



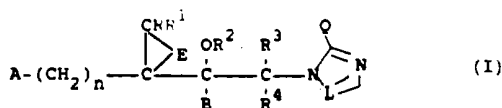
Patentdirektoratet

- (21) Patentansøgning nr.: 1475/90 (51) Int.Cl. 5: **A 01 N 43/653**
 (22) Indleveringsdag:.... 15 jun 1990 A 01 N 43/50
 (24) Løbedag:..... 07 dec 1988 A 61 K 31/41
 (41) Alm. tilgængelig:.... 25 jul 1990 A 61 K 31/415
 (62) Stamansøgningsnummer:..... A 61 K 31/44
 (86) International ansøgning nr.:... PCT/US88/04343 C 07 D 249/08
 (86) International indleveringsdag: 07 dec 1988 C 07 D 401/06
 (85) Videreførselsdag: 15 jun 1990 C 07 D 403/06
 C 07 D 405/06
 C 07 D 409/06
 C 07 D 233/54
- (30) Prioritet: 17 dec 1987 US 134261
 (71) Ansøger: *E. I. du Pont de Nemours and Company, 1007 Market street; Wilmington; Delaware 19898, US
 (72) Opfinder: John *Cuomo, 16 Hillcroft; Newark; Delaware 19711, US
 Richard Scot *Greenberg, 41-10 Erli Road; Fairlawn; New Jersey 07410, US
 Richard Eric *Olson, 600 Silverside Road; Wilmington; Delaware 19809, US
 (74) Fuldmægtig: Ingeniørfirmaet Budde, Schou & Co., H.C. Andersens Boulevard 4, 1553, København V

- (54) Carbinoler og deres anvendelse til bekæmpelse af svampeinfektioner samt uønsket plantevækst
 (57) Sammendrag

1475-90

Hidtil ukendte carbinoler med den almene formel



eller er farmaceutisk eller agrikulturelt egnede salte deraf, i hvilken formel

E betegner en binding eller et oxygenatom, idet dog når E betyder oxygen, betyder R og R¹ ikke halogen,

A betyder perfluoralkyl med 1-8 carbonatomer, N(CH₃)₂, OH, naphthyl, der eventuelt er substitueret med i alt 1-3 substituent, der hver uafhængigt af hinanden er valgt blandt halogen og CF₃, -N $\begin{matrix} \diagup \\ \diagdown \end{matrix}$ X, der eventuelt er substitueret med 1 eller 2 methylgrupper, phenyl, der eventuelt er substitueret med i alt 1-3 substituent, der hver er valgt uafhængigt blandt

halogen, alkyl med 1-4 carbonatomer, halogenalkyl med 1-4 carbonatomer, alkoxy med 1-4 carbonatomer, og med ikke mere end én gruppe valgt blandt

halogenalkoxy med 1-4 carbonatomer, CN, CO₂R₁₄, CH=NOR₁₄, S(O)_mR₅, R₆, 2-, 3- eller 4-pyridyl eller et N-oxid deraf, imidazol-1-yl, 1,2,4-triazol-1-yl og -N $\begin{matrix} \diagup \\ \diagdown \end{matrix}$ X, eventuelt substitueret med 1 eller 2 methylgrupper,

fortsættes

eller en heterocyclisk ring valgt blandt imidazol-1-yl, 1,2,4-triazol-1-yl, 2- eller 3-thienyl og 2-, 3- eller 4-pyridyl eller et N-oxid deraf, eventuelt substitueret med 1 eller 2 substituent, der hver for sig er valgt blandt

halogen, alkyl med 1-4 carbonatomer, CF_3 , alkoxy med 1-4 carbonatomer, halogenalkoxy med 1-4 carbonatomer og $\text{S(O)}_m\text{R}^5$,

B betyder alkyl med 1-8 carbonatomer, naphthyl, biphenyl,

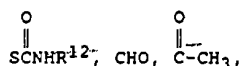


R^6 , perfluoralkyl med 1-8 carbonatomer, phenyl, der eventuelt er substitueret med 1-3 substituent, der hver for sig er valgt blandt halogen, alkyl med 1-4 carbonatomer, halogenalkyl med 1-4 carbonatomer, alkoxy med 1-4 carbonatomer, og med ikke mere end én gruppe valgt blandt halogenalkoxy med 1-4 carbonatomer, CN, CO_2R_{14} , $\text{CH}=\text{NOR}_{14}$, $\text{S(O)}_m\text{R}^5$, 2-, 3- eller 4-pyridyl eller et N-oxid deraf,

benzyl, der eventuelt er substitueret på phenylringen med halogen eller alkyl med 1-4 carbonatomer, eller eventuelt α -substitueret med 1 eller 2 methylgrupper, eller

en heterocyclisk gruppe valgt blandt 2- eller 3-thienyl og 2-, 3- eller 4-pyridyl, hvilke heterocycliske grupper eventuelt er substitueret med 1 eller 2 substituent, der hver for sig er valgt blandt halogen, alkyl med 1-4 carbonatomer, halogenalkoxy med 1-4 carbonatomer, CF_3 og $\text{S(O)}_m\text{R}^5$,

Q betyder hydrogen, halogen, $\text{S(O)}_m\text{R}^{11}$,



CO_2R^{13} , SCN, SSR^{12} eller SH eller det tilsvarende disulfid, forudsat at når Q er forskellig fra hydrogen, betyder n 0, R, R^1 og R^4 betyder hver for sig H eller CH_3 , R^3 betyder hydrogen, og A og B betyder hver phenyl, der eventuelt er substitueret med fra 1 til 3 substituent, der hver for sig er halogen, CH_3 , CF_3 , OCH_3 eller $\text{S(O)}_m\text{R}^5$,

L betyder CH eller N, idet dog når L betyder CH, betyder Q hydrogen,

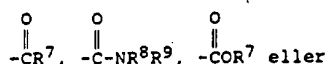
n betyder 0-4, idet dog når A betyder $-\text{N} \begin{array}{c} \diagup \quad \diagdown \end{array} \text{X}$, $\text{N}(\text{CH}_3)_2$ eller OH, er n forskellig fra 0,

m betegner hver gang 0, 1 eller 2,

X betyder C, NR^{10} eller O,

R og R^1 betyder hver for sig hydrogen, alkyl med 1-4 carbonatomer, halogen eller phenyl eller tilsammen cycloalkyl med 3-7 carbonatomer,

R^2 betyder hydrogen, allyl, propargyl, alkyl med 1-4 carbonatomer,



halogenalkyl med 1-4 carbonatomer

R^3 og R^4 betyder hver for sig hydrogen, fluor eller alkyl med 1-4 carbonatomer,

R^5 betyder alkyl med 1-4 carbonatomer,

R^6 betyder phenyl, der eventuelt er substitueret med i alt 1-3 substituent, der hver for sig er valgt blandt halogen og CF_3 ,

1475-90

- R⁷ betyder alkyl med 1-4 carbonatomer, phenyl eller benzyl,
R⁸ og R⁹ betyder hver for sig hydrogen, alkyl med 1-4 carbonatomer, phenyl eller benzyl,
R¹⁰ betyder hydrogen, alkyl med 1-4 carbonatomer eller acetyl,
R¹¹ betyder alkyl med 1-4 carbonatomer, halogenalkyl med 1-2 carbonatomer, CH₂CN, CH₂SCN, CH(CH₃)CN, CH₂CO₂CH₃ eller CH₂CO₂CH₂CH₃,
R¹² betyder alkyl med 1-4 carbonatomer, allyl, phenyl, der eventuelt er substitueret med 1-2 substituenten, der hver for sig betyder halogen, CH₃ eller OCH₃, eller benzyl, der eventuelt er substitueret med 1-2 substituenten, der hver for sig er halogen, CH₃ eller OCH₃,
R¹³ betyder hydrogen eller alkyl med 1-4 carbonatomer, og
R¹⁴ betyder alkyl med 1-4 carbonatomer,
kan anvendes i lægemidler til bekæmpelse af svampeinfektioner samt til bekæmpelse af uønsket plantevækst.