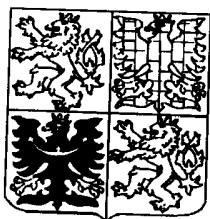


ČESKÁ
REPUBLIKA

(19)



ÚŘAD
PRŮMYSLVÉHO
VLASTNICTVÍ

ZVEŘEJNĚNÁ PŘIHLÁŠKA VYNÁLEZU

(12)

(22) 11.07.94
(32) 16.07.93
(31) 93/4323916
(33) DE
(40) 17.04.96

(21) 21-96

(13) A3

6(51)

C 07 D 401/04

C 07 D 413/04

A 01 N 43/40

// (C 07 D 413/04,

C 07 D 265:00,

C 07 D 213:00),

(C 07 D 401/04, C 07 D 233:00,

C 07 D 213:00),

(C 07 D 401/04, C 07 D 249:00,

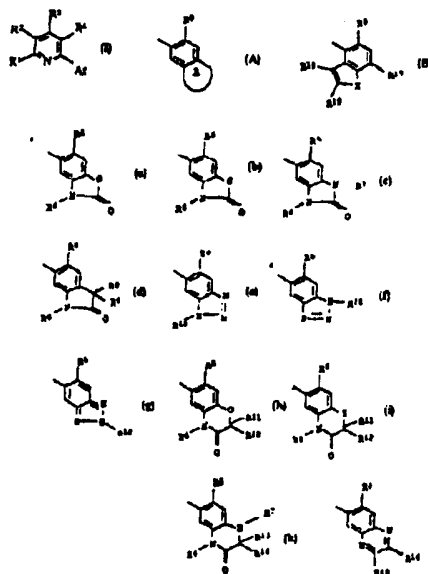
C 07 D 213:00)

(71) BASF AKTIENGESSELLSCHAFT, Ludwigshafen, DE;

(72) Schaefer Peter Dr., Ottersheim, DE;
Hamprecht Gerhard Dr., Weinheim, DE;
Heistracher Elisabeth Dr., Ludwigshafen, DE;
Koenig Hartmann Dr., Limburgerhof, DE;
Klintz Ralf Dr., Gruenstadt, DE;
Muenster Peter Dr., Neulussheim, DE;
Rang Harald Dr., Altrip, DE;
Westphalen Karl Otto Dr., Speyer, DE;
Gerber Matthias Dr., Limburgerhof, DE;
Walter Helmut Dr., Obrigheim, DE;

(54) **Substituované 2-kondenzované fenylpyridiny
s herbicidní aktivitou**

(57) Substituované 2-fenylpyridiny vzorce I, kde Ar je radikl (A) nebo (B) a kde kruh R je kondenzovaný heterocyklický kruh, který spolu s fenylovým kruhem tvoří jeden z následujících bicyklických kruhů (a) až (1) a N-oxidy sloučenin vzorce I agrikulturně využitelné soli sloučenin vzorce I, pokud tyto existují. Použití: herbicidy, desikace/defoliace rostlin.

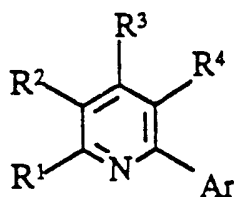


7V 21-96

Substituované 2-kondenzované fenyropyridiny s herbicidní účinností

Oblast techniky

Předložený vynález se týká nových substituovaných 2-fenyropyridinů obecného vzorce I



I

kde substituenty mají následující významy:

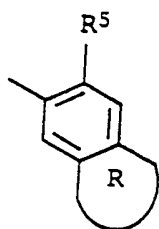
R¹, R³ a R⁴ jsou nezávisle na sobě vodík, halogen, C₁-C₄-alkyl, C₁-C₄-halogenalkyl, C₁-C₄-alkoxy-C₁-C₄-alkyl, C₁-C₄-alkoxy, C₁-C₄-alkoxy-C₁-C₄-alkoxy, hydroxyl, C₁-C₄-halogenalkoxy, (C₁-C₅-alkyl)karbonyloxy-, (C₁-C₅-halogenalkyl)karbonyloxy, SH, C₁-C₄-alkylthio, C₁-C₄-alkylsulfinyl, C₁-C₄-alkylsulfonyl, C₁-C₄-halogenalkylthio, C₁-C₄-halogenalkylsulfinyl, C₁-C₄-halogenalkylsulfonyl, formyl, kyano, hydroxykarbonyl, (C₁-C₄-alkoxy)karbonyl, C₁-C₄-alkoxy-(C₁-C₄-alkoxy)karbonyl, (C₁-C₄-halogenalkoxy)karbonyl, (C₁-C₄-alkyl)karbonyl, (C₁-C₄-halogenalkyl)karbonyl, C₁-C₄-alkoxy-(C₁-C₄-alkyl)karbonyl, CONH₂C₁-C₄, (C₁-C₄-alkyl)aminokarbonyl, di(C₁-C₄-alkyl)aminokarbonyl, pyrrolidinylnkarbonyl, piperidinylnkarbonyl, morfolinylnkarbonyl, nitro, amino, C₁-C₄-alkylamino, di(C₁-C₄-alkyl)amino, pyrrolidinyln, piperidinyln, morfolinyln,

Pril.
VLASTNOSTI
PRŮMYSLU
U RAD
96 II 90
00500
008947
2.1.

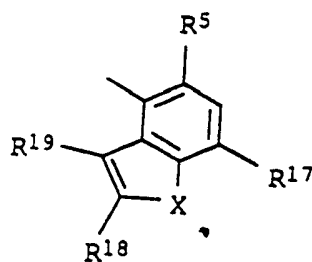
(C₁-C₄-alkyl)karbonylamino, (C₁-C₄-halogenalkyl)karbonyl-
amino nebo C₁-C₄-alkylsulfonylamino;

R² je halogen, kyano, nitro, C₁-C₄-alkyl, C₁-C₄-halogenalkyl,
C₁-C₄-alkoxy, C₁-C₄-halogenalkoxy, C₁-C₄-alkylthio,
C₁-C₄-halogenalkylthio nebo
spolu s R¹ nebo s R² představuje trimethylenový nebo
tetramethylenový řetězec;

Ar je radikál



nebo



kde

R⁵ je vodík nebo halogen,

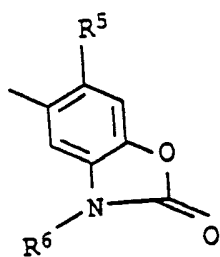
X je kyslík nebo síra,

R¹⁷ je halogen, kyano, nitro, hydroxyl, C₁-C₄-alkoxy nebo
trifluormethyl,

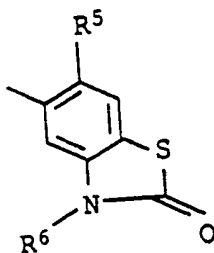
R¹⁸ je vodík, C₁-C₆-alkyl, C₁-C₆-halogenalkyl nebo
C₁-C₄-alkoxy-C₁-C₄-alkyl a

R¹⁹ je vodík nebo C₁-C₆-alkyl

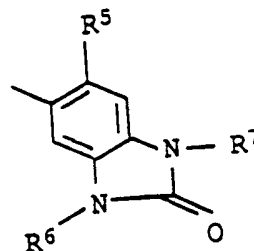
a kde kruh R je kondenzovaný heterocyklický kruh, který spolu s fenylovým kruhem, tvoří jeden z následujících bicyklických kruhů (a) až (f):



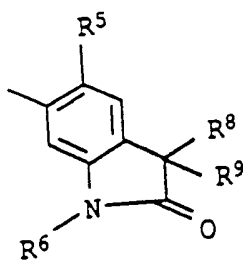
(a)



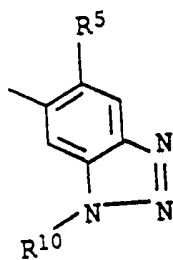
(b)



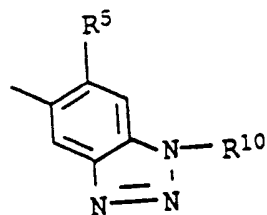
(c)



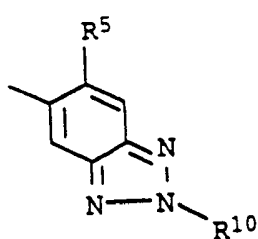
(d)



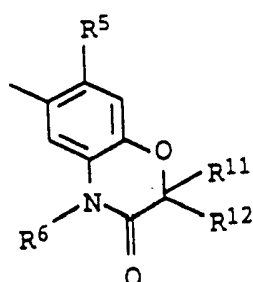
(e)



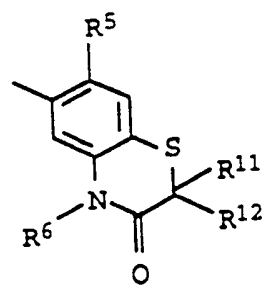
(f)



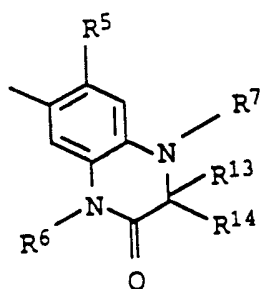
(g)



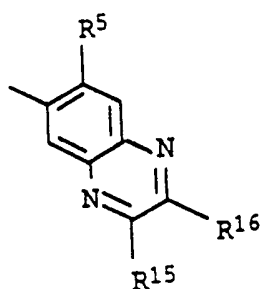
(h)



(i)



(k)



(l)

R⁶, R⁷ a R¹⁰ nezávisle na sobě znamenají vodík, C₁-C₆-alkyl, C₂-C₆-alkenyl, C₂-C₆-alkinyl, C₁-C₆-halogenalkyl, C₂-C₆-halogenalkyl, C₂-C₆-halogenalkinyl, C₁-C₄-alkoxy-C₁-C₄-alkyl, C₁-C₄-alkoxy-C₁-C₂-alkoxy-C₁-C₄-alkyl, 1-fenyl-propen-3-yl, kyano-C₁-C₄-alkyl, C₃-C₆-cykloalkyl-C₁-C₆-alkyl, (1-methylthiocykloprop-1-yl)-methyl, karboxyl-C₁-C₄-alkyl, (C₁-C₆-alkoxy)karbonyl-C₁-C₄-alkyl, (C₁-C₆-halogenalkoxy)karbonyl-C₁-C₄-alkyl, C₁-C₄-alkoxy-(C₁-C₂-alkoxy)karbonyl-C₁-C₄-alkyl, (C₁-C₆-alkoxy)karbonyl-(C₁-C₂-alkoxy)karbonyl-C₁-C₄-alkyl, C₃-C₆-cykloalkyl-(C₁-C₂-alkoxy)karbonyl-C₁-C₄-alkyl, C₁-C₅-alkylaminokarbonyl-C₁-C₄-alkyl, di-(C₁-C₅-alkyl)aminokarbonyl-C₁-C₄-alkyl, C₃-C₆-cykloalkyl,

C₁-C₄-alkylthio-C₁-C₄-alkyl, C₁-C₄-alkylsulfonyl,
C₃-C₆-alkenyloxy-C₁-C₄-alkyl, C₁-C₈-alkenyloxy-C₁-C₄-alkyl,
C₁-C₈-alkylkarbonyl, C₁-C₈-alkoxy,
oxetan-3-yl-oxykarbonyl-C₁-C₄-alkyl,
thietan-3-yl-oxykarbonyl-C₁-C₄-alkyl, oxetan-3-ylmethyl,
3-(C₁-C₄-alkyl)-oxetan-3-ylmethyl nebo benzyl, který může být
nesubstituován nebo může nést jeden až tři radikály, vybrané
ze skupiny, zahrnující halogen, C₁-C₄-alkyl a C₁-C₄-alkoxy;

R⁸ a R⁹ jsou nezávisle na sobě vodík, C₁-C₄-alkyl,
hydroxykarbonyl, (C₁-C₄-alkoxy)karbonyl nebo spolu znamenají
ethylen, propylen, butylen, pentylen nebo hexylen;

R¹¹, R¹², R¹³ a R¹⁴ jsou nezávisle na sobě vodík, halogen,
C₁-C₆-alkyl, C₁-C₆-halogenalkyl nebo C₁-C₄-alkoxy-C₁-C₄-alkyl;

R¹⁵ a R¹⁶ jsou nezávisle na sobě vodík, chlor, brom,
C₁-C₈-alkyl, -OR²⁰, -SR²¹ nebo -N(R²²)-R²³,

R²⁰ a R²¹ jsou nezávisle na sobě vodík, C₁-C₈-alkyl,
C₁-C₈-halogenalkyl, C₄-C₇-cykloalkyl, který na své části může
nést až tři C₁-C₃-alkylové radikály, C₃-C₆-alkenyl,
C₅-C₇-cykloalkenyl, který na své části může
nést až tři C₁-C₃-alkylové radikály, C₃-C₆-halogenalkenyl,
kyano-C₁-C₈-alkyl, C₃-C₆-alkinyl, C₁-C₄-alkoxy-C₁-C₄-alkyl,
2-tetrahydrofuranyl-C₁-C₈-alkyl, 3-oxetanyl, 3-thietanyl,
karboxyl-C₁-C₆-alkyl, (C₁-C₈-alkoxy)-karbonyl-C₁-C₆-alkyl,
(C₁-C₆-alkoxy)karbonyl-(C₃-C₇-cykloalkyl),
C₁-C₄-alkoxy(C₁-C₄-alkoxy)karbonyl-C₁-C₆-alkyl,
cyklopropylmethyl, (1-methylthiocyklo-prop-1-yl)methyl,
-CH(SH)-COOH, -CH(SH)-CO-(C₁-C₈-alkoxy),
-CH(C₁-C₈-alkylthio)-COOH,
-CH(C₁-C₄-alkylthio)-CO-(C₁-C₈-alkoxy), -CH₂-CO-N(R⁹)-R¹⁰,

$-\text{CH}(\text{C}_1\text{-C}_4\text{-alkyl})-\text{CO}-\text{N}(\text{R}^9)-\text{R}^{10}$, $-\text{C}(\text{C}_1\text{-C}_4\text{-alkyl})_2-\text{CO}-\text{N}(\text{R}^9)-\text{R}^{10}$,
 $\text{CH}_2-\text{CO}-\text{N}(\text{R}^9)-\text{SO}_2-(\text{C}_1\text{-C}_4\text{-alkyl})$,
 $-\text{CH}(\text{C}_1\text{-C}_4\text{-alkyl})-\text{CO}-\text{N}(\text{R}^9)-\text{SO}_2-(\text{C}_1\text{-C}_4\text{-alkyl})$,
 $-\text{C}(\text{C}_1\text{-C}_4\text{-alkyl})_2-\text{CO}-\text{N}(\text{R}^9)-\text{SO}_2-(\text{C}_1\text{-C}_4\text{-alkyl})$, $-\text{S}-\text{CO}-\text{NH}_2$,
 $-\text{S}-\text{CO}-\text{N}(\text{C}_1\text{-C}_4\text{-alkyl})-(\text{C}_1\text{-C}_4\text{-alkyl})$,
 $-\text{CH}_2-\text{CO}-\text{O}-(\text{C}_1\text{-C}_6\text{-alkylen})-\text{COOH}$,
 $-\text{CH}_2-\text{CO}-\text{O}-(\text{C}_1\text{-C}_6\text{-alkylen})-\text{CO}-(\text{C}_1\text{-C}_6\text{-alkoxy})$,
 $-\text{C}(\text{C}_1\text{-C}_4\text{-alkyl})_2-\text{CO}-\text{O}-(\text{C}_1\text{-C}_6\text{-alkylen})-\text{COOH}$,
 $-\text{C}(\text{C}_1\text{-C}_4\text{-alkyl})_2-\text{CO}-\text{O}-(\text{C}_1\text{-C}_4\text{-alkylen})-\text{CO}-(\text{C}_1\text{-C}_6\text{-alkoxy})$,
 $-\text{CH}(\text{C}_1\text{-C}_4\text{-alkyl})-\text{CO}-\text{O}-(\text{C}_1\text{-C}_6\text{-alkylen})-\text{COOH}$,
 $-\text{CH}(\text{C}_1\text{-C}_4\text{-alkyl})-\text{CO}-\text{O}-(\text{C}_1\text{-C}_6\text{-alkylen})-\text{CO}-(\text{C}_1\text{-C}_6\text{-alkoxy})$,
 $\text{C}_3\text{-C}_9-(\alpha\text{-alkylalkyliden})\text{iminooxy}-\text{C}_1\text{-C}_6\text{-alkyl}$, fenyl,
 fenyl- $\text{C}_1\text{-C}_6\text{-alkyl}$, fenyl- $\text{C}_3\text{-C}_6\text{-alkenyl}$, fenyl- $\text{C}_3\text{-C}_6\text{-alkinyl}$
 nebo fenoxi- $\text{C}_1\text{-C}_6\text{-alkyl}$, kde fenylový kruh v každém případě
 může být nesubstituován nebo nést jeden až tři radikály
 vybrané ze skupiny, zahrnující halogen, nitro, kyano,
 $\text{C}_1\text{-C}_4\text{-alkyl}$, $\text{C}_1\text{-C}_4\text{-alkoxy}$, $\text{C}_1\text{-C}_4\text{-alkylthio}$, $\text{C}_1\text{-C}_4\text{-halogenalkyl}$
 a $\text{C}_2\text{-C}_6\text{-alkenyl}$, 5- nebo 6-členný heteroaryl,
 heteroaryl- $\text{C}_1\text{-C}_6\text{-alkyl}$, heteroaryl- $\text{C}_3\text{-C}_6\text{-alkenyl}$,
 heteroaryl- $\text{C}_3\text{-C}_6\text{-alkinyl}$ nebo heteroaryloxy- $\text{C}_1\text{-C}_6\text{-alkyl}$, kde
 heteroaromát v každém případě obsahuje jeden až tři
 heteroatomy vybrané ze skupiny, zahrnující jeden nebo dva
 atomy dusíku a atom kyslíku nebo síry a kde heteroaromát,
 je-li to žádoucí, může dále nést na každém substituovatelném
 kruhovém atomu radikál vybraný ze skupiny, zahrnující
 hydroxyl, halogen, $\text{C}_1\text{-C}_4\text{-alkyl}$, $\text{C}_1\text{-C}_4\text{-alkoxy}$, $\text{C}_1\text{-C}_4\text{-alkylthio}$
 a $\text{C}_1\text{-C}_4\text{-halogenalkyl}$;

R^{22} a R^{23} nezávisle na sobě jsou

vodík, $\text{C}_1\text{-C}_8\text{-alkyl}$, $\text{C}_2\text{-C}_8\text{-alkenyl}$, $\text{C}_3\text{-C}_8\text{-alkinyl}$,
 $\text{C}_1\text{-C}_8\text{-halogenalkyl}$, $\text{C}_1\text{-C}_4\text{-alkoxy}-\text{C}_1\text{-C}_4\text{-alkyl}$,
 $\text{C}_1\text{-C}_4\text{-alkylthio}-\text{C}_1\text{-C}_4\text{-alkyl}$, kyano- $\text{C}_1\text{-C}_8\text{-alkyl}$,
 karboxyl- $\text{C}_1\text{-C}_4\text{-alkyl}$, $(\text{C}_1\text{-C}_4\text{-alkoxy})\text{karbonyl}-\text{C}_1\text{-C}_4\text{-alkyl}$,

(C₁-C₆-alkoxy)karbonyl-(C₃-C₇-cykloalkyl),
C₁-C₄-alkylsulfonyl-C₁-C₄-alkyl, C₃-C₈-cykloalkyl,
C₁-C₆-alkoxy, (C₃-C₆-cykloalkoxy)-karbonyl-C₁-C₄-alkyl,
C₁-C₄-alkoxy-(C₁-C₄-alkoxy)karbonyl-C₁-C₄-alkyl, fenyl,
fenyl-C₁-C₄-alkyl, kde fenylový kruh v každém případě může být
nesubstituován nebo může nést jeden až tři radikály vybrané ze
skupiny, zahrnující halogen, nitro, kyano, C₁-C₄-alkyl,
C₁-C₄-alkoxy, C₁-C₄-alkylthio, C₁-C₄-halogenalkyl a
C₂-C₆-alkenyl, 5- nebo 6-členný heteroaryl nebo
heteroaryl-C₁-C₄-alkyl, kde heteroaromát obsahuje jeden až tři
heteroatomy vybrané ze skupiny, zahrnující jeden nebo dva
atomy dusíku a kyslíkový nebo sírový atom a kde heteroaromát,
je-li to žádoucí, může dále nést na každém substituovatelném
kruhovém atomu radikál vybraný ze skupiny, zahrnující
hydroxyl, halogen, C₁-C₄-alkyl, C₁-C₄-alkoxy, C₁-C₄-alkylthio
a C₁-C₄-halogenalkyl;

a N-oxidy sloučenin vzorce I a jejich agrikulturně využitelné
solí, jestliže tyto existují.

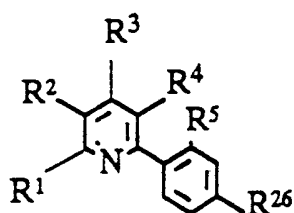
Dále se vynález týká

- použití sloučenin vzorce I, jejich N-oxidů a/nebo
agrikulturně využitelných solí a pro desikaci a/nebo defoliaci
rostlin,
- herbicidních kompozic a kompozic pro desikaci a/nebo
defoliaci rostlin, které obsahují sloučeniny vzorce I, jejich
N-oxidy a/nebo agrikulturně využitelné sole jako účinné
složky,
- způsobů přípravy těchto herbicidních kompozic a kompozic
pro desikaci a/nebo defoliaci rostlin,

- způsobů kontroly nežádoucího růstu rostlin a desikace a/nebo defoliace rostlin za použití sloučenin vzorce I a také použití N-oxidů a agrikulturně využitelných solí sloučeniny vzorce I a také

- způsobů přípravy sloučenin vzorce I.

Vynález se dále týká použití fenyropyridinů obecného vzorce IV



IV

kde substituenty R^1 až R^5 mají stejné významy jako u sloučenin obecného vzorce I a

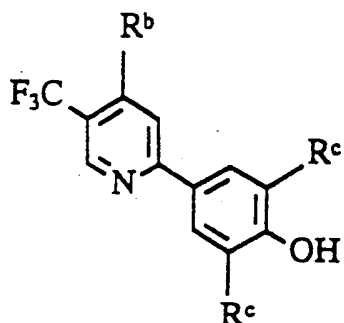
R^{26} je fluor, hydroxyl nebo C_1 - C_6 -alkoxy,

aromatických kyselin boru a esterů kyselin boru vzorce XIX a nových 2-(4-hydroxy-5-nitrofenyl)pyridinů vzorce IX, 2-(4-hydroxy-5-aminofenyl)pyridinů vzorce X a karboxaanilidů vzorce XII.

Dosavadní stav techniky

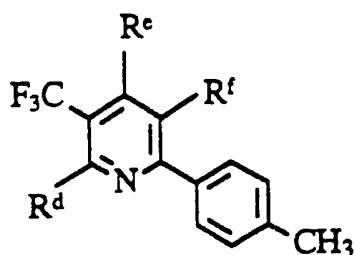
2-Fenyropyridiny byly dosud popsány v následujících publikacích: EP-A 167491; EP- 412681; WO 94/0513; WO 92/10118 ; WO 92/22203; CA 114(11), 9674k: Izv. Timiryazevsk. S-Kh.Akad.3, 155-160; Pestic.Sci. 21(3), 175-179; CA 113(1), 171837j; Nippon Kagaku Kaishi 5, 466-471; JP 12 11586.

P.Boy a spol. (Synlett 12, 923) popisují přípravu
4-[(trifluormethyl)pyridyl]fenolů vzorce



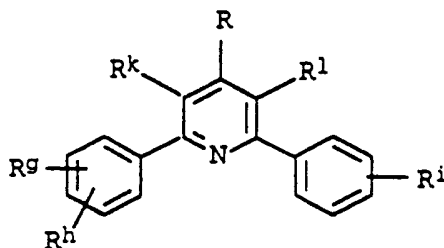
R^b = vodík nebo trifluormethyl, R^c = vodík nebo terc.butyl.

N.Katagiri a spol. (Chem.Pharm.Bull. 36(9), 3354-72) popisují přípravu substituovaných 2-fenylpyridinů obecného vzorce



kde R^d je vodík, chlor nebo methoxy, R^e je vodík, methyl, ethyl nebo ethoxy a R^f je vodík nebo methyl nebo R^e a R^f spolu jsou $(CH_2)_3$ nebo $(CH_2)_4$.

Konečně byly 2,6-diarylpyridinové deriváty, mající herbicidní a defoliační vlastnosti popsány v DE-A 4020257:



kde R^g a R^h jsou vodík, halogen, alkyl, alkoxy nebo halogenalkyl, R^i je vodík, halogen, kyano, alkyl, alkoxy nebo halogenalkyl a R^k a R^l jsou vodík nebo alkyl.

I když známé sloučeniny mají herbicidní nebo desikační/defoliační účinnost, nejsou vždy zcela bezpečné.

Objektem předloženého vynálezu je poskytnout nové, zvláště herbicidně účinné, sloučeniny, pomocí kterých může být nežádoucí růst rostlin lépe specificky kontrolován než pomocí známých sloučenin.

Podstata vynálezu

Nyní byly nalezeny substituované 2-fenylpyridiny obecného vzorce I. Byly také nalezeny herbicidní kompozice, které obsahují sloučeniny vzorce I a mají herbicidní účinnost. Sloučeniny jsou tolerovatelné nebo selektivní, zejména v obilninách jako je pšenice, kukuřice a rýže.

Byly dále nalezeny nové meziprodukty vzorce IX, X a XII pro přípravu substituovaných 2-fenylpyridinů vzorce I.

Sloučeniny vzorce I podle předloženého vynálezu jsou navíc vhodné pro defoliaci a desikaci částí rostlin např. bavlníku, brambor, řepky, slunečnice, sojových bobů nebo fazolí.

Organické molekulární skupiny uvedené výše pro substituenty R^1 až R^{27} nebo jako radikály (hetero)aromátů jsou, podobně jako je tomu u výrazu halogen, společné výrazy pro jednotlivé seznamy jednotlivých skupin členů. Všechny uhlovodíkové řetězce, tj. všechny alkyl, alkenyl, alkinyl, halogenalkyl, halogenalkenyl, halogenalkiny a halogenalkoxyskupiny a α -alkylalkylidenová skupina, mohou mít přímý nebo rozvětvený řetězec. Halogenované substituenty výhodně nesou jeden až pět stejných nebo rozdílných atomů halogenu.

Specifické příklady skupin jsou:

- halogen: fluor, chlor, brom a jod, výhodně fluor a chlor;
- C_1 - C_4 -alkyl: methyl, ethyl, n-propyl, 1-methylethyl, n-butyl, 1-methylpropyl, 2-methylpropyl a 1,1-dimethylethyl;
- C_1 - C_6 -alkyl: C_1 - C_4 -alkyl jak je uveden výše a také n-pentyl, 1-methylbutyl, 2-methylbutyl, 3-methylbutyl, 2,2-dimethylpropyl, 1-ethylpropyl, n-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, 1,2,2-trimethylpropyl, 1-ethyl-1-methylpropyl a 1-ethyl-2-methylpropyl;

- C₁-C₈-alkyl: C₁-C₆-alkyl jak je uveden výše a také, inter alia, n-heptyl, n-oktyl;

- C₂-C₄-alkenyl: ethenyl, prop-1-en-1-yl, prop-2-en-1-yl, 1-methylethenyl, n-buten-1-yl, n-buten-2-yl, n-buten-3-yl, 1-methylprop-1-en-1-yl, 2-methylprop-1-en-1-yl, 1-methylprop-2-en-1-yl a 2-methylprop-2-en-1-yl;

- C₃-C₆-alkenyl: prop-1-en-1-yl, prop-2-en-1-yl, 1-methylethenyl, n-buten-1-yl, n-buten-2-yl, n-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, n-penten-1-yl, n-penten-2-yl, n-penten-3-yl, n-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, n-hex-1-en-1-yl, n-hex-2-en-1-yl, n-hex-3-en-1-yl, n-hex-4-en-1-yl, n-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-methyl-2-en-1-yl, 3-methylpent-2-en-1-yl, 4-methylpent-2-en-1-yl, 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-methyl-prop-2-en-1-yl,
 1-ethyl-2-methyl-prop-1-en-1-yl
 a 1-ethyl-2-methyl-prop-2-en-1-yl, výhodně ethenyl
 a prop-2-en-1-yl;

- C₂-C₈-alkenyl: ethenyl, C₃-C₆-alkenyl jak uveden výše a,
 inter alia, n-hept-1-en-1-yl, n-hept-2-en-1-yl,
 n-hept-3-en-1-yl, n-hept-4-en-1-yl, n-hept-5-en-1-yl,
 n-hept-6-en-1-yl, n-okt-1-en-1-yl, n-okt-2-en-1-yl,
 n-okt-3-en-1-yl, n-okt-4-en-1-yl, n-okt-5-en-1-yl,
 n-okt-6-en-1-yl a n-okt-7-en-1-yl;

- C₂-C₆-alkinyl: ethinyl a C₃-C₆-alkinyl jako je
 prop-1-in-1-yl, prop-2-in-3-yl, n-but-1-in-1-yl,
 n-but-1-in-4-yl, n-but-2-in-1-yl, n-pent-1-in-1-yl,
 n-pent-1-in-3-yl, n-pent-1-in-4-yl, n-pent-1-in-5-yl,
 n-pent-2-in-1-yl, n-pent-2-in-4-yl, n-pent-2-in-5-yl,
 3-methylbut-1-in-1-yl, 3-methylbut-1-in-3-yl,
 3-methylbut-1-in-4-yl, n-hex-1-in-1-yl, n-hex-1-in-3-yl,
 n-hex-1-in-4-yl, n-hex-1-in-5-yl, n-hex-1-in-6-yl,
 n-hex-2-in-1-yl, n-hex-2-in-4-yl, n-hex-2-in-5-yl,
 n-hex-2-in-6-yl, n-hex-3-in-1-yl, n-hex-3-in-2-yl,
 3-methylpent-1-in-1-yl, 3-methylpent-1-in-3-yl,
 3-methylpent-1-in-4-yl, 3-methylpent-1-in-5-yl,
 4-methylpent-1-in-1-yl, 4-methylpent-2-in-4-yl a

4-methylpent-2-in-5-yl, výhodně prop-2-in-1-yl a 1-methylprop-2-in-1-yl;

- C₂-C₈-alkynyl: ethynyl, C₃-C₆-alkynyl jak je uveden výše a, inter alia, n-hept-1-in-1-yl, n-hept-2-in-1-yl, n-hept-3-in-1-yl, n-hept-4-in-1-yl, n-hept-5-in-1-yl, n-hept-6-in-1-yl, n-okt-1-in-1-yl, n-okt-2-in-1-yl, n-okt-3-in-1-yl, n-okt-4-in-1-yl, n-okt-5-in-1-yl, n-okt-6-in-1-yl a n-okt-7-in-1-yl;

- C₃-C₆-halogenalkyl: C₃-C₆-alkenyl jak je uveden výše, kde v každém případě jsou jeden až tři atomy vodíku nahrazeny fluorem, chlorem a/nebo bromem;

- C₂-C₈-halogenalkyl: C₂-C₈-alkenyl jak je uveden výše, kde v každém případě jsou jeden až tři atomy vodíku nahrazeny fluorem, chlorem a/nebo bromem;

- C₂-C₈-halogenalkynyl: C₂-C₈-alkynyl jak je uveden výše, kde v každém případě jsou jeden až tři atomy vodíku nahrazeny fluorem, chlorem a/nebo bromem;

- C₃-C₆-cykloalkyl: cyklopropyl, cyklobutyl, cyklopentyl a cyklohexyl, výhodně cyklopropyl, cyklopentyl a cyklohexyl;

- C₄-C₇-cykloalkyl: cyklobutyl, cyklopentyl, cyklohexyl a cykloheptyl, výhodně cyklopentyl a cyklohexyl;

- C₅-C₇-cykloalkenyl, např.: cyklopent-1-enyl, cyklopent-2-enyl, cyklopent-3-enyl, cyklohex-1-enyl, cyklohex-2-enyl, cyklohex-3-enyl, cyklohept-1-enyl, cyklohept-2-enyl, cyklohept-3-enyl a cyklohept-4-enyl;

- (C₃-C₆-cykloalkoxy)karbonyl: cyklopropoxykarbonyl, cyklobutoxykarbonyl, cyklopentoxykarbonyl a cyklohexoxykarbonyl, výhodně cyklopropoxykarbonyl, cyklopentoxykarbonyl a cyklohexoxykarbonyl;
- C₁-C₄-halogenalkyl: C₁-C₄-alkyl jak je uveden výše, který je částečně nebo úplně substituován fluorem, chlorem a/nebo bromem, to je např. chlormethyl, dichlormethyl, trichlormethyl, fluormethyl, difluormethyl, trifluormethyl, chlorfluormethyl, dichlorfluormethyl, chlordinfluormethyl, 1-fluorethyl, 2-fluorethyl, 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 a 3-chlorpropyl, výhodně trifluormethyl;
- C₁-C₆-halogenalkyl: C₁-C₆-alkyl jak je uveden výše, který je částečně nebo úplně substituován fluorem, chlorem a/nebo bromem;
- C₁-C₈-halogenalkyl: C₁-C₈-alkyl jak je uveden výše, který je částečně nebo úplně substituován fluorem, chlorem a/nebo bromem, tj. např. jak výše uvedené C₁-C₄-halogenalkyly;
- kyano-C₁-C₈-alkyl: C₁-C₈-alkyl jak je uveden výše, kde v každém případě je jedním atomem vodíku nahrazen kyanoskupinou, tj. např. kyanomethyl, 1-kyanoethyl, 2-kyanoethyl, 1-kyanopropyl, 2-kyanopropyl, 3-kyanopropyl, 1-kyanopropyl-2-yl, 2-kyanopropyl-2-yl, 1-kyanobutyl, 2-kyanobutyl, 3-kyanobutyl, 4-kyanobutyl, 1-kyanobutyl-2-yl, 2-kyanobutyl-2-yl, 1-kyanobutyl-3-yl, 2-kyanobutyl-3-yl, 1-kyano-2-methylpropyl-3-yl, 2-kyano-2-methylpropyl-3-yl, 3-kyano-2-methylpropyl-3-yl a

2-kyanomethylprop-2-yl, výhodně kyanomethyl a 1-kyano-1-methylethyl;

- fenyl-C₁-C₄-alkyl- C₁-C₄-alkyl jak je uveden výše, kde v každém případě je jeden atom vodíku nahrazen fenylovou skupinou, tj. např. benzyl, 1-fenylethyl, 2-fenylethyl, 1-fenylprop-1-yl, 2-fenylprop-1-yl, 3-fenylprop-1-yl, 1-fenylbut-1-yl, 2-fenylbut-1-yl, 3-fenylbut-1-yl, 4-fenylbut-1-yl, 1-fenylbut-2-yl, 2-fenylbut-2-yl, 3-fenylbut-2-yl, 3-fenylbut-2-yl, 4-fenylbut-2-yl, 1-(fenylmethyl)eth-1-yl, 1-(fenylmethyl)-1-(methyl)eth-1-yl a 1-(fenyl-methyl)prop-1-yl, výhodně benzyl;

- fenyl-C₁-C₆-alkyl: C₁-C₆-alkyl jak uvedeno výše, kde v každém případě je jeden atom vodíku nahrazen fenylovou skupinou, tj. např. výše uvedenými fenyl-C₁-C₄-alkyly;

- fenyl-C₃-C₆-alkenyl: C₃-C₆-alkenyl jak je uveden výše, kde v každém případě je jeden atom vodíku nahrazen fenylskupinou;

- fenyl-C₃-C₆-alkinyl-C₃-C₆-alkinyl jak uveden výše, kde jeden atom vodíku je v každém případě nahrazen fenylovou skupinou;

- C₁-C₄-alkoxy: methoxy, ethoxy, n-propoxy, 1-methylethoxy, n-butoxy, 1-methylpropoxy, 2-methylpropoxy a 1,1-dimethylethoxy, výhodně methoxy, ethoxy a 1-methylethoxy;

- C₁-C₆-alkoxy: C₁-C₄-alkoxy jak je uveden výše a také n-pentoxy, 1-methylbutoxy, 2-methylbutoxy, 3-methylbutoxy, 1,1-dimethylpropoxy, 1,2-dimethylpropoxy, 2,2-dimethylpropoxy, 1-ethylpropoxy, n-hexoxy, 1-methylpentoxy, 2-methylpentoxy, 3-methylpentoxy, 4-methylpentoxy, 1,1-dimethylbutoxy, 1,2-dimethylbutoxy, 1,3-dimethylbutoxy, 2,2-dimethylbutoxy,

2,3-dimethylbutoxy, 3,3-dimethylbutoxy, 1-ethylbutoxy, 2-ethylbutoxy, 1,1,2-trimethylpropoxy, 1,2,2-trimethylpropoxy, 1-ethyl-1-methylpropoxy a 1-ethyl-2-methylpropoxy;

- C₁-C₈-alkoxy: C₁-C₆-alkoxy jak je uveden výše a také např. n-heptoxy a n-oktoxy;

- C₁-C₄-halogenalkoxy: C₁-C₄-alkoxy jak je uveden výše, který je částečně nebo úplně substituován fluorem, chlorem a/nebo bromem, tj. např. chlormethoxy, dichlormethoxy, trichlormethoxy, fluormethoxy, difluormethoxy, trifluormethoxy, chlorfluormethoxy, dichlorfluormethoxy, chlordinfluormethoxy, 1-fluorethoxy, 2-fluorethoxy, 2,2-difluorethoxy, 2,2,2-trifluorethoxy, 2-chlor-2-fluorethoxy, 2-chlor-2,2-difluorethoxy, 2,2-dichlor-2-fluorethoxy, 2,2,2-trichlorethoxy a pentafluorethoxy, výhodně C₁-C₂-halogenalkoxy jako je trifluormethoxy;

- C₁-C₄-alkylthio: methylthio, ethylthio, propylthio, 1-methylethylthio, n-butylthio, 1-methylpropylthio, 2-methylpropylthio a 1,1-dimethylethylthio, výhodně methylthio, ethylthio a methylethylthio;

- C₁-C₄-halogenalkylthio: chlormethylthio, dichlormethylthio, trichlormethylthio, fluormethylthio, difluormethylthio, trifluormethylthio, chlorfluormethylthio, dichlorfluormethylthio, chlordinfluormethylthio, 1-fluorethylthio, 2-fluorethylthio, 2,2-difluorethylthio, 2,2,2-trifluor-ethylthio, 2-chlor-2-fluorethylthio, 2-chlor-2,2-difluorethylthio, 2,2-dichlor-2-fluorethylthio, 2,2,2-trichlorethylthio a pentafluorethylthio, výhodně C₁-C₂-halogenalkyl jako je trifluormethylthio;

- C₃-C₆-alkenyloxy: prop-1-en-1-yloxy, prop-2-en-1-yloxy,
 1-methylethenyloxy, n-buten-1-yloxy, n-buten-3-yloxy,
 1-methylprop-1-en-1-yloxy, 2-methylprop-1-en-1-yloxy,
 1-methylprop-2-en-1-yloxy, 2-methylprop-2-en-1-yloxy,
 n-penten-1-yloxy, n-penten-3-yloxy, n-penten-4-yloxy,
 1-methylbut-1-en-1-yloxy, 2-methylbut-1-en-1-yloxy,
 3-methylbut-1-en-1-yloxy, 1-methylbut-2-en-1-yloxy,
 3-methylbut-2-en-1-yloxy, 1-methylbut-3-en-1-yloxy,
 2-methylbut-3-en-1-yloxy, 3-methylbut-3-en-1-yloxy,
 1,1-dimethylprop-1-en-1-yloxy, 1,2-dimethylprop-2-en-1-yloxy,
 1-ethylprop-1-en-2-yloxy, 1-ethylprop-2-en-1-yloxy,
 n-hex-1-en-1-yloxy, n-hex-2-en-1-yloxy, n-hex-3-en-1-yloxy,
 n-hex-4-en-1-yloxy, n-hex-1-en-5-yloxy,
 1-methylpent-1-en-1-yloxy, 2-methylpent-1-en-1-yloxy,
 3-methylpent-1-en-1-yloxy, 4-methylpent-1-en-1-yloxy,
 1-methylpent-2-en-1-yloxy, 2-methylpent-2-en-1-yloxy,
 3-methylpent-2-en-1-yloxy, 4-methylpent-3-en-1-yloxy,
 2-methylpent-3-en-1-yloxy, 3-methylpent-3-en-1-yloxy,
 4-methylpent-3-en-1-yloxy, 1-methylpent-4-en-1-yloxy,
 2-methylpent-4-en-1-yloxy, 3-methylpent-4-en-1-yloxy,
 4-methylpent-4-en-1-yloxy, 1,1-dimethylbut-2-en-1-yloxy,
 1,1-dimethylbut-3-en-1-yloxy, 1,2-dimethylbut-1-en-1-yloxy,
 1,2-dimethylbut-2-en-1-yloxy, 1,2-dimethylbut-3-en-1-yloxy,
 1,3-dimethylbut-1-en-1-yloxy, 1,3-dimethylbut-2-en-1-yloxy,
 1,3-dimethylbut-3-en-1-yloxy, 2,2-dimethylbut-3-en-1-yloxy,
 2,3-dimethylbut-1-en-1-yloxy, 2,3-dimethylbut-2-en-1-yloxy,
 2,3-dimethylbut-3-en-1-yloxy, 3,3-dimethylbut-1-en-1-yloxy,
 3,3-dimethylbut-2-en-1-yloxy, 1-ethylbut-1-en-1-yloxy,
 1-ethylbut-2-en-1-yloxy, 1-ethylbut-3-en-1-yloxy,
 2-ethylbut-1-en-1-yloxy, 2-ethylbut-2-en-1-yloxy,
 2-ethylbut-3-en-1-yloxy, 1,1,2-trimethylprop-2-en-1-yloxy,
 1-ethyl-1-methylprop-2-en-1-yloxy,
 1-ethyl-2-methylprop-1-en-1-yloxy a

1-ethyl-2-methylprop-2-en-1-yloxy, výhodně ethenyloxy a prop-2-en-1-yloxy;

- fenoxý-C₁-C₄--alkyl: fenoxymethyl, 1-fenoxýethyl, 2-fenoxýethyl, 1-fenoxýprop-1-yl, 2-fenoxýprop-1-yl, 3-fenoxýprop-1-yl, 1-fenoxýbut-1-yl, 2-fenoxýbut-1-yl, 3-fenoxýbut-1-yl, 4-fenoxýbut-1-yl, 1-fenoxýbut-2-yl, 2-fenoxýbut-2-yl, 3-fenoxýbut-2-yl, 3-fenoxýbut-2-yl, 4-fenoxýbut-2-yl, 1-(fenoxymethyl)eth-1-yl, 1-(fenoxymethyl)-1-(meth)eth-1-yl a 1-(fenoxymethyl)-prop-1-yl, výhodně fenoxymethyl;

- C₁-C₄-alkylamino: methylamino, ethylamino, n-propylamino, 1-methylethylamino, n-butylamino, 1-methylpropylamino, 2-methylpropylamino a 1,1-dimethylethylamino, výhodně methylamino a ethylamino;

- di-(C₁-C₄)-alkylamino: N,N-dimethylamino, N,N-diethylamino, N,N-dipropylamino, N,N-(1-methylethyl)amino, N,N-dibutylamino, N,N-di-(1-methylpropyl)amino, N,N-di-(2-methylpropyl)amino, N,N-di-(1,1-dimethylethyl)amino, N-ethyl-N-methylamino, N-methyl-N-propylamino, N-methyl-N-(1-methylethyl)amino, N-butyl-N-methylamino, N-methyl-N-(1-methylpropyl)amino, N-methyl-N-(2-methylpropyl)amino, N-(1,1-dimethylethyl)-N-methylamino, N-ethyl-N-propylamino, N-ethyl-N-(1-methylethyl)amino, N-butyl-N-ethylamino, N-ethyl-N-(1-methylpropyl)amino, N-ethyl-N-(2-methylpropyl)amino, N-ethyl-N-(1,1-dimethylethyl)amino, N-(1-methylethyl)-N-propylamino, N-butyl-N-propylamino, n-(1-methylpropyl)-N-propylamino, N-(2-methylpropyl)-N-propylamino,

N-(1,1-dimethylethyl)-N-propylamino,
 N-butyl-N-(1-methylethyl)amino,
 N-(1-methylethyl)-N-(1-methylpropyl)amino,
 N-(1-methylethyl)-N-(2-methylpropyl)amino,
 N-(1,1-dimethylethyl)-N-(1-methylethyl)amino,
 N-butyl-N-(1-methylpropyl)amino,
 N-butyl-N-(2-methylpropyl)amino,
 N-butyl-N-(1,1-dimethylethyl)amino,
 N-(1-methylpropyl)-N-(2-methylpropyl)amino,
 N-(1,1-dimethylethyl)-N-(1-methylpropyl)amino
 a N-(1,1-dimethylethyl)-N-(2-methylpropyl)amino, výhodně
 dimethylamino a diethylamino;

- C₁-C₄-alkylaminokarbonyl: methylaminokarbonyl,
 ethylaminokarbonyl, n-propylaminokarbonyl,
 1-methylethylaminokarbonyl, n-butylaminokarbonyl,
 1-methylpropylaminokarbonyl, 2-methylpropylaminokarbonyl a
 1,1-dimethylethylaminokarbonyl, výhodně methylaminokarbonyl a
 ethylaminokarbonyl;

- di-(C₁-C₄)-alkylaminokarbonyl: N,N-dimethylaminokarbonyl,
 N,N-diethylaminokarbonyl, N,N-dipropylaminokarbonyl,
 N,N-(1-methylethyl)aminokarbonyl, N,N-dibutylaminokarbonyl,
 N,N-di-(1-methylpropyl)aminokarbonyl,
 N,N-di-(2-methylpropyl)aminokarbonyl,
 N,N-di-(1,1-dimethylethyl)aminokarbonyl,
 N-ethyl-N-methylaminokarbonyl,
 N-methyl-N-propylaminokarbonyl,
 N-methyl-N-(1-methylethyl)aminokarbonyl,
 N-butyl-N-methylaminokarbonyl,
 N-methyl-N-(1-methylpropyl)aminokarbonyl,
 N-methyl-N-(2-methylpropyl)aminokarbonyl,
 N-(1,1-dimethylethyl)-N-methylaminokarbonyl,

N-ethyl-N-propylaminokarbonyl,
 N-ethyl-N-(1-methylethyl)aminokarbonyl,
 N-butyl-N-ethylaminokarbonyl,
 N-ethyl-N-(1-methylpropyl)aminokarbonyl,
 N-ethyl-N-(2-methylpropyl)aminokarbonyl,
 N-ethyl-N-(1,1-dimethylethyl)aminokarbonyl,
 N-(1-methylethyl)-N-propylaminokarbonyl,
 N-butyl-N-propylaminokarbonyl,
 N-(1-methylpropyl)-N-propylaminokarbonyl,
 N-(2-methylpropyl)-N-propylaminokarbonyl,
 N-(1,1-dimethylethyl)-N-propylaminokarbonyl,
 N-butyl-N-(1-methylethyl)aminokarbonyl,
 N-(1-methylethyl)-N-(1-methylpropyl)aminokarbonyl,
 N-(1-methylethyl)-N-(2-methylpropyl)aminokarbonyl,
 N-(1,1-dimethylethyl)-N-(1-methylethyl)aminokarbonyl,
 N-butyl-N-(1-methylpropyl)aminokarbonyl,
 N-butyl-N-(2-methylpropyl)aminokarbonyl,
 N-butyl-N-(1,1-dimethylethyl)aminokarbonyl,
 N-(1-methylpropyl)-N-(2-methylpropyl)aminokarbonyl,
 N-(1,1-dimethylethyl)-N-(1-methylpropyl)aminokarbonyl,
 a N-(1,1-dimethylethyl)-N-(2-methylpropyl)aminokarbonyl,
 výhodně dimethylaminokarbonyl a diethylaminokarbonyl;

- C₁-C₄-alkylsulfonyl: methylsulfonyl, ethylsulfonyl,
 n-propylsulfonyl, 1-methylethylsulfonyl, n-butylsulfonyl,
 1-methylpropylsulfonyl, 2-methylpropylsulfonyl a
 1,1-dimethylethylsulfonyl;

- C₁-C₄-alkylsulfinyl: methylsulfinyl, ethylsulfinyl,
 n-propylsulfinyl, 1-methylethylsulfinyl, n-butylsulfinyl,
 1-methylpropylsulfinyl, 2-methylpropylsulfinyl a
 1,1-dimethylethylsulfinyl;

- C₁-C₄-alkylsulfonylamino: methylsulfonylamino, ethylsulfonylamino, n-propylsulfonylamino, 1-methylethylsulfonylamino, n-butylsulfonylamino, 1-methylpropylsulfonylamino, 2-methylpropylsulfonylamino a 1,1-dimethylethylsulfonylamino;

-C₁-C₄-halogenalkylsulfonyl: C₁-C₄-alkylsulfonyl jak je uveden výše, který je částečně nebo zcela substituován fluorem, chlorem a/nebo bromem, tj. např. chlormethylsulfonyl, dichlormethylsulfonyl, trichlormethylsulfonyl, fluormethylsulfonyl, difluormethylsulfonyl, trifluormethylsulfonyl, chlorfluormethylsulfonyl, dichlorfluormethylsulfonyl, chlordinfluormethylsulfonyl, 1-fluorethylsulfonyl, 2-fluorethylsulfonyl, 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 a pentafluorethylsulfonyl, výhodně trichlormethylsulfonyl a trifluormethylsulfonyl;

-C₁-C₄-halogenalkylsulfinyl: C₁-C₄-alkylsulfinyl jak je uveden výše, který je částečně nebo zcela substituován fluorem, chlorem a/nebo bromem, tj. např. chlormethylsulfinyl, dichlormethylsulfinyl, trichlormethylsulfinyl, fluormethylsulfinyl, difluormethylsulfinyl, trifluormethylsulfinyl, chlorfluormethylsulfinyl, dichlorfluormethylsulfinyl, chlordinfluormethylsulfinyl, 1-fluorethylsulfinyl, 2-fluorethylsulfinyl, 2,2-difluorethylsulfinyl, 2,2,2-trifluorethylsulfinyl, 2-chlor-2-fluorethylsulfinyl, 2-chlor-2,2-difluorethylsulfinyl, 2,2-dichlor-2-fluorethylsulfinyl, 2,2,2-trichlorethylsulfinyl a pentafluorethylsulfinyl, výhodně trichlormethylsulfinyl

a trifluormethylsulfinyl;

- C₃-C₉-(α -alkylalkyliden)iminooxy např.: α -methylideniminooxy, α -methylpropylideniminooxy.

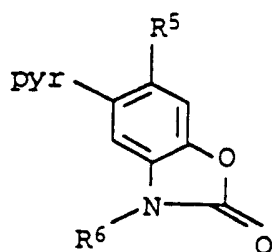
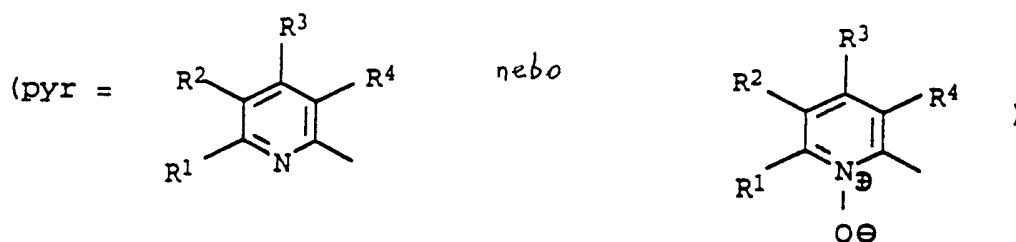
Pro významy 5- nebo 6-členný heteroaryl a heteroaryl-C₁-C₄-alkyl, jsou vhodné následující heteroaromatické zbytky: 2-furyl, 3-furyl, 2-thienyl, 3-thienyl, 2-pyrrolyl, 3-pyrrolyl, 3-isoxazolyl, 4-isoxazolyl, 5-isoxazolyl, 3-isothiazolyl, 4-isothiazolyl, 5-isothiazolyl, 3-pyrazolyl, 4-pyrazolyl, 2-oxazolyl, 4-oxazolyl, 5-oxazolyl, 2-thiazolyl, 4-thiazolyl, 5-thiazolyl, 2-imidazolyl, 4-imidazolyl, 1,2,4-oxadiazol-3-yl, 1,2,4-oxadiazol-5-yl, 1,2,4-thiadiazol-3-yl, 1,2,4-thiadiazol-5-yl, 1,2,4-triazol-3-yl, 1,3,4-oxadiazol-2-yl, 1,3,4-thiadiazol-2-yl, 1,3,4-triazol-2-yl, 2-pyridinyl, 3-pyridinyl, 4-pyridinyl, 3-pyridazinyl, 4-pyridazinyl, 2-pyrimidinyl, 4-pyrimidinyl, 5-pyrimidinyl, 2-pyrazinyl, 1,3,5-triazin-2-yl a 1,2,4-triazin-3-yl.

Vhodné agrikulturně využitelné kationy jsou zejména takové kationty, které nepůsobí nežádoucím způsobem na herbicidní účinnost sloučenin vzorce I, zejména ionty alkalických kovů, výhodně sodíku a draslíku, kovů alkalických zemin, výhodně vápníku, hořčíku a barya a přechodových kovů, výhodně manganu, mědi, zinku a železa a také amoniový iont, který, je-li to žádoucí, může nést jeden až tři C₁-C₄-alkylové nebo hydroxy-C₁-C₄-alkylové substituenty a/nebo fenylový nebo benzylový substituent, výhodně diisopropylamonium, tetramethylamonium, tetrabutylamonium, trimethylbenzylamonium a trimethyl(2-hydroxyethyl)amonium, tri(C₁-C₄-alkyl)sulfonium a sulfoxonium ionty, výhodně tri(C₁-C₄-alkyl)sulfoxonium.

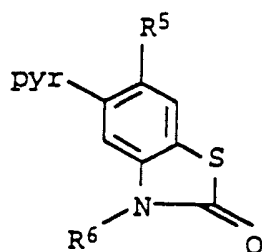
Amoniový iont a výše uvedené substituované amoniové ionty

jsou zvláště výhodné.

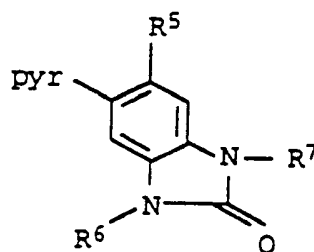
Sloučeniny vzorce I a jejich N-oxidy mají následující struktury vzorců Ia až Im:



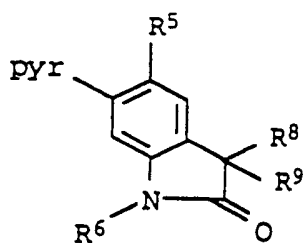
Ia



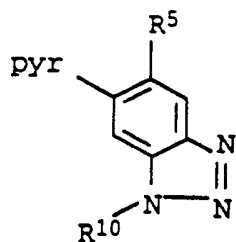
Ib



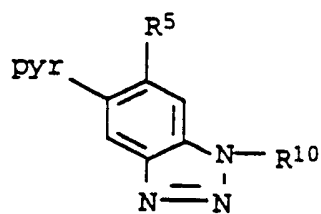
Ic



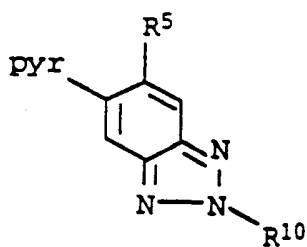
Id



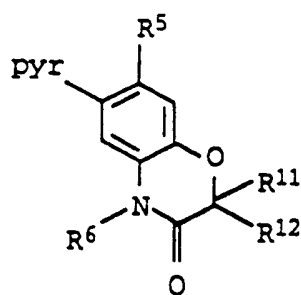
Ie



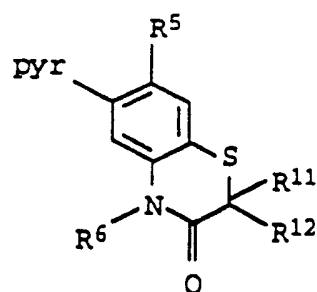
If



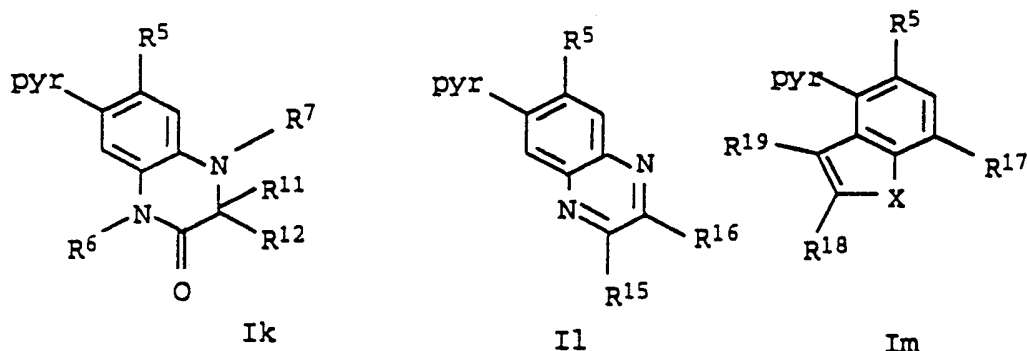
Ig



Ih

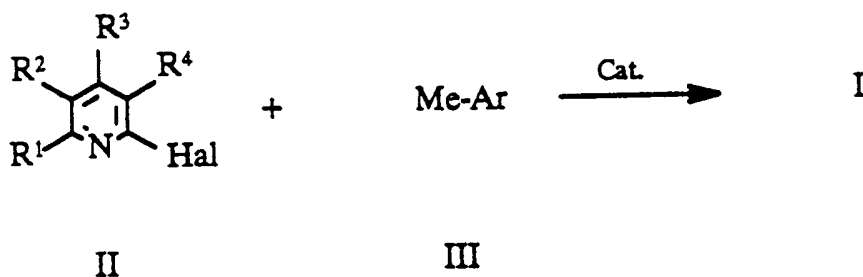


Ii



Nové substituované 2-fenylpyridiny vzorce I a jejich N-oxidy jsou připravitelné různými způsoby, výhodně některým z následujících způsobů:

A): Reakce substituovaného 2-halogenpyridinu s organokovovou sloučeninou za přítomnosti katalyzátoru v inertním rozpouštědle:



V tomto případě je Hal chlor nebo brom, Me je Mg-Hal, Zn-Hal, tri-C₁-C₄-alkylcín, lithium, měď nebo B(OR²⁴)(OR²⁵), kde R²⁴ a R²⁵ jsou vodík nebo C₁-C₄-alkyl a cat. je katalyzátor na bázi přechodového kovu, zejména palladiový katalyzátor jako je tetrakis(trifenylfosfin)palladium(0), bis(1,4-difenylfosfino)butanpalladium(II)chlorid a bis(trifenylfosfin)palladium(II)chlorid, nebo katalyzátor na

bázi niklu jako je $\text{Ni}(\text{II})\text{acetylacetonát}$,
 $\text{bis}(\text{trifenylylfosfin})\text{Ni}(\text{II})\text{chlorid}$ a
 $\text{bis}(1,3\text{-difenylylfosfino})\text{propanNi}(\text{II})\text{chlorid}$.

Me je výhodně $\text{B}(\text{OR}^{24})(\text{OR}^{25})$.

Reakce tohoto typu jsou obecně známé, například z následujících prací:

- Reakce s kyselinami boru ($\text{Me} = \text{B}(\text{OR}^{24})(\text{OR}^{25})$):

- (1) W.J.Thompson a J.Gaudino, J.Org.Chem. 49 (1984) 5237;
- (2) S.Gronowitz a K.Lawitz, Chem.Scr. 24 (1984) 5;
- (3) S.Gronowitz a spol., Chem.Scr.25 (1986) 305;
- (4) J.Stauvenouiter a spol., Heterocycles 26 (1987) 2711;
- (5) V. Snieckus a spol., Tetrahedron Letters 28 (1987) 5093;
- (6) V.Snieckus a spol., Tetrahedron Letters 29 (1988) 2135;
- (7) M.B.Mitchell a spol., Tetrahedron Letters 32 (1991) 2273;
Tetrahedron 48 (1992) 8117;
- (8) JP-A 93/301870;

- reakce s Grignardovými sloučeninami ($\text{Me} = \text{Mg-Hal}$):

- (9) L.N.Pridgen, J.Heterocyclic Chem., 12 (1975) 443;
- (10) M.Kumada a spol., Tetrahedron Letters 21 (1980) 845, ibid
22 (1981) 5319;
- (11) A.Minato a spol., J.Chem.Soc.,Chem.Comm., (1984) 511;

- reakce s organickými sloučeninami ($\text{Me} = \text{Zn-Hal}$):

- (12) A.S.Bell a spol., Synthesis (1987) 843;
- (13) A.S.Bell a spol., Tetrahedron Letters, 29 (1988) 5013;
- (14) J.W.Tilley a S.Zawoisky, J.Org.Chem. 53 (1988) 386,

viz také odkaz (1);

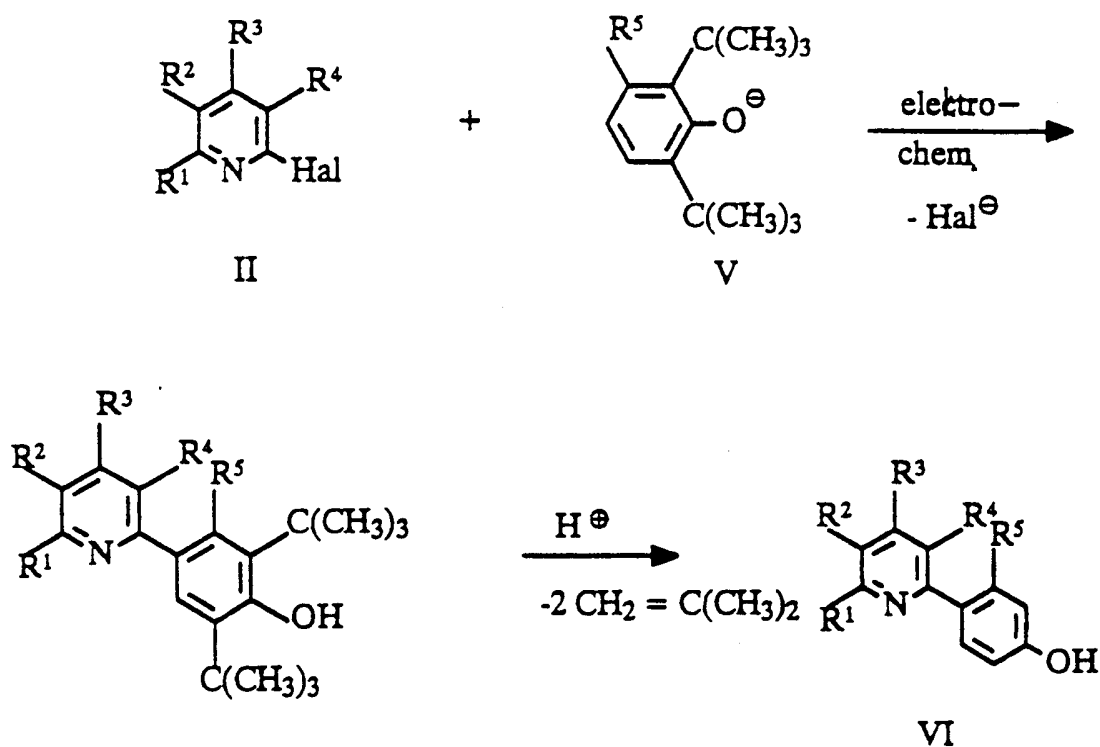
- reakce s organocínovými sloučeninami (Me = Sn(alkyl)₃)

(15) T.R.Bailey a spol., Tetrahedron Letters, 27 (1986) 4407;

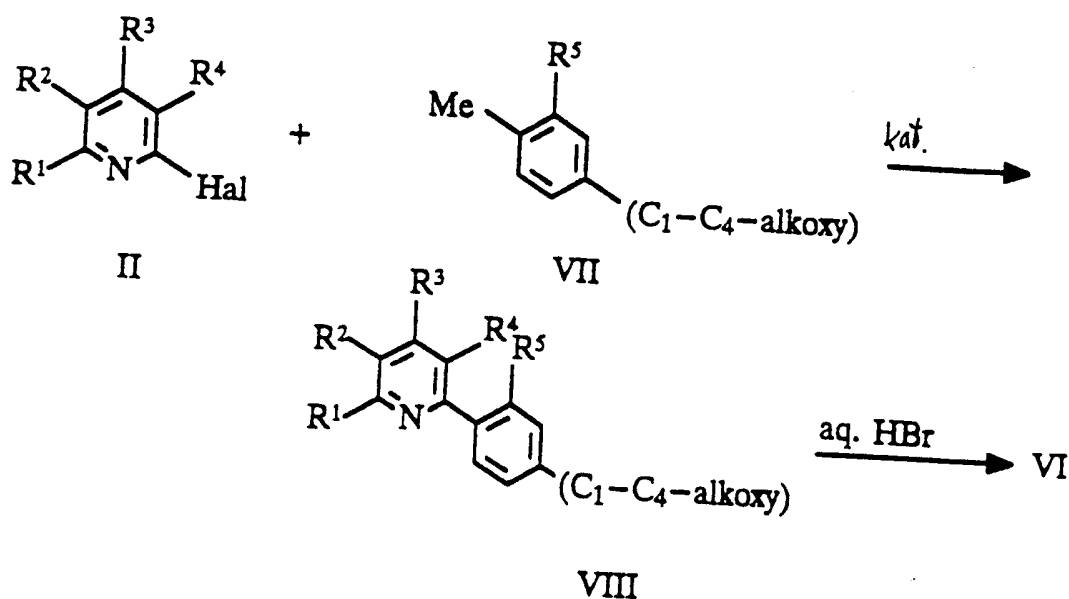
(16) Y.Yamamoto a spol., Synthesis, 1986, 564;

viz také odkaz (6).

B): Pro syntézu substituovaných 2-fenylpyridinů vzorce Ia a Ih se vhodně používají odpovídající 2-(4-hydroxyfenyl)pyridiny vzorce VI jako výchozí materiály. tyto mohou být připraveny způsobem známým per se elektrochemickou reakcí 2-halogenpyridinů vzorce II se 2,6-di-terc-butylfenoláty vzorce V a následnou kysele katalyzovanou eliminací isobutenu (viz např. P.Boy a spol., Synlett 1991, 923):



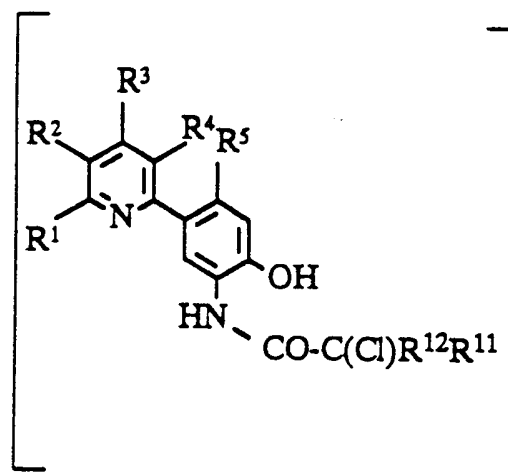
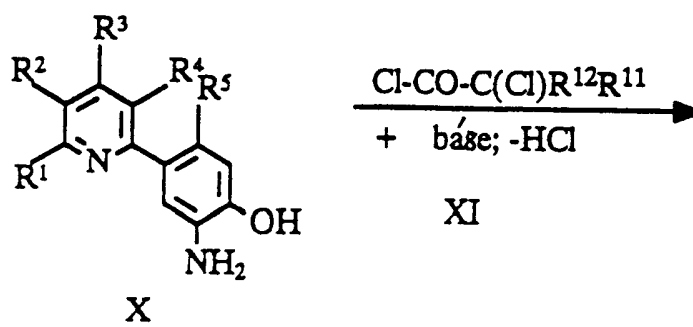
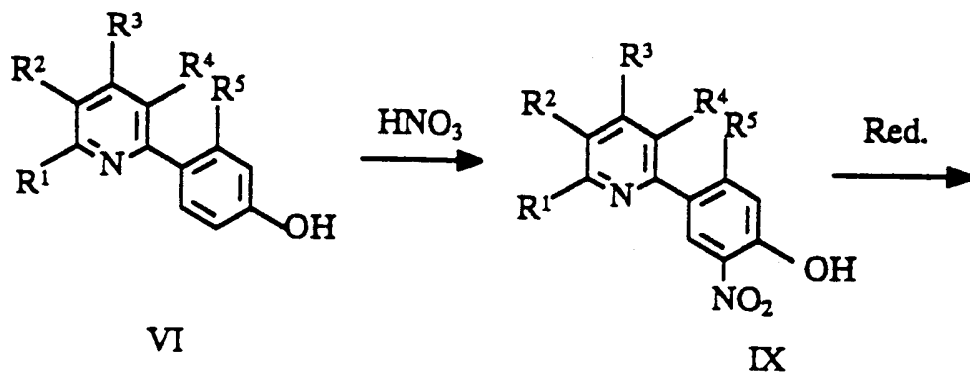
2-Halogenpyridiny vzorce II mohou také reagovat s p-metalátovaným fenyl-C₁-C₄-alkyletherem vzorce VII, např. kyselinou p-methoxybenzenboronovou. Kyselé štěpení 2-(4-alkoxyfenyl)pyridinu vzorce VIII, např. konc. vodným roztokem bromovodíku, poskytne v dobrém výtěžku 2-(4-hydroxyfenyl)pyridin vzorce VI:



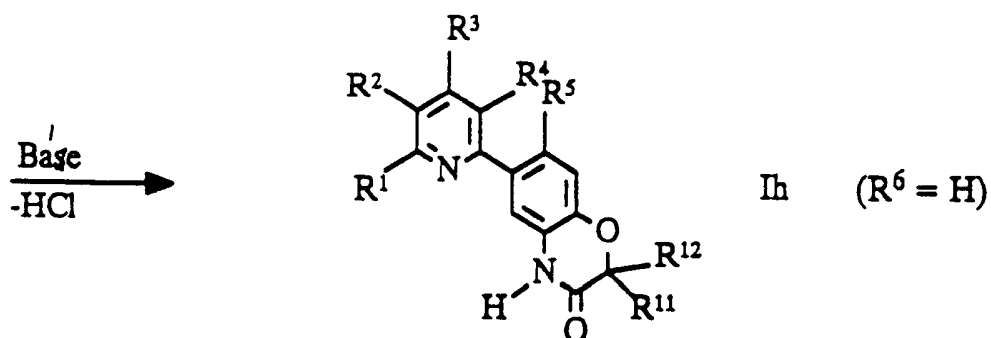
Další reakce 2-(4-hydroxyfenyl)pyridinu VI pro poskytnutí substituovaných 2-fenylpyridinů vzorce Ia a Ih se provádí podobně metodami známými z literatury, viz např.:

- R.Tania a spol., Synth.Comm.16 (1986) 681,
- EP-A 170191,
- US 4792605,
- EP-A 448 188.

Nitrace sloučenin vzorce VII poskytne
2-(4-hydroxy-5-nitrofenyl)pyridin vzorce IX, jehož redukcí
pomocí Fe/kyselina octová nebo SnCl_2 /kyselina chlorovodíková
nebo H_2 /kat. se získá 2-(5-amino-4-hydroxyfenyl)paridin vzorce
X. Acylací X pomocí chloridu kyseliny α -chloroctové vzorce XI
za přítomnosti báze poskytne izolovatelný karboxanilid vzorce
XII ke sloučenině vzorce Ih (kde $\text{R}^6 = \text{vodík}$).

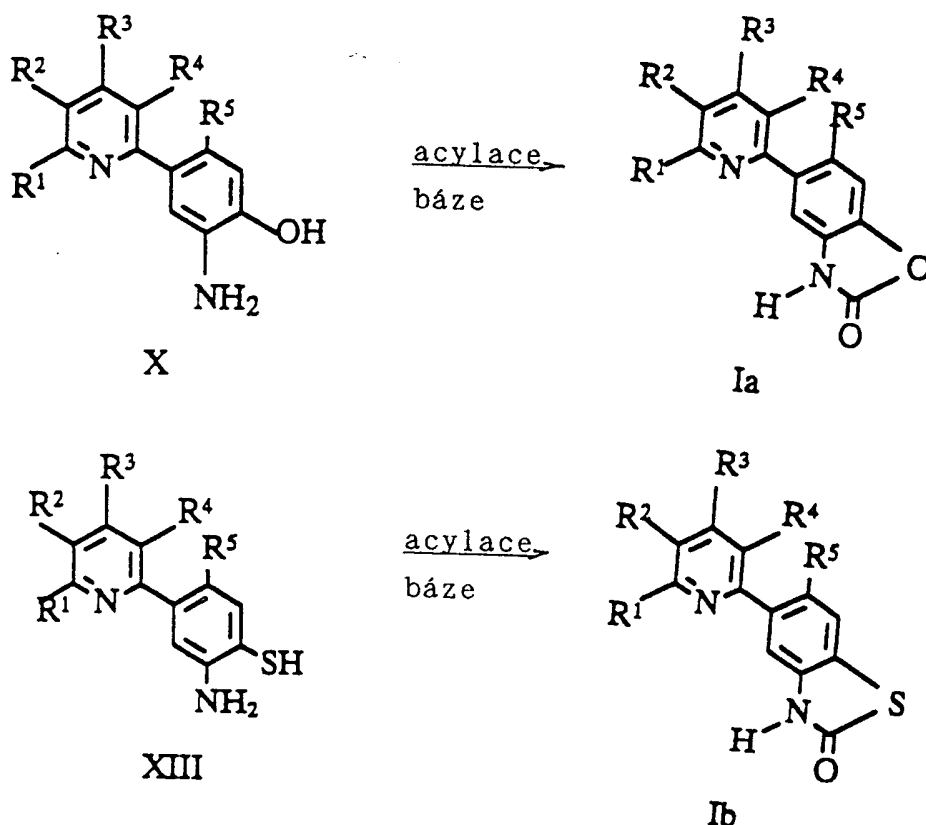


XII



2-(4-Hydroxy-5-nitrofenyl)pyridiny vzorce IX jsou nové. Nové jsou také 2-(5-amino-4-hydroxyfenyl)pyridiny vzorce X a karboxanilidy vzorce XII, které z nich mohou být připraveny.

C) Sloučeniny vzorce Ia a Ib, kde $R^6 = \text{vodík}$, mohou podobně být připraveny ze 2-(5-amino-4-hydroxyfenyl)pyridinů vzorce X nebo ze 2-(5-amino-4-merkaptofenyl)pyridinů vzorce XIII:



Acylace se provádí za použití derivátů kyseliny uhličitě jako je fosgen, difosgen, karbonyldiimidazol, ester kyseliny chlormravenčí, di-2-pyridylkarbonát, disukcinimidkarbonát, S,S-bis(1-fenyl-1H-tetrazol-5-yl)dithiokarbonát nebo močovina.

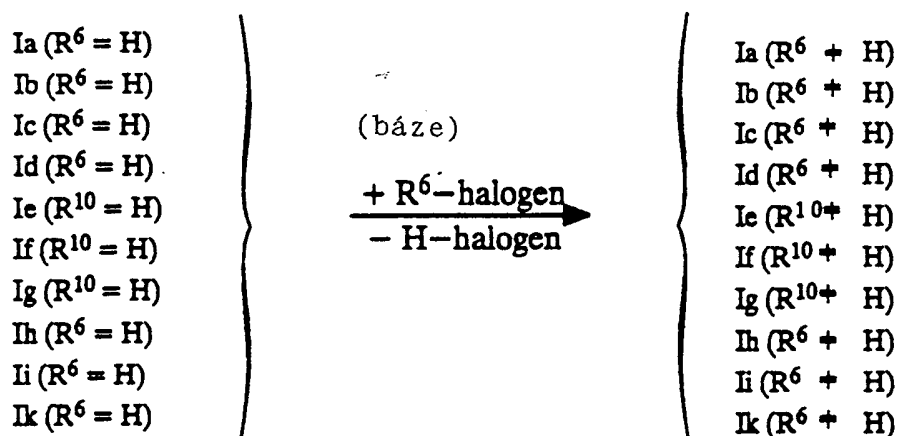
Přídavek báze může být výhodný, v závislosti na použitém aminofenolu vzorce X nebo aminothiofenolu vzorce XIII a

derivátu kyseliny uhličitě, vhodné báze jsou zejména anorganické sole, např. hydrogenuhlíčan sodný, hydrogenuhlíčan draselný, uhličitan sodný, uhličitan draselný, hydroxid sodný, hydroxid draselný, pyridin nebo terciární aminy např. triethylamin.

Reakce o-aminofenolů a o-aminothiofenolů s karbonylderiváty jsou obecně známé (viz také J.Sam a spol., J.Pharm.Sci. 58 (1969), 1043), například z následujících odkazů:

- reakce s močovinou: W.J.Close a spol., J.Am.Chem.Soc. 71 (1949), 1265; JP 9048 472;
- reakce s karbonyldiimidazolem: R.J.Nachman, J.Heterocyclic Chem. 19 (1982), 1545;
- reakce s di-2-pyridylkarbonátem: S.Kim a spol., Heterocycles 24 (1986), 1625;
- reakce s S,S'-bis-(1-fenyl-1H-tetrazol-5-yl)dithiokarbonátem: K.Takeda a spol., Chem.Pharm.Bull. 37 (1989), 2334;
- reakce s esterem kyseliny chlormravenčí: R.S.Atkinson a spol., J.Chem.Soc.Perkin Trans. 1991, díl 2, č. 3.str.509;
- reakce s disukcinimidokarbonátem: K.Takeda a spol., Synth.Comm.12 (1982), 213;
- reakce s fosgenem nebo difosgenem: US 4420486; JP-A 60-94973; J.Weinstock a spol., J.Med.Chem. 30 (1987) 1166.

Acylace nebo alkylace sloučenin vzorce Ia až Ik, kde R^6 nebo R^{10} je vodík, s alkylhalogenidy, estery kyseliny sírové, karbonylchloridy nebo anhydridy karboxylových kyselin vede k dalším sloučeninám vzorce Ia až Ik, kde R^6 nebo R^{10} nejsou vodík. Tato reakce se vhodně také provádí za přítomnosti báze:



pro acylaci benzoxazolin-2-onů acetanhydridem viz W.J.Close a spol., J.Am.Chem.Soc. 71 (1949), 1256;

pro acylaci benzoxazolin-2-onů chloridy kyselin viz N.Cotelle a spol., Synthetic Commun. 19 (1989), 3259;

pro acylaci benzoxazolin-2-onů alkylhalogenidy viz M.Yamato a spol., Chem. and Pharm. Bull 31 (1983), 1733; US 4640707; K.T.Potts a spol., J.Org.Chem. 45 (1980) 4985;

pro acylaci benzoxazolin-2-onů acetanhydridem viz S.Kadoya a spol., Chem.Pharm.Bull. 24 (1976), 147;

pro acylaci benzoxazolin-2-onů chloridy kyselin viz JP 62-201

876;

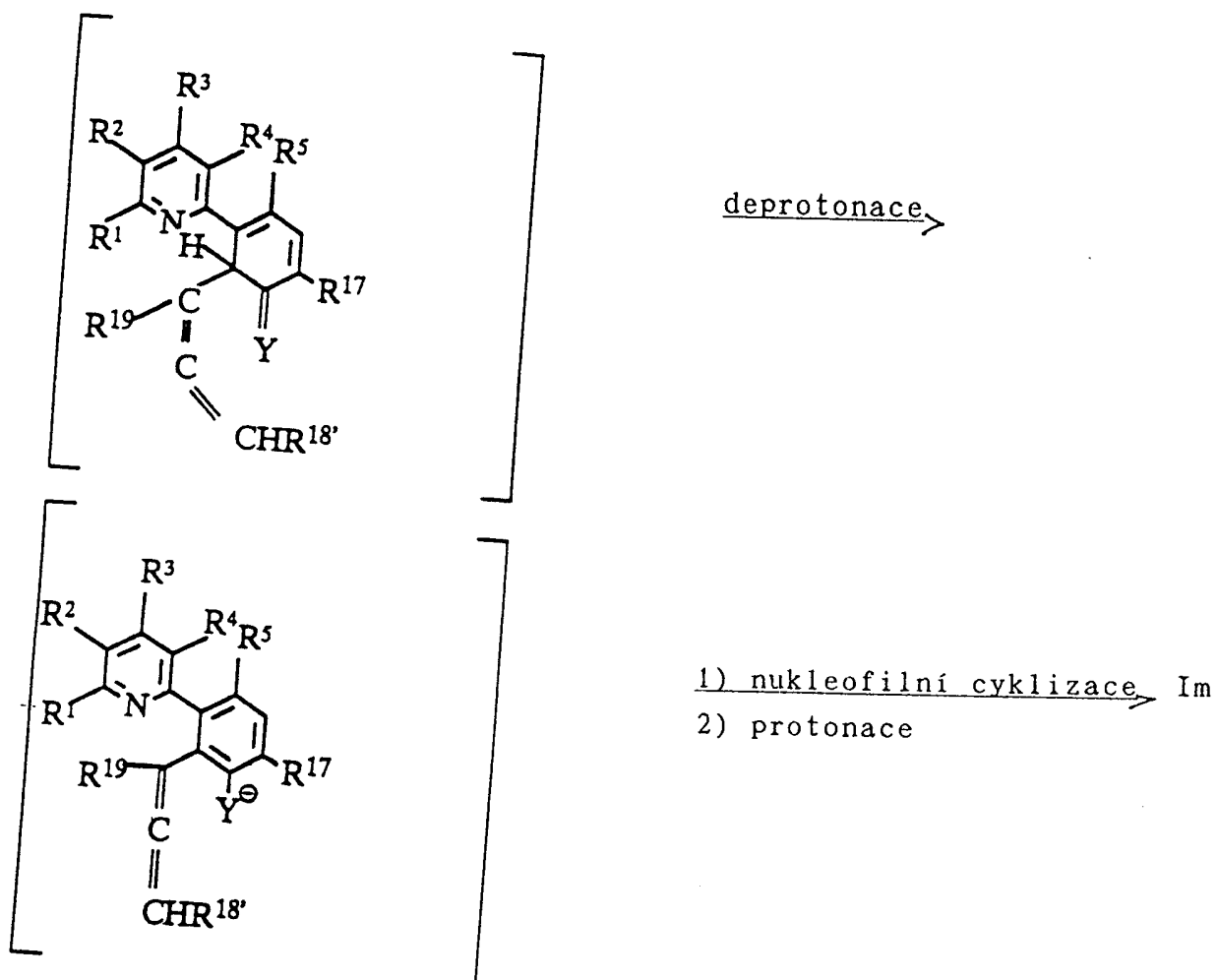
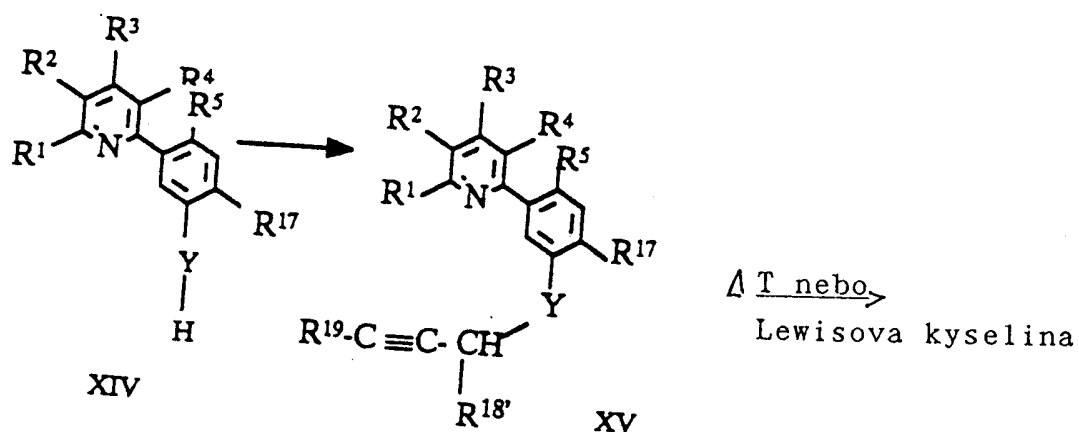
pro acylaci benzoxazolin-2-onů esterem kyseliny chlormravenčí viz S.Kadoya a spol., Chem. and Pharm.Bull.24 (1976), 147;

pro alkylaci benzothiazolin-2-onů alkylhalogenidy nebo estery kyseliny sírové viz S.Kadoya a spol., Chem. and Pharm.Bull. 24 (1976), 147;

JP 62-132873; JP 62-252787; US 4720297;

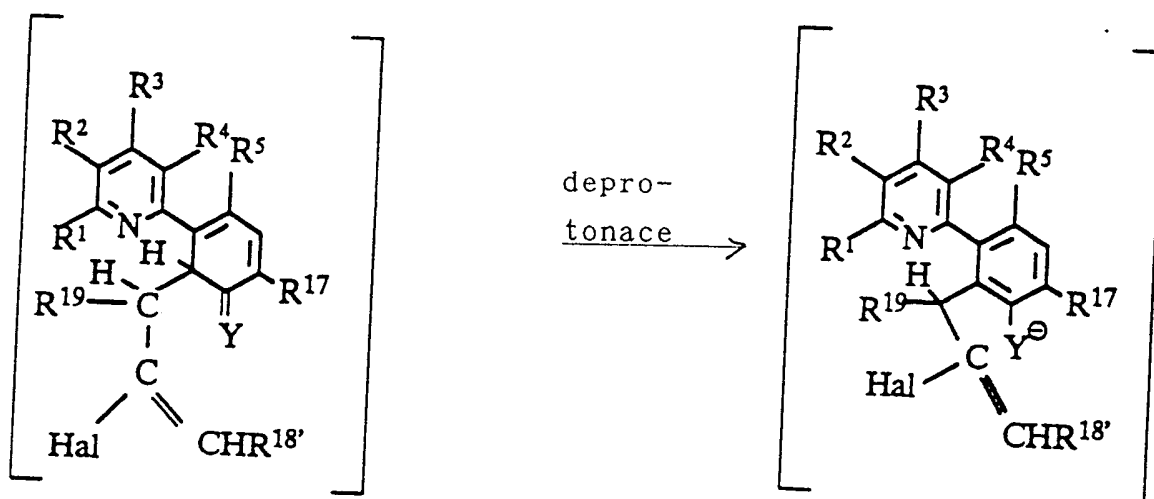
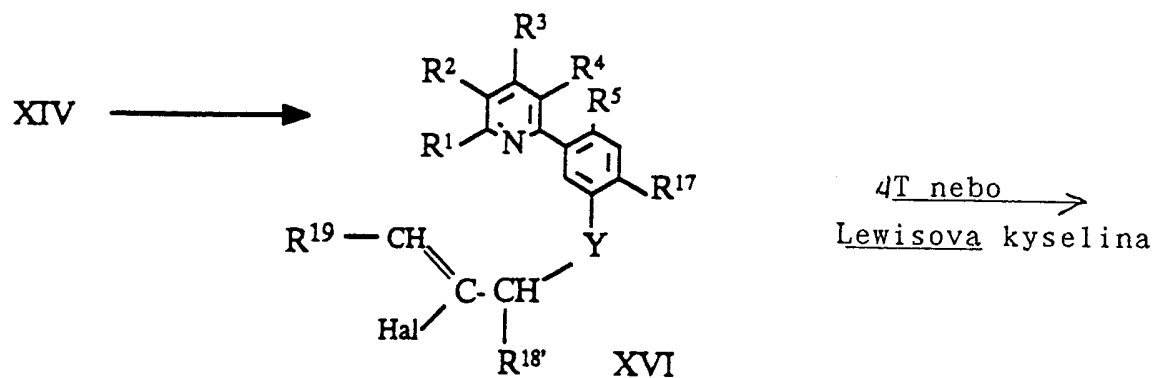
pro alkylaci benzothiazolin-2-onů pomocí Michaelovy adice k esterům kyseliny akrylové viz US 4720297.

E): Konverzi 3-hydroxyfenyl- nebo 3-merkaptofenylpyridinů XIV (srov.DE-A 4323916) buď na propargylethery nebo propargylthioethery vzorce XV, které se pak podrobí tepelně vyvolanému nebo Lewisovou kyselinou katalyzovanému Claisenovu přesmyku:



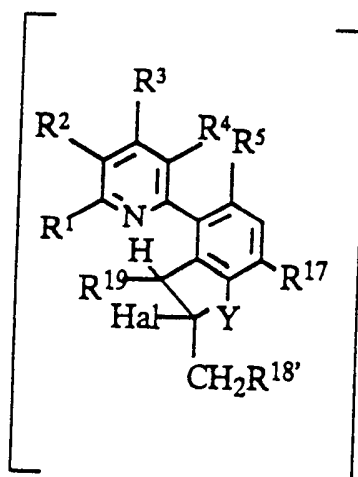
($R^{18'}$ C₁-C₅-alkyl, C₁-C₅-halogenalkyl nebo
 C₁-C₄-alkoxy-C₁-C₃-alkyl; Y je kyslík nebo síra)
 nebo na β-halogenallylehery vzorce XVI, které jsou podobně

podrobeny tepelně vyvolanému nebo Lewisovou kyselinou katalyzovanému Claisenovu přesmyku:



1) nukleofilní
cyklizace

2) protonace

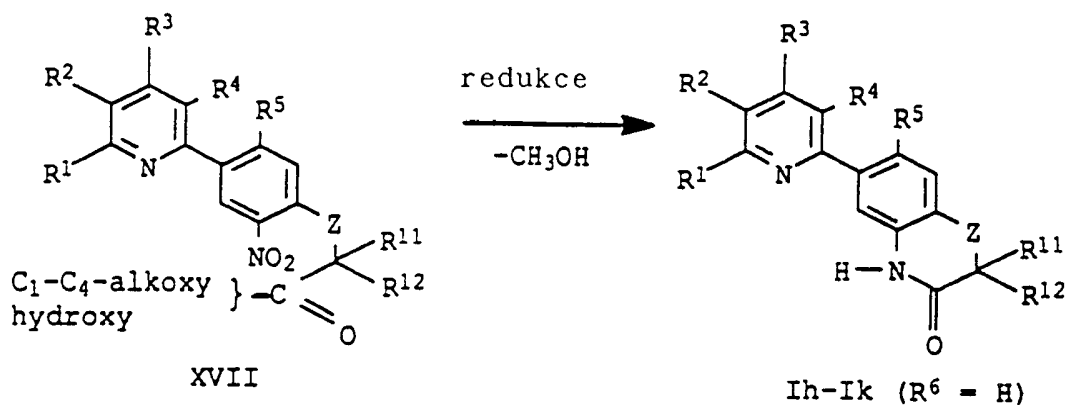


-H-Hal

I_m

Obě reakce jsou v zásadě známy např. z EP-A 476697. Pokud jde o první uvedenou variantu, je možno učinit odkaz na H.Ishii-ho a spol., Chem.Pharm.Bull.40 (1992) 1148. Reakce ze druhé varianty jsou navíc známy z práce E.K.Ryu-e a spol., Bull. Korean Chem.Soc., 13 (1992), 361.

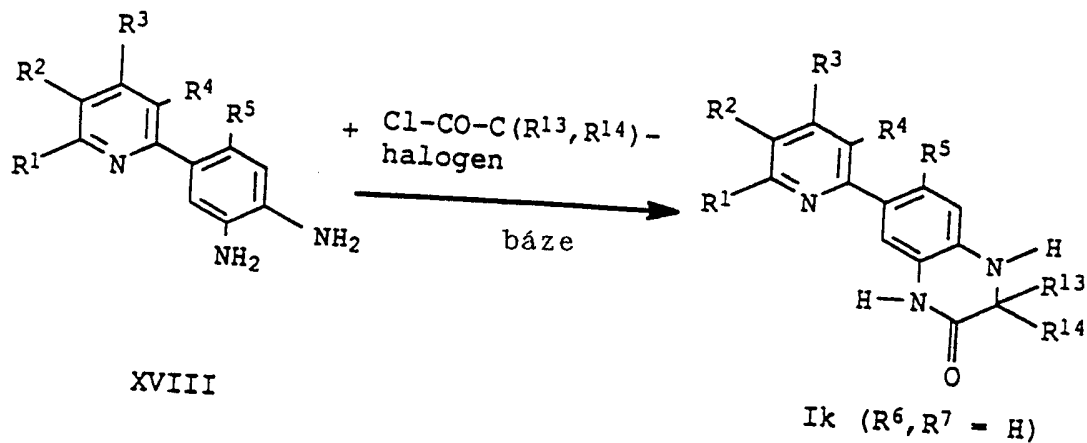
F) Redukce nitrofenylových derivátů vzorce XVII na sloučeniny vzorce Ik, kde R^6 = vodík, způsobem o sobě známým (viz např. US 4670042):



(Z je kyslík, síra nebo N- R^7).

Vhodné reduktanty jsou, například, vodík (hydrogenace na běžném katalyzátoru) na nosiči nebo železo v kyselině octové.

G) Reakce diaminů vzorce XVIII s halogenkarbonylchloridem $Cl-O-C(R^{13}, R^{14})$ -halogen způsobem známým per se (viz např. JP-A 55-49379) za vzniku sloučenin vzorce Ik, kde R^6 , R^7 = vodík:



Sloučeniny vzorce I mohou být převedeny na N-oxidy běžnými metodami, např. reakcí s organickou perkyselinou jako je kyselina metachlorperbenzoová.

Substituované 2-fenylpyridiny vzorce I, kde R^1 , R^3 a/nebo R^4 jsou radikály karboxylátů alkalických kovů, mohou být získány zpracováním sloučenin vzorce I, kde R^1 , R^3 a/nebo R^4 = hydroxykarbonyl např.

- s hydroxidem sodným nebo hydroxidem draselným ve vodném roztoku nebo v organickém rozpouštědle jako je methanol, ethanol, aceton nebo toluen nebo

- s hydridem sodným v organickém rozpouštědle jako je dimethylformamid.

Tvorba solí se normálně provádí při asi 20 °C adekvátní rychlostí.

Sůl může být izolována např. vysrážením se vhodným inertním rozpouštědlem nebo odpařením rozpouštědla.

Substituované 2-fenylpyridiny vzorce I, kde R^1 , R^3 a/nebo R^4 jsou karboxylátový radikál, jehož protiontem je agrikulturně využitelný kationt, který nepatří do skupiny alkalických kovů, mohou být běžně připraveny dvojitým rozkladem odpovídajících karboxylátů alkalických kovů.

Sloučeniny vzorce I, kde R^1 , R^3 a/nebo R^4 jsou karboxylátový radikál, jehož protiontem je např. iont zinku, železa, vápníku nebo hořčíku, mohou být připraveny z odpovídajících karboxylátů sodných běžným způsobem, stejně tak sloučeniny vzorce I, kde R^1 , R^3 a/nebo R^4 jsou karboxylátový radikál, jehož protiontem je amoniový iont, pomocí amoniaku.

Pokud není uvedeno jinak, provádějí se všechny zde popsané reakce při atmosférickém tlaku nebo pod autogenním tlakem příslušné reakční směsi.

Substituované 2-fenylpyridiny vzorce I mohou být získány během přípravy jako isomerní směsi, které však mohou být rozděleny, je-li to žádoucí, na čisté isomery metodami běžnými pro tento účel jako je krystalizace nebo chromatografie, alternativně na opticky aktivním adsorbátu. Čisté opticky aktivní isomery mohou být výhodně připraveny z odpovídajících opticky aktivních výchozích látek.

2-Substituované 2-fenylpyridiny vzorce I, jejich agrikulturně využitelné soli a N-oxidy jsou vhodné jako herbicidy, jak jako isomerní směsi tak ve formě čistých isomerů. Mohou velmi účinně kontrolovat širokolisté plevely a travní plevely v kulturních plodinách jako je pšenice, rýže,

kukuřice, sojové boby a bavlník, bez významného poškození kulturních rostlin. Tento účinek se objevuje zejména při nízkých aplikačních dávkách.

V závislosti na jednotlivé aplikační metodě, sloučeniny vzorce I nebo herbicidní kompozice, které je obsahují, mohou navíc být využity v mnoha dalších kulturních plodinách pro eliminaci nežádoucích rostlin. Příklady vhodných kulturních plodin jsou následující: *Allium cepa*, *Ananas comosus*, *Arachis hypogaea*, *Asparagus officinalis*, *Beta vulgaris* spp. *altissima*, *Beta vulgaris* spp. *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*, *Opomea batatas*, *Juglans regia*, *Lens culinaris*, *Linum usitatissimum*, *Lycopersicon lycopersicum*, *Malus* spp., *Manihot esculenta*, *Medicago sativa*, *Musa* spp., *Nicotiana tabacum* (*N. rustica*), *Olea europaea*, *Oryza sativa*, *Phaseolus lunatus*, *Phaseolus vulgaris*, *Picea abies*, *Pinus* spp., *Pisum sativum*, *Prunus avium*, *Prunus persica*, *Pyrus communis*, *Ribes sylvestris*, *Panicum communis*, *Sacharum 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 sloučeniny vzorce I, jejich N-oxidy a/nebo soli mohou být použity v kulturních plodinách, které mohou být velmi rezistentní k působení sloučenin vzorce I v důsledku

šlechtěním a/nebo pomocí metod genetického inženýrství.

Dále jsou substituované 2-fenylpyridiny vzorce I také vhodné pro desikaci a/nebo defoliaci rostlin. Jako desikanty jsou vhodné zejména pro desikaci nadzemních částí kulturních rostlin jako jsou brambory, řepka, slunečnice a sojové boby. Je tak umožněna plně mechanizovaná sklizeň těchto důležitých kulturních plodin.

Dalším ekonomickým přínosem je usnadnění sklizně, které je možné současným koncentrovaným opadáním nebo snížením síly adheze ke stromu v případě citrusových plodů, oliv nebo jiných odrůd a typů ovocných měkkých plodů, tvrdých plodů a suchých plodů s tvrdou skořápkou. Stejný mechanismus, tj. promotování tvorby oddělení tkáně mezi plodem nebo listem a stonkovou částí rostliny je také podstatné pro vysoce kontrolovatelnou defoliaci vhodných rostlin, zejména bvlly.

Navíc, zkrácení časového intervalu, ve kterém jednotlivé bavlníkové rostliny dozrávají, vede ke zvýšené kvalitě vlákna po sklizni.

Účinné sloučeniny mohou být aplikovány postřikem, nebulizací, atomizací, rozházením nebo zavodněním, jako takové nebo ve formě svých přípravků nebo aplikačních forem z nich připravených, např. ve formě přímo rozstříkovatelných roztoků, prášků, suspenzí nebo disperzí, emulzí, olejových disperzí, past, poprašových kompozic, kompozic nebo granulí pro rozhazování. Aplikační formy zcela závisí na zamýšleném použití; v mnoha případech, je-li to žádoucí, by měly obsahovat nejjemnější disperzi účinných sloučenin podle vynálezu.

Formulace jsou připravovány známým způsobem, např. nastavením účinné sloučeniny rozpouštědla a/nebo nosiči, je-li to žádoucí za použití emulgátorů a dispergantů, může být také možné použít jiná další organická rozpouštědla jako pomocná rozpouštědla, je-li použita voda jako ředidlo.

Vhodné inertní pomocné látky pro tento účel jsou v podstatě: frakce minerálních olejů se střední až vysokou teplotou varu a dieselový olej a také pleje uhelného dehtu a oleje rostlinného nebo živočišného původu, rozpouštědla jako jsou aromáty (např. toluen, xylen), chlorované aromáty (např. chlorbenzeny), parafiny (např. ropné frakce), alkoholy (např. methanol, ethanol, butanol, cyklohexanol), ketony (např. cyklohexanon, isoforon), aminy (např. ethanolamin, N,N-dimethylformamid, N-methylpyrrolidon), a voda; nosiče jako jsou mleté přírodní materiály (např. kaoliny, hlínky, talek, křída), a mleté syntetické materiály (např. vysoce dispergovaná kyselina křemičitá, silikáty); emulgátory jako jsou neiontové a aniontové emulgátory (např. ethery polyoxyethylen-mastný alkohol, alkylsulfonáty a arylsulfonáty) a dispergantů jako jsou lignin-sulfitové odpadní louhy a methylceluloza.

Vodné aplikační formy mohou být připraveny z emulzních koncentrátů, smáčitelných prášků nebo ve vodě dispergovatelných granulí přidávkem vody. Pro přípravu emulzí, past nebo olejových disperzí mohou být substráty homogenizovány, jako takové nebo rozpuštěny v oleji nebo rozpouštědle, pomocí smáčecích činidel, adheziv, dispergantů nebo emulgátorů. Mohou však být také připraveny koncentráty, obsahující účinnou složku, smáčecí činidlo, adhezivum, dispergant nebo emulgátor a podle potřeby rozpouštědlo nebo olej.

Vhodné povrchově aktivní složky jsou soli aromatických sulfonových kyselin s alkalickými kovy, kovy alkalických zemin nebo amoniové soli, např. kyseliny lignosulfonové, kyseliny fenolsulfonové, kyseliny naftalensulfonové a kyseliny dibutylnaftalensulfonové a také mastných kyselin, alkylsulfonáty a arylsulfonáty, alkyl, laurylether a sulfáty mastných alkoholů a také sole sulfatovaných hexa-, hepta- a oktadekanoly a také mastné alkoholglykolethery, kondenzační produkty sulfonovaných naftalenů a jejich derivátů s formaldehydem, kondenzační produkty naftalenové nebo naftalensulfonové kyseliny s fenolem a formaldehydem, polyoxyethylenoktylfenolether, ethoxylovaný isooktyl-, oktyl- nebo nonylfenol, alkylfenol nebo tributylfenylpolyglykolether, alkylarylpolyetheralkoholy, isotridecylalkohol, kondenzáty mastný alkohol-ethylenoxid, ethoxylovaný ricinový olej, polyoxyethylenalkylethery nebo polyoxypropylen, laurylalkoholpolyglykoletheracetát, sorbitan estery, lignin-sulfinové odpadní louhy nebo methylceluloza.

Práškované, rozhazovací a poprašové kompozice mohou být připraveny smísením nebo společným mletím účinných složek s pevným nosičem.

Granule, např. potažené, impregnované a homogenní granule, mohou být připraveny smísením účinných sloučenin s pevnými nosiči. Pevné nosiče jsou minerální hlinky jako jsou kyseliny křemičité, silikagely, silikáty, talek, kaolin, vápenec, vápno, křída, kmeny stromů, spraš, hlínka, dolomit, diatomická hlínka, síran vápenatý a síran hořečnatý, oxid hořečnatý, mleté plasty, hnojiva, jako je síran amonný, fosforečnan amonný, dusičnan amonný, močoviny a rostlinné produkty jako je obilná mouka, stromová kůra, dřevná moučka a moučka z ořechových skořápek, celulozový prášek nebo jiné

pevné nosiče.

Koncentrace účinných sloučenin I v přípravcích připravených k použití se může měnit v širokých mezích, například mezi 0,01 a 95 % hmotn.

Účinné sloučeniny jsou v tomto případě normálně používány v čistotě 90 % až 100 %, výhodně 95 % až 100 % (podle NMR spektra).

Příklady provedení vynálezu

Příklady takových přípravků jsou:

I. 20 dílů hmotnostních sloučeniny č. Ia.01 se rozpustí ve směsi, která obsahuje dílů hmotnostních alkylovaného benzenu, 10 dílů hmotnostních adičního produktu 8 až 10 mol ethylenoxidu na 1 mol N-monoethanolamidu kyseliny olejové, 5 dílů hmotnostních vápenaté soli kyseliny dodecylbenzensulfonové a 5 dílů hmotnostních adičního produktu 40 mol ethylenoxidu na 1 mol ricinového oleje. Nalitím a jemnou dispergací roztoku v 100000 dílech hmotnostních vody se získá vodná disperze, která obsahuje 0,02 % hmotnostních účinné sloučeniny.

II. 20 dílů hmotnostních sloučeniny č. Ic.01 se rozpustí ve směsi, která obsahuje 40 dílů hmotnostních cyklohexanonu, 30 dílů hmotnostních isobutanolu, 20 dílů hmotnostních adičního produktu 7 mol ethylenoxidu k 1 mol iosoktylfenolu a 10 dílů hmotnostních adičního produktu 40 mol ethylenoxidu k 1 mol ricinového oleje. Nalitím roztoku do 100000 dílů hmotnostních vody a jemnou dispergací se získá vodná disperze, která obsahuje 0,02 % hmotn. účinné sloučeniny.

III. 20 dílů hmotnostních účinné sloučeniny č. Id.01 se rozpustí ve směsi, která obsahuje 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 k 1 mol ricinového oleje. Nalitím roztoku do 100000 dílů hmotnostních vody a jemnou dispergací se získá vodná disperze, která obsahuje 0,02 % hmotn. účinné sloučeniny.

IV. 20 dílů hmotnostních účinné sloučeniny č. Ig.01 se dobře smísí se 3 díly hmotnostními sodné sole kyseliny diisobutyl-naftalen- α -sulfonové, 17 díly hmotnostními sodné soli kyseliny lignosulfonové ze sulfitového odpadního louhu a 60 práškovaného gelu kyseliny křemičité a mele se v kladivovém mlýnu. Jemnou dispergací směsi ve 20000 dílech hmotnostních vody se získá postřiková kapalina, která obsahuje 0,1 % hmotnostní účinné sloučeniny.

V. 3 díly hmotnostní účinné sloučeniny č. Ih.001 se smísí s 97 díly hmotnostními jemně děleného kaolinu. Získá se tak poprašová kompozice, která obsahuje 3 % hmotnostní účinné sloučeniny.

VI. 20 dílů hmotnostních účinné sloučeniny č. Im.01 se dobře promísí se 2 díly hmotnostními vápenaté soli kyseliny dodecylbenzensulfonové, 8 díly hmotnostními mastný alkohol-polyglykoetheru, 2 díly hmotnostními sodné soli kondenzátu fenol/močovina/formaldehyd a 68 díly hmotnostními parafinického minerálního oleje. Získá se stabilní olejová disperze.

Aplikace účinných sloučenin nebo herbicidních a růst

rostlin regulujících činitel může být provedena pre-emergentně nebo post-emergentně. Normálně se rostliny postříkají nebo popráší účinnými sloučeninami nebo se zpracují s účinnými sloučeninami semena testovaných rostlin. Jestliže jsou účinné sloučeniny méně tolerovatelné určitými kulturními rostlinami, mohou být použita aplikační techniky, ve kterých se herbicidní kompozice nastříkají postřikovacím zařízením tak, že listy citlivých kulturních rostlin nejsou zasaženy jak jen je to možné, zatímco účinné sloučeniny se dostanou na listy nežádoucích rostlin, které rostou pod nimi nebo na nepokrytý půdní povrch ("post-directed, lay-by" aplikace).

Aplikační dávka účinné sloučeniny se může měnit v závislosti na cíli kontroly, roční době a stadiu růstu. Při použití jako herbicidy nebo jako defoliační činitel je aplikační dávka výhodně od 0,001 do 3,0, výhodně od 0,01 do 1,0 kg/ha účinné složky (a.s.).

Pro rozšíření spektra působnosti a pro dosažení synergických účinků mohou být substituované 2-fenylpyridiny vzorce I smíseny s mnoha reprezentanty jiných skupin herbicidních nebo růst regulujících účinných sloučenin a aplikovány společně. Vhodnými složkami směsi jsou například diaziny, deriváty 4H-3,1-bezoxazinu, benzothiadiazinony, 2,6-dinitroaniliny, N-fenylkarbamáty, thiokarbamáty, halogenkarboxylové kyseliny, triaziny, amidy, močoviny, difenylethery, triazinony, uracily, deriváty benzofuranu, deriváty cyklohexan-1,3-dionu, které nesou např. karboxylovou nebo karbaminoskupinu v poloze 2, deriváty chinolinkarboxylové kyseliny, imidazolinony, sulfonamidy, sulfonylmočoviny, kyseliny aryloxy- nebo heteroaryloxyfenoxypropionové a jejich soli, estery a amidy a jiné.

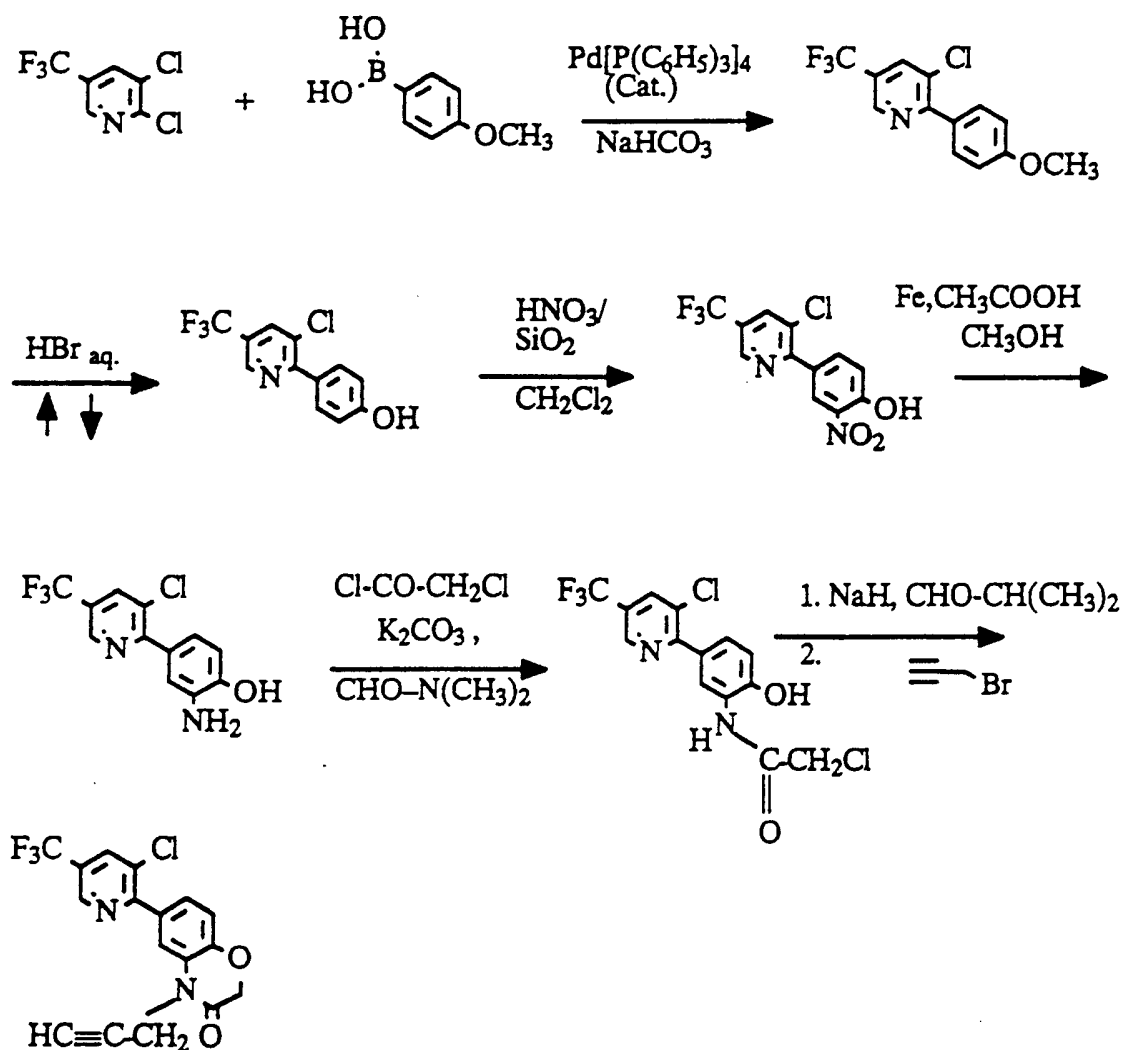
Dále může být vhodné aplikovat sloučeniny vzorce I jako takové nebo v kombinaci s jinými herbicidy a dále s jinými čidly, chránícími úrodu, například v kompozicích pro kontrolu škůdců nebo fytopatogenních hub nebo bakterií. Zajímavé jsou také směsi sroztoky minerálních solí, které se používají pro odstranění nedostatku nutričních a stopových prvků. Mohou také být přidány nefytotoxické oleje a olejové koncentráty.

Preparační příklady

Příklad 1

6-[3-Chlor-5-trifluormethylpyridin-2-yl]-4-propargyl-2H-1,4-benzoxazin-3-on (tabulka 5, sloučenina č. Ih.001)

Příprava se provede podle následujícího reakčního schématu:



1. stupeň reakce:

3-Chlor-2-(4-methoxyfenyl)-5-trifluormethylpyridin

20,4 g 2,3-dichlor-5-trifluormethylpyridinu, 18,9 g
p-methoxyfenylborkyseliny, 0,4 g
tetrakis(trifenylfosfin)palladia(0) a 23,8 g
hydrogenuhlčitanu sodného se refluxuje 2 h ve směsi 300 ml

tetrahydrofuranu a 300 ml vody. Po ochlazení se směs okyselí pomocí 10% kyseliny chlorovodíkové. Tetrahydrofuran se odstraní destilací za sníženého tlaku a produkt se pak třikrát extrahuje vždy 100 ml methylenchloridu. Spojené organické fáze se odsají přes silikagel a pak se odpaří. Rekrystalizací surového produktu z n-hexanu se získá 19,5 g (72 %) bezbarvých krystalů, t.t. 71 až 72 °C.

2.stupeň reakce:

3-Chlor-2-(4-hydroxyfenyl)-5-trifluormethylpyridin

Suspenze 10,0 g (34,8 mmol)

3-chlor-2-(4-methoxyfenyl)-5-trifluormethylpyridinu v 50 ml 47% kyseliny bromovodíkové se zahřívá pod refluxem dvě hodiny. Po ochlazení se reakční směs zředí 200 ml vody. Po několika hodinách chlazení se výsledné krystaly oddělí, promyjí se vodou a suší za sníženého tlaku. Výtěžek: 8,0 g (84 %) bezbarvýchkrystalů.

$^1\text{H-NMR}$ (270 MHz, v CDCl_3 : δ [ppm] = 6,78 (d,2H), 6,8-7,6 (br,1H), 7,62(d,2H), 8,08(s,1H), 8,82(s,1H).

3.stupemň reakce:

3-Chlor-2-(4-hydroxy-3-nitrofenyl)-5-trifluormethylpyridin

Nitrace se provede podle postupu popsaného R.Tapia-ou a spol., Synth.Comm. 16 (1986) 681;

Směs 8,0 g (29,3 mmol)

3-chlor-2-(6-hydroxyfenyl)-5-trifluormethylpyridinu, 7,1 g (29,3 mmol) $\text{HNO}_3/\text{SiO}_2$ (obsah HNO_3 asi 26 %) a 200 ml methylenchloridu se míchá při 20 až 25 °C asi 15 hodin. SiO_2 se odfiltruje odsátím a promyje se methylenchloridem. Po

odpaření spojených methylenchloridových fází se čistí olejový zbytek chromatografií na silikagelu (eluent: cyklohexan/ethylacetát 6:1). Výtěžek: 9,0 g (96 %) bezbarvých krystalů o t.t. 62 až 63 °C.

$^1\text{H-NMR}$ (250 MHz, v CDCl_3): δ [ppm] = 7,29 (d, 1H), 8,08 (s, 1H), 8,10 (dd, 1H), 8,68 (d, 1H), 8,88 (s, 1H), 10,80 (s, br., 1H).

4. stupeň reakce:

3-Chlor-2-(3-amino-4-hydroxyfenyl)-5-trifluormethylpyridin

6,2 g (110 mmol) železného prášku se zahřívá na teplotu refluxu ve směsi 66 ml methanolu a 33 ml ledové kyseliny octové a po částech se zpracuje s celkem 11,7 g (36,7 mmolů 3-chlor-2-(4-hydroxy-3-nitrofenyl)-5-trifluormethylpyridinu. Po ukončení přidávání se směs zahřívá další 2 hodiny pod refluxem, nechá se vychladnout a zředí se 130 ml ethylacetátu. Pevné složky se oddělí, promyjí se ethylacetátem a odloží. Filtrát se zpracovává s vodou takže se vytvoří dvě fáze. Vodná fáze se oddělí a extrahuje se dvakrát ethylacetátem. Spojené organické fáze se promyjí vodou, suší nad síranem sodným a filtrují se přes silikagel. Výtěžek: 7,8 g (74 %) tmavého oleje.

$^1\text{H-NMR}$ (250 MHz, v d^6 -dimethylsulfoxidu): δ [ppm] = 4,75 (s, br., 2H), 6,77 (d, 1H), 6,92 (dd, 1H), 7,08 (d, 1H), 8,47 (s, 1H), 8,98 (s, 1H), 9,65 (s, br., 1H).

5. stupeň reakce:

3-Chlor-2-[3-(2-chloracetylamino)-4-hydroxyfenyl]-5-trifluormethylpyridin

3,8 g (33,3 mol) chloracetylchloridu se přikape při 0 °C

ke směsi 7,4 g (25,6 mmol) 3-chlor-2-(3-amino-4-hydroxyfenyl)-5-trifluormethylpyridinu a 2,1 g (15,4 mmol) uhličitanu draselného ve 100 ml bezvodého dimethylformamidu. Po míchání při 90 °C po tři hodiny se reakční směs nechá vychladnout a pak se nalije do 500 ml vody. Pevný podíl se odfiltruje odsátím, promyje se vodou a suší se za sníženého tlaku. Výtěžek: 7,3 g (87 %) bezbarvých krystalů o t.t. 205 °C.

¹H-NMR (250 MHz, v d⁶-dimethylsulfoxidu): δ [ppm] = 4,44 (s, 2H), 7,04 (d, 1H), 7,49 (dd, 1H), 8,50 (m, 2H), 9,00 (s, 1H), 9,62 (s, 1H), 10,67 (s, 1H).

6. stupeň reakce

6-[3-Chlor-5-trifluormethylpyridin-2-yl]-4-propargyl-2H-1,4-benzoxazin-3-on

Roztok 3,6 g (11,0 mmol)

3-chlor-2-[3-(2-chloracetylamo)-4-hydroxyfenyl]-5-trifluormethylpyridinu v 50 ml bezvodého dimethylformamidu se přikape při 0 °C k suspenzi 0,4 g (12 mmol) hydridu sodného (80% v minerálním oleji), která byla zbavena minerálního oleje a 50 ml bezvodého dimethylformamidu. Po 15 minutách míchání se ke směsi přikape 1,3 g (11,0 mmol) propargylbromidu. Reakční směs se pomalu nechá ohřát na teplotu místnosti asi 20 °C, míchá se další tři hodiny a pak se nalije do 500 ml ledové vody. Vodná fáze se třikrát extrahuje vždy 200 ml ethylacetátu. Spojené organické fáze se promyjí dvakrát malým množstvím vody, suší se nad síranem sodným a pak se zahustí. Chromatografickým čištěním zbytku na silikagelu (eluent: cyklohexan/ethylacetát 4:1) se získá 1,9 g (47 %) bezbarvých krystalů o t.t. 136 až 137 °C.

¹H-NMR (270 MHz, v CDCl₃): δ [ppm] = 2,25 (t,1H), 4,70 (s,2H), 4,74 (d,2H), 7,13 (d,1H), 7,54 (dd,1H), 7,68 (d,1H), 8,07 (s,1H), 8,85 (s,1H).

Příklad 2

6-[3-Chlor-5-trifluormethylpyridin-2-yl]-4-allyl-
2H-1,4-benzoxazin-3-on (tabulka 5, sloučenina č. Ih.002)

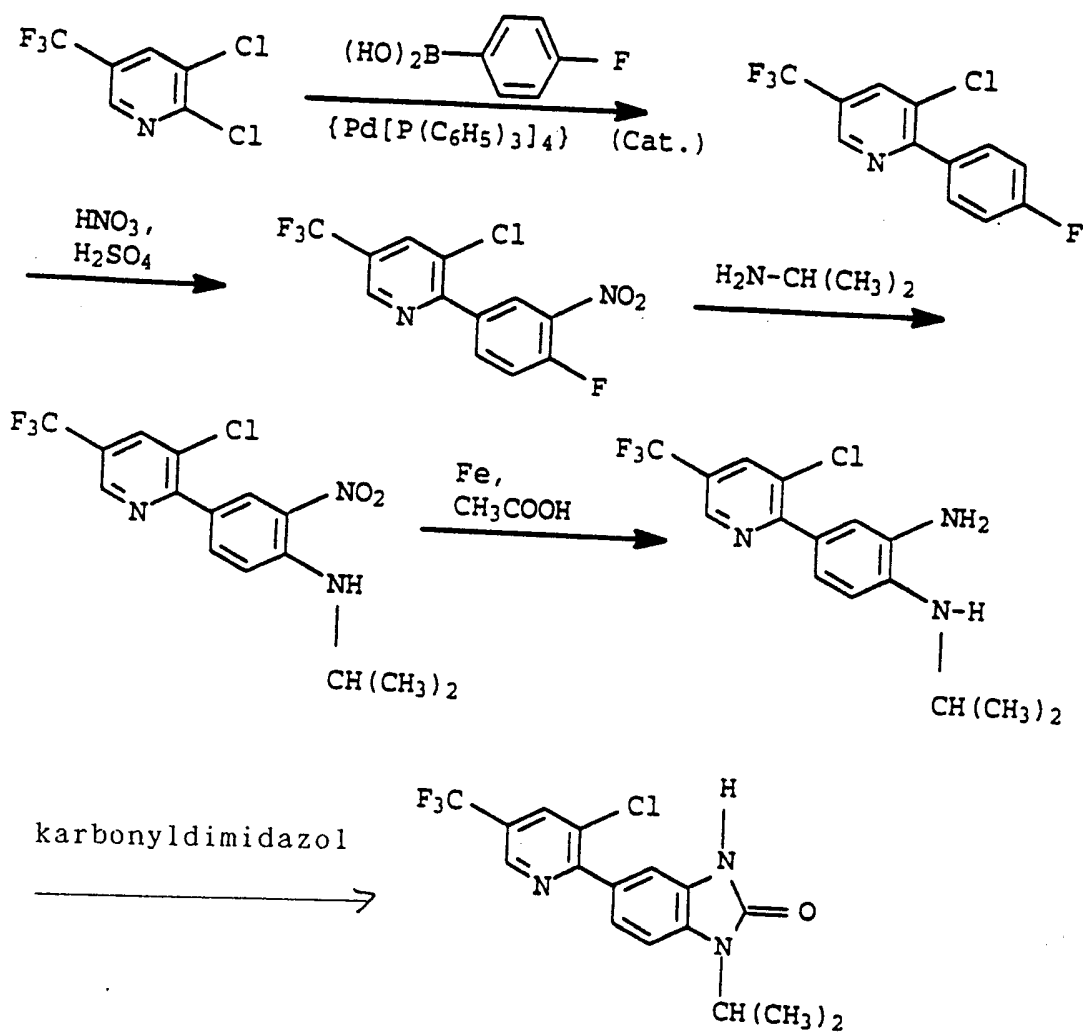
Způsobem podobným jako pro přípravu
6-[3-chlor-5-trifluormethylpyridin-2-yl]-4-propargyl-
2H-1,4-benzoxazin-3-onu, se za použití 3,4 g (10,4 mmol)
2-[3-(2-chloracetylamo)-4-hydroxyfenyl]-5-trifluormethylpyridinu,
0,7 g (23 mmol) 80% suspenze hydridu sodného, 1,4 g (11,4
mmol) allylbromidu a celkem 100 ml bezvodého dimethylformamidu
se získá, po chromatografii surového produktu na silikagelu
(eluent: cyklohexan/ethylacetát 6:1), 1,5 g (39 %) bezbarvých
krystalů o t.t. 132 až 134 °C.

¹H-NMR (270 MHz, v CDCl₃): δ [ppm] = 4,57 (d,2H), 4,72 (s,2H),
5,19–5,28 (m, 2H), 5,80–5,98 (m, 1H), 7,10 (d,1H), 7,45
(d,1H), 7,47 (dd,1H), 8,04 (s,1H), 8,82 (s,1H).

Příklad 3

6-[3-Chlor-5-trifluormethylpyridin-2-yl]-1-(1-methylethyl)-
benzimidazol-2-onu (tabulka 3, sloučenina č. Ic.01)

Připraví se podle následujícího reakčního schématu:



1. stupeň reakce:

3-Chlor-2-(4-trifluorfenyl)-5-trifluormethylpyridin

Podobným přípravem jak je popsán výše pro přípravu 3-chlor-2-(4-methoxyfenyl)-5-trifluormethylpyridinu, za použití 55,0 g 2,3-dichlor-5-trifluormethylpyridinu, 35,6 g 4-fluorfenylborkyseliny, 1,0 g tetrakistrifenyfosfinpalladia, 64,2 g hydrogenuhlčitanu sodného, 300 ml dimethoxyethanu a 500 ml vody se získá 65,0 g (93 %) bezbarvých krystalů o t.t. 41 až 42 °C.

2. stupeň reakce:

3-Chlor-2-(4-fluor-3-nitrofenyl)-5-trifluormethylpyridin

40,8 g 100% kyseliny dusičné se přikape při 0 až 5 °C k roztoku 118,9 g 3-chlor-2-(4-fluorfenyl)-5-trifluormethylpyridinu při 0 až 5 °C k roztoku 118,9 g 3-chlor-2-(4-fluorfenyl)-5-trifluormethylpyridinu v 563 ml 96% kyseliny sírové a směs se pak míchá při teplotě od 0 do 5 °C 1,5 hodiny. Pro zpracování se reakční směs nalije do 2 l vody a produkt se pak extrahuje ethylacetátem (3 x 300 ml). Spojené organické fáze se promyjí dvakrát vždy 100 ml vody, suší se nad síranem sodným a pak se odpaří. Výtěžek: 134,5 g (97 %) bezbarvého oleje, který stáním pomalu krystaluje.

¹H-NMR (250 MHz, v CDCl₃): δ [ppm] = 7,47 (t, 1H), 8,09–8,19 (m, 2H), 8,60 (dd, 1H), 8,89 (s, 1H).

3. stupeň reakce:

3-Chlor-2-[4-(1-methylethylamino)-3-nitrofenyl]-5-trifluormethylpyridin

44,0 g 3-chlor-2-(4-fluor-3-nitrofenyl)-5-trifluormethylpyridinu ve 250 ml isopropylaminu se míchá při 23 °C šest hodin. Reakční směs se pak zahustí. Zbytek se míchá se 100 ml vody, potom se zbylá pevná část oddělí, promyje se vodou a suší ve vakuové sušárně. Výtěžek 48,2 g (98 %) bezbarvých krystalů; t.t. 107 až 109 °C.

4.stupeň reakce:

2-[3-Amino-4-(1-methylethylamino)fenyl]-3-chlor-5-trifluormethylpyridin

Podobným způsobem jako pro přípravu 3-chlor-2-(3-amino-4-hydroxyfenyl)-5-trifluormethylpyridinu popsanou výše poskytne 46,1 g 3-chlor-2-[4-(1-methylethylamino)-3-nitrofenyl]-5-trifluormethylpyridinu a 21,5 g železného prášku 39,1 g (93 %) bezbarvých krystalů, t.t. 116 až 117 °C.

5.stupeň reakce:

5-(3-Chlor-5-trifluormethylpyridin-2-yl)-1-(1-methylethyl)-benzimidazol-2-on

37,4 g 2-[3-amino-4-(1-methylethylamino)-fenyl]-3-chlor-5-trifluormethylpyridinu a 27,6 g karbonyldiimidazolu se zahřívá na teplotu místnosti čtyři hodiny ve 200 ml bezvodého tetrahydrofuranu, potom se reakční směs zahustí. Zbytek se zpracuje se 100 ml 10% kyselině chlorovodíkové a směs se extrahuje třikrát vždy 100 ml methylenchloridu. Spojené organické fáze se promyjí dvakrát vždy 50 ml vody, suší se nad síranem sodným a zahustí. Surový produkt se míchá s etherem, potom se oddělí a suší. Výtěžek: 29,8 g (74 %) bezbarvých krystalů, t.t. 192 až 193 °C.

Příklad 4

5-(3-Chlor-5-trifluormethylpyridin-2-yl)-3-methyl-1-(1-methylethyl)benzimidazol-2-on (tabulka 3, sloučenina č. Ic.02)

0,23 g 80% hmotn. suspenze hydridu sodného v minerálním oleji se přidá při 23 °C ke 25 ml bezvodého dimethylformamidu. Směs se pak po kapkách zpracuje s roztokem 2,50 g 5-(3-chlor-5-trifluormethylpyridin-2-yl)-1-(1-methylethyl)benzimidazol-2-onu ve 25 ml dimethylformamidu a, po 15 minutách, s 1,05 g methyljodidu. Po 6 hodinách míchání se reakční směs nalije do 300 ml ledové vody. Vodná fáze se extrahuje třikrát vždy 100 ml terc.butylmethyletheru, potom se spojené organické fáze promyjí dvakrát vždy 50 ml vody, suší nad síranem sodným a zahustí. Chromatografií na silikagelu za použití cyklohexanu/ethylacetátu (4:1) jako elučního činidla se získá 2,1 g bezbarvých krystalů. Výtěžek: 75 %, t.t. 108 až 109 °C.

Příklad 5

5-(3-Chlor-5-trifluormethylpyridin-2-yl)-1-(1-methylethyl)-3-(2-propinyl)benzimidazol-2-on (tabulka 3, sloučenina č. Ic.06)

Podobně jako při přípravě 5-(3-chlor-5-trifluormethylpyridin-2-yl)-3-methyl-1-(1-methylethyl)benzimidazol-2-onu popsané výše, poskytne 2,5 g 5-(3-chlor-5-trifluormethylpyridin-2-yl)-1-(1-methylethyl)benzimidazol-2-onu a 0,9 g propargylbromidu, po chromatografii na silikagelu, 1,3 g (47 %) bezbarvých krystalů. Výtěžek: 47 %, t.t. 109 až 111 °C.

Příklad 6

5-(3-Chlor-5-trifluormethylpyridin-2-yl)-3-kyanomethyl-1-(1-methylethyl)benzimidazol-2-on (tabulka 3, sloučenina č. Ic.010)

Podobně jako při přípravě 5-(3-chlor-5-trifluormethylpyridin-2-yl)-3-methyl-1-(1-methylethyl)benzimidazol-2-onu popsané výše, poskytne 2,5 g 5-(3-chlor-5-trifluormethylpyridin-2-yl)-1-(1-methylethyl)benzimidazol-2-onu a 0,9 g bromacetonitrilu, po chromatografii na silikagelu, 1,4 g bezbarvých krystalů. Výtěžek: 50 %, t.t. 158 až 159 °C.

Příklad 7

5-(3-Chlor-5-trifluormethylpyridin-2-yl)-3-(2,3-epoxypropyl)-1-(1-methylethyl)benzimidazol-2-on (tabulka 3, sloučenina č. Ic.07)

Podobně jako při přípravě 5-(3-chlor-5-trifluormethylpyridin-2-yl)-3-methyl-1-(1-methylethyl)benzimidazol-2-onu popsané výše, poskytne 2,5 g 5-(3-chlor-5-trifluormethylpyridin-2-yl)-1-(1-methylethyl)benzimidazol-2-onu a 1,0 g epibromhydrinu 2,4 g bezbarvých krystalů. Výtěžek: 83 %, t.t. 110 až 111 °C.

Příklad 8

5-(3-Chlor-5-trifluormethylpyridin-2-yl)-3-ethoxykarbonylmethyl-1-(1-methylethyl)benzimidazol-2-on (tabulka 3, sloučenina č. Ic.08)

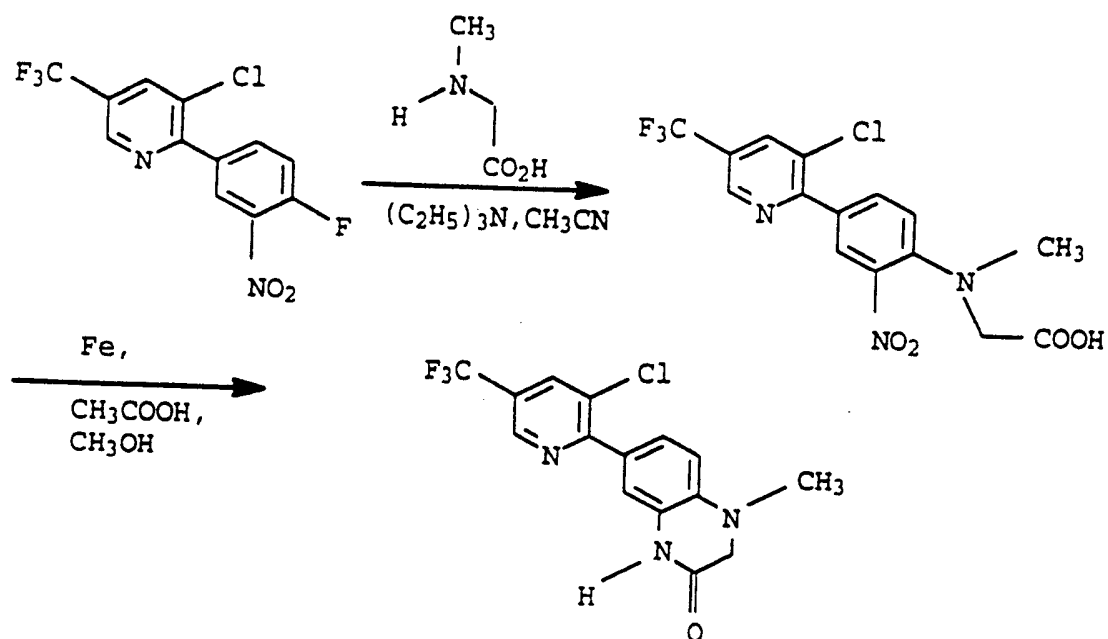
Podobně jako při přípravě 5-(3-chlor-5-trifluormethyl-

pyridin-2-yl)-3-methyl-1-(1-methylethyl)benzimidazol-2-onu popsané výše, poskytne 2,5 g 5-(3-chlor-5-trifluormethylpyridin-2-yl)-1-(1-methylethyl)benzimidazol-2-onu a 1,23 g ethylbromacetátu 2,1 g (68 %) bezbarvých krystalů. Výtěžek: 68 %, t.t. 125 až 127 °C.

Příklad 9

7-(3-Chlor-5-trifluormethylpyridin-2-yl)-1,2,3,4-tetrahydro-4-methylchinoxalin-2-on (tabulka 7, sloučenina Ik.12)

Příprava se provede podle následujícího reakčního schematu:



1. stupeň reakce:

3-Chlor-2-[4-(1-hydroxykarbonylmethyl-1-methylamino)-3-nitro-fenyl]-5-trifluormethylpyridin

Roztok 5,0 g

3-chlor-2-(4-fluor-3-nitrofenyl)-5-trifluormethylpyridinu, 1,4 g sarkosinu a 1,73 g triethylaminu v 50 ml acetonitrilu se míchá při 23 °C 3 dny a potom při teplotě refluxu další čtyři hodiny. Směs se potom zahustí dosucha. Zbytek se vyjme do 100 ml ethylacetátu, pak se organická fáze promyje dvakrát vždy 30 ml vody, suší se nad síranem sodným a zahustí. Surový produkt se míchá v n-hexanu, potom se odfiltruje a suší. Výtěžek: 4,7 g (77 %) bezbarvých krystalů.

¹H-NMR (250 MHz, v d₆-dimethylsulfoxidu): δ [ppm] = 2,90(s,3H), 4,13(s,2H), 7,20(d,1H), 7,98(dd,1H), 8,27(d,1H), 8,58(s,1H), 9,03(s,1H), 13,0(s,1H).

3.stupeň reakce:

7-(3-Chlor-5-trifluormethylpyridin-2-yl)-1,2,3,4-tetrahydro-4-methylchinoxalin-2-on

3,9 g železného prášku se zahřívá na teplotu refluxu ve směsi 42 ml methanolu a 21 ml ledové kyseliny octové a zpracuje po částech s celkem 9,1 g 3-chlor-4-[4-(1-hydroxykarbonylmethyl-1-methylamino)-3-nitrofenyl]-5-trifluormethylpyridinu. Po ukončení přidávání se směs míchá další dvě hodiny při teplotě refluxu, potom se ochladí a zředí 100 ml ethylacetátu. Pevný podíl se oddělí, promyje se ethylacetátem a odloží. Filtrát se zpracuje s vodou, takže se vytvoří dvě fáze. Vodná fáze se oddělí a extrahuje dvakrát ethylacetátem. Spojené organické fáze se nakonec promyjí vodou, suší se nad síranem sodným a filtrují se přes silikagel. Výtěžek: 6,7 g (84 %) bezbarvé pevné látky.

¹H-NMR (270 MHz, v CDCl₃): δ [ppm] 2,93(s,3H), 3,90(s,2H), 6,74(d,1H), 7,30(d,1H), 7,53 (dd,1H), 7,99(s,1H), 8,79(s,1H), 9,42(s,1H).

Příklad 10

7-(3-Chlor-5-trifluormethylpyridin-2-yl)-1,2,3,4-tetrahydro-4-methyl-1-(2-propin-1-yl)chinoxalin-2-on (tabulka 7, sloučenina č. Ik.01)

Roztok 2,0 g 7-(3-Chlor-5-trifluormethylpyridin-2-yl)-1,2,3,4-tetrahydro-4-methylchinoxalin-2-onu ve 35 ml dimethylformamidu se přikape k suspenzi 0,2 g 80% hmotn.

hydridu sodného ve 35 ml bezvodého dimethylformamidu. Po 15 minutách míchání se k reakční směsi přidá 0,73 g propargylbromidu. Po 18 hodinách při 23 °C se reakční směs nalije do 300 ml ledové vody a extrahuje se třikrát vždy 100 ml terc.butylmethyletheru, potom se spojené organické fáze promyje dvakrát vždy 100 ml vody, suší se nad síranem sodným a zahustí. Čištění surového produktu se provede chromatografií na silikagelu (eluent: cyklohexan/ethylacetát). Výtěžek: 1,1 g (49 %) bezbarvých krystalů; t.t. 128 až 129 °C.

Příklad 11

6-(3-Chlor-5-trifluormethylpyridin-2-yl)-2-isopropoxy-chinoxalin a

7-(3-Chlor-5-trifluormethylpyridin-2-yl)-2-isopropoxy-chinoxalin

Příprava se provede podle následujícího reakčního schematu:



1. stupeň reakce:

2-(4-Amino-3-nitrofenyl)-3-chlor-5-trifluormethylpyridin

Roztok 50,0 g 3-chlor-2-(4-fluor-3-nitrofenyl)-5-trifluormethylpyridinu ve 200 ml tetrahydrofuranu se zpracuje se 200 g 25% hmotn. vodného roztoku amoniaku. Po míchání při 23 °C po tři dny se tetrahydrofuran odstraní destilací, potom se produkt krystaluje. Krystaly se oddělí, promyjí se vodou a suší ve vakuové sušárně. Výtěžek: 48,7 g (98 %) bezbarvých krystalů; t.t. 126 až 127 °C.

2. stupeň reakce:

2-(3,4-Diaminofenyl)-3-chlor-5-trifluormethylpyridin

Podobným způsobem jako při přípravě 3-chlor-2-(3-amino-4-hydroxyfenyl)-5-trifluormethylpyridinu popsané výše se za použití 48,7 g 2-(4-amino-3-nitrofenyl)-3-chlor-5-trifluormethylpyridinu, 25,7 g železného prášku, 276 ml methanolu a 138 ml ledové kyseliny octové získá po konečném míchání v malém množství etheru. 31,4 g bezbarvých krystalů. Výtěžek: 71 %.

$^1\text{H-NMR}$ (270 MHz, v d^6 -dimethylsulfoxidu): δ [ppm] = 4,67 (s, 2H), 5,04 (s, 2H), 6,60 (d, 1H), 7,01 (dd, 1H), 7,10 (d, 1H), 8,38 (s, 1H), 8,90 (s, 1H).

3. stupeň reakce:

6-(3-Chlor-5-trifluormethylpyridin-2-yl)-1,2-dihydro-chinoxalin-2-on a
7-(3-chlor-5-trifluormethylpyridin-2-yl)-1,2-dihydro-chinoxalin-2-on

Směs 10,0 g

2-(3,4-diaminofenyl)-3-chlor-5-trifluormethylpyridinu, 5,7 g 50% hmotn. vodného roztoku kyseliny šťavelové, 100 ml ethanolu a 50 ml ledové kyseliny octové se míchá při 23 °C 2,5 hodiny. Pevný vzniklý podíl se oddělí, promyje se ethanolem a suší. Po zahuštění poskytne filtrát další množství produktu. Celkový výtěžek: 87 % (9,9 g bezbarvých krystalů); poměr isomerů podle $^1\text{H-NMR}$ = asi 1:1).

$^1\text{H-NMR}$ (270 MHz. v d^6 -dimethylsulfoxidu): δ [ppm] = 7.46(d,1H), 7.62-7.70(m,2H), 7.89-7.99(m,2H), 8.18-8.28(m,3H), 8.62(s,1H), 8.67(s,1H), 9.07(s,1H), 9.10(s,1H), 12.7(s,2H).

4.stupeň reakce:

6-(3-Chlor-5-trifluormethylpyridin-2-yl)-2-isopropoxy-chinoxalin a

7-(3-chlor-5-trifluormethylpyridin-2-yl)-2-isopropoxy-chinoxalin

Roztok 9,9 g

6-(3-chlor-5-trifluormethylpyridin-2-yl)-1,2-dihydro-chinoxalin-2-onu a

7-(3-chlor-5-trifluormethylpyridin-2-yl)-1,2-dihydro-chinoxalin-2-onu získaného ve 3.stupni ve 200 ml

dimethylformamidu se přikape k suspenzi 1,2 g hydridu sodného v 50 ml dimethylformamidu. Po 15 minutách míchání se ke směsi přidá 8.0 g isopropyljodidu. Reakční směs se pak míchá při 80 °C 6 hodin a při 23 °C 64 hodin. Po opatrném přidavku 500 ml vody se směs extrahuje třikrát vždy 200 ml

terc.butylmethyletheru, potom se spojené organické fáze promyjí dvakrát vždy 200 ml vody, suší se nad síranem sodným a zahustí se. Zbytek se pak chromatografuje na silikagelu za použití cyklohexanu/ethylacetátu (98:2). Oba produkty se

rekrytalují z n-hexanu.

Frakce 1: 1,3 g bezbarvých krystalů, t.t. 92 až 93 .

$^1\text{H-NMR}$ (270 MHz, v CDCl_3): δ [ppm] = 1,45(d,6H), 5,56(h, 1H), 7,91(d,1H), 8,04–8,09(m,2H), 8,45–8,49(m,2H), 8,09(s,1H).

Tato sloučenina byla přiřazena první uvedené struktuře v názvu.

Frakce 2: 0,9 g bezbarvých krystalů, t.t. 99 až 100 °C.

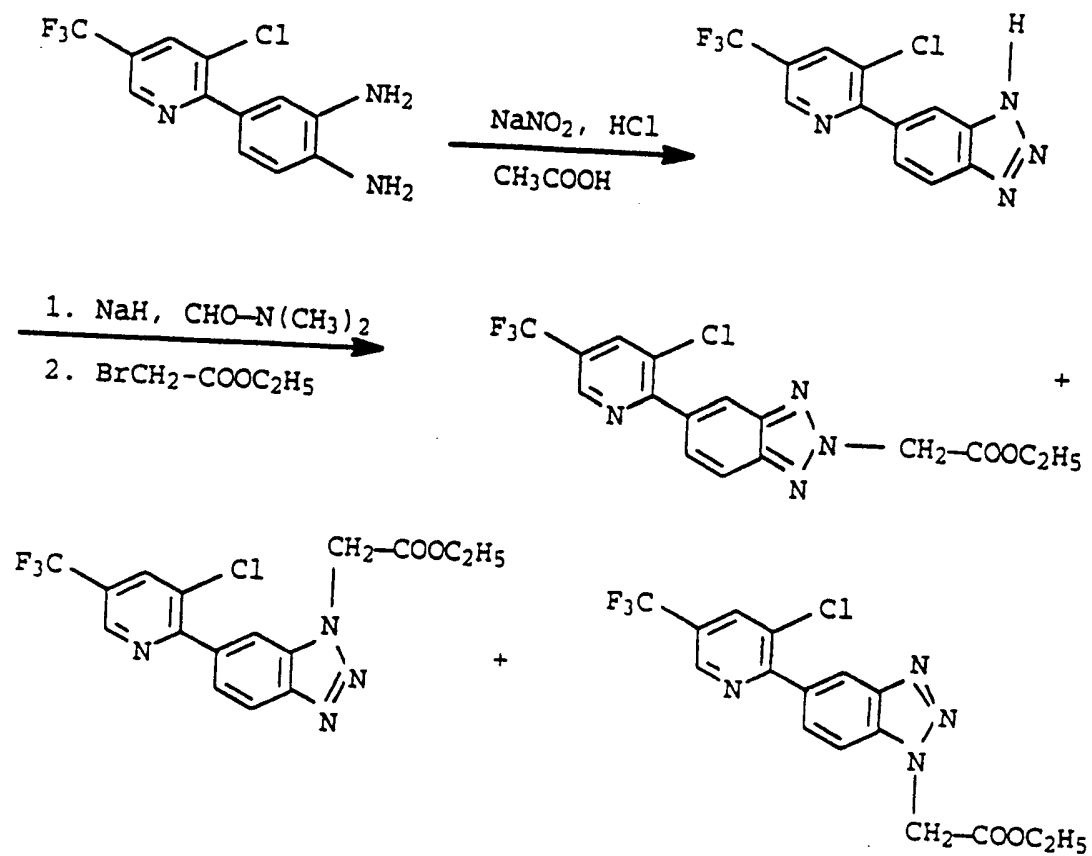
$^1\text{H-NMR}$ (270 MHz, v CDCl_3): δ [ppm] = 1,45(d,6H), 5,56(h,1H), 7,92(dd,1H), 8,10–8,13(m,2H), 8,25(d,2H), 8,48(s,1H), 8,91(s,1H).

Tato sloučenina byla přiřazena druhé uvedené struktuře v názvu.

Příklad 12

5-(3-Chlor-5-trifluormethylpyridin-2-yl)-2-ethoxykarbonylmethylbenzotriazol (tabulka 12, sloučenina č. Ig.01), a
6-(3-chlor-5-trifluormethylpyridin-2-yl)-1-ethoxykarbonylmethylbenzotriazol (tabulka 13, sloučenina č.Ie.01) a
5-(3-chlor-5-trifluormethylpyridin-2-yl)-1-ethoxykarbonylmethylbenzotriazol (tabulka 11, sloučenina č.If.03)

Příprava se provede podle následujícího reakčního schématu:



1. stupeň reakce:

5-(3-chlor-5-trifluormethylpyridin-2-yl)benzotriazol

8 ml koncentrované kyseliny chlorovodíkové a roztok 2,64 g dusitanu sodného v 8 ml vody se přikape za míchání a chlazení ledem při 0 až 5 °C k roztoku 10,0 g 2-(3,4-diaminofenyl)-3-chlor-5-trifluormethylpyridinu ve 100

ml ledové kyseliny octové. Po ukončení přidávání se reakční směs nechá ohřát na asi 23 °C, míchá se dalších 30 minut a pak se zpracuje se 300 ml vody. Vzniklé krystaly se oddělí, promyjí se vodou a suší se za sníženého tlaku. Výtěžek: 8,8 g bezbarvých krystalů.

$^1\text{H-NMR}$ (270 MHz, v d^6 -dimethylsulfoxidu: δ [ppm] = 7,80(d,1H), 8,06(d,1H), 8,34(s,1H), 8,67(s,1H), 9,08(s,1H), 16(s,br.).

2.stupeň reakce:

5-(3-Chlor-5-trifluormethylpyridin-2-yl)-2-ethoxykarbonylmethylbenzotriazol.

6-(3-chlor-5-trifluormethylpyridin-2-yl)-1-ethoxykarbonylmethylbenzotriazol a

5-(3-chlor-5-trifluormethylpyridin-2-yl)-1-ethoxykarbonylmethylbenzotriazol

0.5 g hydridu sodného (80% hmotn. suspenze v minerálním oleji) ve 25 ml bezvodého dimethylformamidu se zpracuje po kapkách s roztokem 4,4 g 5-(3-chlor-5-trifluormethylpyridin-2-yl)benzotriazolu ve 25 ml dimethylformamidu. PO 15 min míchání se přikape 2,6 g ethylbromacetátu a potom se směs míchá při 23 °C 20 hodin. Směs se pak nalije do 200 ml vody. Po extrakci třikrát vždy 100 ml terc.butylmethyletheru se spojené fáze promyjí 100 ml vody, suší se nad síranem sodným a zahustí. Olejovitý zbytek se čistí pomocí chromatografie na silikagelu (eluent: cyklohexan/ethylacetát = 6:1). Získá se postupně (aniž by byly brány v úvahu směsné frakce): 1,0 g 5-(3-chlor-5-trifluormethylpyridin-2-yl)-2-ethoxykarbonylmethylbenzotriazolu; t.t. 127 až 129 °C.

$^1\text{H-NMR}$ (270 MHz, v CDCl_3): δ [ppm] = 1,29(t,3H), 4,30(q,2H),

5,56(s,2H), 7,79(d,1H), 8,08(s,1H), 8,34(s,1H), 8,88(s,1H).
1,2 g 6-(3-chlor-5-trifluormethylpyridin-2-yl)-1-ethoxykar-
bonylmethylbenzotriazolu; t.t. 107 až 108 °C.

¹H-NMR (270 MHz, v CDCl₃): δ [ppm] = 1,27(t,3H), 4,25(q,2H),
5,48(s,2H), 7,82(d,1H), 7,93(s,1H), 8,09(s,1H), 8,20(d,1H),
8,89(s,1H).

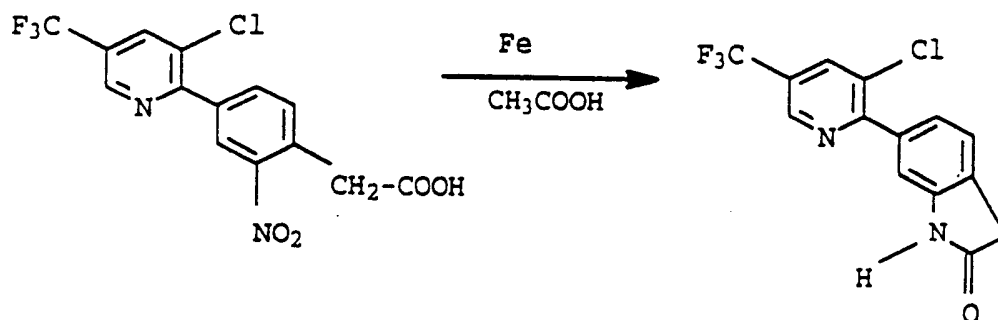
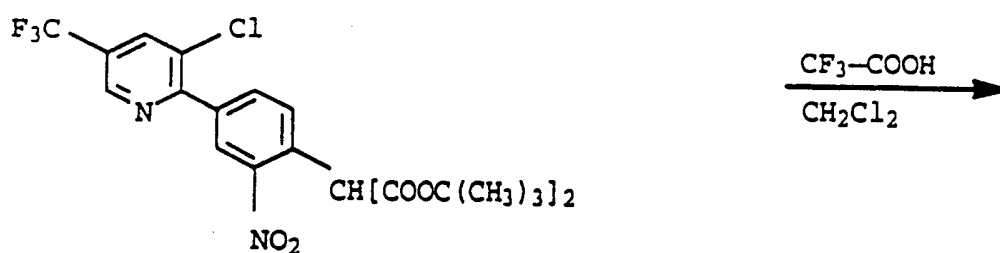
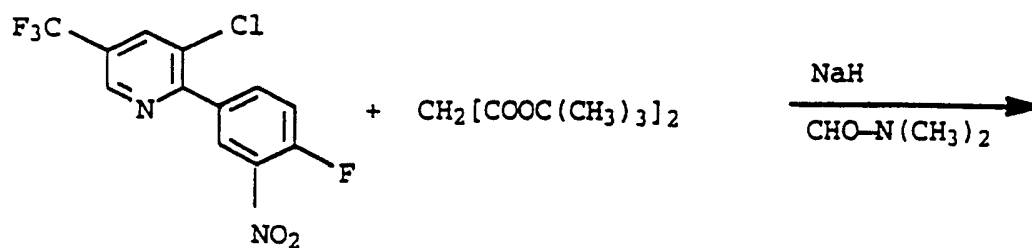
1,15 g 5-(3-chlor-5-trifluormethylpyridin-2-yl)-1-ethoxy-
karbonylmethylbenzotriazolu; t.t. 123 až 124 °C.

¹H-NMR (270 MHz, v CDCl₃): δ [ppm] = 1,28(t,3H), 4,27(q,2H),
5,47(s,2H), 7,60(d,1H), 8,10(s,1H), 8,57(s,1H), 8,90(s,1H).

Příklad 13

6-(3-Chlor-5-trifluormethyl-2-pyridyl)-2,3-dihydroindol-2-on
(tabulka 4, sloučenina č. Id.01)

Příprava se provede podle následujícího reakčního
schematu:



1. stupeň reakce:

3-Chlor-2-[4-(bis-[1,1-dimethylethoxykarbonyl]methyl)-3-nitrofenyl]-5-trifluormethylpyridin

0,9 g 80% hmotn. suspenze hydridu sodného v minerálním oleji se přidá k 10 ml bezvodého dimethylformamidu. K této směsi se přikape roztok 5,1 g di-terc.butylmalonátu ve 20 ml dimethylformamidu, potom se míchá 20 minut. Přikape se roztok 7,5 g 3-chlor-2-(4-fluor-3-nitrofenyl)-5-trifluormethylpyridinu ve 20 ml dimethylformamidu. Reakční směs se míchá při 23 °C

20 hodin a při 80 °C 5 hodin. Ochlazená reakční směs se pak nalije do 200 ml ledové vody. Vodná fáze se extrahuje třikrát vždy 100 ml terc.butylmethyletheru. Spojené organické fáze se promyjí 100 ml vody, suší se nad síranem sodným a zahustí. Výtěžek: 10.8 g (79 %) bezbarvého oleje.

$^1\text{H-NMR}$ (270 MHz, v CDCl_3): δ [ppm] = 1.51(s,18H), 5.20(s,1H), 7.72(d,1H), 8.09–8.17(m,2H), 8.56(s,1H), 8.92(s,1H).

2.stupeň reakce:

3-Chlor-2-(4-hydroxykarbonylmethyl)-3-nitrofenyl]-5-trifluormethylpyridin

16 ml kyseliny trifluoroctové se přikape k roztoku 10,2 g 3-chlor-2-[4-bis-[1.1-dimethylethoxykarbonyl]methyl)-3-nitrofenyl]-5-trifluormethylpyridinu ve 100 ml bezvodého dichlormethanu. Po míchání při 23 °C po 65 hodin se methylenchlorid odstraní destilací. Zbytek se rozpustí ve 100 ml etheru. potom se etherová fáze extrahuje třikrát vždy 50 ml vody, suší se nad síranem sodným a zahustí. Surový produkt se míchá s n-hexanem/etherem (9:1). Výtěžek: 5,1 g (72 %) bezbarvých krystalů.

$^1\text{H-NMR}$ (270 MHz, v CDCl_3): δ [ppm] = 4.17(s,2H), 7.51(d,1H), 8.07(dd,1H), 8.13(s,1H), 8.60(d,1H), 8.93(s,1H), 10,15(br.,1H).

3.stupeň reakce:

6-(3-Chlor-5-trifluormethyl-2-pyridyl)-2,3-dihydroindol-2-on

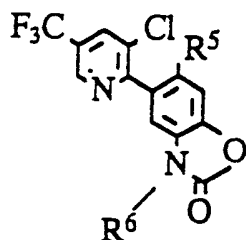
5,1 g 3-chlor-2-(4-hydroxykarbonylmethyl-3-nitrofenyl)-5-trifluormethylpyridinu se po částech k suspenzi 2,4 g

železného prášku ve směsi 26 ml methanolu a 13 ml ledové kyseliny octové. Po zahřívání na teplotu refluxu po 3 hodiny se směs zředí 100 ml ethylacetátu. Pevný podíl se pak oddělí a promyje se ethylacetátem. Ethylacetátová fáze se promyje dvakrát malým množstvím vody, suší se nad síranem sodným a zahustí se. Chromatografií na silikagelu za použití n-hexanu/ethylacetátu (1:1) se získá 2,85 g bezbarvého oleje. Výtěžek: 64 %.

$^1\text{H-NMR}$ (250 MHz, v d^6 -dimethylsulfoxidu): δ [ppm] = 3,56(s,2H), 7,14 (s,1H), 7,32(d,1H), 7,37(d,1H), 8,57(s,1H), 9,04(s,1H), 10,55(s,1H).

Následující tabulky 1 až 14 ještě představují sloučeniny vzorce I, které byly připraveny nebo mohou být připraveny některým z popsaných způsobů:

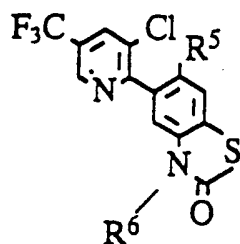
Tabulka :



Ia {R¹, R³=H;
R²=CF₃; R⁴=Cl}

č.	R ⁵	R ⁶	t. t. \ IR [cm ⁻¹] \ ¹ H-NMR [ppm]
Ia.01	H	-CH ₂ -C≡C-H	145-146°C
Ia.02	H	-CH ₂ -CH=CH ₂	91-93°C
Ia.03	H	-CH(CH ₃)-C≡C-H	
Ia.04	H	-CH(CH ₃)-CH=CH ₂	
Ia.05	F	-CH ₂ -C≡C-H	
Ia.06	F	-CH ₂ -CH=CH ₂	
Ia.07	F	-CH(CH ₃)-C≡C-H	
Ia.08	F	-CH(CH ₃)-CH=CH ₂	
Ia.09	Cl	-CH ₂ -C≡C-H	
Ia.10	Cl	-CH ₂ -CH=CH ₂	
Ia.11	Cl	-CH(CH ₃)-C≡C-H	
Ia.12	H	-H	210-212°C
Ia.13	H	-CH ₃	171-172°C
Ia.14	H	-CH(CH ₃) ₂	1.60 (d,6H), 4.62 (h,1H), 7.33 (d,1H), 7.56 (d,1H), 7.59 (dd,1H), 8.10 (s,1H), 8.88 (s,1H)
Ia.15	H	-CH ₂ -CO-OC ₂ H ₅	96-98°C
Ia.16	H	-CH(CH ₃)-CO-OC ₂ H ₅	1.25 (t,3H), 1.80 (d,3H), 4.25 (q,2H), 5.13 (q,1H), 7.35 (d,1H), 7.43 (d,1H), 7.60 (dd,1H), 8.07 (s,1H), 8.85 (s,1H)

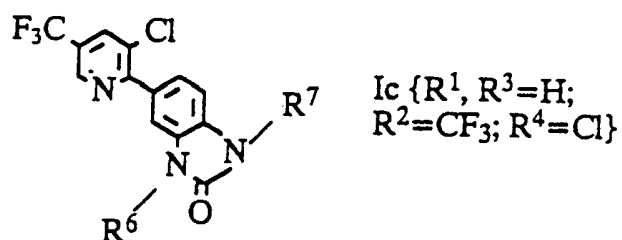
Tabulka 2



Ib {R¹, R³=H; R²=CF₃;
R⁴=Cl}

č.	R ⁵	R ⁶	t. t. \ IR [cm ⁻¹] \ ¹ H-NMR [ppm]
Ib.01	H	-CH ₂ -C≡C-H	
Ib.02	H	-CH ₂ -CH=CH ₂	
Ib.03	H	-CH(CH ₃)-C≡C-H	
Ib.04	H	-CH(CH ₃)-CH=CH ₂	
Ib.05	F	-CH ₂ -C≡C-H	
Ib.06	F	-CH ₂ -CH=CH ₂	
Ib.07	F	-CH(CH ₃)-C≡C-H	
Ib.08	F	-CH(CH ₃)-CH=CH ₂	
Ib.09	Cl	-CH ₂ -C≡C-H	
Ib.10	Cl	-CH ₂ -CH=CH ₂	
Ib.11	Cl	-CH(CH ₃)-C≡C-H	

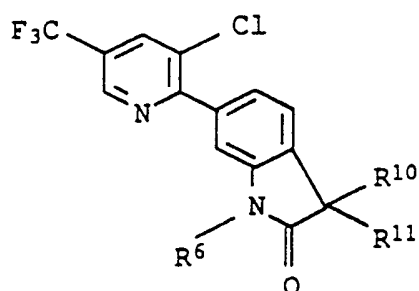
Tabulka 3



č.	R ⁷	R ⁶	t. t. Δ IR [cm ⁻¹] \ ¹ H-NMR [ppm]
Ic.01	-CH(CH ₃) ₂	-H	192-193°C
Ic.02	-CH(CH ₃) ₂	-CH ₃	108-109°C
Ic.03	-CH(CH ₃) ₂	-CH ₂ -C ₂ H ₅	74-77°C
Ic.04	-CH(CH ₃) ₂	-CH(CH ₃) ₂	124-126°C
Ic.05	-CH(CH ₃) ₂	-CH ₂ -CH=CH ₂	85-87°C
Ic.06	-CH(CH ₃) ₂	-CH ₂ -C≡CH	109-111°C
Ic.07	-CH(CH ₃) ₂	$\begin{array}{c} \text{O} \\ \diagup \quad \diagdown \\ -\text{CH}_2-\text{CH}-\text{CH}_2 \end{array}$	111°C
Ic.08	-CH(CH ₃) ₂	-CH ₂ -CO-OC ₂ H ₅	125-127°C
Ic.09	-CH(CH ₃) ₂	-CH(CH ₃)CO-OC ₂ H ₅	1.22 (t,3H), 1.59 (d,6H), 1.75 (d,3H), 4.21 (q,2H), 4.78 (h,1H), 5.30 (q,1H), 7.29 (d,1H), 7.48 (d,1H), 7.57(dd,1H), 8.04 (s,1H), 8.84(s,1H)
Ic.10	-CH(CH ₃) ₂	-CH ₂ -CN	158-159°C
Ic.11	-CH(CH ₃) ₂	-CH(CH ₃)-CN	154-156°C
Ic.12	-H	-H	> 300°C in d ⁶ -DMSO: 7.08 (d,1H), 7.37 (d,1H), 7.42 (dd,1H), 8.52 (d,1H), 9.01 (d,1H), 10.83 (s,1H), 10.92 (s,1H)
Ic.13	-H	-CH ₂ -CO-OC ₂ H ₅	241-242°C
Ic.14	-CH ₃	-CH=CH=CH ₂	179-180°C
Ic.15	-CH ₃	-CH ₂ -C≡CH	176-177°C
Ic.16	-CH ₃	-CH ₂ -CH=CH ₂	147-148°C

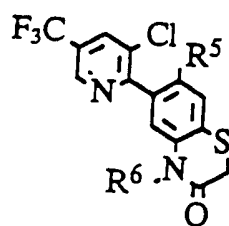
č.	R ⁷	R ⁶	t. t. \ IR [cm ⁻¹] \ ¹ H-NMR [ppm]
Ic.17	-CH ₃	-CH ₂ -CO-OCH ₃	185-186°C
Ic.18	-CH ₃	-CH ₂ -CO-OC ₂ H ₅	145-146°C
Ic.19	-CH ₃	-CH(CH ₃)-CO-OCH ₃	143-144°C
Ic.20	-CH ₃	-CH(CH ₃)-CO-OC ₂ H ₅	106-107°C
Ic.21	-H	-CH ₂ -CO-OC ₂ H ₅	241-242°C
Ic.22	-CH ₃	-H	256-258°C
Ic.23	-CH ₂ -C≡CH	-CH ₂ -C≡CH	175-177°C
Ic.24	-CH ₂ -CO-OC ₂ H ₅	-CH ₂ -CO-OC ₂ H ₅	165-166°C

Tabulka 4

Id {R¹, R³=H; R²=CF₃; R⁴ = Cl}

č.	R ⁶	R ¹⁰	R ¹¹	t. t. \ IR [cm ⁻¹] \ ¹ H-NMR [ppm]
Id.01	-H	H	H	in d ⁶ -DMSO: δ = 3.56 (s,2H), 7.14 (s,1H), 7.32 (d,1H), 7.37 (d,1H), 8.57 (s,1H), 9.04 (s,1H), 10.55 (s,1H)
Id.02	-CO-CH ₃	-CH ₂ -CH ₂ -		163-164°C
Id.03	-H	-CH ₂ -CH ₂ -		1.55-1.65 (m,2H), 1.79-1.87 (m,2H), 6.93 (d,1H), 7.37 (s,1H), 7.42 (d,1H), 8.04 (s,1H), 8.84 (s,1H), 9.04 (s,1H)
Id.04	-CH ₂ -C≡CH	-CH ₂ -CH ₂ -		131-133°C

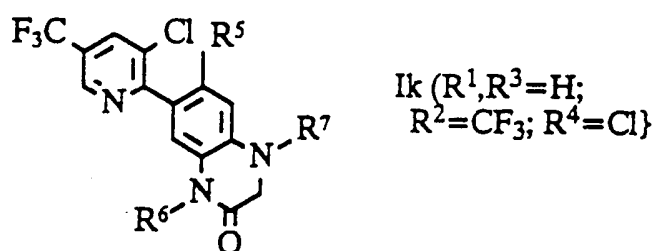
Tabulka 6



II ($R^1, R^3 = H$; $R^2 = CF_3$;
 $R^4 = Cl$)

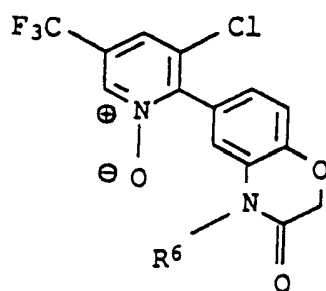
č.	R^5	R^6	t. t. λ IR [cm^{-1}] \ ^1H -NMR [ppm]
II.01	H	$-CH_2-C \equiv C-H$	159-160°C
II.02	H	$-CH_2-CH=CH_2$	
II.03	H	$-CH(CH_3)-C \equiv C-H$	
II.04	H	$-CH(CH_3)-CH=CH_2$	
II.05	F	$-CH_2-C \equiv C-H$	
II.06	F	$-CH_2-CH=CH_2$	
II.07	F	$-CH(CH_3)-C \equiv C-H$	
II.08	F	$-CH(CH_3)-CH=CH_2$	
II.09	Cl	$-CH_2-C \equiv C-H$	
II.10	Cl	$-CH_2-CH=CH_2$	
II.11	Cl	$-CH(CH_3)-C \equiv C-H$	

Tabulka 7



č.	R^5	R^7	R^6	$t, t \backslash IR [cm^{-1}] \backslash$ $^1H-NMR [ppm]$
Ik.01	H	CH ₃	-CH ₂ -C≡C-H	128-129°C
Ik.02	H	CH ₃	-CH ₂ -CH=CH ₂	234-235°C
Ik.03	H	CH ₃	-CH(CH ₃)-C≡C-H	
Ik.04	H	CH ₃	-CH(CH ₃)-CH=CH ₂	
Ik.05	F	CH ₃	-CH ₂ -C≡C-H	
Ik.06	F	CH ₃	-CH ₂ -CH=CH ₂	
Ik.07	F	CH ₃	-CH(CH ₃)-C≡C-H	
Ik.08	F	CH ₃	-CH(CH ₃)-CH=CH ₂	
Ik.09	H	H	-CH ₂ -C≡C-H	188-190°C
Ik.10	F	H	-CH ₂ -C≡C-H	
Ik.11	Cl	CH ₃	-CH ₂ -C≡C-H	
Ik.12	H	CH ₃	H	2.93(s,3H), 3.90(s,2H), 6.74 (d,1H), 7.30 (d,1H), 7.53(dd,1h), 7.99(s,1H), 8.79(s,1H), 9.42(s,1H)

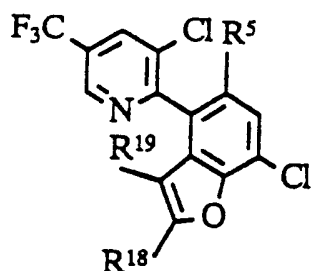
Tabulka 8



Ih {R¹, R³=H;
R²=CF₃; R⁴=Cl}

№.	R ⁶	tt. \ IR [cm ⁻¹] \ ¹ H-NMR [ppm]
Ih.101	-CH ₂ -C≡C-H	2.29 (t, 1H), 4.69 (d, 2H), 4.72 (s, 2H), 7.18 (s, 2H), 7.33 (s, 1H), 7.62 (s, 1H), 8.57 (s, 1H); 194-195°C

Tabulka 9

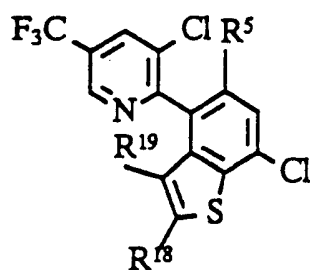


Im {R¹, R³=H;
R²=CF₃; R⁴, R¹⁷=Cl;
X = O}

№.	R ⁵	R ¹⁸	R ¹⁹	tt. \ IR [cm ⁻¹] \ ¹ H-NMR [ppm]
Im.01	H	H	H	250 MHz- ¹ H-NMR in CDCl ₃ : 2.50 (s, 3H), 6.43 (s, 1H), 7.32 (d, 1H), 7.44 (d, 1H), 8.09 (s, 1H), 8.87 (s, 1H)
Im.02	H	CH ₃	H	
Im.03	H	H	CH ₃	
Im.04	H	CH ₃	CH ₃	
Im.05	F	H	H	
Im.06	F	CH ₃	H	
Im.07	F	H	CH ₃	
Im.08	F	CH ₃	CH ₃	
Im.09	Cl	H	H	

č.	R ⁵	R ¹⁸	R ¹⁹	IR [cm ⁻¹] 1H-NMR [ppm]
Im.10	Cl	CH ₃	H	
Im.11	Cl	H	CH ₃	

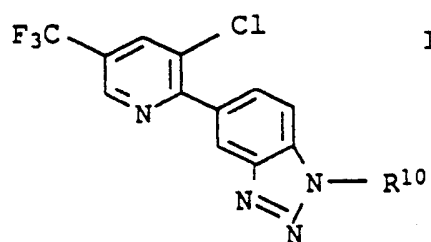
Tabulka 10



Im (R¹, R³=H; R²=CF₃;
R⁴, R¹⁷ = Cl; X = S)

č.	R ⁵	R ¹⁸	R ¹⁹	IR [cm ⁻¹] 1H-NMR [ppm]
Im.12	H	H	H	
Im.13	H	CH ₃	H	
Im.14	H	H	CH ₃	
Im.15	H	CH ₃	CH ₃	
Im.16	F	H	H	
Im.17	F	CH ₃	H	
Im.18	F	H	CH ₃	
Im.19	F	CH ₃	CH ₃	
Im.20	Cl	H	H	
Im.21	Cl	CH ₃	H	
Im.22	Cl	H	CH ₃	

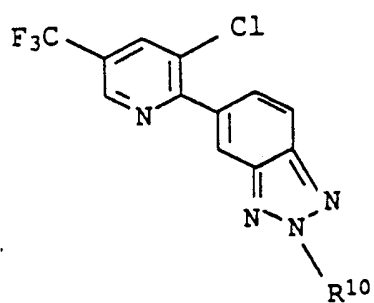
Tabulka 11



If ($R^1, R^3, R^5 = H$; $R^2 = CF_3$;
 $R^4 = Cl$)

č.	R^{10}	tt.č. IR [cm^{-1}] č. ^1H -NMR [ppm]
If.01	$-CH(CH_3)_2$	119-120°C
If.02	$-CH_2-C_6H_5$	176-177°C
If.03	$-CH_2-CO-OC_2H_5$	123-124°C

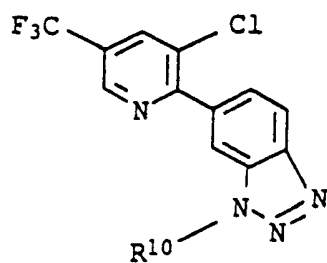
Tabulka 12



Ig ($R^1, R^3, R^5 = H$;
 $R^2 = CF_3$;
 $R^4 = Cl$)

č.	R^{10}	tt.č. IR [cm^{-1}] č. ^1H -NMR [ppm]
Ig.01	$-CH_2-CO-OC_2H_5$	127-129°C

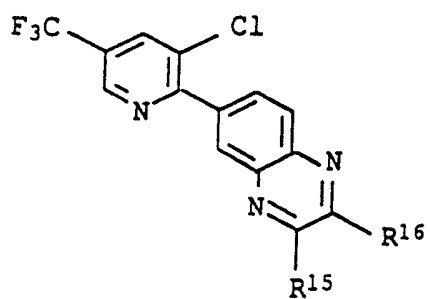
Tabulka 13



Ie ($R^1, R^3, R^5 = H$; $R^2 = CF_3$;
 $R^4 = Cl$)

č.	R^{10}	t t. č. IR [cm^{-1}] č. ^1H -NMR [ppm]
Ie.01	$-CH_2-CO-OC_2H_5$	107-108°C

Tabulka 14



I1 {R¹, R³, R⁵=H; R²=CF₃;
R⁴=Cl}

Č.	R ¹⁵	R ¹⁶	t.t.
I1.01	-O-CH(CH ₃) ₂	-H	99-100°C
I1.02	-H	-O-CH(CH ₃) ₂	92-93°C

Aplikační příklady herbicidní účinnosti

Herbicidní účinnost substituovaných 2-fenylpyridinů bylo možno demonstrovat pomocí testů ve skleníku:

Jako kultivační nádoby byly použity plastové květináče, obsahující jako substrát jílovitý písek, obsahující asi 3,0 % humusu. Semena testovaných rostlin byla vyseta odděleně podle druhů.

Při preemergentním ošetření byly účinné sloučeniny suspendovány nebo emulgovány ve vodě a aplikovány přímo na osivo pomocí jemně dispergujících trysek. Nádoby byly slabě postříkány pro promotování klíčení a růstu a potom pokryty transparentními plastovými kryty do zakořenění rostlin. Tyto kryty vyvolávají jednotné klíčení testovaných rostlin a nejsou nežádoucím způsobem ovlivněny účinnými sloučeninami.

Pro účely post-emergentního ošetření, rostliny vyrostly, podle formy růstu, napočátku do výšky od 3 do 15 cm a pouze pak byly ošetřeny účinnými sloučeninami suspendovanými nebo emulgovanými ve vodě. pro tento účel byly testované rostliny buď vysety přímo a kultivovány ve stejných nádobách nebo byly nejprve vysety jako a přesazeny do testových nádob několik dnů před ošetřením. Aplikační dávka pro post-emergentní ošetření byla 0,0625 nebo 0,0313 kg/ha úč.složky.

Rostliny byly udržovány při teplotách 10 až 25 °C nebo 20 až 35 °C. Doba testu činila 2 až 4 týdny. Během této doby měly rostliny sledovány a jejich reakce na jednotlivá ošetření byla hodnocena.

Hodnocení byla provedena pomocí stupnice 0 až 100, kde

100 znamená žádnou germinaci rostlin nebo úplnou destrukci alespoň nadzemních částí a 0 znamená žádné poškození nebo normální průběh růstu.

V testu ve skleníku byly použity následující druhy:

botanický název	obecný název
<i>Abutilon theophrasti</i>	abutilon
<i>Ipomoea subspacies</i>	povíjnice
<i>Solanum nigrum</i>	lilek černý
<i>Stellaria media</i>	ptačinec

Při aplikační dávce 0,0625 nebo 0,0313 kg/ha, byly velmi účinně kontrolovány nežádoucí širokolisté rostliny post-emergentně za použití sloučeniny č.Ih.001.

Aplikační příklady růstově regulační aktivity

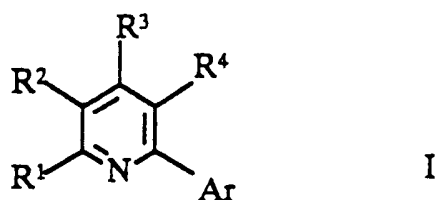
Použité testované rostliny byly mladé, 4-listové (bez děložních lístků) rostliny bavlníku odrůdy Stoneville 825, které vyrostly za skleníkových podmínek (rel. atmosférická vlhkost 50 až 70 %; den/noc teplota 27/20 °C).

Mladé bavlníkové rostliny byly podrobeny ošetření na list do skapávání pomocí vodných přípravků účinných sloučenin (za přídatku 0,15 % hmotn. mastného alkohol alkoxylátu Plurafac LF 700, vztaženo na postřikovou kapalinu). Množství aplikované vody odpovídalo 1000 l/ha. Po 13 dnech byl stanoven počet shozených listů a byl vypočten stupeň defoliace v %. U neošetřených kontrolních rostlin se neobjevil žádná spadlý list.

70 21-96

P A T E N T O V É N A R O K Y

1. Substituované 2-fenylpyridiny obecného vzorce I



kde substituenty mají následující významy:

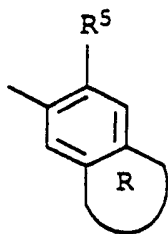
R^1 , R^3 a R^4 jsou nezávisle na sobě vodík, halogen,
 C_1 - C_4 -alkyl, C_1 - C_4 -halogenalkyl, C_1 - C_4 -alkoxy- C_1 - C_4 -alkyl,
 C_1 - C_4 -alkoxy, C_1 - C_4 -alkoxy- C_1 - C_4 -alkoxy, hydroxyl,
 C_1 - C_4 -halogenalkoxy, (C_1 - C_5 -alkyl)karbonyloxy-,
(C_1 - C_5 -halogenalkyl)karbonyloxy, SH, C_1 - C_4 -alkylthio,
 C_1 - C_4 -alkylsulfinyl, C_1 - C_4 -alkylsulfonyl,
 C_1 - C_4 -halogenalkylthio, C_1 - C_4 -halogenalkylsulfinyl,
 C_1 - C_4 -halogenalkylsulfonyl, formyl, kyano, hydroxykarbonyl,
(C_1 - C_4 -alkoxy)karbonyl, C_1 - C_4 -alkoxy-(C_1 - C_4 -alkoxy)karbonyl,
(C_1 - C_4 -halogenalkoxy)karbonyl,
(C_1 - C_4 -alkyl)karbonyl, (C_1 - C_4 -halogenalkyl)karbonyl,
 C_1 - C_4 -alkoxy-(C_1 - C_4 -alkyl)karbonyl, $CONH_2C_1-C_4$,
(C_1 - C_4 -alkyl)aminokarbonyl, di(C_1 - C_4 -alkyl)aminokarbonyl,
pyrrolidinylkarbonyl, piperidinylkarbonyl, morfolinylkarbonyl,
nitro, amino, C_1 - C_4 -alkylamino, di(C_1 - C_4 -alkyl)amino,
pyrrolidinyl, piperidinyl, morfolinyl,

PRIL.
VLASTNOSTI
PRŮMYSL. VLASTNOSTI
0 9 6
00510
0 0 8 9 4 7
2. J.

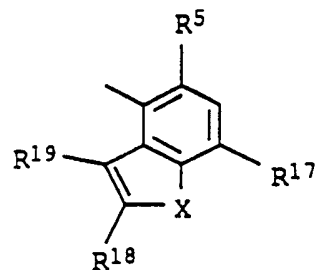
(C₁-C₄-alkyl)karbonylamino, (C₁-C₄-halogenalkyl)karbonylamino nebo C₁-C₄-alkylsulfonylamino;

R² je halogen, kyano, nitro, C₁-C₄-alkyl, C₁-C₄-halogenalkyl, C₁-C₄-alkoxy, C₁-C₄-halogenalkoxy, C₁-C₄-alkylthio, C₁-C₄-halogenalkylthio nebo spolu s R¹ nebo s R² představuje trimethylenový nebo tetramethylenový řetězec;

Ar je radikál



nebo



kde

R⁵ je vodík nebo halogen,

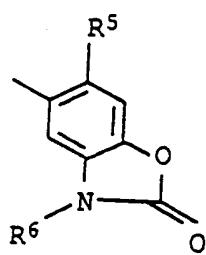
X je kyslík nebo síra,

R¹⁷ je halogen, kyano, nitro, hydroxyl, C₁-C₄-alkoxy nebo trifluormethyl,

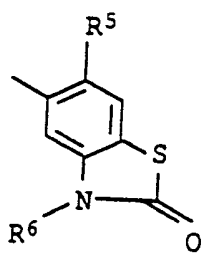
R¹⁸ je vodík, C₁-C₆-alkyl, C₁-C₆-halogenalkyl nebo C₁-C₄-alkoxy-C₁-C₄-alkyl a

R¹⁹ je vodík nebo C₁-C₆-alkyl

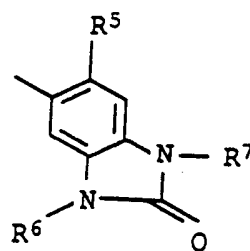
a kde kruh R je kondenzovaný heterocyklický kruh, který spolu s fenylovým kruhem, tvoří jeden z následujících bicyklických kruhů (a) až (f):



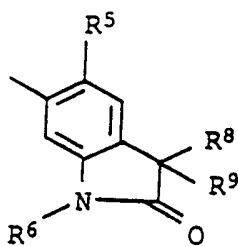
(a)



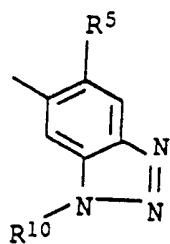
(b)



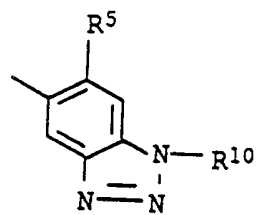
(c)



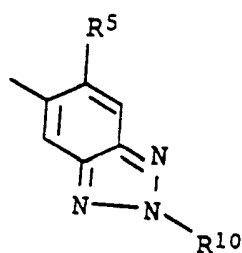
(d)



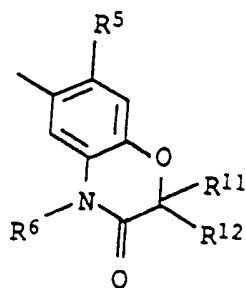
(e)



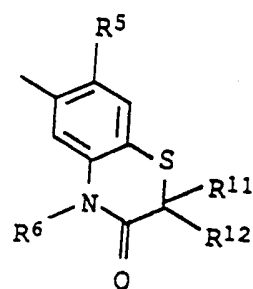
(f)



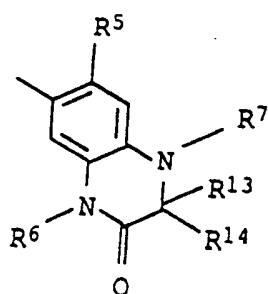
(g)



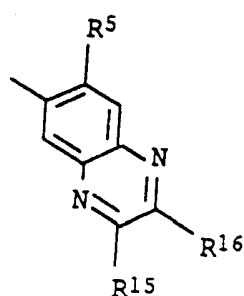
(h)



(i)



(k)



(l)

R^6 , R^7 a R^{10} nezávisle na sobě znamenají vodík, C_1 - C_6 -alkyl, C_2 - C_6 -alkenyl, C_2 - C_6 -alkinyl, C_1 - C_6 -halogenalkyl, C_2 - C_6 -halogenalkyl, C_2 - C_6 -halogenalkinyl, C_1 - C_4 -alkoxy- C_1 - C_4 -alkyl, C_1 - C_4 -alkoxy- C_1 - C_2 -alkoxy- C_1 - C_4 -alkyl, 1-fenyl-propen-3-yl, kyano- C_1 - C_4 -alkyl, C_3 - C_6 -cykloalkyl- C_1 - C_6 -alkyl, (1-methylthiocykloprop-1-yl)-methyl, karboxyl- C_1 - C_4 -alkyl, (C_1 - C_6 -alkoxy)karbonyl- C_1 - C_4 -alkyl, (C_1 - C_6 -halogenalkoxy)karbonyl- C_1 - C_4 -alkyl, C_1 - C_4 -alkoxy-(C_1 - C_2 -alkoxy)karbonyl- C_1 - C_4 -alkyl, (C_1 - C_6 -alkoxy)karbonyl-(C_1 - C_2 -alkoxy)karbonyl- C_1 - C_4 -alkyl, C_3 - C_6 -cykloalkyl-(C_1 - C_2 -alkoxy)karbonyl- C_1 - C_4 -alkyl, C_1 - C_5 -alkylaminokarbonyl- C_1 - C_4 -alkyl, di-(C_1 - C_5 -alkyl)aminokarbonyl- C_1 - C_4 -alkyl, C_3 - C_6 -cykloalkyl,

C₁-C₄-alkylthio-C₁-C₄-alkyl, C₁-C₄-alkylsulfonyl,
 C₃-C₆-alkenyloxy-C₁-C₄-alkyl, C₁-C₈-alkenyloxy-C₁-C₄-alkyl,
 C₁-C₈-alkylkarbonyl, C₁-C₈-alkoxy,
 oxetan-3-yl-oxykarbonyl-C₁-C₄-alkyl,
 thietan-3-yl-oxykarbonyl-C₁-C₄-alkyl, oxetan-3-ylmethyl,
 3-(C₁-C₄-alkyl)-oxetan-3-ylmethyl nebo benzyl, který může být
 nesubstituován nebo může nést jeden až tři radikály, vybrané
 ze skupiny. zahrnující halogen, C₁-C₄-alkyl a C₁-C₄-alkoxy;

R⁸ a R⁹ jsou nezávisle na sobě vodík, C₁-C₄-alkyl,
 hydroxykarbonyl, (C₁-C₄-alkoxy)karbonyl nebo spolu znamenají
 ethylen, propylen, butylen, pentylen nebo hexylen;

R¹¹, R¹², R¹³ a R¹⁴ jsou nezávisle na sobě vodík, halogen,
 C₁-C₆-alkyl, C₁-C₆-halogenalkyl nebo C₁-C₄-alkoxy-C₁-C₄-alkyl;

R¹⁵ a R¹⁶ jsou nezávisle na sobě vodík, chlor, brom,
 C₁-C₈-alkyl, -OR²⁰, -SR²¹ nebo -N(R²²)-R²³,

R²⁰ a R²¹ jsou nezávisle na sobě vodík, C₁-C₈-alkyl,
 C₁-C₈-halogenalkyl, C₄-C₇-cykloalkyl, který na své části může
 nést až tři C₁-C₃-alkylové radikály, C₃-C₆-alkenyl,
 C₅-C₇-cykloalkenyl, který na své části může
 nést až tři C₁-C₃-alkylové radikály, C₃-C₆-halogenalkenyl,
 kyano-C₁-C₈-alkyl, C₃-C₆-alkinyl, C₁-C₄-alkoxy-C₁-C₄-alkyl,
 2-tetrahydrofuranyl-C₁-C₈-alkyl, 3-oxetanyl, 3-thietanyl,
 karboxyl-C₁-C₆-alkyl, (C₁-C₈-alkoxy)-karbonyl-C₁-C₆-alkyl,
 (C₁-C₆-alkoxy)karbonyl-(C₃-C₇-cykloalkyl),
 C₁-C₄-alkoxy(C₁-C₄-alkoxy)karbonyl-C₁-C₆-alkyl,
 cyklopropylmethyl, (1-methylthiocyklo-prop-1-yl)methyl,
 -CH(SH)-COOH, -CH(SH)-CO-(C₁-C₈-alkoxy),
 -CH(C₁-C₈-alkylthio)-COOH,
 -CH(C₁-C₄-alkylthio)-CO-(C₁-C₈-alkoxy), -CH₂-CO-N(R⁹)-R¹⁰,

$-\text{CH}(\text{C}_1\text{-C}_4\text{-alkyl})-\text{CO}-\text{N}(\text{R}^9)-\text{R}^{10}$, $-\text{C}(\text{C}_1\text{-C}_4\text{-alkyl})_2-\text{CO}-\text{N}(\text{R}^9)-\text{R}^{10}$,
 $\text{CH}_2-\text{CO}-\text{N}(\text{R}^9)-\text{SO}_2-(\text{C}_1\text{-C}_4\text{-alkyl})$,
 $-\text{CH}(\text{C}_1\text{-C}_4\text{-alkyl})-\text{CO}-\text{N}(\text{R}^9)-\text{SO}_2-(\text{C}_1\text{-C}_4\text{-alkyl})$,
 $-\text{C}(\text{C}_1\text{-C}_4\text{-alkyl})_2-\text{CO}-\text{N}(\text{R}^9)-\text{SO}_2-(\text{C}_1\text{-C}_4\text{-alkyl})$, $-\text{S}-\text{CO}-\text{NH}_2$,
 $-\text{S}-\text{CO}-\text{N}(\text{C}_1\text{-C}_4\text{-alkyl})-(\text{C}_1\text{-C}_4\text{-alkyl})$,
 $-\text{CH}_2-\text{CO}-\text{O}-(\text{C}_1\text{-C}_6\text{-alkylen})-\text{COOH}$,
 $-\text{CH}_2-\text{CO}-\text{O}-(\text{C}_1\text{-C}_6\text{-alkylen})-\text{CO}-(\text{C}_1\text{-C}_6\text{-alkoxy})$,
 $-\text{C}(\text{C}_1\text{-C}_4\text{-alkyl})_2-\text{CO}-\text{O}-(\text{C}_1\text{-C}_6\text{-alkylen})-\text{COOH}$,
 $-\text{C}(\text{C}_1\text{-C}_4\text{-alkyl})_2-\text{CO}-\text{O}-(\text{C}_1\text{-C}_4\text{-alkylen})-\text{CO}-(\text{C}_1\text{-C}_6\text{-alkoxy})$,
 $-\text{CH}(\text{C}_1\text{-C}_4\text{-alkyl})-\text{CO}-\text{O}-(\text{C}_1\text{-C}_6\text{-alkylen})-\text{COOH}$,
 $-\text{CH}(\text{C}_1\text{-C}_4\text{-alkyl})-\text{CO}-\text{O}-(\text{C}_1\text{-C}_6\text{-alkylen})-\text{CO}-(\text{C}_1\text{-C}_6\text{-alkoxy})$,
 $\text{C}_3\text{-C}_9-(\alpha\text{-alkylalkyliden})\text{iminooxy}-\text{C}_1\text{-C}_6\text{-alkyl}$, fenyl,
 fenyl- $\text{C}_1\text{-C}_6\text{-alkyl}$, fenyl- $\text{C}_3\text{-C}_6\text{-alkenyl}$, fenyl- $\text{C}_3\text{-C}_6\text{-alkinyl}$
 nebo fenoxý- $\text{C}_1\text{-C}_6\text{-alkyl}$, kde fenýlový kruh v každém případě
 může být nesubstituován nebo nést jeden až tři radikály
 vybrané ze skupiny, zahrnující halogen, nitro, kyano,
 $\text{C}_1\text{-C}_4\text{-alkyl}$, $\text{C}_1\text{-C}_4\text{-alkoxy}$, $\text{C}_1\text{-C}_4\text{-alkylthio}$, $\text{C}_1\text{-C}_4\text{-halogenalkyl}$
 a $\text{C}_2\text{-C}_6\text{-alkenyl}$. 5- nebo 6-členný heteroaryl,
 heteroaryl- $\text{C}_1\text{-C}_6\text{-alkyl}$, heteroaryl- $\text{C}_3\text{-C}_6\text{-alkenyl}$,
 heteroaryl- $\text{C}_3\text{-C}_6\text{-alkinyl}$ nebo heteroaryloxy- $\text{C}_1\text{-C}_6\text{-alkyl}$, kde
 heteroaromát v každém případě obsahuje jeden až tři
 heteroatomy vybrané ze skupiny, zahrnující jeden nebo dva
 atomy dusíku a atom kyslíku nebo síry a kde heteroaromát,
 je-li to žádoucí, může dále nést na každém substituovatelném
 kruhovém atomu radikál vybraný ze skupiny, zahrnující
 hydroxyl, halogen, $\text{C}_1\text{-C}_4\text{-alkyl}$, $\text{C}_1\text{-C}_4\text{-alkoxy}$, $\text{C}_1\text{-C}_4\text{-alkylthio}$
 a $\text{C}_1\text{-C}_4\text{-halogenalkyl}$;

R^{22} a R^{23} nezávisle na sobě jsou

vodík, $\text{C}_1\text{-C}_8\text{-alkyl}$, $\text{C}_2\text{-C}_8\text{-alkenyl}$, $\text{C}_3\text{-C}_8\text{-alkinyl}$,
 $\text{C}_1\text{-C}_8\text{-halogenalkyl}$, $\text{C}_1\text{-C}_4\text{-alkoxy}-\text{C}_1\text{-C}_4\text{-alkyl}$,
 $\text{C}_1\text{-C}_4\text{-alkylthio}-\text{C}_1\text{-C}_4\text{-alkyl}$, kyano- $\text{C}_1\text{-C}_8\text{-alkyl}$,
 karboxyl- $\text{C}_1\text{-C}_4\text{-alkyl}$, $(\text{C}_1\text{-C}_4\text{-alkoxy})\text{karbonyl}-\text{C}_1\text{-C}_4\text{-alkyl}$,

(C₁-C₆-alkoxy)karbonyl-(C₃-C₇-cykloalkyl),
 C₁-C₄-alkylsulfonyl-C₁-C₄-alkyl, C₃-C₈-cykloalkyl,
 C₁-C₆-alkoxy, (C₃-C₆-cykloalkoxy)-karbonyl-C₁-C₄-alkyl,
 C₁-C₄-alkoxy-(C₁-C₄-alkoxy)karbonyl-C₁-C₄-alkyl, fenyl,
 fenyl-C₁-C₄-alkyl, kde fenylový kruh v každém případě může být
 nesubstituován nebo může nést jeden až tři radikály vybrané ze
 skupiny, zahrnující halogen, nitro, kyano, C₁-C₄-alkyl,
 C₁-C₄-alkoxy, C₁-C₄-alkylthio, C₁-C₄-halogenalkyl a
 C₂-C₆-alkenyl, 5- nebo 6-členný heteroaryl nebo
 heteroaryl-C₁-C₄-alkyl, kde heteroaromát obsahuje jeden až tři
 heteroatomy vybrané ze skupiny, zahrnující jeden nebo dva
 atomy dusíku a kyslíkový nebo sírový atom a kde heteroaromát,
 je-li to žádoucí, může dále nést na každém substituovatelném
 kruhovém atomu radikál vybraný ze skupiny, zahrnující
 hydroxyl, halogen, C₁-C₄-alkyl, C₁-C₄-alkoxy, C₁-C₄-alkylthio
 a C₁-C₄-halogenalkyl:

a N-oxidy sloučenin vzorce I a jejich agrikulturně využitelné soli, jestliže tyto existují.

2- Substituované 2-fenylpyridiny obecného vzorce I podle nároku 1, kde

R¹ a R³ jsou vodík nebo halogen,

R² je halogen nebo C₁-C₄-halogenalkyl,

R⁴ je chlor,

R⁵ je vodík, fluor nebo chlor,

R⁶, R⁷ a R¹⁰ jsou nezávisle na sobě vodík, C₁-C₆-alkyl,
 C₂-C₆-alkenyl, C₂-C₆-alkinyl nebo

(C₁-C₆-alkoxy)karbonyl-C₁-C₄-alkyl;

R¹¹, R¹², R¹³, R¹⁴, R¹⁸ a R¹⁹ jsou nezávisle na sobě vodík nebo C₁-C₆-alkyl;

R¹⁵ a R¹⁶ jsou nezávisle na sobě vodík, chlor nebo -OR²⁰.

3. Použití substituovaných 2-fenylpyridinů obecného vzorce I, jejich N-oxidů a/nebo agrikulturně využitelných solí, podle nároku 1, jako herbicidů nebo pro desikaci a/nebo defoliaci rostlin.

4. Herbicidní prostředek, v y z n a č u j í c í s e t í m, že obsahuje herbicidně účinné množství alespoň jednoho substituovaného 2-fenylpyridinu obecného vzorce I nebo jeho N-oxidu nebo jeho agrikulturně využitelné soli, podle nároku 1 a alespoň jeden inertní kapalný a/nebo pevný nosič a, je-li to žádoucí, alespoň jednu přísadu.

5. Prostředek pro desikaci a/nebo defoliaci rostlin, v y z n a č u j í c í s e t í m, že obsahuje množství, mající desikační a/nebo defoliační účinek, alespoň jednoho substituovaného 2-fenylpyridinu obecného vzorce I nebo jeho N-oxidu nebo jeho agrikulturně využitelné soli, podle nároku 1 a alespoň jeden inertní kapalný a/nebo pevný nosič a, je-li to žádoucí, alespoň jednu přísadu.

6. Způsob přípravy herbicidně účinných prostředků, v y z n a č u j í c í s e t í m, že zahrnuje smísení herbicidně účinného množství alespoň jednoho substituovaného 2-fenylpyridinu obecného vzorce I nebo jeho N-oxidu nebo jeho agrikulturně využitelné soli, podle

nároku 1 a alespoň jednoho inertního kapalného a/nebo pevného nosiče a, je-li to žádoucí, alespoň jedné přísady.

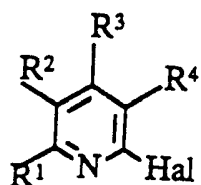
7. Způsob přípravy prostředků, majících desikační a/nebo defoliační aktivitu, v y z n a č u j í c í s e t í m, že zahrnuje smísení herbicidně účinného množství alespoň jednoho substituovaného 2-fenylpyridinu obecného vzorce I nebo jeho N-oxidu nebo jeho agrikulturně využitelné soli, podle nároku 1 a alespoň jednoho inertního kapalného a/nebo pevného nosiče a, je-li to žádoucí, alespoň jedné přísady.

8. Způsob kontroly nežádoucího růstu rostlin, v y z n a č u j í c í s e t í m, že zahrnuje umožnění působení herbicidně účinného množství alespoň jednoho substituovaného 2-fenylpyridinu obecného vzorce I nebo jeho N-oxidu nebo agrikulturně využitelné soli, na rostliny, jejich životní prostředí nebo na semena.

9. Způsob desikace a defoliace rostlin, v y z n a č u j í c í s e t í m, že zahrnuje umožnění působení herbicidně účinného množství alespoň jednoho substituovaného 2-fenylpyridinu obecného vzorce I nebo jeho N-oxidu nebo agrikulturně využitelné soli na rostliny.

10. Způsob podle nároku 9, v y z n a č u j í c í s e t í m, že defoliovanou rostlinou je bavlník.

11. Způsob přípravy substituovaných 2-fenylpyridinů obecného vzorce I, v y z n a č u j í c í s e t í m, že zahrnuje reakci 2-halogenpyridinu obecného vzorce II



II

kde Hal je chlor nebo brom,

za přítomnosti katalyzátoru na bázi přechodového kovu, s organokovovou sloučeninou obecného vzorce III

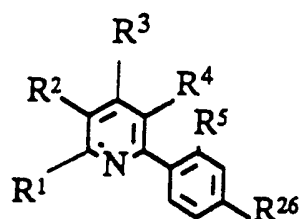
$$\text{Me-Ar}$$

(III)

kde Me je magnesiumhalogenid, halogenid zinku, cín-(C₁-C₄-alkyl), lithium, měď nebo B(OR²⁴)(OR²⁵), kde R²⁴ a R²⁵ jsou nezávisle na sobě vodík nebo C₁-C₄-alkyl nebo spolu jsou ethylen a propylen.

12. Způsob podle nároku 11, v y z n a č u j í c í s e t í m, že se jako výchozí látka použije sloučenina vzorce III, kde M je B(OH)₂.

13. Použití fenyropyridinů obecného vzorce IV



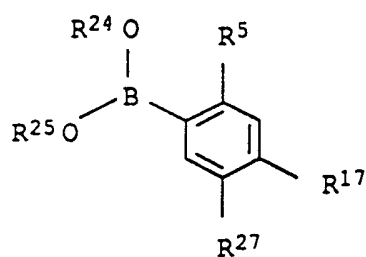
IV

kde substituenty R^1 až R^5 mají stejné významy jako u sloučenin obecného vzorce I podle nároku 1 a

R^6 je fluor, hydroxyl nebo C_1 - C_6 -alkoxy,

jako meziproduktů pro přípravu 2-fenylpyridinů obecného vzorce I podle nároku I.

14. Použití aromatických kyselin boru nebo esterů kyselin boru obecného vzorce XIX



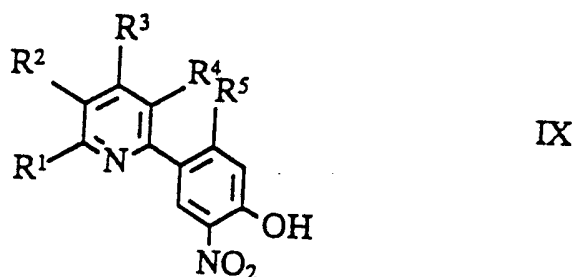
XIX

kde R^5 a R^{17} mají stejný význam jako ve sloučeninách obecného vzorce I podle nároku 1 a kde

R^{24} a R^{25} nezávisle na sobě jsou vodík nebo C_1 - C_4 -alkyl nebo spolu jsou ethylen nebo propylen a R^{27} je vodík nebo

C₁-C₄-alkoxy.

15. 2-(4-Hydroxy-5-nitrofenyl)pyridin obecného vzorce IX



kde substituenty mají následující významy

R¹, R³ a R⁴ jsou nezávisle na sobě vodík, halogen, C₁-C₄-alkyl, C₁-C₄-halogenalkyl, C₁-C₄-alkoxy-C₁-C₄-alkyl, C₁-C₄-alkoxy, C₁-C₄-alkoxy-C₁-C₄-alkoxy, hydroxyl, C₁-C₄-halogenalkoxy, (C₁-C₅-alkyl)karbonyloxy, (C₁-C₅-halogenalkyl)karbonyloxy, SH, C₁-C₄-alkylthio, C₁-C₄-alkylsulfinyl, C₁-C₄-alkylsulfonyl, C₁-C₄-halogenalkylthio, C₁-C₄-halogenalkylsulfinyl, C₁-C₄-halogenalkylsulfonyl, formyl, kyano, CO₂H, (C₁-C₄-alkoxy)karbonyl, C₁-C₄-alkoxy-(C₁-C₄-alkoxy)karbonyl, (C₁-C₄-halogenalkoxy)karbonyl, (C₁-C₄-alkyl)karbonyl, (C₁-C₄-halogenalkyl)karbonyl, C₁-C₄-alkoxy-(C₁-C₄-alkyl)karbonyl, CONH₂, (C₁-C₄-alkyl)aminokarbonyl, di(C₁-C₄-alkyl)aminokarbonyl, pyrrolidinylní karbonyl, piperidinylní karbonyl, morfolinylní karbonyl, nitro, amino, C₁-C₄-alkylamino, di(C₁-C₄-alkyl)amino, pyrrolidinyl, piperidinyl, morfolinyl, (C₁-C₄-alkyl)karbonylamino, (C₁-C₄-halogenalkyl)karbonylamino nebo C₁-C₄-alkylsulfonylamino nebo CO₂-M⁺, kde M⁺ je Na⁺, K⁺, Ca²⁺, Mg²⁺, amonium nebo amoniový iont substituovaný C₁-C₄-alkylovým, C₁-C₄-hydroxyalkylovým, fenylovým nebo

benzylovým radikálem, který, je-li to žádoucí, může nést jeden až tři další C₁-C₄-alkylové radikály,

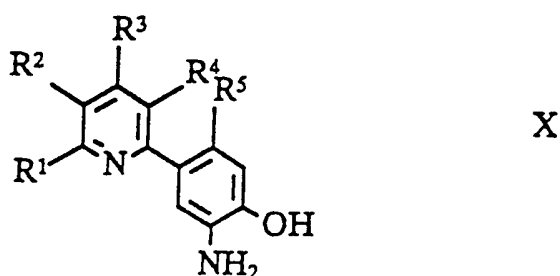
nebo R¹ a R² nebo R² a R³ spolu znamenají vždy trimethylenový nebo tetramethylenový řetězec

R² je halogen, kyano, nitro, C₁-C₄-alkyl, C₁-C₄-halogenalkyl, C₁-C₄-alkoxy, C₁-C₄-halogenalkoxy, C₁-C₄-alkylthio nebo C₁-C₄-halogenalkylthio,

a

R⁵ je vodík nebo halogen.

16. 2-(4-Hydroxy-5-aminofenyl)pyridin obecného vzorce X



kde substituenty mají následující významy

R¹, R³ a R⁴ jsou nezávisle na sobě vodík, halogen, C₁-C₄-alkyl, C₁-C₄-halogenalkyl, C₁-C₄-alkoxy-C₁-C₄-alkyl, C₁-C₄-alkoxy, C₁-C₄-alkoxy-C₁-C₄-alkoxy, hydroxyl, C₁-C₄-halogenalkoxy, (C₁-C₅-alkyl)karbonyloxy, (C₁-C₅-halogenalkyl)karbonyloxy, SH, C₁-C₄-alkylthio, C₁-C₄-alkylsulfinyl, C₁-C₄-alkylsulfonyl,

C_1-C_4 -halogenalkylthio, C_1-C_4 -halogenalkylsulfinyl,
 C_1-C_4 -halogenalkylsulfonyl, formyl, kyano, CO_2H ,
 $(C_1-C_4-alkoxy)karbonyl$, $C_1-C_4-alkoxy-(C_1-C_4-alkoxy)karbonyl$,
 $(C_1-C_4-halogenalkoxy)karbonyl$,
 $(C_1-C_4-alkyl)karbonyl$, $(C_1-C_4-halogenalkyl)karbonyl$,
 $C_1-C_4-alkoxy-(C_1-C_4-alkyl)karbonyl$, $CONH_2$,
 $(C_1-C_4-alkyl)aminokarbonyl$, $di(C_1-C_4-alkyl)aminokarbonyl$,
pyrrolidinylnarbonyl, piperidinylnarbonyl, morfolinylnarbonyl,
nitro, amino, $C_1-C_4-alkylamino$, $di(C_1-C_4-alkyl)amino$,
pyrrolidinylnarbonyl, piperidinylnarbonyl, morfolinylnarbonyl,
 $(C_1-C_4-alkyl)karbonylamino$, $(C_1-C_4-halogenalkyl)karbonyl-$
amino nebo $C_1-C_4-alkylsulfonylamino$ nebo CO_2-M^+ , kde M^+ je
 Na^+ , K^+ , Ca^{2+} , Mg^{2+} , amonium nebo amoniový iont substituovaný
 $C_1-C_4-alkylovým$, $C_1-C_4-hydroxyalkylovým$, fenylovým nebo
benzylovým radikálem, který, je-li to žádoucí, může nést jeden
až tři další $C_1-C_4-alkylové$ radikály,

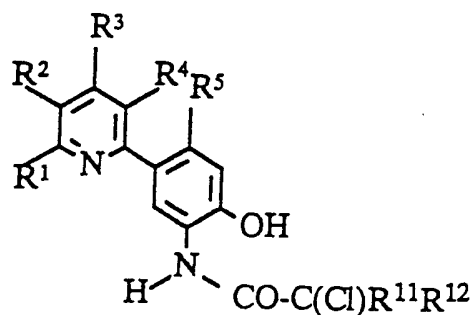
nebo R^1 a R^2 nebo R^2 a R^3 spolu znamenají vždy trimethylenový
nebo tetramethylenový řetězec

R^2 je halogen, kyano, nitro, $C_1-C_4-alkyl$, $C_1-C_4-halogenalkyl$,
 $C_1-C_4-alkoxy$, $C_1-C_4-halogenalkoxy$, $C_1-C_4-alkylthio$ nebo
 $C_1-C_4-halogenalkylthio$,

a

R^5 je vodík nebo halogen.

17. Karboxanilid obecného vzorce XII



kde substituenty mají následující významy

R^1 , R^3 a R^4 jsou nezávisle na sobě vodík, halogen, C_1 - C_4 -alkyl, C_1 - C_4 -halogenalkyl, C_1 - C_4 -alkoxy- C_1 - C_4 -alkyl, C_1 - C_4 -alkoxy, C_1 - C_4 -alkoxy- C_1 - C_4 -alkoxy, hydroxyl, C_1 - C_4 -halogenalkoxy, $(C_1$ - C_5 -alkyl)karbonyloxy, $(C_1$ - C_5 -halogenalkyl)karbonyloxy, SH, C_1 - C_4 -alkylthio, C_1 - C_4 -alkylsulfinyl, C_1 - C_4 -alkylsulfonyl, C_1 - C_4 -halogenalkylthio, C_1 - C_4 -halogenalkylsulfinyl, C_1 - C_4 -halogenalkylsulfonyl, formyl, kyano, CO_2H , $(C_1$ - C_4 -alkoxy)karbonyl, C_1 - C_4 -alkoxy- $(C_1$ - C_4 -alkoxy)karbonyl, $(C_1$ - C_4 -halogenalkoxy)karbonyl, $(C_1$ - C_4 -alkyl)karbonyl, $(C_1$ - C_4 -halogenalkyl)karbonyl, C_1 - C_4 -alkoxy- $(C_1$ - C_4 -alkyl)karbonyl, $CONH_2$, $(C_1$ - C_4 -alkyl)aminokarbonyl, $di(C_1$ - C_4 -alkyl)aminokarbonyl, pyrrolidinylkarbonyl, piperidinylkarbonyl, morfolinylkarbonyl, nitro, amino, C_1 - C_4 -alkylamino, $di(C_1$ - C_4 -alkyl)amino, pyrrolidinyl, piperidinyl, morfolinyl, $(C_1$ - C_4 -alkyl)karbonylamino, $(C_1$ - C_4 -halogenalkyl)karbonylamino nebo C_1 - C_4 -alkylsulfonylamino nebo CO_2-M^+ , kde M^+ je Na^+ , K^+ , Ca^{2+} , Mg^{2+} , amonium nebo amoniový iont substituovaný C_1 - C_4 -alkylovým, C_1 - C_4 -hydroxyalkylovým, fenylovým nebo

benzylovým radikálem, který, je-li to žádoucí, může nést jeden až tři další C₁-C₄-alkylové radikály,

nebo R¹ a R² nebo R² a R³ spolu znamenají vždy trimethylenový nebo tetramethylenový řetězec

R² je halogen, kyano, nitro, C₁-C₄-alkyl, C₁-C₄-halogenalkyl, C₁-C₄-alkoxy, C₁-C₄-halogenalkoxy, C₁-C₄-alkylthio nebo C₁-C₄-halogenalkylthio,

R⁵ je vodík nebo halogen a

R¹¹ a R¹² jsou nezávisle na sobě vodík, halogen, C₁-C₆-alkyl, C₁-C₆-halogenalkyl nebo C₁-C₄-alkoxy-C₁-C₄--alkyl.