxysulfonylmočoviny, například popsané v EP-A-0342569, výhodně sloučeniny obecného vzorce



ve kterém

20

E značí skupinu CH nebo N, výhodně CH,

R¹³ značí ethoxykupinu, propoxykupinu nebo izopropoxykupinu,

25 R¹⁴ značí vodíkový atom, atom halogenu, nitroskupinu, trifluormethylovou skupinu, kyano- skupinu, alkylovou skupinu s 1 až 4 uhlíkovými atomy, alkoxykupinu s 1 až 4 uhlíkovými atomy, alkylthioskupinu s 1 až 4 uhlíkovými atomy nebo alkoxykarbonylovou skupinu s 1 až 3 uhlíkovými atomy v alkoxy, výhodně v poloze 6 fenylového kruhu,

30 n značí číslo 1, 2 nebo 3, výhodně 1,

R¹⁵ značí vodíkový atom, alkylovou skupinu s 1 až 4 uhlíkovými atomy nebo alkenylovou skupinu se 3 až 4 uhlíkovými atomy a

35 R¹⁶ a R¹⁷ značí nezávisle na sobě atom halogenu, alkylovou skupinu s 1 až 2 uhlíkovými atomy, alkoxykupinu s 1 až 2 uhlíkovými atomy, halogenalkylovou skupinu s 1 až 2 uhlíkovými atomy, halogenalkoxykupinu s 1 až 2 uhlíkovými atomy nebo alkoxyalkylovou skupinu s 1 až 2 uhlíkovými atomy v alkyly i alkoxy, výhodně methoxykupinu nebo methylovou skupinu,

40

například 3-(4,6-dimethoxypyrimidin-2-yl)-1-(2-ethoxyfenoxy)-sulfonylmočovina nebo její soli;

7) Imidazolylsulfonylmočoviny, například

45

MON 37500, sulfosulfuron (viz Brighton Corp Prot. Conf. – Weeds – 1995, str. 57),

a jiné příbuzné deriváty sulfonylmočoviny a jejich směsi.

Vhodnými herbicidy ze skupiny imidazolinonů jsou například deriváty kyseliny 2-(4-alkyl-5-oxo-2-imidazolin-2-yl)-benzoové nebo deriváty kyseliny 2-(4-alkyl-5-oxo-2-imidazolin-2-yl)-heteroarylkarboxylové, jako je například:

- 5 – methylester kyseliny 2-(4-izopropyl-4-methyl-5-oxo-2-imidazolin-2-yl)-5-methyl-benzoové a kyselina 2-(4-izopropyl-4-methyl-5-oxo-2-imidazolin-2-yl)-4-methyl-benzoová (imazamethabenz),
- kyselina 5-ethyl-2-(4-izopropyl-4-methyl-5-oxo-2-imidazolin-2-yl)-pyridin-3-karboxylová (imazethapyr),
- 10 – kyselina 2-(4-izopropyl-4-methyl-5-oxo-2-imidazolin-2-yl)-chinolin-3-karboxylová (imazaquin),
- kyselina 2-(4-izopropyl-4-methyl-5-oxo-2-imidazolin-2-yl)-pyridin-3-karboxylová (imazapyr) a
- 15 – kyselina 5-methyl-2-(4-izopropyl-4-methyl-5-oxo-2-imidazolin-2-yl)-pyridin-3-karboxylová (imezethamethapyr).

Vhodnými herbicidy ze skupiny herbicidů typu derivátů kyseliny fenoxifenoxycarboxylové a heteroaryloxyfenoxycarboxylové jsou například

- 20 a) deriváty kyseliny fenoxi-fenoxi-karboxylové a benzyloxy-fenoxi-karboxylové, například:
 - methylester kyseliny 2-[4-(2,4-dichlorfenoxi)-fenoxi]-propionové (diclofop-methyl),
 - methylester kyseliny 2-[4-(4-brom-2-chlorfenoxi)-fenoxi]-propionové (viz DE-A-2 601 548),
 - methylester kyseliny 2-[4-(4-brom-2-fluorfenoxi)-fenoxi]-propionové (viz US 4 808 750),
 - 25 – methylester kyseliny 2-[4-(2-chlor-4-trifluormethylfenoxi)-fenoxi]-propionové (viz DE-A-2 433 067),
 - methylester kyseliny 2-[4-(2-fluor-4-trifluormethylfenoxi)-fenoxi]-propionové (viz US 4 808 750),
 - 30 – methylester kyseliny 2-[4-(2,4-dichlorbenzyl)-fenoxi]-propionové (viz DE-A-2 417 487),
 - ethylester kyseliny 4-[4-(4-trifluormethylfenoxi)-fenoxi]-pent-2-en-karboxylové a
 - methylester kyseliny 2-[4-(4-trifluormethylfenoxi)-fenoxi]-propionové (viz DE-A-2 433 067);
- 35 b) „jednojaderné“ deriváty kyseliny heteroaryloxy-fenoxi-alkankarboxylové, například:
 - ethylester kyseliny 2-[4-(3,5-dichlorpyridyl-2-oxy)-fenoxi]-propionové (viz EP-A-2 925),
 - propargylester kyseliny 2-[4-(3,5-dichlorpyridyl-2-oxy)-fenoxi]-propionové (viz EP-A-3 114),
 - 40 – methylester kyseliny 2-[4-(3-chlor-5-trifluormethyl-2-pyridyloxy)-fenoxi]-propionové (viz EP-A-3 890),
 - ethylester kyseliny 2-[4-(3-chlor-5-trifluormethyl-2-pyridyloxy)-fenoxi]-propionové (viz EP-A-3 890),
 - propargylester kyseliny 2-[4-(5-chlor-3-fluor-2-pyridyloxy)-fenoxi]-propionové (viz EP-A-191 736) a
 - 45 – butylester kyseliny 2-[4-(5-trifluormethyl-2-pyridyloxy)-fenoxi]-propionové (fluazifop-butyl);

- c) „dvoujaderné“ deriváty kyseliny heteroaryloxy-fenoxy-alkankarboxylové, například:
- methylester a ethylester kyseliny 2-[4-(6-chlor-2-chinoxalyloxy)-fenoxy]-propionové (quizalofop-methyl a quizalofop-ethyl),
 - methylester kyseliny 2-[4-(6-fluor-2-chinoxalyloxy)-fenoxy]-propionové (viz J. Pest. Sci. Vol. 10, 61 (1985)),
 - kyselina 2-[4-(6-chlor-2-chinoxalyloxy)-fenoxy]-propionová a její 2-izopropyliden-aminooxyethylester (propaquizafop a ester),
 - ethylester kyseliny 2-[4-(6-chlorbenzoxazol-2-yl-oxy)-fenoxy]-propionové (fenoxaprop-ethyl), jeho D(+) izomer (fenoxaprop-P-ethyl) a ethylester kyseliny 2-[4-(6-chlorbenz-thiazol-2-yloxy)-fenoxy]-propionové (viz DE-A-26 40 730) a
 - tetrahydrofur-2-ylmethylester kyseliny 2-[4-(6-chlorchinoxalyloxy)-fenoxy]-propionové (viz EP-A-323 727).

Vhodnými herbicidy ze skupiny cyklohexandionů jsou například:

- methylester kyseliny 3-(1-allyloxyiminobutyl)-4-hydroxy-6,6-dimethyl-2-oxocyklohex-3-en-karboxylové (alloxydim),
- 2-(1-ethoxyiminobutyl)-5-(2-ethylthiopropyl)-3-hydroxy-cyklohex-2-en-1-on (sethoxydim),
- 2-(1-ethoximinobutyl)-5-(2-fenylthiopropyl)-3-hydroxy-cyklohex-2-en-1-on (cloproxydim),
- 2-[(1-(3-chlorallyloxy)-iminobutyl)]-5-[2-(ethylthio)propyl]-3-hydroxy-cyklohex-2-en-1-on,
- 2-[(1-(3-chlorallyloxy)-iminopropyl)]-5-[2-(ethylthio)propyl]-3-hydroxy-cyklohex-2-en-1-on (clethodim),
- 2-[(1-(ethoxyimino)-butyl)]-3-hydroxy-5-(thian-3-yl)-cyklohex-2-enon (cycloxydim) a
- 2-(1-ethoxyiminopropyl)-5-(2,4,6-trimethylfenyl)-3-hydroxy-cyklohex-2-en-1-on (tralkoxydim).

Vhodnými herbicidy ze skupiny benzylcyklohexandionů jsou například:

- 2-(2-chlor-4-methylsulfonylbenzoyl)-cyklohexan-1,3-dion (SC-0051, viz EP-A-137 963),
- 2-(2-nitrobenzoyl)-4,4-dimethyl-cyklohexan-1,3-dion (viz EP-A-274 634) a
- 2-(2-nitro-3-methylsulfonylbenzoyl)-4,4-dimethyl-cyklohexan-1,3-dion (viz WO 91/13548).

Vhodnými herbicidy ze skupiny derivátů kyseliny pyrimidinyloxy-pyrimidinkarboxylové, popřípadě pyrimidinyloxy-benzoové, jsou například:

- benzylester kyseliny 3-(4,6-dimethoxypyrimidin-2-yl)-oxy-pyridin-2-karboxylové (EP-A-249 707),
- methylester kyseliny 3-(4,6-dimethoxypyrimidin-2-yl)-oxy-pyridin-2-karboxylové (EP-A-249 707),
- kyselina 2,6-bis-[(4,6-dimethoxypyrimidin-2-yl)-oxy]-benzoová (EP-A-321 846) a
- (1-ethoxykarbonyloxyethyl)-ester kyseliny 2,6-bis-[(4,6-dimethoxypyrimidin-2-yl)-oxy]-benzoové (EP-A-472 113).

Vhodnými herbicidy ze skupiny triazolopyrimidinsulfonamidů jsou například:

- N-(2,6-difluorfenyl)-7-methyl-1,2,4-triazolo-(1,5-c)-pyrimidin-2-sulfonamid (flumetulam),
- N-(2,6-dichlor-3-methylfenyl)-5,7-dimethoxy-1,2,4-triazolo-(1,5-c)-pyrimidin-2-sulfonamid,

- N-(2,6-difluorfenyl)-7-fluor-5-methoxy-1,2,4-triazolo-(1,5-c)-pyrimidin-2-sulfonamid,
- N-(2,6-dichlor-3-methylfenyl)-7-chlor-5-methoxy-1,2,4-triazolo-(1,5-c)-pyrimidin-2-sulfonamid a
- N-(2-chlor-6-methoxykarbonyl)-5,7-dimethyl-1,2,4-triazolo-(1,5-c)-pyrimidin-2-sulfonamid (viz například EP-A-343 752, US 4 988 812).

Vhodným herbicidem ze skupiny esterů kyseliny S-(N-aryl-N-alkyl-karbamoylmethyl)-dithiofosforečné je například:

- S-[N-(4-chlorfenyl)-N-izopropyl-karbamoylmethyl]-O,O-dimethyl-dithiofosfát (Anilofos).

Výše uvedené herbicidy jsou pro odborníky známé a jsou zpravidla popsány v „The Pesticide Manual“, The British Crop Protection and the Royal Soc. of Chemistry, 10th edition, 1994, nebo v „Agricultural Chemicals Book II – Herbicides–“, W. T. Thompson, Thompson Publications, Fresno CA, USA, 1990, nebo v „Farm Chemicals Handbook‘ 90“, Meister Publishing Company, Willoughby OH, USA 1990.

Herbicidní účinné látky a uvažované safenery je možno aplikovat společně (jako hotové přípravky nebo v tankových směsích) nebo v libovolném pořadí po sobě. Hmotnostní poměr safener: herbicidní účinná látka se může pohybovat v širokém rozmezí, výhodně v rozmezí 1 : 10 až 10 : 1, obzvláště 1 : 10 až 5 : 1. Odpovídající optimální množství herbicidu a safeneru je závislé na typu použitého herbicidu nebo na typu použitého safeneru, jakož i na druhu ošetřovaných rostlin a dají se případ od případu zjistit pomocí odpovídajících předběžných pokusů.

Hlavní oblasti pro použití safenerů jsou především kultury obilí (pšenice, oves, ječmen, žito), rýže, cukrovky, ale také bavlny a sojových bobů, výhodně obilí a kukuřice.

Obzvláštní výhoda safeneru obecného vzorce I podle předloženého vynálezu byla zjištěna při jeho kombinaci s herbicidy ze skupiny sulfonylmočovin. Některé herbicidy této strukturní třídy se speciálně v kulturách obilí a/nebo kukuřice nemohou použít nebo se mohou použít nedostatečně selektivně. Kombinací se safeneru podle předloženého vynálezu se také u těchto herbicidů dosáhne v obilí nebo kukuřici výrazných selektivit.

Safenery obecného vzorce I se mohou vždy podle svých vlastností použít pro předzpracování osiva kulturních rostlin (moření semen) nebo se mohou nanést před setím do brázd, nebo se mohou použít společně s herbicidem před nebo po vzejití rostlin. Zpracování před vzejitím zahrnuje jak ošetření plochy pro pěstování před vysetím, tak také ošetření vyseté plochy, která ještě není porostlá. Výhodné je společné použití s herbicidem. K tomu je možno použít tankových směsí nebo hotových přípravků.

Potřebná aplikační množství safeneru mohou kolísat vždy podle indikace a použitého herbicidu v širokých mezích a jsou zpravidla v rozmezí 0,001 až 5 kg, výhodně 0,005 až 0,5 kg a obzvláště 5 až 100 g účinné látky na hektar.

Způsob ochrany kulturních rostlin před fytotoxickými vedlejšími účinky herbicidů ze skupiny sulfonylmočovin, spočívá v aplikaci účinného množství sloučeniny obecného vzorce I před, po nebo současně s herbicidem, na rostliny, semena rostlin nebo na plochu pro pěstování.

Prostředky pro ochranu rostlin mohou obsahovat účinnou látku obecného vzorce I a obvyklé pomocné formulační prostředky, jakož i herbicidní prostředky, které obsahují účinnou látku obecného vzorce I a herbicid ze skupiny sulfonylmočovin, jakož i pomocné formulační prostředky, obvyklé v oblasti ochrany rostlin.

Sloučeniny obecného vzorce I a jejich kombinace s jednou nebo několika z uvedených herbicidních účinných látek se mohou formulovat na různé typy, vždy podle toho, jaké jsou předem dané biologické a/nebo fyzikálně-chemické parametry. Jako možnosti formulace přichází například v úvahu postřikový prášek (WP), ve vodě rozpustný prášek (SP), ve vodě rozpustné koncentráty (SL), emulgovatelné koncentráty (EC), emulze (EW), jako jsou emulze typu voda v oleji a olej ve vodě, stříkatelné roztoky nebo suspenze, suspoemulze, suspenzní koncentráty (SC), disperze na bázi oleje nebo vody, s olejem mísitelné roztoky (OL), kapslové suspenze (CS), popraše (DP), mořidla, granuláty pro rozmetací a půdní aplikaci, granuláty (GR) ve formě mikrogranulátů, postřikových granulátů, potahovaných granulátů a adsorpčních granulátů, granuláty pro aplikaci na půdu nebo pro poprašování, ve vodě dispergovatelné granuláty (WG), ve vodě rozpustné granuláty (SG), ULW-formulace, mikrokapsle a vosky.

Tyto jednotlivé typy formulací jsou v principu známé a jsou například popsány v publikacích Winnacker-Küchler, „Chemische Technologie“, díl 7, C. Hauser Verlag München, 4. vyd. 1986; Wade van Valkenburg, „Pesticide Formulations“, Marcel Dekker, N.Y., 1973; K. Martens, „Spray Drying“ Handbook, 3. ed. 1979, G. Goodwin Ltd. London.

Nutné pomocné prostředky pro uvedené formulace, jako jsou inertní materiály, tenzidy, rozpouštědla a další přísady, jsou rovněž známé a jsou popsány například v publikacích: Watkiuns, „Handbook of Insecticide Dust Diluent and Carriers“, 2. ed., Darland Books, Caldwell N. J.; H.v.Olphen, „Introduction to Clay Colloid Chemistry“, 2. ed., J. Wiley & Sons, N.Y.; C. Marsden, „Solvents Guide“, 2. ed., Interscience, N.Y. 1963; McCutcheon's „Detergents and Emulsifiers Annual“, MC Publ. Corp., Ridgewood N. J.; Sisley and Wood, „Encyclopedia of Surface Active Agents“, Chem. Publ. Co. Inc., N.Y. 1964; Schönfeldt, „Grenzflächenaktive Äthylenoxidaddukte“, Wiss. Verlagsgesellschaft, Stuttgart 1976; Winnacker-Küchler, „Chemische Technologie“, díl 7, C. Hauser Verlag München, 4. vyd. 1986.

Na bázi těchto formulací se dají vyrobit také kombinace s jinými pesticidně účinnými látkami, hnojivy a/nebo růstovými regulátory, například ve formě hotových přípravků nebo tankových směsí.

Postřikové prášky jsou ve vodě rovnoměrně dispergovatelné preparáty, které vedle účinné látky obsahují kromě zředovací nebo inertní látky ještě tenzidy ionogenního a/nebo neionogenního typu (smáčedla, dispergační činidla), například polyoxyethylované alkylfenoly, polyoxyethylované mastné alkoholy, polyoxyethylované mastné aminy, polyglykolethersulfáty mastných alkoholů, alkansulfonáty, alkylbensensulfonáty, sodné soli ligninových kyselin, sodná sůl 2,2'-dinaftylmethan-6,6'-disulfonové kyseliny, sodná sůl kyseliny dibutyl-naftalen-sulfonové nebo také sodná sůl kyseliny oleylmethyltaurové.

Emulgovatelné koncentráty se vyrobí rozpuštěním účinné látky v organickém rozpouštědle, jako je například butylalkohol, cyklohexanon, dimethylformamid, xylen, nebo také výševroucí aromáty nebo uhlovodíky nebo směsi organických rozpouštědel za přídavku jednoho nebo více tenzidů ionogenního a/nebo neionogenního typu (emulgátory). Jako emulgátory se mohou například použít vápenaté soli alkylarylsulfonových kyselin, jako je dodecylbensensulfonát vápenatý, nebo neionogenní emulgátory, jako jsou polyglykolestery mastných kyselin, alkylaryl-polyglykolethery, polyglykolethery mastných alkoholů, kondenzační produkty propylenoxidu a ethylenoxidu, alkylpolyethery, sorbitanestery, jako jsou například estery mastných kyselin a sorbitolu, nebo polyoxyethylensorbitanestery, jako estery mastných kyselin a polyoxyethylensorbitolu.

Popraše se získají rozemletím účinné látky s jemně rozmělněnými pevnými látkami, jako je například mastek, přírodní zeminy, jako je kaolin, bentonit nebo pyroflyllit, nebo také křemelina.

Suspenzní koncentráty mohou být na bázi vody nebo oleje. Mohou se například vyrobit mokřím mletím pomocí na trhu obvyklých perlových mlýnů a popřípadě za přídavku tenzidů, které byly například již výše uvedené u jiných typů formulací.

Emulze, například typu olej ve vodě (EW), se dají vyrobit například pomocí míchadel, koloidních mlýnů a/nebo statických míšičů, za použití vodných organických rozpouštědel a popřípadě tenzidů, které byly například již výše uvedené u jiných typů formulací.

5

Granuláty se mohou vyrobit buď rozstříkáváním účinné látky na adsorpce schopný, granulovaný inertní materiál, nebo nanesením koncentráту účinné látky pomocí lepidel, například polyvinyl-alkoholu, polyakrylátu sodného nebo také minerálních olejů, na povrch nosných látek, jako je písek, kaolinit nebo granulovaný inertní materiál. Také se mohou vhodné účinné látky granulovat

10

způsobem obvyklým pro výrobu granulovaných hnojiv, popřípadě ve směsi shnojiv.

Ve vodě dispergovatelné granuláty se zpravidla vyrábějí pomocí obvyklých způsobů, jako je sprejové sušení, granulace ve vířivém loži, talířová granulace, mísení ve vysokorychlostních míšičích a extruze bez pevného inertního materiálu.

15

Výroba různých typů granulátů je například popsána ve „Spray-Drying Handbook“ 3. ed. 1979, G. Goodwin Ltd., London; J. E. Browning, „Agglomeration“, Chemical and Engineering 1967, str. 147 a další; „Perry's Chemical Engineer's Handbook“, 5. ed., McGraw-Hill, New York 1973, str. 8 až 57.

20

Další podrobnosti o formulacích prostředků pro ochranu rostlin jsou popsány například G. C. Klingmanem „Weed Control as a Science“, John Wiley and Sons, Inc., New York, 1961, str. 81 až 96 a J. D. Freyerem a S. A. Evansem „Weed Control Handbook“, 5. ed., Blackwell Scientific Publications, Oxford, 1968, str. 101 až 103.

25

Agrochemické přípravky obsahují zpravidla 0,1 až 99 % hmotnostních, obzvláště 0,1 až 95 % hmotnostních účinné látky obecného vzorce I (safener) nebo směsi účinných látek safener/herbicide a 1 až 99,9 % hmotnostních, obzvláště 5 až 99,8 % hmotnostních, pevných nebo kapalných přísad a 0 až 25 % hmotnostních, obzvláště 0,1 až 25 % hmotnostních tenzidů.

30

V postřikových práscích činí koncentrace účinné látky například asi 10 až 90 % hmotnostních, zbytek do 100 % hmotnostních sestává z obvyklých součástí formulací. U emulgovatelných koncentrátů může koncentrace účinné látky činit asi 1 až 90 % hmotnostních, výhodně 5 až 80 % hmotnostních. Práškovité formulace obsahují 1 až 30 % hmotnostních účinné látky, výhodně většinou 5 až 20 % hmotnostních účinné látky, stříkatelné roztoky obsahují asi 0,05 až 80 % hmotnostních účinné látky, výhodně 2 až 50 % hmotnostních účinné látky. U ve vodě dispergovatelných granulátů závisí obsah účinné látky zčásti na tom, zda se účinná sloučenina vyskytuje v kapalném nebo pevném stavu a jaké se použije granulační pomocné činidlo, plnidlo a podobně. U ve vodě dispergovatelných granulátů je obsah účinné látky například v rozmezí

40

1 až 95 % hmotnostních, výhodně 10 až 80 % hmotnostních.

Vedle uvedeného obsahují formulace účinných látek popřípadě odpovídající obvyklé látky zprostředkující přilnavost, smáčedla, dispergační činidla, emulgátory, penetrační činidla, konzervační prostředky, protimrazové prostředky a rozpouštědla, plnidla, nosiče a barviva, odpěňovadla, látky potlačující odpařování a látky ovlivňující hodnotu pH a viskozity.

45

Pro použití se obchodní formy uvedených přípravků popřípadě obvyklým způsobem zředí, například u postřikových prášků, emulgovatelných koncentrátů, disperzí a ve vodě dispergovatelných granulátů pomocí vody, a potom se aplikují na rostliny, části rostlin, nebo na zemědělsky nebo průmyslově využívané půdy, na kterých rostliny stojí, nebo ze kterých vyrůstají, nebo kde se vyskytují jako setba. Práškovité přípravky, půdní nebo rozprašovací granuláty, jakož i stříkatelné roztoky se před použitím obvykle již neředí dalšími inertními látkami.

50

S vnějšími podmínkami, jako je teplota, vlhkost, typ použitého herbicide, se mimo jiné mění potřebné aplikované množství safeneru.

55

Příklady provedení vynálezu

5 A) Příklady formulací

a) Práškový přípravek se získá tak, že se smísí 10 hmotnostních dílů sloučeniny obecného vzorce I nebo směsi účinných látek z herbicidu a safeneru vzorce I a 90 hmotnostních dílů mastku jako inertní látky a rozmělní se v kladivovém mlýnu.

10

b) Ve vodě lehce dispergovatelný, smáčitelný prášek se získá tak, že se smísí 25 hmotnostních dílů sloučeniny obecného vzorce I nebo směsi účinných látek z herbicidu a safeneru vzorce I, 64 hmotnostních dílů kaolin obsahujícího křemene jako inertní látky, 10 hmotnostních dílů ligninsulfonátu draselného a 1 hmotnostní díl oleylmethyltaurátu sodného jako smáčedla

15

c) Ve vodě dispergovatelný disperzní koncentrát se získá tak, že se smísí 20 hmotnostních dílů sloučeniny obecného vzorce I nebo směsi účinných látek z herbicidu a safeneru vzorce I, se 6 hmotnostními díly alkylfenolpolyglykoetheru (^RTriton X 207), 3 hmotnostní díly izotri-dekanolpolyglykoetheru (8 EO) a 71 hmotnostními díly parafinického minerálního oleje (oblast teploty varu asi 255 °C až přes 277 °C) a tato směs se rozemele v kulovém mlýnu na jemnost pod 5 mikrometrů.

20

d) Emulgovatelný koncentrát se získá z 15 hmotnostních dílů sloučeniny obecného vzorce I nebo směsi účinných látek z herbicidu a safeneru vzorce I, 75 hmotnostních dílů cyklohexanonu jako rozpouštědla a 10 hmotnostních dílů oxethylovaného nonylfenolu jako emulgátoru.

25

e) Ve vodě dispergovatelný granulát se získá tak, že se smísí

75 hmotnostních dílů	sloučeniny obecného vzorce I, nebo směsi účinných látek z herbicidu a safeneru vzorce I,
10 hmotnostních dílů	ligninsulfonátu vápenatého,
5 hmotnostních dílů	natriumlaurylsulfátu,
3 hmotnostní díly	polyvinylalkoholu a
7 hmotnostní díly	kaolinu,

30

tato směs se rozemele v kolíčkovém mlýnu a získaný prášek se granuluje ve vířivém loži za postřikování vodou jako granulační kapalinou.

f) Ve vodě dispergovatelný granulát se získá také tak, že se smísí

35

25 hmotnostních dílů	sloučeniny obecného vzorce I, nebo směsi účinných látek z herbicidu a safeneru vzorce I,
5 hmotnostních dílů	sodné soli kyseliny 2,2'-dinaftylmethan-6,6'-disulfonové,
2 hmotnostní díly	oleylmethyltaurátu sodného,
1 hmotnostní díl	polyvinylalkoholu,
17 hmotnostních dílů	uhličitanu vápenatého a
50 hmotnostních dílů	vody,

homogenizuje se v koloidním mlýnu a předběžně se rozmělní, potom se mele v perlovém mlýnu a takto získaná suspenze se ve sprejové věži rozprašuje pomocí jednolátkové trysky a usuší se.

B. Výrobní příklady

- 5 1. N-[4-(2-methoxybenzoylsulfamoyl)-fenyl]-cyklopentankarboxamid
(příklad 172 z tabulky 1)

1a. 2-methoxy-N-(4-nitrofenylsulfonyl)-benzamid

10 30,0 g (0,15 mol) 4-nitrobenzensulfonamidu se smísí se 30,0 g (0,3 mol) triethylaminu ve 300 ml acetonitrilu a při teplotě 50 °C se smísí se 27,8 g (0,16 mol) o-anisoylchloridu, rozpuštěných ve 20 ml acetonitrilu. Po 3 hodinách při teplotě 50 °C se směs vmíchá do 80 ml ledové vody a vytvořená sraženina se odsaje a usuší. Další produkt se může získat okyselením matečného louhu.

15 Výtěžek: 41,4 g (83 %)

t.t.: 154 až 158 °C.

1b. 2-methoxy-N-(4-aminofenylsulfonyl)-benzamid

20 50,0 g (0,15 mol) 2-methoxy-N-(4-nitrofenylsulfonyl)-benzamid se suspenduje ve směsi 450 ml ethylalkoholu a 750 ml 2n kyseliny chlorovodíkové a suspenze se zahřeje na teplotu 50 °C. Při této teplotě se po částech přidá 97,2 g (1,5 mol) zinkového prášku a míchá se další 2 hodiny. Po ochlazení se reakční směs přefiltruje, filtrát se zahustí na jednu polovinu a ochladí se. Vytvořená sraženina se odsaje a usuší.

25 Výtěžek: 43,6 (96 %)

t.t.: 180 až 182 °C.

30

1c. N-[4-(2-methoxybenzensulfamoyl)fenyl]-cyklopentankarboxamid

35 2,8 g (9 mmol) 2-methoxy-N-(4-aminofenylsulfonyl)-benzamid se suspenduje ve 100 ml dioxanu, při teplotě 0 °C se smísí s 0,72 g (9 mmol) pyridinu a 1,21 g (9 mmol) chloridu kyseliny cyklopentankarboxylové a reakční směs se při této teplotě míchá po dobu 2 hodin. Potom se vlije do vody a vytvořená sraženina se odsaje. Po usušení se získá 2,68 g (73 %) N-[4-(2-methoxybenzensulfamoyl)fenyl]-cyklopentankarboxamidu s teplotou tání 202 až 206 °C.

- 40 2. N-[4-(2-methoxybenzoylsulfamoyl)fenyl]-2,4-dichlorbenzamid
(příklad 215 z tabulky 1)

2a. N-(4-sulfamoylfenyl)-2,4-dichlorbenzamid

45 10 g (60 mmol) sulfanilamidu se suspenduje ve 150 ml dioxanu a smísí se se 4,6 g (60 mmol) pyridinu. Při teplotě 0 °C se potom přidá 12,2 g (60 mmol) 2,4-dichlorbenzoylchloridu a míchá se po dobu dalších 2 hodin při teplotě místnosti. Reakční směs se potom vmíchá do 200 ml vody a vypadlá sraženina se odsaje a usuší.

50 Výtěžek: 16,9 g (85 %)

t.t.: 228 až 232 °C.

2b. N-[4-(2-methoxybenzoylsulfamoyl)fenyl]-2,4-dichlorbenzamid

5 g (15 mmol) N-(4-sulfamoylfenyl)-2,4-dichlorbenzamid se při teplotě 0 °C předloží do 80 ml acetonitrilu a smísí se se 2,93 g (30 mmol) triethylaminu a katalytickým množstvím DMAP (4-dimethylaminopyridin). Potom se přikape 2,47 g (15 mmol) o-anisoylchloridu, rozpuštěných ve 20 ml acetonitrilu, načež se po dvouhodinovém míchání při teplotě místnosti reakční směs vmísí do vody a vytvořená sraženina se odsaje a usuší.

Výtěžek: 4,2 g (60 %)

t.t.: 140 až 146 °C.

3. 2-methoxy-N-[4-(2-methoxybenzoylsulfamoyl)fenyl]-acetamid
(příklad 160 z tabulky 1)

3a. 2-methoxy-N-(4-sulfamoylfenyl)-acetamid

10 g (0,06 mol) sulfanilidu se suspenduje ve 150 ml dioxanu a smísí se se 4,6 g (60 mmol) pyridinu. Při teplotě 0 °C se potom přidá 6,3 g (60 mmol) chloridu kyseliny methoxyoctové a reakční směs se míchá po dobu 2 hodin při teplotě místnosti. Potom se vmíchá do 200 ml vody a vytvořená sraženina se odsaje a usuší.

Výtěžek: 12,9 g (91 %)

t.t.: 200 až 208 °C.

3b. 2-methoxy-N-[4-(2-methoxybenzoylsulfamoyl)fenyl]-acetamid

8 g (33 mmol) 2-methoxy-N-(4-sulfamoylfenyl)-acetamidu se předloží do 160 ml acetonitrilu při teplotě 0 °C a smísí se se 6,63 g (66 mmol) triethylaminu a katalytickým množstvím DMAP. Potom se přidá 5,6 g (33 mmol) při teplotě 0 °C 2-methoxybenzoylchloridu, rozpuštěných ve 20 ml acetonitrilu a reakční směs se míchá po dobu 2 hodin při této teplotě. Po dalších 2 hodinách při teplotě místnosti se směs vlije do vody a vytvořená sraženina se odsaje a usuší.

Výtěžek: 10,5 g (84 %)

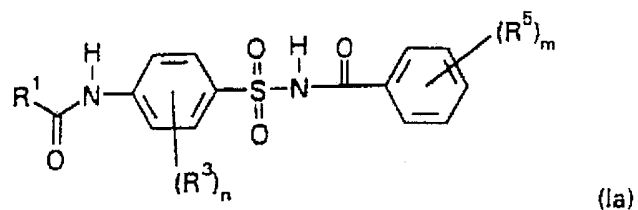
t.t.: 170 až 172 °C.

V následujících tabulkách je příkladně uvedena řada sloučenin obecného vzorce I, které se mohou získat analogickými způsoby, jako je uvedeno v příkladech 1 až 3 a dále uvedenými metodami. V tabulkách značí:

Me	methyl
Et	ethyl
n-Pr	n-propyl
i-Pr	izopropyl
c-Pr	cyklopropyl
n-, i-, t- nebo s-Bu	n-, izo-, terc.- nebo sek.-butyl
c-Bu	cyklobutyl
Schmp.	teplota tání ve °C.

Indexová čísla nejsou z důvodu místa uváděna dole, popřípadě nahoře; tak značí například OCF₃ skupinu trifluormethoxy (OCF₃) a podobně a R¹ značí zbytek R¹ a podobně.

T a b u l k a 1 (sloučeniny vzorce Ia)



slouč. č.	R ₁	R ₃	R ₅	t. t. [°C]
1	H	H	2-CF ₃	
2	H	H	2-Cl	
3	H	H	2-OCF ₃	
4	H	H	2-OEt	
5	H	H	2-OMe	181
6	H	H	2-OMe, 4-Cl	
7	H	H	2-OMe, 4-Me	
8	H	H	2-OMe, 5-Cl	202
9	H	H	2-OMe, 5-Me	
10	H	H	3,6-Di-Cl, 2-OMe	
11	OMe	H	2,4-Di-OMe	
12	OMe	H	2-CF ₃	
13	OMe	H	2-OCF ₃	
14	OMe	H	2-OEt	
15	OMe	H	2-OMe	211
16	OMe	H	2-OMe, 4-Cl	
17	OMe	H	2-OMe, 4-Me	
18	OMe	H	2-OMe, 4-SMe	
19	OMe	H	2-OMe, 5-Cl	
20	OMe	H	2-OMe, 5-Me	
21	OMe	H	3,6-Di-Cl, 2-OMe	
22	OEt	H	2-OCF ₃	
23	OEt	H	2-OEt	
24	OEt	H	2-OMe	170
25	OEt	H	2-OMe, 4-Cl	
26	OEt	H	2-OMe, 4-Me	
27	OEt	H	2-OMe, 5-Cl	
28	OEt	H	2-OMe, 5-Me	
29	OEt	H	3,6-Di-Cl, 2-OMe	
30	O-C ₆ H ₅	H	2-OMe	160
31	O-n-Pr	H	2-OMe	
32	O-i-Pr	H	2-OMe	

slouč. č.	R1	R3	R5	t. t. [°C]
33	O-CH=CH ₂	H	2-OMe	
34	SMe	H	2-OCF ₃	
35	SMe	H	2-OEt	
36	SMe	H	2-OMe	
37	SMe	H	2-OMe, 4-Cl	
38	SMe	H	2-OMe, 4-Me	
39	SMe	H	2-OMe, 4-SMe	
40	SMe	H	2-OMe, 5-Cl	
41	SMe	H	2-OMe, 5-Me	
42	SMe	H	3,6-Di-Cl, 2-OMe	
43	SEt	H	2-OMe	174
44	SEt	H	2-OMe, 4-Cl	
45	SEt	H	2-OMe, 4-Me	
46	SEt	H	2-OMe, 5-Cl	
47	SEt	H	2-OMe, 5-Me	
48	S-n-Pr	H	2-OMe	
49	S-i-Pr	H	2-OMe	
50	C ₆ H ₅	H	2-OMe	
51	Me	H	2,4-Di-OMe	
52	Me	H	2-CF ₃	199
53	Me	H	2-Cl	244
54	Me	H	2-OCF ₃	
55	Me	H	2-OEt	222
56	Me	H	2-OMe	228
57	Me	H	2-OMe, 4-Cl	131
58	Me	H	2-OMe, 4-Me	
59	Me	H	2-OMe, 4-SMe	
60	Me	H	2-OMe, 5-Cl	225
61	Me	H	2-OMe, 5-Me	
62	Me	H	3,4-Di-Me	
63	Me	H	3,6-Di-Cl, 2-OMe	
64	Et	H	2,4-Di-OMe	
65	Et	H	2-CF ₃	
66	Et	H	2-Cl	245
67	Et	H	2-OCF ₃	
68	Et	H	2-OEt	
69	Et	H	2-OMe	212
70	Et	H	2-OMe, 4-Cl	
71	Et	H	2-OMe, 4-Me	
72	Et	H	2-OMe, 4-SMe	
73	Et	H	2-OMe, 5-Cl	
74	Et	H	2-OMe, 5-Me	
75	Et	H	3,6-Di-Cl, 2-OMe	
76	i-Pr	H	2,4-Di-OMe	

slouč. č.	R1	R3	R5	t. t. [°C]
77	i-Pr	H	2-CF3	
78	i-Pr	H	2-Cl	240
79	i-Pr	H	2-OCF3	
80	i-Pr	H	2-OEt	
81	i-Pr	H	2-OMe	224
82	i-Pr	H	2-OMe, 4-Cl	
83	i-Pr	H	2-OMe, 4-Me	
84	i-Pr	H	2-OMe, 5-Cl	
85	i-Pr	H	2-OMe, 5-Me	
86	i-Pr	H	3,6-Di-Cl, 2-OMe	
87	n-Pr	H	2-CF3	
88	n-Pr	H	2-Cl	
89	n-Pr	H	2-OCF3	
90	n-Pr	H	2-OEt	
91	n-Pr	H	2-OMe	
92	n-Pr	H	2-OMe, 4-Cl	
93	n-Pr	H	2-OMe, 4-Me	
94	n-Pr	H	2-OMe, 5-Cl	
95	n-Pr	H	2-OMe, 5-Me	
96	n-Pr	H	3,6-Di-Cl, 2-OMe	
97	c-Pr	H	2,4-Di-OMe	213
98	c-Pr	H	2-CF3	262
99	c-Pr	H	2-Cl	260
100	c-Pr	H	2-OCF3	229
101	c-Pr	H	2-OEt	125
102	c-Pr	H	2-OMe	212
103	c-Pr	H	2-OMe, 4-Cl	
104	c-Pr	H	2-OMe, 4-Me	
105	c-Pr	H	2-OMe, 4-SMe	227
106	c-Pr	H	2-OMe, 5-Cl	246
107	c-Pr	H	2-OMe, 5-Me	
108	c-Pr	H	3,6-Di-Cl, 2-OMe	
109	i-Bu	H	2-CF3	
110	i-Bu	H	2-Cl	
111	i-Bu	H	2-OCF3	
112	i-Bu	H	2-OEt	
113	i-Bu	H	2-OMe	196
114	i-Bu	H	2-OMe, 4-Cl	
115	i-Bu	H	2-OMe, 4-Me	
116	i-Bu	H	2-OMe, 5-Cl	
117	i-Bu	H	2-OMe, 5-Me	
118	i-Bu	H	3,6-Di-Cl, 2-OMe	
119	n-Bu	H	2-CF3	
120	n-Bu	H	2-Cl	

slouč. č.	R1	R3	R5	t. t. [°C]
121	n-Bu	H	2-OCF ₃	
122	n-Bu	H	2-OEt	
123	n-Bu	H	2-OMe	
124	n-Bu	H	2-OMe, 4-Cl	
125	n-Bu	H	2-OMe, 4-Me	
126	n-Bu	H	2-OMe, 5-Cl	
127	n-Bu	H	2-OMe, 5-Me	
128	n-Bu	H	3,6-Di-Cl, 2-OMe	
129	c-Bu	H	2,4-Di-OMe	
130	c-Bu	H	2-CF ₃	248
131	c-Bu	H	2-Cl	234
132	c-Bu	H	2-OCF ₃	249
133	c-Bu	H	2-OEt	202
134	c-Bu	H	2-OMe	210
135	c-Bu	H	2-OMe, 4-Cl	195
136	c-Bu	H	2-OMe, 4-Me	
137	c-Bu	H	2-OMe, 4-SMe	219
138	c-Bu	H	2-OMe, 5-Cl	221
139	c-Bu	H	2-OMe, 5-Me	206
140	c-Bu	H	3,6-Di-Cl, 2-OMe	
141	t-Bu	H	2-CF ₃	
142	t-Bu	H	2-Cl	248
143	t-Bu	H	2-OCF ₃	
144	t-Bu	H	2-OEt	226
145	t-Bu	H	2-OMe	235
146	t-Bu	H	2-OMe, 4-Cl	119
147	t-Bu	H	2-OMe, 4-Me	
148	t-Bu	H	2-OMe, 5-Cl	190
149	t-Bu	H	2-OMe, 5-Me	183
150	CHCH ₃ -CH ₂ -CH ₃	H	2-OMe	
151	CHCH ₃ -CH ₂ -CH ₃	H	2-OMe, 4-Cl	
152	CHCH ₃ -CH ₂ -CH ₃	H	2-OMe, 4-Me	
153	CHCH ₃ -CH ₂ -CH ₃	H	2-OMe, 5-Cl	
154	CHCH ₃ -CH ₂ -CH ₃	H	2-OMe, 5-Me	
155	CH ₂ OMe	H	2,4-Di-F	195
156	CH ₂ OMe	H	2-CF ₃	169
157	CH ₂ OMe	H	2-Cl	195
158	CH ₂ OMe	H	2-OCF ₃	185
159	CH ₂ OMe	H	2-OEt	165
160	CH ₂ OMe	H	2-OMe	172
161	CH ₂ OMe	H	2-OMe, 4-Cl	184
162	CH ₂ OMe	H	2-OMe, 4-Me	
163	CH ₂ OMe	H	2-OMe, 5-Cl	175
164	CH ₂ OMe	H	2-OMe, 5-Me	

slouč. č.	R1	R3	R5	t. t. [°C]
165	CH ₂ OMe	H	3,4-Di-Me	215
166	CH ₂ OMe	H	3,6-Di-Cl, 2-OMe	
167	CH ₂ OMe	H	4-F	238
168	CH ₂ OMe	H	4-Me	244
169	CH ₂ OMe	H	4-OMe	228
170	c-Pentyl	H	2-CF ₃	
171	c-Pentyl	H	2-OCF ₃	
172	c-Pentyl	H	2-OMe	206
173	c-Pentyl	H	2-OMe, 4-Cl	
174	c-Pentyl	H	2-OMe, 4-Me	
175	c-Pentyl	H	3,6-Di-Cl, 2-OMe	
176	c-Hexyl	H	2-OMe	290
177	n-Octyl	H	2-OMe	
178	CH ₂ Cl	H	2-OMe	221
179	CHCl ₂	H	2-OMe	255
180	CHCl ₂	H	2-OMe, 4-Cl	
181	CH ₂ OH	H	2-OMe	188
182	CF ₃	H	2-CF ₃	
183	CF ₃	H	2-OCF ₃	
184	CF ₃	H	2-OMe	232
185	CCl ₃	H	2-CF ₃	
186	CCl ₃	H	2-OCF ₃	
187	CCl ₃	H	2-OMe	228
188	CH ₂ -CH ₂ Cl	H	2-CF ₃	
189	CH ₂ -CH ₂ Cl	H	2-OMe	210
190	CHCl-CH ₃	H	2-OMe	229
191	CCl ₂ -CCl ₃	H	2-OMe	
192	CH(C ₂ H ₅) ₂	H	2-CF ₃	
193	CH(C ₂ H ₅) ₂	H	2-Cl	
194	CH(C ₂ H ₅) ₂	H	2-OMe	165
195	CH(C ₂ H ₅) ₂	H	2-OMe, 5-Cl	
196	(CH ₂) ₆ -CH ₃	H	2-OMe	158
197	(CH ₂) ₆ -CH ₃	H	2-OMe, 5-Cl	
198	CHCH ₃ -(CH ₂) ₄ -CH ₃	H	2-CF ₃	
199	CHCH ₃ -(CH ₂) ₄ -CH ₃	H	2-OMe	
200	CHCH ₃ -(CH ₂) ₄ -CH ₃	H	2-OMe, 5-Cl	
201	CH ₂ -NH-i-Pr	H	2-OMe	215
202	CH ₂ -CH ₂ -COOMe	H	2-OMe	162
203	CH ₂ -COOCH ₃	H	2-OMe	173
204	CH=CH ₂	H	2-OMe	185
205	CH=CH-CH ₃	H	2-OMe	
206	CH=C(CH ₃) ₂	H	2-OCF ₃	
207	CH=C(CH ₃) ₂	H	2-OMe	193
208	CCl=CCl ₂	H	2-OMe	

slouč. č.	R1	R3	R5	t. t. [°C]
209	CH ₂ -O-C ₆ H ₅	H	2-OMe	146
210	CH ₂ -O-(2,4-Di-Cl-C ₆ H ₃)	H	2-OMe	216
211	CHCH ₃ -(4-Cl-C ₆ H ₄)	H	2-OMe	202
212	CH ₂ -(4-F-C ₆ H ₄)	H	2-OMe	174
213	CH ₂ -(4-Cl-C ₆ H ₄)	H	2-OMe	216
214	CH ₂ -(2,4-Di-Cl-C ₆ H ₃)	H	2-OMe	
215	2,4-Di-Cl-C ₆ H ₃	H	2-OMe	146
216	3,4-Di-Cl-C ₆ H ₃	H	2-OMe	
217	2,4-Di-F-C ₆ H ₃	H	2-OMe	221
218	2-F-C ₆ H ₄	H	2-OMe	210
219	4-F-C ₆ H ₄	H	2-OMe	228
220	2-H ₃ CO-C ₆ H ₄	H	2-OMe	179
221	2-Thienyl	H	2,4-Di-OMe	
222	2-Thienyl	H	2-CF ₃	
223	2-Thienyl	H	2-Cl	
224	2-Thienyl	H	2-OCF ₃	
225	2-Thienyl	H	2-OEt	
226	2-Thienyl	H	2-OMe	225
227	2-Thienyl	H	2-OMe, 4-Cl	
228	2-Thienyl	H	2-OMe, 4-Me	
229	2-Thienyl	H	2-OMe, 5-Cl	
230	2-Thienyl	H	3,6-Di-Cl, 2-OMe	
231	2-Furanyl	H	2,4-Di-OMe	
232	2-Furanyl	H	2-CF ₃	233
233	2-Furanyl	H	2-Cl	258
234	2-Furanyl	H	2-OCF ₃	
235	2-Furanyl	H	2-OEt	
236	2-Furanyl	H	2-OMe	195
237	2-Furanyl	H	2-OMe, 4-Cl	
238	2-Furanyl	H	2-OMe, 4-Me	
239	2-Furanyl	H	2-OMe, 5-Cl	
240	2-Furanyl	H	3,6-Di-Cl, 2-OMe	
241	3-Furanyl	H	2-CF ₃	
242	3-Furanyl	H	2-Cl	
243	3-Furanyl	H	2-OCF ₃	
244	3-Furanyl	H	2-OEt	
245	3-Furanyl	H	2-OMe	
246	3-Furanyl	H	2-OMe, 4-Cl	
247	3-Furanyl	H	2-OMe, 4-Me	
248	3-Furanyl	H	2-OMe, 5-Cl	
249	3-Furanyl	H	3,6-Di-Cl, 2-OMe	
250	5-CH ₃ -3-Furanyl	H	2-OMe	
251	2-CH ₃ -3-Furanyl	H	2-OMe	
252	2,5-Di-CH ₃ -3-Furanyl	H	2-OMe	

slouč. č.	R1	R3	R5	t. t. [°C]
253	CH(C6H5)2	H	2-OMe	225
254	CH2-OMe	H	2,4-Di-OMe	
255	CH2-OMe	H	2-OMe, 4-SMe	
256	CHC-C2H5	H	2-OMe	
257	n-C5H11	H	2-OMe, 5-Cl	
258	n-C7H15	H	2-OMe, 5-Cl	
259	CH2-O-(4-Me-C6H4)	H	2-OMe, 5-Cl	
260	CH2-O-CH2-C6H5	H	2-OMe, 5-Cl	
261	3,4-Di-Cl-C6H3	H	2-OMe, 5-Cl	
262	4-F3CO-C6H4	H	2-OMe, 5-Cl	
263	3-Cl-C6H4	H	2-OMe, 5-Cl	
264	CH2Cl	H	2-OMe, 5-Cl	
265	n-C7H15	H	2-OMe, 4-Me	
266	CH2OMe	H	2-OMe, 3-Me	
267	n-Bu	H	2-OMe, 3-Me	
268	n-C7H15	H	2-OMe, 5-Me	
269	n-C5H11	H	2-OMe, 4-Me	
270	n-C5H11	H	2-OMe, 3-Me	
271	c-Pr	H	2-OMe, 3-Me	
272	CH2-C6H5	H	2-OMe, 3-Me	
273	n-C7H15	H	2-OMe, 3-Me	
274	CH(C2H5)OC6H5	H	2-OMe, 5-Cl	
275	CH(CH3)OC6H5	H	2-OMe, 5-Cl	
276	CH(C2H5)C4H9	H	2-OMe, 5-Cl	
277	4-F3C-C6H4	H	2-OMe, 5-Cl	
278	2-F-C6H4	H	2-OMe, 5-Cl	
279	CH2-C6H5	H	2-OMe, 4-Me	
280	CH2-O-(4-Me-C6H4)	H	2-OMe, 4-Me	
281	CH2-O-(4-Me-C6H4)	H	2-OMe, 5-Me	
282	CH2-O-(4-Me-C6H4)	H	2-OMe, 3-Me	
283	4-F-C6H4	H	2-OMe, 5-Cl	
284	4-Br-C6H4	H	2-OMe, 5-Cl	
285	C6H5	H	2-OMe, 5-Cl	
286	C17H35	H	2-OMe, 5-Cl	
287	CH(i-Pr)C6H5	H	2-OMe, 5-Cl	
288	C15H31	H	2-OMe, 5-Cl	
289	2-Cl-C6H4	H	2-OMe, 5-Cl	
290	3,5-Di-Cl-C6H3	H	2-OMe, 5-Cl	
291	2-Br-C6H4	H	2-OMe, 5-Cl	
292	2,6-Di-F-C6H3	H	2-OMe, 5-Cl	
293	2,4,5-Tri-F-C6H2	H	2-OMe, 5-Cl	
294	4-Me-C6H4	H	2-OMe, 5-Cl	
295	2,4-Di-F-C6H3	H	2-OMe, 5-Cl	
296	C15H31	H	2-OMe, 5-Me	

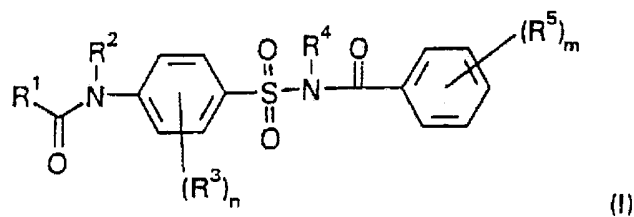
slouč. č.	R1	R3	R5	t. t. [°C]
297	C17H35	H	2-OMe, 4-Me	
298	C17H35	H	2-OMe, 5-Me	
299	C17H35	H	2-OMe, 3-Me	
300	C15H31	H	2-OMe, 3-Me	
301	n-Bu	H	2,6-Di-OMe	
302	c-Bu	H	2,6-Di-OMe	
303	H	H	2,6-Di-OMe	
304	c-Pr	H	2,6-Di-OMe	
305	OMe	H	2-OMe, 3-Me	
306	OMe	H	2,6-Di-OMe	
307	Me	H	2-OMe, 3-Me	
308	Me	H	2,6-Di-OMe	
309	Et	H	2,6-Di-OMe	
310	t-Bu	H	2,6-Di-OMe	
311	t-Bu	H	2-OMe, 3-Me	
312	c-Bu	H	4-CCCH ₂ -O-CH ₂ -PO(OEt) ₂	
313	c-Pr	H	4-CCCH ₂ -O-CH ₂ -PO(OEt) ₂	
314	2-Me-c-Pr	H	2-OMe	220
315	c-Bu	3,5-Di-Cl	2-OMe	
316	c-Bu	2,5-Di-OMe	2-OMe	
317	c-Bu	3-OMe	2-OMe	164
318	c-Pr	3,5-Di-Cl	2-OMe, 4-SMe	
319	c-Pr	3,5-Di-Cl	2-CF ₃	
320	c-Pr	3,5-Di-Cl	2-OCF ₃	
321	c-Pr	3,5-Di-Cl	2-OMe, 4-Cl	
322	CH ₂ -OMe	3,5-Di-Cl	2-OMe, 4-SMe	
323	CH ₂ -OMe	3,5-Di-Cl	2-CF ₃	
324	CH ₂ -OMe	3,5-Di-Cl	2-OCF ₃	
325	CH ₂ -OMe	3,5-Di-Cl	2-OMe, 4-Cl	
326	c-Bu	3,5-Di-Cl	4-CCCH ₂ -O-CH ₂ -PO(OEt) ₂	
327	c-Pr	3,5-Di-Cl	4-CCCH ₂ -O-CH ₂ -PO(OEt) ₂	
328	CH ₂ -OMe	3-OMe	2-OMe, 5-Cl	129
329	CH ₂ -OMe	2,5-Di-OMe	2-OMe	176
330	CH ₂ -OMe	3-OMe	2-OMe	
331	c-Pr	3-OMe	2-OMe	218
332	CH ₂ OMe	3-OMe	2-OMe	143
333	OMe	3-OMe	2-OMe	
334	t-Bu	3-OMe	2-OMe	
335	Me	3,5-Di-Cl	2-OMe	
336	CH ₂ -OMe	3,5-Di-Cl	2-OMe	192
337	c-Pr	H	2,5-Di-OMe	214
338	c-Bu	H	2,5-Di-OMe	190
339	c-Pr	2,5-Di-OMe	2-OMe	228
340	c-Bu	2,5-Di-OMe	2-OMe	192

slouč. č.	R1	R3	R5	t. t. [°C]
341	2-Furanyl	2,5-Di-OMe	2-OMe	208
342	Me	3-OMe	2-OMe	200
343	2-Furanyl	3-OMe	2-OMe	164
344	c-Pr	2,5-Di-OMe	2-OMe, 5-Cl	205
345	c-Bu	2,5-Di-OMe	2-OMe, 5-Cl	204
346	2-Furanyl	2,5-Di-OMe	2-OMe, 5-Cl	246
347	c-Pr	3-OMe	2-OMe, 5-Cl	193
348	c-Bu	3-OMe	2-OMe, 5-Cl	158
349	Me	3-OMe	2-OMe, 5-Cl	204
350	2-Furanyl	3-OMe	2-OMe, 5-Cl	182
351	c-Pr	H	2,3-Di-OMe	215
352	c-Bu	H	2,3-Di-OMe	199
353	2-Furanyl	H	2,3-Di-OMe	238
354	CH ₂ -OMe	H	2,3-Di-OMe	156
355	Me	H	2,3-Di-OMe	228
356	t-Bu	H	2,3-Di-OMe	234
357	t-Bu	H	2-Me	268
358	Me	H	3-Cl	245
359	Me	H	2-Me	246
360	Me	H	3-Me	218
361	Me	H	2,4,5-Tri-OMe	260
362	Me	H	2,5-Di-OMe	200
363	Me	H	2,5-Di-Cl	277
364	Me	H	-	260
365	Me	H	2-F	137
366	Me	H	2-Br	254
367	Me	H	2-I	274
368	Me	H	2,3-Di-Cl	280
369	Me	H	2,4-Di-Me	270
370	Me	H	2,4-Di-Cl	252
371	Me	H	2-OH, 5-Cl	264
372	Me	H	2-OH, 3-Me	266
373	Me	H	2-SMe	255
374	Me	H	2,3-Di-Me	267
375	Me	H	2,5-Di-Me	269
376	Me	H	2-COOMe	247
377	Me	H	2-OC ₆ H ₅	185
378	Me	H	2,3,4-Tri-OMe	204
379	i-Pr	H	2-Me	218
380	i-Pr	H	2,4-Di-Me	137
381	i-Pr	H	2,3-Di-OMe	206
382	i-Pr	H	2,4-Di-Cl	220
383	i-Pr	H	2-OH, 5-Cl	259
384	i-Pr	H	2-OH, 3-Me	242
385	i-Pr	H	2-SMe	225
386	i-Pr	H	2,3-Di-Me	233
387	i-Pr	H	2,5-Di-Me	242

slouč. č.	R1	R3	R5	t. t. [°C]
388	i-Pr	H	2-COOMe	201
389	i-Pr	H	2-OC6H5	203
390	i-Pr	H	2,3,4-Tri-OMe	207
391	H	H	2,5-Di-OMe	194
392	H	H	2,3-Di-OMe	200
393	Et	H	2-Me	231
394	Et	H	2,4-Di-Me	236
395	Et	H	2,3-Di-OMe	195
396	Et	H	2,4-Di-Cl	218
397	Et	H	2-OH, 5-Cl	267
398	Et	H	2-OH, 3-Me	249
399	Et	H	2-SMe	202
400	Et	H	2,3-Di-Me	231
401	Et	H	2,5-Di-Me	241
402	Et	H	2-COOMe	253
403	Et	H	2-OC6H5	202
404	Et	H	2,3,4-Tri-OMe	190
405	CH2OMe	H	2-Me	178
406	CH2OMe	H	3-Cl	204
407	CH2OMe	H	3-Me	214
408	CH2OMe	H	2,4,5-Tri-OMe	168
409	CH2OMe	H	2,5-Di-CF3	222
410	CH2OMe	H	2-OMe, 5-Br	181
411	CH2OMe	H	2,5-Di-Cl	213
412	CH2OMe	H	-	200
413	CH2OMe	H	2-F	205
414	CH2OMe	H	2-Br	198
415	CH2OMe	H	2-I	166
416	CH2OMe	H	2,3-Di-Cl	217
417	CH2OMe	H	2,5-Di-OMe	141
418	CH2OMe	H	2,4-Di-Me	171
419	CH2OMe	H	2-NHMe	216
420	CH2OMe	H	2,4-Di-Cl	194
421	CH2OMe	H	2-OH, 5-Cl	253
422	CH2OMe	H	2-OH, 3-Me	205
423	CH2OMe	H	2-SMe	181
424	CH2OMe	H	2,3-Di-Me	197
425	CH2OMe	H	2,5-Di-Me	190
426	CH2OMe	H	2-COOMe	184
427	CH2OMe	H	2-OC6H5	144
428	CH2OMe	H	2,3,4-Tri-OMe	150
429	CH(i-Pr)-C6H5	H	2-OMe	125
430	c-Pr	H	3-Cl	275
431	c-Pr	H	2-Me	254
432	c-Pr	H	3-Me	245
433	c-Pr	H	2,4,5-Tri-OMe	110
434	c-Pr	H	2,5-Di-CF3	275
435	c-Pr	H	2-OMe, 5-Br	241
436	c-Pr	H	2,5-Di-Cl	225
437	c-Pr	H	-	257

slouč. č.	R1	R3	R5	t. t. [°C]
438	c-Pr	H	2-F	225
439	c-Pr	H	2-Br	269
440	c-Pr	H	2-I	269
441	c-Pr	H	2,3-Di-Cl	251
442	c-Pr	H	2-OH	278
443	c-Pr	H	2,4-Di-Me	156
444	c-Pr	H	2-NO ₂	289
445	c-Pr	H	2-NHMe	222
446	c-Pr	H	2,4-Di-Cl	220
447	c-Pr	H	2-OH, 5-Cl	276
448	c-Pr	H	2-OH, 3-Me	274
449	c-Pr	H	2-SMe	206
450	c-Pr	H	2,3-Di-Me	250
451	c-Pr	H	2,5-Di-Me	226
452	c-Pr	H	2-COOMe	244
453	c-Pr	H	2-OC ₆ H ₅	210
454	c-Pr	H	2,3,4-Tri-OMe	214
455	c-Bu	H	3-Cl	
456	c-Bu	H	2-Me	258
457	c-Bu	H	3-Me	218
458	c-Bu	H	2,4,5-Tri-OMe	207
459	c-Bu	H	2,5-Di-Cl	268
460	c-Bu	H	2,3-Di-Cl	253
461	c-Bu	H	2,4-Di-Me	196
462	2-Furanyl	H	3-Me	254
463	2-Furanyl	H	2-Me	252
464	2-Furanyl	H	2,4,5-Tri-OMe	211
465	2-Furanyl	H	2,5-Di-OMe	189
466	2-Furanyl	H	2,5-Di-Cl	238
467	2-Furanyl	H	2,3-Di-Cl	272
468	2-Furanyl	H	2,4-Di-Me	236

T a b u l k a 2 (sloučeniny vzorce I)



slouč. č.	R1	R2	R3	R4	R5	t. t. [°C]
2-1	c-Bu	Me	H	H	2-OMe	
2-2	c-Pr	Me	H	H	2-OMe	
2-3	CH2-OMe	Me	H	H	2-OMe	
2-4	Me	Me	H	H	2-OMe	
2-5	c-Bu	H	H	Me	2-OMe	
2-6	c-Pr	H	H	Me	2-OMe	
2-7	CH2-OMe	H	H	Me	2-OMe	
2-8	Me	H	H	Me	2-OMe	
2-9	c-Bu	H	H	Na	2-OMe	
2-10	c-Pr	H	H	Na	2-OMe	240
2-11	CH2-OMe	H	H	Na	2-OMe	
2-12	Me	H	H	Na	2-OMe	
2-13	t-Bu	H	H	Na	2-OMe	209
2-14	c-Bu	H	H	Na	2-OMe, 5-Cl	
2-15	c-Pr	H	H	Na	2-OMe, 5-Cl	234
2-16	CH2-OMe	H	H	Na	2-OMe, 5-Cl	
2-17	Me	H	H	Na	2-OMe, 5-Cl	
2-18	t-But	H	H	Na	2-OMe, 5-Cl	
2-19	c-Pr	H	2,5-Di-OMe	Na	2-OMe	200
2-20	CH ₂ -CH ₂ -CH ₂		H	H	2-OMe	176
2-21	CH ₂ -CH ₂ -CH ₂		H	H	2-Cl	227
2-22	CH ₂ -CH ₂ -CH ₂		H	H	2-OMe, 5-Me	204
2-23	CH ₂ -CH ₂ -CH ₂		H	H	2,5-Di-Cl	215
2-24	CH ₂ -CH ₂ -CH ₂		H	H	2-Me	175

C. Biologické příklady

5 1. Bonitace škodlivého účinku

Škodlivý účinek na rostliny se vyhodnocuje opticky ve srovnání s kontrolními rostlinami ve škále 0 až 100 %:

- 10 0 % žádný viditelný účinek ve srovnání s neošetřenými rostlinami,
 100 % ošetřené rostliny uhynou.

2. Herbicidní účinek a účinek safeneru v postupu před vzejitím

5 Semena, popřípadě kousky oddenků jednoděložných a dvouděložných rostlin plevelů a kulturních rostlin se dají do plastických hrnků o průměru 9 cm do písčité hlinité půdy a překryjí se půdou. Alternativně se pro test plevelů, vyskytujících se za podmínek pro Paddy-rýži v kulturách rýže, kultivují tyto plevely ve vodou nasycené půdě, přičemž se do hrnků naplní tolik vody, že voda stojí až k povrchu půdy nebo několik milimetrů nad ní. Kombinace účinných látek herbicid-safener podle předloženého vynálezu, formulované jako emulzní koncentráty, jakož i 10 v paralelních pokusech odpovídajícím způsobem formulované jednotlivé účinné látky, se potom aplikují jako emulze s aplikovaným množstvím vody, přepočteným na 300 l/ha, v různých dávkách na povrch krycí zeminy, nebo u rýže se nalijí na zavodňovací vodu.

Po ošetření se hrnky umístí do skleníku a udržují se za dobrých růstových podmínek pro plevely. 15 Optická bonitace poškození rostlin, popřípadě poškození vzejití, se provádí po vzejití pokusných rostlin po pokusné době 2 týdnů ve srovnání s nezpracovanou kontrolou. Jak pokusy ukazují, mají herbicidní prostředky, které například obsahují safener podle příkladů 5, 15, 30, 43, 56, 60, 81, 97, 98, 99, 101, 102, 103, 106, 134, 145, 155, 156, 157, 158, 160, 179, 181, 189, 194, 204, 207, 219, 236, 245, 363, 401, 405, 425, 431, 436, 465, 2-10, 2-15 a 2-20 v kombinaci se 20 sulfonylmočovinovým herbicidem 3-(4,6-dimethoxypyrimidin-2-yl)-1-[3-(N-methylsulfonyl-N-methylamino)-pyridin-2-yl-sulfonyl]-močovinou nebo sodnou solí 3-(4-methoxy-6-methyl-1,3,5-triazin-2-yl)-1-(2-methoxykarbonyl-5-jod-fenylsulfonyl)-močoviny nebo 1-(2-methoxykarbonylthiofen-3-yl)-3-(4-methoxy-6-methyl-1,3,5-triazin-2-yl)-močovinou (thifensulfuron-methyl) nebo 1-(3-N,N-dimethylaminokarbonylpyridin-2-ylsulfonyl)-3-(4,6-dimethoxypyrimidin-2-yl)-močovinou (nicosulfuron) nebo 1-(3-ethylsulfonylpyridin-2-ylsulfonyl)-3-(4,6-dimethoxypyrimidin-2-yl)-močovinou (rimsulfuron) nebo N,N-dimethyl-2-[3-(4,6-dimethoxypyrimidin-2-yl)-ureidosulfonyl]-4-formylaminobenzamidem nebo methyl-2-[3-(4,6-dimethoxypyrimidin-2-yl)ureidosulfonyl]-4-methansulfonamidomethylbenzoátem, 25 nebo v kombinaci s imidazolidinonovým herbicidem 5-ethyl-2-(4-izopropyl-4-methyl-5-oxo-2-imidazolin-2-yl)-pyridin-3-karboxylovou kyselinou (imazethapyr) nebo s aryloxyfenoxylovým herbicidem ethylesterem kyseliny 2-[4-(6-chlorbenzoxazol)-2-yloxy]-fenoxy]-propionové (fenoxaprop-ethyl) nebo se sodnou solí kyseliny 2,6-bis-[(4,6-dimethoxypyrimidin-2-yl)oxy]-benzoové v poměru herbicid : safener 2 : 1 až 1 : 20, dobrou herbicidní účinnost před vzejitím proti širokému spektru plevelných trav a plevelů, přičemž poškození kulturních rostlin, jako je 30 kukuřice, pšenice nebo ječmen, nebo jiného obilí, je ve srovnání s použitím jednotlivých herbicidů bez safenerů podstatně zredukováno, to znamená poškození způsobené herbicidy menší než 30 % až 100 %.

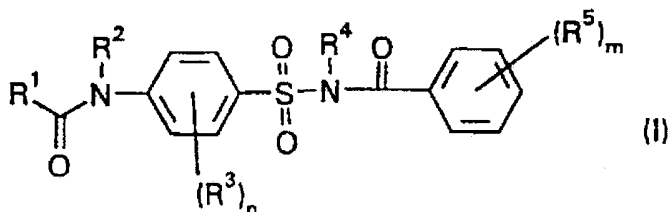
3. Herbicidní účinek a účinek safeneru v postupu po vzejití

40 Semena, popřípadě kousky oddenků jednoděložných a dvouděložných rostlin plevelů a kulturních rostlin se dají do plastických hrnků o průměru 9 cm do písčité hlinité půdy, překryjí se půdou a umístí se do skleníku za dobrých růstových podmínek. Alternativně se pro test plevelů, vyskytujících se za podmínek pro Paddy-rýži v kulturách rýže, kultivují tyto plevely ve vodou 45 nasycené půdě, přičemž se do hrnků naplní tolik vody, že voda stojí až 2 cm nad povrchem půdy. Tři týdny po vysetí se zpracovávají pokusné rostliny ve stadiu tří lístků. Kombinace účinných látek herbicid-safener podle předloženého vynálezu, formulované jako emulzní koncentráty, jakož i v paralelních pokusech odpovídajícím způsobem formulované jednotlivé účinné látky, se potom nastříkají jako emulze s aplikovaným množstvím vody, přepočteným na 300 l/ha, 50 v různých dávkách na zelené části rostlin a po dvou týdnech umístění pokusných rostlin ve skleníku za optimálních růstových podmínek se opticky pozoruje účinek preparátů ve srovnání s nezpracovanou kontrolou. U rýže nebo u plevelů, které se vyskytují v kulturách rýže, se účinné látky aplikují přímo do zavodňovací vody nebo se nastříkají na rostliny a do zavodňovací vody. Jak pokusy ukazují, mají herbicidní prostředky, které například obsahují safener podle příkladů 5, 55 15, 30, 43, 56, 60, 81, 97, 98, 99, 101, 102, 103, 106, 134, 145, 155, 156, 157, 158, 160, 179,

181, 189, 194, 204, 207, 219, 236, 245, 363, 401, 405, 425, 431, 436, 465, 2-10, 2-15 a 2-20
v kombinaci se sulfonylmočovinným herbicidem 3-(4,6-dimethoxypyrimidin-2-yl)-1-[3-(N-
methylsulfonyl-N-methylamino)-pyridin-2-yl-sulfonyl]-močovinou nebo sodnou solí 3-(4-
methoxy-6-methyl-1,3,5-triazin-2-yl)-1-(2-methoxykarbonyl-5-jod-fenylsulfonyl)-
močoviny nebo 1-(2-methoxykarbonylthiofen-3-yl)-3-(4-methoxy-6-methyl-1,3,5-triazin-2-
yl)-močovinou (thifensulfuron-methyl) nebo 1-(3-N,N-dimethylaminokarbonylpyridin-2-yl-
sulfonyl)-3-(4,6-dimethoxypyrimidin-2-yl)-močovinou (nicosulfuron) nebo 1-(3-ethyl-
sulfonylpyridin-2-ylsulfonyl)-3-(4,6-dimethoxypyrimidin-2-yl)-močovinou (rimsulfuron)
nebo N,N-dimethyl-2-[3-(4,6-dimethoxypyrimidin-2-yl)-ureidosulfonyl]-4-formylamino-
benzamidem nebo methyl-2-[3-(4,6-dimethoxypyrimidin-2-yl)ureidosulfonyl]-4-methan-
sulfonamidomethylbenzoátem, nebo v kombinaci s imidazolidinonovým herbicidem 5-ethyl-2-
(4-izopropyl-4-methyl-5-oxo-2-imidazolin-2-yl)-pyridin-3-karboxylovou kyselinou
(imazethapyr) nebo s aryloxyfenoxyllovým herbicidem ethylesterem kyseliny 2-[4-(6-chlor-
benzoxazol)-2-yloxy]-fenoxyl-propionové (fenoxaprop-ethyl) nebo se sodnou solí kyseliny
2,6-bis-[(4,6-dimethoxypyrimidin-2-yl)oxy]-benzoové v poměru herbicid : safener 2 : 1 až
1 : 20, dobrou herbicidní účinnost před vzejitím proti širokému spektru plevelných trav a plevelů,
přičemž poškození kulturních rostlin, jako je kukuřice, pšenice nebo ječmen, nebo jiného obilí, je
ve srovnání s použitím jednotlivých herbicidů bez safenerů podstatně zredukováno, to znamená
poškození způsobené herbicidy menší než 30 % až 100 %.

PATENTOVÉ NÁROKY

1. Použití sloučenin obecného vzorce I



ve kterém

- R^1 značí vodíkový atom, uhlovodíkový zbytek s až 12 uhlíkovými atomy, uhlovodíkoxyzbytek s až 8 uhlíkovými atomy nebo uhlovodíktiozbytek s až 8 uhlíkovými atomy, přičemž každý z posledně jmenovaných tří zbytků je nesubstituovaný nebo substituovaný jedním nebo více stejnými nebo různými zbytky ze skupiny zahrnující atom halogenu, kyanoskupinu, nitroskupinu, aminoskupinu, hydroxyskupinu, karboxyskupinu, formylovou skupinu, karbonamidovou skupinu, sulfonamidovou skupinu a zbytky vzorce $-Z^a-R^a$,
- R^2 značí vodíkový atom nebo alkylovou skupinu s 1 až 4 uhlíkovými atomy, nebo
- R^1 a R^2 společně se skupinou vzorce $-\text{CO}-\text{N}-$ značí zbytek tříčlenného až osmičlenného nasyceného nebo nenasyceného kruhu,
- R^3 značí v případě, že $n = 1$, nebo nezávisle na sobě, když n je větší než 1, atom halogenu, kyanoskupinu, nitroskupinu, aminoskupinu, hydroxyskupinu, karboxyskupinu formylovou skupinu, skupinu CONH_2 , skupinu SO_2NH_2 nebo zbytek $-Z^b-R^b$,
- R^4 značí vodíkový atom nebo alkylovou skupinu s 1 až 4 uhlíkovými atomy,

- R^5 značí v případě, že $m = 1$, nebo nezávisle na sobě, když m je větší než 1, atom halogenu, kyanoskupinu, nitroskupinu, aminoskupinu, hydroxyskupinu, karboxyskupinu, skupinu CHO, skupinu $CONH_2$, skupinu SO_2NH_2 nebo zbytek $-Z^c-R^c$,
- R^a značí uhlovodíkový zbytek nebo heterocyklylový zbytek, přičemž každý z obou zbytků může být nesubstituovaný nebo substituovaný jedním nebo více stejnými nebo různými substituenty ze skupiny zahrnující atom halogenu, kyanoskupinu, nitroskupinu, aminoskupinu, hydroxyskupinu, alkylaminoskupinu a dialkylaminoskupinu s 1 až 4 uhlíkovými atomy v každém alkylu, nebo značí alkylový zbytek, ve kterém je více nesousedících methylenových skupin nahrazeno kyslíkovým atomem,
- R^b a R^c značí nezávisle na sobě uhlovodíkový zbytek nebo heterocyklylový zbytek, přičemž každý z obou zbytků může být nesubstituovaný nebo substituovaný jedním nebo více stejnými nebo různými substituenty ze skupiny zahrnující atom halogenu, kyanoskupinu, nitroskupinu, aminoskupinu, hydroxyskupinu, fosforylovou skupinu, halogenalkoxyskupinu s 1 až 4 uhlíkovými atomy, alkylaminoskupinu a dialkylaminoskupinu s 1 až 4 uhlíkovými atomy v každém alkylu, nebo značí alkylový zbytek, ve kterém je více nesousedících methylenových skupin nahrazeno kyslíkovým atomem,
- Z^a značí divalentní skupinu vzorce $-O-$, $-S-$, $-CO-$, $-CS-$, $-CO-O-$, $-CO-S-$, $-O-CO-$, $-S-CO-$, $-SO-$, $-SO_2-$, $-NR^*-$, $-CO-NR^*-$, $-NR^*-CO-$, $-SO_2-NR^*-$ nebo $-NR^*-SO_2-$, přičemž vpravo uváděná vazba odpovídající divalentní skupiny je vazba ke zbytku R^a a přičemž R^* v posledně jmenovaných pěti zbytcích značí nezávisle na sobě vodíkový atom, alkylovou skupinu s 1 až 4 uhlíkovými atomy nebo halogenalkylovou skupinu s 1 až 4 uhlíkovými atomy,
- Z^b a Z^c značí nezávisle na sobě přímou vazbu nebo divalentní skupinu vzorce $-O-$, $-S-$, $-CO-$, $-CS-$, $-CO-O-$, $-CO-S-$, $-O-CO-$, $-S-CO-$, $-SO-$, $-SO_2-$, $-NR^*-$, $-CO-NR^*-$, $-NR^*-CO-$, $-SO_2-NR^*-$ nebo $-NR^*-SO_2-$, přičemž vpravo uváděná vazba odpovídající divalentní skupiny je vazba ke zbytku R^b , popřípadě R^c a přičemž R^* v posledně jmenovaných pěti zbytcích značí nezávisle na sobě vodíkový atom, alkylovou skupinu s 1 až 4 uhlíkovými atomy nebo halogenalkylovou skupinu s 1 až 4 uhlíkovými atomy,
- n značí celé číslo 0 až 4 a
- m značí celé číslo 0 až 5,
- nebo jejich soli jako safenerů pro ochranu kulturních rostlin před fyto toxickými vedlejšími účinky pesticidů.

2. Použití podle nároku 1, vyznačující se tím, že v obecném vzorci I

- R^1 značí vodíkový atom, alkylovou skupinu s 1 až 12 uhlíkovými atomy, alkenylovou skupinu se 2 až 8 uhlíkovými atomy, alkinylovou skupinu se 2 až 8 uhlíkovými atomy, cykloalkylovou skupinu se 3 až 8 uhlíkovými atomy, cykloalkenylovou skupinu se 3 až 8 uhlíkovými atomy, alkoxyskupinu s 1 až 8 uhlíkovými atomy, alkenyloxyskupinu se 2 až 8 uhlíkovými atomy, alkinyloxyskupinu se 2 až 8 uhlíkovými atomy, cykloalkoxyskupinu se 3 až 8 uhlíkovými atomy, cykloalkenyloxyskupinu se 3 až 8 uhlíkovými atomy, alkylthioskupinu s 1 až 8 uhlíkovými atomy, alkenylthioskupinu se 2 až 8 uhlíkovými atomy, alkynylthioskupinu se 2 až 8 uhlíkovými atomy, cykloalkylthioskupinu se 3 až 8 uhlíkovými atomy, cykloalkenylthioskupinu se 3 až 8 uhlíkovými atomy, nebo arylovou skupinu, přičemž každý ze 16 posledně jmenovaných zbytků je nesubstituovaný nebo substituovaný jedním nebo více stejnými nebo různými zbytky ze skupiny zahrnující atom halogenu, kyanoskupinu, nitro-

skupinu, aminoskupinu, hydroxyskupinu, karboxyskupinu, formylovou skupinu, karbonamidovou skupinu, sulfonamidovou skupinu a zbytky vzorce $-Z^aR^a$,

R^2 značí vodíkový atom nebo alkylovou skupinu s 1 až 4 uhlíkovými atomy, nebo

R^1 a R^2 značí společně se skupinou vzorce $-CO-N-$ zbytek tříčlenného až osmičlenného, nasyčeného nebo nenasyčeného heterocyklického kruhu, který vedle dusíkového atomu skupiny vzorce $-CO-N-$ může obsahovat ještě jeden nebo dva heteroatomy ze skupiny zahrnující dusík, kyslík a síru,

R^3 značí v případě, že $n = 1$, nebo nezávisle na sobě, když n je větší než 1, atom halogenu, kyanoskupinu, nitroskupinu, aminoskupinu, hydroxyskupinu, fosforylovou skupinu, karboxyskupinu, formylovou skupinu, skupinu $CONH_2$, skupinu SO_2NH_2 nebo zbytek $-Z^b-R^b$,

R^4 značí vodíkový atom nebo alkylovou skupinu s 1 až 4 uhlíkovými atomy,

R^5 značí v případě, že $m = 1$, nebo nezávisle na sobě, když m je větší než 1, atom halogenu, kyanoskupinu, nitroskupinu, aminoskupinu, hydroxyskupinu, karboxyskupinu, fosforylovou skupinu, skupinu CHO , skupinu $CONH_2$, skupinu SO_2NH_2 nebo zbytek $-Z^c-R^c$,

R^a značí alkylovou skupinu s 1 až 8 uhlíkovými atomy, cykloalkylovou skupinu se 3 až 6 uhlíkovými atomy, alkenylovou skupinu se 2 až 8 uhlíkovými atomy, cykloalkenylovou skupinu se 3 až 6 uhlíkovými atomy, alkinylovou skupinu se 2 až 8 uhlíkovými atomy, fenylovou skupinu nebo heterocyklylový zbytek se 3 až 6 atomy kruhu a s 1 až 3 heteroatomy kruhu ze skupiny zahrnující dusík, kyslík a síru, přičemž každý ze 7 posledně jmenovaných zbytků může být nesubstituovaný nebo substituovaný jedním nebo více stejnými nebo různými substituenty ze skupiny zahrnující atom halogenu, kyanoskupinu, nitroskupinu, aminoskupinu, hydroxyskupinu, alkylaminoskupinu a dialkylaminoskupinu s 1 až 4 uhlíkovými atomy v každém alkylu, nebo značí alkylový zbytek, ve kterém je několik, výhodně 2 nebo 3, nesousedících methylenových skupin, nahrazeno kyslíkovým atomem,

R^b a R^c značí nezávisle na sobě alkylovou skupinu s 1 až 8 uhlíkovými atomy, cykloalkylovou skupinu se 3 až 6 uhlíkovými atomy, alkenylovou skupinu se 2 až 8 uhlíkovými atomy, cykloalkenylovou skupinu se 3 až 6 uhlíkovými atomy, alkinylovou skupinu se 2 až 8 uhlíkovými atomy, fenylovou skupinu nebo heterocyklylový zbytek se 3 až 6 atomy kruhu a s 1 až 3 heteroatomy kruhu ze skupiny zahrnující dusík, kyslík a síru, přičemž každý ze 7 posledně jmenovaných zbytků může být nesubstituovaný nebo substituovaný jedním nebo více stejnými nebo různými substituenty ze skupiny zahrnující atom halogenu, kyanoskupinu, nitroskupinu, aminoskupinu, hydroxyskupinu, fosforylovou skupinu, halogenalkoxyskupinu s 1 až 4 uhlíkovými atomy, alkylaminoskupinu a dialkylaminoskupinu s 1 až 4 uhlíkovými atomy v každém alkylu, nebo značí alkylový zbytek, ve kterém je více nesousedících methylenových skupin, nahrazeno kyslíkovým atomem,

Z^a značí divalentní skupinu vzorce $-O-$, $-S-$, $-CO-$, $-CS-$, $-CO-O-$, $-CO-S-$, $-O-CO-$, $-S-CO-$, $-SO-$, $-SO_2-$, $-NR^*-$, $-CO-NR^*-$ nebo $-NR^*-CO-$, přičemž vpravo uváděná vazba odpovídající divalentní skupiny je vazba ke zbytku R^a a přičemž R^* v posledně jmenovaných zbytcích značí nezávisle na sobě vodíkový atom, alkylovou skupinu s 1 až 4 uhlíkovými atomy nebo halogenalkylovou skupinu s 1 až 4 uhlíkovými atomy,

Z^b a Z^c značí nezávisle na sobě přímou vazbu nebo divalentní skupinu vzorce $-O-$, $-S-$, $-CO-$, $-CS-$, $-CO-O-$, $-CO-S-$, $-O-CO-$, $-S-CO-$, $-SO-$, $-SO_2-$, $-NR^*-$, $-CO-NR^*-$, $-NR^*-CO-$, $-SO_2-NR^*-$ nebo $-NR^*-SO_2-$, přičemž vpravo uváděná vazba odpovídající divalentní skupiny je vazba ke zbytku R^b , popřípadě R^c a přičemž R^* v posledně jmenova-

ných pěti zbytcích značí nezávisle na sobě vodíkový atom, alkylovou skupinu s 1 až 4 uhlíkovými atomy nebo halogenalkylovou skupinu s 1 až 4 uhlíkovými atomy.

3. Použití podle nároku 1 nebo 2, **v y z n a č u j í c í s e t í m**, že v obecném vzorci I

5 R¹ značí vodíkový atom, alkylovou skupinu s 1 až 12 uhlíkovými atomy, alkenylovou skupinu se 2 až 8 uhlíkovými atomy, alkinylovou skupinu se 2 až 8 uhlíkovými atomy, cykloalkylovou skupinu se 3 až 8 uhlíkovými atomy, cykloalkenylovou skupinu se 3 až 8 uhlíkovými atomy, alkoxykupinu s 1 až 8 uhlíkovými atomy, alkenyloxyskupinu se 2 až 8 uhlíkovými atomy, alkinyloxyskupinu se 2 až 8 uhlíkovými atomy, cykloalkoxykupinu se 3 až 8 uhlíkovými atomy, cykloalkenyloxyskupinu se 3 až 8 uhlíkovými atomy, alkylthioskupinu s 1 až 8 uhlíkovými atomy, alkenylthioskupinu se 2 až 8 uhlíkovými atomy, alkinylthioskupinu se 2 až 8 uhlíkovými atomy, cykloalkylthioskupinu se 3 až 8 uhlíkovými atomy, cykloalkenylthioskupinu se 3 až 8 uhlíkovými atomy nebo fenylovou skupinu, přičemž
10 každý z předchozích uhlík obsahujících zbytků je nesubstituovaný nebo substituovaný jedním nebo více, stejnými nebo různými zbytky ze skupiny zahrnující atom halogenu, kyanoskupinu, nitroskupinu, aminoskupinu, hydroxyskupinu, alkoxykupinu s 1 až 8 uhlíkovými atomy, ve které jedna nebo více, nesousedící methylenové skupiny mohou být nahrazené kyslíkovým atomem, alkylthioskupinu s 1 až 8 uhlíkovými atomy, alkylsulfinylovou skupinu s 1 až 6 uhlíkovými atomy, alkylsulfonylovou skupinu s 1 až 6 uhlíkovými atomy, alkenyloxyskupinu se 2 až 8 uhlíkovými atomy, alkenylthioskupinu se 2 až 8 uhlíkovými atomy, alkinyloxyskupinu se 2 až 8 uhlíkovými atomy, alkinylthioskupinu se 2 až 8 uhlíkovými atomy, cykloalkylovou skupinu se 3 až 7 uhlíkovými atomy, cykloalkenylovou skupinu se 3 až 7 uhlíkovými atomy, cykloalkoxykupinu se 3 až 7 uhlíkovými atomy, cykloalkenyloxyskupinu se 3 až 7 uhlíkovými atomy, alkylaminovou a dialkylaminovou skupinu s 1 až 4 uhlíkovými atomy v každém alkyly, alkoxykarbonylovou skupinu s 1 až 8 uhlíkovými atomy v alkoxyly, alkenyloxykarbonylovou skupinu se 2 až 8 uhlíkovými atomy v alkenyly, alkinyloxykarbonylovou skupinu se 2 až 8 uhlíkovými atomy v alkinyly, alkylthiokarbonylovou skupinu s 1 až 8 uhlíkovými atomy v alkyly, alkylkarbonylovou skupinu s 1 až 8 uhlíkovými atomy v alkyly, alkenylkarbonylovou skupinu se 2 až 8 uhlíkovými atomy v alkenyly, alkinylkarbonylovou skupinu se 2 až 8 uhlíkovými atomy v alkinyly, fenylovou skupinu, fenylalkoxykupinu s 1 až 6 uhlíkovými atomy v alkoxyly, heterocyklylovou skupinu se 3 až 6 atomy kruhu a s 1 až 3 heteroatomy kruhu ze skupiny zahrnující dusík, kyslík a síru a v případě cyklických zbytků jsou také substituované
30 alkylovou skupinou s 1 až 6 uhlíkovými atomy, přičemž každý ze 25 posledně jmenovaných zbytků je nesubstituovaný nebo substituovaný jedním nebo více zbytky ze skupiny zahrnující atom halogenu, nitroskupinu, aminoskupinu, kyanoskupinu a hydroxyskupinu,

40 R² značí vodíkový atom nebo alkylovou skupinu s 1 až 4 uhlíkovými atomy, nebo

R¹ a R² značí společně se skupinou vzorce -CO-N- zbytek pětičlenného až šestičlenného, nasyceného nebo nenasyčeného heterocyklického kruhu, který vedle dusíkového atomu skupiny vzorce -CO-N- může obsahovat ještě jeden heteroatom ze skupiny zahrnující dusík, kyslík a síru a

45 R³ a R⁵ jsou stejné nebo různé zbytky, které nezávisle na sobě značí atom halogenu, nitroskupinu, aminoskupinu, hydroxyskupinu, kyanoskupinu, sulfamoylovou skupinu, alkylovou skupinu s 1 až 6 uhlíkovými atomy, cykloalkylovou skupinu se 3 až 6 uhlíkovými atomy, alkenylovou skupinu se 2 až 6 uhlíkovými atomy, alkinylovou skupinu se 2 až 6 uhlíkovými atomy, alkoxykupinu s 1 až 6 uhlíkovými atomy, alkenyloxyskupinu se 2 až 6 uhlíkovými atomy, alkinyloxyskupinu se 2 až 6 uhlíkovými atomy, alkylaminosulfonylovou a dialkylaminosulfonylovou skupinu s 1 až 4 uhlíkovými atomy v každém alkyly, alkylthioskupinu s 1 až 6 uhlíkovými atomy, alkylsulfinylovou skupinu s 1 až 6 uhlíkovými atomy, alkylsulfonylovou skupinu s 1 až 6 uhlíkovými atomy, alkoxykarbonylovou skupinu s 1 až 6 uhlíkovými atomy v alkoxyly, alkylthiokarbonylovou skupinu s 1 až 6 uhlíkovými atomy v alkyly,

alkylkarbonylovou skupinu s 1 až 6 uhlíkovými atomy v alkyly, přičemž každý z posledně jmenovaných 15 zbytků je nesubstituovaný nebo substituovaný jedním nebo více stejnými nebo různými zbytky ze skupiny zahrnující atom halogenu, halogenalkoxyskupinu s 1 až 6 uhlíkovými atomy, fosforylovou skupinu, nitroskupinu, aminoskupinu, kyanoskupinu, hydroxyskupinu, alkokyskupinu s 1 až 8 uhlíkovými atomy, ve které mohou být jedna nebo více nesousedící methylenové skupiny nahrazené kyslíkem a v případě cyklických zbytků také alkylovou skupinou s 1 až 4 uhlíkovými atomy a halogenalkylovou skupinou s 1 až 4 uhlíkovými atomy.

4. Použití podle některého z nároků 1 až 3, **vyznačující se tím**, že v obecném vzorci I

R^1 značí vodíkový atom, alkylovou skupinu s 1 až 8 uhlíkovými atomy, alkenylovou skupinu se 2 až 6 uhlíkovými atomy, alkinylovou skupinu se 2 až 6 uhlíkovými atomy, cykloalkylovou skupinu se 3 až 6 uhlíkovými atomy, cykloalkenylovou skupinu s 5 až 6 uhlíkovými atomy, cykloalkenylovou skupinu s 5 až 6 uhlíkovými atomy, alkokyskupinu s 1 až 6 uhlíkovými atomy, alkenyloxyskupinu se 2 až 6 uhlíkovými atomy, alkinyloxyskupinu se 2 až 6 uhlíkovými atomy, cykloalkoxyskupinu se 3 až 6 uhlíkovými atomy, cykloalkenyloxyskupinu s 5 až 6 uhlíkovými atomy, alkylthioskupinu s 1 až 6 uhlíkovými atomy, alkenylthioskupinu se 2 až 6 uhlíkovými atomy, alkynylthioskupinu se 2 až 6 uhlíkovými atomy, cykloalkylthioskupinu se 3 až 6 uhlíkovými atomy, cykloalkenylthioskupinu s 5 až 6 uhlíkovými atomy nebo fenylovou skupinu, přičemž každý z předchozích 16 zbytků je nesubstituovaný nebo substituovaný jedním nebo více stejnými nebo různými zbytky ze skupiny zahrnující atom halogenu, kyanoskupinu, alkokyskupinu s 1 až 6 uhlíkovými atomy, alkylthioskupinu s 1 až 6 uhlíkovými atomy, alkylsulfinylovou skupinu s 1 až 4 uhlíkovými atomy, alkylsulfonylovou skupinu s 1 až 4 uhlíkovými atomy, alkenyloxyskupinu se 2 až 4 uhlíkovými atomy, alkenylthioskupinu se 2 až 4 uhlíkovými atomy, alkinyloxyskupinu se 2 až 4 uhlíkovými atomy, alkynylthioskupinu se 2 až 4 uhlíkovými atomy, cykloalkylovou skupinu se 3 až 6 uhlíkovými atomy, cykloalkenylovou skupinu se 3 až 6 uhlíkovými atomy, cykloalkoxy- skupinu se 3 až 6 uhlíkovými atomy, cykloalkenyloxyskupinu s 5 až 6 uhlíkovými atomy, alkylaminovou a dialkylaminovou skupinu s 1 až 4 uhlíkovými atomy v každém alkyly, alkoxykarbonylovou skupinu s 1 až 6 uhlíkovými atomy v alkoxyly, alkylthiokarbonylovou skupinu s 1 až 6 uhlíkovými atomy v alkyly, alkylkarbonylovou skupinu s 1 až 6 uhlíkovými atomy v alkyly, fenylovou skupinu, fenylalkoxyskupinu s 1 až 4 uhlíkovými atomy v alkoxyly, heterocyklylovou skupinu s 5 až 6 atomy kruhu a s 1 až 3 heteroatomy kruhu ze skupiny zahrnující dusík, kyslík a síru a v případě cyklických zbytků jsou také substituované alkylovou skupinou s 1 až 4 uhlíkovými atomy, přičemž každý ze 21 posledně jmenovaných zbytků je nesubstituovaný nebo substituovaný jedním nebo více zbytky ze skupiny zahrnující atom halogenu a kyanoskupinu a v případě cyklických zbytků také alkylovou skupinu s 1 až 4 uhlíkovými atomy,

R^2 značí vodíkový atom nebo alkylovou skupinu s 1 až 4 uhlíkovými atomy, nebo

R^1 a R^2 značí společně se skupinou vzorce $-CO-N-$ zbytek pětičlenného až šestičlenného, nasyceného nebo nenasyceného heterocyklického kruhu, který vedle dusíkového atomu skupiny vzorce $-CO-N-$ neobsahuje žádný další heteroatom a

R^3 a R^5 jsou stejné nebo různé zbytky, které nezávisle na sobě značí atom halogenu, nitroskupinu, aminoskupinu, hydroxyskupinu, kyanoskupinu, sulfamoylovou skupinu, alkylovou skupinu s 1 až 6 uhlíkovými atomy, cykloalkylovou skupinu se 3 až 6 uhlíkovými atomy, alkenylovou skupinu se 2 až 6 uhlíkovými atomy, alkinylovou skupinu se 2 až 6 uhlíkovými atomy, alkokyskupinu s 1 až 6 uhlíkovými atomy, alkenyloxyskupinu se 2 až 6 uhlíkovými atomy, alkinyloxyskupinu se 2 až 6 uhlíkovými atomy, alkylaminosulfonylovou a dialkylaminosulfonylovou skupinu s 1 až 4 uhlíkovými atomy v každém alkyly, alkylthioskupinu s 1 až 6 uhlíkovými atomy, alkylsulfinylovou skupinu s 1 až 6 uhlíkovými atomy, alkyl-

5 sulfonylovou skupinu s 1 až 6 uhlíkovými atomy, alkoxykarbonylovou skupinu s 1 až 6 uhlíkovými atomy v alkoxyly, alkylthiokarbonylovou skupinu s 1 až 6 uhlíkovými atomy v alkyly, alkylkarbonylovou skupinu s 1 až 6 uhlíkovými atomy v alkyly, přičemž každý z posledně jmenovaných 15 zbytků je nesubstituovaný nebo substituovaný jedním nebo více
stejnými nebo různými zbytky ze skupiny zahrnující atom halogenu, halogenalkoxyskupinu s 1 až 4 uhlíkovými atomy, kyanoskupinu, alkoxyskupinu s 1 až 4 uhlíkovými atomy a v případě cyklických zbytků také alkylovou skupinou s 1 až 4 uhlíkovými atomy a halogenalkylovou skupinou s 1 až 4 uhlíkovými atomy.

10 5. Použití podle některého z nároků 1 až 4, **v y z n a č u j í c í s e t í m**, že v obecném vzorci I

R¹ značí vodíkový atom, alkylovou skupinu s 1 až 6 uhlíkovými atomy, alkenylovou skupinu se 2 až 6 uhlíkovými atomy, cykloalkylovou skupinu se 3 až 6 uhlíkovými atomy, cykloalkenylovou skupinu s 5 až 6 uhlíkovými atomy, alkoxyskupinu s 1 až 6 uhlíkovými atomy nebo fenylovou skupinu, přičemž každý z posledně jmenovaných 6 zbytků je nesubstituovaný nebo substituovaný jedním nebo více stejnými nebo různými zbytky ze skupiny zahrnující atom halogenu, alkoxyskupinu s 1 až 6 uhlíkovými atomy, přičemž jedna nebo více methylenových skupin může být nahrazena kyslíkovým atomem, halogenalkoxyskupinu s 1 až 6 uhlíkovými atomy, alkylsulfinylovou skupinu s 1 až 2 uhlíkovými atomy, alkylsulfonylovou skupinu s 1 až 2 uhlíkovými atomy, cykloalkylovou skupinu se 3 až 6 uhlíkovými atomy, alkoxykarbonylovou skupinu s 1 až 4 uhlíkovými atomy v alkoxyly, alkylkarbonylovou skupinu s 1 až 4 uhlíkovými atomy v alkyly a fenylovou skupinu, a v případě cyklických zbytků jsou také substituované alkylovou skupinou s 1 až 4 uhlíkovými atomy a halogenalkylovou skupinou s 1 až 4 uhlíkovými atomy,

R² značí vodíkový atom,

30 R³ značí atom halogenu, halogenalkylovou skupinu s 1 až 4 uhlíkovými atomy, halogenalkoxyskupinu s 1 až 4 uhlíkovými atomy, alkylovou skupinu s 1 až 4 uhlíkovými atomy, alkoxyskupinu s 1 až 4 uhlíkovými atomy, alkylsulfonylovou skupinu s 1 až 4 uhlíkovými atomy, alkoxykarbonylovou skupinu s 1 až 4 uhlíkovými atomy v alkoxyly nebo alkylkarbonylovou skupinu s 1 až 4 uhlíkovými atomy v alkyly,

35 R⁴ značí vodíkový atom,

40 R⁵ značí vodík halogenu, alkylovou skupinu s 1 až 4 uhlíkovými atomy, halogenalkylovou skupinu s 1 až 4 uhlíkovými atomy, halogenalkoxyskupinu s 1 až 4 uhlíkovými atomy, cykloalkylovou skupinu se 3 až 6 uhlíkovými atomy, fenylovou skupinu, alkoxyskupinu s 1 až 4 uhlíkovými atomy, kyanoskupinu, alkylthioskupinu s 1 až 4 uhlíkovými atomy, alkylsulfinylovou skupinu s 1 až 4 uhlíkovými atomy, alkylsulfonylovou skupinu s 1 až 4 uhlíkovými atomy, alkoxykarbonylovou skupinu s 1 až 4 uhlíkovými atomy v alkoxyly nebo alkylkarbonylovou skupinu s 1 až 4 uhlíkovými atomy v alkyly,

45 n značí číslo 0, 1 nebo 2 a

m značí číslo 1 nebo 2.

50 6. Použití podle některého z nároků 1 až 5, **v y z n a č u j í c í s e t í m**, že v obecném vzorci I

55 R¹ značí vodíkový atom, alkylovou skupinu s 1 až 6 uhlíkovými atomy nebo cykloalkylovou skupinu se 3 až 6 uhlíkovými atomy, přičemž každý z posledně jmenovaných zbytků je nesubstituovaný nebo substituovaný jedním nebo více stejnými nebo různými zbytky ze skupiny zahrnující atom halogenu, alkoxyskupinu s 1 až 4 uhlíkovými atomy, halogen-

alkoxyskupinu s 1 až 6 uhlíkovými atomy a alkylthioskupinu s 1 až 4 uhlíkovými atomy a v případě cyklických zbytků jsou také substituované alkylovou skupinou s 1 až 4 uhlíkovými atomy a halogenalkylovou skupinou s 1 až 4 uhlíkovými atomy,

- 5 R^2 značí vodíkový atom,
- R^3 značí atom halogenu, halogenalkylovou skupinu s 1 až 4 uhlíkovými atomy, halogenalkoxy-
 skupinu s 1 až 4 uhlíkovými atomy, alkylovou skupinu s 1 až 4 uhlíkovými atomy, alkoxy-
 10 skupinu s 1 až 4 uhlíkovými atomy, alkylsulfonylovou skupinu s 1 až 4 uhlíkovými atomy,
 alkoxykarbonylovou skupinu s 1 až 4 uhlíkovými atomy v alkoxyly nebo alkylkarbonylovou
 skupinu s 1 až 4 uhlíkovými atomy v alkylu,
- R^4 značí vodíkový atom,
- 15 R^5 značí atom halogenu, alkylovou skupinu s 1 až 4 uhlíkovými atomy, halogenalkylovou
 skupinu s 1 až 4 uhlíkovými atomy, halogenalkoxyskupinu s 1 až 4 uhlíkovými atomy,
 cykloalkylovou skupinu se 3 až 6 uhlíkovými atomy, fenylovou skupinu, alkoxyskupinu
 s 1 až 4 uhlíkovými atomy, kyanoskupinu, alkylthioskupinu s 1 až 4 uhlíkovými atomy,
 20 alkylsulfinylovou skupinu s 1 až 4 uhlíkovými atomy, alkylsulfonylovou skupinu s 1 až 4
 uhlíkovými atomy, alkoxykarbonylovou skupinu s 1 až 4 uhlíkovými atomy v alkoxyly nebo
 alkylkarbonylovou skupinu s 1 až 4 uhlíkovými atomy v alkylu,
- n značí číslo 0, 1 nebo 2 a
- 25 m značí číslo 1 nebo 2.
7. Sloučeniny obecného vzorce I a jejich soli, definované v některém z nároků 1 až 6, vyjma
 sloučenin obecného vzorce I, ve kterém
- 30 a) $R^2 = H$, $n = 0$ a
- a1) $R^1 = CH_3$ a $m = 0$ nebo $(R^5)_m = 2-$, $3-$ nebo $4-CH_3$, $4-C_2H_5$, $4-n-C_3H_7$, $4-i-C_3H_7$,
 $4-OCH_3$, $4-i-OC_3H_7$, $4-NH_2$, $4-Cl$, $4-NO_2$, $2,3-(CH_3)_2$, $2,4-(CH_3)_2$, $3,4-(CH_3)_2$,
 35 $2,5-(CH_3)_2$, $2,4,5-(CH_3)_3$, $2,4,6-(CH_3)_3$, $2,3,4,5,6-(CH_3)_5$, $3-CH_3-4-OCH_3$,
 $3-CH_3-4-SCH_3$, $2,4-(OCH_3)_2$, $2,5-(OCH_3)_2$, $3,4,5-(OCH_3)_3$, $2-OCH_3-4-NH_2$,
 $2-OCH_3-4-NO_2$, $2-OH-4-NO_2$ nebo $2-OH-4-NH_2$,
- a2) $R^1 = H$, $n-C_3H_7$, $n-C_4H_9$, $n-C_5H_{11}$, $n-C_6H_{13}$, cyklohexyl nebo 2-methylpentenyl
 a $(R^5)_m = 2-CH_3$,
- 40 a3) $R^1 = n-C_5H_{11}$ a
 $m = 0$ nebo $(R^5)_m = 2-CH_3$, $3-NO_2$, nebo $4-NO_2$,
- a4) $R^1 = n-C_9H_{19}$ a $m = 0$,
- 45 a5) $R^1 = OCH_3$, $(R^5)_m = 2-i-OC_3H_7$ nebo $4-i-OC_3H_7$,
- a6) $R^1 = OC_2H_5$, $(R^5)_m = 2-OCH_3$, $2-COOH$, $3,5-(CH_3)_2$,
- 50 a7) $R^1 = CH_2CH_2COOH$ a
 $m = 0$ nebo $(R^5)_m = 4-i-OC_3H_7$,
- a8) $R^1 = CH=CHCOOH$ a $(R^5)_m = 2-CH_3$ nebo $4-i-OC_3H_7$,
- 55 a9) $R^1 = 4-methoxyfenyl$ a $(R^5)_m = 4-OCH_3$,

- a10) $R^1 = 4\text{-nitrofenyl}$ a $(R^5)_m = 4\text{-NO}_2$,
- 5 a11) $R^1 = \text{CH}_2\text{Cl}$, $R^2 = R^4 = \text{H}$ a $m = n = 0$,
- a12) $R^1 = 3,5\text{-dimethyl-1-fenyl-pyrazol-4-yl}$ nebo $2,3\text{-dimethyl-1-fenyl-5-oxo-pyrazol-4-yl}$ a
 $(R^5)_m = 4\text{-i-OC}_3\text{H}_7$,
- 10 a13) $R^1 = \text{C}_{11}\text{H}_{23}$, CH_2Cl , CH_2Br , CH_2J , CHCl_2 , CCl_3 nebo CH_2F a
 $(R^5)_m = 3,4\text{-(CH}_3)_2$; nebo
- b) $R^1 = \text{H}$, $R^2 = \text{H}$, $R^4 = \text{CH}_3$, $n = m = 0$,
- 15 c) $R^1 = \text{-C(CH}_3)_3$, $R^2 = R^4 = \text{H}$, $(R^5)_m = 4\text{-CH}_3$ a $n = 0$,
- d) $R^1 = \text{fenyl}$, $R^2 = R^4 = \text{H}$, $m = 0$ a $n = 0$ nebo $(R^3)_n = 3\text{-fenylkarbonyloxy}$,
- e) $\text{N-}[(4\text{-benzoylsulfamoyl})\text{fenyl}]\text{-ftalimid}$,
- 20 f) $R^1 = 2\text{-(2-karboxyfenyl)fenyl}$, $R^2 = R^4 = \text{H}$, $n = 0$ a $m = 0$ nebo $(R^5)_m = 4\text{-NO}_2$,
- g) $R^1 = 2\text{-karboxyfenyl}$, $R^2 = R^4 = \text{H}$, $n = 0$ a $m = 0$ nebo
- 25 h) $R^1 = \text{CH}_3$, $R^2 = \text{H}$, $R^4 = \text{CH}_3$ a $n = m = 0$.

30

Konec dokumentu
