

PŘÍHLÁŠKA VYNÁLEZU

zveřejněná podle § 31 zákona č. 527/1990 Sb.

(19)
ČESKÁ
REPUBLIKA



ÚŘAD
PRŮMYSLVÉHO
VLASTNICTVÍ

(22) Přihlášeno: 02.12.1999

(32) Datum podání prioritní přihlášky: 04.12.1998 06.08.1999

(31) Číslo prioritní přihlášky: 1998/19855850 1999/19936705

(33) Země priority: DE DE

(40) Datum zveřejnění přihlášky vynálezu: 13.02.2002
(Věstník č. 2/2002)

(86) PCT číslo: PCT/EP99/09412

(87) PCT číslo zveřejnění: WO00/34272

(21) Číslo dokumentu:

2001 - 1961

(13) Druh dokumentu: A3

(51) Int. Cl. ⁷:

C 07 D 231/02

C 07 D 413/10

A 01 N 43/56

A 01 N 43/80

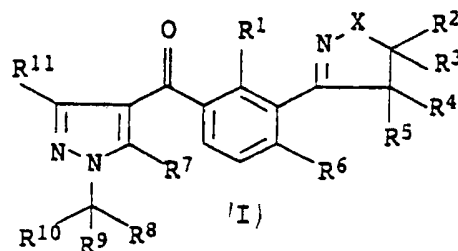
(71) Přihlašovatel:

BASF AKTIENGESELLSCHAFT, Ludwigshafen, DE;

(72) Původce:

Neidlein Ulf Dr., Mannheim, DE;
Götz Norbert Dr., Worms, DE;
Mißlitz Ulf Dr., Neustadt, DE;
Götz Roland Dr., Neuulshheim, DE;
Baumann Ernst Dr., Dudenhofen, DE;
von Deyn Wolfgang Dr., Neustadt, DE;
Kudis Steffen Dr., Mannheim, DE;
Langemann Klaus Dr., Worms, DE;
Mayer Guido Dr., Neustadt, DE;
Witschel Matthias Dr., Ludwigshafen, DE;
Otten Martina Dr., Ludwigshafen, DE;
Westphalen Karl-Otto Dr., Speyer, DE;
Walter Helmut Dr., Obrigheim, DE;

a použití těchto sloučeniny nebo prostředků je obsahujících
pro potlačování nežádoucích rostlin.



(74) Zástupce:

Švorčík Otakar JUDr., Hálkova 2, Praha 2, 12000;

(54) Název přihlášky vynálezu:

3-(Heterocyklyl)+benzoylpyrazolové deriváty

(57) Anotace:

Jsou popsány 3-(heterocyklyl)benzoylpyrazolové deriváty obecného vzorce I, ve kterém X je O, NH nebo N-alkyl, R¹ je nitroskupina, atom halogenu, alkoxykupina, halogenalkoxykupina, alkylthioskupina, halogenalkylthioskupina, alkylsulfonyl nebo halogenalkylsulfonyl, R², R³, R⁴, R⁵ jsou atom vodíku, alkyl nebo halogenalkyl, R⁶ je atom halogenu, nitroskupina, halogenalkyl, alkoxykupina, halogenalkoxykupina, alkylthioskupina, halogenalkylthioskupina, alkylsulfonyl nebo halogenalkylsulfonyl, R⁷ je hydroxyl, alkoxykupina, alkenyloxykupina, alkylsulfonyloxykupina, alkylkarbonyloxykupina, (alkylthio)-karbonyloxykupina, fenylsulfonyloxykupina nebo fenylkarbonyloxykupina, kde fenyllová část může být substituována, R⁸, R⁹ jsou alkyl, R¹⁰ je atom vodíku nebo alkyl, R¹¹ je atom vodíku nebo alkyl, a jejich zemědělsky užitečné soli, sloučeniny pro jejich přípravu

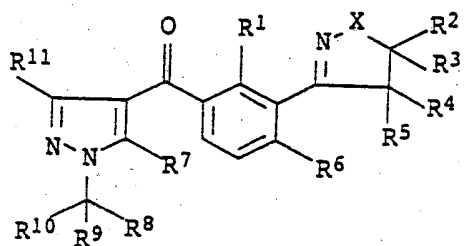
3-(Heterocyklyl)benzoylpyrazolový derivát

10.10.01

2001-1961

Oblast techniky

Předložený vynález se týká 3-(heterocyklyl)benzoylpyrazolových derivátů obecného vzorce I



ve kterém

X je O, NH nebo N(alkylová skupina s 1 až 6 atomy uhlíku);

R¹ je nitroskupina, atom halogenu, alkoxy skupina s 1 až 4 atomy uhlíku, halogenalkoxy skupina s 1 až 4 atomy uhlíku, alkylthio skupina s 1 až 4 atomy uhlíku, halogenalkylthio skupina s 1 až 4 atomy uhlíku, alkylsulfonylová skupina s 1 až 4 atomy uhlíku nebo halogenalkylsulfonylová skupina s 1 až 4 atomy uhlíku;

R², R³, R⁴, R⁵ jsou atom vodíku, alkylová skupina s 1 až 4 atomy uhlíku nebo halogenalkylová skupina s 1 až 4 atomy uhlíku;

R⁶ je atom halogenu, nitroskupina, halogenalkylová skupina s 1 až 4 atomy uhlíku, alkoxy skupina s 1 až 4 atomy uhlíku, halogenalkoxy skupina s 1 až 4 atomy uhlíku;

10.10.01

atomy uhlíku, alkylthioskupina s 1 až 4 atomy uhlíku, halogenalkylthioskupina s 1 až 4 atomy uhlíku, alkylsulfonylová skupina s 1 až 4 atomy uhlíku nebo halogenalkylsulfonylová skupina s 1 až 4 atomy uhlíku;

R⁷ je hydroxyl, alkoxykupina s 1 až 6 atomy uhlíku, alkenyloxyskupina se 3 až 6 atomy uhlíku, alkylsulfonyloxyskupina s 1 až 6 atomy uhlíku, alkylkarbonyloxyskupina s 1 až 6 atomy uhlíku, (alkylthio)karbonyloxyskupina s 1 až 4 atomy uhlíku, fenylsulfonyloxy- nebo fenylkarbonyloxyskupina, kde fenylová část dvou posledně zmíněných substituentů může být částečně nebo plně halogenována a/nebo může nést jednu až tři následující skupiny: nitroskupina, kyanoskupina, alkylová skupina s 1 až 4 atomy uhlíku, halogenalkylová skupina s 1 až 4 atomy uhlíku, alkoxykupina s 1 až 4 atomy uhlíku nebo halogenalkoxykupina s 1 až 4 atomy uhlíku;

R⁸, R⁹ jsou alkylová skupina s 1 až 4 atomy uhlíku;

R¹⁰ je atom vodíku nebo alkylová skupina s 1 až 4 atomy uhlíku, kde počet atomů uhlíku částí R⁸, R⁹ a R¹⁰ je dohromady nejvýše 7,

R¹¹ je atom vodíku nebo alkylová skupina s 1 až 4 atomy uhlíku,

a její zemědělsky užitečné soli.

10.10.01

Navíc se tento vynález týká způsobů přípravy sloučeniny obecného vzorce I, prostředků je obsahujících a použití těchto derivátů nebo prostředků je obsahujících pro potlačování škodlivých rostlin.

Osavadní stav techniky

Pyrazol-4-ylbenzoylové deriváty jsou v literatuře popsány, například ve WO 96/26206 a WO 98/31681.

Herbicidní vlastnosti sloučenin známých z dosavadního stavu techniky a jejich kompatibilita s plodinovými rostlinami nejsou zcela uspokojivé. Předmětem předloženého vynálezu je poskytnout nové, obzvláště herbicidně aktivní sloučeniny, které mají zlepšené vlastnosti.

Původci zjistili, že tohoto předmětu se dosáhne (heterocyklyl)benzoylpyrazolovými deriváty obecného vzorce I a jejich herbicidním působením.

Dále původci zjistili, že herbicidní prostředky, které obsahují sloučeniny obecného vzorce I mají velmi dobré herbicidní působení. Původci navíc našli způsoby výroby těchto prostředků a způsoby potlačování nežádoucí vegetace za použití sloučenin obecného vzorce I.

V závislosti na vzoru substituce mohou sloučeniny obecného vzorce I obsahovat jedno nebo více chirálních center, v kterémžto případě jsou přítomny jako enantiomery nebo směsi diastereomerů. Tento vynález poskytuje jak čisté enantiomery, tak diastereomery a jejich směsi.

10.10.01

Sloučeniny obecného vzorce I mohou být také přítomny ve formě svých zemědělsky užitečných solí, přičemž druh solí je obvykle nedůležitý. Obecně jsou vhodné soli těch kationtů nebo adiční soli s těmi kyselinami, jejichž kationty nebo anionty neovlivňují nepříznivě herbicidní účinek sloučenin obecného vzorce I.

Vhodnými kationty jsou obzvláště ionty alkalických kovů, výhodně lithia, sodíku a draslíku, ionty kovů alkalických zemin, výhodně vápníku a hořčíku, a iontů přechodových kovů, výhodně manganu, mědi a železa, a také ionty amoniové, kde, pokud je to žádoucí, jeden ze 4 atomů vodíku může být nahrazen alkylovou skupinou s 1 až 4 atomy uhlíku, hydroxyalkylovou skupinou s 1 až 4 atomy uhlíku, alkoxy-alkylovou skupinou s 1 až 4 atomy uhlíku v alkoxy skupině i v alkylové skupině, hydroxyalkoxyalkylovou skupinou s 1 až 4 atomy uhlíku v alkoxy skupině i v alkylové skupině, fenylem nebo benzylem, výhodně amoniový, dimethylamoniový, diisopropylamoniový, tetramethylamoniový; tetrabutylamoniový, 2-(2-hydroxyeth-1-oxy)eth-1-ylamoniový, di(2-hydroxyeth-1-yl)amoniový nebo trimethylbenzylamoniový, dále fosfoniové ionty, sulfoniové ionty, výhodně tri(alkyl)sulfoniový s alkylovými částmi obsahujícími 1 až 4 atomy uhlíku, a sulfoxoniové ionty, výhodně tri(alkyl)sulfoxoniový s alkylovými částmi obsahujícími 1 až 4 atomy uhlíku.

Anionty výhodných adičních solí s kyselinou jsou hlavně chlorid, bromid, fluorid, hydrogensíran, síran, dihydrogenfosfát, hydrogenfosfát, nitrát, hydrogen-uhličitan, uhličitan, hexafluorokřemičitan, hexafluorofosfát, benzoat a anionty alkanových kyselin s 1 až 4

uhlíku, výhodně formiat, acetat, propionat a butyrat.

Organické molekulární části uvedené pro substituenty R^1 až R^{11} nebo jako části na fenylových kruzích jsou souhrnné pojmy pro jednotlivé členy skupin. Všechny uhlovodíkové řetězce, tj. všechny alkylové, alkylkarbonylové, halogenalkylové, alkoxy-, halogenalkoxy-, alkylkarbonyloxy-, (alkylthio)karbonyloxy-, alkylsulfonyloxy-, alkylthio-, halogenalkylthio-, alkylsulfonylové, halogenalkylsulfonylové, alkenylové a alkenyloxy-části mohou být s přímým řetězcem nebo rozvětvené. Pokud není uvedeno jinak, nesou halogenované substituenty výhodně jeden až pět shodných nebo různých atomů halogenu. Pojem "halogen" představuje v každém případě fluor, chlor, brom nebo jod.

Příklady jiných významů jsou:

- alkylová skupina s 1 až 4 atomy uhlíku a alkylové části alkylkarbonylové skupiny s 1 až 4 atomy uhlíku v alkylovém podílu a alkylkarbonyloxyskupiny s 1 až 4 atomy uhlíku v alkylovém podílu: například methyl, ethyl, propyl, 1-methylethyl, butyl, 1-methylpropyl, 2-methylpropyl a 1,1-dimethylethyl;
- alkylová skupina s 1 až 6 atomy uhlíku a alkylové části alkylkarbonylové skupiny s 1 až 6 atomy uhlíku v alkylovém podílu a alkylkarbonyloxyskupina s 1 až 6 atomy uhlíku v alkylovém podílu: alkylová skupina s 1 až 4 atomy uhlíku jak je uvedena výše a také například, pentyl, 1-methylbutyl, 2-methylbutyl, 3-methylbutyl, 2,2-dimethylpropyl, 1-ethylpropyl, hexyl, 1,1-dimethylpropyl,

1,2-dimethylpropyl, 1-methylpentyl, 2-methylpentyl, 3-methylpentyl, 4-methylpentyl, 1,1-dimethylbutyl, 1,2-dimethylbutyl, 1,3-dimethylbutyl, 2,2-dimethylbutyl, 2,3-dimethylbutyl, 3,3-dimethylbutyl, 1-ethylbutyl, 2-ethylbutyl, 1,1,2-trimethylpropyl, 1-ethyl-1-methylpropyl a 1-ethyl-3-methylpropyl;

- halogenalkylová skupina s 1 až 4 atomy uhlíku: alkylová skupina s 1 až 4 atomy uhlíku jak je uvedena výše, která je částečně nebo plně substituována fluorem, chlorem, bromem a/nebo jodem, tj. například chlormethyl, dichlormethyl, trichlormethyl, fluormethyl, difluormethyl, trifluormethyl, chlorfluormethyl, dichlorfluormethyl, chlordifluormethyl, brommethyl, jodmethyl, 1-fluorethyl, 1-chlorethyl, 1-bromethyl, 1-jodethyl, 2-fluorethyl, 2-chlorethyl, 2-bromethyl, 2-jodethyl, 2,2-difluorethyl, 2,2,2-trifluorethyl, 2-chlor-2-fluorethyl, 2-chlor-2,2-difluorethyl, 2,2-dichlor-2-fluorethyl, 2,2,2-trichlorethyl, pentafluorethyl, 2-fluorpropyl, 3-fluorpropyl, 2,2-difluorpropyl, 2,3-difluorpropyl, 2-chlorpropyl, 3-chlorpropyl, 2,3-dichlorpropyl, 2-brompropyl, 3-brompropyl, 3,3,3-trifluorpropyl, 3,3,3-trichlorpropyl, 2,2,3,3,3-pentafluorpropyl, heptafluorpropyl, 1-(fluormethyl)-2-fluorethyl, 1-(chlormethyl)-2-chlorethyl, 1-(brommethyl)-2-bromethyl, 4-fluorbutyl, 4-chlorbutyl, 4-brombutyl a nonafluorbutyl;

- alkoxykupina s 1 až 4 atomy uhlíku: například methoxykupina, ethoxykupina, propoxykupina, 1-methylethoxykupina, butoxykupina, 1-methylpropoxy-

10.10.01

skupina, 2-methylpropoxyskupina a 1,1-dimethyl-
ethoxyskupina;

alkoxyskupina s 1 až 6 atomy uhlíku: alkoxyskupina s 1
až 4 atomy uhlíku jak je uvedena výše a také
například pentyloxyskupina, 1-methylbutoxyskupina, 2-
-methylbutoxyskupina, 3-methylbutoxyskupina, 1,1-dime-
thylpropoxyskupina, 1,2-dimethylpropoxyskupina,
2,2-dimethylpropoxyskupina, 1-ethylpropoxyskupina,
hexyloxyskupina, 1-methylpentyloxyskupina, 2-methyl-
pentyloxyskupina, 3-methylpentyloxyskupina, 4-methyl-
pentyloxyskupina, 1,1-dimethylbutoxyskupina, 1,2-
-dimethylbutoxyskupina, 1,3-dimethylbutoxyskupina,
2,2-dimethylbutoxyskupina, 2,3-dimethylbutoxyskupina,
3,3-dimethylbutoxyskupina, 1-ethylbutoxyskupina,
2-ethylbutoxyskupina, 1,1,2-trimethylpropoxyskupina,
1,2,2-trimethylpropoxyskupina, 1-ethyl-1-methyl-
propoxyskupina a 1-ethyl-2-methylpropoxyskupina;

halogenalkoxyskupina s 1 až 4 atomy uhlíku:
zbytek alkoxyskupiny s 1 až 4 atomy uhlíku jak je
uveden výše, který je částečně nebo zcela substituován
fluorem, chlorem, bromem a/nebo jodem, tj. například
fluormethoxyskupina, difluormethoxyskupina,
trifluormethoxyskupina, chlordinfluormethoxyskupina,
bromdifluormethoxyskupina, 2-fluorethoxyskupina,
2-chlorethoxyskupina, 2-brommethoxyskupina, 2-jod-
ethoxyskupina, 2,2-difluorethoxyskupina, 2,2,2-tri-
fluorethoxyskupina, 2-chlor-2-fluorethoxyskupina,
2-chlor-2,2-difluorethoxyskupina, 2,2-dichlor-2-fluor-
ethoxyskupina, 2,2,2-trichlorethoxyskupina,
pentafluorethoxyskupina, 2-fluorpropoxyskupina,

10.10.01

3-fluorpropoxyskupina, 2-chlorpropoxyskupina, 3-chlorpropoxyskupina, 2-brompropoxyskupina, 3-brompropoxyskupina, 2,2-difluorpropoxyskupina, 2,3-difluorpropoxyskupina, 2,3-dichlorpropoxyskupina, 3,3,3-trifluorpropoxyskupina, 3,3,3-trichlorpropoxyskupina, 2,2,3,3,3-pentafluorpropoxyskupina, heptafluorpropoxyskupina, 1-(fluormethyl)-2-fluor-ethoxyskupina, 1-(chlormethyl)-2-chlorethoxyskupina, 1-(brommethyl)-2-bromethoxyskupina, 4-fluorbutoxyskupina, 4-chlorbutoxyskupina, 4-brombutoxyskupina a nonafluorbutoxyskupina;

alkylthioskupina s 1 až 4 atomy uhlíku a alkylthioskupinové části (alkylthio)karbonyloxyskupiny s 1 až 4 atomy uhlíku v alkylovém podílu: například methylthioskupina, ethylthioskupina, propylthioskupina, 1-methylethylthioskupina, butylthioskupina, 1-methylpropylthioskupina, 2-methylpropylthioskupina a 1,1-dimethylethylthioskupina;

halogenalkylthioskupina s 1 až 4 atomy uhlíku: část alkylthioskupiny s 1 až 4 atomy uhlíku jak je uvedena výše která je částečně nebo zcela substituována fluorem, chlorem, bromem a/nebo jodem, tj., například, fluormethylthioskupina, difluormethylthioskupina, trifluormethylthioskupina, chlordinfluormethylthioskupina, bromdifluormethylthioskupina, 2-fluorethylthioskupina, 2-chlorethylthioskupina, 2-bromethylthioskupina, 2-jodethylthioskupina, 2,2-difluorethylthioskupina, 2,2,2-trifluorethylthioskupina, 2,2,2-trichlorethylthioskupina, 2-chlor-2-fluorethylthioskupina, 2-chlor-2,2-difluorethylthioskupina, 2,2-dichlor-2-fluorethylthioskupina, pentafluorethyl-

101001

thioskupina, 2-fluorpropylthioskupina, 3-fluorpropylthioskupina, 2-chlorpropylthioskupina, 3-chlorpropylthioskupina, 2-brompropylthioskupina, 3-brompropylthioskupina, 2,2-difluorpropylthioskupina, 2,3-difluorpropylthioskupina, 2,3-dichlorpropylthioskupina, 3,3,3-trifluorpropylthioskupina, 3,3,3-trichlorpropylthioskupina, 2,2,3,3,3-pentafluorpropylthioskupina, heptafluorpropylthioskupina, 1-(fluor-methyl)-2-fluorethylthioskupina, 1-(chlormethyl)-2-chlorethylthioskupina, 1-(brommethyl)-2-bromethylthioskupina, 4-fluorbutylthioskupina, 4-chlorbutylthioskupina, 4-brombutylthioskupina a nonafluorbutylthioskupina;

alkylsulfonylová skupina s 1 až 4 atomy uhlíku (alkylová skupina s 1 až 4 atomy uhlíku-S(=O)₂-) a alkylsulfonylové části alkylsulfonyloxyskupiny s 1 až 4 atomy uhlíku: například methylsulfonyl, ethylsulfonyl, propylsulfonyl, 1-methylethylsulfonyl, butylsulfonyl, 1-methylpropylsulfonyl, 2-methylpropylsulfonyl a 1,1-dimethylethylsulfonyl;

alkylsulfonylová skupina s 1 až 6 atomy uhlíku a alkylsulfonylové části alkylsulfonyloxyskupiny s 1 až 6 atomy uhlíku: zbytek alkylsulfonylové skupiny s 1 až 4 atomy uhlíku jak je uveden výše a také například pentylsulfonyl, 1-methylbutylsulfonyl, 2-methylbutylsulfonyl, 3-methylbutylsulfonyl, 1,1-dimethylpropylsulfonyl, 1,2-dimethylpropylsulfonyl, 2,2-dimethylpropylsulfonyl, 1-ethylpropylsulfonyl, hexylsulfonyl, 1-methylpentylsulfonyl, 2-methylpentylsulfonyl, 3-methylpentylsulfonyl, 4-methylpentylsulfonyl, 1,1-dimethylbutylsulfonyl, 1,2-dimethyl-

butylsulfonyl, 1,3-dimethylbutylsulfonyl, 2,2-dimethylbutylsulfonyl, 2,3-dimethylbutylsulfonyl, 3,3-dimethylbutylsulfonyl, 1-ethylbutylsulfonyl, 2-ethylbutylsulfonyl, 1,1,2-trimethylpropylsulfonyl, 1,2,2-trimethylpropylsulfonyl, 1-ethyl-1-methylpropylsulfonyl a 1-ethyl-2-methylpropylsulfonyl;

halogenalkylsulfonylová skupina s 1 až 4 atomy uhlíku: zbytek alkylsulfonylové skupiny s 1 až 4 atomy uhlíku jak je uveden výše, který je částečně nebo zcela substituován fluorem, chlorem, bromem a/nebo jodem, tj. například, fluormethylsulfonyl, difluormethylsulfonyl, trifluormethylsulfonyl, chlordinfluormethylsulfonyl, bromdifluormethylsulfonyl, 2-fluorethylsulfonyl, 2-chlorethylsulfonyl, 2-bromethylsulfonyl, 2-jodethylsulfonyl, 2,2-difluorethylsulfonyl, 2,2,2-trifluorethylsulfonyl, 2-chlor-2-fluorethylsulfonyl, 2-chlor-2,2-difluorethylsulfonyl, 2,2-dichlor-2-fluorethylsulfonyl, 2,2,2-trichlorethylsulfonyl, pentafluorethylsulfonyl, 2-fluorpropylsulfonyl, 3-fluorpropylsulfonyl, 2-chlorpropylsulfonyl, 3-chlorpropylsulfonyl, 2-brompropylsulfonyl, 3-brompropylsulfonyl, 2,2-difluorpropylsulfonyl, 2,3-difluorpropylsulfonyl, 2,3-dichlorpropylsulfonyl, 3,3,3-trifluorpropylsulfonyl, 3,3,3-trichlorpropylsulfonyl, 2,2,3,3,3-pentafluorpropylsulfonyl, heptafluorpropylsulfonyl, 1-(fluormethyl)-2-fluorethylsulfonyl, 1-(chlormethyl)-2-chlorethylsulfonyl, 1-(brommethyl)-2-bromethylsulfonyl, 4-fluorbutylsulfonyl, 4-chlorbutylsulfonyl, 4-brombutylsulfonyl a nonafluorbutylsulfonyl;

alkenyloxyskupina se 3 až 6 atomy uhlíku: například

10 10 01

prop-1-en-1-yloxyskupina, prop-2-en-1-yloxyskupina,
 1-methylethylenyloxyskupina, buten-1-yloxyskupina,
 buten-2-yloxyskupina, buten-3-yloxyskupina, 1-me-
 thylprop-1-en-1-yloxyskupina, 2-methylprop-1-en-1-yl-
 oxyskupina, 1-methylprop-2-en-1-yloxyskupina, 2-me-
 thylprop-2-en-1-yloxyskupina, penten-1-yloxyskupina,
 penten-2-yloxyskupina, penten-3-yloxyskupina, penten-
 -4-yloxyskupina, 1-methylbut-1-en-1-yloxyskupina,
 2-methylbut-1-en-1-yloxyskupina, 3-methylbut-1-en-1-
 yloxyskupina, 1-methylbut-2-en-1-yloxyskupina, 2-me-
 thylbut-2-en-1-yloxyskupina, 3-methylbut-2-en-1-yl-
 oxyskupina, 1-methylbut-3-en-1-yloxyskupina, 2-methyl-
 but-3-en-1-yloxyskupina, 3-methylbut-3-en-1-yloxy-
 skupina, 1,1-dimethylprop-2-en-1-yloxyskupina, 1,2-di-
 methylprop-1-en-1-yloxyskupina, 1,2-dimethylprop-2-en-
 -1-yloxyskupina, 1-ethylprop-1-en-2-yloxyskupina,
 1-ethylprop-2-en-1-yloxyskupina, hex-1-en-1-yloxy-
 skupina, hex-2-en-1-yloxyskupina, hex-3-en-1-yloxy-
 skupina, hex-4-en-1-yloxyskupina, hex-5-en-1-yloxy-
 skupina, 1-methylpent-1-en-1-yloxyskupina, 2-methyl-
 pent-1-en-1-yloxyskupina, 3-methylpent-1-en-1-yl-
 oxyskupina, 4-methylpent-1-en-1-yloxyskupina, 1-me-
 thylpent-2-en-1-yloxyskupina, 2-methylpent-2-en-1-yl-
 oxyskupina, 3-methylpent-2-en-1-yloxyskupina, 4-me-
 thylpent-2-en-1-yloxyskupina, 1-methylpent-3-en-1-yl-
 oxyskupina, 2-methylpent-3-en-1-yloxyskupina, 3-me-
 thylpent-3-en-1-yloxyskupina, 4-methylpent-3-en-1-yl-
 oxyskupina, 1-methylpent-4-en-1-yloxyskupina, 2-me-
 thylpent-4-en-1-yloxyskupina, 3-methylpent-4-en-1-yl-
 oxyskupina, 4-methylpent-4-en-1-yloxyskupina,
 1,1-dimethylbut-2-en-1-yloxyskupina, 1,1-dimethylbut-
 -3-en-1-yloxyskupina, 1,2-dimethylbut-1-en-1-yloxy-
 skupina, 1,2-dimethylbut-2-en-1-yloxyskupina, 1,2-di-

10 10 01

methylbut-3-en-1-yloxyskupina, 1,3-dimethylbut-1-en-1-yloxyskupina, 1,3-dimethylbut-2-en-1-yloxyskupina, 1,3-dimethylbut-3-en-1-yloxyskupina, 2,2-dimethylbut-3-en-1-yloxyskupina, 2,3-dimethylbut-1-en-1-yloxyskupina, 2,3-dimethylbut-2-en-1-yloxyskupina, 2,3-dimethylbut-3-en-1-yloxyskupina, 3,3-dimethylbut-1-en-1-yloxyskupina, 3,3-dimethylbut-2-en-1-yloxyskupina, 1-ethylbut-1-en-1-yloxyskupina, 1-ethylbut-2-en-1-yloxyskupina, 1-ethylbut-3-en-1-yloxyskupina, 2-ethylbut-1-en-1-yloxyskupina, 2-ethylbut-2-en-1-yloxyskupina, 2-ethylbut-3-en-1-yloxyskupina, 1,1,2-trimethylprop-2-en-1-yloxyskupina, 1-ethyl-1-methylprop-2-en-1-yloxyskupina, 1-ethyl-2-methylprop-1-en-1-yloxyskupina a 1-ethyl-2-methylprop-2-en-1-yloxyskupina;

alkenylová skupina se 3 až 6 atomy uhlíku: prop-1-en-1-yl, prop-2-en-1-yl, 1-methylethenyl, buten-1-yl, buten-2-yl, buten-3-yl, 1-methylprop-1-en-1-yl, 2-methylprop-1-en-1-yl, 1-methylprop-2-en-1-yl, 2-methylprop-2-en-1-yl, penten-1-yl, penten-2-yl, penten-3-yl, penten-4-yl, 1-methylbut-1-en-1-yl, 2-methylbut-1-en-1-yl, 3-methylbut-1-en-1-yl, 1-methylbut-2-en-1-yl, 2-methylbut-2-en-1-yl, 3-methylbut-2-en-1-yl, 1-methylbut-3-en-1-yl, 2-methylbut-3-en-1-yl, 3-methylbut-3-en-1-yl, 1,1-dimethylprop-2-en-1-yl, 1,2-dimethylprop-1-en-1-yl, 1,2-dimethylprop-2-en-1-yl, 1-ethylprop-1-en-2-yl, 1-ethylprop-2-en-1-yl, hex-1-en-1-yl, hex-2-en-1-yl, hex-3-en-1-yl, hex-4-en-1-yl, hex-5-en-1-yl, 1-methylpent-1-en-1-yl, 2-methylpent-1-en-1-yl, 3-methylpent-1-en-1-yl, 4-methylpent-1-en-1-yl, 1-methylpent-2-en-1-yl, 2-methylpent-2-en-1-yl, 3-methylpent-2-en-1-yl, 4-methylpent-2-en-1-yl,

10. 10. 01

1-methylpent-3-en-1-yl, 2-methylpent-3-en-1-yl,
3-methylpent-3-en-1-yl, 4-methylpent-3-en-1-yl,
1-methylpent-4-en-1-yl, 2-methylpent-4-en-1-yl,
3-methylpent-4-en-1-yl, 4-methylpent-4-en-1-yl,
1,1-dimethylbut-2-en-1-yl, 1,1-dimethylbut-3-en-1-yl,
1,2-dimethylbut-1-en-1-yl, 1,2-dimethylbut-2-en-1-yl,
1,2-dimethylbut-3-en-1-yl, 1,3-dimethylbut-1-en-1-yl,
1,3-dimethylbut-2-en-1-yl, 1,3-dimethylbut-3-en-1-yl,
2,2-dimethylbut-3-en-1-yl, 2,3-dimethylbut-1-en-1-yl,
2,3-dimethylbut-2-en-1-yl, 2,3-dimethylbut-3-en-1-yl,
3,3-dimethylbut-1-en-1-yl, 3,3-dimethylbut-2-en-1-yl,
1-ethylbut-1-en-1-yl, 1-ethylbut-2-en-1-yl,
1-ethylbut-3-en-1-yl, 2-ethylbut-1-en-1-yl,
2-ethylbut-2-en-1-yl, 2-ethylbut-3-en-1-yl,
1,1,2-trimethylprop-2-en-1-yl, 1-ethyl-1-methylprop-2-
-en-1-yl, 1-ethyl-2-methylprop-1-en-1-yl a 1-ethyl-2-
-methylprop-2-en-1-yl.

Fenylové kruhy jsou výhodně nesubstituovány nebo
nesou 1 až 3 atomy halogenu a/nebo 1 nitroskupinu, 1
cyanoskupinu, 1 nebo 2 methyly, trifluormethyly,
methoxyskupiny nebo trifluormethoxyskupiny.

Vhodné jsou ty sloučeniny obecného vzorce I, kde

R^1 je hydroxyl, alkoxyskupina s 1 až 6 atomy uhlíku,
alkenyloxyskupina se 3 až 6 atomy uhlíku,
alkylsulfonyloxyskupina s 1 až 6 atomy uhlíku,
alkylkarbonyloxyskupina skupina s 1 až 6 atomy
uhlíku, fenylsulfonyloxyskupina nebo fenyl-
karbonyloxyskupina, kde fenylová část dvou
posledně uvedených substituentů může být částečně
nebo zcela halogenována a/nebo může nést 1 až 3

10.10.01

z následujících skupin: nitroskupina, kyanoskupina, alkylová skupina s 1 až 4 atomy uhlíku, halogenalkylová skupina s 1 až 4 atomy uhlíku, alkoxykupina s 1 až 4 atomy uhlíku nebo halogenalkoxykupina s 1 až 4 atomy uhlíku.

Výhodné jsou 3-(heterocyklyl)benzoylpyrazolové deriváty obecného vzorce I, kde:

je O;

je nitroskupina, atom halogenu, alkoxykupina s 1 až 4 atomy uhlíku nebo alkylthioskupina s 1 až 4 atomy uhlíku; zvláště výhodně nitroskupina, atom halogenu nebo alkoxykupina s 1 až 4 atomy uhlíku; obzvláště výhodně atom halogenu, jako je fluor, chlor nebo brom, nebo alkoxykupina s 1 až 4 atomy uhlíku, jako je methoxykupina nebo ethoxykupina; velmi obzvláště výhodně chlor nebo methoxykupina;

, R^3 , R^4 , R^5 jsou atom vodíku, alkylová skupina s 1 až 4 atomy uhlíku nebo halogenalkylová skupina s 1 až 4 atomy uhlíku, zvláště výhodně atom vodíku, methyl, ethyl, propyl, 1-methylethyl, fluormethyl nebo chlormethyl; obzvláště výhodně atom vodíku, methyl, ethyl nebo chlormethyl;

je alkylthioskupina s 1 až 4 atomy uhlíku nebo alkylsulfonylová skupina s 1 až 4 atomy uhlíku; zvláště výhodně methylthioskupina, ethylthioskupina nebo 1-methyl-1-ethylthioskupina, methylsulfonyl, ethylsulfonyl, 1-methylethyl-

sulfonyl nebo propylsulfonyl; obzvláště výhodně
methylsulfonyl, ethylsulfonyl, 1-methylethyl-
sulfonyl nebo propylsulfonyl;

R⁷

je hydroxyl, alkoxy skupina s 1 až 6 atomy uhlíku,
alkenyloxy skupina se 3 až 6 atomy uhlíku,
alkylsulfonyloxy skupina s 1 až 6 atomy uhlíku,
Alkylkarbonyloxy skupina s 1 až 6 atomy uhlíku,
(alkylthio)karbonyloxy skupina s 1 až 4 atomy
uhlíku, fenylsulfonyloxy- nebo fenylkarbonyl-
oxy skupina, kde fenylová část dvou posledně
zmiňovaných substituentů může být částečně nebo
zcela halogenována a/nebo může nést 1 až 3
z následujících skupin: nitro skupina,
kyan skupina, alkylová skupina s 1 až 4 atomy
uhlíku, halogenalkylová skupina s 1 až 4 atomy
uhlíku, alkoxy skupina s 1 až 4 atomy uhlíku nebo
halogenalkoxy skupina s 1 až 4 atomy uhlíku;
zvláště výhodně hydroxyl, alkoxy skupina s 1 až 4
atomy uhlíku, alkenyloxy skupina se 3 až 6 atomy
uhlíku, alkylsulfonyloxy skupina s 1 až 4 atomy
uhlíku, alkylkarbonyloxy skupina skupina s 1 až 4
atomy uhlíku, fenylsulfonyloxy- nebo fenylkarbo-
nyloxy skupina, kde fenylová část dvou posledně
uvedených substituentů může být částečně nebo
zcela halogenována a/nebo může nést 1 až 3
z následujících skupin: nitro skupina,
kyan skupina, alkylová skupina s 1 až 4 atomy
uhlíku, halogenalkylová skupina s 1 až 4 atomy
uhlíku, alkoxy skupina s 1 až 4 atomy uhlíku nebo
halogenalkoxy skupina s 1 až 4 atomy uhlíku;

R⁸, R⁹

jsou alkylová skupina s 1 až 4 atomy uhlíku; zvláště výhodně methyl, ethyl, propyl, 1-methyl-1-ethyl, butyl, 1-methyl-1-propyl a 2-methyl-1-propyl;

R¹⁰

je atom vodíku nebo alkylová skupina s 1 až 4 atomy uhlíku; zvláště výhodně alkylová skupina s 1 až 4 atomy uhlíku; obzvláště výhodně methyl, ethyl nebo propyl;

R¹¹

je atom vodíku nebo alkylová skupina s 1 až 4 atomy uhlíku; zvláště výhodně atom vodíku nebo methyl.

Zvláště výhodné jsou ty 3-(heterocyklyl)benzoyl-pyrazolové deriváty obecného vzorce I, kde

R¹

je atom halogenu nebo alkoxykupina s 1 až 4 atomy uhlíku; zvláště výhodně atom halogenu, jako je fluor, chlor nebo brom, nebo methoxykupina nebo ethoxykupina; obzvláště výhodně chlor nebo methoxykupina;

R²

je alkylsulfonylová skupina s 1 až 4 atomy uhlíku; zvláště výhodně methylsulfonyl, ethylsulfonyl, 1-methyl-1-ethylsulfonyl nebo propylsulfonyl;

R³

je hydroxyl, alkylsulfonyloxyskupina s 1 až 6 atomy uhlíku, alkylkarbonyloxyskupina s 1 až 6 atomy uhlíku, fenylsulfonyloxyskupina nebo fenylkarbonyloxyskupina, kde fenylová část dvou posledně uvedených substituentů může být částečně

nebo zcela halogenováno a/nebo může nést 1 až 3 z
následujících skupin: nitroskupina, kyanoskupina,
alkylová skupina s 1 až 4 atomy uhlíku,
halogenalkylová skupina s 1 až 4 atomy uhlíku,
alkoxyskupina s 1 až 4 atomy uhlíku nebo
halogenalkoxyskupina s 1 až 4 atomy uhlíku;
zvláště výhodně hydroxyl;

R^8, R^9 jsou alkylová skupina s 1 až 4 atomy uhlíku;

R^{10} je atom vodíku nebo alkylová skupina s 1 až 4
atomy uhlíku.

Velmi obzvláště výhodné jsou 3-(heterocyklyl)-
benzoylpyrazolové deriváty obecného vzorce I, kde

je alkylová skupiny se 2 až 4 atomy uhlíku,
například ethyl, 1-methyl-1-ethyl, propyl nebo
butyl;

je alkylová skupina s 1 až 4 atomy uhlíku,
například methyl nebo ethyl;

je atom vodíku nebo alkylová skupina s 1 až 4
atomy uhlíku, například methyl nebo ethyl.

Velmi obzvláště výhodné jsou také 3-(hetero-
cyklyl)benzoylpyrazolové deriváty obecného vzorce I, kde

R^8 je methyl;

R^9 je alkylová skupina s 1 až 4 atomy uhlíku,
například methyl, ethyl, propyl nebo butyl;

10.10.01

R^{10} je alkylová skupina s 1 až 4 atomy uhlíku, například methyl nebo ethyl.

Velmi obzvláště výhodné jsou také 3-(heterocyklyl)benzoylpyrazolové deriváty obecného vzorce I, kde

R^8, R^9 jsou methyl;

R^{10} je atom vodíku.

Výhodné jsou také 3-(heterocyklyl)benzoylpyrazolové deriváty obecného vzorce I, kde:

x je 0

R^1 je nitroskupina, atom halogenu, alkoxykupina s 1 až 4 atomy uhlíku nebo alkylthioskupina s 1 až 4 atomy uhlíku; zvláště výhodně nitroskupina, halogen nebo alkoxykupina s 1 až 4 atomy uhlíku; obzvláště výhodně atom halogenu, jako je fluor, chlor nebo brom, nebo alkoxykupina s 1 až 4 atomy uhlíku, jako je methoxykupina nebo ethoxykupina; velmi obzvláště výhodně chlor nebo methoxykupina;

R^2, R^3, R^4, R^5 jsou atom vodíku, alkylová skupina s 1 až 4 atomy uhlíku nebo halogenalkylová skupina s 1 až 4 atomy uhlíku; zvláště výhodně vodík, methyl, ethyl, propyl, 1-methyl-1-ethyl, chlormethyl nebo fluormethyl; obzvláště výhodně vodík, methyl, ethyl nebo chlormethyl;

R⁶

je atom halogenu, nitroskupina, halogenalkylová skupina s 1 až 4 atomy uhlíku, alkoxykupina s 1 až 4 atomy uhlíku nebo halogenalkoxykupina s 1 až 4 atomy uhlíku; zvláště výhodně atom halogenu, jako je chlor nebo brom, nitroskupina, halogenalkylová skupina s 1 nebo 2 atomy uhlíku, jako je difluormethyl nebo trifluormethyl, alkoxykupina s 1 a nebo 2 atomu uhlíku nebo halogenalkoxykupina s 1 nebo 2 atomy uhlíku, jako je difluormethoxykupina, chlordinfluormethoxykupina nebo trifluormethoxykupina;

R⁷

je hydroxyl, alkoxykupina s 1 až 6 atomy uhlíku, alkenyloxykupina se 3 až 6 atomy uhlíku, alkylsulfonyloxykupina s 1 až 6 atomy uhlíku, alkylkarbonyloxykupina s 1 až 6 atomy uhlíku, (alkylthio)karbonyloxykupina s 1 až 4 atomy uhlíku, fenylsulfonyloxykupina nebo fenylkarbonyloxykupina, kde fenylová část dvou posledně uvedených substituentů může být částečně nebo zcela halogenována a/nebo může nést 1 až 3 z následujících skupin: nitroskupina, kyanoskupina, alkylová skupina s 1 až 4 atomy uhlíku; halogenalkylová skupina s 1 až 4 atomy uhlíku, alkoxykupina s 1 až 4 atomy uhlíku nebo halogenalkoxykupina s 1 až 4 atomy uhlíku; zvláště výhodně hydroxyl, alkoxykupina s 1 až 4 atomy uhlíku, alkenyloxykupina se 3 až 6 atomy uhlíku, alkylsulfonyloxykupina s 1 až 4 atomy uhlíku, alkylkarbonyloxykupina s 1 až 4 atomy uhlíku, fenylsulfonyloxykupina nebo fenylkarbonyloxykupina, kde fenylová část dvou posledně uvedených substituentů může být částečně

nebo zcela halogenována a/nebo může nést 1 až 3 následujících skupin: nitroskupina, kyanoskupina, alkylová skupina s 1 až 4 atomy uhlíku, halogenalkylová skupina s 1 až 4 atomy uhlíku, alkoxykupina s 1 až 4 atomy uhlíku nebo halogenalkoxykupina s 1 až 4 atomy uhlíku;

R^8, R^9 jsou alkylová skupina s 1 až 4 atomy uhlíku; zvláště výhodně methyl, ethyl, propyl, 1-methyl-1-ethyl, butyl, 1-methyl-1-propyl a 2-methyl-1-propyl;

R^{10} je atom vodíku nebo alkylová skupina s 1 až 4 atomy uhlíku; zvláště výhodně alkylová skupina s 1 až 4 atomy uhlíku; obzvláště výhodně methyl, ethyl nebo propyl;

R^{11} je atom vodíku nebo alkylová skupina s 1 až 4 atomy uhlíku, zvláště výhodně hydrogen nebo methyl.

Zvláště výhodné jsou 3-(heterocyklyl)benzoyl-pyrazolové deriváty obecného vzorce I, kde

X je O;

R^1 je atom halogenu nebo alkoxykupina s 1 až 4 atomy uhlíku; zvláště výhodně atom halogenu, jako je fluor, chlor nebo brom, nebo methoxykupina nebo ethoxykupina; obzvláště výhodně chlor nebo methoxykupina;

R^6 je atom halogenu, nitroskupina, halogenalkylová

skupina s 1 až 4 atomy uhlíku, alkoxy skupina s 1 až 4 atomy uhlíku nebo halogenalkoxy skupina s 1 až 4 atomy uhlíku; zvláště výhodně atom halogenu, jako je chlor nebo brom, nitro skupina, halogenalkylová skupina s 1 nebo 2 atomy uhlíku, jako je difluormethyl nebo trifluormethyl, alkoxy skupina s 1 nebo 2 atomy uhlíku nebo halogenalkoxy skupina s 1 nebo 2 atomy uhlíku, jako je difluormethoxy skupina;

je hydroxyl, alkylsulfonyloxy skupina s 1 až 6 atomy uhlíku, alkylkarbonyloxy skupina s 1 až 6 atomy uhlíku, fenylsulfonyloxy skupina nebo fenylkarbonyloxy skupina, kde fenylová část dvou posledně uvedených substituentů může být částečně nebo zcela halogenována a/nebo může nést 1 až 3 z následujících skupin: nitro skupina, kyanoskupina, alkylová skupina s 1 až 4 atomy uhlíku, halogenalkylová skupina s 1 až 4 atomy uhlíku, alkoxy skupina s 1 až 4 atomy uhlíku nebo halogenalkoxy skupina s 1 až 4 atomy uhlíku; zvláště výhodně hydroxyl;

jsou alkylová skupina s 1 až 4 atomy uhlíku;

je atom vodíku nebo alkylová skupina s 1 až 4 atomy uhlíku.

Velmi obzvláště výhodné jsou 3-(heterocyklyl)-benzoylpyrazolové deriváty obecného vzorce I, kde

je alkylová skupina se 2 až 4 atomy uhlíku, například ethyl, 1-methyl-1-ethyl, propyl nebo

butyl;

je alkylová skupina s 1 až 4 atomy uhlíku,
například methyl nebo ethyl;

je atom vodíku nebo alkylová skupina s 1 až 4
atomy uhlíku, například methyl nebo ethyl.

Velmi obzvláště výhodné jsou také 3-(hetero-
cyklyl)benzoylpyrazolové deriváty obecného vzorce I, kde

je methyl;

je alkylová skupina s 1 až 4 atomy uhlíku,
například methyl, ethyl, propyl nebo butyl;

je alkylová skupina s 1 až 4 atomy uhlíku,
například methyl nebo ethyl.

Velmi obzvláště výhodné jsou také 3-(hetero-
cyklyl)benzoylpyrazolové deriváty obecného vzorce I, kde

, R⁹ jsou methyl;

je atom vodíku.

Výhodné jsou také 3-(heterocyklyl)-substituované
benzoylpyrazoly [přesná citace] obecného vzorce I, kde:

je N(alkylová skupina s 1 až 6 atomy uhlíku);
zvláště výhodně N-methyl, N-ethyl, N-(1-methyl-1-
ethyl) nebo N-propyl;

je nitroskupina, atom halogenu, alkoxykupina s 1 až 4 atomy uhlíku nebo alkylthioskupina s 1 až 4 atomy uhlíku; zvláště výhodně nitroskupina, atom halogenu nebo alkoxykupina s 1 až 4 atomy uhlíku; obzvláště výhodně atom halogenu, jako je fluor, chlor nebo brom, nebo alkoxykupina s 1 až 4 atomy uhlíku, jako je methoxykupina nebo ethoxykupina; velmi obzvláště výhodně chlor nebo methoxykupina;

, R^3 , R^4 , R^5 jsou atom vodíku, alkylová skupina s 1 až 4 atomy uhlíku nebo halogenalkylová skupina s 1 až 4 atomy uhlíku; zvláště výhodně hydrogen, methyl, ethyl, propyl, 1-methyl-1-ethyl, fluormethyl nebo chlormethyl; obzvláště výhodně hydrogen, methyl, ethyl nebo chlormethyl;

je atom halogenu, nitroskupina, halogenalkylová skupina s 1 až 4 atomy uhlíku, alkoxykupina s 1 až 4 atomy uhlíku, halogenalkoxykupina s 1 až 4 atomy uhlíku, alkylthioskupina s 1 až 4 atomy uhlíku, halogenalkylthioskupina s 1 až 4 atomy uhlíku, alkylsulfonylová skupina s 1 až 4 atomy uhlíku nebo halogenalkylsulfonylová skupina s 1 až 4 atomy uhlíku; zvláště výhodně atom halogenu, jako je fluor, chlor nebo brom, nitroskupina, halogenalkylová skupina s 1 až 4 atomy uhlíku, jako je difluormethyl nebo trifluormethyl, alkoxykupina s 1 až 4 atomy uhlíku, jako je methoxykupina nebo ethoxykupina, halogenalkoxykupina s 1 až 4 atomy uhlíku, jako je difluormethoxykupina, chlordinfluormethoxykupina nebo trifluormethoxykupina, alkylthioskupina s 1

až 4 atomy uhlíku, jako je methylthioskupina nebo ethylthioskupina, nebo alkylsulfonylová skupina s 1 až 4 atomy uhlíku, jako je methylsulfonyl, ethylsulfonyl, 1-methyl-1-ethylsulfonyl nebo propylsulfonyl;

je hydroxyl, alkoxykupina s 1 až 6 atomy uhlíku, alkenyloxyskupina se 3 až 6 atomy uhlíku, alkylsulfonyloxyskupina s 1 až 6 atomy uhlíku, alkylkarbonyloxyskupina s 1 až 6 atomy uhlíku, (alkylthio)karbonyloxyskupina s 1 až 4 atomy uhlíku, fenylsulfonyloxyskupina nebo fenylkarbonyloxyskupina, kde fenylová část dvou posledně uvedených substituentů může být částečně nebo zcela halogenována a/nebo může nést 1 až 3 z následujících skupin: nitroskupina, kyano-skupina, alkylová skupina s 1 až 4 atomy uhlíku, halogenalkylová skupina s 1 až 4 atomy uhlíku, alkoxykupina s 1 až 4 atomy uhlíku nebo halogenalkoxykupina s 1 až 4 atomy uhlíku; zvláště výhodně hydroxyl, alkoxykupina s 1 až 4 atomy uhlíku, alkenyloxyskupina se 3 až 6 atomy uhlíku, alkylsulfonyloxyskupina s 1 až 4 atomy uhlíku, alkylkarbonyloxyskupina s 1 až 4 atomy uhlíku, fenylsulfonyloxyskupina nebo fenylkarbonyloxyskupina, kde fenylová část dvou posledně uvedených substituentů může být částečně nebo zcela halogenována a/nebo může nést 1 až 3 z následujících skupin: nitroskupina, kyanoskupina, alkylová skupina s 1 až 4 atomy uhlíku, halogenalkylová skupina s 1 až 4 atomy uhlíku, alkoxykupina s 1 až 4 atomy uhlíku nebo halogenalkoxykupina s 1 až 4 atomy uhlíku;

R^8, R^9 jsou alkylová skupina s 1 až 4 atomy uhlíku; zvláště výhodně methyl, ethyl, propyl, 1-methyl-1-ethyl, butyl, 1-methyl-1-propyl a 2-methyl-1-propyl;

R^{10} je atom vodíku nebo alkylová skupina s 1 až 4 atomy uhlíku; zvláště výhodně alkylová skupina s 1 až 4 atomy uhlíku; obzvláště výhodně methyl, ethyl nebo propyl;

R^{11} je atom vodíku nebo alkylová skupina s 1 až 4 atomy uhlíku; zvláště výhodně hydrogen nebo methyl.

Zvláště výhodné jsou 3-(heterocyklyl)benzoyl-pyrazolové deriváty obecného vzorce I, kde

je hydroxyl, alkylsulfonyloxyskupina s 1 až 6 atomy uhlíku, alkylkarbonyloxyskupina s 1 až 6 atomy uhlíku, fenylsulfonyloxyskupina nebo fenylkarbonyloxyskupina, kde fenylová část dvou posledně uvedených substituentů může být částečně nebo zcela halogenována a/nebo může nést 1 až 3 z následujících skupin: nitroskupina, kyano-skupina, alkylová skupina s 1 až 4 atomy uhlíku, halogenalkylová skupina s 1 až 4 atomy uhlíku, alkoxyskupina s 1 až 4 atomy uhlíku nebo halogenalkoxyskupina s 1 až 4 atomy uhlíku; zvláště výhodně hydroxyl.

Obdobně výhodné jsou 3-(heterocyklyl)benzoyl-

pyrazolové deriváty obecného vzorce I, kde proměnné mají význam definovaný dále:

X je 0;

R^1 je atom halogenu nebo alkoxy skupina s 1 až 4 atomy uhlíku; zvláště výhodně fluor, chlor, brom, methoxy skupina nebo ethoxy skupina; zvláště výhodně chlor nebo methoxy skupina;

R^2, R^3, R^4, R^5 jsou atom vodíku hydrogen;

R^6 je alkylsulfonylová skupina s 1 až 4 atomy uhlíku; zvláště výhodně methylsulfonyl;

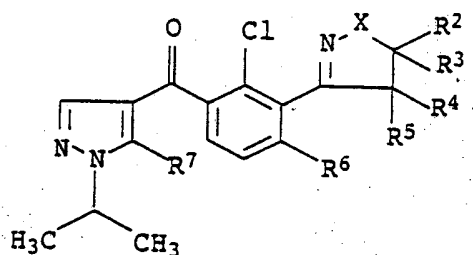
R^7 je hydroxyl, alkoxy skupina s 1 až 6 atomy uhlíku, (alkylthio)karbonyloxyskupina s 1 až 4 atomy uhlíku nebo fenyلكarbonyloxyskupina, kde fenylová část může být částečně nebo zcela halogenována a/nebo může nést 1 až 3 z následujících skupin: nitroskupina, kyanoskupina, alkylová skupina s 1 až 4 atomy uhlíku, halogenalkylová skupina s 1 až 4 atomy uhlíku, alkoxy skupina s 1 až 4 atomy uhlíku nebo halogenalkoxy skupina s 1 až 4 atomy uhlíku; zvláště výhodně hydroxyl, alkoxy skupina s 1 až 6 atomy uhlíku nebo fenyلكarbonyloxyskupina, kde fenylová část může být částečně nebo zcela halogenována a/nebo může nést 1 až 3 z následujících skupin: nitroskupina, kyanoskupina, alkylová skupina s 1 až 4 atomy uhlíku, halogenalkylová skupina s 1 až 4 atomy uhlíku, alkoxy skupina s 1 až 4 atomy uhlíku nebo halogenalkoxy skupina s 1 až 4 atomy uhlíku;

R^8, R^9 jsou alkylová skupina s 1 až 4 atomy uhlíku;

R^{10} je atom vodíku nebo alkylová skupina s 1 až 4 atomy uhlíku;

R^{11} je atom vodíku.

Velmi obzvláště výhodné jsou sloučeniny obecného vzorce Ia1 ($\equiv I$, kde $R^1 = Cl$; $R^8, R^9 = CH_3$; $R^{10}, R^{11} = H$), zvláště sloučeniny Ia1.1 až Ia1.300 z tabulky 1, kde definice zbytků X a R^1 až R^{11} mají obzvláštní význam pro sloučeniny podle tohoto vynálezu, nikoli pouze ve vzájemné kombinaci, ale v každém případě i samotné.



Ia1

Tabulka 1

Č.	X	R^2	R^3	R^4	R^5	R^6	R^7
Ia1.1	O	H	H	H	H	SCH ₃	OH
Ia1.2	O	H	H	H	H	SCH ₂ CH ₃	OH
Ia1.3	O	H	H	H	H	SO ₂ CH ₃	OH
Ia1.4	O	H	H	H	H	SO ₂ CH ₂ CH ₃	OH
Ia1.5	O	H	H	H	H	SO ₂ CH(CH ₃) ₂	OH
Ia1.6	O	H	H	H	H	SO ₂ (CH ₂) ₂ CH ₃	OH
Ia1.7	O	H	H	H	H	Cl	OH
Ia1.8	O	H	H	H	H	Br	OH

C.	X	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷
Ial.9	O	H	H	H	H	NO ₂	OH
Ial.10	O	H	H	H	H	CHF ₂	OH
Ial.11	O	H	H	H	H	CF ₃	OH
Ial.12	O	H	H	H	H	OCH ₃	OH
Ial.13	O	H	H	H	H	OCH ₂ CH ₃	OH
Ial.14	O	H	H	H	H	OCHF ₂	OH
Ial.15	O	H	H	H	H	OCF ₃	OH
Ial.16	O	CH ₃	H	H	H	SCH ₃	OH
Ial.17	O	CH ₃	H	H	H	SCH ₂ CH ₃	OH
Ial.18	O	CH ₃	H	H	H	SO ₂ CH ₃	OH
Ial.19	O	CH ₃	H	H	H	SO ₂ CH ₂ CH ₃	OH
Ial.20	O	CH ₃	H	H	H	SO ₂ CH(CH ₃) ₂	OH
Ial.21	O	CH ₃	H	H	H	SO ₂ (CH ₂) ₂ CH ₃	OH
Ial.22	O	CH ₃	H	H	H	Cl	OH
Ial.23	O	CH ₃	H	H	H	Br	OH
Ial.24	O	CH ₃	H	H	H	NO ₂	OH
Ial.25	O	CH ₃	H	H	H	CHF ₂	OH
Ial.26	O	CH ₃	H	H	H	CF ₃	OH
Ial.27	O	CH ₃	H	H	H	OCH ₃	OH
Ial.28	O	CH ₃	H	H	H	OCH ₂ CH ₃	OH
Ial.29	O	CH ₃	H	H	H	OCHF ₂	OH
Ial.30	O	CH ₃	H	H	H	OCF ₃	OH
Ial.31	O	H	H	CH ₃	H	SCH ₃	OH
Ial.32	O	H	H	CH ₃	H	SCH ₂ CH ₃	OH
Ial.33	O	H	H	CH ₃	H	SO ₂ CH ₃	OH
Ial.34	O	H	H	CH ₃	H	SO ₂ CH ₂ CH ₃	OH
Ial.35	O	H	H	CH ₃	H	SO ₂ CH(CH ₃) ₂	OH
Ial.36	O	H	H	CH ₃	H	SO ₂ (CH ₂) ₂ CH ₃	OH
Ial.37	O	H	H	CH ₃	H	Cl	OH
Ial.38	O	H	H	CH ₃	H	Br	OH
Ial.39	O	H	H	CH ₃	H	NO ₂	OH
Ial.40	O	H	H	CH ₃	H	CHF ₂	OH
Ial.41	O	H	H	CH ₃	H	CF ₃	OH
Ial.42	O	H	H	CH ₃	H	OCH ₃	OH
Ial.43	O	H	H	CH ₃	H	OCH ₂ CH ₃	OH
Ial.44	O	H	H	CH ₃	H	OCHF ₂	OH
Ial.45	O	H	H	CH ₃	H	OCF ₃	OH
Ial.46	O	CH ₃	CH ₃	H	H	SCH ₃	OH
Ial.47	O	CH ₃	CH ₃	H	H	SCH ₂ CH ₃	OH

C.	X	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷
Ial.48	O	CH ₃	CH ₃	H	H	SO ₂ CH ₃	OH
Ial.49	O	CH ₃	CH ₃	H	H	SO ₂ CH ₂ CH ₃	OH
Ial.50	O	CH ₃	CH ₃	H	H	SO ₂ CH(CH ₃) ₂	OH
Ial.51	O	CH ₃	CH ₃	H	H	SO ₂ (CH ₂) ₂ CH ₃	OH
Ial.52	O	CH ₃	CH ₃	H	H	Cl	OH
Ial.53	O	CH ₃	CH ₃	H	H	Br	OH
Ial.54	O	CH ₃	CH ₃	H	H	NO ₂	OH
Ial.55	O	CH ₃	CH ₃	H	H	CHF ₂	OH
Ial.56	O	CH ₃	CH ₃	H	H	CF ₃	OH
Ial.57	O	CH ₃	CH ₃	H	H	OCH ₃	OH
Ial.58	O	CH ₃	CH ₃	H	H	OCH ₂ CH ₃	OH
Ial.59	O	CH ₃	CH ₃	H	H	OCHF ₂	OH
Ial.60	O	CH ₃	CH ₃	H	H	OCF ₃	OH
Ial.61	O	CH ₃	H	CH ₃	H	SCH ₃	OH
Ial.62	O	CH ₃	H	CH ₃	H	SCH ₂ CH ₃	OH
Ial.63	O	CH ₃	H	CH ₃	H	SO ₂ CH ₃	OH
Ial.64	O	CH ₃	H	CH ₃	H	SO ₂ CH ₂ CH ₃	OH
Ial.65	O	CH ₃	H	CH ₃	H	SO ₂ CH(CH ₃) ₂	OH
Ial.66	O	CH ₃	H	CH ₃	H	SO ₂ (CH ₂) ₂ CH ₃	OH
Ial.67	O	CH ₃	H	CH ₃	H	Cl	OH
Ial.68	O	CH ₃	H	CH ₃	H	Br	OH
Ial.69	O	CH ₃	H	CH ₃	H	NO ₂	OH
Ial.70	O	CH ₃	H	CH ₃	H	CHF ₂	OH
Ial.71	O	CH ₃	H	CH ₃	H	CF ₃	OH
Ial.72	O	CH ₃	H	CH ₃	H	OCH ₃	OH
Ial.73	O	CH ₃	H	CH ₃	H	OCH ₂ CH ₃	OH
Ial.74	O	CH ₃	H	CH ₃	H	OCHF ₂	OH
Ial.75	O	CH ₃	H	CH ₃	H	OCF ₃	OH
Ial.76	O	H	H	CH ₃	CH ₃	SCH ₃	OH
Ial.77	O	H	H	CH ₃	CH ₃	SCH ₂ CH ₃	OH
Ial.78	O	H	H	CH ₃	CH ₃	SO ₂ CH ₃	OH
Ial.79	O	H	H	CH ₃	CH ₃	SO ₂ CH ₂ CH ₃	OH
Ial.80	O	H	H	CH ₃	CH ₃	SO ₂ CH(CH ₃) ₂	OH
Ial.81	O	H	H	CH ₃	CH ₃	SO ₂ (CH ₂) ₂ CH ₃	OH
Ial.82	O	H	H	CH ₃	CH ₃	Cl	OH
Ial.83	O	H	H	CH ₃	CH ₃	Br	OH
Ial.84	O	H	H	CH ₃	CH ₃	NO ₂	OH
Ial.85	O	H	H	CH ₃	CH ₃	CHF ₂	OH
Ial.86	O	H	H	CH ₃	CH ₃	CF ₃	OH

10.10.01

C	X	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷
Ial.87	O	H	H	CH ₃	CH ₃	OCH ₃	OH
Ial.88	O	H	H	CH ₃	CH ₃	OCH ₂ CH ₃	OH
Ial.89	O	H	H	CH ₃	CH ₃	OCHF ₂	OH
Ial.90	O	H	H	CH ₃	CH ₃	OCF ₃	OH
Ial.91	O	CH ₃	CH ₃	CH ₃	H	SCH ₃	OH
Ial.92	O	CH ₃	CH ₃	CH ₃	H	SCH ₂ CH ₃	OH
Ial.93	O	CH ₃	CH ₃	CH ₃	H	SO ₂ CH ₃	OH
Ial.94	O	CH ₃	CH ₃	CH ₃	H	SO ₂ CH ₂ CH ₃	OH
Ial.95	O	CH ₃	CH ₃	CH ₃	H	SO ₂ CH(CH ₃) ₂	OH
Ial.96	O	CH ₃	CH ₃	CH ₃	H	SO ₂ (CH ₂) ₂ CH ₃	OH
Ial.97	O	CH ₃	CH ₃	CH ₃	H	Cl	OH
Ial.98	O	CH ₃	CH ₃	CH ₃	H	Br	OH
Ial.99	O	CH ₃	CH ₃	CH ₃	H	NO ₂	OH
Ial.100	O	CH ₃	CH ₃	CH ₃	H	CHF ₂	OH
Ial.101	O	CH ₃	CH ₃	CH ₃	H	CF ₃	OH
Ial.102	O	CH ₃	CH ₃	CH ₃	H	OCH ₃	OH
Ial.103	O	CH ₃	CH ₃	CH ₃	H	OCH ₂ CH ₃	OH
Ial.104	O	CH ₃	CH ₃	CH ₃	H	OCHF ₂	OH
Ial.105	O	CH ₃	CH ₃	CH ₃	H	OCF ₃	OH
Ial.106	O	CH ₃	H	CH ₃	CH ₃	SCH ₃	OH
Ial.107	O	CH ₃	H	CH ₃	CH ₃	SCH ₂ CH ₃	OH
Ial.108	O	CH ₃	H	CH ₃	CH ₃	SO ₂ CH ₃	OH
Ial.109	O	CH ₃	H	CH ₃	CH ₃	SO ₂ CH ₂ CH ₃	OH
Ial.110	O	CH ₃	H	CH ₃	CH ₃	SO ₂ CH(CH ₃) ₂	OH
Ial.111	O	CH ₃	H	CH ₃	CH ₃	SO ₂ (CH ₂) ₂ CH ₃	OH
Ial.112	O	CH ₃	H	CH ₃	CH ₃	Cl	OH
Ial.113	O	CH ₃	H	CH ₃	CH ₃	Br	OH
Ial.114	O	CH ₃	H	CH ₃	CH ₃	NO ₂	OH
Ial.115	O	CH ₃	H	CH ₃	CH ₃	CHF ₂	OH
Ial.116	O	CH ₃	H	CH ₃	CH ₃	CF ₃	OH
Ial.117	O	CH ₃	H	CH ₃	CH ₃	OCH ₃	OH
Ial.118	O	CH ₃	H	CH ₃	CH ₃	OCH ₂ CH ₃	OH
Ial.119	O	CH ₃	H	CH ₃	CH ₃	OCHF ₂	OH
Ial.120	O	CH ₃	H	CH ₃	CH ₃	OCF ₃	OH
Ial.121	O	CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃	SCH ₃	OH
Ial.122	O	CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃	SCH ₂ CH ₃	OH
Ial.123	O	CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃	SO ₂ CH ₃	OH
Ial.124	O	CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃	SO ₂ CH ₂ CH ₃	OH
Ial.125	O	CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃	SO ₂ CH(CH ₃) ₂	OH

$\check{C}$	X	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷
Ial.126	O	CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃	SO ₂ (CH ₂) ₂ CH ₃	OH
Ial.127	O	CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃	Cl	OH
Ial.128	O	CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃	Br	OH
Ial.129	O	CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃	NO ₂	OH
Ial.130	O	CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃	CHF ₂	OH
Ial.131	O	CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃	CF ₃	OH
Ial.132	O	CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃	OCH ₃	OH
Ial.133	O	CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃	OCH ₂ CH ₃	OH
Ial.134	O	CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃	OCHF ₂	OH
Ial.135	O	CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃	OCF ₃	OH
Ial.136	O	CH ₂ Cl	H	H	H	SCH ₃	OH
Ial.137	O	CH ₂ Cl	H	H	H	SCH ₂ CH ₃	OH
Ial.138	O	CH ₂ Cl	H	H	H	SO ₂ CH ₃	OH
Ial.139	O	CH ₂ Cl	H	H	H	SO ₂ CH ₂ CH ₃	OH
Ial.140	O	CH ₂ Cl	H	H	H	SO ₂ CH(CH ₃) ₂	OH
Ial.141	O	CH ₂ Cl	H	H	H	SO ₂ (CH ₂) ₂ CH ₃	OH
Ial.142	O	CH ₂ Cl	H	H	H	Cl	OH
Ial.143	O	CH ₂ Cl	H	H	H	Br	OH
Ial.144	O	CH ₂ Cl	H	H	H	NO ₂	OH
Ial.145	O	CH ₂ Cl	H	H	H	CHF ₂	OH
Ial.146	O	CH ₂ Cl	H	H	H	CF ₃	OH
Ial.147	O	CH ₂ Cl	H	H	H	OCH ₃	OH
Ial.148	O	CH ₂ Cl	H	H	H	OCH ₂ CH ₃	OH
Ial.149	O	CH ₂ Cl	H	H	H	OCHF ₂	OH
Ial.150	O	CH ₂ Cl	H	H	H	OCF ₃	OH
Ial.151	NCH ₃	H	H	H	H	SCH ₃	OH
Ial.152	NCH ₃	H	H	H	H	SCH ₂ CH ₃	OH
Ial.153	NCH ₃	H	H	H	H	SO ₂ CH ₃	OH
Ial.154	NCH ₃	H	H	H	H	SO ₂ CH ₂ CH ₃	OH
Ial.155	NCH ₃	H	H	H	H	SO ₂ CH(CH ₃) ₂	OH
Ial.156	NCH ₃	H	H	H	H	SO ₂ (CH ₂) ₂ CH ₃	OH
Ial.157	NCH ₃	H	H	H	H	Cl	OH
Ial.158	NCH ₃	H	H	H	H	Br	OH
Ial.159	NCH ₃	H	H	H	H	NO ₂	OH
Ial.160	NCH ₃	H	H	H	H	CHF ₂	OH
Ial.161	NCH ₃	H	H	H	H	CF ₃	OH
Ial.162	NCH ₃	H	H	H	H	OCH ₃	OH
Ial.163	NCH ₃	H	H	H	H	OCH ₂ CH ₃	OH
Ial.164	NCH ₃	H	H	H	H	OCHF ₂	OH

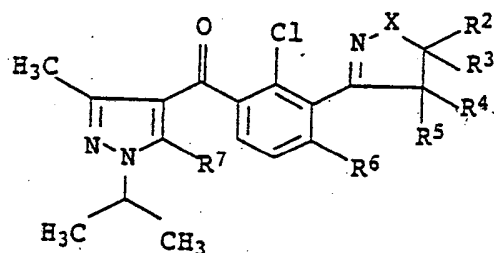
IČ.	X	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷
Ial.165	NCH ₃	H	H	H	H	OCF ₃	OH
Ial.166	NCH ₃	CH ₃	H	H	H	SCH ₃	OH
Ial.167	NCH ₃	CH ₃	H	H	H	SCH ₂ CH ₃	OH
Ial.168	NCH ₃	CH ₃	H	H	H	SO ₂ CH ₃	OH
Ial.169	NCH ₃	CH ₃	H	H	H	SO ₂ CH ₂ CH ₃	OH
Ial.170	NCH ₃	CH ₃	H	H	H	SO ₂ CH(CH ₃) ₂	OH
Ial.171	NCH ₃	CH ₃	H	H	H	SO ₂ (CH ₂) ₂ CH ₃	OH
Ial.172	NCH ₃	CH ₃	H	H	H	Cl	OH
Ial.173	NCH ₃	CH ₃	H	H	H	Br	OH
Ial.174	NCH ₃	CH ₃	H	H	H	NO ₂	OH
Ial.175	NCH ₃	CH ₃	H	H	H	CHF ₂	OH
Ial.176	NCH ₃	CH ₃	H	H	H	CF ₃	OH
Ial.177	NCH ₃	CH ₃	H	H	H	OCH ₃	OH
Ial.178	NCH ₃	CH ₃	H	H	H	OCH ₂ CH ₃	OH
Ial.179	NCH ₃	CH ₃	H	H	H	OCHF ₂	OH
Ial.180	NCH ₃	CH ₃	H	H	H	OCF ₃	OH
Ial.181	NCH ₃	H	H	CH ₃	H	SCH ₃	OH
Ial.182	NCH ₃	H	H	CH ₃	H	SCH ₂ CH ₃	OH
Ial.183	NCH ₃	H	H	CH ₃	H	SO ₂ CH ₃	OH
Ial.184	NCH ₃	H	H	CH ₃	H	SO ₂ CH ₂ CH ₃	OH
Ial.185	NCH ₃	H	H	CH ₃	H	SO ₂ CH(CH ₃) ₂	OH
Ial.186	NCH ₃	H	H	CH ₃	H	SO ₂ (CH ₂) ₂ CH ₃	OH
Ial.187	NCH ₃	H	H	CH ₃	H	Cl	OH
Ial.188	NCH ₃	H	H	CH ₃	H	Br	OH
Ial.189	NCH ₃	H	H	CH ₃	H	NO ₂	OH
Ial.190	NCH ₃	H	H	CH ₃	H	CHF ₂	OH
Ial.191	NCH ₃	H	H	CH ₃	H	CF ₃	OH
Ial.192	NCH ₃	H	H	CH ₃	H	OCH ₃	OH
Ial.193	NCH ₃	H	H	CH ₃	H	OCH ₂ CH ₃	OH
Ial.194	NCH ₃	H	H	CH ₃	H	OCHF ₂	OH
Ial.195	NCH ₃	H	H	CH ₃	H	OCF ₃	OH
Ial.196	NCH ₃	CH ₃	CH ₃	H	H	SCH ₃	OH
Ial.197	NCH ₃	CH ₃	CH ₃	H	H	SCH ₂ CH ₃	OH
Ial.198	NCH ₃	CH ₃	CH ₃	H	H	SO ₂ CH ₃	OH
Ial.199	NCH ₃	CH ₃	CH ₃	H	H	SO ₂ CH ₂ CH ₃	OH
Ial.200	NCH ₃	CH ₃	CH ₃	H	H	SO ₂ CH(CH ₃) ₂	OH
Ial.201	NCH ₃	CH ₃	CH ₃	H	H	SO ₂ (CH ₂) ₂ CH ₃	OH
Ial.202	NCH ₃	CH ₃	CH ₃	H	H	Cl	OH
Ial.203	NCH ₃	CH ₃	CH ₃	H	H	Br	OH

$\check{C}$	X	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷
Ial.204	NCH ₃	CH ₃	CH ₃	H	H	NO ₂	OH
Ial.205	NCH ₃	CH ₃	CH ₃	H	H	CHF ₂	OH
Ial.206	NCH ₃	CH ₃	CH ₃	H	H	CF ₃	OH
Ial.207	NCH ₃	CH ₃	CH ₃	H	H	OCH ₃	OH
Ial.208	NCH ₃	CH ₃	CH ₃	H	H	OCH ₂ CH ₃	OH
Ial.209	NCH ₃	CH ₃	CH ₃	H	H	OCHF ₂	OH
Ial.210	NCH ₃	CH ₃	CH ₃	H	H	OCF ₃	OH
Ial.211	NCH ₃	CH ₃	H	CH ₃	H	SCH ₃	OH
Ial.212	NCH ₃	CH ₃	H	CH ₃	H	SCH ₂ CH ₃	OH
Ial.213	NCH ₃	CH ₃	H	CH ₃	H	SO ₂ CH ₃	OH
Ial.214	NCH ₃	CH ₃	H	CH ₃	H	SO ₂ CH ₂ CH ₃	OH
Ial.215	NCH ₃	CH ₃	H	CH ₃	H	SO ₂ CH(CH ₃) ₂	OH
Ial.216	NCH ₃	CH ₃	H	CH ₃	H	SO ₂ (CH ₂) ₂ CH ₃	OH
Ial.217	NCH ₃	CH ₃	H	CH ₃	H	Cl	OH
Ial.218	NCH ₃	CH ₃	H	CH ₃	H	Br	OH
Ial.219	NCH ₃	CH ₃	H	CH ₃	H	NO ₂	OH
Ial.220	NCH ₃	CH ₃	H	CH ₃	H	CHF ₂	OH
Ial.221	NCH ₃	CH ₃	H	CH ₃	H	CF ₃	OH
Ial.222	NCH ₃	CH ₃	H	CH ₃	H	OCH ₃	OH
Ial.223	NCH ₃	CH ₃	H	CH ₃	H	OCH ₂ CH ₃	OH
Ial.224	NCH ₃	CH ₃	H	CH ₃	H	OCHF ₂	OH
Ial.225	NCH ₃	CH ₃	H	CH ₃	H	OCF ₃	OH
Ial.226	NCH ₃	H	H	CH ₃	CH ₃	SCH ₃	OH
Ial.227	NCH ₃	H	H	CH ₃	CH ₃	SCH ₂ CH ₃	OH
Ial.228	NCH ₃	H	H	CH ₃	CH ₃	SO ₂ CH ₃	OH
Ial.229	NCH ₃	H	H	CH ₃	CH ₃	SO ₂ CH ₂ CH ₃	OH
Ial.230	NCH ₃	H	H	CH ₃	CH ₃	SO ₂ CH(CH ₃) ₂	OH
Ial.231	NCH ₃	H	H	CH ₃	CH ₃	SO ₂ (CH ₂) ₂ CH ₃	OH
Ial.232	NCH ₃	H	H	CH ₃	CH ₃	Cl	OH
Ial.233	NCH ₃	H	H	CH ₃	CH ₃	Br	OH
Ial.234	NCH ₃	H	H	CH ₃	CH ₃	NO ₂	OH
Ial.235	NCH ₃	H	H	CH ₃	CH ₃	CHF ₂	OH
Ial.236	NCH ₃	H	H	CH ₃	CH ₃	CF ₃	OH
Ial.237	NCH ₃	H	H	CH ₃	CH ₃	OCH ₃	OH
Ial.238	NCH ₃	H	H	CH ₃	CH ₃	OCH ₂ CH ₃	OH
Ial.239	NCH ₃	H	H	CH ₃	CH ₃	OCHF ₂	OH
Ial.240	NCH ₃	H	H	CH ₃	CH ₃	OCF ₃	OH
Ial.241	NCH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃	H	SCH ₃	OH
Ial.242	NCH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃	H	SCH ₂ CH ₃	OH

C.	X	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷
Ial.243	NCH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃	H	SO ₂ CH ₃	OH
Ial.244	NCH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃	H	SO ₂ CH ₂ CH ₃	OH
Ial.245	NCH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃	H	SO ₂ CH(CH ₃) ₂	OH
Ial.246	NCH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃	H	SO ₂ (CH ₂) ₂ CH ₃	OH
Ial.247	NCH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃	H	Cl	OH
Ial.248	NCH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃	H	Br	OH
Ial.249	NCH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃	H	NO ₂	OH
Ial.250	NCH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃	H	CHF ₂	OH
Ial.251	NCH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃	H	CF ₃	OH
Ial.252	NCH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃	H	OCH ₃	OH
Ial.253	NCH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃	H	OCH ₂ CH ₃	OH
Ial.254	NCH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃	H	OCHF ₂	OH
Ial.255	NCH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃	H	OCF ₃	OH
Ial.256	NCH ₃	CH ₃	H	CH ₃	CH ₃	SCH ₃	OH
Ial.257	NCH ₃	CH ₃	H	CH ₃	CH ₃	SCH ₂ CH ₃	OH
Ial.258	NCH ₃	CH ₃	H	CH ₃	CH ₃	SO ₂ CH ₃	OH
Ial.259	NCH ₃	CH ₃	H	CH ₃	CH ₃	SO ₂ CH ₂ CH ₃	OH
Ial.260	NCH ₃	CH ₃	H	CH ₃	CH ₃	SO ₂ CH(CH ₃) ₂	OH
Ial.261	NCH ₃	CH ₃	H	CH ₃	CH ₃	SO ₂ (CH ₂) ₂ CH ₃	OH
Ial.262	NCH ₃	CH ₃	H	CH ₃	CH ₃	Cl	OH
Ial.263	NCH ₃	CH ₃	H	CH ₃	CH ₃	Br	OH
Ial.264	NCH ₃	CH ₃	H	CH ₃	CH ₃	NO ₂	OH
Ial.265	NCH ₃	CH ₃	H	CH ₃	CH ₃	CHF ₂	OH
Ial.266	NCH ₃	CH ₃	H	CH ₃	CH ₃	CF ₃	OH
Ial.267	NCH ₃	CH ₃	H	CH ₃	CH ₃	OCH ₃	OH
Ial.268	NCH ₃	CH ₃	H	CH ₃	CH ₃	OCH ₂ CH ₃	OH
Ial.269	NCH ₃	CH ₃	H	CH ₃	CH ₃	OCHF ₂	OH
Ial.270	NCH ₃	CH ₃	H	CH ₃	CH ₃	OCF ₃	OH
Ial.271	NCH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃	SCH ₃	OH
Ial.272	NCH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃	SCH ₂ CH ₃	OH
Ial.273	NCH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃	SO ₂ CH ₃	OH
Ial.274	NCH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃	SO ₂ CH ₂ CH ₃	OH
Ial.275	NCH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃	SO ₂ CH(CH ₃) ₂	OH
Ial.276	NCH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃	SO ₂ (CH ₂) ₂ CH ₃	OH
Ial.277	NCH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃	Cl	OH
Ial.278	NCH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃	Br	OH
Ial.279	NCH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃	NO ₂	OH
Ial.280	NCH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃	CHF ₂	OH
Ial.281	NCH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃	CF ₃	OH

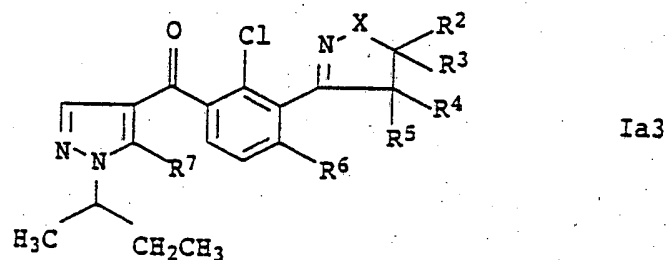
Č.	X	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷
Ia1.282	NCH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃	OCH ₃	OH
Ia1.283	NCH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃	OCH ₂ CH ₃	OH
Ia1.284	NCH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃	OCHF ₂	OH
Ia1.285	NCH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃	OCF ₃	OH
Ia1.286	NCH ₃	CH ₂ Cl	H	H	H	SCH ₃	OH
Ia1.287	NCH ₃	CH ₂ Cl	H	H	H	SCH ₂ CH ₃	OH
Ia1.288	NCH ₃	CH ₂ Cl	H	H	H	SO ₂ CH ₃	OH
Ia1.289	NCH ₃	CH ₂ Cl	H	H	H	SO ₂ CH ₂ CH ₃	OH
Ia1.290	NCH ₃	CH ₂ Cl	H	H	H	SO ₂ CH(CH ₃) ₂	OH
Ia1.291	NCH ₃	CH ₂ Cl	H	H	H	SO ₂ (CH ₂) ₂ CH ₃	OH
Ia1.292	NCH ₃	CH ₂ Cl	H	H	H	Cl	OH
Ia1.293	NCH ₃	CH ₂ Cl	H	H	H	Br	OH
Ia1.294	NCH ₃	CH ₂ Cl	H	H	H	NO ₂	OH
Ia1.295	NCH ₃	CH ₂ Cl	H	H	H	CHF ₂	OH
Ia1.296	NCH ₃	CH ₂ Cl	H	H	H	CF ₃	OH
Ia1.297	NCH ₃	CH ₂ Cl	H	H	H	OCH ₃	OH
Ia1.298	NCH ₃	CH ₂ Cl	H	H	H	OCH ₂ CH ₃	OH
Ia1.299	NCH ₃	CH ₂ Cl	H	H	H	OCHF ₂	OH
Ia1.300	NCH ₃	CH ₂ Cl	H	H	H	OCF ₃	OH

Mimořádně výhodné jsou také sloučeniny obecného vzorce Ia2, zvláště sloučeniny Ia2.1 až Ia2.300, které se liší od odpovídajících sloučenin Ia1.1 až Ia1.300 v tom, že R¹¹ je methyl.

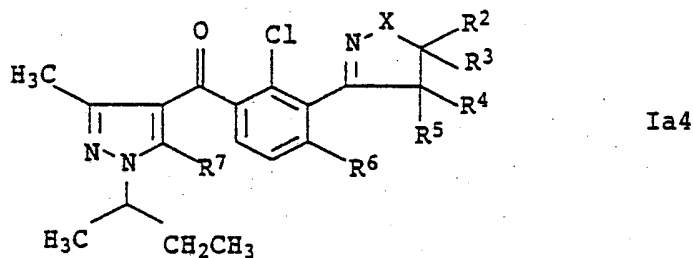


Ia2

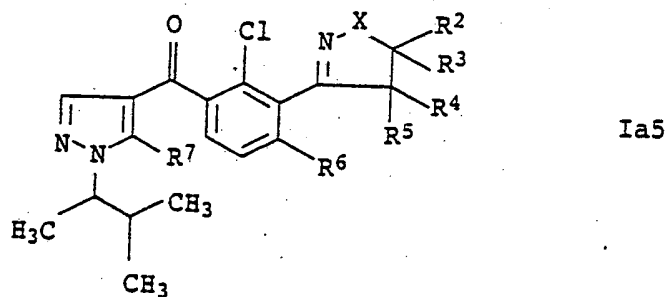
Mimořádně výhodné jsou také sloučeniny obecného vzorce Ia3, zvláště sloučeniny Ia3.1 až Ia3.300, které se liší od odpovídajících sloučenin Ia1.1 až Ia1.300 v tom, že R^8 je ethyl.



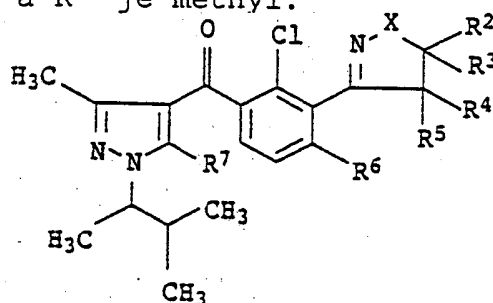
Mimořádně výhodné jsou také sloučeniny obecného vzorce Ia4, zvláště sloučeniny Ia4.1 až Ia4.300, které se liší od odpovídajících sloučenin Ia1.1 až Ia1.300 v tom, že R^8 je ethyl a R^{11} je methyl.



Mimořádně výhodné jsou také sloučeniny obecného vzorce Ia5, zvláště sloučeniny Ia5.1 až Ia5.300, které se liší od odpovídajících sloučenin Ia1.1 až Ia1.300 v tom, že R^8 je 1-methyl-1-ethyl.

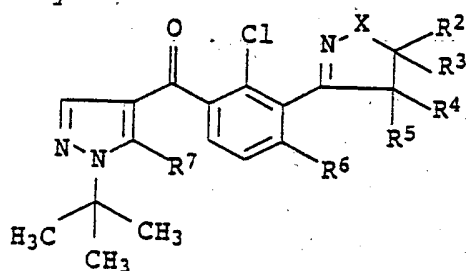


Mimořádně výhodné jsou také sloučeniny obecného vzorce Ia6, zvláště sloučeniny Ia6.1 až Ia6.300, které se liší od odpovídajících sloučenin Ia1.1 až Ia1.300 v tom, že R^8 je 1-methyl-1-ethyl a R^{11} je methyl.



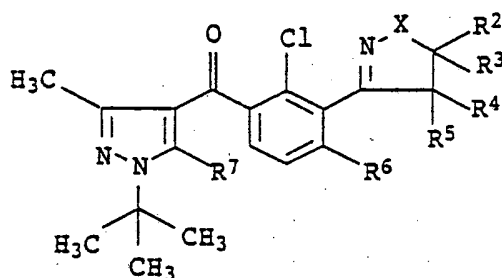
Ia6

Mimořádně výhodné jsou také sloučeniny obecného vzorce Ia7, zvláště sloučeniny Ia7.1 až Ia7.300, které se liší od odpovídajících sloučenin Ia1.1 až Ia1.300 v tom, že R^{10} je methyl.



Ia7

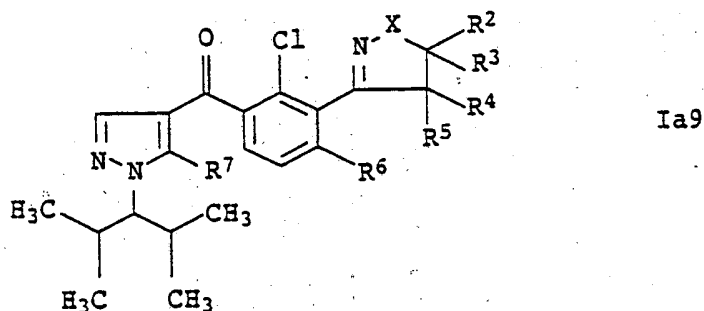
Mimořádně výhodné jsou také sloučeniny obecného vzorce Ia8, zvláště sloučeniny Ia8.1 až Ia8.300, které se liší od odpovídajících sloučenin Ia1.1 až Ia1.300 v tom, že R^{10} methyl a R^{11} je methyl.



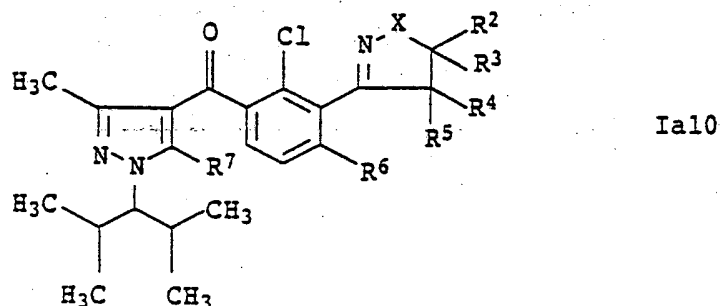
Ia8

Mimořádně výhodné jsou také sloučeniny obecného vzorce Ia9, zvláště sloučeniny Ia9.1 až Ia9.300, které se

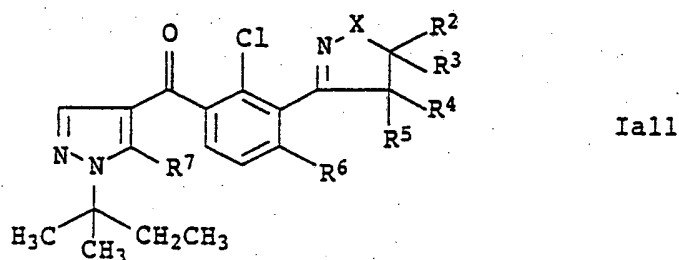
liši od odpovídajících sloučenin Ia1.1 až Ia1.300 v tom, že R^8 a R^9 jsou 1-methyl-1-ethyl.



Mimořádně výhodné jsou také sloučeniny obecného vzorce Ia10, zvláště sloučeniny Ia10.1 až Ia10.300, které se liší od odpovídajících sloučenin Ia1.1 až Ia1.300 v tom, že R^8 a R^9 jsou 1-methyl-1-ethyl a R^{11} je methyl.



Mimořádně výhodné jsou také sloučeniny obecného vzorce Ia11, zvláště sloučeniny Ia11.1 až Ia11.300, které se liší od odpovídajících sloučenin Ia1.1 až Ia1.300 v tom, že R^8 je ethyl a R^{10} je methyl.



Mimořádně výhodné jsou také sloučeniny obecného vzorce Ia12, zvláště sloučeniny Ia12.1 až Ia12.300, které se liší od odpovídajících sloučenin Ia1.1 až Ia1.300 v tom, že R^8 je ethyl a R^{10} a R^{11} jsou methyl.



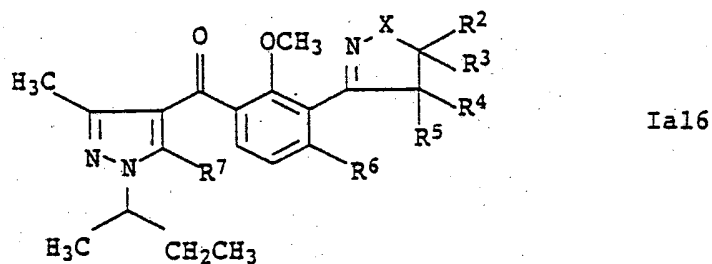
Ia13

Ia14

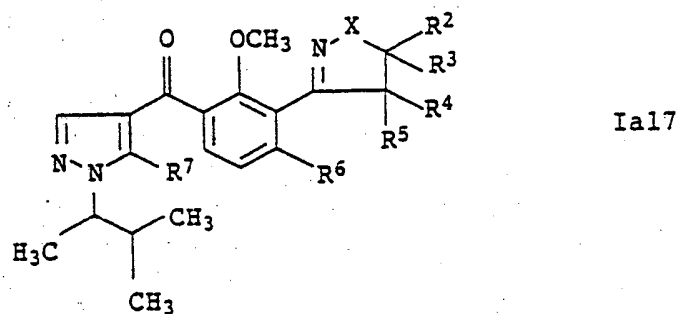
[illegible]

Ia15

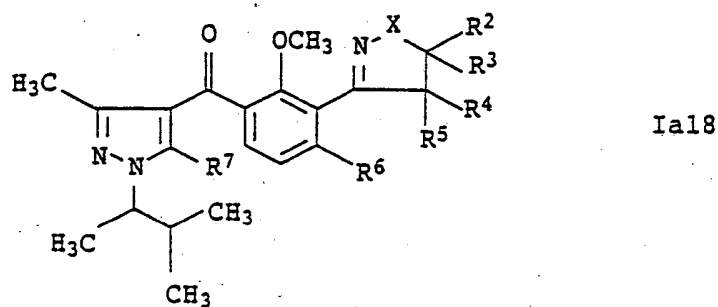
Mimořádně výhodné jsou také sloučeniny obecného vzorce Ia16, zvláště sloučeniny Ia16.1 až Ia16.300, které se liší od odpovídajících sloučenin Ia1.1 až Ia1.300 v tom, že R^1 je methoxyskupina, R^8 je ethyl a R^{11} je methyl.



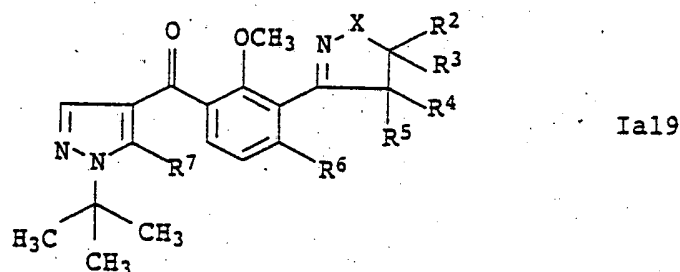
Mimořádně výhodné jsou také sloučeniny obecného vzorce Ia17, zvláště sloučeniny Ia17.1 až Ia17.300, které se liší od odpovídajících sloučenin Ia1.1 až Ia1.300 v tom, že R^1 je methoxyskupina a R^8 je 1-methyl-1-ethyl.



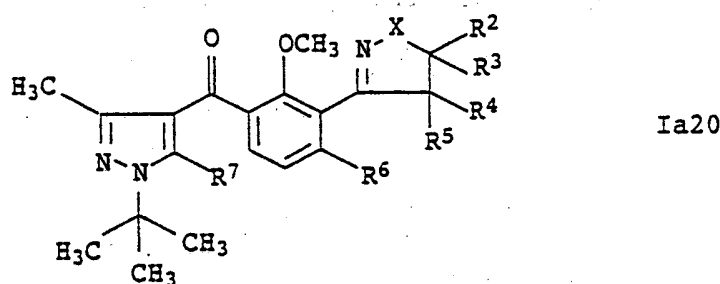
Mimořádně výhodné jsou také sloučeniny obecného vzorce Ia18, zvláště sloučeniny Ia18.1 až Ia18.300, které se liší od odpovídajících sloučenin Ia1.1 až Ia1.300 v tom, že R^1 je methoxyskupina, R^8 je 1-methyl-1-ethyl a R^{11} je methyl.



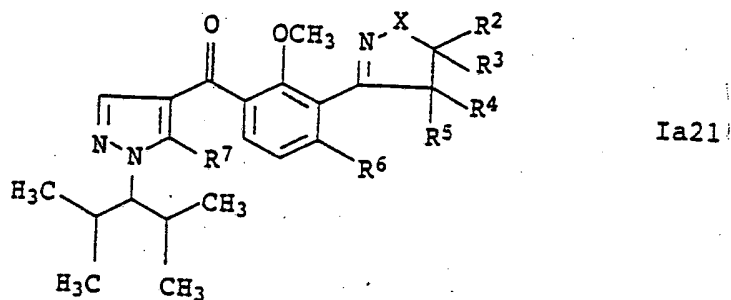
Mimořádně výhodné jsou také sloučeniny obecného vzorce Ia19, zvláště sloučeniny Ia19.1 až Ia19.300, které se liší od odpovídajících sloučenin Ia1.1 až Ia1.300 v tom, že R^1 je methoxyskupina a R^{10} je methyl.



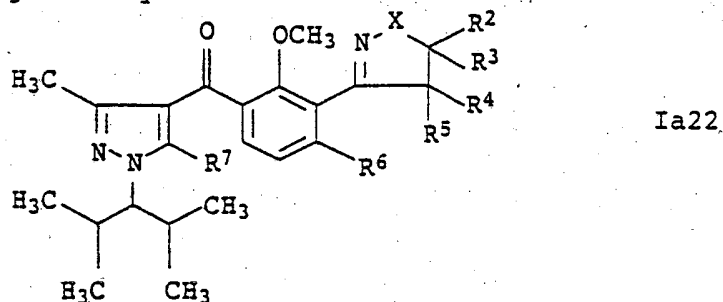
Mimořádně výhodné jsou také sloučeniny obecného vzorce Ia20, zvláště sloučeniny Ia20.1 až Ia20.300, které se liší od odpovídajících sloučenin Ia1.1 až Ia1.300 v tom, že R^1 je methoxyskupina, R^{10} je methyl a R^{11} je methyl.



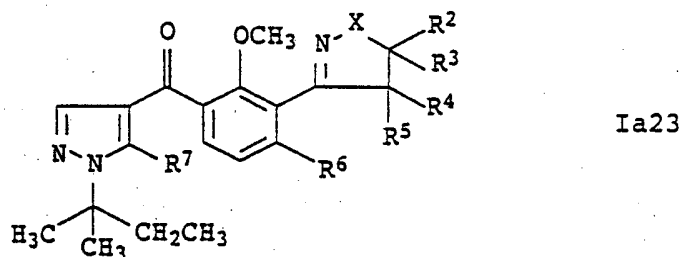
Mimořádně výhodné jsou také sloučeniny obecného vzorce Ia21, zvláště sloučeniny Ia21.1 až Ia21.300, které se liší od odpovídajících sloučenin Ia1.1 až Ia1.300 v tom, že R^1 je methoxyskupina, R^8 a R^9 jsou 1-methyl-1-ethyl.



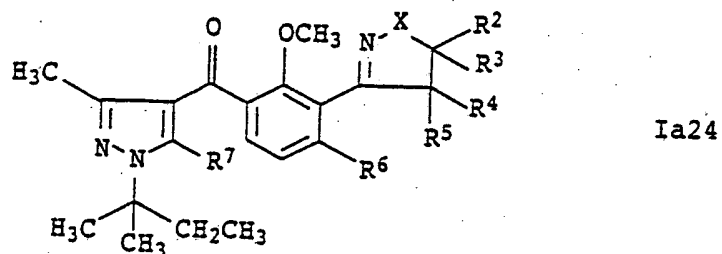
Mimořádně výhodné jsou také sloučeniny obecného vzorce Ia22, zvláště sloučeniny Ia22.1 až Ia22.300, které se liší od odpovídajících sloučenin Ia1.1 až Ia1.300 v tom, že R^1 je methoxyskupina, R^8 a R^9 jsou 1-methyl-1-ethyl a R^{11} je methyl.



Mimořádně výhodné jsou také sloučeniny obecného vzorce Ia23, zvláště sloučeniny Ia23.1 až Ia23.300, které se liší od odpovídajících sloučenin Ia1.1 až Ia1.300 v tom, že R^1 je methoxyskupina, R^8 je ethyl a R^{10} je methyl.



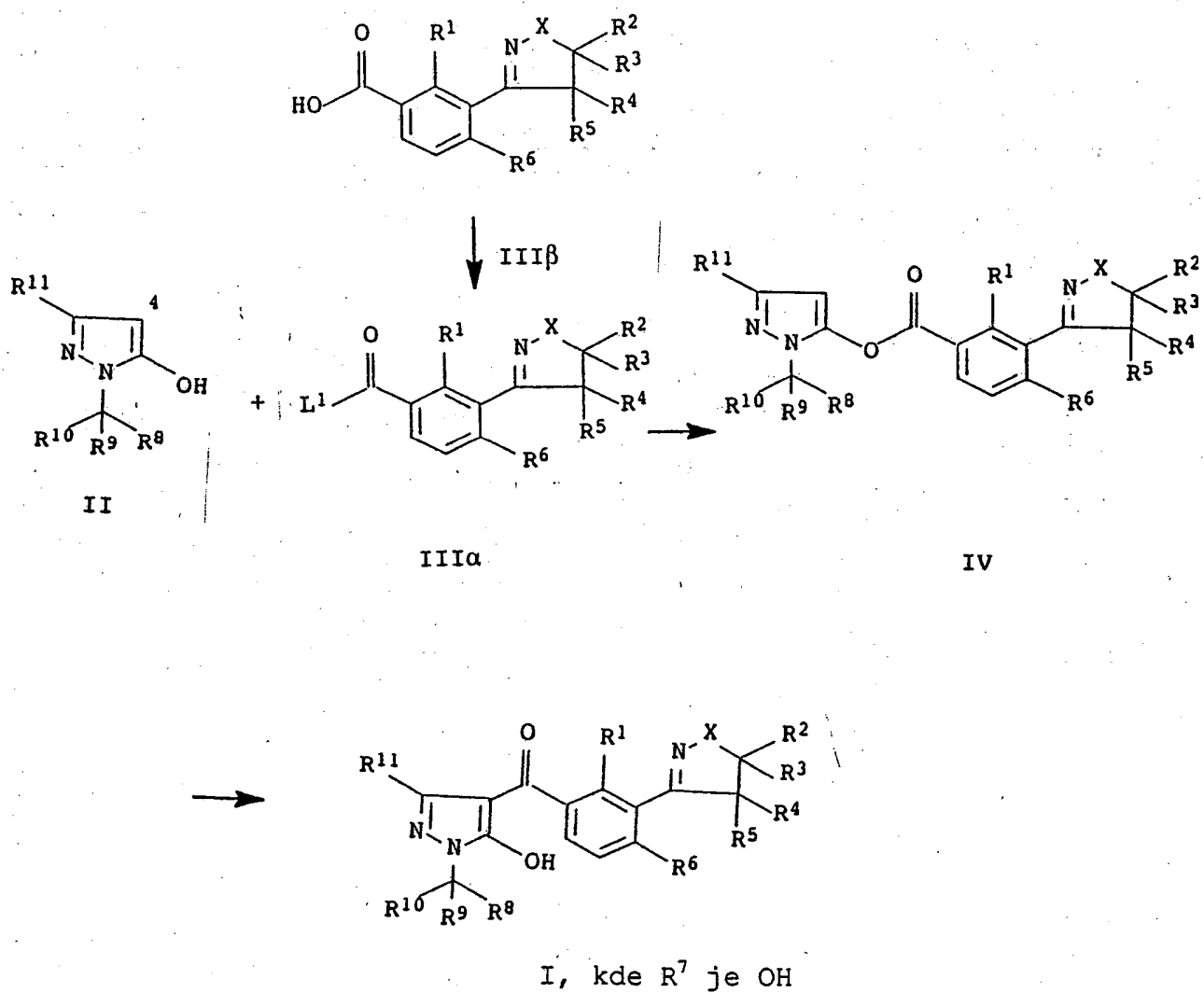
Mimořádně výhodné jsou také sloučeniny obecného vzorce Ia24, zvláště sloučeniny Ia24.1 až Ia24.300, které se liší od odpovídajících sloučenin Ia1.1 až Ia1.300 v tom, že R^1 je methoxyskupina, R^8 je ethyl a R^{10} a R^{11} jsou methyl.



3-(heterocyklyl)benzoylpyrazolové deriváty
obecného vzorce I se mohou získat různými cestami,
například způsoby uvedenými dále.

Způsob A

Reakce pyrazolů obecného vzorce II s aktivovanou
kyselinou benzoovou III α nebo kyselinou benzoovou III β ,
která se výhodně aktivuje in situ, k získání odpovídajícího
acylačního produktu IV, následovaná přesmyknutím,
poskytuje sloučeniny obecného vzorce I, kde R⁷ je OH.



L¹ je nukleofilně vytěsnitelná odstupující skupina, jako je atom halogenu, například bromu nebo chloru, hetaryl, například imidazolyl nebo pyridyl, karboxylat, například acetat nebo trifluoracetat atd.

Aktivovaná kyselina benzoová se může použít přímo, jako v případě benzoylhalogenidů, nebo se může vytvořit in situ, například za použití dicyklohexylkarbodiimidu, směsi trifenylfosfin/ester kyseliny azodikarboxylové, směsi 2-pyridindisulfid/trifenylfosfin, karbonyldiimidazolu atd.

Může být výhodné provádět acylační reakci za přítomnosti báze. Reaktanty a pomocná báze se zde výhodně použijí v ekvimolárních množstvích. V určitých případech může být výhodný mírný přebytek pomocné báze, například 1,2 až 1,5 molárních ekvivalentů.

Vhodnými pomocnými bázemi jsou terciární alkylaminy, pyridin nebo uhličitany alkalických kovů. Pro použití jako rozpouštědla jsou vhodné například chlorované uhlovodíky, jako je methylenchlorid nebo 1,2-dichlorethan, aromatické uhlovodíky, jako je toluen, xylen nebo chlorbenzen, ethery, jako je diethylether, methyl-terc.-butylether, dimethoxyethan, tetrahydrofuran nebo dioxan, polární aprotická rozpouštědla, jako je acetonitril, dimethylformamid nebo dimethylsulfoxid, nebo estery, jako je ethylacetat, nebo jejich směsi.

Pokud použitými složkami aktivované kyseliny karboxylové jsou benzoylhalogenidy, může být výhodné ochladit reakční směs na teplotu 0 až 10 °C, když se

přidává reakční partner. Směs se následně míchá při teplotě 20 až 100 °C, výhodně 25 až 50 °C, až se reakce ukončí. Zpracování se provádí obvyklým způsobem, například vlitím reakční směsi do vody a extrakcí požadovaného produktu. Rozpouštědly, která jsou obzvláště vhodná k tomuto účelu, jsou methylenchlorid, diethylether, dimethoxyethan a ethylacetat. Organická fáze se vysuší a rozpouštědlo se odpaří, načež se může surový ester použít k přesmyknutí bez dalšího čištění.

Přesmyknutí esterů k poskytnutí sloučenin obecného vzorce I se výhodně provádí při teplotě 20 až 40 °C za použití rozpouštědla a za přítomnosti báze a, pokud je to příhodné, za použití kyanosloučeniny jako katalyzátoru.

Vhodnými rozpouštědly jsou například acetonitril, methylenchlorid, 1,2-dichlorethan, dioxan, ethylacetat, dimethoxyethan, toluen nebo jejich směsi. Výhodnými rozpouštědly jsou acetonitril nebo dioxan.

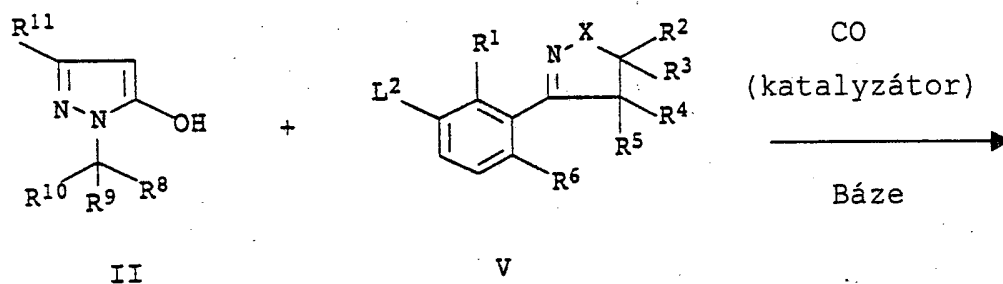
Vhodnými bázemi jsou terciární aminy, jako je triethylamin nebo pyridin, nebo uhličitany alkalických kovů, jako je uhličitán sodný nebo uhličitán draselný, které se výhodně použijí v ekvimolárním množství nebo až ve čtyřnásobném přebytku, vztaženo k esteru. Výhodně se použije triethylamin nebo uhličitany alkalických kovů, výhodně v dvojnásobném ekvimolárním množství, vztaženo k esteru.

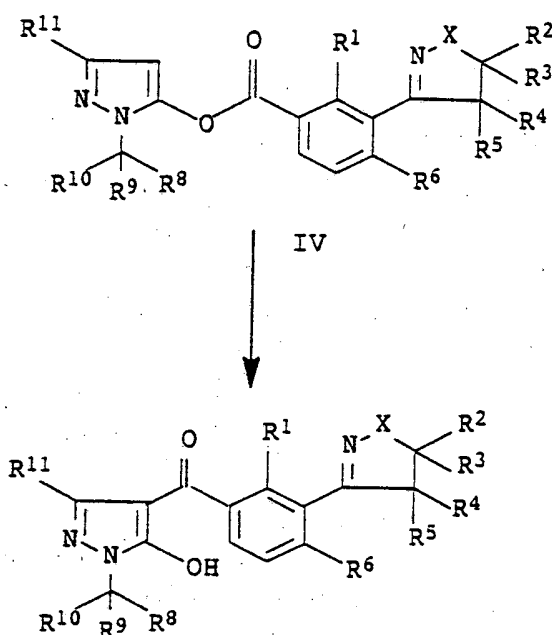
Vhodnými kyanosloučeninami jsou anorganické kyanidy, jako je kyanid sodný nebo kyanid draselný, a organické kyanosloučeniny, jako je acetonkyanhydrin a

trimethylsilyl-kyanid. Použijí se v množství od 1 do 50 % molárních, vztaženo k esteru. Výhodně se použije acetonkyanhydrin nebo trimethylsilylkyanid, například v množství od 5 do 15, výhodně 10, % molárních, vztaženo k esteru.

Zpracování se může provádět způsobem známým jako takovým. Reakční směs se například okyselí zředěnou minerální kyselinou, jako je 5% kyselina chlorovodíková nebo kyselina sírová, a extrahuje se organickým rozpouštědlem, například methylenchloridem nebo ethylacetatem. Organický extrakt se extrahuje 5 až 10% roztokem uhličitanu alkalického kovu, například roztokem uhličitanu sodného nebo uhličitanu draselného. Vodná fáze se okyselí a výsledná sraženina se odfiltruje za odsávání a/nebo se extrahuje methylenchloridem nebo ethylacetatem, a směs se vysuší a odpaří. (Příklady přípravy esterů hydroxypyrazolů k přesmyku esterů jsou uvedeny například v EP-A 282 944 a US patentu č. 4 643 757).

Je však také možné vytvořit „acylační produkt“ IV in situ reakcí pyrazolu obecného vzorce II nebo jeho alkalické soli s 3-(heterocyklyl)benzenovým derivátem obecného vzorce V za přítomnosti oxidu uhelnatého, katalyzátoru a báze.





I, kde R⁷ je OH

L² je odstupující skupina, jako je atom halogenu, například chloru, bromu nebo jodu, nebo sulfonát, jako je mesylát nebo trifluormethylsulfonát. Výhodně se použije atom bromu nebo trifluormethylsulfonát.

„Acylační produkt“ IV reaguje dále, přímo nebo nepřímo, k poskytnutí 3-(heterocyklyl)benzoylpyrazolového derivátu obecného vzorce I.

Vhodnými katalyzátory jsou komplexy palladium-ligand, ve kterých je palladium přítomno v oxidačním stavu 0, jako kovové palladium, které je případně absorbováno na osiči, a výhodně palladnaté soli. Reakce s palladnatými

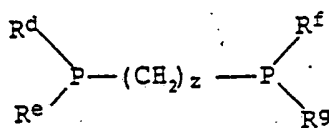
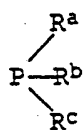
solemi a kovovým palladiem se výhodně provádí za přítomnosti komplexních ligandů.

Příkladem vhodného komplexu palladium(0)-ligand je tetrakis(trifenylfosfin)palladium.

Kovové palladium se výhodně absorbuje na inertním nosiči, jako je například aktivní uhlí, oxid křemičitý, oxid hlinitý, síran barnatý nebo uhličitán vápenatý. Reakce se výhodně provádí za přítomnosti komplexních ligandů, jako je například trifenylfosfin.

Příklady vhodných palladnatých solí jsou octan palladnatý a chlorid palladnatý. Výhodná je přítomnost komplexních ligandů, jako je například trifenylfosfin.

Vhodnými komplexními ligandy pro komplexy palladium-ligand, nebo v-jejichž-přítomnosti-se-reakce výhodně provádí s kovovým palladiem nebo palladnatými solemi, jsou terciární fosfiny, jejichž struktura je představována následujícími obecnými vzorci



ve kterých

je 1 až 4 a zbytky

R^a až R^g jsou alkylová skupina s 1 až 6 atomy uhlíku, cykloalkylová skupina se 3 až 6 atomy uhlíku, arylalkylová skupina s 1 až 2 atomy uhlíku

v alkylové části nebo, výhodně, aryl.

Aryl je například, naftyl a nesubstituovaný nebo substituovaný fenyl jako je například 2-tolyl a, obzvláště, nesubstituovaný fenyl.

Komplexní palladiové soli se mohou připravit způsobem známým jako takovým tím, že se vyjde z komerčně dostupných palladiových solí, jako je chlorid palladnatý nebo octan palladnatý a příhodných fosfinů, jako je například trifenylfosfin nebo 1,2-bis(difenylfosfino)-ethan. Mnohé z komplexních palladiových solí jsou komerčně dostupné. Výhodnými palladiovými solemi jsou chlorid [(R)-(+)-2,2'-bis-(difenylfosfino)-1,1'-binaftyl]palladnatý, octan bis(trifenylfosfin)palladnatý a, obzvláště, chlorid bis(trifenylfosfin)palladnatý.

Palladiový katalyzátor se obvykle použije v koncentraci od 0,05 do 5 % molárních, a výhodně od 1 do 3 % molárních.

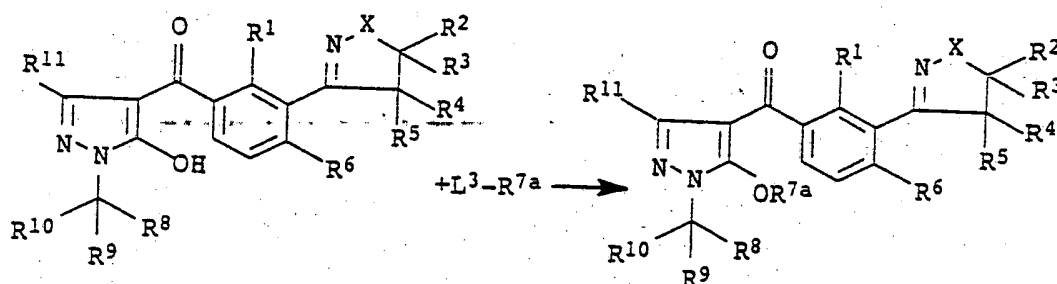
Vhodnými bázemi jsou terciární aminy, jako je například N-methylpiperidin, ethyldiisopropylamin, 1,8-bisdimethylaminonafthalen nebo, obzvláště, triethylamin. Vhodné jsou rovněž uhličitany alkalických kovů, jako je uhličitán sodný nebo uhličitán draselný. Vhodné jsou však také směsi uhličitanu draselného a triethylaminu.

Obecně se použije od 2 do 4 molárních ekvivalentů, obzvláště 2 molárních ekvivalentů, uhličitanu alkalického kovu a od 1 do 4 molárních ekvivalentů, obzvláště 2 molární ekvivalenty, terciárního aminu, vztaženo k 3-(heterocyklyl)benzenovému derivátu obecného vzorce V.

Vhodnými rozpouštědly jsou nitrily, jako je benzonitril a acetonitril, amidy, jako je dimethylformamid, dimethylacetamid, tetraalkylmočoviny s 1 až 4 atomy uhlíku v každé alkylové části nebo N-methylpyrrolidon a, výhodně, ethery, jako je tetrahydrofuran a methyl-terc.-butylethery. Zvláště výhodné jsou ethery, jako je 1,4-dioxan a dimethoxyethan.

Způsob B:

Sloučeniny obecného vzorce I, kde R^7 není hydroxyl, se získají reakcí sloučenin obecného vzorce I, kde $R^7 = \text{hydroxyl}$, s alkylačními činidly, sulfonylačními činidly nebo acylačními činidly L^3-R^{7a} (VI).



I, kde $R^7 = \text{OH}$

VI

I, kde $R^7 = \text{OR}^{7a}$

L^3 je nukleofilně vytěsnitelná odstupující skupina, jako je atom halogenu, například atom bromu nebo chloru, acyloxyskupina, například acetyloxyskupina nebo ethylkarbonyloxyskupina, nebo alkylsulfonyloxyskupina, například metylsulfonyloxyskupina nebo trifluormethylsulfonyloxyskupina.

R^{7a} je alkylová skupina s 1 až 6 atomy uhlíku, alkenylová skupina se 3 až 6 atomy uhlíku, alkylsulfonylová skupina s 1 až 6 atomy uhlíku, alkylkarbonylová skupina s 1 až 6 atomy uhlíku v alkylovém podílu, (alkylthio)karbonylová skupina s 1 až 6 atomy uhlíku v alkylovém podílu, fenylsulfonylová skupina nebo fenylkarbonylová skupina, kde fenyllová část dvou posledně zmíněných substituentů může být částečně nebo plně halogenována a/nebo může nést jednu až tři následující skupiny: nitroskupina, kyanoskupina, alkylová skupina s 1 až 4 atomy uhlíku, halogenalkylová skupina s 1 až 4 atomy uhlíku, alkoxykupina s 1 až 4 atomy uhlíku nebo halogenalkoxykupina s 1 až 4 atomy uhlíku.

Sloučeniny obecného vzorce VI se mohou použít přímo, jako například v případě sulfonylhalogenidů nebo anhydridů kyseliny sulfonové, nebo se mohou vytvořit in situ, například aktivované kyseliny sulfonové (za použití kyseliny sulfonové a dicyklohexylkarbonyldiimidu karbonyldiimidazolu atd).

Výchozí materiály se obecně použijí v ekvimolárních množstvích. Může však být také výhodné použít přebytek jedné nebo druhé složky.

Pokud je to příhodno, může být výhodné provádět reakci za přítomnosti báze. Reaktanty a pomocná báze se zde výhodně použijí v ekvimolárních množstvích. V určitých případech může být výhodný mírný přebytek pomocné báze, například 1,5 až 3 molární ekvivalenty, vztaženo ke sloučenině obecného vzorce I.

Vhodnými pomocnými bázemi jsou terciární aminy, jako je triethylamin nebo pyridin, uhličitany alkalických kovů, například uhličitán sodný nebo uhličitán draselný, a hydridy alkalických kovů, například hydrid sodný. Výhodně se použije triethylamin a pyridin.

Vhodnými rozpouštědly jsou například chlorované uhlovodíky, jako je methylenchlorid a 1,2-dichlorethan, aromatické uhlovodíky, například toluen, xylen nebo chlorbenzen, ethery, jako je diethylether, methyl-terc.-butylether, tetrahydrofuran a dioxan, polární aprotická rozpouštědla, jako je acetonitril, dimethylformamid nebo dimethylsulfoxid, nebo estery, jako je ethylacetat, nebo jejich směsi.

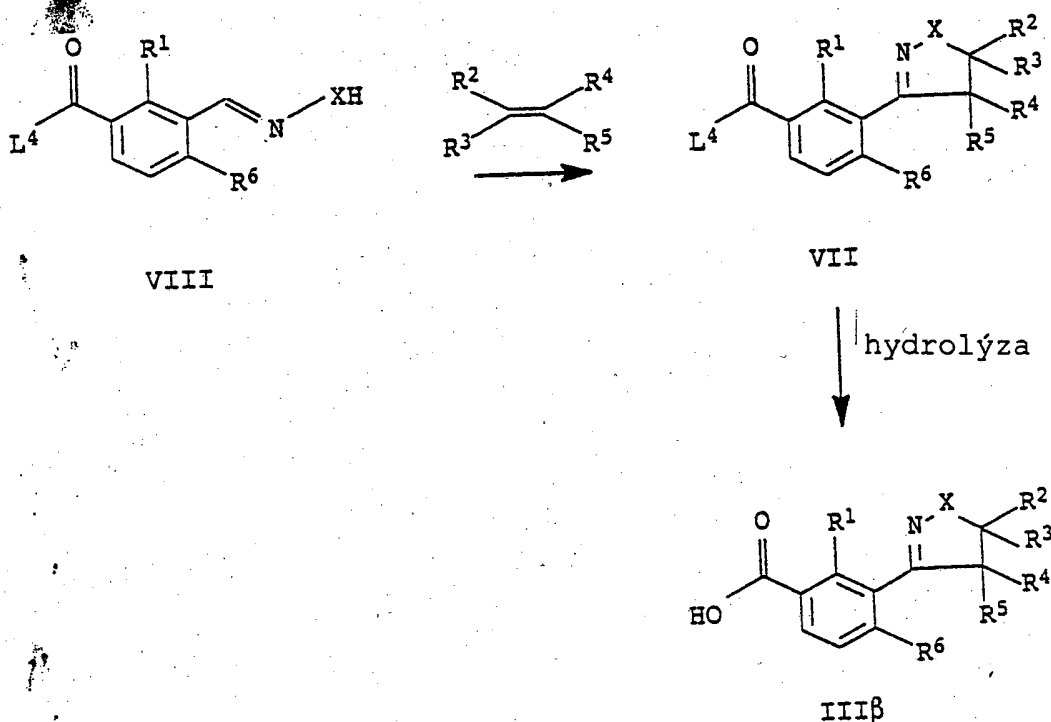
Obecně je reakční teplota v rozmezí od 0 °C do teploty varu reakční směsi.

Zpracování se může provést způsobem známým jako takovým k získání produktu.

Pyrazoly obecného vzorce II použité jako výchozí materiály jsou známy nebo se mohou připravit nebo způsoby známými jako takové (například EP-A 240 001 a J. Prakt. Chem., 315, 383 (1973)).

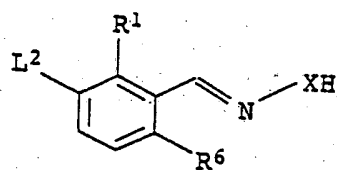
Aktivované kyseliny benzoové III α se mohou získat způsobem známým jako takovým z kyselin benzoových III β . Posledně uvedené se získají hydrolýzou odpovídajících esterů VII. Ty se mohou připravit konverzí oximu nebo hydrazonu obecného vzorce VIII na odpovídající halogenid kyseliny hydroxamové, obzvláště chlorid kyseliny hydroxamové, nebo halogenid karbohydrazidu, obzvláště

chlorid karbohydrazidu; čímž se vytvoří nitriloxid nebo nitrilimin in situ a ten se nechá reagovat s alkenem (viz například Chem. Ber., 106, 3258-3274 (1973)).

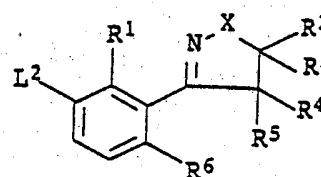
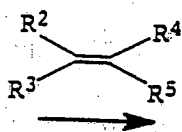


L^4 je alkoxykupina s 1 až 6 atomy uhlíku.

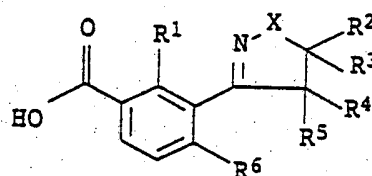
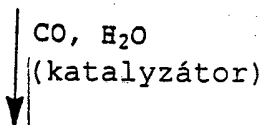
Kyseliny benzoové IIIβ se však také mohou získat konverzí oximu nebo hydrazonu obecného vzorce IX na odpovídající nitriloxidy nebo nitrilaminy a tím, že se nechají reagovat s alkeny k získání odpovídajících cykloadičních produktů (viz například Chem. Ber., 106, 3252-3274 (1973)). Například tedy oxim obecného vzorce IX ($X = O$) se oxiduje chlornanem sodným a nechá se reagovat s příhodným alkenem v inertním rozpouštědle, jako je methylenchlorid, chloroform, tetrahydrofuran, dioxan nebo acetonitril. Produkt se poté za přítomnosti katalyzátoru a báze převede na kyselinu benzoovou IIIβ za použití oxidu uhelnatého a vody.



IX



V



IIIβ

L² je odstupující skupina, jako je atom halogenu, například chloru, bromu nebo jodu, nebo sulfonát, jako je mesylát nebo trifluormethylsulfonát, výhodně atom bromu nebo trifluormethylsulfonát.

Pokud jde o karbonylační reakci, analogicky se aplikuje výše uvedené.

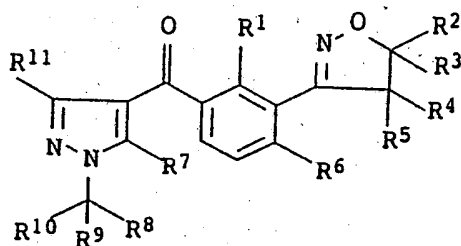
Příklady provedení vynálezu

1-[2-Chlor-3-(4,5-dihydroisoxazol-3-yl)-4-methylsulfonyl-benzoyl]-5-hydroxy-1-(1,1-dimethyl-1-ethyl)-1H-pyrazol

(Sloučenina 2.1)

2,32 g (0,02 mol) 1-(1,1-dimethyl-1-ethyl)-5-hydroxy-1H-pyrazolu a 2,3 g (0,02 mol) uhličitanu draselného se přidají k roztoku 5,4 g (0,02 mol) 2-chlor-3-(4,5-di-hydroisoxazol-3-yl)-4-methylsulfonylbenzoylchloridu ve 100 ml dimethyletheru ethylenglykolu a směs se přes noc míchá. Směs se následně 3 hodiny zahřívá na teplotu zpětného toku, rozpouštědlo se oddestiluje, odparek se vyjme 300 ml vody a promyje se methylenchloridem a vodná fáze se okyselí na hodnotu pH 3 za použití 10% kyseliny chlorovodíkové. Sraženina se odfiltruje za odsávání a vysuší se při teplotě 40 °C. Tím se získá 4,6 g (65 % teoretického výtěžku) 4-[2-chlor-3-(4,5-dihydroisoxazol-3-yl)-4-methylsulfonylbenzoyl]-5-hydroxy-1-(1,1-dimethyl-1-ethyl)-1H-pyrazolu.

Vedle výše uvedených sloučenin uvádí tabulka 2 další 3-(heterocyklyl)-substituované benzoylpyrazoly obecného vzorce I, které se připravily nebo se dají připravit podobným způsobem.



Tabulka 2

Č.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	R ⁸	R ⁹	R ¹⁰	R ¹¹	Fyzikální data t.t. (°C) ¹ H NMR [δ v ppm]
2.1	Cl	H	H	H	H	SO ₂ CH ₃	OH	CH ₃	CH ₃	CH ₃	H	198-200
2.2	Cl	H	H	H	H	SO ₂ CH ₃	OH	CH ₃	CH ₃	H	H	210-215
2.3	Cl	H	H	H	H	SO ₂ CH ₃	OCH(CH ₃) ₂	CH ₃	CH ₃	H	H	175-180
2.4	Cl	H	H	H	H	SO ₂ CH ₃	OCH ₂ CH ₃	CH ₃	CH ₃	H	H	150-155
2.5	Cl	H	H	H	H	SO ₂ CH ₃	OCH ₃	CH ₃	CH ₃	H	H	185-190
2.6	Cl	H	H	H	H	SO ₂ CH ₃	OCO[3-F-C ₆ H ₄]	CH ₃	CH ₃	H	H	225-230
2.7	Cl	H	H	H	H	SO ₂ CH ₃	OCOC ₆ H ₅	CH ₃	CH ₃	H	H	220-225
2.8	Cl	H	H	H	H	SO ₂ CH ₃	OCO[3,5-F ₂ -C ₆ H ₃]	CH ₃	CH ₃	H	H	220-225
2.9	Cl	H	H	H	H	SO ₂ CH ₃	OH	CH(CH ₃) ₂	CH ₃	H	H	150-155
2.10	Cl	H	H	H	H	SO ₂ CH ₃	OCH(CH ₃) ₂	CH(CH ₃) ₂	CH ₃	H	H	125-130
2.11	Cl	H	H	H	H	SO ₂ CH ₃	OCOC ₆ H ₅	CH(CH ₃) ₂	CH ₃	H	H	135-140

10.10.01

Č.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	R ⁸	R ⁹	R ¹⁰	R ¹¹	Fyzikální data t.t. (°C) ¹ H NMR [δ v ppm]
2.12	Cl	H	H	H	H	SO ₂ CH ₃	OCO[3-F-C ₆ H ₄]	CH(CH ₃) ₂	CH ₃	H	H	130-135
2.13	OCH ₃	H	H	H	H	SO ₂ CH ₃	OH	CH ₃	CH ₃	H	H	154-156
2.14	OCH ₃	H	H	H	H	SO ₂ CH ₃	OCOSCH ₃	CH ₃	CH ₃	H	H	oil
2.15	Cl	H	H	H	H	SO ₂ CH ₃	OH	CH(CH ₃) ₂	CH(CH ₃) ₂	H	H	200-205
2.16	Cl	H	H	H	H	SO ₂ CH ₃	OCH ₃	CH(CH ₃) ₂	CH(CH ₃) ₂	H	H	65-70
2.17	Cl	H	H	H	H	SO ₂ CH ₃	OC ₂ H ₅	CH(CH ₃) ₂	CH(CH ₃) ₂	H	H	oil
2.18	OCH ₃	H	H	H	H	SO ₂ CH ₃	OCO[3-F-C ₆ H ₄]	CH ₃	CH ₃	H	H	78-79

3-(Heterocyklyl)benzoylpyrazolové deriváty obecného vzorce I a jejich zemědělsky užitečné soli jsou vhodné pro použití jako herbicidy, jak ve formě směsi isomerů, tak ve formě čistých isomerů. Herbicidní prostředky, které obsahují sloučeniny I poskytují velmi dobré potlačování vegetace na neprodukčních plochách, zvláště při silné aplikaci. U plodin jako je pšenice, rýže, kukuřice, sója a bavlna působí proti širokolistým plevelům a travním plevelům aniž by způsobovaly podstatné poškození plodinových rostlin. Tento účinek se pozoruje především při slabé aplikaci.

V závislosti na příslušném aplikačním způsobu mohou být sloučeniny I nebo herbicidní prostředky je obsahující také použity na dalších četných plodinových rostlinách pro eliminaci nežádoucích rostlin. Příklady vhodných plodin jsou následující: *Allium cepa*, *Ananas comosus*, *Arachis hypogaea*, *Asparagus officinalis*, *Beta vulgaris spec. altissima*, *Beta vulgaris spec. rapa*, *Brassica napus var. napus*, *Brassica napus var. napobrassica*, *Brassica rapa var. silvestris*, *Camellia sinensis*, *Carthamus tinctorius*, *Carya illinoensis*, *Citrus limon*, *Citrus sinensis*, *Coffea arabica* (*Coffea canephora*, *Coffea liberica*), *Cucumis sativus*, *Cynodon dactylon*, *Daucus carota*, *Elaeis guineensis*, *Fragaria vesca*, *Glycine max*, *Gossypium hirsutum* (*Gossypium arboreum*, *Gossypium herbaceum*, *Gossypium vitifolium*), *Helianthus annuus*, *Hevea brasiliensis*, *Hordeum vulgare*, *Humulus lupulus*, *Ipomoea batatas*, *Juglans regia*, *Lens culinaris*, *Linum usita-tissimum*, *Lycopersicon lycopersicum*, *Malus spec.*, *Manihot esculenta*, *Medicago sativa*, *Musa spec.*, *Nicotiana tabacum* (*N. rustica*), *Olea*

europaea, Oryza sativa, Phaseolus lunatus, Phaseolus vulgaris, Picea abies, Pinus spec., Pisum sativum, Prunus avium, Prunus persica, Pyrus communis, Ribes sylvestre, Ricinus communis, Saccharum officinarum, Secale cereale, Solanum tuberosum, Sorghum bicolor (S. vulgare), Theobroma cacao, Trifolium pratense, Triticum aestivum, Triticum durum, Vicia faba, Vitis vinifera a Zea mays.

Navíc mohou být sloučeniny I také použity u plodin, které prostřednictvím šlechtění, včetně metod genetického inženýrství, získaly odolnost vůči působení herbicidů.

Sloučeniny I nebo herbicidní prostředky je obsahující se mohou použít například ve formě přímo rozprašovatelných vodných roztoků, prášků, suspensí, včetně vysoce koncentrovaných vodných, olejových nebo jiných suspensí nebo dispersí, emulsí, olejových dispersí, past, prachů, materiálů pro rozhazování nebo granulí, prostřednictvím rozprašování, atomizace, prášení, rozhazování nebo zalévání. Formy použití závisejí na zamýšlených účelech, v každém případě musí zajišťovat nejjemnější možnou distribuci aktivních složek podle tohoto vynálezu.

Herbicidní prostředky zahrnují herbicidně účinné množství alespoň jedné sloučeniny obecného vzorce I nebo zemědělsky užitečné soli sloučeniny obecného vzorce I a pomocné látky, které se obvykle používají k formulování herbicidů ochrany rostlin.

Vhodné inertní pomocné látky v podstatě zahrnují:

ropné frakce minerálního oleje se střední až vysokou teplotou varu, jako je kerosin a motorová nafta, dále oleje z uhlénoho dehtu a oleje rostlinného nebo živočišného původu, alifatické, cyklické a aromatické uhovodíky, například parafiny, tetrahydronaftalen, alkylované naftaleny a jejich deriváty, alkylované benzeny a jejich deriváty, alkoholy, jako je methanol, ethanol, propanol, butanol a cyklohexanol, ketony, jako je cyklohexanon, nebo silně polární rozpouštědla, například aminy, jako je N-methylpyrrolidon, a vodu.

Vodné formy použití se mohou připravit z emulsních koncentrátů, suspensí, past, zvlhčovacích prášků nebo granulí dispergovatelných ve vodě přidáním vody. K přípravě emulsí, past nebo olejových dispersí se buď jako takové nebo rozpuštěné v oleji nebo rozpouštědle, mohou homogenizovat ve vodě prostřednictvím zvlhčovačů, pojiva, dispergátoru nebo emulgátoru. Alternativně je možno připravit koncentráty složené z aktivní látky, zvlhčovačů, pojiva, dispergátoru nebo emulgátoru a, pokud je to příhodné, rozpouštědla nebo oleje, přičemž tyto koncentráty jsou vhodné pro naředění vodou.

Vhodnými povrchově aktivními látkami (adjuvancií) jsou soli alkalických kovů, soli kovů alkalických zemin a amoniové soli aromatických sulfonových kyselin, např., kyseliny ligno-, fenol-, naftalen- a dibutyl-naftalensulfonové, a mastných kyselin, alkyl- a alkylarylsulfonátů, alkylsulfátů, lauryl- ethersulfátů a sulfátů alifatických alkoholů, a soli sulfatovaných hexa-, hepta- a oktadekanolů, a glykolethery alifatických alkoholů, kondensáty sulfonovaného naftalenu a jeho derivátů s formaldehydem, kondensáty naftalenu nebo naftalensulfo-

nových kyselin s fenolem a formaldehydem, polyoxyethylen-
oktylfenoethery, ethoxylovaný isooktyl-, oktyl- nebo
nonylfenol, alkylfenylpolyglykoether nebo tributylfenyl-
polyglykoether, alkarylpolyetheralkoholy, isotride-
cylalkohol, kondenzáty alifatický alkohol/ethylenoxid,
ethoxylovaný ricinový olej, polyoxyethylenalkylethery nebo
polyoxypropylenalkylethery, laurylalkoholpolyglykoether-
acetat, estery sorbitolu, lignin-sulfitové odpadní
kapaliny nebo methylcelulosa.

Prášky, materiály pro rozhazování a prachy se
mohou připravit mísením nebo mletím aktivních látek
dohromady s tuhým nosičem.

Granule, například potažené granule, impregnované
granule a homogenní granule se mohou připravit navázáním
aktivních složek na tuhé nosiče. Tuhými nosiči jsou
minerální zeminy, jako jsou křemičitany, silikagel,
silikáty, mastek, kaolin, vápenec, vápno, křída, červená
hlinka, spraš, jíl, dolomit, rozsvíková zemina, síran
vápenatý, síran hořečnatý, oxid hořečnatý, mleté
syntetické materiály, hnojiva, jako je síran amonný,
fosforečnan amonný, dusičnan amonný, močoviny a produkty
rostlinného původu, jako je obilná drť, drť ze stromové
kůry, dřevná drť a drť ze skořápek ořechů, celulózové
prachy nebo jiné tuhé nosiče.

Koncentrace aktivních složek sloučenin I
prostředcích k přímému použití se mohou pohybovat ve
velkém rozpětí. Obecně prostředky obsahují od 0,001 do 98
hmotnostních, výhodně od 0,01 do 95 % hmotnostních,
alespoň jedné aktivní složky. Aktivní složky se použijí

v čistotě od 90 do 100 %, výhodně od 95 do 100 % (podle NMR spektra).

Následující příklady formulací ilustrují přípravu takových prostředků:

- I 20 dílů hmotnostních sloučeniny č.2.2 se rozpustí ve směsi složené z 80 dílů hmotnostních alkylovaného benzenu, 10 dílů hmotnostních aduktu 8 až 10 mol ethylenoxidu a 1 mol N-monoethanolamidu kyseliny olejové, 5 dílů hmotnostních dodecylbenzensulfonatu vápenatého a 5 dílů hmotnostních aduktu 40 mol ethylenoxidu a 1 mol ricinového oleje. Vlitím roztoku do 100 000 dílů hmotnostních vody a důkladnou distribucí v ní se získá vodná disperse, která obsahuje 0,02 % hmotnostního aktivní sloučeniny.
- II 20 dílů hmotnostních sloučeniny č. 2.8 se rozpustí ve směsi složené ze 40 dílů hmotnostních cyklohexanonu, 30 dílů hmotnostních isobutanolu, 20 dílů hmotnostních aduktu 7 mol ethylenoxidu a 1 mol isooktylfenolu a 10 dílů hmotnostních aduktu 40 mol ethylenoxidu a 1 mol ricinového oleje. Vlitím roztoku do 100 000 dílů hmotnostních vody a důkladnou distribucí v ní se získá vodná disperse, která obsahuje 0,02 % hmotnostního aktivní sloučeniny.
- III 20 dílů hmotnostních aktivní sloučeniny č. 2.8 se rozpustí ve směsi složené z 25 dílů hmotnostních cyklohexanonu, 65 dílů hmotnostních frakce minerálního oleje s teplotou varu od 210 do 280 °C a 10 dílů hmotnostních aduktu 40 mol ethylenoxidu a 1 mol ricinového oleje. Vlitím roztoku do 100 000 dílů

hmotnostních vody a důkladnou distribucí v ní se získá vodná disperse, která obsahuje 0,02 % hmotnostního aktivní sloučeniny.

- V 20 dílů hmotnostních aktivní sloučeniny č. 2.2 se důkladně smísí se 3 díly hmotnostními diisobutyl-naftalensulfonatu sodného, 17 díly hmotnostními sodné soli kyseliny lignosulfonové ze sulfitového odpadního louhu a 60 díly hmotnostními práškového silikagelu a směs se mele v kladivové mlýně. Důkladnou distribucí směsi ve 20 000 dílů hmotnostních vody se získá směs, která obsahuje 0,1 % hmotnostního aktivní sloučeniny.

3 díly hmotnostní aktivní sloučeniny č. 2.8 se smísí s 97 díly hmotnostními jemně drceného kaolinu. Tím se získá prach, který obsahuje 3 % hmotnostní aktivní sloučeniny.

- VI 20 dílů hmotnostních aktivní sloučeniny č. 2.2 se smísí důkladně se 2 díly hmotnostními dodecylbenzen-sulfonatu vápenatého, 8 díly hmotnostními polyglykoetheru alifatického alkoholu, 2 díly hmotnostními sodné soli kondenzátu fenol/močovina/formaldehyd a 68 díly hmotnostními parafinového minerálního oleje. Tím se získá stabilní olejová disperse.

- VII 1 díl hmotnostní aktivní sloučeniny č. 2.8 se rozpustí ve směsi složené ze 70 dílů hmotnostních cyklohexanonu, 20 dílů hmotnostních ethoxylovaného isooktylphenolu a 10 dílů hmotnostních ethoxylovaného ricinového oleje. Tím se získá stabilní emulsní koncentrát.

III 1 díl hmotnostní aktivní sloučeniny č. 2.2 se rozpustí ve směsi složené z 80 dílů hmotnostních cyklohexanonu a 20 dílů hmotnostních přípravku Wettol® EM 31 (neiontový emulgátor založený na ethoxylovaném ricinovém oleji). Tím se získá stabilní emulsní koncentrát.

Herbicidní prostředky nebo sloučeniny obecného vzorce I se mohou aplikovat před vzejitím nebo po vzejití. Pokud jsou aktivní složky jistými užitkovými plodinami méně dobře tolerovány, mohou se použít takové aplikační postupy, ve kterých se herbicidní prostředky rozprašují za pomoci postřikovacího zařízení takovým způsobem, že se do styku s listy citlivých plodin dostanou do co nejmenšího kontaktu, pokud vůbec, přičemž aktivní složky zasáhnou listy nežádoucích rostlin, které rostou dole nebo povrch holé půdy (ošetření po sklizni, odstavná plocha).

V závislosti na potlačovaném cíli, období, cílové rostlině a stadiu růstu jsou míry aplikace aktivní složky od 0,001 do 3,0, výhodně od 0,01 do 1,0, kg/ha aktivní látky (a.s.).

K rozšíření spektra účinku a k dosažení synergického působení se 3-(heterocyklyl)benzoylpyrazolové deriváty obecného vzorce I mohou mísit s velkým počtem zástupců jiných skupin herbicidních aktivních složek nebo aktivních složek regulujících růst a mohou se aplikovat společně. Vhodnými složkami pro směsi jsou například 2,4-thiadiazoly, 1,3,4-thiadiazoly, amidy, kyselina aminofosforečná a její deriváty, aminotriazoly, anilidy,

kyseliny aryloxy/hetaryloxyalkanové a jejich deriváty, kyselina benzoová a její deriváty, benzothiadiazinony, 2-hetaroyl/aroyl-1,3-cyklohexanediony, hetarylarylketony, benzylisoxazolidinony, deriváty meta-CF₃-fenylu, karbamaty, kyselina chinolinkarboxylová a její deriváty, chloracetanilidy, deriváty cyklohexenonoximetheru, diaziny, kyselina dichlorpropionová a její deriváty, dihydrobenzofurany, dihydrofuran-3-ony, dinitroaniliny, dinitrofenoly, difenylethery, bipyridyly, kyseliny halogenkarboxylové a jejich deriváty, močoviny, 3-fenyluracily, imidazoly, imidazolinony, N-fenyl-3,4,5,6-tetrahydroftalimidy, oxadiazoly, oxirany, fenoly, estery kyseliny aryloxy- a heteroaryloxyfenoxypropionové, kyselina fenylloctová a její deriváty, kyselina 2-fenylpropionová a její deriváty, pyrazoly, fenylpyrazoly, pyridaziny, kyselina pyridinkarboxylová a její deriváty, pyrimidyl-ethery, sulfonamidy, sulfonylmočoviny, triaziny, triazinony, triazolinony, triazolkarboxamidy a uracily.

Dále může být výhodné aplikovat sloučeniny obecného vzorce I, samotné nebo v kombinaci s jinými herbicidy, také ve formě směsi s jinými prostředky ochrany rostlin, například s činidlo pro potlačování škůdců nebo fytopatogenních hub nebo bakterií. Zajímavá je také mísitelnost s roztoky minerálních solí, které se používají k nahrazování nutričních deficitů a deficitů stopových prvků. Mohou se také přidat nefytotoxické oleje a olejové koncentráty.

Příklady použití

Herbicidní aktivita 3-(heterocyklyl)benzoyl-pyrazolových derivátů obecného vzorce I se prokáže v následujících skleníkových experimentech.

Použitými kořenáči jsou plastické nádoby obsahující písčitohlinitou půdu s přibližně 3,0 % humusu jako substrát. Semena testovacích rostlin se pro každý druh vysejí zvlášť.

Při ošetření před vzejitím se aktivní složky suspendované nebo emulgované ve vodě aplikují bezprostředně po vysetí pomocí jemně distribuujících trysek. Kořenáče se opatrně zalijí k navození klíčení a růstu a následně pokryjí průsvitnými plastickými kryty až rostliny zakoření. Toto zakrytí navozuje uniformní klíčení testovacích rostlin, pokud není nežádoucím způsobem ovlivněno aktivními složkami.

Pro ošetření po vzejití se testovací rostliny napřed vypěstují na rostlinu o výšce od 3 do 15 cm, v závislosti na růstové velikosti, a pouze poté se ošetří aktivními složkami, které jsou suspendovány nebo emulgovány ve vodě. Testovací rostliny se k tomuto účelu sejí buď přímo do stejných kořenáčů, ve kterých se pěstují nebo se napřed odděleně vypěstují jako semenáčky a přesadí se do testovacích kořenáčů několik dní před ošetřením. Míra aplikace pro ošetření po vzejití je 0,25, 0,125 nebo 0,0625 kg aktivní látky/ha.

V závislosti na druhu se rostliny uchovávají při teplotě od 10 do 25 °C nebo od 20 do 35 °C. Testovací doba je od 2 do 4 týdnů. Během této doby se rostliny ošetřují a jejich odpověď na jednotlivá ošetření se vyhodnotí.

Vyhodnocení se provádí za použití stupnice od 0 do 100. Hodnota 100 znamená žádné vzejití rostlin nebo úplné zničení alespoň nadzemních částí a hodnota 0 znamená žádné poškození neboli normální průběh růstu.

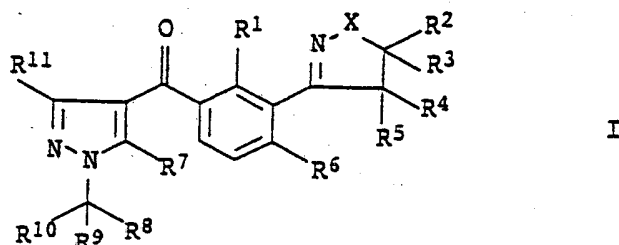
Použité rostliny ve skleníkových experimentech patří k následujícím druhům:

Latinský název	Český název
<i>Chenopodium album</i>	merlík bílý
<i>Echinochloa crus-galli</i>	ježatka kuří noha
<i>Ipomea</i> ssp.	povíjnice ssp.
<i>Polygonum persicaria</i>	rdesno černivec
<i>Setaria faberi</i>	bér velký
<i>Setaria viridis</i>	bér zelený
<i>Sinapis alba</i>	hořčice bílá
<i>Solanum nigrum</i>	lilek černý

Při mírách aplikace 0,25 nebo 0,125 kg/ha vykazuje sloučenina č. 2.2 (tabulka 2) velmi dobré působení po vzejití jak proti škodlivým trávám *Echinochloa crus-galli* a *Setaria viridis*, tak proti plevelům *Chenopodium album*, *Polygonum persicaria* a *Solanum nigrum*. Navíc sloučenina 2.8 (tabulka 2) vykazuje za výše uvedených podmínek velmi dobré působení proti nežádoucím rostlinám, jako je *Echinochloa crus-galli*, *Setaria faberi*, *Ipomea* ssp., *Sinapis alba* a *Solanum nigrum*.

P A T E N T O V É N Á R O K Y

1. 3-(Heterocyklyl)benzoylpyrazolový derivát obecného vzorce I



ve kterém

X je O, NH nebo N(alkylová skupina s 1 až 6 atomy uhlíku);

R¹ je nitroskupina, atom halogenu, alkoxy skupina s 1 až 4 atomy uhlíku, halogenalkoxy skupina s 1 až 4 atomy uhlíku, alkylthio skupina s 1 až 4 atomy uhlíku, halogenalkylthio skupina s 1 až 4 atomy uhlíku, alkylsulfonylová skupina s 1 až 4 atomy uhlíku nebo halogenalkylsulfonylová skupina s 1 až 4 atomy uhlíku;

R², R³, R⁴, R⁵ jsou atom vodíku, alkylová skupina s 1 až 4 atomy uhlíku nebo halogenalkylová skupina s 1 až 4 atomy uhlíku;

R⁶ je atom halogenu, nitroskupina, halogenalkylová skupina s 1 až 4 atomy uhlíku, alkoxy skupina s 1 až 4 atomy uhlíku, halogenalkoxy skupina s 1 až 4 atomy uhlíku, alkylthio skupina s 1 až 4 atomy uhlíku, halogenalkylthio skupina s 1 až 4 atomy uhlíku;

uhlíku, alkylsulfonylová skupina s 1 až 4 atomy uhlíku nebo halogenalkylsulfonylová skupina s 1 až 4 atomy uhlíku;

R^7

je hydroxyl, alkoxy skupina s 1 až 6 atomy uhlíku, alkenyloxyskupina se 3 až 6 atomy uhlíku, alkylsulfonyloxyskupina s 1 až 6 atomy uhlíku, alkylkarbonyloxyskupina s 1 až 6 atomy uhlíku, (alkylthio)karbonyloxyskupina s 1 až 4 atomy uhlíku, fenylsulfonyloxy- nebo fenylkarbonyloxyskupina, kde fenylová část dvou posledně zmíněných substituentů může být částečně nebo plně halogenována a/nebo může nést jednu až tři následující skupiny: nitroskupina, kyanoskupina, alkylová skupina s 1 až 4 atomy uhlíku, halogenalkylová skupina s 1 až 4 atomy uhlíku, alkoxy skupina s 1 až 4 atomy uhlíku nebo halogenalkoxy skupina s 1 až 4 atomy uhlíku;

R^8, R^9

jsou alkylová skupina s 1 až 4 atomy uhlíku;

R^{10}

je atom vodíku nebo alkylová skupina s 1 až 4 atomy uhlíku, kde počet atomů uhlíku částí R^8 , R^9 a R^{10} je dohromady nejvýše 7,

R^{11}

je atom vodíku nebo alkylová skupina s 1 až 4 atomy uhlíku,

jejích zemědělsky užitečných solí.

3-(Heterocyklyl)benzoylpyrazolový derivát obecného vzorce I podle nároku 1, kde

R je atom kyslíku,

R^1 je nitroskupina, atom halogenu, alkoxy skupina s 1 až 4 atomy uhlíku, alkylthioskupina s 1 až 4 atomy uhlíku,

R^6 je alkylthioskupina s 1 až 4 atomy uhlíku, alkylsulfonylová skupina s 1 až 4 atomy uhlíku.

3. 3-(Heterocyklyl)benzoylpyrazolový derivát obecného vzorce I podle nároku 1, kde

R je atom kyslíku,

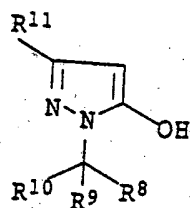
R^1 je nitroskupina, atom halogenu, alkoxy skupina s 1 až 4 atomy uhlíku, alkylthioskupina s 1 až 4 atomy uhlíku,

R^6 je atom halogenu, nitroskupina, halogenalkylová skupina s 1 až 4 atomy uhlíku, alkoxy skupina s 1 až 4 atomy uhlíku nebo halogenalkoxy skupina s 1 až 4 atomy uhlíku.

4. 3-(Heterocyklyl)benzoylpyrazolový derivát obecného vzorce I podle nároku 1, kde

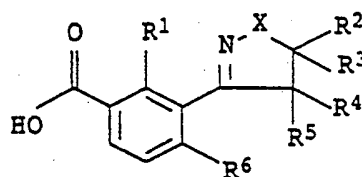
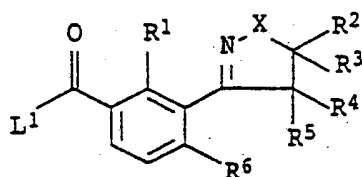
R je N(alkylová skupina s 1 až 6 atomy uhlíku).

5. Způsob přípravy 3-(heterocyklyl)benzoylpyrazolových derivátů obecného vzorce I, kde R^7 je hydroxyl, podle nároku 1, v y z n a č u j í c í s e t í m, že zahrnuje acylaci pyrazolu obecného vzorce II



II

aktivovanou kyselinou benzoovou IIIa nebo kyselinou benzoovou IIIb



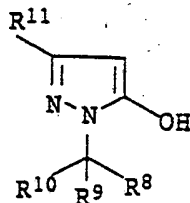
kde

proměnné X, R¹ až R⁶ a R⁸ až R¹¹ mají význam definovaný v nároku 1 a

X je nukleofilně vytěsnitelná odstupující skupina,

a přesmyk acylačního produktu za přítomnosti nebo nepřítomnosti katalyzátoru k získání sloučenin obecného vzorce I, kde R⁷ je hydroxyl.

b. Způsob přípravy 3-(heterocyklyl)benzoylpyrazolových derivátů obecného vzorce I, kde R⁷ je hydroxyl, podle nároku 1, v y z n a č u j í c í s e t í m, že zahrnuje reakci pyrazolu obecného vzorce II

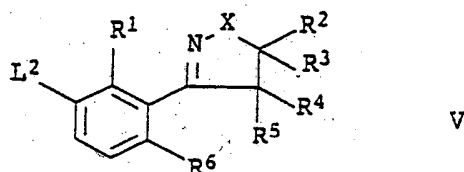


II

kde

proměnné R^8 až R^{11} mají význam definovaný v nároku 1

nebo její soli alkalického kovu, s 3-(heterocyklyl)benzenovým derivátem obecného vzorce V

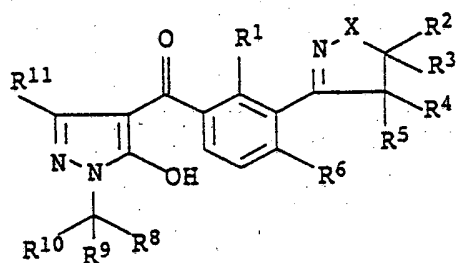


kde

proměnné X a R^1 až R^6 mají význam definovaný v nároku 1 a

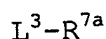
je odstupující skupina, za přítomnosti oxidu uhelnatého, katalyzátoru a báze.

1. Způsob přípravy 3-(heterocyklyl)benzoylpyrazolových derivátů obecného vzorce I, kde R^7 není hydroxyl, podle nároku 1, v y z n a č u j í c í s e t í m, že zahrnuje reakci 3-(heterocyklyl)benzoylpyrazolového derivátu I, kde R^7 = hydroxyl



I, kde R^7 = OH

se sloučeninou obecného vzorce VI



VI

ve kterém

L^3 je nukleofilně vytěsnitelná odstupující skupina a

R^{7a} je alkylová skupina s 1 až 6 atomy uhlíku, alkenylová skupina se 3 až 6 atomy uhlíku, alkylsulfonylová skupina s 1 až 6 atomy uhlíku, alkylkarbonylová skupina s 1 až 6 atomy uhlíku v alkylovém podílu, (alkylthio)karbonylová skupina s 1 až 4 atomy uhlíku v alkylovém podílu, fenylsulfonylová skupina nebo fenylkarbonylová skupina, kde fenylová část dvou posledně zmíněných substituentů může být částečně nebo plně halogenována a/nebo může nést jednu až tři následující skupiny: nitroskupina, kyano- skupina, alkylová skupina s 1 až 4 atomy uhlíku, halogenalkylová skupina s 1 až 4 atomy uhlíku, alkoxy skupina s 1 až 4 atomy uhlíku nebo halogenalkoxy skupina s 1 až 4 atomy uhlíku.

8. Prostředek v y z n a č u j í c í s e t í m, že obsahuje herbicidně účinné množství alespoň jednoho 3-(heterocyklyl)benzoylpyrazolového derivátu obecného vzorce I nebo zemědělsky užitečnou sůl sloučeniny obecného vzorce I podle kteréhokoli z nároků 1 až 4 a pomocné látky, které jsou obvykle používány pro formulaci prostředků ochrany užitkových rostlin.

9. Způsob výroby herbicidních prostředků podle nároku 8, v y z n a č u j í c í s e t í m, že zahrnuje mísení herbicidně účinného množství alespoň jednoho 3-(heterocyklyl)benzoylpyrazolového derivátu obecného vzorce I nebo zemědělsky užitečné soli sloučeniny obecného vzorce I podle kteréhokoli z nároků 1 až 4 a pomocné látky, které jsou obvykle používány pro formulaci prostředků ochrany užitkových rostlin.

10. Způsob potlačování nežádoucí vegetace, v y z n a č u j í c í s e t í m, že zahrnuje ponechání herbicidně účinného množství alespoň jednoho 3-(heterocyklyl)-benzoylpyrazolového derivátu obecného vzorce I nebo zemědělsky užitečné soli sloučeniny obecného vzorce I podle kteréhokoli z nároků 1 až 4 působit na rostliny, jejich stanoviště a/nebo na semeno.

11. Použití 3-(heterocyklyl)benzoylpyrazolových derivátů obecného vzorce I a/nebo jejich zemědělsky užitečných solí podle kteréhokoli z nároků 1 až 4 jako herbicidů.