

(19)
ČESKÁ
REPUBLIKA



ÚŘAD
PRŮMYSLOVÉHO
VLASTNICTVÍ

(21) Číslo přihlášky: 1995 - 2768

(22) Přihlášeno: 13.04.1994

(30) Právo přednosti:
23.04.1993 DE 1993/4313412

(40) Zveřejněno: 14.02.1996

(Věstník č. 2/1996)

(47) Uděleno: 14.01.2003

(24) Oznámeno udělení ve Věstníku: 12.03.2003
(Věstník č. 3/2003)

(86) PCT číslo: PCT/EP94/01141

(87) PCT číslo zveřejnění: WO 94/025442

(13) Druh dokumentu: B6

(51) Int. Cl. ⁷:

C 07 D 239/60

C 07 D 405/12

C 07 D 409/12

C 07 D 401/12

C 07 D 417/12

C 07 D 413/12

A 01 N 43/54

(73) Majitel patentu:

BASF AKTIENGESELLSCHAFT, Ludwigshafen, DE;

(72) Původce vynálezu:

Baumann Ernst, Dudenhofen, DE;
Rheinheimer Joachim, Ludwigshafen, DE;
Vogelbacher Uwe Josef, Ludwigshafen, DE;
Bratz Matthias, Speyer, DE;
Theobald Hans, Limburgerhof, DE;
Gerber Matthias, Limburgerhof, DE;
Westphalen Karl Otto, Speyer, DE;
Walter Helmut, Obrigheim, DE;
Rademacher Wilhelm, Limburgerhof, DE;

(74) Zástupce:

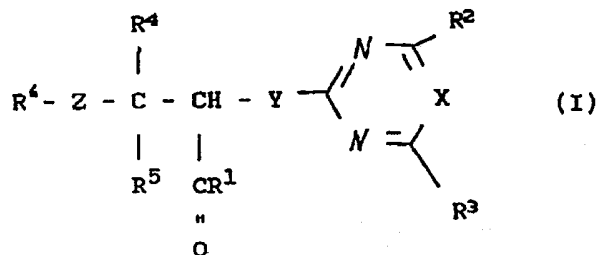
Koreček Ivan JUDr., Na baště sv. Jiří 9, Praha 6, 16000;

(54) Název vynálezu:

Derivát 3-(het)arylkarboxylové kyseliny, způsob jeho přípravy, prostředek, který ho obsahuje, způsob potlačování nežádoucího růstu a regulování růstu rostlin

(57) Anotace:

Je popsán derivát 3-(het)arylkarboxylové kyseliny obecného vzorce I, ve kterém substituenty mají specifický význam, způsob přípravy tohoto derivátu reakcí příslušné karboxylové kyseliny s pyrimidylovými deriváty, herbicidní prostředek, s obsahem derivátu obecného vzorce I, způsob potlačování nežádoucího růstu rostlin působením derivátu obecného vzorce I na rostliny nebo na jejich životní prostor, prostředek pro ovlivňování růstu rostlin, který obsahuje derivát obecného vzorce I a způsob regulování růstu rostlin, působením bioregulačně účinného množství derivátu obecného vzorce I.



Derivát 3-(het)arylkarboxylové kyseliny, způsob jeho přípravy, prostředek, který ho obsahuje, způsob potlačování nežádoucího růstu a regulování růstu rostlin

5 Oblast techniky

Vynález se týká derivátů 3-(het)arylkarboxylové kyseliny, které regulují růst rostlin a mají herbicidní účinky způsobu jejich přípravy, prostředku, který takový derivát obsahuje, způsobu potlačování nežádoucího růstu rostlin a způsobu regulování růstu rostlin.

10

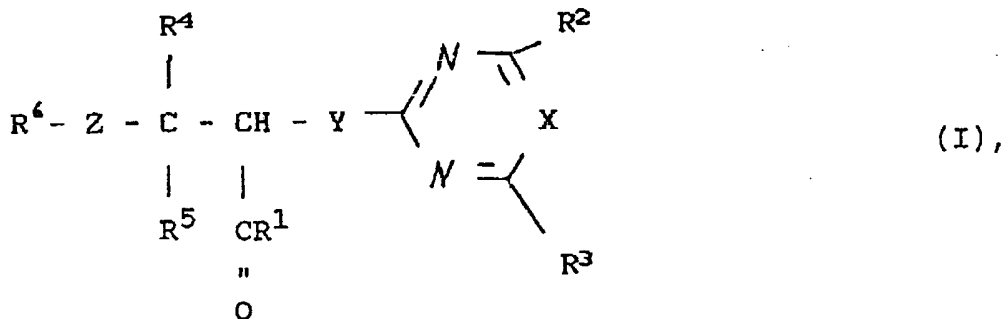
Dosavadní stav techniky

Ze stavu techniky jsou známy podobné deriváty karboxylové kyseliny jako podle vynálezu, například také 3-alkoxyderiváty, avšak žádné z nich neobsahují (het)arylový zbytek v poloze 3 (viz například EP-A 347 811, EP-A 400 471, EP-A 409 368, EP-A 481 512 a EP-A 517 215, Chemical Abstracts 119, č. 139 254e (1993), německá zveřejněná přihláška vynálezu P 41 42 570 [EP-A 548 710]).

Protože herbicidní a/nebo biologicky regulující účinek a selektivita známých sloučenin nejsou vždy uspokojivé, hledají se stále sloučeniny s lepší selektivitou a/nebo s lepším biologickým účinkem. Vynález je výsledkem takového úsilí.

25 Podstata vynálezu

Předmětem tohoto vynálezu je derivát 3-(het)arylkarboxylové kyseliny obecného vzorce I



kde znamená

30

R^1 atom vodíku nebo skupinu vzorce OR^{10} , kde znamená

R^{10} atom vodíku, kation alkalického kovu nebo ekvivalent kovu alkalické zeminy, amoniový kation nebo terc.-alkylamoniový ion s 1 až 4 atomy uhlíku v každém alkylovém podílu, alkylovou skupinu s 1 až 8 atomy uhlíku substituovanou jedním až pěti atomy halogenu a/nebo skupinami ze souboru zahrnujícího alkoxy skupinu s 1 až 4 atomy uhlíku, alkylthio skupinu s 1 až 4 atomy uhlíku, kyanoskupinu, alkylkarbonylovou skupinu s 1 až 4 atomy uhlíku v alkylovém podílu, cykloalkylovou skupinu s 3 až 8 atomy uhlíku, alkoxykarbonylovou skupinu s 1 až 4 atomy uhlíku v alkoxy podílu, fenylovou skupinu, fenoxyskupinu a fenyلكarbonylovou skupinu, přičemž aromatické podíly jsou popřípadě substituovány jedním až pěti atomy halogenu a/nebo jednou až třemi skupinami ze souboru zahrnujícího nitroskupinu, kyanoskupinu, alkylovou skupinu s 1 až 4 atomy uhlíku, halogenalkylovou skupinu s 1 až 4 atomy uhlíku, alkoxy skupinu s 1 až 4 atomy uhlíku, halogenalkoxy skupinu s 1 až 4 atomy uhlíku a alkylthioskupinu s 1 až 4 atomy uhlíku,

40

R^2 a R^3 alkoxy skupinu s 1 až 4 atomy uhlíku, X CH skupinu, Y a Z atom kyslíku,

5 R^4 skupinu fenylovou nebo naftylovou popřípadě substituovanou alespoň jednou, zvláště jednou až třemi skupinami ze souboru zahrnujícího atom halogenu, nitroskupinu, kyanoskupinu, hydroxyskupinu, merkaptoskupinu, aminoskupinu, alkylovou skupinu s 1 až 4 atomy uhlíku, halogenalkylovou skupinu s 1 až 4 atomy uhlíku, alkoxy skupinu s 1 až 4 atomy uhlíku, halogenalkoxy skupinu s 1 až 4 atomy uhlíku, alkylthioskupinu s 1 až 4 atomy uhlíku, alkylamino-skupinu s 1 až 4 atomy uhlíku, dialkylaminoskupinu s 1 až 4 atomy uhlíku v každém alkylovém podílu, alkylkarbonylovou skupinu s 1 až 4 atomy uhlíku v alkylovém podílu a alkoxykarbonylovou skupinu s 1 až 4 atomy uhlíku v alkoxy-

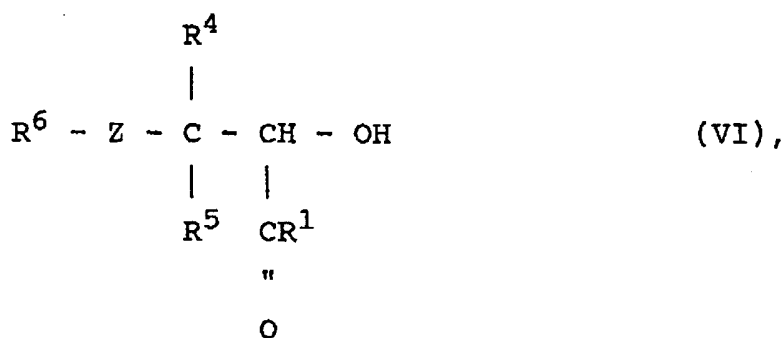
15 pětičlenný nebo šestičlenný heteroaromatický zbytek, který obsahuje 1 až 3 atomy dusíku a/nebo jeden atom síry nebo kyslíku, popřípadě substituovaný jednou nebo několika skupinami ze souboru zahrnujícího atom halogenu, nitroskupinu, kyanoskupinu, hydroxyskupinu, merkaptoskupinu, aminoskupinu, alkylovou skupinu s 1 až 4 atomy uhlíku, halogenalkylovou skupinu s 1 až 4 atomy uhlíku, alkoxy skupinu s 1 až 4 atomy uhlíku, halogenalkoxy skupinu s 1 až 4 atomy uhlíku, alkylthioskupinu s 1 až 4 atomy uhlíku, alkylaminoskupinu s 1 až 4 atomy uhlíku, dialkylaminoskupinu s 1 až 4 atomy uhlíku v alkylovém podílu, alkylkarbonylovou skupinu s 1 až 4 atomy uhlíku v každém alkylovém podílu, alkoxykarbonylovou skupinu s 1 až 4 atomy uhlíku v alkoxy podílu a fenylovou skupinu,

25 R^5 atom vodíku nebo alkylovou skupinu s 1 až 4 atomy uhlíku,

R^6 alkylovou skupinu s 1 až 8 atomy uhlíku popřípadě substituovanou alespoň jednou skupinou ze souboru zahrnujícího atom halogenu, nitroskupinu, kyanoskupinu, alkoxy skupinu s 1 až 4 atomy uhlíku, alkenyloxy skupinu se 3 až 6 atomy uhlíku, alkinyloxy skupinu se 3 až 6 atomy uhlíku, alkylthioskupinu s 1 až 4 atomy uhlíku, halogenalkoxy skupinu s 1 až 4 atomy uhlíku, alkylkarbonylovou skupinu s 1 až 4 atomy uhlíku v alkylovém podílu, alkoxykarbonylovou skupinu s 1 až 4 atomy v alkoxy podílu, alkylamino-skupinu s 1 až 4 atomy uhlíku, dialkylaminoskupinou s 1 až 4 atomy uhlíku v každém alkylovém podílu, fenylovou skupinu, fenylovou skupinu nebo fenoxyskupinu substituovanou alespoň jednou, například jednou až třemi skupinami ze souboru zahrnujícího atom halogenu, nitroskupinu, kyanoskupinu, alkylovou skupinu s 1 až 4 atomy uhlíku, halogenalkylovou skupinu s 1 až 4 atomy uhlíku, alkoxy skupinu s 1 až 4 atomy uhlíku, halogenalkoxy skupinu s 1 až 4 atomy uhlíku nebo alkylthioskupinu s 1 až 4 atomy uhlíku,

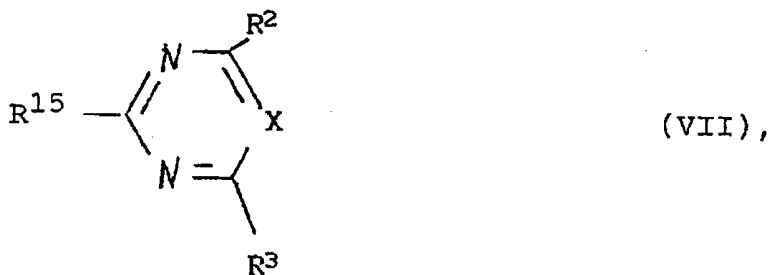
40 s podmínkou, že R^6 neznamena nesubstituovanou alkylovou skupinu s 1 až 4 atomy uhlíku, když R^4 je nesubstituovaný fenyl, Z značí atom kyslíku a současně R^5 je methyl nebo atom vodíku.

Předmětem tohoto vynálezu také je způsob přípravy svrchu vymezeného derivátu, jehož podstata spočívá v tom, že se derivát 3-het(aryl)karboxylové kyseliny obecného vzorce VI



kde jednotlivé symboly mají výše uvedený význam,

nechá reagovat s pyrimidylovými nebo triazinylovými deriváty obecného vzorce VII



5 kde

R^{15} znamená atom halogenu nebo skupinu vzorce $R^{16}-SO_2-$,

10 kde R^{16} znamená alkylovou skupinu s 1 až 4 atomy uhlíku, halogenalkylovou skupinu s 1 až 4 atomy uhlíku nebo fenylovou skupinu,

v inertním rozpouštědle v přítomnosti báze.

15 Předmětem tohoto vynálezu rovněž je herbicidní prostředek, jehož podstata spočívá v tom, že obsahuje svrchu vymezený derivát obecného vzorce I a obvyklé inertní přísady.

Předmětem tohoto vynálezu také je způsob potlačování nežádoucího růstu rostlin, jehož podstata spočívá v tom, že se nechá působit herbicidně účinné množství svrchu vymezeného derivátu obecného vzorce I na rostliny nebo na jejich životní prostor.

20

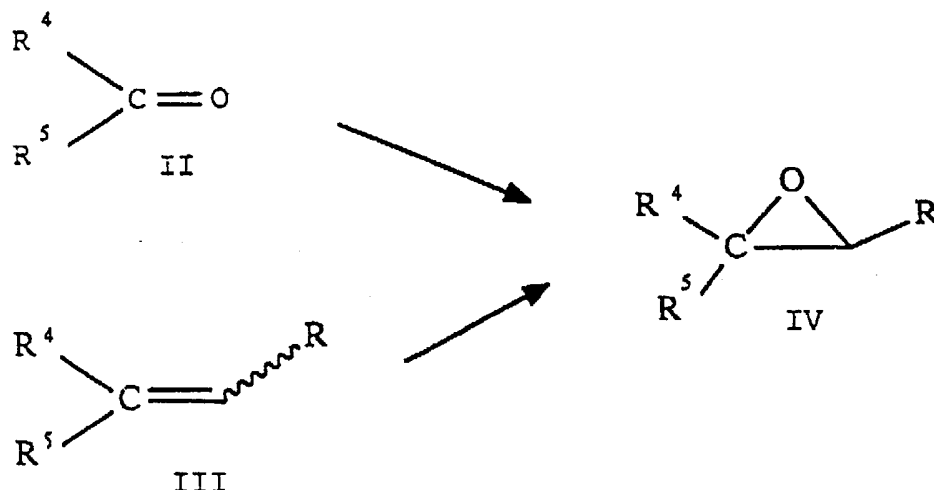
Předmětem tohoto vynálezu dále je prostředek pro ovlivňování růstu rostlin, jehož podstata spočívá v tom, že obsahuje derivát svrchu uvedeného obecného vzorce I a obvyklé inertní přísady.

25 Předmětem tohoto vynálezu konečně je způsob regulování růstu rostlin, jehož podstata spočívá v tom, že se nechá působit bioregulačně účinné množství svrchu vymezeného derivátu obecného vzorce I na rostliny nebo jejich životní prostor.

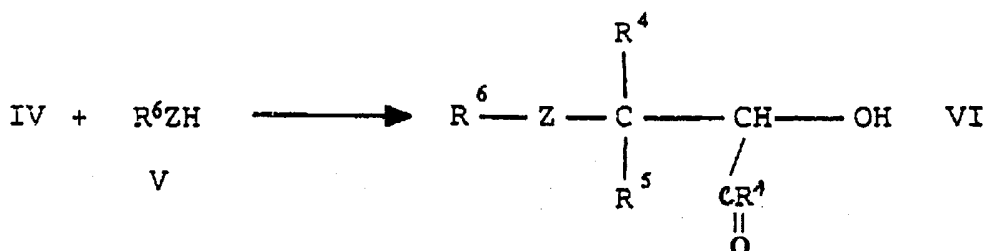
30 Tento vynález je dále objasněn detailněji a v širších souvislostech.

S překvapením se zjistilo, že předmětné deriváty 3-(het)arylkarboxylové kyseliny mají vynikající herbicidní vlastnosti a regulují růst rostlin.

35 Způsob přípravy sloučenin podle tohoto vynálezu vychází z epoxidů obecného vzorce IV, které se získají obecně známým způsobem, například jak popsal J. March v Advanced Organic Chemistry, 2. vyd., str. 862 a 750, /1983/, z aldehydů nebo ketonů obecného vzorce II nebo z olefinů obecného vzorce III podle vztahu:



Deriváty 3-(het)arylkarboxylové kyseliny obecného vzorce VI se mohou vyrobit, jestliže se přivedou do reakce epoxidy obecného vzorce IV (například s R značícím skupinu vzorce ROOR¹⁰) s alkoholy nebo thioley obecného vzorce V, ve kterém R⁶ a Z mají význam uvedený v nároku 1.



K tomu se sloučenina obecného vzorce IV zahřívá s přebytkem, například 1,2-molárním až 7-molárním, výhodně s 2,5-molárním ekvivalentem, sloučeniny obecného vzorce V na teplotu od 50 do 200 °C, výhodně na teplotu od 80 do 150 °C.

Reakce se může také provádět v přítomnosti ředidla. K tomu se mohou používat všechna rozpouštědla inertní vůči použitým reakčním činidlům.

Příklady takových rozpouštědel nebo ředidel jsou voda, alifatické, alicyklické a aromatické uhlovodíky, které vždy mohou popřípadě být chlorovány, jako například hexan, cyklohexan, petrolether, ligroin, benzen, toluen, xylén, methylchlorid, chloroform, chlorid uhličitý, ethylenchlorid a trichlorethylen, ethery, jako je například diizopropylether, dibutylether, propylenoxid, dioxan a tetrahydrofuran, ketony, jako je například aceton, methylethylketon, methylizopropylketon a methylizobutylketon, nitrily, jako je například acetonitril a propionitril, alkoholy, jako je například methanol, ethanol, izopropanol, butanol a ethylenglykol, estery, jako je například ethylacetát a amylacetát, amidy kyselin, jako je například dimethylformamid a dimethylacetamid, sulfoxidy a sulfony, jako je například dimethylsulfoxid a sulfolan a báze, jako je například pyridin.

Reakce se výhodně provádí při teplotě od 0 °C do teploty varu rozpouštědla nebo směsi rozpouštědel.

Přítomnost reakčního katalyzátoru může být výhodná. Jako katalyzátory přitom přicházejí v úvahu silné organické a anorganické kyseliny, stejně jako Lewisovy kyseliny. Příkladně se uvádějí kyselina sírová, chlorovodíková a trifluoroctová, bortrifluoridetherát a alkoxyd čtyřmocného titanu.

Předmětný způsob přípravy derivátu 3-(het)arylkarboxylové kyseliny obecného vzorce I, spočívá podle vynálezu v tom, že se derivát S-het(aryl)karboxylové kyseliny obecného vzorce VI nechá reagovat s pyrimidylovými nebo triazinylovými deriváty obecného vzorce VII v inertním rozpouštědle v přítomnosti báze.

Reakce se provádí výhodně v jednom z výše jmenovaných inertních ředidel za přídavku vhodné báze, to znamená báze, která působí deprotonizaci meziprojektu obecného vzorce VI, za teploty místnosti až teploty varu rozpouštědla.

Jako báze mohou sloužit hydridy alkalických kovů nebo alkalických zemin, jako natriumhydrid, kaliumhydrid nebo kalciumhydrid, uhličitany, jako uhličitany alkalických kovů, například uhličitan sodný nebo uhličitan draselný, hydroxidy alkalických kovů nebo kovů alkalických zemin, jako hydroxid sodný nebo hydroxid draselný, organokovové sloučeniny, jako butyllithium, nebo amidy alkalických kovů, jako lithiumdiizopropylamid.

Sloučeniny obecného vzorce I se mohou také připravit tak, že se vychází z odpovídajících karboxylových sloučenin, to znamená sloučenin obecného vzorce I, ve kterém R^{10} znamená atom vodíku, a tyto sloučeniny se obvyklým způsobem nejprve převedou na aktivovanou formu, jako halogenid, anhydrid nebo imidazolid, a tato forma se potom nechá reagovat s odpovídající hydroxysloučeninou obecného vzorce



kde má R^{10} shora uvedený význam kromě atomu vodíku.

Tato reakce se nechá provádět v obvyklém rozpouštědle a vyžaduje často přídavek báze, jako které přicházejí v úvahu báze svrchu jmenované. Tyto oba kroky se mohou také zjednodušit tím, že se karboxylovou kyselinou působí v přítomnosti činidla odštěpujícího vodu, jako karbodiimidu, na hydroxysloučeninu.

Kromě toho se sloučeniny obecného vzorce I se také mohou připravit tak, že se vychází ze solí odpovídajících karboxylové kyseliny, to znamená sloučenin obecného vzorce I, kde R^{10} znamená kation alkalického kovu nebo ekvivalent kationtu kovu alkalické zeminy. Tyto soli se mohou uvést do reakce s řadou sloučenin obecného vzorce



kde znamená

A obvyklou nukleofugní odštěpitelnou skupinu, například atom halogenu, jako atom chloru, bromu nebo jodu, nebo arylsulfonylovou nebo alkylsulfonylovou skupinu, popřípadě substituovanou atomem halogenu, alkylovou skupinou nebo halogenalkylovou skupinou, jako je toluensulfonyl nebo methylsulfonyl, nebo jinou ekvivalentní odštěpitelnou skupinu.

Sloučeniny obecného vzorce $R^{10}-A$ s reaktivním substituentem A, kde R^{10} má shora uvedený význam, jsou známy nebo se lehko získají na základě obecných odborných znalostí. Tato reakce se může provádět v běžném rozpouštědle a výhodně za přídavku báze, přičemž v úvahu přicházejí báze uvedené výše.

Alkylovou skupinou s 1 až 8 atomy uhlíku se míní skupina jako methyl, ethyl, propyl, 1-methyl-ethyl, butyl, 1-methylpropyl, 2-methylpropyl, 1,1-dimethylethyl, pentyl, 1-methylbutyl, 2-methylbutyl, 3-methylbutyl, 1,2-dimethylpropyl, 1,1-dimethylpropyl, 2,2-dimethylpropyl, 1-ethylpropyl, hexyl, 1-methylpentyl, 2-methylpentyl, 3-methylpentyl, 4-methylpentyl, 1,2-dimethylbutyl, 1,3-dimethylbutyl, 2,3-dimethylbutyl, 1,1-dimethylbutyl, 2,2-diaethylbutyl,

3,3-dimethylbutyl, 1,1,2-trimethylpropyl, 1,2,2-trimethylpropyl, 1-ethylbutyl, 2-ethylbutyl, 1-ethyl-2-methylpropyl, které mohou být ještě substituovány.

- Alkylovou skupinou s 1 až 4 atomy uhlíku se míní skupina jako je methyl, ethyl, 1-propyl, 2-propyl, 2-methyl-2-propyl, 2-methyl-1-propyl, 1-butyl a 2-butyl.

Cykloalkylovou skupinu se 3 až 8 atomy uhlíku se míní skupina, jako cyklopropyl, cyklobutyl, cyklopentyl, cyklohexyl, cykloheptyl a cyklooktyl.

- Alkenylovou skupinou se 3 až 6 atomy uhlíku se míní skupina jako 2-propenyl, 2-butenyl, 3-butenyl, 1-methyl-2-propenyl, 2-methyl-2-propenyl, 2-pentenyl, 3-pentenyl, 4-pentenyl, 1-methyl-2-butenyl, 2-methyl-2-butenyl, 3-methyl-2-butenyl, 1-methyl-3-butenyl, 2-methyl-3-butenyl, 3-methyl-3-butenyl, 1,1-dimethyl-2-propenyl, 1,2-dimethyl-2-propenyl, 1-ethyl-2-propenyl, 2-hexenyl, 3-hexenyl, 4-hexenyl, 5-hexenyl, 1-methyl-2-pentenyl, 2-methyl-2-pentenyl, 3-methyl-2-pentenyl, 4-methyl-2-pentenyl, 3-methyl-3-pentenyl, 4-methyl-3-pentenyl, 1-methyl-4-pentenyl, 2-methyl-4-pentenyl, 3-methyl-4-pentenyl, 4-methyl-4-pentenyl, 1,1-dimethyl-2-butenyl, 1,1-dimethyl-3-butenyl, 1,2-dimethyl-2-butenyl, 1,2-dimethyl-3-butenyl, 1,3-dimethyl-2-butenyl, 1,3-dimethyl-3-butenyl, 2,2-dimethyl-3-butenyl, 2,3-dimethyl-2-butenyl, 2,3-dimethyl-3-butenyl, 1-ethyl-2-butenyl, 1-ethyl-3-butenyl, 2-ethyl-2-butenyl, 2-ethyl-3-butenyl, 1,1,2-trimethyl-2-propenyl, 1-ethyl-1-methyl-2-propenyl a 1-ethyl-2-methyl-2-propenyl, zvláště 2-propenyl, 2-butenyl, 3-methyl-2-butenyl a 3-methyl-2-pentenyl.

- Alkinylovou skupinu se 3 až 6 atomy uhlíku se míní skupina jako 2-propinyl, 2-butenyl, 3-butenyl, 1-methyl-2-propinyl, 2-pentinyl, 3-pentinyl, 4-pentinyl, 1-methyl-3-butenyl, 2-methyl-3-butenyl, 1-methyl-2-butenyl, 1,1-dimethyl-2-propinyl, 1-ethyl-2-propinyl, 2-hexinyl, 3-hexinyl, 4-hexinyl, 5-hexinyl, 1-methyl-2-pentinyl, 1-methyl-2-pentinyl, 1-methyl-3-pentinyl, 1-methyl-4-pentinyl, 2-methyl-3-pentinyl, 2-methyl-4-pentinyl, 3-methyl-4-pentinyl, 4-methyl-2-pentinyl, 1,1-dimethyl-2-butenyl, 1,1-dimethyl-3-butenyl, 1,2-dimethyl-3-butenyl, 2,2-dimethyl-3-butenyl, 1-ethyl-2-butenyl, 1-ethyl-3-butenyl, 2-ethyl-3-butenyl a 1-ethyl-1-methyl-2-propinyl, výhodou 2-propinyl, 2-butenyl, 1-methyl-2-propinyl a 1-methyl-2-butenyl, obzvláště 2-propinyl.

- Alkoxykupinou s 1 až 4 atomy uhlíku se míní skupina jako methoxykupina, ethoxykupina, propoxykupina, 1-methylethoxykupina, butoxykupina, 1-methylpropoxykupina, 2-methylpropoxykupina, 1,1-dimethylethoxykupina, zvláště methoxykupina, ethoxykupina a 1-methylethoxykupina.

- Halogenalkylovou skupinou s 1 až 4 atomy uhlíku, zvláště halogenalkylovou skupinu s 1 nebo 2 atomy uhlíku se míní skupina jako fluormethyl, difluormethyl, trifluormethyl, chlordinfluormethyl, dichlorfluormethyl, trichloromethyl, 1-fluorethyl, 2-fluorethyl, 2,2-difluorethyl, 2,2,2-trifluorethyl, 2-chlor-2,2-difluorethyl, 2,2-chlor-2-fluorethyl, 2,2,2-trichlorethyl a pentafluorethyl.

- Halogenalkoxykupinou s 1 až 4 atomy uhlíku, zvláště halogenalkoxykupinou s 1 nebo 2 atomy uhlíku, se míní skupina jako například difluormethoxykupina, trifluormethoxykupina, chlordinfluormethoxykupina, 1-fluorethoxykupina, 2-fluorethoxykupina, 2,2-difluorethoxykupina, 1,1,2,2-tetrafluorethoxykupina, 2,2,2-trifluorethoxykupina, 2-chlor-1,1,2-tri-fluorethoxykupina a pentafluorethoxykupina, zvláště trifluormethoxykupina.

- Alkylthioskupinou s 1 až 4 atomy uhlíku se míní skupina jako methylthioskupina, ethylthioskupina, propylthioskupina, 1-methylethylthioskupina, butylthioskupina, 1-methylpropylthioskupina, 2-methylpropylthioskupina, 1,1-dimethylethylthioskupina, zvláště methylthioskupina a ethylthioskupina.

- Alkylkarbonylovou skupinou s 1 až 4 atomy uhlíku v alkylovém podílu se míní skupina jako zvláště methylkarbonyl, ethylkarbonyl, propylkarbonyl, 1-methylethylkarbonyl, butylkarbonyl, 1-methylpropylkarbonyl, 2-methylpropylkarbonyl a 1,1-dimethylethylkarbonyl.
- 5 Alkoxykarbonylovou skupinou s 1 až 4 atomy uhlíku v alkoxylovém podílu se míní skupina jako methoxykarbonyl, ethoxykarbonyl, propoxykarbonyl, 1-methylethoxykarbonyl, butoxykarbonyl, 1-methylpropoxykarbonyl, 2-methylpropoxykarbonyl a 1,1-dimethylethoxykarbonyl.
- 10 Alkylaminoskupinou s 1 až 4 atomy uhlíku se míní skupina jako methylaminoskupina, ethylaminoskupina, propylaminoskupina a butylaminoskupina.
- Dialkylaminoskupinu s 1 až 4 atomy uhlíku v každém alkylovém podílu se míní skupina, jako zvláště dimethylaminoskupina, dipropylaminoskupina, N-propyl-N-methylaminoskupina, N-propyl-N-ethylaminoskupina, diizopropylaminoskupina, N-izopropyl-N-methylaminoskupina, N-izopropyl-N-ethylaminoskupina a N-izopropyl-N-propylaminoskupina.
- 15 Fenylovou skupinou, popřípadě alespoň jednou, například jednou až třikrát substituovanou atomem halogenu, nitroskupinou, kyanoskupinou, alkylovou skupinou s 1 až 4 atomy uhlíku, halogenalkylovou skupinou s 1 až 4 atomy uhlíku, alkoxykupinou s 1 až 4 atomy uhlíku, halogenalkoxykupinou s 1 až 4 atomy uhlíku nebo alkylthioskupinou s 1 až 4 atomy uhlíku se míní skupina jako například 2-fluorfenyl, 3-chlorfenyl, 4-bromfenyl, 2-methylfenyl, 3-nitrofenyl, 4-kyanfenyl, 2-trifluormethylfenyl, 3-methoxyfenyl, 4-trifluorethoxyfenyl, 2-methylthiofenyl, 2,4-dichlorfenyl, 2-methoxy-3-methylfenyl, 2,4-dimethoxyfenyl, 2-nitro-5-kyanfenyl a 2,6-difluorfenyl.
- 25 Pětičlennou nebo šestičlennou heteroarylovou skupinou se míní skupina jako furyl, thienyl, pyrrolyl, pyrazolyl, imidazolyl, triazolyl, izoxazolyl, oxazolyl, izothiazolyl, thiazolyl, thiadiazolyl, pyridyl, pyrimidinyl, pyrazinyl, pyridazinyl, triazinyl, například 2-furyl, 3-furyl, 2-thienyl, 3-thienyl, 3-izoxazolyl, 4-izoxazolyl, 5-izoxazolyl, 3-izo-thiazolyl, 4-izothiazolyl, 5-izothiazolyl, 2-oxazolyl, 4-oxazolyl, 5-oxazolyl, 2-thiazolyl, 4-thiazolyl, 5-thiazolyl, 2-imidazolyl, 4-imidazolyl, 5-imidazolyl, 2-pyrrolyl, 3-pyrrolyl, 4-pyrrolyl, 3-pyrazolyl, 4-pyrazolyl, 5-pyrazolyl, 2-pyridyl, 3-pyridyl, 4-pyridyl, oxa-2,4-diazolyl, oxa-3,4-diazolyl, thia-2,4-diazolyl, thia-3,4-diazolyl a triazolyl, přičemž heteroaromatické skupiny mohou nést jednu až pět atomů halogenu, jak shora uvedeno, zvláště atomů fluoru a chloru a/ nebo jednu až
- 30 tři skupiny ze souboru zahrnujícího alkylovou skupinu s 1 až 4 atomy uhlíku, alkoxykupinu s 1 až 4 atomy uhlíku, alkylthioskupinu s 1 až 4 atomy uhlíku, kyanoskupinu, nitroskupinu, alkylkarbonylovou skupinu s 1 až 8 atomy uhlíku v alkylovém podílu, alkoxykarbonylovou skupinu s 1 až S atomy uhlíku v alkoxylovém podílu, fenyl, fenoxyskupinu a fenyلكarbonylovou skupinu.
- 35 Pětičlennou heteroaromatickou skupinu vázanou přes atom dusíku, obsahující jeden až tři atomy dusíku, která může nést jeden nebo dva atomy halogenu a/nebo jednu nebo dvě skupiny ze souboru zahrnujícího alkylovou skupinu s 1 až 4 atomy uhlíku, halogenalkylovou skupinu s 1 až 4 atomy uhlíku, alkoxykupinu s 1 až 4 atomy uhlíku, feriny, halogenalkoxykupinu s 1 až 4 atomy uhlíku a/nebo alkylthioskupinu s 1 až 4 atomy uhlíku se míní zvláště skupina jako
- 40 1-pyrazolyl, 3-methyl-1-pyrazolyl, 4-methyl-1-pyrazolyl, 3,5-dimethyl-1-pyrazolyl, 3-fenyl-1-pyrazolyl, 4-fenyl-1-pyrazolyl, 4-chlor-1-pyrazolyl, 4-brom-1-pyrazolyl, 1-imidazolyl, 1-benzimidazolyl, 1,2,4-(1-triazolyl), 3-methyl-1,2,4-(1-triazolyl), 5-methyl-1,2,4-(1-triazolyl), 1-benztriazolyl a 3,4-dichlor-1-imidazolyl.
- 45 S ohledem na biologický účinek jsou zvláště výhodné deriváty 3-(het)arylkarbonylové kyseliny obecného vzorce I,
- 50

kde znamená

55 R^2 a

R³ methoxyskupinu,

- 5 R⁴ znamená pětičlennou nebo šestičlennou heteroarylovou skupinu jako furyl, thienyl, pyrolyl, pyrazolyl, imidazolyl, triazolyl, izoxazolyl, oxazolyl, izothiazolyl, thiazolyl, thiadiazolyl, pyridyl, pyrimidil, pyrazinyl, pyridazinyl, triazinyl, například 2-furyl, 3-furyl, 2-thienyl, 3-thienyl, 3-izoxazolyl, 4-izoxazolyl, 5-izoxazolyl, 3-izothiazolyl, 4-izothiazolyl, 5-izothiazolyl, 2-oxazolyl, 4-oxazolyl, 5-oxazolyl, 2-thiazolyl, 4-thiazolyl, 5-thiazolyl, 2-imidazolyl, 4-imidazolyl, 5-imidazolyl, 2-pyrrolyl, 3-pyrrolyl, 4-pyrrolyl, 3-pyrazolyl, 4-pyrazolyl, 5-pyrazolyl, 2-pyridyl, 3-pyridyl, 4-pyridyl, oxa-2,4-diazolyl, oxa-3,4-diazolyl, thia-2,4-diazolyl, thia-3,4-diazolyl a triazolyl, přičemž heteroaromatické jsou popřípadě substituovány jedním až pět i atomy halogenu. zvláště atomy fluoru a chloru a/nebo jednou až třemi skupinami ze souboru zahrnujícího
- 10 alkylovou skupinu s 1 až 4 atomy uhlíku, alkoxykupinu s 1 až 4 atomy uhlíku, alkylthio- skupinu s 1 až 4 atomy uhlíku, kyanoskupinu, nitroskupinu, alkyl karbonylovou skupinu s 1 až 8 atomy uhlíku v alkylové části, alkoxykarbonylovou skupinu s 1 až 8 atomy uhlíku v alkoxylovém podílu, fenyl, fenoxyskupinu a fenylkarbonylovou skupinu,
- 15 dále znamená fenylovou nebo naftylovou skupinu, které jsou popřípadě substituovány alespoň jednou, například jednou až třemi skupinami ze souboru zahrnujícího atom halogenu, nitroskupinu, kyanoskupinu, hydroxyskupinu, merkaptoskupinu, aminoskupinu, alkylovou skupinu s 1 až 4 atomy uhlíku, halogenalkylovou skupinu s 1 až 4 atomy uhlíku, alkoxykupinu s 1 až 4 atomy uhlíku, halogenalkoxykupinu s 1 až 4 atomy uhlíku, alkyl- thioskupinu s 1 až 4 atomy uhlíku, alkylaminoskupinu s 1 až 4 atomy uhlíku, dialkylamino- skupinu s 1 až 4 atomy uhlíku v každém alkylovém podílu, alkylkarbonylovou skupinu s 1 až 4 atomy uhlíku v alkylovém podílu nebo alkoxykarbonylovou skupinu s 1 až 4 atomy uhlíku v alkoxylovém podílu, jako například 3-hydroxyfenyl, 4-dimethylaminofenyl, 2-merkaptofenyl, 3-methoxykarbonyl-fenyl, 4-acetylfenyl, 1-naftyl, 2-naftyl, 3-brom-2-naftyl, 4-methyl-1-naftyl, 5-methoxyl-naftyl, 6-trifluormethyl-1-naftyl, 7-chlor-1-naftyl, 8-hydroxyl-naftyl,
- 20 30

a ostatní symboly mají význam, uvedený u obecného vzorce I za podmínky, uvedené u obecného vzorce I.

- 35 Zvlášť výhodné jsou sloučeniny uvedené v následující tabulce.

Tabulka

R ¹	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ²	R ³	X	Y	Z
OH	fenyl	methyl	methyl	OCH ₃	OCH ₃	CH	S	S
OH	fenyl	methyl	methyl	OCH ₃	OCH ₃	CH	O	S
OCH ₃	fenyl	methyl	methyl	OCH ₃	OCH ₃	CH	S	S
OH	fenyl	isopropyl	methyl	OCH ₃	OCH ₃	CH	O	O
OCH ₃	2-fluorfenyl	ethyl	methyl	OCH ₃	OCH ₃	CH	O	O
OC ₂ H ₅	3-fluorfenyl	propyl	methyl	OCH ₃	OCH ₃	N	O	O
ON(CH ₃) ₂	4-bromfenyl	isopropyl	methyl	CF ₃	CF ₃	CH	S	O
ON=C(CH ₃) ₂	2-thienyl	methyl	methyl	OCF ₃	OCF ₃	CH	O	S
HNSO ₂ C ₆ H ₅	3-thienyl	methyl	methyl	CH ₃	CH ₃	CH	O	O
NHfenyl	2-furyl	methyl	methyl	Cl	Cl	CH	O	O
ONa	3-furyl	methyl	methyl	OCH ₃	-OCH ₂ -CH ₂ -	S	O	O
O-CH ₂ -C≡CH	fenyl	ethyl	ethyl	OCH ₃	CF ₃	CH	O	O
OH	fenyl	propyl	propyl	OCH ₃	OCF ₃	CH	O	S
OCH ₃	fenyl	isopropyl	isopropyl	OCH ₃	CH ₃	CH	O	O
OC ₂ H ₅	fenyl	methyl	sek.-butyl	OCH ₃	Cl	CH	S	O
ON(CH ₃) ₂	2-methylfenyl	methyl	methyl	OCH ₃	OCH ₃	CH	O	O
ON(CH ₃) ₂	3-methoxyfenyl	methyl	methyl	OCH ₃	OCH ₃	CH	O	O
ON=C(CH ₃) ₂	4-nitrofenyl	methyl	methyl	OCH ₃	OCH ₃	CH	O	O
NHfenyl	2-oxazolyl	methyl	methyl	CF ₃	CF ₃	N	S	O
ONa	4-oxazolyl	methyl	3-propenyl	OCF ₃	OCF ₃	N	O	S

R ¹	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ²	R ³	X	Y	Z
O-CH ₂ -C≡CH	5-oxazolyl	methyl	3-propinyl	CH ₃	CH ₃	N	O	O
OH	3-isoxazolyl	methyl	cyklopentyl	Cl	Cl	N	O	O
OCH ₃	4-isoxazolyl	methyl	cyklohexyl	OCH ₃	-OCH ₂ -CH ₂ -	O	O	O
OC ₂ H ₅	5-isoxazolyl	methyl	cyklopropylmethyl	OCH ₃	CF ₃	N	S	O
ON(CH ₃) ₂	fenyl	methyl	1-fenyl-3-propinyl	OCH ₃	OCF ₃	N	O	S
ON=C(CH ₃) ₂	2-hydroxyfenyl	methyl	methyl	OCH ₃	CH ₃	N	O	O
ONSO ₂ C ₆ H ₅	3-trifluormethyl-fenyl	methyl	methyl	OCH ₃	Cl	N	O	O
NHfenyl	4-dimethylamino-fenyl	methyl	methyl	OCH ₃	OCH ₃	CH	S	O
ONa	2-imidazolyl	ethyl	methyl	OCH ₃	OCH ₃	CH	S	S
O-CH ₂ -C≡CH	4-imidazolyl	propyl	methyl	OCH ₃	OCH ₃	N	S	S
OH	3-pyrazolyl	isopropyl	methyl	CF ₃	CF ₃	CH	O	S
OCH ₃	4-pyrazolyl	methyl	methyl	OCF ₃	OCF ₃	CH	O	O
OC ₂ H ₅	fenyl	methyl	trifluorethyl	CH ₃	CH ₃	CH	O	O
ON(CH ₃) ₂	fenyl	methyl	benzyl	Cl	Cl	CH	O	O
ON(CH ₃) ₂	fenyl	methyl	2-methoxyethyl	OCH ₃	-OCH ₂ -CH ₂ -	S	S	O
ON=C(CH ₃) ₂	fenyl	methyl	3-methoxykarbonyl-propyl	OCH ₃	CF ₃	N	S	S
NHfenyl	2-pyridyl	methyl	2-chlorethyl	OCH ₃	OCF ₃	N	S	S
ONa	3-pyridyl	methyl	methyl	OCH ₃	CH ₃	N	O	O
O-CH ₂ -C≡CH	4-pyridyl	methyl	methyl	OCH ₃	Cl	N	O	O

Sloučeniny obecného vzorce I nebo herbicidní prostředky s jejich obsahem, stejně jako jejich soli s alkalickými kovy a kovy alkalických zemin, přijatelné pro životní prostředí, se mohou velmi dobře používat k potlačování plevelů a škodlivých trav v kulturách, jako je pšenice, rýže a kukuřice, sója a bavlna, přičemž účinek nastává při nižším použitém množství.

Tyto látky se mohou používat ve formě přímo rozstřikovatelných roztoků, prášků, suspenzí nebo také vysoko procentních vodných, olejových nebo jiných suspenzí nebo disperzí, emulzí, olejových disperzí, past, poprašků, posypů nebo granulátů, a to postřikem, vytvářením mlhy, poprášením, posypáním nebo zaléváním. Aplikační formy se zcela řídí účely použití; v každém případě se má zajistit co nejjemnější rozptýlení účinné látky podle tohoto vynálezu.

Sloučeniny obecného vzorce I se hodí obecně pro výrobu přímo rozstřikovatelných roztoků, emulzí, past nebo olejových disperzí. Jako inertní přísady přicházejí v úvahu mimo jiné frakce minerálních olejů se středně vysokou nebo vysokou teplotou varu, jako je petrolej nebo nafta, dále dehtový olej ze zpracování uhlí, stejně jako oleje rostlinného a živočišného původu, alifatické, cykloalifatické a aromatické uhlovodíky, například toluen, xylen, parafinické látky, tetrahydronaftalen, alkylované naftaleny nebo jejich deriváty, methanol, ethanol, propanol, butanol, cyklohexanol, cyklohexanon, chlorbenzen a izoforon, nebo silně polární rozpouštědla, například N,N-dimethylformamid, dimethylsulfoxid, N-methylpyrrolidon nebo voda.

Vodné aplikační formy se mohou připravovat z emulzních koncentrátů, past, smáčitelných prášků nebo granulátů dispergovatelných ve vodě tím, že se k nim přidá voda.

K výrobě emulzí, past nebo olejových disperzí se mohou účinné látky, jako takové nebo rozpuštěné v oleji nebo rozpouštědle, homogenizovat pomocí smáčedel, adheziv, dispergačních činidel nebo emulgačních činidel ve vodě. Tyto prostředky se však také mohou vyrobit z koncentráту, který sestává z účinné látky, smáčedla, adheziva, dispergačního činidla nebo emulgačního činidla a popřípadě rozpouštědla nebo oleje. Tyto koncentráty jsou vhodné po zředění vodou.

Jako povrchově aktivní látky přicházejí v úvahu alkalické soli, soli alkalických zemin a amonné soli aromatických sulfonových kyselin, například kyseliny ligninsulfonové, kyseliny fenol-sulfonové, kyseliny naftalensulfonové a kyseliny dibutyl-naftalensulfonové, stejně jako mastných kyselin, alkylsulfonáty a alkylarylsulfonáty, alkylsulfáty, sulfáty lauryletheru a sulfáty alifatických alkoholů a mastných kyselin, jakož i soli sulfatovaných hexadekonolů, heptadekanolů a oktadekanolů, stejně jako glykoethery alifatických alkoholů, kondenzační produkty sulfonovaného naftalenu a jeho derivátů s formaldehydem, kondenzační produkty naftalenu nebo kyseliny naftalensulfonové s fenolem a formaldehydem, polyoxyethylenoktylfenolether, ethoxylovaný izooktylfenol, oktylfenol, nonylfenol, alkylfenolpolyglykoether, tributylfenylpolyglykoether, alkylarylpolyetheralkoholy, izotridecylalkohol, kondenzační produkty ethylenoxidu s alifatickými alkoholy, ethoxylovaný ricinový olej, polyoxyethylenalkylether, ethoxylovaný polyoxypropylen, acetát polyglykoetheru laurylalkoholu, sorbitester, lignin ze sulfitových výluhů a methylcelulóza.

Práškové, posypové a poprašové prostředky se mohou vyrábět smísením nebo společným semletím účinné látky s pevnou nosnou látkou.

Granuláty, například povlečené, impregnované a homogenní granuláty, se mohou vyrobit tím, že se účinná látka váže na pevné nosné látce. Pevnými nosnými látkami jsou například minerální hlinky, jako je kyselina křemičitá, silikagel, gel kyseliny křemičité, křemičitany, mastek, kaolín, vápenec, vápno, křída, bolus, spraš, hlínka, dolomit, rozsvíková zemina, síran vápenatý, síran horečnatý, oxid horečnatý, rozemleté plastické hmoty, průmyslová hnojiva, jako například síran amonný, fosforečnan amonný, dusičnan amonný, močovina a rostlinné produkty, jako je obilná

mouka, rozemletá kůra stromů, dřevěná moučka a umleté ořechové skořápky, prášková celulóza a jiné pevné nosné látky.

- 5 Z obecného hlediska prostředky obsahují od 0,01 do 95 % hmotnostních účinné látky, s výhodou obsahují od 0,5 do 90 % hmotnostních účinné látky. Účinná látka se přitom používá o čistotě od 90 do 100 %, s výhodou od 95 do 100 %, podle NMR spektrální analýzy.

Jako příklady takových prostředků je možné uvést:

- 10 I. 20 dílů hmotnostních sloučeniny č. 2.1 se rozpustí ve směsi, která sestává z 80 dílů hmotnostních alkylovaného benzenu, 10 dílů hmotnostních adičního produktu 8 až 10 mol ethylenoxidu a 1 mol N-monoethanolamidu kyseliny olejové, 5 dílů hmotnostních vápenaté soli kyseliny dodecylbenzensulfonové a 5 dílů hmotnostních adičního produktu 40 mol ethylenoxidu a 1 mol ricinového oleje. Vylitím tohoto roztoku do vody a jemným rozptýlením ve 100 000 dílech hmotnostních vody se získá vodná disperze, která obsahuje 0,02 % hmotnostní účinné látky.
- 15 II. 20 dílů hmotnostních sloučeniny č. 2.1 se rozpustí ve směsi, která sestává z 40 dílů hmotnostních cyklohexanonu, 30 dílů hmotnostních izobutanolu, 20 dílů hmotnostních adičního produktu 7 mol ethylenoxidu a 1 mol izooktylfenolu a 10 dílů hmotnostních adičního produktu 40 mol ethylenoxidu a 1 mol ricinového oleje. Vylitím tohoto roztoku do vody a jemným rozptýlením v 100 000 dílech hmotnostních vody se získá vodná disperze, která obsahuje 0,02 % hmotnostní účinné látky.
- 20 III. 20 dílů hmotnostních sloučeniny č. 2.1 se rozpustí ve směsi, která sestává z 25 dílů hmotnostních cyklohexanonu, 65 dílů hmotnostních frakce minerálního oleje o teplotě varu 210 až 280 °C a 10 dílů hmotnostních adičního produktu 40 mol ethylenoxidu a 1 mol ricinového oleje. Vylitím tohoto roztoku do 100 000 dílů hmotnostních vody a jemným rozptýlením se získá vodná disperze, která obsahuje 0,02 % hmotnostní účinné látky.
- 25 IV. 20 dílů hmotnostních sloučeniny č. 2.1 se dobře promíchá se směsí, která sestává ze 3 dílů hmotnostních sodné soli kyseliny diizobutyl-naftalen- α -sulfonové, 17 dílů hmotnostních sodné soli kyseliny ligninsulfonové ze sulfitových odpadních louhů a 60 dílů hmotnostních práškovitého silikagelu a vzniklá směs se dobře rozemele na kladivovém mlýnu. Jemným rozptýlením této směsi ve 20 000 dílech hmotnostních vody se získá postřiková suspenze, která obsahuje 0,1 % hmotnostní účinné látky.
- 30 V. 3 díly hmotnostní sloučeniny č. 2.1 se promísí s 97 díly hmotnostními jemné rozmělněného kaolínu. Tímto způsobem se získá popraš, která obsahuje 3 % hmotnostní účinné látky.
- 35 VI. 20 dílů hmotnostních sloučeniny č. 2.1 se důkladně smísí s 2 díly hmotnostními vápenaté soli kyseliny dodecylbenzensulfonové, 8 díly hmotnostními polyglykoletheru alifatického alkoholu, 2 díly hmotnostními sodné soli kondenzačního produktu fenolu, močoviny a formaldehydu a 68 díly hmotnostními parafinického minerálního oleje. Získá se stabilní olejová disperze.
- 40
- 45

- 50 Aplikace se může provádět ošetřením před nebo po vzejití. Pokud jsou účinné látky pro určité kulturní rostliny méně snášitelné, tak se mohou použít aplikační technické postupy, při kterých se herbicidní prostředek rozstříkuje pomocí rozstříkovacího zařízení tak, že listy citlivých kulturních rostlin jsou co možná nejméně zasaženy, zatímco účinné látky ulpívají na listech nežádoucích rostlin rostoucích pod kulturními rostlinami nebo na nezakryté půdě (post-directed, lay-by metoda).

Aplikované množství účinné látky se řídí vždy podle druhu požadovaného potlačení, roční doby, rostlin vybraných k ošetření a růstového stádia od 0,001 do 5 kg účinné látky na hektar, s výhodou od 0,01 do 2 kg účinné látky na hektar.

- 5 Se zřetelem na mnohostrannost aplikačních metod se, mohou sloučeniny podle vynálezu nebo prostředky, které takové sloučeniny obsahují, používat ve velkém počtu kulturních rostlin k odstranění nežádoucích rostlin. V úvahu přicházejí například tyto kultury:

10 *Allium cepa* (cibule), *Ananas comosus* (ananas), *Arachis hypogaea* (podzemnice olejna), *Asparagus officinalis* (chřest), *Beta vulgaris* spp. *altissima* (řepa cukrovka), *Beta vulgaris* spp. *rapa* (řepa burák), *Brassica napus* var. *napus* (řepka olejka), *Brassica napus* var. *napobrassica* (tuřín), *Brassica rapa* var. *silvestris* (řepice), *Camellia sinensis* (čajovník), *Carthamus tinctorius* (světlice barvířská), *Carya illinoensis*, *Citrus limon* (citronovník), *Citrus sinensis* (pomerančovník), *Coffea arabica* (kávovník) (*Coffea canephora*, *Coffea liberica*), *Cucumis sativus* (okurka), *Cynodon dactylon* (troskut prstnatý), *Daucus carota* (mrkev obecná), *Elaeis guineensis* (olejnice), *Fragaria vesca* (jahodník), *Glycine max* (sója mrtnatá), *Gossypium hirsutum* (bavlník) (*Gossypium arboreum*, *Gossypium herbaceum*, *Gossypium vitifolium*), *Helianthus annuus* (slunečnice), *Hevea brasiliensis* (kaučukovník), *Hordeum vulgare* (ječmen obecný), *Humulus lupulus* (chmel), *Ipomea batatas* (povíjnice), *Juglans regia*, *Lens culinaris* (čočka), *Linum usitatissimum* (len), *Lycopersicon lycopersicum* (rajče), *Malus* spp. (jabloň), *Manihot esculenta* (dávivec), *Medicago sativa* (vojtěška), *Musa* spp. (banánovník), *Nicotina tabacum* (tabák) (*Nicotina rusticana*), *Olea europaea* (oliva), *Oryza sativa* (rýže setá), *Phaseolus lunatus* (fazol měsíční), *Phaseolus vulgaris* (fazol obecný), *Picea abies* (smrk), *Pinus* spp. (borovice), *Pisum sativum* (hrách zahradní), *Prunus avium* (třešeň ptačí), *Prunus persica* (broskvoň), *Pyrus communis* (hrušeň), *Ribes sylvestre* (rybíz červený), *Ricinus communis* (skořec), *Saccharum officinarum* (cukrová třtina), *Secale cereale* (žito), *Solanum tuberosum* (brambor), *Sorgum bicolor* (čirok) (*Sorgum vulgare*), *Theobroma cacao* (kakaovník), *Trifolium pratense* (jetel luční), *Triticum aestivum* (pšenice), *Triticum durum* (přešívka), *Vicia faba* (bob obecný), *Vitis vinifera* (réva vinná pěstovaná) a *Zea mays* (kukuřice).

30 Sloučeniny obecného vzorce I mohou prakticky ovlivnit všechna vývojová stádia rostlin různých druhů a jsou proto použitelné jako regulátory růstu rostlin. Rozmanitost účinku při působení jako regulátor růstu rostlin závisí především na

- 35 a) druhu a odrůdě rostliny.
- b) časovém okamžiku aplikace, ve vztahu k vývojovému stádiu rostliny a roční době,
- 40 c) místě a způsobu aplikace (například moření semen, ošetřování půdy, aplikaci na list nebo injekci do kmene u stromů),
- d) klimatických faktorech, například teplotě, množství srážek, kromě toho také na délce dne a intenzitě světla,
- 45 e) povaze půdy (včetně hnojení),
- f) prostředku nebo použité formě účinné látky a konečné
- g) použité koncentraci účinné látky.

50 Z řady různých možností použití sloučenin obecného vzorce I jako regulátorů růstu rostlin při pěstování rostlin, v zemědělství a v zahradnictví, se některé zmiňují dále.

- 55 A. Se sloučeninami použitelnými podle tohoto vynálezu se může silně omezit vegetativní růst rostlin, co se ukazuje zvláště na redukci prodlouženého růstu.

Ošetřené rostliny mají proto podsaditý vzrůst a mimo jiné se pozoruje tmavší zabarvení listů.

5 Jako výhodná pro praxi se ukazuje snížená intenzita růstu trav, stejně jako kultur náchylných k poléhání, jako je obilí, kukuřice, slunečnice a sója. Zkrácení a zesílení stébela tím způsobené zmenšuje nebo odstraňuje nebezpečí poléhání (lámání) rostlin za nepříznivých povětrnostních podmínek před sklizní.

10 Důležité je také použití regulátoru růstu rostlin k potlačování prodlouženého růstu a k časové změně průběhu zrání u bavlny. Tím se umožňuje úplná mechanizovaná sklizeň této důležité kulturní rostliny.

U ovocných a jiných stromů se s regulátory růstu rostlin mohou ušetřit náklady za prořezávání. Kromě toho regulátory růstu rostlin mohou zrušit potřebu obměny ovocných stromů.

15 Použitím regulátoru růstu rostlin se může také zvětšit nebo přibrzdit postranní rozvětvení rostlin. Je zájem na tom, aby například u tabákových rostlin se zamezilo nasazování postranních výhonků ve prospěch růstu listů.

20 S regulátory růstu rostlin se dá značně zvýšit například u zimní řepky také odolnost proti mrazu. Přitom se jednak zamezí předložený růst a vývoj až bujně (a tím zvláště náchylné k poškození mrazem) listové nebo rostlinné hmoty, jednak se mladé rostliny řepky po vysetí a před začátkem zimních mrazů navzdory příznivým růstovým podmínkám udržují ve vegetativním vývojovém stádiu. Tím se také odstraňuje ohrožení mrazem u takových rostlin, které mají sklon
25 k předčasnému opadávání zbrzděných květů a k přechodu do generativní fáze. Také u jiných kultur, například u ozimého obilí, je výhodné, pokud se ošetřením sloučeninami podle tohoto vynálezu na podzim dosáhne sice dobrého růstu, avšak vzešlé rostliny před zimou nejsou bujné. Tím se může zvýšit citlivost vůči mrazu a v důsledku relativně malých listů nebo rostlinné hmoty se předejde napadení různými chorobami (například chorobami způsobenými houbami).

30 B. S regulátory růstu rostlin se může dosáhnout zvětšení částí rostlin, stejně jako obsahu látek v rostlinách. Tak například je možné vyvolat růst většího množství pupat, květů, listů, plodů, zrnitého semene, kořenů a hlíz, zvýšení obsahu cukru v cukrové řepě, cukrové třtině a citrusových plodech, obsahu proteinů v obilí nebo v sóje nebo u gumovníkovitých stromů je možné podpořit zvýšený výtok latexu.
35

Přitom mohou sloučeniny obecného vzorce I způsobit zvýšení výnosu tím, že působí při látkové výměně v rostlinách nebo zesilují nebo potlačují vegetativní a/nebo generativní růst.

40 C. S regulátory růstu rostlin se může konečně dosáhnout jak zkrácení, tak prodloužení vývojových stádií, stejně jako urychlené nebo zpožděné zrání sklizených rostlinných částí před nebo po sklizni.

Hospodářský zajímavé je například usnadnění sklizně, které umožňuje časové zhuštění opadávání nebo snížené ulpívání na stromě u citrusového ovoce, oliv nebo u jiných druhů a odrůd
45 jádrového ovoce, ovoce s tvrdou skořápkou nebo loupavého ovoce. Tentýž mechanismus, to znamená požadavek na tvorbu dělicí tkáně mezi ovocnými, popřípadě listovými a výhonkovými částmi rostlin, je také podstatný u dobře kontrolovatelných sklizených listů užitkových rostlin, jako například bavlníku.

50 D. S regulátory růstu rostlin se může dále snížit spotřeba vody rostlinami. Podáním látek podle tohoto vynálezu se může snížit intenzita zavodňování, což povede k cenově příznivému hospodaření, protože mimo jiné

- snižuje se velikost otvoru stomatu,
- vytváří se tlustá epiderma a kutikula,
- zlepšuje se prokořeňování v půdě a
- 5 – mikroklima během trvání rostlin je příznivě ovlivněno kompaktním růstem.

Sloučeniny obecného vzorce I se zvláště dobře hodí ke zkrácení stébla kulturních rostlin, jako je ječmen, řepka a pšenice.

- 10 Sloučeniny obecného vzorce I určené k použití jako účinné látky podle tohoto vynálezu se mohou zavádět do kulturních rostlin, stejně jako semen (jako mořící prostředek pro semena), jakož i dodávat přes půdu, to znamená kořeny, a zvláště výhodně postřikem přes list.

- 15 Použité množství účinné látky není rozhodující v důsledku vysoké snášenlivosti pro rostliny. Optimálně použité množství se mění podle potlačovaného cíle, roční doby, cílové rostliny a růstového stádia.

- Při ošetřování osiva je obecně zapotřebí účinná látka v množství od 0,001 do 50 g, s výhodou od 0,01 do 10 g, vždy na kilogram osiva.

- 20 Pro ošetřování listu a půdy se pozoruje jako obecně vyhovující dávka od 0,001 do 10 kg/ha, výhodně od 0,01 do 3 kg/ha, zvláště výhodně od 0,01 do 0,5 kg/ha.

- 25 K rozšíření spektra účinnosti a dosažení synergického účinku se mohou sloučeniny obecného vzorce I míchat a dohromady používat s velkým počtem zástupců jiných skupin herbicidně účinných látek nebo látek regulujících růst rostlin. Jako látky vhodné pro směsi přicházejí například v úvahu diaziny, 4H-3,1-benzoxazinové deriváty, benzothiadiazinony, 2,6-nitro-aniliny, N-fenylkarbamáty, thiolkarbamáty, halogenované karboxylové kyseliny, triaziny, amidy, močoviny, difenylethery, triazinony, uráčily, benzofuranové deriváty, cyklohexan-1,3-dionové
- 30 deriváty, které v poloze 2 obsahují například karboxylovou skupinu nebo karbiminoskupinu, deriváty kyseliny chinolinkarboxylové, imidazolinony, sulfonamidy, sulfonylmočoviny, kyseliny aryloxyfenoxypropionové a kyseliny heteroaryloxyfenoxypropionové, stejně jako jejich soli, estery a amidy, a také jiné sloučeniny.

- 35 Kromě toho může být užitečné, aby se sloučeniny obecného vzorce I, samotné nebo v kombinaci s jinými herbicidními prostředky, používaly smíšené dohromady také ještě s dalšími prostředky pro ochranu rostlin, například s prostředky pro potlačování škůdců nebo fytopatogenních hub a bakterií. Zajímavé je dále mísení s roztoky solí minerálních kyselin, které se používají k odstranění nedostatku živných látek nebo stopových prvků. Mohou se také používat
- 40 nefytotoxické oleje a olejové koncentráty.

Příklady provedení vynálezu

45

Příklady syntézy

Syntéza sloučenin obecného vzorce VI

50

Příklad 1

Způsob výroby methylesteru kyseliny 3-methoxy-3-(3-methoxy-fenyl)-2-hydroxymáselné

- 19,5 g (88 mmol) methylesteru kyseliny 3-(3-methoxy-fenyl)-2,3-epoxymáselné se rozpustí ve 200 ml absolutního methanolu a uvede do styku s 0,1 ml bortrifluorid-etherátu. Reakční směs se míchá 12 hodin za teploty místnosti a rozpouštědlo se oddestiluje. Odparek se vyjme ethylacetátem, promyje roztokem hydrogenuhlčitanu sodného a vodou a vysuší síranem sodným. Po oddestilování rozpouštědla zbude 21,1 g slabě nažloutlého oleje.

Výtěžek odpovídá 94 % teorie (diastereomerní směs v poměru 1:1).

10 Příklad 2

Způsob výroby methylesteru kyseliny 3-benzyloxy-3-fenyl-2-hydroxymáselné

- 9,6 g (50 mmol) methylesteru kyseliny 3-fenyl-2,3-epoxymáselné se rozpustí ve 150 ml benzylalkoholu a k roztoku se přidá 0,5 ml koncentrované kyseliny sírové. Reakční směs se míchá za teploty 50 °C po dobu 6 hodin a potom nechá ochladit na teplotu místnosti. Po neutralizaci roztokem hydrogenuhlčitanu sodného se oddestiluje přebytečný benzylalkohol za vysokého vakua a odparek se čistí velmi rychlou chromatografií na silikagelu, za použití směsi n-hexanu a ethylacetátu v poměru 9:1. Po oddestilování rozpouštědla zbude 6,5 g bezbarvého oleje.

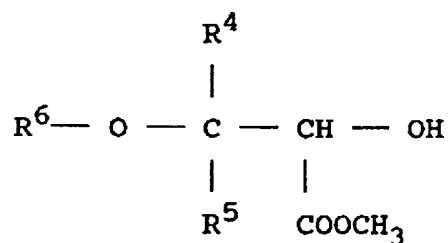
Výtěžek odpovídá 43 % teorie (diastereomerní směs v poměru 3:2).

Analogicky se vyrobí sloučeniny uvedené v tabulce 1.

25

Tabulka 1

Meziprodukty obecného vzorce VI, ve kterém R¹ znamená methyloxy,



Čís.	R ⁶	R ⁴	R ⁵	PD*	t.t. (°C)
1.1	methyl	3-methoxyfenyl	methyl	1:1	olej
1.2	benzyl	fenyl	methyl	3:2	olej
1.3	methyl	2-fluorfenyl	methyl	1:1	olej
1.4	methyl	4-izopropylfenyl	methyl		
1.5	methyl	2-methylfenyl	methyl	2:1	olej
1.6	methyl	3-methylfenyl	methyl		
1.7	methyl	4-methylfenyl	methyl	3:2	olej
1.8	methyl	3-nitrofenyl	methyl		
1.9	methyl	4-bromfenyl	methyl	3:1	olej
1.10	methyl	2-furyl	methyl		
1.11	methyl	3-furyl	methyl		
1.12	methyl	2-thienyl	methyl		
1.13	methyl	3-thienyl	methyl		
1.14	methyl	2-pyridyl	methyl		
1.15	methyl	3-pyridyl	methyl		

Tabulka 1 - pokračování

Čís.	R ⁶	R ⁴	R ⁵	PD*	t.t. (°C)
1.16	methyl	4-pyridyl	methyl		
1.17	methyl	2-thiazolyl	methyl		
1.18	methyl	3-izoxazolyl	methyl		
1.19	methyl	4-imidazolyl	methyl		
1.20	methyl	2-pyrazolyl	methyl		
1.21	methyl	4-chlorfenyl	methyl	2:1	olej
1.22	benzyl	3-methylfenyl	methyl	1:1	olej
1.23	methyl	4-fluorfenyl	methyl	1:1	olej
1.24	benzyl	4-bromfenyl	methyl	1:1	olej
1.25	benzyl	4-chlorfenyl	methyl	3:2	olej
1.26	benzyl	4-fluorfenyl	methyl	1:1	olej
1.27	methyl	fenyl	ethyl	1:1	olej
1.28	methyl	3-nitrofenyl	methyl	2:1	olej
1.29	ethyl	4-methylfenyl	methyl	1:1	olej
1.30	benzyl	4-methylfenyl	methyl	1:1	olej
1.31	benzyl	fenyl	ethyl	1:0	olej
1.32	4-fluorbenzyl	fenyl	methyl	1:1	olej

* Poměr diastereomerů

5

Syntéza sloučenin obecného vzorce I

Příklad 3

10

Způsob výroby methylesteru kyseliny 3-benzyloxy-3-fenyl-2-(4,6-dimethoxy-2-pyrimidinyl)-oxymáselné

15

3 g (10 mmol) methylesteru kyseliny 3-benzyloxy-3-fenyl-2-hydroxymáselné (sloučenina 1.1) se rozpustí ve 40 ml dimethylformamidu a uvede do styku s 0,3 g (12 minol) natriumhydridu. Reakční směs se míchá 1 hodinu a potom se přidá 2,2 g (10 mmol) 4,6-dimethoxy-2-methylsulfonylpyrimidinu. Reakční směs se míchá po dobu 24 hodin za teploty místnosti a potom se opatrně hydrolyzuje 10 ml vody, upraví na hodnotu pH 5 přidáním kyseliny octové a rozpouštědlo se oddestiluje za vysokého vakua. Odparek se vyjme 100 ml ethylacetátu, promyje vodou, vysuší síranem sodným a rozpouštědlo se oddestiluje. Odparek se uvede do styku s 10 ml methyl-terc.-butyletheru a vzniklá sraženina se odsaje. Po vysušení zbude 2,4 g bílého prášku.

20

Výtěžek odpovídá 55 % teorie (diastereomerní směs v poměru 1:1).

25

Sloučenina má teplotu tání 115 až 117 °C.

Příklad 4

30

Způsob výroby kyseliny 3-benzyloxy-3-fenyl-2-(4,6-dimethoxy-2-pyrimidinyl)oxymáselné

35

1,4 g (3 mmol) methylesteru kyseliny 3-benzyloxy-3-fenyl-2-(4,6-dimethoxy-2-pyrimidinyl)-oxymáselné (příklad 3) se rozpustí ve 20 ml methanolu a 20 ml tetrahydrofuranu a uvede do styku s 3,7 g 10% roztoku hydroxidu sodného. Reakční směs se míchá po dobu 6 hodin za teploty 60 °C a během 12 hodin za teploty místnosti, rozpouštědlo se oddestiluje za sníženého tlaku

a odparek se vyjme 100 ml vody. Potom se provede extrakce reakční směsi ethylacetátem, k odstranění nezreagovaného esteru. Nakonec se vodná fáze upraví na hodnotu pH 1 až 2 zředěnou kyselinou chlorovodíkovou a extrahuje ethylacetátem. Vzniklá směs se vysuší síranem horečnatým a rozpouštědlo se oddestiluje. K odparku se přidá malé množství acetonu a vzniklá sraženina se odsaje. Po vysušení zbude 1,2 g bílého prášku.

Výtěžek odpovídá 88 % teorie (diastereomerní směs v poměru 3:2).

Sloučenina má teplotu tání 165 °C (za rozkladu).

Příklad 5

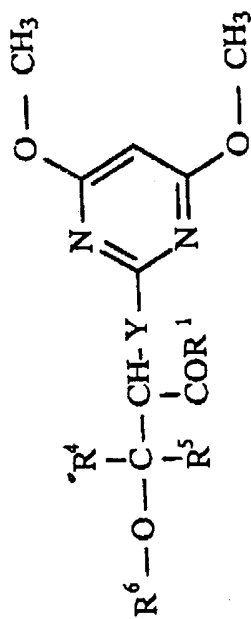
Způsob výroby methylesteru kyseliny 3-benzyloxy-3-fenyl-2-(4,6-dimethoxy-2-pyrimidinyl)-thio/máselné

11 g (25 mmol) methylesteru kyseliny 3-benzyloxy-3-fenyl-2-hydroxymáselné (sloučenina 1.1) se rozpustí v 50 ml dichlormethanu, k roztoku se přidají 3 g (30 mmol) triethylaminu a za míchání se přikape 3,2 g (28 mmol) chloridu kyseliny methansulfonové. Reakční směs se míchá po dobu 2 hodin za teploty místnosti, promyje vodou, vysuší síranem horečnatým a odpaří za sníženého tlaku. Odparek se vyjme dimethylformamidem a za teploty 0 °C se přikape suspenze 12,9 g (75 mmol) 4,6-dimethoxypyrimidin-2-thiolu a 8,4 g (100 mmol) hydrogenuhličitanu sodného ve 100 ml dimethylformamidu. Reakční směs se míchá po dobu 2 hodin za teploty místnosti a během dalších 2 hodin za teploty 60 °C, nato se vylije na 1 litr ledové vody a vzniklá sraženina se odsaje. Po vysušení zbude 3,2 g bílého prášku.

Výtěžek odpovídá 29 % teorie (diastereomerní směs v poměru 1:1).

Obdobně jako ve výše uvedených příkladech se vyrobí sloučeniny jmenované v tabulce 2.

Tabulka 2



Číslo	R ⁶	R ⁴	R ⁵	Y	R ¹	Diaste-	
						reomery	t.t. (°C)
2.1	benzyl	fenyl	methyl	O	OCH ₃	1:1	115-117
2.2	benzyl	fenyl	methyl	O	OH	3:2	165 (rozklad)
2.3	benzyl	fenyl	methyl	S	OCH ₃	1:1	
2.4	benzyl	fenyl	methyl	S	OH		
2.5	methyl	2-fluorfenyl	methyl	O	OCH ₃	1:1	126-128
2.6	methyl	2-fluorfenyl	methyl	O	OH	2:1	185-186
2.7	methyl	3-methoxyfenyl	methyl	O	OCH ₃	1:0 (5:1)	131-132 (93-95)
2.8	methyl	3-methoxyfenyl	methyl	O	OH	1:0	187-189
2.9	methyl	4-isopropylfenyl	methyl	O	OCH ₃		
2.10	methyl	4-isopropylfenyl	methyl	O	OH		
2.11	methyl	2-methylfenyl	methyl	O	OCH ₃	3:1	122-124
2.12	methyl	2-methylfenyl	methyl	O	OH	1:1	135-137
2.13	methyl	3-methylfenyl	methyl	O	OCH ₃	1:1	105-110

Číslo	R ⁶	R ⁴	R ⁵	Y	R ¹	Diaste- reomery	t.t. (°C)
2.14	methyl	3-methylphenyl	methyl	O	OH	1:1	130-132
2.15	methyl	4-methylphenyl	methyl	O	OCH ₃	1:1	99-102
2.16	methyl	4-methylphenyl	methyl	O	OH	1:1	145-147
2.17	methyl	4-bromophenyl	methyl	O	OCH ₃	1:0	148-150
2.18	methyl	4-bromophenyl	methyl	O	OH	1:0	189-190
2.19	methyl	2-furyl	methyl	O	OCH ₃		
2.20	methyl	2-furyl	methyl	O	OH		
2.21	methyl	3-furyl	methyl	O	OCH ₃		
2.22	methyl	3-furyl	methyl	O	OH		
2.23	methyl	2-thienyl	methyl	O	OCH ₃		
2.24	methyl	2-thienyl	methyl	O	OH		
2.25	methyl	2-pyridyl	methyl	O	OCH ₃	2:1	olej
2.26	methyl	2-pyridyl	methyl	O	ONa		175-176
2.27	methyl	3-pyridyl	methyl	O	OCH ₃		
2.28	methyl	3-pyridyl	methyl	O	OH		
2.29	methyl	4-pyridyl	methyl	O	OCH ₃		
2.30	methyl	4-pyridyl	methyl	O	OH		
2.31	methyl	3-chlorophenyl	methyl	O	OCH ₃		
2.32	methyl	3-chlorophenyl	methyl	O	OH		
2.33	methyl	2-thiazolyl	methyl	O	OCH ₃		
2.34	methyl	2-thiazolyl	methyl	O	OH		
2.35	methyl	3-isoxazolyl	methyl	O	OCH ₃		
2.36	methyl	3-isoxazolyl	methyl	O	OH		

číslo	R ⁶	R ⁴	R ⁵	Y	R ¹	Diaste- reomery	t.t. (°C)
2.37	methyl	4-imidazolyl	methyl	O	OCH ₃		
2.38	methyl	4-imidazolyl	methyl	O	OH		
2.39	methyl	2-pyrazolyl	methyl	O	OCH ₃		
2.40	methyl	2-pyrazolyl	methyl	O	OH		
2.41	benzyl	4-chlorfenyl	methyl	O	OCH ₃	1:1	112-114
2.42	benzyl	4-chlorfenyl	methyl	O	OH		
2.43	isopropyl	2-fluorfenyl	methyl	O	OCH ₃	4:1	115-120
2.44	isopropyl	2-fluorfenyl	methyl	O	OH	2:1	143-145
2.45	methyl	4-fluorfenyl	methyl	O	OCH ₃	1:1	122-125
2.46	methyl	4-fluorfenyl	methyl	O	OH	3:1	170-172
2.47	benzyl	3-methylfenyl	methyl	O	OCH ₃	1:1	94- 95
2.48	benzyl	3-methylfenyl	methyl	O	OH	1:1	154-156
2.49	methyl	4-chlorfenyl	methyl	O	OCH ₃	1:1	125-127
2.50	methyl	4-chlorfenyl	methyl	O	OH	5:1	206-207
2.51	methyl	fenyl	ethyl	O	OCH ₃	1:0	95-100
2.52	methyl	fenyl	ethyl	O	OH	1:0	140-142
2.53	benzyl	4-fluorfenyl	methyl	O	OCH ₃	1:1	95- 98
2.54	benzyl	4-fluorfenyl	methyl	O	OH	4:1	153-154
2.55	4-fluorbenzyl	fenyl	methyl	O	OCH ₃	1:0	152-153
2.56	4-fluorbenzyl	fenyl	methyl	O	OH	7:3	160-162
2.57	4-brombenzyl	fenyl	methyl	O	OCH ₃	9:1	158-160
2.58	4-brombenzyl	fenyl	methyl	O	OH	1:0	203-204
2.59	benzyl	2-fluorfenyl	methyl	O	OCH ₃	1:0	129-130

Číslo	R ⁶	R ⁴	R ⁵	Y	R ¹	Diaste- reomery	t.t. (°C)
2.60	benzyl	2-fluorfenyl	methyl	O	OH	1:0	200-201
2.61	benzyl	4-bromfenyl	methyl	O	OCH ₃	1:1	78- 79
2.62	benzyl	4-bromfenyl	methyl	O	OH	1:1	156-158
2.63	benzyl	4-methylfenyl	methyl	O	OCH ₃	1:1	olej
2.64	benzyl	4-methylfenyl	methyl	O	OH	4:1	158-159
2.65	benzyl	fenyl	ethyl	O	OCH ₃	1:0	110-112
2.66	benzyl	fenyl	ethyl	O	OH	1:0	92- 93
2.67	ethyl	4-methylfenyl	methyl	O	OCH ₃	1:0	117-119
2.68	ethyl	4-methylfenyl	methyl	O	OH	1:1	olej
2.69	methyl	2-furyl	H	O	OCH ₃	1:1	olej
2.70	methyl	2-furyl	H	O	OH	1:1	olej
2.71	4-chlorbenzyl	fenyl	methyl	O	OCH ₃	1:0	172-174
2.72	4-chlorbenzyl	fenyl	methyl	O	OH	1:0	60- 61
2.73	2-butyl	4-bromfenyl	methyl	O	OCH ₃	-	104-106
2.74	2-butyl	4-bromfenyl	methyl	O	OH	1:0	153-154
2.75	n-propyl	4-fluorfenyl	methyl	O	OCH ₃	9:1	119-120
2.76	n-propyl	4-fluorfenyl	methyl	O	OH	9:1	104-105
2.77	methyl	3-nitrofenyl	methyl	O	OCH ₃	1:1	101-102
2.78	methyl	3-nitrofenyl	methyl	O	OH	1:1	165-172
2.79	methyl	4-trifluorfenyl	methyl	O	OCH ₃	1:0	112-113
2.80	methyl	4-trifluorfenyl	methyl	O	OH	4:1	68- 70
2.81	methyl	3-thienyl	H	O	OCH ₃	1:1	80- 82

číslo	R ⁶	R ⁴	R ⁵	Y	R ¹	Diaste- reomery	t.t. (°C)
2.82	methyl	3-thienyl	H	O	OH	1:1	olej
2.83	4-chlorbenzyl	fenyl	methyl	O	OCH ₃	0:1	112-113
2.84	4-chlorbenzyl	fenyl	methyl	O	OCH ₃	0:1	60- 61
2.85	methyl	fenyl	ethyl	O	OCH ₃	1:3	125-130
2.86	methyl	fenyl	ethyl	O	OH	0:1	133-135
2.87	benzyl	3-methoxyfenyl	methyl	O	OCH ₃	3:1	86- 87
2.88	benzyl	3-methoxyfenyl	methyl	O	OH	1:0	155
2.89	benzyl	3-methoxyfenyl	methyl	O	OH	0:1	138-140
2.90	2-fenylethyl	fenyl	methyl	O	OH	1:0	147-149
2.91	methyl	3-furyl	H	O	OCH ₃	1:1	olej
2.92	methyl	3-furyl	H	O	OH	1:1	131-135
2.93	3-CF ₃ -benzyl	fenyl	methyl	O	OCH ₃	2:1	151-152
2.94	3-CF ₃ -benzyl	fenyl	methyl	O	OH	1:1	olej
2.95	2-fluorbenzyl	fenyl	methyl	O	OCH ₃	2:1	170-173
2.96	2-fluorbenzyl	fenyl	methyl	O	OH	1:0	160-162
2.97	2-fluorbenzyl	fenyl	methyl	O	OH	1:3	138-141
2.98	3-fluorbenzyl	fenyl	methyl	O	OCH ₃	1:1	81- 86
2.99	3-fluorbenzyl	fenyl	methyl	O	OH	4:1	195-197
2.100	3-fluorbenzyl	fenyl	methyl	O	ONa	3:1	250-260
2.101	4-fluorbenzyl	fenyl	methyl	O	OCH ₃	1:1	112-115
2.102	4-fluorbenzyl	fenyl	methyl	O	OH		

Příklady použití

5 Herbicidní účinek derivátů 3-(het)arylkarboxylové kyseliny obecného vzorce I se může ukázat na skleníkových testech.

10 Jako nádoby pro pěstování kultur slouží plastické kořenáče. Písek s jílovou složkou, který obsahuje přibližně 3,0 % humusu, slouží jako substrát. Semena testovaných rostlin se vysévají odděleně, vždy podle druhu.

15 Při preemergentním ošetřování se účinná látka, suspendovaná nebo emulgovaná ve vodě, přímo aplikuje po zasetí pomocí jemně rozprašujících trysek. Nádoby se lekce skrání, aby se dosáhlo vyklíčení a růstu, a nakonec se odkryje průhledný příklop z plastické hmoty, až rostliny povyrostou. Toto odkrytí působí rovnoměrné klíčení testovaných rostlin, pokud tyto rostliny nejsou poškozeny účinnou látkou.

20 Za účelem postemergentního ošetření se testované rostliny vždy podle formy růstu nejprve nechají vyrůst až do výšky od 3 do 15 cm a teprve potom se ošetří účinnou látkou suspendovanou nebo emulgovanou ve vodě. Testované rostliny se k tomu vysejí buď přímo a nechají růst ve stejné nádobě, nebo se nejprve nechají růst odděleně jako klíčící rostliny a jeden den před ošetřením se zasadí do pokusných nádob. Použité množství pro postemergentní ošetřování činí 0,125 nebo 0,06 kg účinné látky na hektar.

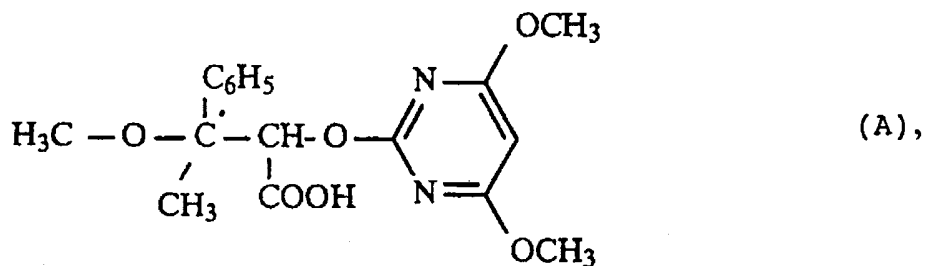
25 Rostliny se udržují za teploty specifické pro druh od 10 do 25 °C nebo od 20 do 35 °C. Pokusné období zabírá 2 až 4 týdny. Během této doby se pečuje o rostliny a vyhodnotí se jejich reakce na jednotlivá ošetření.

30 Ohodnocení se provádí podle stupnice od 0 až do 100. Hodnota 100 přitom znamená zničení rostliny, popřípadě úplné zničení přinejmenším její nadzemní části a hodnota 0 označuje, že nedošlo k žádnému poškození neboli že nastal normální průběh růstu.

Rostliny použité při skleníkových testech se skládají z těchto druhů:

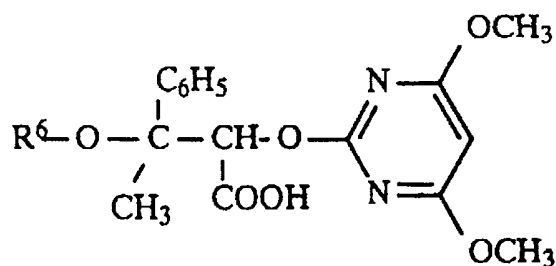
latinský název	český název	zkratka
<i>Gossypium hirsutum</i>	bavlna	GOSHI
<i>Oryza sativa</i>	rýže	ORYSA
<i>Triticum aestivum</i>	pšenice obecná jarní	TRZAS
<i>Alopecurus myosuroides</i>	psárka rolní	ALOMY
<i>Amaranthus retrofractus</i>	laskavec ohnutý	AMARE
<i>Brachiaria platyphylla</i>	—	BRAPP
<i>Chenopodium album</i>	merlík	CHEAL
<i>Sesbania exaltata</i>	—	SEBEX
<i>Setaria faberii</i>	bér	SETFA
<i>Setaria viridis</i>	bér	SETVI
<i>Solanum nigrum</i>	lilek černý	SOLNI
<i>Veronica spp.</i>	druhy rozrazilu	VERSS

35 Výsledky shrnuté do tabulky A ukazují silný herbicidní účinek, stejně jako zlepšenou selektivitu sloučeniny č. 2.2 podle tohoto vynálezu se srovnání se známou srovnávací sloučeninou vzorce A



která je popsána v evropském patentovém spisu 409 368A. Tabulka A

- 5 Experimenty s potlačováním nežádoucích rostlin, stejně jako selektivita v kultuře bavlny (která slouží jako příklad) při postemergentním použití 0,125 nebo 0,06 kg účinné látky na hektar, stanoveny ve skleníku



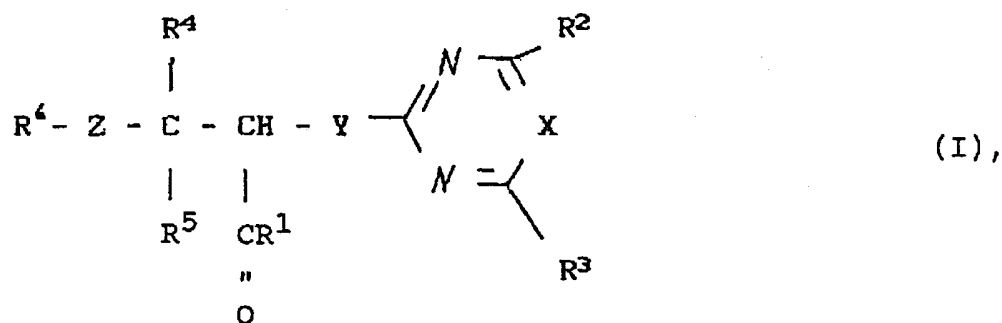
R ⁶ Příklad č. Testovaná rostlina	Benzyl 2.2		CH ₃ A	
	Poškození v %		Poškození v %	
	0,125 kg/ha	0,06 kg/ha	0,125 kg/h	a 0,06 kg/ha
GOSHI	10	5	35	20
SETFA	100	100	75	70
SETVI	100	98	80	60
AMARE	98	98	100	75
SOLNI	100	100	98	90

- 10 Sloučeniny 2.84, 2.16, 2.52, 2.86 a 2.25 projevují při použití v množství 5 až 0,25 kg/ha dobrý herbicidní účinek. Sloučeniny č. 2.84 a 2.16 mají přitom současně dobrou selektivitu v kultuře bavlny, která slouží jako příklad. Kromě toho má například sloučenina č. 2.16 také dobrou selektivitu u rýže. Například sloučenina č. 2.52 je dobře snášena kulturní rostlinou pšenicí obecnou jarní.

PATENTOVÉ NÁROKY

5

1. Derivát 3-(het)arylkarboxylové kyseliny obecného vzorce I



kde znamená

10 R^1 atom vodíku nebo skupinu vzorce OR^{10} , kde znamená R^{10} atom vodíku, kationt alkalického kovu nebo ekvivalent kovu alkalické zeminy, amoniový kationt nebo terc.-alkylamoniový iont s 1 až 4 atomy uhlíku v každém alkylovém podílu,

15 alkylovou skupinu s 1 až 8 atomy uhlíku substituovanou jedním až pěti atomy halogenu a/nebo skupinami ze souboru zahrnujícího alkoxy skupinu s 1 až 4 atomy uhlíku, alkylthioskupinu s 1 až 4 atomy uhlíku, kyanoskupinu, alkylkarbonylovou skupinu s 1 až 4 atomy uhlíku v alkylovém podílu, cykloalkylovou skupinu s 3 až 8 atomy uhlíku, alkoxykarbonylovou skupinu s 1 až 4 atomy uhlíku v alkoxy podílu, fenylovou skupinu, fenoxyskupinu a fenyلكarbonylovou skupinu, přičemž aromatické podíly jsou popřípadě
 20 substituovány jedním až pěti atomy halogenu a/nebo jednou až třemi skupinami ze souboru zahrnujícího nitroskupinu, kyanoskupinu, alkylovou skupinu s 1 až 4 atomy uhlíku, halogenalkylovou skupinu s 1 až 4 atomy uhlíku, alkoxy skupinu s 1 až 4 atomy uhlíku, halogenalkoxy skupinu s 1 až 4 atomy uhlíku a alkylthioskupinu s 1 až 4 atomy uhlíku,

25 R^2 a R^3 alkoxy skupinu s 1 až 4 atomy uhlíku, X CH skupinu,30 Y a Z atom kyslíku,

R^4 skupinu fenylovou nebo naftylovou popřípadě substituovanou alespoň jednou, zvláště
 35 jednou až třemi skupinami ze souboru zahrnujícího atom halogenu, nitroskupinu, kyanoskupinu, hydroxyskupinu, merkaptoskupinu, aminoskupinu, alkylovou skupinu s 1 až 4 atomy uhlíku, halogenalkylovou skupinu s 1 až 4 atomy uhlíku, alkoxy skupinu s 1 až 4 atomy uhlíku, halogenalkoxy skupinu s 1 až 4 atomy uhlíku, alkylthioskupinu s 1 až 4 atomy uhlíku, alkylaminoskupinu s 1 až 4 atomy uhlíku, dialkylaminoskupinu s 1 až 4 atomy uhlíku v každém alkylovém podílu, alkylkarbonylovou skupinu s 1 až 4 atomy uhlíku v alkylovém podílu a alkoxykarbonylovou skupinu s 1 až 4 atomy uhlíku v alkoxy-
 40 podílu;

pětičlenný nebo šestičlenný heteroaromatický zbytek, který obsahuje 1 až 3 atomy dusíku a/nebo jeden atom síry nebo kyslíku, popřípadě substituovaný jednou nebo několika skupinami ze souboru zahrnujícího atom halogenu, nitroskupinu, kyanoskupinu, hydroxy-

skupinu, merkaptoskupinu, aminoskupinu, alkylovou skupinu s 1 až 4 atomy uhlíku, halogenalkylovou skupinu s 1 až 4 atomy uhlíku, alkoxykupinu s 1 až 4 atomy uhlíku, halogenalkoxykupinu s 1 až 4 atomy uhlíku, alkylthioskupinu s 1 až 4 atomy uhlíku, alkylaminoskupinu s 1 až 4 atomy uhlíku, dialkylaminoskupinu s 1 až 4 atomy uhlíku
 5 v alkylovém podílu, alkylkarbonylovou skupinu s 1 až 4 atomy uhlíku v každém alkylovém podílu, alkoxykarbonylovou skupinu s 1 až 4 atomy uhlíku v alkoxy podílu a fenylovou skupinu,

R^5 atom vodíku nebo alkylovou skupinu s 1 až 4 atomy uhlíku,
 10 R^6 alkylovou skupinu s 1 až 8 atomy uhlíku popřípadě substituovanou alespoň jednou skupinou ze souboru zahrnujícího atom halogenu, nitroskupinu, kyanoskupinu, alkoxykupinu s 1 až 4 atomy uhlíku, alkenyloxykupinu se 3 až 6 atomy uhlíku, alkenyloxykupinu se 3 až 6 atomy uhlíku, alkylthioskupinu s 1 až 4 atomy uhlíku, halogenalkoxykupinu s 1 až 4 atomy uhlíku, alkylkarbonylovou skupinu s 1 až 4 atomy uhlíku v alkylovém podílu,
 15 alkoxykarbonylovou skupinu s 1 až 4 atomy v alkoxy podílu, alkylaminoskupinu s 1 až 4 atomy uhlíku, dialkylaminoskupinou s 1 až 4 atomy uhlíku v každém alkylovém podílu, fenylovou skupinu, fenylovou skupinu nebo fenoxyskupinu substituovanou alespoň jednou, například jednou až třemi skupinami ze souboru zahrnujícího atom halogenu, nitroskupinu,
 20 kyanoskupinu, alkylovou skupinu s 1 až 4 atomy uhlíku, halogenalkylovou skupinu s 1 až 4 atomy uhlíku, alkoxykupinu s 1 až 4 atomy uhlíku, halogenalkoxykupinu, s 1 až 4 atomy uhlíku nebo alkylthioskupinu s 1 až 4 atomy uhlíku,

s podmínkou, že R^6 neznámá nesubstituovanou alkylovou skupinu s 1 až 4 atomy uhlíku, když
 25 R^4 je nesubstituovaný fenyl, Z značí atom kyslíku a současně R^5 je methyl nebo atom vodíku.

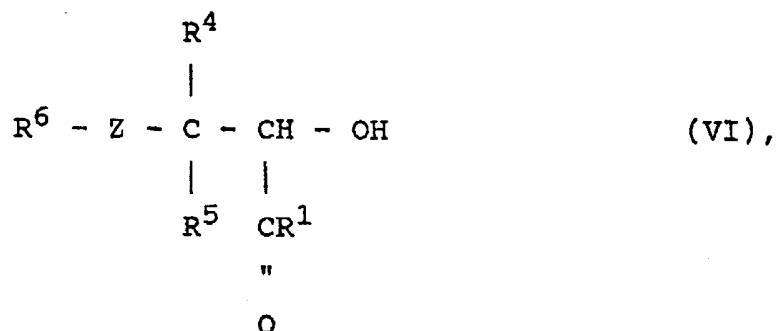
2. Derivát 3-(het)arylkarboxylové kyseliny podle nároku 1 obecného vzorce I, kde znamená R^4 fenylovou skupinu popřípadě substituovanou podle nároku 1 a ostatní symboly mají v nároku 1 uvedený význam.

30 3. Derivát 3-(het)arylkarboxylové kyseliny podle nároku 1 obecného vzorce I, kde znamená Z atom kyslíku, R^4 fenylovou skupinu popřípadě substituovanou podle nároku 1, R^5 methyl, X skupinu vzorce CH, R^2 a R^3 methoxykupinu a Y, R^1 a R^6 mají v nároku 1 uvedený význam.

35 4. Derivát 3-(het)arylkarboxylové kyseliny podle nároku 1 obecného vzorce I, kde znamená R^4 pětičlenný nebo šestičlenný heteroaromatický zbytek podle nároku 1 a ostatní symboly mají v nároku 1 uvedený význam.

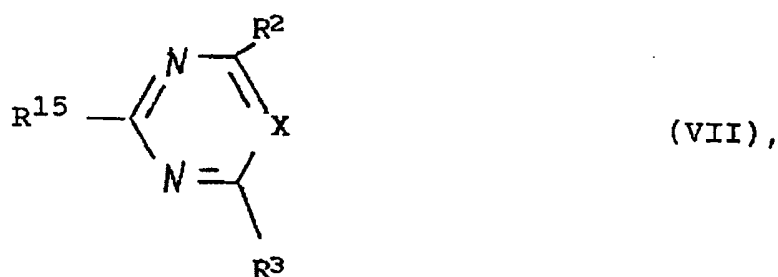
40 5. Derivát 3-(het)arylkarboxylové kyseliny podle nároku 1 obecného vzorce I, kde znamená Z atom kyslíku, R^4 pětičlenný nebo šestičlenný heteroaromatický zbytek podle nároku 1, R^5 methyl, X skupinu vzorce CH, R^2 a R^3 methoxykupinu a Y, R^1 a R^6 mají v nároku 1 uvedený význam.

45 6. Způsob přípravy derivátu 3-(het)arylkarboxylové kyseliny obecného vzorce I podle nároku 1, kde Y znamená atom kyslíku, vyznačující se tím, že se derivát 3-(het)arylkarboxylové kyseliny obecného vzorce VI



kde jednotlivé symboly mají v nároku 1 uvedený význam,

- 5 nechá reagovat s pyrimidylovými nebo triazinylovými deriváty obecného vzorce VII



kde

10 R^{15} znamená atom halogenu nebo skupinu vzorce $\text{R}^{16}-\text{SO}_2-$,

kde R^{16} znamená alkylovou skupinu s 1 až 4 atomy uhlíku, halogenalkylovou skupinu s 1 až 4 atomy uhlíku nebo fenylovou skupinu,

15 v inertním rozpouštědle v přítomnosti báze.

7. Herbicidní prostředek, **vyznačující se tím**, že obsahuje sloučeninu obecného vzorce I podle nároku 1 a obvyklé inertní přísady.

8. Způsob potlačování nežádoucího růstu rostlin, **vyznačující se tím**, že se nechá působit herbicidně účinné množství sloučeniny obecného vzorce I podle nároku 1 na rostliny nebo na jejich životní prostor.

9. Prostředek pro ovlivňování růstu rostlin, **vyznačující se tím**, že obsahuje sloučeninu obecného vzorce I podle nároku 1 a obvyklé inertní přísady.

10. Způsob regulování růstu rostlin, **vyznačující se tím**, že se nechá působit bioregulačně účinné množství sloučeniny obecného vzorce I podle nároku 1 na rostliny nebo jejich životní prostor.

Konec dokumentu
