



SCHWEIZERISCHE EIDGENOSSENSCHAFT
BUNDESAMT FÜR GEISTIGES EIGENTUM

(51) Int. Cl.³: C 07 D 213/62
A 01 N 43/34

Erfindungspatent für die Schweiz und Liechtenstein

Schweizerisch-liechtensteinischer Patentschutzvertrag vom 22. Dezember 1978



(12) PATENTSCHRIFT A5

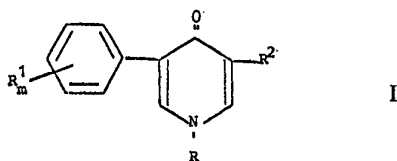
(11)

632 497

(21) Gesuchsnummer:	9471/79	(73) Inhaber:	Eli Lilly and Company, Indianapolis/IN (US)
(62) Teilgesuch von:	11048/75		
(22) Anmeldungsdatum:	26.08.1975		
(30) Priorität(en):	28.08.1974 US 501424 03.07.1975 US 591681	(72) Erfinder:	Harold Mellon Taylor, Indianapolis/IN (US)
(24) Patent erteilt:	15.10.1982		
(45) Patentschrift veröffentlicht:	15.10.1982	(74) Vertreter:	E. Blum & Co., Zürich

(54) Verfahren zur Herstellung von 3-Phenyl-5-substituierten-4(1H)-pyridonen und deren Verwendung.

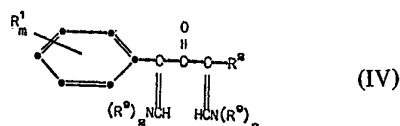
(57) 3-Phenyl-5-substituierte-4(1H)-pyridone der Formel I



Aus den Pyridonen können durch Umsetzung mit Phosphorpentasulfid die entsprechenden Pyridothione hergestellt werden.

Sowohl die Pyridone als auch die entsprechenden Pyridothione, und auch die Salze dieser Verbindungen, werden als Wirkstoffkomponente in herbiziden Mitteln eingesetzt. Sie üben ihre Wirksamkeit gegenüber einem ungewöhnlich breiten Bereich an Unkräutern aus.

werden hergestellt, indem man eine Verbindung der Formel IV



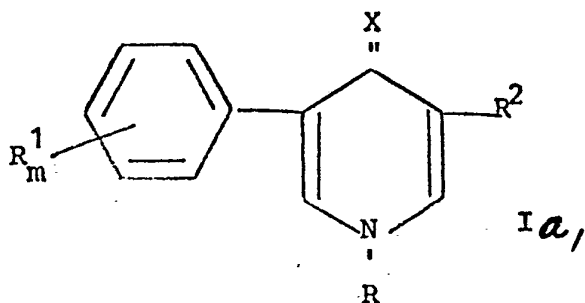
mit einer Verbindung der Formel



oder einem Säureadditionssalz dieser Verbindung umgesetzt. In diesen Verbindungen haben die Substituenten die in Patentanspruch 1 angegebene Bedeutung.

PATENTANSPRÜCHE

1. Verfahren zur Herstellung von 3-Phenyl-5-substituierten-4(1H)-pyridonen der Formel



worin

X Sauerstoff bedeutet,

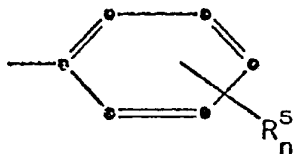
R für Wasserstoff, C₁-C₃-Alkyl, durch Halogen, Cyano, Carboxy oder Methoxycarbonyl substituiertes C₁-C₃-Alkyl, C₂-C₃-Alkenyl, C₂-C₃-Alkynyl, C₁-C₃-Alkoxy, Hydroxy oder Dimethylamino steht, mit der Massgabe, dass der Substituent R nicht mehr als 3 Kohlenstoffatome enthält,

die Reste

R¹ unabhängig voneinander Halogen, C₁-C₈-Alkyl, halogensubstituiertes C₁-C₈-Alkyl, mit Phenyl, Cyano oder C₁-C₃-Alkoxy monosubstituiertes C₁-C₈-Alkyl, C₂-C₈-Alkenyl, halogensubstituiertes C₂-C₈-Alkenyl, C₂-C₈-Alkynyl, halogensubstituiertes C₂-C₈-Alkynyl, C₃-C₆-Cycloalkyl, C₄-C₆-Cycloalkenyl, C₄-C₈-Cycloalkylalkyl, C₁-C₃-Alkanoyloxy, C₁-C₃-Alkylsulfonyloxy, Phenyl, durch Halogen, C₁-C₃-Alkyl, C₁-C₃-Alkoxy oder Nitro monosubstituiertes Phenyl, Nitro, Cyano, Carboxy, Hydroxy, C₁-C₃-Alkoxy carbonyl, -O-R³, -S-R³, -SO-R³ oder -SO₂-R³ bedeuten, wobei

R³ für C₁-C₁₂-Alkyl, halogensubstituiertes C₁-C₁₂-Alkyl, durch Phenyl, Cyano oder C₁-C₃-Alkoxy monosubstituiertes C₁-C₁₂-Alkyl, Phenyl, durch Halogen, C₁-C₃-Alkyl, C₁-C₃-Alkoxy oder Nitro monosubstituiertes Phenyl, C₃-C₆-Cycloalkyl, C₄-C₈-Cycloalkylalkyl, C₂-C₁₂-Alkenyl, halogensubstituiertes C₂-C₁₂-Alkenyl, C₂-C₁₂-Alkynyl oder halogensubstituiertes C₂-C₁₂-Alkynyl oder halogensubstituiertes C₂-C₁₂-Alkynyl steht, mit der Massgabe, dass der Substituent R³ höchstens 12 Kohlenstoffatome enthält,

R² für Halogen, Wasserstoff, Cyano, C₁-C₃-Alkoxy carbonyl, C₁-C₆-Alkyl, durch Halogen oder C₁-C₃-Alkoxy substituiertes C₁-C₆-Alkyl, C₂-C₆-Alkenyl, durch Halogen oder C₁-C₃-Alkoxy substituiertes C₂-C₆-Alkenyl, C₂-C₆-Alkynyl, C₃-C₆-Cycloalkyl, durch Halogen, C₁-C₃-Alkyl oder C₁-C₃-Alkoxy substituiertes C₃-C₆-Cycloalkyl, C₄-C₆-Cycloalkenyl, C₄-C₈-Cycloalkylalkyl, Phenyl-C₁-C₃-alkyl, Furyl, Naphthyl, Thienyl, -O-R⁴, -S-R⁴, -SO-R⁴, -SO₂-R⁴ oder



steht,

R⁴ für C₁-C₃-Alkyl, halogensubstituiertes C₁-C₃-Alkyl, C₂-C₃-Alkenyl, halogensubstituiertes C₂-C₃-Alkenyl, Benzyl, Phenyl oder durch Halogen, C₁-C₃-Alkyl oder C₁-C₃-Alkoxy substituiertes Phenyl steht,

die Reste

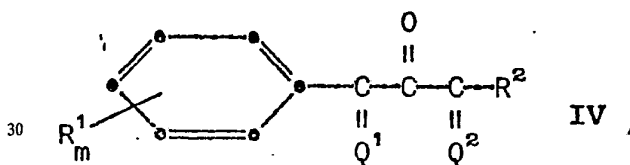
R⁵ unabhängig voneinander Halogen, C₁-C₈-Alkyl, halogensubstituiertes C₁-C₈-Alkyl, durch Phenyl, Cyano oder

C₁-C₃-Alkoxy monosubstituiertes C₁-C₈-Alkyl, C₂-C₈-Alkenyl, halogensubstituiertes C₂-C₈-Alkenyl, C₂-C₈-Alkynyl, halogensubstituiertes C₂-C₈-Alkynyl, C₃-C₆-Cycloalkyl, C₄-C₆-Cycloalkenyl, C₄-C₈-Cycloalkylalkyl, C₁-C₃-Alkanoyloxy, C₁-C₃-Alkylsulfonyloxy, Phenyl, durch Halogen, C₁-C₃-Alkyl, C₁-C₃-Alkoxy oder Nitro monosubstituiertes Phenyl, Nitro, Cyano, Carboxy, Hydroxy, C₁-C₃-Alkoxy carbonyl, -O-R⁶, -S-R⁶, -SO-R⁶ oder -SO₂-R⁶ bedeuten, wobei

R⁶ für C₁-C₁₂-Alkyl, halogensubstituiertes C₁-C₁₂-Alkyl, durch Phenyl, Cyano oder C₁-C₃-Alkoxy monosubstituiertes C₁-C₁₂-Alkyl, Phenyl, durch Halogen, C₁-C₃-Alkyl, C₁-C₃-Alkoxy oder Nitro monosubstituiertes Phenyl, C₃-C₆-Cycloalkyl, C₄-C₈-Cycloalkylalkyl, C₂-C₁₂-Alkenyl, halogensubstituiertes C₂-C₁₂-Alkenyl, C₂-C₁₂-Alkynyl oder halogensubstituiertes C₂-C₁₂-Alkynyl steht, mit der Massgabe, dass der Substituent R⁶ höchstens 12 Kohlenstoffatome enthält,

die Indices

m und n unabhängig voneinander 0, 1 oder 2 bedeuten, wobei der Index m für 1 oder 2 steht, falls R für Wasserstoff oder Methyl steht und R² unsubstituiertes Phenyl darstellt, und Salzen der Verbindungen der Formel Ia, dadurch gekennzeichnet, dass man eine Verbindung der Formel IV



worin R¹, R² und m die oben genannten Bedeutungen haben, worin beide Substituenten Q¹ und Q² für



stehen, worin die Reste R⁹ unabhängig voneinander C₁-C₃-Alkyl bedeuten oder die Reste R⁹ zusammen mit dem Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, Pyrrolidino, Piperidino, Morpholino oder N-Methylpiperazino bilden, mit einer Verbindung der Formel



worin R die oben angegebene Bedeutung hat, oder dem Säureadditionssalz dieser Verbindung, cyclisiert.

2. Verfahren nach Patentanspruch 1, dadurch gekennzeichnet, dass man als Aminoverbindung Ammoniak oder dessen Säureadditionssalz verwendet um Verbindungen der Formel zu erhalten, in welchen R ein Wasserstoffatom ist, und diese dann anschliessend nach der Methode der N-Alkylierung in solche Verbindungen der Formel Ia überführt, in welchen R ein Alkylrest mit 1-3 Kohlenstoffatomen, der gegebenenfalls durch Halogen, Cyano, Carboxy oder Methoxycarbonyl substituiert ist, oder ein Alkenylrest mit 2 oder 3 Kohlenstoffatomen oder ein Alkynylrest mit 2 oder 3 Kohlenstoffatomen ist.

3. Verfahren nach Patentanspruch 1 zur Herstellung von 1-Methyl-3-phenyl-4(1H)-pyridon, dadurch gekennzeichnet, dass man 1,5-Bis(dimethylamino)-2-phenyl-1,4-pentadien-3-on mit Methylamin-hydrochlorid cyclisiert.

4. Verfahren nach Patentanspruch 1 zur Herstellung von 1-Methyl-3(3-trifluormethylphenyl)-4(1H)-pyridon, dadurch gekennzeichnet, dass man 1,5-Bis(dimethylamino)-2-(3-trifluormethylphenyl)-1,4-pentadien-3-on mit Methylamin-hydrochlorid cyclisiert.

5. Verfahren nach Patentanspruch 1 zur Herstellung von 3-(3-Carboxyphenyl)-1-methyl-5-phenyl-4(1H)-pyridon-hydrochlorid, dadurch gekennzeichnet, dass man 1,5-Bis(dimethylamino)-

2-(3-carboxyphenyl)-4-phenyl-1,4-pentadien-3-on mit Methylamin-hydrochlorid cyclisiert.

6. Verfahren nach Patentanspruch 1 zur Herstellung von 3-(3-Cyanophenyl)-1-methyl-5-phenyl-4(1H)-pyridon, dadurch gekennzeichnet, dass man 1,5-Bis(dimethylamino)-2-(3-cyanophenyl)-4-phenyl-1,4-pentadien-3-on mit Methylamin cyclisiert.

7. Verfahren nach Patentanspruch 1 zur Herstellung von 3-(3-Äthoxycarbonylphenyl)-1-methyl-5-phenyl-4(1H)-pyridon, dadurch gekennzeichnet, dass man 1,5-Bis(dimethylamino)-2-(3-äthoxycarbonylphenyl)-4-phenyl-1,4-pentadien-3-on mit Methylamin-hydrochlorid cyclisiert.

8. Verfahren nach Patentanspruch 1 zur Herstellung von 3,5-Bis(3-cyanophenyl)-1-methyl-4(1H)-pyridon, dadurch gekennzeichnet, dass man 2,4-Bis(3-cyanophenyl)-1,5-bis-(dimethylamino)-1,4-pentadien-3-on mit Methylamin cyclisiert.

9. Verfahren nach Patentanspruch 1 zur Herstellung von 1-Methyl-3-phenyl-5-(3-thienyl)-4(1H)-pyridon, dadurch gekennzeichnet, dass man 1,5-Bis(dimethylamino)-2-phenyl-4-(3-thienyl)-1,4-pentadien-3-on mit Methylamin cyclisiert.

10. Verfahren nach Patentanspruch 1 zur Herstellung von 3-Cyano-1-methyl-5-phenyl-4(1H)-pyridon, dadurch gekennzeichnet, dass man 1,5-Bis(dimethylamino)-2-cyano-4-phenyl-1,4-pentadien-3-on mit Methylamin-hydrochlorid cyclisiert.

11. Verfahren nach Patentanspruch 1 zur Herstellung von 1,3-Dimethyl-5-(3-trifluormethylphenyl)-4(1H)-pyridon, dadurch gekennzeichnet, dass man 1,5-Bis(dimethylamino)-2-methyl-4-(3-trifluormethylphenyl)-1,4-pentadien-3-on mit Methylamin cyclisiert.

12. Verfahren nach Patentanspruch 1 zur Herstellung von 1,3-Dimethyl-5-phenyl-4(1H)-pyridon, dadurch gekennzeichnet, dass man 1,5-Bis(dimethylamino)-2-methyl-4-phenyl-1,4-pentadien-3-on mit Methylamin cyclisiert.

13. Verfahren nach Patentanspruch 1 zur Herstellung von 3-(3-Chlorphenyl)-1,5-dimethyl-4(1H)-pyridon, dadurch gekennzeichnet, dass man 1,5-Bis(dimethylamino)-2-(3-chlorphenyl)-4-methyl-1,4-pentadien-3-on mit Methylamin cyclisiert.

14. Verfahren nach Patentanspruch 1 zur Herstellung von 3-Äthyl-1-methyl-5-(3-trifluormethylphenyl)-4(1H)-pyridon, dadurch gekennzeichnet, dass man 1,5-Bis(dimethylamino)-2-äthyl-4-(3-trifluormethylphenyl)-1,4-pentadien-3-on mit Methylamin cyclisiert.

15. Verfahren nach Patentanspruch 1 zur Herstellung von 3-Cyclohexyl-1-methyl-5-(3-trifluormethylphenyl)-4(1H)-pyridon, dadurch gekennzeichnet, dass man 1,5-Bis(dimethylamino)-2-cyclohexyl-4-(3-trifluormethylphenyl)-1,4-pentadien-3-on mit Methylamin cyclisiert.

16. Verfahren nach Patentanspruch 1 zur Herstellung von 3-Isopropyl-1-methyl-5-(3-trifluormethylphenyl)-4(1H)-pyridon, dadurch gekennzeichnet, dass man 1,5-Bis(dimethylamino)-2-isopropyl-4-(3-trifluormethylphenyl)-1,4-pentadien-3-on mit Methylamin cyclisiert.

17. Verfahren nach Patentanspruch 1 zur Herstellung von 3-Hexyl-1-methyl-5-(3-trifluormethylphenyl)-4(1H)-pyridon, dadurch gekennzeichnet, dass man 1,5-Bis(dimethylamino)-2-hexyl-4-(3-trifluormethylphenyl)-1,4-pentadien-3-on mit Methylamin cyclisiert.

18. Verfahren nach Patentanspruch 1 zur Herstellung von 3-Benzyl-1-methyl-5-(3-trifluormethylphenyl)-4(1H)-pyridon, dadurch gekennzeichnet, dass man 2-Benzyl-1,5-bis(dimethylamino)-4-(3-trifluormethylphenyl)-1,4-pentadien-3-on mit Methylamin cyclisiert.

19. Verfahren nach Patentanspruch 1 zur Herstellung von 3-Butyl-1-methyl-5-(3-trifluormethylphenyl)-4(1H)-pyridon, dadurch gekennzeichnet, dass man 1,5-Bis(dimethylamino)-2-butyl-4-(3-trifluormethylphenyl)-1,4-pentadien-3-on mit Methylamin cyclisiert.

20. Verfahren nach Patentanspruch 1 zur Herstellung von 3-

(3-Cyclohexenyl)-1-methyl-5-(3-trifluormethylphenyl)-4(1H)-pyridon, dadurch gekennzeichnet, dass man 1,5-Bis(dimethylamino)-2-(3-cyclohexenyl)-4-(3-trifluormethylphenyl)-1,4-pentadien-3-on mit Methylamin cyclisiert.

21. Verfahren nach Patentanspruch 1 zur Herstellung von 1-Methyl-3-propyl-5-(3-trifluormethylphenyl)-4(1H)-pyridon, dadurch gekennzeichnet, dass man 1,5-Bis(dimethylamino)-2-propyl-4-(3-trifluormethylphenyl)-1,4-pentadien-3-on mit Methylamin cyclisiert.

22. Verfahren nach Patentanspruch 1 zur Herstellung von 1-Methyl-3-(4-nitrophenyl)-5-phenyl-4(1H)-pyridon, dadurch gekennzeichnet, dass man 1,5-Bis(dimethylamino)-2-(4-nitrophenyl)-4-phenyl-1,4-pentadien-3-on mit Methylamin cyclisiert.

23. Verfahren nach Patentanspruch 1 zur Herstellung von 3,5-Bis(3,4-dimethoxyphenyl)-1-methyl-4(1H)-pyridon, dadurch gekennzeichnet, dass man 2,4-Bis(3,4-Dimethoxyphenyl)-1,5-bis(dimethylamino)-1,4-pentadien-3-on mit Methylamin cyclisiert.

24. Verfahren nach Patentanspruch 1 zur Herstellung von 3-Äthoxycarbonyl-1-methyl-5-phenyl-4(1H)-pyridon, dadurch gekennzeichnet, dass man 1,5-Bis(dimethylamino)-2-äthoxycarbonyl-4-phenyl-1,4-pentadien-3-on mit Methylamin cyclisiert.

25. Verfahren nach Patentanspruch 1 zur Herstellung von 3-(2-Furyl)-1-methyl-5-phenyl-4(1H)-pyridon, dadurch gekennzeichnet, dass man 1,5-Bis(dimethylamino)-2-(2-furyl)-4-phenyl-1,4-pentadien-3-on mit Methylamin cyclisiert.

26. Verfahren nach Patentanspruch 1 zur Herstellung von 3-Cyano-1-methyl-5-(3-trifluormethylphenyl)-4(1H)-pyridon, dadurch gekennzeichnet, dass man 1,5-Bis(dimethylamino)-2-cyano-4-(3-trifluormethylphenyl)-1,4-pentadien-3-on mit Methylamin cyclisiert.

27. Verfahren nach Patentanspruch 1 zur Herstellung von 3-(3,4-Dimethoxyphenyl)-1-methyl-5-phenyl-4(1H)-pyridon, dadurch gekennzeichnet, dass man 1,5-Bis(dimethylamino)-2-(3,4-dimethoxyphenyl)-4-phenyl-1,4-pentadien-3-on mit Methylamin cyclisiert.

28. Verfahren nach Patentanspruch 1 zur Herstellung von 3-(3-Isopropenylphenyl)-1-methyl-5-phenyl-4(1H)-pyridon, dadurch gekennzeichnet, dass man 1,5-Bis(dimethylamino)-2-(3-isopropenylphenyl)-4-phenyl-1,4-pentadien-3-on mit Methylamin cyclisiert.

29. Verfahren nach Patentanspruch 1 zur Herstellung von 3-(3-Äthylphenyl)-1-methyl-5-phenyl-4(1H)-pyridon, dadurch gekennzeichnet, dass man 1,5-Bis(dimethylamino)-2-(3-äthylphenyl)-4-phenyl-1,4-pentadien-3-on mit Methylamin cyclisiert.

30. Verfahren nach Patentanspruch 1 zur Herstellung von 3-(3-Hexylphenyl)-1-methyl-5-phenyl-4(1H)-pyridon, dadurch gekennzeichnet, dass man 1,5-Bis(dimethylamino)-2-(3-hexylphenyl)-4-phenyl-1,4-pentadien-3-on mit Methylamin cyclisiert.

31. Verfahren nach Patentanspruch 1 zur Herstellung von 3-(4-Äthylphenyl)-1-methyl-5-phenyl-4(1H)-pyridon, dadurch gekennzeichnet, dass man 1,5-Bis(dimethylamino)-2-(4-äthylphenyl)-4-phenyl-1,4-pentadien-3-on mit Methylamin cyclisiert.

32. Verfahren nach Patentanspruch 1 zur Herstellung von 3-(3-Cyclohexylmethylphenyl)-1-methyl-5-phenyl-4(1H)-pyridon, dadurch gekennzeichnet, dass man 1,5-Bis(dimethylamino)-2-(3-cyclohexylmethylphenyl)-4-phenyl-1,4-pentadien-3-on mit Methylamin cyclisiert.

33. Verfahren nach Patentanspruch 1 zur Herstellung von 1-Methyl-3-phenyl-5-benzylthio-4(1H)-pyridon, dadurch gekennzeichnet, dass man 2-Benzylthio-1,5-bis(dimethylamino)-4-phenyl-1,4-pentadien-3-on mit Methylamin cyclisiert.

34. Verfahren nach Patentanspruch 1 zur Herstellung von 1-Methyl-3-phenyl-5-phenylthio-4(1H)-pyridon, dadurch gekennzeichnet, dass man 1,5-Bis(dimethylamino)-2-phenyl-4-phenylthio-1,4-pentadien-3-on mit Methylamin cyclisiert.

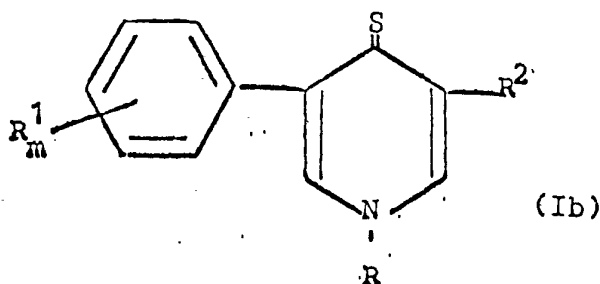
35. Verfahren nach Patentanspruch 1 zur Herstellung von 1-Methyl-3-phenoxy-5-phenyl-4(1H)-pyridon, dadurch gekennzeichnet,

zeichnet, dass man 1,5-Bis(dimethylamino)-2-phenoxy-4-phenyl-1,4-pentadien-3-on mit Methylamin cyclisiert.

36. Verfahren nach Patentanspruch 1 zur Herstellung von 1-Methyl-3-(3-nitrophenyl)-5-phenyl-4(1H)-pyridon, dadurch gekennzeichnet, dass man 1,5-Bis(dimethylamino)-2-(3-nitrophenyl)-4-phenyl-1,4-pentadien-3-on mit Methylamin cyclisiert.

37. Verfahren nach Patentanspruch 1, dadurch gekennzeichnet, dass man die Verbindungen der Formel Ia mit einer geeigneten Säure oder einer geeigneten Base in die entsprechenden Salze überführt.

38. Verfahren zur Herstellung von 3-Phenyl-5-substituierten-4(1H)-pyridothionen der Formel Ib



worin

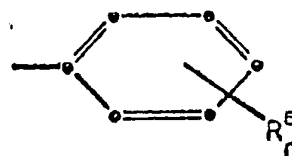
R für Wasserstoff, einen Alkylrest mit 1 bis 3 Kohlenstoffatomen, einen durch Halogen, Cyano, Carboxy oder Methoxycarbonyl substituierten Alkylrest mit 1–3 Kohlenstoffatomen im Alkylteil, ein Alkenylrest mit 2 oder 3 Kohlenstoffatomen, einen Alkynylrest mit 2 oder 3 Kohlenstoffatomen, einen Alkoxyrest mit 1 bis 3 Kohlenstoffatomen, den Hydroxy- oder Dimethylaminorest steht, mit der Massgabe, dass der Substituent R insgesamt nicht mehr als 3 Kohlenstoffatome enthält,

die Reste

R¹ unabhängig voneinander Halogen, Alkylgruppen mit 1–8 Kohlenstoffatomen, halogensubstituierte Alkylgruppen mit 1–8 Kohlenstoffatomen, mit Phenyl, Cyano oder Alkoxygruppen mit 1–3 Kohlenstoffatomen monosubstituierte Alkylreste mit 1–8 Kohlenstoffatomen, Alkenylreste mit 2–8 Kohlenstoffatomen, halogensubstituierte Alkenylreste mit 2–8 Kohlenstoffatomen, Alkynylreste mit 2–8 Kohlenstoffatomen, halogensubstituierte Alkynylreste mit 2–8 Kohlenstoffatomen, Cycloalkylreste mit 3–6 Kohlenstoffatomen, Cycloalkenylreste mit 4–6 Kohlenstoffatomen, Cycloalkylalkylreste mit 4–8 Kohlenstoffatomen, Alkanoyloxyreste mit 1–3 Kohlenstoffatomen, Alkylsulfonyloxyreste mit 1–3 Kohlenstoffatomen, Phenylreste, durch Halogen, Alkyl mit 1–3 Kohlenstoffatomen, Alkoxy mit 1–3 Kohlenstoffatomen monosubstituierte Phenylreste, Nitro-, Cyano-, Carboxy- oder Hydroxygruppen, Alkoxy-carbonylgruppen mit 1–3 Kohlenstoffatomen, oder Gruppierungen der Formeln $-O-R^3$, $-S-R^3$, $-SO-R^3$ oder $-SO_2-R^3$ bedeuten, worin

R³ für einen Alkylrest mit 1–12 Kohlenstoffatomen, halogensubstituierten Alkylrest mit 1–12 Kohlenstoffatomen, durch Phenyl, Cyano oder eine Alkoxygruppe mit 1–3 Kohlenstoffatomen monosubstituierten Alkylrest mit 1 bis 12 Kohlenstoffatomen, einen Phenylrest, einen durch Halogen, Alkyl mit 1–3 Kohlenstoffatomen, Alkoxy mit 1–3 Kohlenstoffatomen oder Nitro monosubstituierten Phenylrest, einen Cycloalkylrest mit 3–6 Kohlenstoffatomen, einen Cycloalkylalkylrest mit 4–8 Kohlenstoffatomen, einen Alkenylrest mit 2–12 Kohlenstoffatomen, einen halogensubstituierten Alkenylrest mit 2–12 Kohlenstoffatomen, einen Alkynylrest mit 2–12 Kohlenstoffatomen oder einen halogensubstituierten Alkynylrest mit 2–12 Kohlenstoffatomen steht, mit der Massgabe, dass der Rest R³

insgesamt höchstens 12 Kohlenstoffatome enthält, für Halogen, Wasserstoff, eine Alkoxy-carbonylgruppe mit 1–3 Kohlenstoffatomen, eine Alkylgruppe mit 1–6 Kohlenstoffatomen, eine durch Halogen oder Alkoxy mit 1–3 Kohlenstoffatomen substituierte Alkylgruppe mit 1–6 Kohlenstoffatomen, einen Alkenylrest mit 2–6 Kohlenstoffatomen, einen durch Halogen oder Alkoxy mit 1–3 Kohlenstoffatomen substituierten Alkenylrest mit 2–6 Kohlenstoffatomen, einen Alkynylrest, einen Cycloalkylrest mit 3–6 Kohlenstoffatomen, einen durch Halogen, Alkyl mit 1–3 Kohlenstoffatomen oder Alkoxy mit 1–3 Kohlenstoffatomen substituierten Cycloalkylrest mit 3–6 Kohlenstoffatomen, einen Cycloalkenylrest mit 4–6 Kohlenstoffatomen, einen Cycloalkylalkylrest mit 4–8 Kohlenstoffatomen, einen phenylsubstituierten Alkylrest mit 1–3 Kohlenstoffatomen in der Alkylgruppe, ein Furyl-, Naphthyl-, oder Thienylrest, eine Gruppierung der Formeln: $-O-R^4$, $-S-R^4$, $-SO-R^4$ oder $-SO_2-R^4$, worin R⁴ für einen Alkylrest mit 1–3 Kohlenstoffatomen, einen halogensubstituierten Alkylrest mit 1–3 Kohlenstoffatomen, einen Alkenylrest mit 2 oder 3 Kohlenstoffatomen, einen halogensubstituierten Alkenylrest mit 2 oder 3 Kohlenstoffatomen, einen Benzyl- oder Phenylrest, oder einen durch Halogen, Alkyl mit 1–3 Kohlenstoffatomen oder Alkoxy mit 1–3 Kohlenstoffatomen substituierten Phenylrest steht, oder der Rest R² ein Phenylrest der Formel



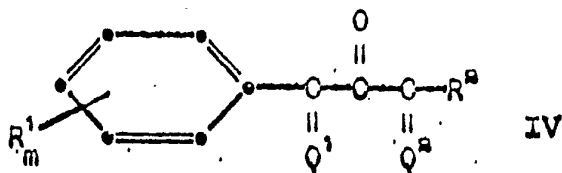
ist, worin die Reste

R⁵ unabhängig voneinander Halogen, Alkylgruppen mit 1–8 Kohlenstoffatomen, halogensubstituierte Alkylgruppen mit 1–8 Kohlenstoffatomen, durch Phenyl, Cyano oder Alkoxy mit 1–3 Kohlenstoffatomen monosubstituierte Alkylgruppen mit 1–8 Kohlenstoffatomen, Alkenylgruppen mit 2–8 Kohlenstoffatomen, halogensubstituierte Alkenylgruppen mit 2–8 Kohlenstoffatomen, Alkynylgruppen mit 2–8 Kohlenstoffatomen, halogensubstituierte Alkynylgruppen mit 2–8 Kohlenstoffatomen, Cycloalkylgruppen mit 3–6 Kohlenstoffatomen, Cycloalkenylgruppen mit 4–6 Kohlenstoffatomen, Cycloalkylalkylgruppen mit 4–6 Kohlenstoffatomen, Alkanoyloxygruppen mit 1–3 Kohlenstoffatomen, Alkylsulfonyloxygruppen mit 1–3 Kohlenstoffatomen, Phenyl, durch Halogen, Alkyl mit 1–3 Kohlenstoffatomen, Alkoxy mit 1–3 Kohlenstoffatomen monosubstituierte Phenylgruppen, oder Nitro-, Cyano-, Carboxy-, oder Hydroxygruppen, Alkoxy-carbonylgruppen mit 1–3 Kohlenstoffatomen oder Gruppierungen der Formeln $-O-R^6$, $-S-R^6$, $-SO-R^6$ oder $-SO_2-R^6$ bedeuten, worin

R⁶ eine Alkylgruppe mit 1–12 Kohlenstoffatomen, eine halogensubstituierte Alkylgruppe mit 1–12 Kohlenstoffatomen, eine durch Phenyl, Cyano oder eine Alkoxygruppe mit 1–3 Kohlenstoffatomen monosubstituierte Alkylgruppe mit 1–12 Kohlenstoffatomen, eine Phenylgruppe, eine durch Halogen, eine Alkylgruppe mit 1–3 Kohlenstoffatomen, eine Alkoxygruppe mit 1–3 Kohlenstoffatomen oder eine Nitrogruppe monosubstituierte Phenylgruppe, eine Cycloalkylgruppe mit 3–6 Kohlenstoffatomen, eine Cycloalkylalkylgruppe mit 4–8 Kohlenstoffatomen, eine Alkenylgruppe mit 2–12 Kohlenstoffatomen, eine halogensubstituierte Alkenylgruppe mit 2–12 Kohlenstoffatomen, eine Alkynylgruppe mit 2–12 Kohlenstoffatomen oder eine halogensubstituierte Alkynylgruppe mit 2–12 Kohlenstoffatomen steht, mit der Massgabe, dass der Substituent R⁶ höchstens 12 Kohlenstoffatome enthält, und

die Indices

m und n unabhängig voneinander 0, 1 oder 2 bedeuten, bzw. von Salzen der Verbindungen der Formel Ib, dadurch gekennzeichnet, dass man eine Verbindung der Formel IV



in welcher

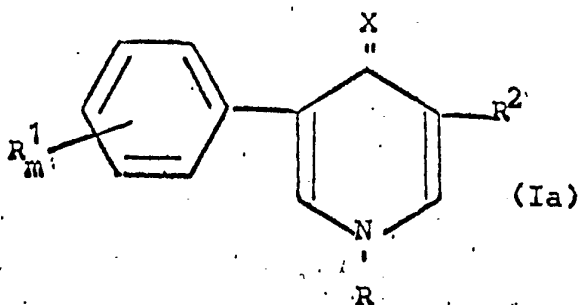
R¹, R² und m die in Formel Ib angegebene Bedeutung haben, und

jeder der beiden Substituenten Q¹ und Q² eine Gruppierung der Formel = CH - N(R⁹)₂ bedeutet, in welcher die Reste R⁹ unabhängig voneinander für Alkylreste mit 1-3 Kohlenstoffatomen stehen, oder die Reste R⁹ zusammen mit dem Stickstoffatom, an welches sie gebunden sind, einen Pyrrolidinorest, Piperidinorest, Morpholinorest oder N-Methylpiperazinorest bilden, bedeutet, mit einer Verbindung der Formel



worin

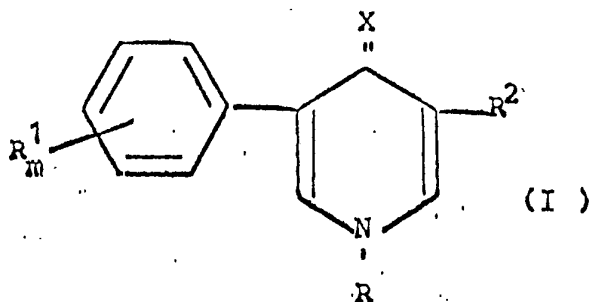
R die gleiche Bedeutung aufweist wie in Formel Ib, oder einem Säureadditionssalz derselben zu einer Verbindung der Formel Ia



worin

X ein Sauerstoffatom ist, und die Symbole m, R, R¹ und R² die gleiche Bedeutung aufweisen wie in Formel Ib, cyclisiert, und die Verbindung der Formel Ia mit Phosphorpentasulfid behandelt, wobei sich die Verbindung der Formel Ib bildet, die in freier Form oder in Form von deren Salzen isoliert wird.

39. Verwendung der neuen 3-Phenyl-5-substituierten-4(1H)-pyridone, bzw. der entsprechenden -pyridothione, der Formel I



worin

X ein Sauerstoffatom oder Schwefelatom ist, und R für Wasserstoff, einen Alkylrest mit 1-3 Kohlenstoffatomen, einen durch Halogen, Cyano, Carboxy oder Methoxycarbonyl substituierten Alkylrest mit 1-3 Kohlenstoffatomen im Alkylteil einen Alkenylrest mit 2 oder 3 Kohlen-

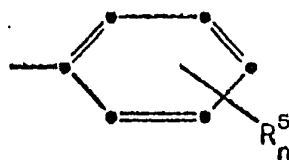
stoffatomen, einen Alkylrest mit 2 oder 3 Kohlenstoffatomen, einen Alkoxyrest mit 1-3 Kohlenstoffatomen, den Hydroxy- oder Dimethylaminorest steht, mit der Massgabe, dass der Substituent R insgesamt nicht mehr als 3 Kohlenstoffatome enthält,

5 die Reste

R¹ unabhängig voneinander Halogen, C₁-C₈-Alkyl, halogensubstituiertes C₁-C₈-Alkyl, mit Phenyl, Cyano oder C₁-C₃-Alkoxy monosubstituiertes C₁-C₈-Alkyl, C₂-C₈-Alkenyl, halogensubstituiertes C₂-C₈-Alkenyl, C₂-C₈-Alkynyl, halogensubstituiertes C₂-C₈-Alkynyl, C₃-C₆-Cycloalkyl, C₄-C₆-Cycloalkenyl, C₄-C₈-Cycloalkylalkyl, C₁-C₃-Alkanoyloxy, C₁-C₃-Alkylsulfonyloxy, Phenyl, durch Halogen, C₁-C₃-Alkyl, C₁-C₃-Alkoxy oder Nitro monosubstituiertes Phenyl, Nitro, Cyano, Carboxy, Hydroxy, C₁-C₃-Alkoxy-carbonyl, -O-R³, -S-R³, -SO-R³ oder -SO₂-R³ bedeuten, wobei

R³ für C₁-C₁₂-Alkyl, halogensubstituiertes, C₁-C₁₂-Alkyl, durch Phenyl, Cyano oder C₁-C₃-Alkoxy monosubstituiertes C₁-C₁₂-Alkyl, Phenyl, durch Halogen, C₁-C₃-Alkyl, C₁-C₃-Alkoxy oder Nitro monosubstituiertes Phenyl, C₃-C₆-Cycloalkyl, C₄-C₈-Cycloalkylalkyl, C₂-C₁₂-Alkenyl, halogensubstituiertes C₂-C₁₂-Alkenyl, C₂-C₁₂-Alkynyl oder halogensubstituiertes C₂-C₁₂-Alkynyl steht, mit der Massgabe, dass der Substituent R³ höchstens 12 Kohlenstoffatome enthält,

R² für Halogen, Wasserstoff, Cyano, C₁-C₃-Alkoxy-carbonyl, C₁-C₆-Alkyl, durch Halogen oder C₁-C₃-Alkoxy substituiertes C₁-C₆-Alkyl, C₂-C₆-Alkenyl, durch Halogen oder C₁-C₃-Alkoxy substituiertes C₂-C₆-Alkenyl, C₂-C₆-Alkynyl, C₃-C₆-Cycloalkyl, durch Halogen, C₁-C₃-Alkyl oder C₁-C₃-Alkoxy substituiertes C₃-C₆-Cycloalkyl, C₄-C₆-Cycloalkenyl, C₄-C₈-Cycloalkylalkyl, Phenyl-C₁-C₃-alkyl, Furyl, Naphthyl, Thienyl, -O-R⁴, -S-R⁴, -SO-R⁴, -SO₂-R⁴ oder



steht,

R⁴ für C₁-C₃-Alkyl, halogensubstituiertes C₁-C₃-Alkyl, C₂-C₃-Alkenyl, halogensubstituiertes C₂-C₃-Alkenyl, Benzyl, Phenyl oder durch Halogen, C₁-C₃-Alkyl oder C₁-C₃-Alkoxy substituiertes Phenyl steht,

die Reste

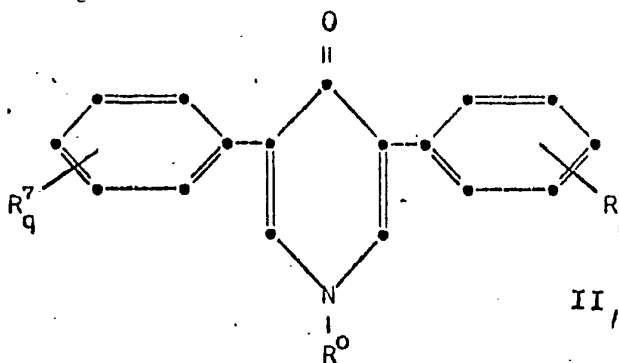
R⁵ unabhängig voneinander Halogen, C₁-C₈-Alkyl, halogensubstituiertes C₁-C₈-Alkyl, durch Phenyl, Cyano oder C₁-C₃-Alkoxy monosubstituiertes C₁-C₈-Alkyl, C₂-C₈-Alkenyl, halogensubstituiertes C₂-C₈-Alkenyl, C₂-C₈-Alkynyl, halogensubstituiertes C₂-C₈-Alkynyl, C₃-C₆-Cycloalkyl, C₄-C₆-Cycloalkenyl, C₄-C₈-Cycloalkylalkyl, C₁-C₃-Alkanoyloxy, C₁-C₃-Alkylsulfonyloxy, Phenyl, durch Halogen, C₁-C₃-Alkyl, C₁-C₃-Alkoxy oder Nitro monosubstituiertes Phenyl, Nitro, Cyano, Carboxy, Hydroxy, C₁-C₃-Alkoxy-carbonyl, -O-R⁶, -S-R⁶, -SO-R⁶ oder -SO₂-R⁶ bedeuten, wobei

R⁶ für C₁-C₁₂-Alkyl, halogensubstituiertes C₁-C₁₂-Alkyl, durch Phenyl, Cyano oder C₁-C₃-Alkoxy monosubstituiertes C₁-C₁₂-Alkyl, Phenyl, durch Halogen, C₁-C₃-Alkyl, C₁-C₃-Alkoxy oder Nitro monosubstituiertes Phenyl, C₃-C₆-Cycloalkyl, C₄-C₈-Cycloalkylalkyl, C₂-C₁₂-Alkenyl, halogensubstituiertes C₂-C₁₂-Alkenyl, C₂-C₁₂-Alkynyl oder halogensubstituiertes C₂-C₁₂-Alkynyl steht, mit der Massgabe, dass der Substituent R⁶ höchstens 12 Kohlenstoffatome enthält,

die Indices

m und n unabhängig voneinander 0, 1 oder 2 bedeuten, wobei der Index m für 1 oder 2 steht, falls R für Wasserstoff oder Methyl steht und R² unsubstituiertes Phenyl darstellt, bzw. der Salze der Verbindungen der Formel I als aktive Komponente eines herbiziden Mittels.

40. Verwendung nach Patentanspruch 39, dadurch gekennzeichnet, dass man als Verbindung der Formel I eine Verbindung der folgenden Formel II



verwendet, worin

R⁰ für C₁–C₃-Alkyl, C₂–C₃-Alkenyl oder Methoxy steht, p und q gleich oder verschieden sind und 0, 1 oder 2 bedeuten, die Reste

R⁷ gleich oder verschieden sind und für Halogen, C₁–C₃-Alkyl, Trifluormethyl oder C₁–C₃-Alkoxy stehen, die Reste

R⁸ gleich oder verschieden sind und Halogen, C₁–C₃-Alkyl, Trifluormethyl oder C₁–C₃-Alkoxy sind oder zwei Reste R⁸ in o- und m-Stellung zueinander benachbart sind und zusammen mit dem Phenylring, an den sie gebunden sind, eine 1-Naphthylgruppe bilden.

41. Verwendung nach Patentanspruch 39, dadurch gekennzeichnet, dass man in dem herbiziden Mittel eine Wirkstoffkomponente der Formel I verwendet, in welcher der Rest R¹ sich in der meta-Stellung des Phenylkernes befindet, wobei dieser Substituent vorzugsweise die Bedeutung einer Trifluormethylgruppe besitzt.

42. Verwendung nach Patentanspruch 39, dadurch gekennzeichnet, dass man in dem herbiziden Mittel als Wirkstoffkomponente der Formel I eine der folgenden Verbindungen:

1-Methyl-3-phenyl-5-(3-trifluormethylphenyl)-4(1H)-pyridon,
1-Methyl-3,5-bis(3-trifluormethylphenyl)-4(1H)-pyridon,
3-Phenyl-1-(2,2,2-trifluoräthyl)-5-(3-trifluormethylphenyl)-4(1H)-pyridon,
3-(3-Bromphenyl)-5-(3-chlorphenyl)-1-methyl-4(1H)-pyridon,
3-(3-Chlorphenyl)-5-(4-chlorphenyl)-1-Methyl-4(1H)-pyridon,
3-(2-Fluorphenyl)-1-methyl-5-(3-trifluormethylphenyl)-4(1H)-pyridon,
3-(2-Chlorphenyl)-5-(3-chlorphenyl)-1-methyl-4(1H)-pyridon,
3-(3-Methoxyphenyl)-1-methyl-5-(3-trifluormethylphenyl)-4(1H)-pyridon,
3-(4-Chlorphenyl)-1-methyl-5-(3-trifluormethylphenyl)-4(1H)-pyridon,
1-Allyl-3-Phenyl-5-(3-trifluormethylphenyl)-4(1H)-pyridon,
3-(4-Isopropylphenyl)-1-methyl-5-phenyl-4(1H)-pyridon,
3-(2-Chlorphenyl)-1-methyl-5-(3-trifluormethylphenyl)-4(1H)-pyridon,
3-(3-Fluorphenyl)-1-methyl-5-(3-trifluormethylphenyl)-4(1H)-pyridon,
3-(4-Fluorphenyl)-1-methyl-5-(3-trifluormethylphenyl)-4(1H)-pyridon,
3-(4-Methoxyphenyl)-1-methyl-5-(3-trifluormethylphenyl)-4(1H)-pyridon,

1-Methyl-3-(3-methylthiophenyl)-5-phenyl-4(1H)-pyridon,
1-Methyl-3-(3-methylsulfinylphenyl)-5-phenyl-4(1H)-pyridon,
1-Methyl-3-(3-methylsulfonylphenyl)-5-phenyl-4(1H)-pyridon,
1-Methyl-3-phenyl-5-(4-trifluormethylphenyl)-4(1H)-pyridon,
3-(3-Benzyloxyphenyl)-1-methyl-5-phenyl-4(1H)-pyridon,
1-Methyl-3-phenyl-5-(2-thienyl)-4(1H)-pyridon,
3-(3-Isobutylphenyl)-1-methyl-5-phenyl-4(1H)-pyridon,
1-Methyl-3-(3-nitrophenyl)-5-phenyl-4(1H)-pyridon,
3-(2,4-Dichlorphenyl)-1-methyl-5-phenyl-4(1H)-pyridon,
3,5-Diphenyl-1-äthyl-4(1H)-pyridon,
1-Allyl-3,5-diphenyl-4(1H)-pyridon,
3,5-Diphenyl-1-isopropyl-4(1H)-pyridon,
1-Cyanomethyl-3,5-diphenyl-4(1H)-pyridon,
3,5-Diphenyl-1-propyl-4(1H)-pyridon,
3,5-Diphenyl-1-methoxy-4(1H)-pyridon,
3-(3-Fluorphenyl)-1-methyl-5-phenyl-4(1H)-pyridon,
3-(4-Bromphenyl)-1-methyl-5-phenyl-4(1H)-pyridon,
3-(4-Methoxyphenyl)-1-methyl-5-phenyl-4(1H)-pyridon,
3-(3-Chlorphenyl)-1-methyl-5-phenyl-4(1H)-pyridon,
3-(4-Chlorphenyl)-1-methyl-5-phenyl-4(1H)-pyridon,
1-Methyl-3-(1-naphthyl)-5-phenyl-4(1H)-pyridon,
3,5-Bis(3-chlorphenyl)-1-methyl-4(1H)-pyridon,
1-Methyl-3-(3-methylphenyl)-5-phenyl-4(1H)-pyridon,
1-Methyl-3-(4-methylphenyl)-5-phenyl-4(1H)-pyridon,
1-Methyl-3-(2-methylphenyl)-5-phenyl-4(1H)-pyridon,
3-(4-Fluorphenyl)-1-methyl-5-phenyl-4(1H)-pyridon,
3-(3-Methoxyphenyl)-1-methyl-5-phenyl-4(1H)-pyridon,
3-(3,4-Dichlorphenyl)-1-methyl-5-phenyl-4(1H)-pyridon,
3-(2,5-Dichlorphenyl)-1-methyl-5-phenyl-4(1H)-pyridon,
3-(2-Chlorphenyl)-1-methyl-5-phenyl-4(1H)-pyridon,
3,5-Bis(3-fluorphenyl)-1-methyl-4(1H)-pyridon,
3-(3-Chlorphenyl)-5-(3-fluorphenyl)-1-methyl-4(1H)-pyridon,
3-(3,5-Dichlorphenyl)-1-methyl-5-phenyl-4(1H)-pyridon,
3,5-Bis(3-bromphenyl)-1-methyl-4(1H)-pyridon,
3-(3-Bromphenyl)-1-methyl-5-phenyl-4(1H)-pyridon,
3-(2-Fluorphenyl)-1-methyl-5-phenyl-4(1H)-pyridon,
3-(3-Bromphenyl)-1-methyl-5-(3-trifluormethylphenyl)-4(1H)-pyridon,
1-(1-Carboxyäthyl)-3-phenyl-5-(3-trifluormethylphenyl)-4(1H)-pyridon,
1-Dimethylamino-3,5-diphenyl-4(1H)-pyridon,
1-Methyl-3-(2-naphthyl)-5-phenyl-4(1H)-pyridon,
1-Äthyl-3-phenyl-5-(3-trifluormethylphenyl)-4(1H)-pyridon,
3-Phenyl-1-propyl-5-(3-trifluormethylphenyl)-4(1H)-pyridon,
1-Methoxy-3-phenyl-5-(3-trifluormethylphenyl)-4(1H)-pyridon,
3-(3-Chlorphenyl)-1-methyl-5-(3-trifluormethylphenyl)-4(1H)-pyridon,
3-(4-Biphenyl)-1-methyl-5-phenyl-4(1H)-pyridon,
3-(3-Biphenyl)-1-methyl-5-phenyl-4(1H)-pyridon,
1-Methyl-3-phenyl-4(1H)-pyridon,
3-Brom-1-methyl-5-phenyl-4(1H)-pyridon,
3-Brom-1-methyl-5-(3-trifluormethylphenyl)-4(1H)-pyridon,
1-Methyl-3-(3-trifluormethylphenyl)-4(1H)-pyridon,
3-Chlor-1-methyl-5-(3-trifluormethylphenyl)-4(1H)-pyridon,
3-(3-Carboxyphenyl)-1-methyl-5-phenyl-4(1H)-pyridon,
3-(3-Cyanophenyl)-1-methyl-5-phenyl-4(1H)-pyridon,
3-(3-Äthoxycarbonylphenyl)-1-methyl-5-phenyl-4(1H)-pyridon,
3,5-Bis(3-cyanophenyl)-1-methyl-4(1H)-pyridon,
1-Methyl-3-phenyl-5-(3-thienyl)-4(1H)-pyridon,
3-Cyano-1-methyl-5-phenyl-4(1H)-pyridon,
1,3-Dimethyl-5-(3-trifluormethylphenyl)-4(1H)-pyridon,
1,3-Dimethyl-5-phenyl-4(1H)-pyridon,
3-(3-Chlorphenyl)-1,5-dimethyl-4(1H)-pyridon,
3-Äthyl-1-methyl-5-(3-trifluormethylphenyl)-4(1H)-pyridon,
3-Cyclohexyl-1-methyl-5-(3-trifluormethylphenyl)-4(1H)-pyridon,
3-Isopropyl-1-methyl-5-(3-trifluormethylphenyl)-4(1H)-pyridon,

3-Hexyl-1-methyl-5-(3-trifluormethylphenyl)-4(1H)-pyridon,
 3-Benzyl-1-methyl-5-(3-trifluormethylphenyl)-4(1H)-pyridon,
 3-Butyl-1-methyl-5-(3-trifluormethylphenyl)-4(1H)-pyridon,
 3-(3-Cyclohexenyl)-1-methyl-5-(3-trifluormethylphenyl)-4(1H)-pyridon,
 1-Methyl-3-propyl-5-(3-trifluormethylphenyl)-4(1H)-pyridon,
 1-Methyl-3-(4-nitrophenyl)-5-phenyl-4(1H)-pyridon,
 3,5-Bis(3,4-dimethoxyphenyl)-1-methyl-4(1H)-pyridon,
 3-Äthoxycarbonyl-1-methyl-5-phenyl-4(1H)-pyridon,
 3-(2-Furyl)-1-methyl-5-phenyl-4(1H)-pyridon,
 3-Cyano-1-methyl-5-(3-trifluormethylphenyl)-4(1H)-pyridon,
 3-(3,4-Dimethoxyphenyl)-1-methyl-5-phenyl-4(1H)-pyridon,
 3-(3,4-Dibromocyclohexyl)-1-methyl-5-(3-trifluormethylphenyl)-4(1H)-pyridon-hydrobromid,
 3-(3-Isopropenylphenyl)-1-methyl-5-phenyl-4(1H)-pyridon,
 3-(3-Äthylphenyl)-1-methyl-5-phenyl-4(1H)-pyridon,
 3-(3-Hexylphenyl)-1-methyl-5-phenyl-4(1H)-pyridon,
 3-(4-Äthylphenyl)-1-methyl-5-phenyl-4(1H)-pyridon,
 3-(3-Cyclohexylmethylphenyl)-1-methyl-5-phenyl-4(1H)-pyridon,
 1-Methyl-3-phenyl-5-benzylthio-4(1H)-pyridon,
 1-Methyl-3-phenyl-5-phenylthio-4(1H)-pyridon,
 1-Methyl-3-phenoxy-5-phenyl-4(1H)-pyridon,
 1-Methyl-3-phenyl-5-phenylsulfonyl-4(1H)-pyridon,
 3-Methoxy-1-methyl-5-phenyl-4(1H)-pyridon,
 3-(3-Hydroxyphenyl)-1-methyl-5-phenyl-4(1H)-pyridon,
 3-Cyclohexyl-5-(3-hydroxyphenyl)-1-methyl-4(1H)-pyridon,
 3-(3-Äthoxyphenyl)-1-methyl-5-phenyl-4(1H)-pyridon,
 3-(3-Allyloxyphenyl)-1-methyl-5-phenyl-4(1H)-pyridon,
 3-[3-(1-Fluor-2-jodvinyl)oxy]phenyl-1-methyl-5-phenyl-4(1H)-pyridon,
 3-(3-Isopropoxyphenyl)-1-methyl-5-phenyl-4(1H)-pyridon,
 3-(3-Cyanomethoxyphenyl)-1-methyl-5-phenyl-4(1H)-pyridon,
 3-(3-Dodecyloxyphenyl)-1-methyl-5-phenyl-4(1H)-pyridon,
 1-Methyl-3-[3-(4-nitrophenoxy)phenyl]-5-phenyl-4(1H)-pyridon,
 1-Methyl-3-(3-methylsulfonyloxyphenyl)-5-phenyl-4(1H)-pyridon,
 1-Methyl-3-phenyl-5-[3-(1,1,2,2-tetrafluoräthoxy)phenyl]-4(1H)-pyridon,
 3-(3-Acetoxyphenyl)-1-methyl-5-phenyl-4(1H)-pyridon,
 3-(3-Hexyloxyphenyl)-1-methyl-5-phenyl-4(1H)-pyridon,
 3-(3-Decyloxyphenyl)-1-methyl-5-phenyl-4(1H)-pyridon,
 1-Methyl-3-phenyl-5-(3-propoxyphenyl)-4(1H)-pyridon,
 1-Methyl-3-phenyl-5-(3-propargyloxyphenyl)-4(1H)-pyridon,
 3-(3-Cyclohexylmethoxyphenyl)-1-methyl-5-phenyl-4(1H)-pyridon,
 1-Methyl-3-(3-octyloxyphenyl)-5-phenyl-4(1H)-pyridon,
 1-Methyl-3-(3-phenoxyphenyl)-5-phenyl-4(1H)-pyridon,
 1-Acetoxy-3,5-diphenyl-4(1H)-pyridon,
 1-Methyl-3,5-diphenyl-4(1H)-pyridon-hydrojodid,
 1-Methyl-3,5-diphenyl-4(1H)-pyridon-hydrochlorid,
 3,5-Diphenyl-1-methyl-4(1H)-pyridinthion,
 3,5-Bis(3-chlorphenyl)-1-methyl-4(1H)-pyridinthion,
 3-(3-Chlorphenyl)-1-methyl-5-phenyl-5(1H)-pyridinthion,
 1-Methyl-3-phenyl-5-(3-trifluormethylphenyl)-4(1H)-pyridinthion,
 verwendet.

Die vorliegende Erfindung betrifft ein Verfahren zur Herstellung von 3-Phenyl-5-substituierten-4(1H)-pyridonen.

Diese neuen Pyridone können als Wirkstoffkomponente von herbiziden Mitteln verwendet werden. Dabei können diese neuen Herbizide Vorlaufherbizide oder Nachlaufherbizide sein, die zur Bekämpfung einer grossen Anzahl an Unkräutern geeignet sind.

Die Bekämpfung von Unkräutern ist ein lebenswichtiger Schritt bei der Maximierung von Ernteausbeuten, und Herbizide

haben sich daher als lebenswichtige Werkzeuge der Landwirtschaft erwiesen, wobei stets Bedarf an neuen und besseren herbiziden Verbindungen besteht.

Trotz des grossen Forschungsaufwandes auf dem Gebiet der Agrochemie wurden bisher keine Wirkstoffe gefunden, die zu den Verbindungen der vorliegenden Formel I nahe verwandt sind. Die Polyhalogenpyridone, deren Pyridinring mit zwei oder mehr Chloratomen und auch anderen Alkyl- sowie Halogensubstituenten substituiert ist, sind bekannte Herbizide. Sie unterscheiden sich jedoch offensichtlich ziemlich stark von den Verbindungen der Formel I.

In der organischen Chemie wurden die Pyridone ziemlich ausgiebig bearbeitet. So wird beispielsweise in J. Am. Chem. Soc. 95, 3396–3397 (1973) eine Umlagerung von 3,5-Diphenyl-1,2,6-trimethyl-4(1H)-pyridon beschrieben. Diese Verbindungen sind jedoch keine Herbizide. In J. Am. Chem. Soc. 77, 1852–1855 (1955) wird die Synthese von 3,5-Dibenzyl-1-methyl-4(1H)-pyridonen angegeben, diese Verbindungen verfügen jedoch ebenfalls über keine herbizide Wirkung. In J. Am. Chem. Soc. 79, 156–160 (1957) werden vom Hauptautor der letztgenannten Arbeit auch 3,5-Di(substituierte-benzyliden)tetrahydro-4-pyridone beschrieben. Diese Verbindungen sind ebenfalls nicht herbizid wirksam.

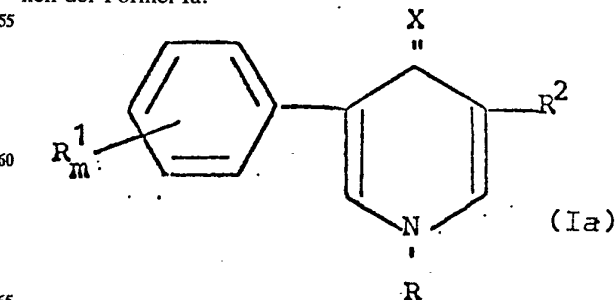
Aus J. Org. Chem. 25, 538–546 (1960) geht eine Reihe von 4-Pyridonverbindungen unter Einschluss von 2,6-Diphenyl-1-methyl-4(1H)-pyridon sowie verwandten Verbindungen, die am Phenylring substituiert sind, hervor, keine dieser Verbindungen verfügt jedoch über eine herbizide Wirksamkeit.

Ein interessanter Artikel wurde neulich in J. Hetero. Chem. 10, 665–667 (1973) veröffentlicht. Hierin wird eine Synthese für 3,5-Diphenyl-1-methyl-4(1H)-pyridon und damit verwandte Verbindungen beschrieben, indem man das Natriumsalz von 1,5-Dihydroxy-2,4-diphenyl-1,4-pentadien-3-on mit Methylamin umsetzt.

In der Veröffentlichung von Benary und Bitter in Ber. 61, 1058 (1928) wird ein Verfahren zur Herstellung von 3,5-Diphenyl-4(1H)-pyridon beschrieben. Nach diesem Verfahren wird durch Kondensation von 1,3-Diphenyl-2-propanon mit Ameisensäureäthylester in Gegenwart von Natriummethoxid zunächst das 1,5-Dihydroxy-2,4-diphenyl-1,4-pentadien-3-on hergestellt. Dieses als Zwischenprodukt gebildete Pentadienon wird dann mit einer starken Säure neutralisiert, wodurch sich das 3,5-Diphenyl-4-pyridon bildet. Durch Umsetzung dieses Pyridons mit Ammoniumacetat bei erhöhter Temperatur erhält man dann das gewünschte Endprodukt, nämlich das 3,5-Diphenyl-4(1H)-pyridon.

Ziel der vorliegenden Erfindung war es, neue 3-Phenyl-5-substituierte-4(1H)-pyridone und auch entsprechende Thione herzustellen, die in freier Form oder in Form von deren Salzen als Wirkstoffkomponente von herbiziden Mitteln verwendet werden können.

Gegenstand der vorliegenden Erfindung ist daher ein Verfahren zur Herstellung von 3-Phenyl-5-substituierten-4(1H)-pyridonen der Formel Ia:



worin

X Sauerstoff bedeutet,

R für Wasserstoff, einen Alkylrest mit 1–3 Kohlenstoffato-

men, einen durch Halogen, Cyano, Carboxy oder Methoxycarbonyl substituierten Alkylrest mit 1–3 Kohlenstoffatomen im Alkylteil, einen Alkenylrest mit 2 oder 3 Kohlenstoffatomen, einen Alkynylrest mit 2 oder 3 Kohlenstoffatomen, einen Alkoxyrest mit 1 bis 3 Kohlenstoffatomen, den Hydroxy- oder Dimethylaminorest steht, mit der Massgabe, dass der Substituent R insgesamt nicht mehr als 3 Kohlenstoffatome enthält,

die Reste

R^1 unabhängig voneinander Halogen, Alkylgruppen mit 1–8 Kohlenstoffatomen, halogensubstituierte Alkylgruppen mit 1–8 Kohlenstoffatomen, mit Phenyl, Cyano oder Alkoxygruppen mit 1–3 Kohlenstoffatomen, monosubstituierte Alkylreste mit 1–8 Kohlenstoffatomen, Alkenylreste mit 2–8 Kohlenstoffatomen, halogensubstituierte Alkenylreste mit 2–8 Kohlenstoffatomen, Alkynylreste mit 2–8 Kohlenstoffatomen, halogensubstituierte Alkynylreste mit 2–8 Kohlenstoffatomen, Cycloalkylreste mit 3–6 Kohlenstoffatomen, Cycloalkenylreste mit 4–6 Kohlenstoffatomen, Cycloalkylalkylreste mit 4–8 Kohlenstoffatomen, Alkanoyloxyreste mit 1–3 Kohlenstoffatomen, Alkylsulfonyloxyreste mit 1–3 Kohlenstoffatomen, Phenylreste, durch Halogen, Alkyl mit 1–3 Kohlenstoffatomen, Alkoxy mit 1–3 Kohlenstoffatomen oder Nitro monosubstituierte Phenylreste, Nitro-, Cyano-, Carboxy- oder Hydroxygruppen, Alkoxy-carbonylgruppen mit 1–3 Kohlenstoffatomen, oder Gruppierungen der Formeln $-O-R^3$, $-S-R^3$, $-SO-R^3$ oder SO_2-R^3 bedeuten, worin

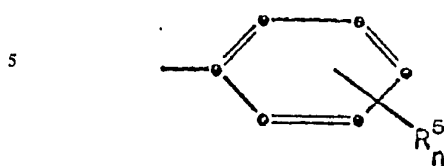
R^3 für einen Alkylrest mit 1–12 Kohlenstoffatomen, halogensubstituierten Alkylrest mit 1–12 Kohlenstoffatomen, durch Phenyl, Cyano oder eine Alkoxygruppe mit 1–3 Kohlenstoffatomen monosubstituierten Alkylrest mit 1–12 Kohlenstoffatomen, einen Phenylrest, einen durch Halogen, Alkyl mit 1–3 Kohlenstoffatomen, Alkoxy mit 1–3 Kohlenstoffatomen oder Nitro monosubstituierten Phenylrest, einen Cycloalkylrest mit 3–6 Kohlenstoffatomen, einen Cycloalkylalkylrest mit 4–8 Kohlenstoffatomen, einen Alkenylrest mit 2–12 Kohlenstoffatomen, einen halogensubstituierten Alkenylrest mit 2–12 Kohlenstoffatomen, einen Alkynylrest mit 2–12 Kohlenstoffatomen oder einen halogensubstituierten Alkynylrest mit 2–12 Kohlenstoffatomen steht, mit der Massgabe, dass der Rest R^3 insgesamt höchstens 12 Kohlenstoffatome enthält,

R^2 für Halogen, Wasserstoff, eine Alkoxy-carbonylgruppe mit 1–3 Kohlenstoffatomen, eine Alkylgruppe mit 1–6 Kohlenstoffatomen, eine durch Halogen oder Alkoxy mit 1–3 Kohlenstoffatomen substituierte Alkylgruppe mit 1–6 Kohlenstoffatomen, einen Alkenylrest mit 2–6 Kohlenstoffatomen, einen durch Halogen oder Alkoxy mit 1–3 Kohlenstoffatomen substituierten Alkenylrest mit 2–6 Kohlenstoffatomen, einen Alkynylrest, einen Cycloalkylrest mit 3–6 Kohlenstoffatomen, einen durch Halogen, Alkyl mit 1–3 Kohlenstoffatomen oder Alkoxy mit 1–3 Kohlenstoffatomen substituierten Cycloalkylrest mit 3–6 Kohlenstoffatomen, einen Cycloalkenylrest mit 4–6 Kohlenstoffatomen, einen Cycloalkylalkylrest mit 4–8 Kohlenstoffatomen, einen phenylsubstituierten Alkylrest mit 1–3 Kohlenstoffatomen in der Alkylgruppe, ein Furyl-, Naphthyl- oder Thienylrest, eine Gruppierung der Formeln $-O-R^4$, $-S-R^4$, $-SO-R^4$ oder $-SO_2-R^4$, worin

R^4 für einen Alkylrest mit 1–3 Kohlenstoffatomen, einen halogensubstituierten Alkylrest mit 1–3 Kohlenstoffatomen, einen Alkenylrest mit 2 oder 3 Kohlenstoffatomen, einen halogensubstituierten Alkenylrest mit 2 oder 3 Kohlenstoffatomen, einen Benzyl- oder Phenylrest, oder einen durch Halogen, Alkyl mit 1–3 Kohlenstoffatomen oder Alkoxy mit 1–3 Kohlenstoffatomen substituierten Phenylrest steht, oder

der Rest

R^2 ein Phenylrest der Formel



ist, worin die Reste

R^5 unabhängig voneinander Halogen, Alkylgruppen mit 1–8 Kohlenstoffatomen, halogensubstituierte Alkylgruppen mit 1–8 Kohlenstoffatomen, durch Phenyl, Cyano oder Alkoxy mit 1–3 Kohlenstoffatomen monosubstituierte Alkylgruppen mit 1–8 Kohlenstoffatomen, Alkenylgruppen mit 2–8 Kohlenstoffatomen, halogensubstituierte Alkenylgruppen mit 2–8 Kohlenstoffatomen, Alkynylgruppen mit 2–8 Kohlenstoffatomen, halogensubstituierte Alkynylgruppen mit 2–8 Kohlenstoffatomen, Cycloalkylgruppen mit 3–6 Kohlenstoffatomen, Cycloalkenylgruppen mit 4–6 Kohlenstoffatomen, Cycloalkylalkylgruppen mit 4–6 Kohlenstoffatomen, Alkanoyloxygruppen mit 1–3 Kohlenstoffatomen, Alkylsulfonyloxygruppen mit 1–3 Kohlenstoffatomen, Phenyl, durch Halogen, Alkyl mit 1–3 Kohlenstoffatomen, Alkoxy mit 1–3 Kohlenstoffatomen monosubstituierte Phenylgruppen, oder Nitro-, Cyano-, Carboxy-, oder Hydroxygruppen, Alkoxy-carbonylgruppen mit 1–3 Kohlenstoffatomen oder Gruppierungen der Formeln $-O-R^6$, $-S-R^6$, $-SO-R^6$ oder $-SO_2-R^6$ bedeuten, worin

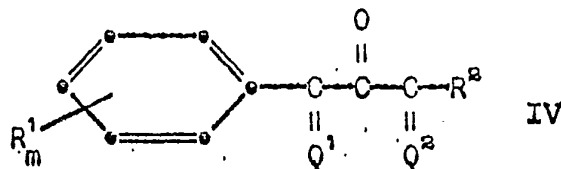
R^6 eine Alkylgruppe mit 1–12 Kohlenstoffatomen, eine halogensubstituierte Alkylgruppe mit 1–12 Kohlenstoffatomen, eine durch Phenyl, Cyano oder eine Alkoxygruppe mit 1–3 Kohlenstoffatomen monosubstituierte Alkylgruppe mit 1–12 Kohlenstoffatomen, eine Phenylgruppe, eine durch Halogen, eine Alkylgruppe mit 1–3 Kohlenstoffatomen, eine Alkoxygruppe mit 1–3 Kohlenstoffatomen oder eine Nitrogruppe monosubstituierte Phenylgruppe, eine Cycloalkylgruppe mit 3–6 Kohlenstoffatomen, eine Cycloalkylalkylgruppe mit 4–8 Kohlenstoffatomen, eine Alkenylgruppe mit 2–12 Kohlenstoffatomen, eine halogensubstituierte Alkenylgruppe mit 2–12 Kohlenstoffatomen, eine Alkynylgruppe mit 2–12 Kohlenstoffatomen oder eine halogensubstituierte Alkynylgruppe mit 2–12 Kohlenstoffatomen steht, mit der Massgabe, dass der Substituent R^6 höchstens 12 Kohlenstoffatome enthält, und die Indices

m und n unabhängig voneinander 0, 1 oder 2 bedeuten, wobei jedoch der Index m für 1 oder 2 steht, falls R ein Wasserstoffatom oder eine Methylgruppe bedeutet, und ausserdem R^2 ein unsubstituierter Phenylrest ist,

bzw. von Salzen der Verbindungen der Formel Ia.

Die entsprechende Verbindung der Formel Ia, in welcher m = 0 ist, R^2 für einen unsubstituierten Phenylrest steht und R ein Wasserstoffatom bedeutet, nämlich das 3,5-Diphenyl-4(1H)-pyridon, ist bereits aus der oben erwähnten Veröffentlichung von Benary und Bitter in Ber. 61, 1058 (1928) bekannt. Auch das entsprechende 1-Methylderivat, nämlich das 3,5-Diphenyl-1-methyl-4(1H)-pyridon, ist bereits in der Literatur beschrieben.

Das erfindungsgemässe Verfahren zur Herstellung der neuen Pyridone der Formel Ia ist dadurch gekennzeichnet, dass man eine Verbindung der Formel IV



in welcher

R^1 , R^2 und m die in Formel Ia angegebene Bedeutung haben, und jeder der beiden Substituenten

Q^1 und Q^2 eine Gruppierung der Formel $=CH - n(R^9)_2$ bedeutet, in welcher die Reste

R^9 unabhängig voneinander für Alkylreste mit 1–3 Kohlenstoffatomen stehen, oder die Reste R^9 zusammen mit dem Stickstoffatom, an welches sie gebunden sind, einen Pyrrolidino-, Piperidino-, Morpholino- oder N-Methylpiperazino- rest bilden,

mit einer Verbindung der Formel



worin

R die gleiche Bedeutung aufweist wie in Formel Ia, oder einem Säureadditionssalz dieser Verbindung cyclisiert.

Bei der Durchführung des erfindungsgemässen Verfahrens kann also als Cyclisierungsmittel zur Cyclisierung der Ausgangsmaterialien der Formel IV Ammoniak (R bedeutet ein Wasserstoffatom), Hydroxylamin (R bedeutet Hydroxy), Dimethylhydrazin (R bedeutet Dimethylamino), oder ein entsprechendes Amin oder auch ein Salz dieser Verbindungen verwendet werden.

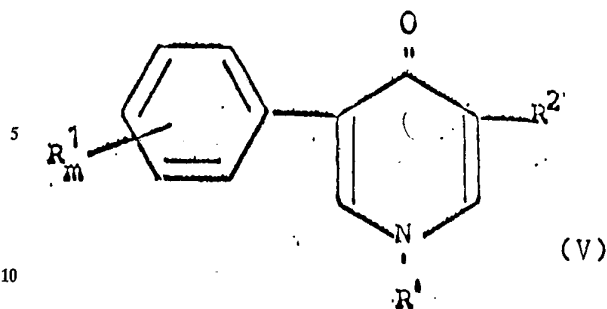
Wenn man die Cyclisierung mit Ammoniak oder einem Säureadditionssalz desselben durchführt, dann erhält man eine Verbindung der Formel Ia, in welcher R ein Wasserstoffatom ist.

Gemäss einer Ausführungsart des erfindungsgemässen Verfahrens kann man zunächst eine Verbindung der Formel Ia herstellen, in welcher R ein Wasserstoffatom ist, und diese dann in eine Verbindung der Formel Ia überführen, in welcher R ein Alkylrest mit 1–3 Kohlenstoffatomen, ein durch Halogen, Cyano, Carboxy oder Methoxycarbonyl substituierter Alkylrest mit 1–3 Kohlenstoffatomen, ein Alkenylrest mit 2 oder 3 Kohlenstoffatomen oder ein Alkylrest mit 2 oder 3 Kohlenstoffatomen ist, indem man am Stickstoffatom den entsprechenden Rest nach der Methode der N-Alkylierung einführt.

Die N-Alkylierung der entsprechenden Verbindung der Formel Ia, in welcher R ein Wasserstoffatom ist, kann durchgeführt werden, indem man den entsprechenden Substituenten R mit einem Halogenid oder, im Falle entsprechender Alkylreste, mit einem Dialkylsulfat einführt.

Die nachträgliche Alkylierung am Stickstoffatom kann jedoch auch durchgeführt werden, indem man das entsprechende 1-unsubstituierte Pyridon der Formel Ia zunächst durch Umsetzung mit einem Halogenierungsmittel oder einem Alkylierungsmittel in das entsprechende 4-Halogenderivat oder das entsprechende 4-Alkoxyderivat überführt. Zu diesem Zwecke sind als Halogenierungsmittel beispielsweise $POCl_3$, $POBr_3$ oder PCl_5 geeignet. Als O-Alkylierungsmittel kommen beispielsweise Methyltrifluormethansulfonat oder Methylfluorsulfonat, sowie auch Alkylhalogenide in Gegenwart einer Base in Frage. In der nächsten Arbeitsstufe wird die 4-Halogen- oder 4-Alkoxy-Verbindung dann mit einem Halogenid des Substituenten R umgesetzt, wodurch das 1-R-Substituierte-4-substituierte-pyridiniumsalz entsteht. Das dabei erhaltene Salz wird zur Bildung des gewünschten Produktes anschliessend entweder mit einer Mineralsäure oder einem Alkalihydroxid hydrolysiert. Im einzelnen wird hierzu auf Pharm. Bull. [Japan 1, 70–74 (1953)] verwiesen.

Wenn man bei der Durchführung des erfindungsgemässen Verfahrens als Cyclisierungsmittel Hydroxylamin oder ein Salz desselben verwendet, dann erhält man ein entsprechendes Pyridon der Formel Ia, in welchem R ebenfalls ein Hydroxyrest ist. Dieses Produkt kann dann anschliessend verestert werden, beispielsweise einer Acetylierung unterworfen werden, wobei man ein entsprechendes 3-Phenyl-5-substituiertes-4(1H)-pyridon der Formel V

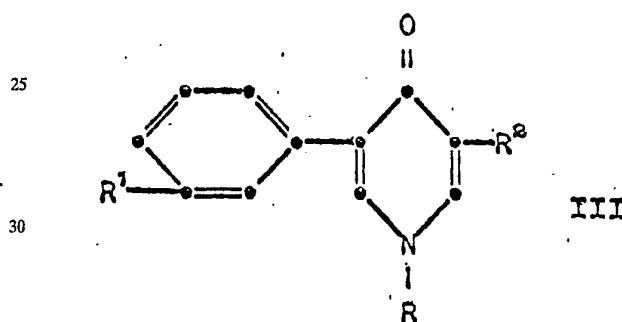


erhält, worin

R' ein Acetoxyrest ist, und die Reste

R^1 , R^2 und m die gleiche Bedeutung aufweisen wie in Formel Ia, und es kann natürlich auch ein Salz der Verbindung der Formel V hergestellt werden.

In bevorzugten, nach dem erfindungsgemässen Verfahren hergestellten Verbindungen der Formel Ia befindet sich der Substituent R^1 in der m-Stellung des Benzolkernes, und diese Verbindungen weisen also die folgende Formel III

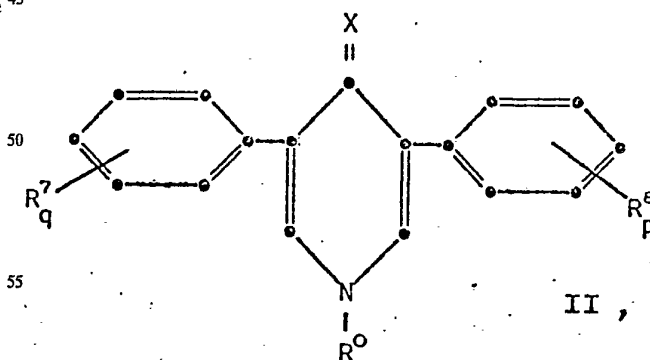


auf, wobei die Reste

R , R^1 und R^2 die gleiche Bedeutung besitzen wie in Formel Ia.

Speziell bevorzugt von diesen Verbindungen der Formel III sind dabei diejenigen, in welchen der Rest R^1 die Bedeutung einer Trifluormethylgruppe aufweist.

Weitere bevorzugte, nach dem erfindungsgemässen Verfahren hergestellte Pyridone der Formel Ia besitzen die folgende Struktur II



worin

X Sauerstoff bedeutet,

R^0 für C_1 – C_3 -Alkyl, C_2 – C_3 -Alkenyl, Acetoxy oder Methoxy steht,

q und p unabhängig voneinander 0, 1 oder 2 bedeuten,

die Reste

R^7 unabhängig voneinander für Halogen, C_1 – C_3 -Alkyl, Trifluormethyl oder C_1 – C_3 -Alkoxy stehen,

die Reste

R^N unabhängig voneinander Halogen, C_1-C_3 -Alkyl, Trifluormethyl oder C_1-C_3 -Alkoxy sind oder sich zwei Reste R^N in o- und m-Stellung zueinander benachbart befinden und zusammen mit dem Phenylring, an den sie gebunden sind, eine 1-Naphthylgruppe bilden.

In den obigen Formeln werden die allgemeinen chemischen Ausdrücke in ihren normalen Bedeutungen verwendet. Die Angaben C_1-C_3 -Alkyl, C_2-C_3 -Alkenyl, C_2-C_3 -Alkynyl, C_1-C_3 -Alkoxy, C_1-C_8 -Alkyl, C_2-C_8 -Alkenyl, C_2-C_8 -Alkynyl, C_1-C_6 -Alkyl, C_2-C_6 -Alkenyl und C_2-C_6 -Alkynyl beziehen sich beispielsweise auf Reste, wie Methyl, Äthyl, Isopropyl, Vinyl, Allyl, Methoxy, Isopropoxy, Propargyl, Isobutyl, Hexyl, Octyl, 1,1-Dimethylpentyl, 2-Octenyl, Pentyl, 3-Hexinyl, 1-Äthyl-2-hexenyl, 3-Octinyl, 5-Heptenyl, 1-Propyl-3-butinyl und Crotyl.

Unter C_3-C_6 -Cycloalkyl und C_4-C_6 -Cycloalkenyl werden beispielsweise Reste verstanden, wie Cyclopropyl, Cyclobutyl, Cyclohexyl, Cyclobutenyl, Cyclopentenyl und Cyclohexadienyl.

Die Angabe C_4-C_8 -Cycloalkylalkyl bezieht sich auf Reste, wie beispielsweise Cyclopropylmethyl, Cyclobutylmethyl, Cyclohexylmethyl und Cyclohexyläthyl.

Mit C_1-C_3 -Alkanoyloxy werden Reste verstanden, wie Formyloxy, Acetoxy und Propionyloxy.

Die Angabe C_1-C_3 -Alkoxy-carbonyl bezieht sich beispielsweise auf Reste, wie Methoxycarbonyl, Äthoxycarbonyl und Isopropoxycarbonyl.

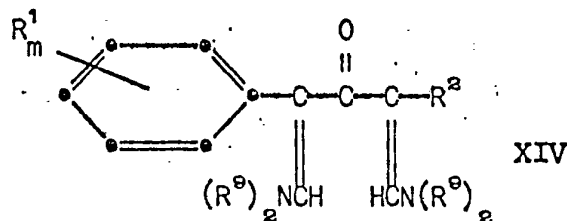
Unter C_1-C_3 -Alkylsulfonyloxy sind Reste gemeint, wie z. B. Methylsulfonyloxy und Propylsulfonyloxy.

Der Ausdruck Halogen bedeutet vorzugsweise Fluor, Chlor, Brom und Jod.

Die oben beschriebenen Verbindungen können Salze, insbesondere Säureadditionssalze bilden. Die bevorzugten Salze sind die Hydrohalogenide, wie die Hydrojodide, Hydrobromide, Hydrochloride und Hydrofluoride. Besonders geeignet sind auch Salze der Sulfonsäuren. Zu derartigen Salzen gehören beispielsweise die Sulfonate, Methylsulfonate und Toluolsulfonate.

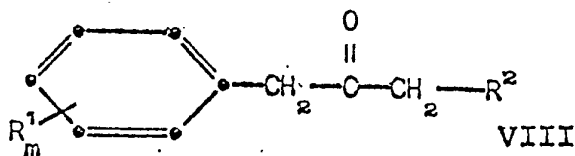
Die Amine der Formel RNH_2 können selbstverständlich auch in Form von Salzen, vorzugsweise in Form von Hydrohalogeniden unter Einschluss von Hydrochloriden oder Hydrobromiden, verwendet werden. Solche Salze eignen sich oft besser als die freien Amine.

Als Ausgangsmaterialien zur Durchführung des erfindungsgemässen Verfahrens benötigt man, wie bereits erwähnt, Verbindungen der Formel IV, in welchen sowohl der Rest Q^1 als auch der Rest Q^2 für eine stickstoffhaltige Gruppierung der angegebenen Struktur steht. Diese Ausgangsmaterialien weisen also die folgende Formel XIV



auf.

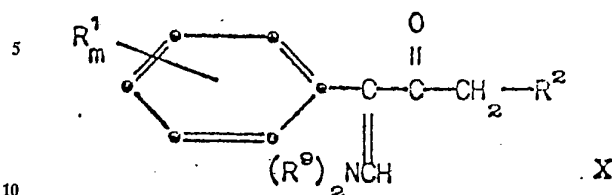
Zur Herstellung dieses Ausgangsmaterials der Formel IV geht man zweckmässigerweise von einem Keton der Formel VIII



aus, in welcher

R^1 , R^2 und m die in Formel Ia angegebene Bedeutung besitzen, und setzt dieses mit einem Aminoformylierungsmittel um, wobei

sich im allgemeinen zunächst als Zwischenprodukt das Enamin-keton der Formel X



bildet, in welcher

R^1 , R^2 und m die gleiche Bedeutung aufweisen wie in Formel Ia, und

die Reste

R^9 unabhängig voneinander für Alkylreste mit 1–3 Kohlenstoffatomen stehen, oder die Reste R^9 zusammen mit dem Stickstoffatom, an welches sie gebunden sind, einen Pyrrolidinorest, Piperidinorest, Morpholinorest oder N-Methylpiperazinorest bilden.

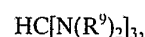
Wie man aus der Formel VIII des eingesetzten Ausgangsmaterials ersieht, wird bei der Durchführung der Aminoformylierungsreaktion eine der beiden CH_2 -Gruppen des Ausgangsmaterials der Formel VIII in die entsprechende stickstoffhaltige Gruppierung umgewandelt. Das hier angeführte Zwischenprodukt der Formel X stellt jedoch nur eine der beiden möglichen Substitutionen dar, und je nach den aktivierenden Eigenschaften der Substituenten R^1 bzw. R^2 des Ausgangsmaterials kann auch bei der Aminoformylierung die andere der beiden genannten CH_2 -Gruppe substituiert werden. Für die Weiterführung der Herstellung des Ausgangsmaterials ist dies jedoch ohne Bedeutung, weil in jedem Fall noch die zweite CH_2 -Gruppe dieses Zwischenproduktes der Formel X durch eine weitere Aminoformylierung in eine zweite derartige Stickstoff enthaltende Gruppierung übergeführt werden muss.

Die zur Herstellung des Ausgangsmaterials der Formel IV benötigten Ketone der Formel VIII sind 2-Propanone, und diese können durch aus der Literatur bekannte Synthesen hergestellt werden. Es wird hierzu beispielsweise auf folgendes Literaturmaterial verwiesen: Coan et al., J. Am. Chem. Soc. 76, 501 (1954); Sullivan et al., «Disodium Tetracarbonylferrate», American Laboratory 49–56 (Juni 1974); Collman et al., «Synthesis of Hemifluorinated Ketones using Disodium Tetracarbonylferrate», J. Am. Chem. Soc. 95, 2689–91 (1973); Collman et al., «Acyl and Alkyl Tetracarbonylferrate Complexes as Intermediates in The Synthesis of Aldehydes and Ketones», J. Am. Chem. Soc. 94, 2516–18 (1972).

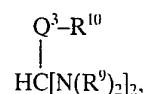
Als Aminoformylierungsmittel zur Einführung der stickstoffhaltigen Gruppe in das zur Herstellung der Ausgangsmaterialien benötigte Keton der Formel VIII können beliebige Verbindungen verwendet werden, die in der Lage sind mit einer aktiven Methylengruppe unter Einführung einer $=CHN(R^9)_2$ -Gruppe oder eines Säureadditionssalzes dieser Gruppierung zu reagieren.

Eine Auswahl geeigneter Aminoformylierungsmittel kann aus den folgenden Verbindungen getroffen werden:

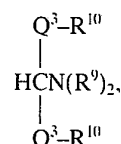
den Orthoformamiden

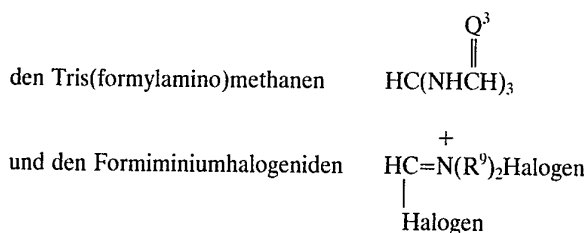


den Formiatesteraminen



den Formamidacetalen





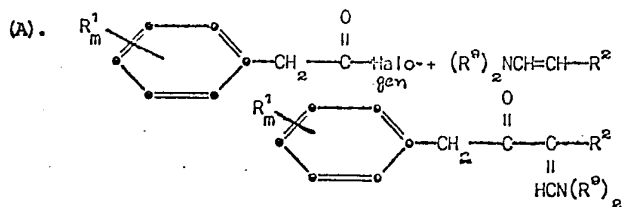
Der Substituent Q^3 steht bei den obigen Formeln für Sauerstoff oder Schwefel, und der Substituent R^{10} bedeutet eine Alkylgruppe mit 1–6 Kohlenstoffatomen oder den Phenylrest und die Reste R^9 unabhängig voneinander für Alkylreste mit 1–3 Kohlenstoffatomen, oder sie bilden zusammen mit dem Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, einen Pyrrolidinorest, einen Piperidinorest, einen Morpholinorest oder einen N-Methylpiperazinorest.

Geeignete Aminoformylierungsmittel werden beispielsweise in De Wolfe, Carboxylic Acid Derivatives 420–506 (Academic Press 1970) und Ulrich, Chemistry of Imidoyl Halides 87–96 (Plenum Press 1968) beschrieben. Von Bredereck et al. gibt es eine Reihe von Publikationen über derartige Mittel und Umsetzungen, von denen folgende typisch sind: Ber. 101, 4048–56 (1968); Ber. 104, 2709–26 (1971); Ber. 106, 3732–42 (1973); Ber. 97, 3397–406 (1964); Ann. 762, 62–72 (1972); Ber. 97, 3407–17 (1964); Ber. 103, 210–21 (1970), Angew. Chem. 78, 147 (1966); Ber. 98, 2887–96 (1965); Ber. 96, 1505–14 (1963); Ber. 104, 3475–85 (1971); Berl. 101, 41–50 (1968); Ber. 106, 3725–31 (1973) und Angew. Chem. Int. Ausgabe 5, 132 (1966). Zu anderen Arbeiten hierüber gehören Kreutzberger et al. Arch. der Pharm. 301, 881–96 (1968) und 302, 362–75 (1969), sowie Weingarten et al., J. Org. Chem. 32, 3293–94 (1967).

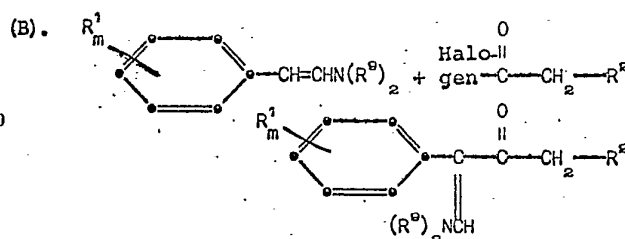
Aminoformylierungen werden im allgemeinen ohne Verwendung eines Lösungsmittels bei erhöhten Temperaturen von etwa 50 bis etwa 200°C durchgeführt. Gelegentlich werden auch Lösungsmittel, wie Dimethylformamid, verwendet, und zwar insbesondere dann, wenn man den Siedepunkt des Reaktionsgemisches erhöhen möchte. Wird die Aminoformylierung mit Formiminiumhalogeniden durchgeführt, dann werden jedoch zweckmässigerweise aprotische Lösungsmittel verwendet. Als derartige aprotische Lösungsmittel können solche verwendet werden, die üblicherweise zu diesem Zwecke zu chemischen Synthesen eingesetzt werden. Speziell gut geeignet sind hierfür Äther, wie zum Beispiel Tetrahydrofuran, Äthylbutyläther, 1,2-Dimethoxyäthan, und ganz speziell bevorzugt Diäthyläther, sowie Mischungen aus derartigen Äthern. Ferner können als aprotische Lösungsmittel auch aromatische Lösungsmittel wie zum Beispiel Benzol, Xylol, eingesetzt werden, und ausserdem auch Alkane, wie zum Beispiel Hexan oder Octan.

Wenn man die Umsetzung mit dem Aminoformylierungsmittel in Anwesenheit eines aprotischen Lösungsmittels durchführt, dann arbeitet man zweckmässigerweise bei Temperaturen, die im Bereich von 0 bis 50°C und vorzugsweise bei etwa Raumtemperatur liegen. Gewünschtenfalls können bei solchen Aminoformylierungen auch halogenhaltige Lösungsmittel verwendet werden, wie Chloroform oder Methylenchlorid.

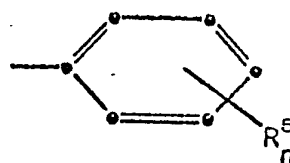
Die Herstellung des bei diesem Verfahren zur Erzeugung des Ausgangsmaterials der Formel IV als Zwischenprodukt gebildeten Enaminketones der Formel X kann jedoch auch nach dem folgenden Reaktionsschema (A) durchgeführt werden



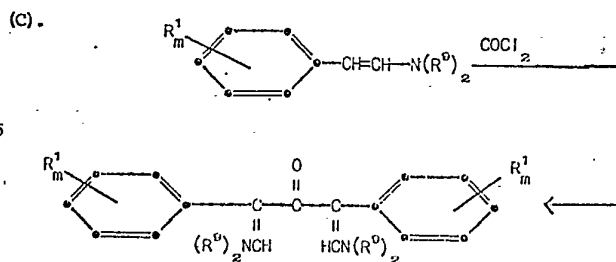
Ferner ist es möglich, die Herstellung des Enaminketones in einer zur Umsetzung (A) analogen Verfahrensweise durchzuführen, nämlich indem man die Umsetzung nach dem folgenden Reaktionsschema (B) durchführt



Die zur Durchführung des erfindungsgemässen Verfahrens eingesetzten Ausgangsmaterialien der Formel IV können symmetrische Verbindungen sein, d. h. in diesem Falle ist der Rest R^2 ein Phenylrest der Formel



wobei in diesem Phenylkern der Rest R^5 bzw. Die Reste R^5 , identisch sein müssen mit den entsprechenden Resten R^1 des anderen Phenylkernes, und auch die Stellung der Substituenten in den beiden Phenylkernen identisch sein müssen. Diese Ausgangsmaterialien liefern dann bei der Durchführung des erfindungsgemässen Verfahrens Pyridone der Formel Ia, in welchen die in der Stellung 3 und der Stellung 5 befindlichen Substituenten identisch sind (die weiter vorne angegebenen bevorzugten Pyridone der Formel II können derartige symmetrisch aufgebaute Pyridone sein). In diesem zuletzt genannten Fall kann das symmetrische Ausgangsmaterial der Formel IV auch nach dem folgenden Reaktionsschema (C) hergestellt werden



Zwischenprodukte bei der Synthese werden im allgemeinen nicht gereinigt, sondern einfach nach Extraktion, Neutralisation oder Entfernung von überschüssigem Lösungsmittel oder Reaktanten für nachfolgende Verfahrensstufen eingesetzt.

Die Enaminacylierungsreaktionen A bis C werden zweckmässigerweise in Gegenwart von Basen, wie tertiären Aminen, Alkalicarbonaten oder Magnesiumoxid, sowie in aprotischen Lösungsmitteln der oben beschriebenen Art durchgeführt.

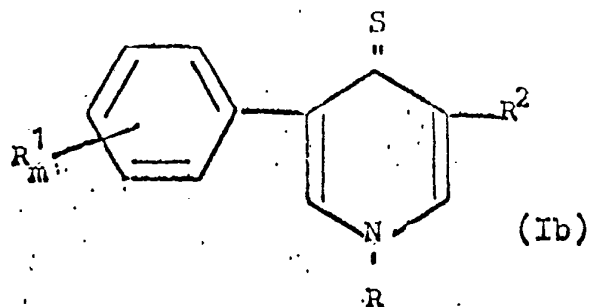
Um die als Zwischenprodukt gebildeten Enaminketone der Formel X in die gewünschten Ausgangsmaterialien der Formel IV umzuwandeln ist es nötig, die noch vorhandene CH_2 -Gruppe der Zwischenprodukte der Formel X ebenfalls in die entsprechende stickstoffhaltige Gruppierung überzuführen. Dies geschieht durch Umsetzung mit weiteren Mengen an einem Aminoformylierungsmittel, vorzugsweise unter den Bedingungen, die bereits weiter vorne erläutert wurden.

Die Cyclisierung der Ausgangsmaterialien der Formel IV erfolgt nach dem erfindungsgemässen Verfahren durch Umset-

zung mit einem Amin der Formel RNH_2 oder eine Säureadditionssalzes dieses Amines. Diese Umsetzung wird vorzugsweise in einem protischen Lösungsmittel durchgeführt, wobei Alkanole bevorzugt sind, und insbesondere ist zu diesem Zwecke Äthanol geeignet. Man kann die Umsetzung beispielsweise bei einer Temperatur im Bereich von -20°C bis 100°C durchführen, und im allgemeinen wird ein Arbeiten bei etwa Raumtemperatur bevorzugt.

Ein bevorzugtes, zur Cyclisierung herangezogenes Amin der angegebenen Formel ist Methylamin.

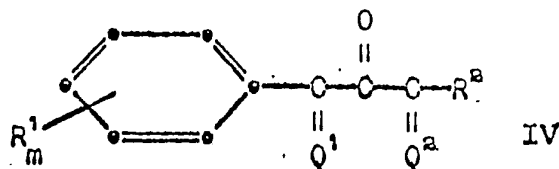
Ein weiterer Gegenstand der vorliegenden Erfindung ist ein Verfahren zur Herstellung der den Pyridonen der Formel Ia analog der folgenden Formel Ib



entsprechen.

In diesen Pyridothionen der Formel Ib haben die Reste R, R^1 und R^2 die gleiche Bedeutung wie in den entsprechenden Pyridonen der Formel Ia, und auch m kann 0, 1 oder 2 sein. In diesem Fall darf jedoch m auch dann 0 sein, wenn R ein Wasserstoffatom oder eine Methylgruppe ist, und ausserdem R^2 ein unsubstituierter Phenylrest ist, weil diese genannten Schwefelverbindungen ebenfalls neue Verbindungen sind.

Das erfindungsgemässe Verfahren zur Herstellung der Pyridothione der Formel Ib und der Salze derselben ist dadurch gekennzeichnet, dass man eine Verbindung der Formel IV



in welcher

R^1 , R^2 und m die in Formel Ia angegebene Bedeutung aufweisen, und

beide Substituenten

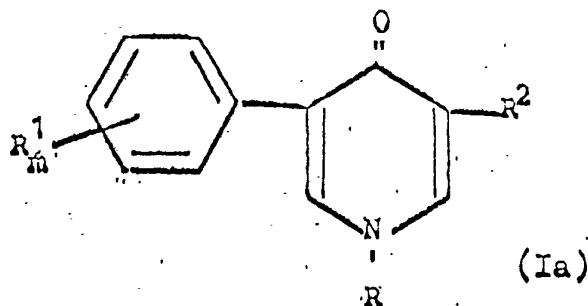
Q^1 und Q^2 für eine Gruppierung der Formel $=CHN(R^9)_2$ stehen, worin

R^9 die weiter vorne angegebene Bedeutung aufweist, mit einer Verbindung der Formel



worin

R die weiter vorne angegebene Bedeutung aufweist, zu einer Verbindung der Formel Ia



cyclisiert, und diese mit Phosphorpentasulfid zu den Verbindungen der Formel Ib umsetzt.

Nach diesem zweistufigen Verfahren kann man beispielsweise das 1-Methyl-3-phenyl-5-(3-trifluormethylphenyl)-4(1H)-pyridothion herstellen, indem man das 1,5-Bis(dimethylamino)-2-(3-trifluormethylphenyl)-1,4-pentadien-3-on mit Methylaminhydrochlorid zu dem 1-Methyl-3-phenyl-5-(3-trifluormethylphenyl)-4(1H)-pyridon cyclisiert, und diese mit Phosphorpentasulfid behandelt.

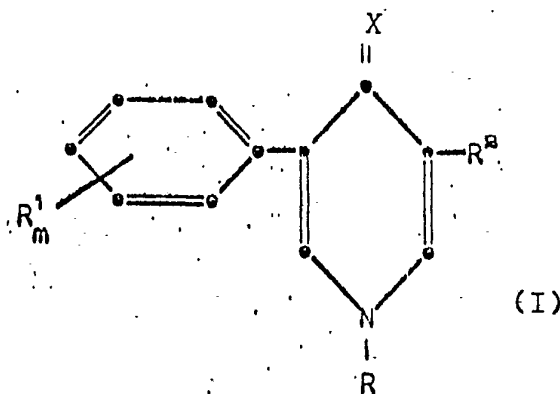
In analoger Weise lassen sich nach diesem zweistufigen Verfahren noch die folgenden Pyridothione herstellen:

das 3,5-Diphenyl-1-methyl-4(1H)-pyridinthion,

das 3,5-Bis(3-chlorphenyl)-1-methyl-4(1H)-pyridinthion, und

das 3-(3-Chlorphenyl)-1-methyl-5-phenyl-4(1H)-pyridinthion.

Des weiteren betrifft die vorliegende Erfindung die Verwendung der neuen 3-Phenyl-5-substituierten-4(1H)-pyridone der Formel Ia bzw. der entsprechenden Pyridothione der Formel Ib, die also die folgende Formel I



aufweisen, in welchen

X ein Sauerstoffatom oder ein Schwefelatom ist,

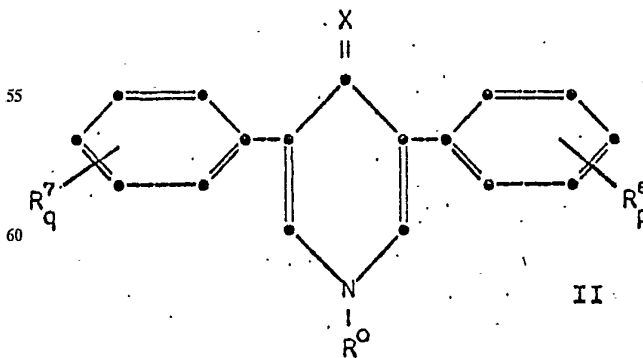
R^1 und R^2 die gleiche Bedeutung aufweisen wie in Formel Ia bzw. Ib, und

die Indices

m und n unabhängig voneinander 0, 1 oder 2 bedeuten, wobei der Index m für 1 oder 2 steht, falls R ein Wasserstoffatom oder eine Methylgruppe ist, und ferner X ein Sauerstoffatom bedeutet, und ausserdem R^2 einen unsubstituierten Phenylrest darstellt,

bzw. von Salzen der Verbindungen der Formel I, als Wirkstoffkomponente eines herbiziden Mittels.

Als Wirkstoffkomponenten der Formel I sind wieder diejenigen speziell bevorzugt, welche der folgenden Formel II



entsprechen, wobei in dieser Formel

X für ein Sauerstoffatom oder Schwefelatom steht,

R^0 für einen Alkylrest mit 1–3 Kohlenstoffatomen, einen

Alkenylrest mit 2 oder 3 Kohlenstoffatomen oder eine Methoxygruppe steht, und
p und q gleich oder verschieden sind, und 0, 1 oder 2 bedeuten,

die Reste

R⁷ gleich oder verschieden sind und für Halogen, Alkylgruppen mit 1–3 Kohlenstoffatomen, Trifluormethylgruppen oder Alkoxygruppen mit 1 bis 3 Kohlenstoffatomen stehen, die Reste

R⁸ gleich oder verschieden sind und Halogen, Alkylgruppen mit 1–3 Kohlenstoffatomen, Trifluormethylgruppen oder Alkoxygruppen mit 1–3 Kohlenstoffatomen sind, oder zwei Reste R⁸, die in o- oder m-Stellung zueinander benachbart sind und zusammen mit dem Phenylring, an den sie gebunden sind, eine 1-Naphthylgruppe bilden.

Ganz speziell bevorzugt sind als Wirkstoffkomponente die Verbindungen der Formel I, in welchen X ein Sauerstoffatom ist und der Substituent R¹ in der m-Stellung des Benzolkernes gebunden ist, und insbesondere die Bedeutung einer Trifluormethylgruppe aufweist.

Die nach den erfindungsgemässen Verfahren herstellbaren Pyridone der Formel Ia bzw. Pyridothione der Formel Ib, können durch Behandlung mit einer Säure oder einer Base in die entsprechenden Salze übergeführt werden.

Als Beispiele für nach dem erfindungsgemässen Verfahren herstellbare Pyridone der Formel Ia bzw. deren Salze, seien die folgenden Verbindungen genannt:

3-(2,6-Dimethylphenyl)-1-isopropyl-5-(1-naphthyl)-4(1H)-pyridon
3-(4-Methylphenyl)-5-phenyl-1-vinyl-4(1H)-pyridon-hydrojodid
3-(3,5-Difluorphenyl)-1-methoxy-5-phenyl-4(1H)-pyridon
1-Propyl-3-(4-trifluormethylphenyl)-5-(3-trifluormethylphenyl)-4(1H)-pyridon
3-(2,6-Difluorphenyl)-5-(3-jodphenyl)-1-vinyl-4(1H)-pyridon
3-(3,5-Dibromphenyl)-5-(3-isopropoxyphenyl)-1-propyl-4(1H)-pyridon
3-(3-Bromphenyl)-1-methyl-5-phenyl-4(1H)-pyridon
3-(4-Chlorphenyl)-5-(2,4-dimethoxyphenyl)-1-propyl-4(1H)-pyridon
1-Acetoxy-3-(4-chlorphenyl)-5-(1-naphthyl)-4(1H)-pyridon
3-(4-Äthoxy-2-fluorphenyl)-1-methoxy-5-phenyl-4(1H)-pyridon
1-Allyl-3,5-bis(3-äthyl-4-methoxyphenyl)-4(1H)-pyridon
3-(3-Chlorphenyl)-5-[2,4-bis(trifluormethyl)phenyl]-1-methoxy-4(1H)-pyridon
3-Benzyl-1-chlormethyl-5-(3-äthylphenyl)-4(1H)-pyridon
3-Benzylthio-1-(2-bromäthyl)-5-(2,4-dimethylphenyl)-4(1H)-pyridon
3-Benzylsulfinyl-1-äthyl-5-(3-fluor-5-propylphenyl)-4(1H)-pyridon
3-Benzylsulfonyl-5-(3-octylphenyl)-1-propyl-4(1H)-pyridon
3-(2-Butylphenyl)-1-trifluormethyl-4(1H)-pyridon-hydrobromid
3-(3-Hexylphenyl)-1-methyl-5-(2-methylphenyl)-4(1H)-pyridon
1-(3,3-Dibrompropyl)-3-(2,4-dichlorphenyl)-5-methyl-4(1H)-pyridon
3-(2,4-Dimethylphenyl)-5-methoxycarbonyl-1-methyl-4(1H)-pyridon
1-Methyl-3-[3-(1-propylpentyl)phenyl]-5-propyl-4(1H)-pyridon
1-(2-Cyanoäthyl)-3-(3-octyl-4-methylphenyl)-5-propoxycarbonyl-4(1H)-pyridon
3-[3-(2-Äthylpentyl)-phenyl]-1-carboxymethyl-5-(3-trifluormethylphenyl)-4(1H)-pyridon
3-(2-Chlormethylphenyl)-1-methoxycarbonylmethyl-4(1H)-pyridon
3-(3,5-Diäthylphenyl)-1-propargyl-5-[3-(5,5-dibrompentyl)-phenyl]-4(1H)-pyridon
3-(2,4-Dipropylphenyl)-1-methyl-5-trifluormethyl-4(1H)-pyridon
3-(4-Benzylphenyl)-1-äthoxy-5-(2-fluoräthyl)-4(1H)-pyridon

3-(3-Chlor-2-methoxyphenyl)-5-(1,1-dibrompentyl)-1-methyl-4(1H)-pyridon
3-(3-Hexylphenyl)-5-methoxymethyl-1-methyl-4(1H)-pyridon
1-Methyl-3-[4-(4-phenylhexyl)phenyl]-5-(3-propylphenyl)-4(1H)-pyridon
3-(6-Äthoxyhexyl)-5-(3-äthyl-5-jodphenyl)-1-(3-jodpropyl)-4(1H)-pyridon
3-[4-(8-Cyanooctyl)phenyl]-1-methyl-5-(2-pentenyl)-4(1H)-pyridon
3-(2,2-Dichlorvinyl)-1-methyl-5-[3-(3-propoxyheptyl)phenyl]-4(1H)-pyridon
3-(2-Brom-1-butenyl)-5-[3-(6-äthoxyheptyl)phenyl]-1-äthoxy-4(1H)-pyridon
3-(4-Äthoxy-2-pentenyl)-5-[2-(2,4-hexadienyl)phenyl]-1-methoxy-4(1H)-pyridon
1-Methoxycarbonylmethyl-3-[3-(3-octenyl)phenyl]-5-phenyl-4(1H)-pyridon-methansulfonat
3-(2-Butinyl)-5-(2,4-dijodphenyl)-1-äthoxy-4(1H)-pyridon
3-[4-(2,6-Dibrom-2-heptenyl)phenyl]-1,5-dimethyl-4(1H)-pyridon
3-(2-Hexenyl)-1-methyl-5-[3-(1,1,2,2-tetrachlor-4-octenyl)-phenyl]-4(1H)-pyridon
3-Cyclobutyl-5-[4-(2-jodvinyl)phenyl]-1-propoxy-4(1H)-pyridon
1-(1-Carboxyäthyl)-3-(2-chlorcyclopropyl)-5-[3-(3-chlorpropargyl)phenyl]-4(1H)-pyridon
3-[4-(1,1-Dibrom-4-pentynyl)phenyl]-1-isopropoxy-5-(2-methylcyclobutyl)-4(1H)-pyridon
3-(2,4-Dijodcyclopentyl)-1-äthyl-5-[4-(2-octinyl)phenyl]-4(1H)-pyridon
3-[2-(1,1-Dichlor-4-heptinyl)phenyl]-5-(4-methoxycyclohexyl)-1-methoxy-4(1H)-pyridon
3-(3-Cyclohexenyl)-5-(3-cyclohexylphenyl)-1-dimethylamino-4(1H)-pyridon
3-[4-(1-Cyclobutenyl)phenyl]-5-methoxy-1-vinyl-4(1H)-pyridon-toluolsulfonat
3-[4-(2-Cyclohexenyl)phenyl]-5-isopropoxy-1-trifluormethyl-4(1H)-pyridon
1-Dichlormethyl-3-(2-jodäthoxy)-5-(4-isopropylsulfonyloxyphenyl)-4(1H)-pyridon
3-Allyloxy-5-[4-(2-chlorphenyl)phenyl]-1-isopropyl-4(1H)-pyridon-hydrochlorid
3-(2,2-Dichlorvinyl)-5-[2-(3-jodphenyl)phenyl]-1-methyl-4(1H)-pyridon
3-(2-Bromallyloxy)-5-[3-(3-bromphenyl)phenyl]-1-vinyl-4(1H)-pyridon
1-Allyl-3-[4-(2-methylphenyl)phenyl]-5-(3,3,3-trifluor-1-propenyl)-4(1H)-pyridon
1-Methoxy-4-phenoxy-5-[3-(4-propylphenyl)phenyl]-4(1H)-pyridon
3-(2-Chlorphenoxy)-5-[4-methoxyphenyl]phenyl]-1-propargyl-4(1H)-pyridon
3-(3-Bromphenoxy)-5-[4-(2-äthoxyphenyl)phenyl]-1-äthyl-4(1H)-pyridon
3-(2-Jodphenoxy)-5-[3-(4-isopropoxyphenyl)phenyl]-1-methoxy-carbonylmethyl-4(1H)-pyridon
1-Methyl-3-(4-nitrophenyl)-5-(3-propylphenoxy)-4(1H)-pyridon
3-(4-Cyanophenyl)-1-äthoxy-5-(2-methoxyphenoxy)-4(1H)-pyridon
3-(3-Carboxyphenyl)-5-(2-äthoxyphenoxy)-1-isopropyl-4(1H)-pyridon-hydrofluorid
1-(2-Carboxyäthyl)-3-(4-hydroxyphenyl)-5-(3-propoxyphenoxy)-4(1H)-pyridon
3-Benzyl-5-(2-methoxycarbonylphenyl)-1-methyl-4(1H)-pyridon
1-Dimethylamino-3-(3-phenylpropyl)-5-(4-propoxycarbonyl)-phenyl]-4(1H)-pyridon
3-(3-Butoxyphenyl)-5-(2-furyl)-1-trifluormethyl-4(1H)-pyridon
3-(1-Äthylpentyl)-5-(3-furyl)-1-methyl-4(1H)-pyridon

- 3-[4-(2-Propylhexyloxy)phenyl]-1-methoxycarbonylmethyl-5-(2-thienyl)-4(1H)-pyridon
- 3-[3-(5,5-Dibrompentoxy)phenyl]-5-(3,5-dicyclopropylphenyl)-1-äthyl-4(1H)-pyridon
- 3-(2,6-Dinitrophenyl)-1-methoxy-5-[5-phenylpentoxy]-phenyl]-4(1H)-pyridon
- 3-(4-Butoxy-2-difluormethylphenyl)-1-cyanomethyl-5-[3-(6-methoxyhexyloxy)phenyl]-4(1H)-pyridon
- 3-(2-Cyclohexyl-4-äthylphenyl)-1-methoxycarbonylmethyl-5-[2-(6-propoxynonyloxy)phenyl]-4(1H)-pyridon
- 3-(2,4-Diallyloxyphenyl)-1-(2,2-dichlorpropyl)-5-(2-methyl-6-nitrophenyl)-4(1H)-pyridon
- 1-Allyl-3-(4-cyano-3-äthoxycarbonylphenyl)-5-[4-(4,4,4-trifluor-2-butenyloxy)phenyl]-4(1H)-pyridon
- 1-Äthoxy-3-[3-(9-jod-1-nonenyloxy)phenyl]-5-phenyl-4(1H)-pyridon
- 3-[3-(4-Chlor-2-butyloxy)phenyl]-1-äthoxy-5-(3-fluor-4-isobutoxyphenyl)-4(1H)-pyridon
- 1-Acetoxy-3-(2,4-dibromphenyl)-5-(1,1,2,2-tetrafluor-3-decinyloxy)phenyl]-4(1H)-pyridon
- 3-[2-(10-Dodecinyloxy)phenyl]-1-methyl-5-(2-propyl-4-propylsulfonyloxyphenyl)-4(1H)-pyridon
- 3-[2,4-Di(3-pentenyl)phenyl]-5-(3-phenoxyphenyl)-1-(1,1,2,2-tetrafluoräthyl)-4(1H)-pyridon
- 1-(3-Chlorpropyl)-3-(3-cyanomethyl-5-äthylphenyl)-5-[3-(3-jodphenoxy)phenyl]-4(1H)-pyridon
- 3-(3-Octyl-4-fluorphenyl)-5-[2-(3-äthylphenoxy)phenyl]-1-trifluormethyl-4(1H)-pyridon
- 3-(2-Äthyl-4-propylsulfonyloxyphenyl)-1-äthyl-5-[2-(4-isopropylphenoxy)phenyl]-4(1H)-pyridon
- 1-Carboxymethyl-3-(2,4-dinonyloxyphenyl)-5-[3-(4-methoxyphenoxy)phenyl]-4(1H)-pyridon
- 3-(3-Chlor-4-heptylthiophenyl)-5-[3-(4-cyanopentyl)phenyl]-1-methyl-4(1H)-pyridon
- 1-Methyl-3-phenyl-5-[2-(3-äthylhexylthio)phenyl]-4(1H)-pyridon-hydrofluorid
- 3-(2-Chlor-4-äthylphenyl)-1-äthyl-5-(3-nonylthio-4-vinylphenyl)-4(1H)-pyridon
- 1-Äthyl-3-phenyl-5-[3-(2-äthylpentylthio)phenyl]-4(1H)-pyridon
- 3-(2-Cyano-4-hydroxyphenyl)-1-dimethylamino-5-[3-(5,5-dibrompentylthio)-4-nitrophenyl]-4(1H)-pyridon
- 3-[4-(4,4-Dijoddodecylthio)phenyl]-1-methyl-5-phenyl-4(1H)-pyridon
- 3-[3,5-Bis(4-phenylbutylthio)phenyl]-5-(2-methylphenyl)-1-(1,1,2,2-tetrafluoräthyl)-4(1H)-pyridon
- 3-[4-(6-Cyanoheptylthio)phenyl]-1-fluormethyl-4(1H)-pyridon
- 3-(3-Acetoxy-5-äthylphenyl)-5-[2-(8-cyanoundecylthio)-phenyl]-1-chlordifluormethyl-4(1H)-pyridon
- 3-(4-Benzyl-2-äthoxyäthoxyphenyl)-1-(2-carboxyäthyl)-5-[3-(2-äthoxyäthoxy)-5-propargylphenyl]-4(1H)-pyridon-toluolsulfonat
- 1-Isopropenyl-3-[3-(3-phenylpentyl)phenyl]-5-[4-(6-isopropoxynonylthio)phenyl]-4(1H)-pyridon
- 3-(2-Cyanomethyl-4-vinylthiophenyl)-1-äthyl-5-[2-(7-phenylheptyl)phenyl]-4(1H)-pyridon
- 3-(3-Allylthio-4-methoxymethylphenyl)-5-[2-(6-cyanoheptyl)-4-vinylphenyl]-1-methyl-4(1H)-pyridon
- 3-[3-(2-Decenylthio)-5-(2,4-hexadienyl)phenyl]-1-äthoxy-5-phenyl-4(1H)-pyridon
- 3-[4-(1,1-Dichlorallylthio)phenyl]-5-[3-(4-octenyl)-2-propylphenyl]-1-trifluormethyl-4(1H)-pyridon
- 3-(4-Carboxy-2-hydroxyphenyl)-5-[3-(2-chlor-3-butenylthio)-5-nitrophenyl]-1-vinyl-4(1H)-pyridon
- 3-[4-(5,5-Dibrom-3-heptenylthio)phenyl]-1-methyl-5-phenyl-4(1H)-pyridon
- 3-[2-(1-Chlorpropargylthio)phenyl]-1-dimethylamino-5-[3-(4-pentenyl)-5-methoxycarbonylphenyl]-4(1H)-pyridon
- 3-[4-(3,3-Dibrom-5-hexinylthio)phenyl]-1-methoxy-5-phenyl-4(1H)-pyridon
- 1-Acetoxy-3-(3-äthylthiophenyl)-5-(3-äthyl-5-fluorphenyl)-4(1H)-pyridon
- 3-(3-Chlorphenyl)-5-[2-(3-fluorphenylthio)phenyl]-1-methyl-4(1H)-pyridon
- 1-Carboxymethyl-3-[3-(2-jodphenylthio)phenyl]-5-(3-methyl-5-methoxycarbonylphenyl)-4(1H)-pyridon
- 1-(2-Chloräthyl)-3-(2,4-diäthylphenyl)-5-[4-(4-äthylphenyl)-thio-2-methoxyphenyl]-4(1H)-pyridon
- 3-[3-(3-Isopropylphenylthio)phenyl]-5-phenyl-1-trifluormethyl-4(1H)-pyridon
- 3-(2-Methyl-6-propoxyphenyl)-3-[4-(3-propoxyphenylthio)-phenyl]-1-propargyl-4(1H)-pyridon
- 3-[3-Chlor-5-(4-nitrophenylthio)phenyl]-1-methyl-5-(2,4-divinylphenyl)-4(1H)-pyridon
- 3-(4-Butylsulfinylphenyl)-5-phenyl-1-propargyl-4(1H)-pyridon
- 1-Äthyl-3-(3-heptylsulfinylphenyl)-5-(4-propoxycarbonylphenyl)-4(1H)-pyridon
- 1-Äthoxy-3-[3-(4-propylnonylsulfinyl)phenyl]-5-phenyl-4(1H)-pyridon
- 3-(2-Äthoxyphenyl)-1-isopropyl-5-[4-(2-fluoräthylsulfinyl)-2-isopropylphenyl]-4(1H)-pyridon
- 3-[3,5-Di(4-chlorphenyl)phenyl]-3-[4-(5,5-dibrompentylsulfinyl)-2-äthoxyphenyl]-1-äthyl-4(1H)-pyridon
- 3-[3-(12-Joddodecylsulfinyl)phenyl]-5-phenyl-1-propargyl-4(1H)-pyridon-hydrojodid
- 3-(4-Benzylsulfinylphenyl)-5-(3-biphenyl)-2-isopropenyl-4(1H)-pyridon
- 3-[3,5-Di(methylsulfonyloxy)phenyl]-5-[3-(5-phenylpentylsulfinyl)phenyl]-1-vinyl-4(1H)-pyridon
- 3-(3-Acetoxyphenyl)-5-[2-(7-cyanoheptylsulfinyl)phenyl]-1-methoxycarbonylmethyl-4(1H)-pyridon
- 1-(2-Carboxyäthyl)-3-[3-(3-cyclohexenyl)-5-(3-cyanoundecylsulfinyl)phenyl]-4(1H)-pyridon
- 1-(2-Chloräthyl)-3-[4-(6-methoxyhexylsulfinyl)phenyl]-4(1H)-pyridon
- 3-(4-Cyclopropylphenyl)-1-jodmethyl-5-[3-(6-propoxynonylsulfinyl)-phenyl]-4(1H)-pyridon
- 3-[3,5-Di(allylsulfinyl)phenyl]-5-phenyl-1-propyl-4(1H)-pyridon-hydrofluorid
- 1-Dimethylamino-3-[2-(5-dodecylsulfinyl)phenyl]-5-(3-isobutylphenyl)-4(1H)-pyridon
- 1-Äthoxy-3-(3-jod-4-pentylphenyl)-5-[3-(3,3,4,4-tetrafluor-1-butenylsulfinyl)-5-hexylphenyl]-4(1H)-pyridon
- 3-[2,4-Di(chlordifluormethyl)phenyl]-1-propargyl-5-[3-(1,2,3-trijod-6-dodecylsulfinyl)phenyl]-4(1H)-pyridon
- 3-[3-(4-Brom-2-butenylsulfinyl)-5-methylphenyl]-5-[2-jod-3-(1,2,3-trichlorpentyl)phenyl]-1-vinyl-4(1H)-pyridon
- 1-Allyl-3-[2-(2,2-dibrom-4-hexinylsulfinyl)phenyl]-5-phenyl-4(1H)-pyridon
- 3-(4-Benzyl-2-bromphenyl)-1-(2-carboxyäthyl)-5-[3-(1-chlorbutyl)-5-(6-dodecylsulfinyl)phenyl]-4(1H)-pyridon
- 1-Cyanomethyl-3-[4-(3-fluorphenylsulfinyl)phenyl]-5-[3-(4-octenyl)phenyl]-4(1H)-pyridon
- 1-Chlormethyl-3-[3-(1,1-dichlor-4-octenyl)-4-nitrophenyl]-5-[3-(2-jodphenylsulfinyl)phenyl]-4(1H)-pyridon
- 3-[3-(2-Chlorvinyl)-5-(4-methylphenylsulfinyl)phenyl]-1-äthoxy-5-[3-(8-jod-4-octenyl)phenyl]-4(1H)-pyridon
- 3-[4-(3-Isopropylphenylsulfinyl)phenyl]-5-phenyl-1-propyl-4(1H)-pyridon
- 3-[3-(2-Äthoxyphenylsulfinyl)phenyl]-1-methyl-5-[4-(2-propoxyphenoxy)phenyl]-4(1H)-pyridon
- 1-Äthyl-3-(3-hexylsulfonylphenyl)-5-(4-hydroxyphenyl)-4(1H)-pyridon
- 3-(2-Carboxy-4-äthylphenyl)-1-dimethylamino-5-[4-(3-äthylheptylsulfonyl)phenyl]-4(1H)-pyridon
- 1-Acetoxy-3-(2-hexyl-5-fluorphenyl)-5-(3-nitro-5-nonylsulfonyl-

phenyl)-4(1H)-pyridon
 3-Phenyl-1-propoxy-5-[2-(3-propylnonylsulfonyl)phenyl]-4(1H)-pyridon
 1-Äthoxy-3-phenyl-5-(3-trifluormethyl-5-trifluormethylsulfonyl)-4(1H)-pyridon
 3-(3-Brom-5-nitrophenyl)-1-äthyl-5-[4-cyano-2-(6,6-dibromhexylsulfonyl)phenyl]-4(1H)-pyridon
 3-[3-(4,4-Dijoddodecylsulfonyl)phenyl]-5-(2-naphthyl)-1-(1-propinyl)-4(1H)-pyridon
 3-[5-Chlormethyl-4-(2-propylphenyl)phenyl]-1-vinyl-5-[4-(3-phenylbutylsulfonyl)phenyl]-4(1H)-pyridon
 3-[3-(3-Cyanopropylsulfonyl)phenyl]-1-methoxycarbonylmethyl-5-phenyl-4(1H)-pyridon
 1-(2-Carboxyäthyl)-3-[4-(7-cyanoheptylsulfonyl)phenyl]-5-[3-(4-chlorphenylphenyl)-4(1H)-pyridon
 1-Cyanomethyl-3-[3-(11-cyanoundecylsulfonyl)-5-fluorphenyl]-5-(4-propylsulfonyloxyphenyl)-4(1H)-pyridon
 3-(2-Acetoxy-4-äthoxyäthylsulfonylphenyl)-1-chlormethyl-5-(5-cyclopropyl-2-trifluormethylphenyl)-4(1H)-pyridon
 3-[4-(3-Cyclohexenyl)phenyl]-1-propyl-5-[3-(9-propoxynonylsulfonyl)phenyl]-4(1H)-pyridon
 1-Acetoxy-3-[4-(2,3-hexadienylsulfonyl)phenyl]-5-phenyl-4(1H)-pyridon
 3,5-Bis[3-(4-decylsulfonyl)phenyl]-1-methoxy-4(1H)-pyridon
 3-[4-(2-Bromallylsulfonyl)-2-methylphenyl]-1-methyl-5-[3-(7,7,8,8-tetrafluor-2-octinyl)phenyl]-4(1H)-pyridon
 3-[4-(6-Heptinyl)-3-methylphenyl]-1-äthyl-5-[3-(1,1,2-trijod-3-butenylsulfonyl)-5-chlorphenyl]-4(1H)-pyridon
 3-[2-(5,5-Dibrom-2-pentinyl)phenyl]-1-dimethylamino-5-[3-(5-fluor-2-nonenylsulfonyl)phenyl]-4(1H)-pyridon
 1-Acetoxy-3-[2-äthyl-4-(5-methoxypentyl)phenyl]-5-[3-(12,12,12-trichlor-6-dodecylsulfonyl)phenyl]-4(1H)-pyridon
 3-[2-(3-Chlor-5-hexinylsulfonyl)-4-nitrophenyl]-5-[3-brom-5-(6-cyanoheptyl)phenyl]-1-methoxy-4(1H)-pyridon
 3-[4-(6,6-Dibrom-3-hexinylsulfonyl)phenyl]-5-phenyl-1-propoxy-4(1H)-pyridon
 3-[3-(2-Cyanoäthyl)phenyl]-1-äthyl-5-[1,1,2,2-tetrafluor-6-decylsulfonyl)phenyl]-4(1H)-pyridon
 1-Cyanomethyl-3-[3-(6-dodecylsulfonyl)-5-methylphenyl]-5-[2-methyl-4-(1,1,2,2-tetrafluoräthyl)phenyl]-4(1H)-pyridon
 1-(2-Carboxyäthyl)-3-phenyl-5-(3-phenylsulfonylphenyl)-4(1H)-pyridon
 3-[3-(4,4-Dijodbutyl)phenyl]-5-[4-(4-fluorphenylsulfonyl)phenyl]-1-trifluormethyl-4(1H)-pyridon
 3-[2-Chlormethyl-3-(6,6-dibromhexyl)phenyl]-5-[3-(3-jodphenylsulfonyl)phenyl]-1-methyl-4(1H)-pyridon
 3-(3-Isopropyl-4-trifluormethylphenyl)-1-methyl-5-[3-(2-propoxyphenylsulfonyl)phenyl]-4(1H)-pyridon
 3-[2-Chlor-4-(4-nitrophenylsulfonyl)phenyl]-1-äthyl-5-[3-fluor-5-(4-heptyl)phenyl]-4(1H)-pyridon
 3-(3-Cyclopropylmethylphenyl)-1-methyl-5-(2-trifluormethylphenyl)-4(1H)-pyridon
 3,5-Bis[3-(2-cyclopentyläthyl)phenyl]-1-methoxy-4(1H)-pyridon
 3-(4-Cyclohexyloxyphenyl)-1-methyl-5-phenyl-4(1H)-pyridon-methansulfonat
 3-(4-Chlorphenyl)-5-(3-cyclobutylthiophenyl)-1-äthoxy-4(1H)-pyridon
 3-(2-Cyclopentylsulfinylphenyl)-5-(3-hexylphenyl)-1-propoxy-4(1H)-pyridon-hydrochlorid
 3-(3-Cyclohexylsulfonylphenyl)-5-(3,5-difluorphenyl)-1-trifluormethyl-4(1H)-pyridon
 1-Cyanomethyl-3-(2-cyclopropylmethoxyphenyl)-5-(3-trifluormethylphenyl)-4(1H)-pyridon
 1-Acetoxy-3-[3-(2-cyclohexyläthoxy)phenyl]-5-phenyl-4(1H)-pyridon-hydrobromid
 3-[4-(2-Cyclobutyläthylthio)phenyl]-1-dimethylamino-5-(3,5-dimethylphenyl)-4(1H)-pyridon

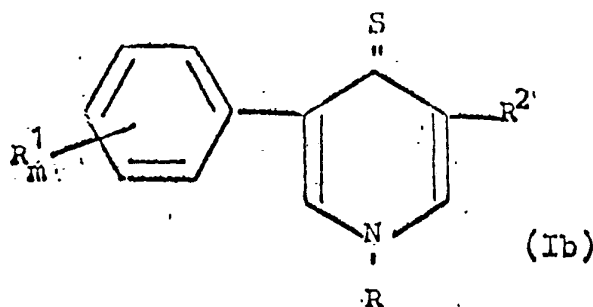
3-(3-Cyclopentylmethylsulfinylphenyl)-1-methyl-5-(3-trifluormethylphenyl)-4(1H)-pyridon
 3-[4-(2-Cyclohexyläthylsulfonyl)phenyl]-1-äthyl-5-(3-propylphenyl)-4(1H)-pyridon
 5 3-Cyclopropylmethyl-5-(3-fluorphenyl)-1-methoxy-4(1H)-pyridon-methansulfonat
 3-(4-Chlorphenyl)-3-(2-cyclohexyläthyl)-1-äthoxy-4(1H)-pyridon
 3-(3-Fluorphenyl)-1-methyl-5-phenylthio-4(1H)-pyridon
 10 3-(3-Chlor-5-methylphenyl)-1-äthoxy-5-phenylsulfinyl-4(1H)-pyridon
 3-(2-Butylphenyl)-5-(3,5-dichlorphenylthio)-1-(1-propenyl)-4(1H)-pyridon
 3-(2,4-Dibromphenyl)-1-dimethylamino-5-(4-äthylphenylsulfinyl)-4(1H)-pyridon
 15 3-Methylthio-5-phenyl-1-(1-propinyl)-4(1H)-pyridon
 3-Äthylsulfonyl-1-isopropyl-5-(3-trifluormethylphenyl)-4(1H)-pyridon
 3-(2-Chloräthylsulfinyl)-1-chlormethyl-5-(3-methylphenyl)-4(1H)-pyridon
 20 1-(1-Carboxyäthyl)-3-(2,4-dimethylphenyl)-5-vinylthio-4(1H)-pyridon
 1-(2-Bromäthyl)-3-(2-chlor-3-fluorphenyl)-5-(1,2-difluorallylsulfinyl)-4(1H)-pyridon
 25 1-Dimethylamino-3-(4-methoxy-2-butenyl)-5-phenyl-4(1H)-pyridon
 1-Äthyl-3-(2-propoxyvinyl)-5-(3-trifluormethylphenyl)-4(1H)-pyridon.

Im folgenden werden bevorzugte Verbindungen der Formel

30 Ia angegeben:
 1-Methyl-3-phenyl-5-(3-trifluormethylphenyl)-4(1H)-pyridon
 3-(3-Fluorphenyl)-1-methyl-5-phenyl-4(1H)-pyridon
 3-(3-Chlorphenyl)-1-methyl-5-phenyl-4(1H)-pyridon
 3,5-Bis(3-chlorphenyl)-1-methyl-4(1H)-pyridon
 35 3-(3-Chlorphenyl)-5-(3-fluorphenyl)-1-methyl-4(1H)-pyridon
 1-Methyl-3-(3-methylphenyl)-5-phenyl-4(1H)-pyridon
 3,5-Diphenyl-1-methyl-4(1H)-pyridon
 1-Methyl-3,5-bis(3-trifluormethylphenyl)-4(1H)-pyridon
 3-(3-Bromphenyl)-1-methyl-5-phenyl-4(1H)-pyridon
 40 3-(3-Methoxyphenyl)-1-methyl-5-phenyl-4(1H)-pyridon
 3-(3-Äthoxyphenyl)-1-methyl-5-phenyl-4(1H)-pyridon
 1-Methyl-3-phenyl-5-(3-propoxyphenyl)-4(1H)-pyridon
 3-(3-Isopropoxyphenyl)-1-methyl-5-phenyl-4(1H)-pyridon
 1-Methyl-3-phenyl-5-[3-(1,1,2,2-tetrafluoräthoxy)phenyl]-4(1H)-pyridon
 45 3,5-Bis(3-fluorphenyl)-1-methyl-4(1H)-pyridon
 3-(2-Chlorphenyl)-1-methyl-5-(3-trifluormethylphenyl)-4(1H)-pyridon
 3-(3-Chlorphenyl)-1-methyl-5-(3-trifluormethylphenyl)-4(1H)-pyridon
 50 3-(4-Chlorphenyl)-1-methyl-5-(3-trifluormethylphenyl)-4(1H)-pyridon
 3-(2-Fluorphenyl)-1-methyl-5-(3-trifluormethylphenyl)-4(1H)-pyridon
 55 3-(3-Fluorphenyl)-1-methyl-5-(3-trifluormethylphenyl)-4(1H)-pyridon
 3-(4-Fluorphenyl)-1-methyl-5-(3-trifluormethylphenyl)-4(1H)-pyridon
 3-(3-Chlorphenyl)-5-(4-chlorphenyl)-1-methyl-4(1H)-pyridon
 60 1-Äthyl-3-phenyl-5-(3-trifluormethylphenyl)-4(1H)-pyridon
 1-Allyl-3-phenyl-5-(3-trifluormethylphenyl)-4(1H)-pyridon
 1-Methyl-3-(3-trifluormethylphenyl)-4(1H)-pyridon
 3-Chlor-1-methyl-5-(3-trifluormethylphenyl)-4(1H)-pyridon
 3-Brom-1-methyl-5-(3-trifluormethylphenyl)-4(1H)-pyridon
 65 1,3-Dimethyl-5-(3-trifluormethylphenyl)-4(1H)-pyridon
 3-Äthyl-1-methyl-5-(3-trifluormethylphenyl)-4(1H)-pyridon
 3-Isopropyl-1-methyl-5-(3-trifluormethylphenyl)-4(1H)-pyridon
 Es ist ferner möglich, die nach dem erfindungsgemässen

Verfahren hergestellten Pyridothione der Formel Ib, in welchen R eine Hydroxygruppe ist, anschliessend zu den entsprechenden 1-Acetoxyverbindungen zu acetylieren, und es ist ferner auch möglich, nach dem erfindungsgemässen Verfahren hergestellte Pyridone der Formel Ia, in welchen R eine Hydroxygruppe ist, zunächst zu den entsprechenden Pyridonen, in welchen R eine Acetoxygruppe bedeutet, zu acetylieren, und diese dann durch eine anschliessende Behandlung mit Phosphorpentasulfid in die entsprechenden Pyridothione überzuführen.

In der Folge werden nach dem erfindungsgemässen Verfahren herstellbare Pyridothione der Formel Ib



genannt, die sämtliche eine herbizide Wirksamkeit besitzen, und auch solche Verbindungen, die aus den Thioverbindungen durch Acetylierung herstellbar sind:

1-Methyl-3,5-bis(3-methoxyphenyl)-4(1H)-pyridinthion
 1-Äthyl-3-(4-äthoxyphenyl)-5-phenyl-4(1H)-pyridinthion
 3-(3,5-Dijodphenyl)-5-(3-propylphenyl)-1-propyl-4(1H)-pyridinthion
 1-Allyl-3-(3-chlorphenyl)-5-(2,3-diäthoxyphenyl)-4(1H)-pyridinthion
 3,5-Diphenyl-1-äthyl-4(1H)-pyridinthion
 1-Acetoxy-3-(3,5-diäthylphenyl)-5-(2,4-diäthylphenyl)-4(1H)-pyridinthion
 1-Allyl-3-(1-naphthyl)-5-(4-propoxyphenyl)-4(1H)-pyridinthion
 1-Methyl-3-phenyl-5-(2-propylphenyl)-4(1H)-pyridinthion-hydrochlorid
 1-Allyl-3-phenyl-5-(3-trifluormethylphenyl)-4(1H)-pyridinthion
 1-Acetoxy-3,5-diphenyl-4(1H)-pyridinthion
 3-(2-Jodphenyl)-5-(3-isopropylphenyl)-1-methoxy-4(1H)-pyridinthion
 3-(2-Jod-4-methylphenyl)-5-phenyl-1-vinyl-4(1H)-pyridinthion
 3,5-Diphenyl-1-isopropyl-4(1H)-pyridinthion
 3-(3-Brom-5-äthylphenyl)-5-(3-methylphenyl)-1-propyl-4(1H)-pyridinthion
 3-(2-Jod-4-propylphenyl)-1-methyl-5-(4-trifluormethylphenyl)-4(1H)-pyridinthion
 1-Methyl-3-(3-methyl-5-propylphenyl)-5-phenyl-4(1H)-pyridinthion
 3-(2-Chlor-4-jodphenyl)-5-(3-fluorphenyl)-1-propyl-4(1H)-pyridinthion
 1-(2-Chloräthyl)-3-cyano-5-phenyl-4(1H)-pyridinthion
 3,5-Diphenyl-1-äthyl-4(1H)-pyridinthion
 3-(4-Heptafluorpropylphenyl)-5-hexyl-1-methyl-4(1H)-pyridinthion
 3-(2-Chloräthyl)-5-(4-(2,2-dijodoctyl)-phenyl)-1-methoxy-4(1H)-pyridinthion
 3-(6-Jodhexyl)-1-isopropoxy-5-phenyl-4(1H)-pyridinthion
 1-Dimethylamino-3,5-bis(3-trifluormethylphenyl)-4(1H)-pyridinthion
 1-(2-Chloräthyl)-3-(4-(2-cyanoäthyl)phenyl)-4(1H)-pyridinthion
 1-Methyl-3-(2-propoxyäthyl)-5-phenyl-4(1H)-pyridinthion-hydrofluorid
 1-Methyl-3-phenyl-5-vinyl-4(1H)-pyridinthion

3-Allyl-5-(4-(3-cyanoethyl)phenyl)-1-propoxy-4(1H)-pyridinthion
 3-(3-Hexenyl)-5-(2-(2-methoxyäthyl)phenyl)-1-methyl-4(1H)-pyridinthion
 3-(2-Jod-1-hexenyl)-1-methyl-5-(3-vinylphenyl)-4(1H)-pyridinthion
 3-(4-Allyl-phenyl)-1-dimethylamino-5-phenyl-4(1H)-pyridinthion
 3-(2-Methoxyallyl)-1-methyl-5-(4-trifluormethylphenyl)-4(1H)-pyridinthion
 3-(3-(2-Hexenyl)phenyl)-1-methyl-5-(3-propylphenyl)-4(1H)-pyridinthion
 3-(2-Äthyl-3-fluorphenyl)-5-äthyl-1-methyl-4(1H)-pyridinthion
 3-Cyclopropyl-5-(2-(2-fluor-1-pentenyl)phenyl)-1-methoxy-4(1H)-pyridinthion
 3-Cyclohexyl-5-(3-äthylphenyl)-1-jodmethyl-4(1H)-pyridinthion,
 3-(2,2-Dibromcyclohexyl)-1-methyl-5-(2-pentynyl)phenyl)-4(1H)-pyridinthion
 1-Acetoxy-3-(4-propylcyclohexyl)-5-(3-(6,6,6-trifluor-2-hexinyl)phenyl)-4(1H)-pyridinthion
 3-(3-(4-Octinyl)phenyl)-5-(2-methoxycyclopropyl)-1-methyl-4(1H)-pyridinthion
 3-(4-Cyclopropylphenyl)-1-(2-methoxycarbonylmethyl)-5-(2-propoxycyclobutyl)-4(1H)-pyridinthion
 3-(2-Cyclobutenyl)-5-(3-cyclopentylphenyl)-1-äthoxy-4(1H)-pyridinthion
 3-Chlormethoxy-1-cyanomethyl-5-(2-formyloxyphenyl)-4(1H)-pyridinthion
 1-(2-Carboxyäthyl)-3-(3-propionyloxyphenyl)-5-trifluormethoxy-4(1H)-pyridinthion
 3-(1,2-Dibrompropoxy)-1-äthoxy-5-(2-methylsulfonyloxyphenyl)-4(1H)-pyridinthion
 3-(3-Diphenyl)-1-methyl-5-vinyloxy-4(1H)-pyridinthion
 1-Cyanomethyl-3-(2-methylphenoxy)-5-(3-(4-nitrophenyl)phenyl)-4(1H)-pyridinthion
 1-Methyl-3-(4-nonyloxyphenyl)-5-(3-thienyl)-4(1H)-pyridinthion
 1-Methyl-3-(4-(2-propylnonyloxy)phenyl)-5-(4-trifluormethylphenyl)-4(1H)-pyridinthion
 3-(3,5-Diäthylphenyl)-1-äthyl-5-(4-trifluormethoxyphenyl)-4(1H)-pyridinthion
 3-(2,4-Divinylphenyl)-5-(4-(2-fluoräthoxy)phenyl)-1-isopropoxy-4(1H)-pyridinthion
 3-(2,4-Dimethoxyphenyl)-1-(2-methoxycarbonylmethyl)-5-(2-(12-joddodecyloxy)phenyl)-4(1H)-pyridinthion
 3-(4-Benzoyloxyphenyl)-1-cyanomethyl-5-(3,5-di(isopropenyl)phenyl)-4(1H)-pyridinthion
 3-(2,4-Diformyloxyphenyl)-1-äthoxy-5-(4-(3-phenyl)-hexyloxy)-phenyl)-4(1H)-pyridinthion
 3-(4-(3-Cyanopropoxy)phenyl)-5-(3-äthoxy-5-jodphenyl)-1-methyl-4(1H)-pyridinthion
 3-(4-(7-Cyanoheptyloxy)phenyl)-1-äthyl-5-phenyl-4(1H)-pyridinthion
 3-(3-(4-Cyanoundecyloxy)phenyl)-5-(2,4-di(2-äthoxyäthyl)-phenyl)-1-methoxy-4(1H)-pyridinthion
 3-(2-(2-Äthoxyäthoxy)phenyl)-1-(2-jodäthyl)-5-(3,4-diacetoxyphenyl)-4(1H)-pyridinthion
 3-(2,4-Di-(2-pentynyl)phenyl)-1-isopropoxy-5-(2-vinyloxyphenyl)-4(1H)-pyridinthion
 3-(3-(2,4-Hexadienyloxy)phenyl)-1-isopropyl-5-phenyl-4(1H)-pyridinthion-hydrojodid
 1-(2-Carboxyäthyl)-3-(2,6-dipropylphenyl)-5-(4-(5-dodecenyloxy)phenyl)-4(1H)-pyridinthion
 3-(2-(2-Chlorallyloxy)phenyl)-1-(2,2-dichloräthyl)-5-(2,4-diäthoxyphenyl)-4(1H)-pyridinthion
 1-Chlormethyl-3-(3-methylsulfonyloxy-5-vinylphenyl)-5-(3-(2,2-

dibrom-3-heptenyloxy)phenyl)-4(1H)-pyridinthion
 1-Chlordifluormethyl-3-(2,4-di(chlormethyl)phenyl)-5-(2-(1,2,3-trichlor-6-dodecenyloxy)phenyl)-4(1H)-pyridinthion
 3-(3-(6,6-Dibrom-3-hexinyloxy)phenyl)-1-methyl-5-(3-nitro-4-propylphenyl)-4(1H)-pyridinthion
 3-(3-Äthinyloxyphenyl)-1-methyl-5-phenyl-4(1H)-pyridinthion-hydrobromid
 3-(4-(4-Fluorphenoxy)phenyl)-1-isopropyl-5-phenyl-4(1H)-pyridinthion
 1-Chlormethyl-3-(2,4-difluorphenyl)-5-(2-(3-propoxyphenoxy)-phenyl)-4(1H)-pyridinthion
 1-Methyl-3-(4-(2-nitrophenoxy)phenyl)-5-phenyl-4(1H)-pyridinthion
 3-(3-Isobutylthiophenyl)-1-isopropyl-5-phenyl-4(1H)-pyridinthion
 1-(2-Methoxycarbonylmethyl)-3-(4-(3-jodphenyl)phenyl)-5-(3-trifluormethylthiophenyl)-4(1H)-pyridinthion
 1-Acetoxy-3-(3-cyclopentylphenyl)-5-(3-(2-fluoräthylthio)-phenyl)-4(1H)-pyridinthion
 3-(3-Benzylthio-5-äthinyphenyl)-1-cyanomethyl-5-(2-hexylphenyl)-4(1H)-pyridinthion
 3-(2-Brom-4-(6-phenylhexylthio)phenyl)-5-(4-(2-cyanopropylthio)-2-äthylphenyl)-1-methyl-4(1H)-pyridinthion
 1-Äthyl-3-(4-(6-methoxyhexylthio)phenyl)-5-phenyl-4(1H)-pyridinthion
 1-Methoxycarbonylmethyl-3-(3-(2-pentenylthio)phenyl)-5-phenyl-4(1H)-pyridinthion
 3,5-Bis(4-(9-jod-8-nonenylthio)phenyl)-1-isopropyl-4(1H)-pyridinthion
 1-Äthyl-3-(3-fluorphenyl)-5-(4-(12,12,12-trichlor-2,6-dodecadienylthio)phenyl)-4(1H)-pyridinthion
 1-(2-Chlorpropyl)-3-(2-cyclopropyl-4-(1,1,2,2-tetrafluor-5-decylthio)phenyl)-5-phenyl-4(1H)-pyridinthion
 3-(4-(4-Decinylthio)-2-methylphenyl)-1-äthoxy-5-(5-fluor-3-trifluormethylphenyl)-4(1H)-pyridinthion
 1-Cyanomethyl-3-(4-phenylthiophenyl)-5-phenyl-4(1H)-pyridinthion-hydrochlorid
 1-Acetoxy-3-(4-butylphenyl)-5-(4-(3-methoxyphenylthio)-phenyl)-4(1H)-pyridinthion
 3-(2-Carboxyphenyl)-1-dimethylamino-5-(2-hydroxy-4-(2-propylpentylsulfinyl)phenyl)-4(1H)-pyridinthion
 1-Acetoxy-3-(2-cyano-5-nonylsulfinylphenyl)-5-(3,5-dinitrophenyl)-4(1H)-pyridinthion
 1-Methoxy-3-(2-nitrophenyl)-5-(4-trifluormethylsulfinylphenyl)-4(1H)-pyridinthion
 3-(2-(3-Cyanopropylsulfinyl)phenyl)-1-methoxycarbonylmethyl-5-phenyl-4(1H)-pyridinthion
 3-(2-Chlor-4-cyclohexylphenyl)-5-(3-chlor-5-(2-äthoxyäthylsulfinyl)phenyl)-1-(2-cyanoäthyl)-4(1H)-pyridinthion
 3-(3-(2-Chlor-6-undecinylsulfinyl)phenyl)-1-(2,2-dibromäthyl)-5-(2-äthyl-5-vinylsulfinylphenyl)-4(1H)-pyridinthion
 3-(3-(2,4-Hexadienylsulfinyl)phenyl)-1-methyl-5-phenyl-4(1H)-pyridinthion
 1-Acetoxy-3-(4-(2-bromallylsulfinyl)phenyl)-5-(2,4-dimethylphenyl)-4(1H)-pyridinthion
 1-Isopropyl-3-phenyl-5-(4-(1,1,2-trichlor-3-heptenylsulfinyl)phenyl)-4(1H)-pyridinthion
 1-Methoxycarbonylmethyl-3-(3-äthyl-5-(9,9,10,10-tetrafluor-3-decylsulfinyl)phenyl)-5-phenyl-4(1H)-pyridinthion
 1-(2-Cyanoäthyl)-3-(4-phenylsulfinylphenyl)-5-phenyl-4(1H)-pyridinthion
 3-(4-(2,4-Cyclohexadienyl)-3-fluorphenyl)-1-äthyl-5-(3-hydroxy-5-(nitrophenylsulfinyl)phenyl)-4(1H)-pyridinthion
 1-Methyl-3-(4-methylsulfonylphenyl)-5-phenyl-4(1H)-pyridinthion
 3-(4-(2-Chloräthylsulfonyl)phenyl)-5-(3-fluor-4-octylphenyl)-1-methoxy-4(1H)-pyridinthion
 3-(3-Äthoxyhexylsulfonylphenyl)-5-phenyl-1-trifluormethyl-

4(1H)-pyridinthion

3-(3-Cyanomethyl-4-(1-cyclobutenyl)phenyl)-1-methyl-5-(4-vinylsulfonylphenyl)-4(1H)-pyridinthion

3-(2-Allylsulfonyl-4-chlorphenyl)-5-(2-allyl-3-cyclohexylphenyl)-1-dimethylamino-4(1H)-pyridinthion

3-(3-Benzyl-5-äthinylsulfonylphenyl)-5-(2-(7-phenylheptyl)phenyl)-1-vinyl-4(1H)-pyridinthion

1-Äthyl-3-(3-äthyl-5-(4-methylphenylsulfonyl)phenyl)-5-(4-jod-3-(2-propylbutyl)phenyl)-4(1H)-pyridinthion

1-(1-Cyanoäthyl)-3-(3-(2-propylphenylsulfonyl)phenyl)-5-phenyl-4(1H)-pyridinthion

3-(5-Butyl-2-(3-methoxyphenylsulfonyl)phenyl)-1-(1-carboxy-äthyl)-5-phenyl-4(1H)-pyridinthion

3-(2-Cyclopropoxyphenyl)-1-äthyl-5-(2-fluorphenyl)-4(1H)-pyridinthion

3-(4-Cyclopropylsulfonylphenyl)-5-(2,4-diäthylphenyl)-1-propyl-4(1H)-pyridinthion

1-Acetoxy-3-phenylsulfonyl-5-(4-trifluormethylphenyl)-4(1H)-pyridinthion

1-Cyanomethyl-3-phenyl-5-(3-propoxyphenylsulfinyl)-4(1H)-pyridinthion

3-(2-Chlorphenyl)-1-methyl-5-propylsulfinyl-4(1H)-pyridinthion-hydrofluorid

1-Äthoxy-3-(4-fluorphenyl)-5-trifluormethylthio-4(1H)-pyridinthion-toluolsulfonat

3-(2-Brompropylsulfonyl)-1-chlordifluormethyl-5-phenyl-4(1H)-pyridinthion

3-Allylsulfinyl-3-(3,5-dijodphenyl)-1-methyl-4(1H)-pyridinthion

1-Methyl-3-(2-trifluormethylphenyl)-5-vinylsulfonyl-4(1H)-pyridinthion

3-(3-Allylphenyl)-5-(2-chlorvinylthio)-1-äthoxy-4(1H)-pyridinthion

3-(2-Brom-1-propenylsulfonyl)-1-methyl-5-(3-methylphenyl)-4(1H)-pyridinthion

3-(6-Äthoxy-2-hexenyl)-1-methyl-5-phenyl-4(1H)-pyridinthion-hydrochlorid.

Von diesen Pyridinthionen ist aufgrund seiner guten herbiziden Eigenschaften das 1-Methyl-3-phenyl-5-(3-trifluormethylphenyl)-4(1H)-pyridinthion speziell bevorzugt.

Die Erfindung sei nun anhand von Beispielen näher erläutert.

Falls nicht ausdrücklich andere Angaben gemacht werden, sind die darin angegebene Temperaturen in Celsiusgraden angeführt. Die magnetischen Kernresonanzspektren, also die NMR-Spektren wurden auf einem 60 Megahertz-Instrument unter Verwendung Tetramethylsilan als interne Bezugsquelle bestimmt und sind in Zyklen pro Sekunde (CPS) angegeben. Die Schmelzpunkte sind mit einem Heizblock bestimmt worden.

Beispiel 1

A) Herstellung des Ausgangsmaterials der Formel IV

Ein Gemisch aus 26,8 g Phenylaceton und 71,4 g Dimethylformamid-dimethylacetal in 100 ml wasserfreiem Dimethylformamid wird 5 Tage zum Rückfluss erhitzt. Das Reaktionsgemisch wird anschliessend unter Vakuum zur Trockene eingedampft. Die Analyse des dabei zurückbleibenden roten Öls ergibt, dass es aus etwa 75 % des gewünschten 1,5-Bis(dimethylamino)-2-phenyl-1,4-pentadien-3-on und etwa 25 % der entsprechenden monoaminoformylierten Verbindung besteht. Die Ausbeute beträgt 30 g, und das Zwischenprodukt wird ohne Reinigung weiter verwendet.

B) Cyclisierung

Das oben hergestellte Gemisch wird in 100 ml denaturiertem Äthanol gelöst und mit 30 g Methylamin-hydrochlorid versetzt. Das Gemisch wird dann über Nacht zum Rückfluss erhitzt, worauf man das Lösungsmittel unter Vakuum entfernt. Der

Rückstand wird in Methylenchlorid aufgenommen, worauf man die Lösung mit Wasser und gesättigter wässriger Natriumchloridlösung wäscht. Die gewaschene organische Schicht wird über Magnesiumsulfat getrocknet, und anschliessend wird das Lösungsmittel unter Vakuum entfernt. Das dabei zurückbleibende Öl wird mit Äthyläther geschüttelt. Das aus dem Äther ausfallende Festprodukt wird mit weiterem Äther gewaschen und an der Luft getrocknet. Durch Umkristallisieren des Produkts aus Isopropyläther-Methylenchlorid erhält man 10 g reines 1-Methyl-3-phenyl-4(1H)-pyridon, das bei 123 bis 125°C schmilzt.

C) Bromierung des Pyridones

3 g des nach dem Verfahren B) erhaltenen Pyridones werden in 100 ml Wasser gelöst, worauf man die Lösung tropfenweise mit wässrigem Brom versetzt, bis bei weiterer Zugabe kein Niederschlag mehr entsteht. Der Niederschlag wird durch Filtrieren abgetrennt, mit Wasser gewaschen und dann an der Luft getrocknet. Durch Umkristallisieren des erhaltenen Produktes aus Äthanol erhält man 3 g an dem 3-Brom-1-methyl-5-phenyl-4(1H)-pyridon, das bei 195 bis 197°C schmilzt.

Beispiel 2

A) Herstellung des Ausgangsmateriales der Formel IV

Ein Gemisch aus 1,92 g Dimethylaminoacrylnitril und 1,6 g Pyridin wird in 25 ml Äthyläther bei einer Temperatur von 0°C gelöst. Hierzu werden dann tropfenweise 3,08 g Phenylacetylchlorid in 25 ml Äthyläther gegeben, und nach beendeter Zugabe wird das Gemisch 2 h bei 0°C gerührt. Anschliessend wird das Gemisch unter Vakuum zur Trockene eingedampft. Der Rückstand wird in Methylenchlorid aufgenommen, mit Wasser gewaschen, getrocknet und erneut eingedampft. Beim Stehenlassen beginnt das Gemisch zu kristallisieren, worauf man die Feststoffe durch Filtrieren abtrennt. Nach Umkristallisieren aus Isopropanol erhält man 400 mg an dem 2-Cyano-1-dimethylamino-4-phenyl-1-buten-3-on.

300 mg des so erhaltenen Enaminketones der Formel X werden einer weiteren Aminoformylierung unterworfen, indem man sie mit 10 ml Dimethylformamidacetat 12 h auf Rückflusstemperatur erhitzt. Das Gemisch wird dann unter Vakuum eingedampft, wobei man als Rückstand das 1,5-Bis(dimethylamino)-2-cyano-4-phenyl-1,4-pentadien-3-on erhält.

B) Cyclisierung

Der nach dem obigen Verfahren erhaltene Rückstand wird mit 25 ml denaturiertem Äthanol und 1 g Methylamin-hydrochlorid versetzt. Die Äthanollösung wird weitere 12 h zum Rückfluss erhitzt und dann zur Trockene eingedampft, worauf man den Rückstand in Methylenchlorid aufnimmt. Die organische Schicht wird nach Waschen mit Wasser und Trocknen zur Trockene eingedampft, worauf der erhaltene Rückstand in Äthyläther behandelt und abfiltriert wird. Durch Umkristallisieren der Feststoffe aus Isopropyläther-Aceton erhält man 260 mg 3-Cyano-1-methyl-5-phenyl-4(1H)-pyridon, das bei 209 bis 210°C schmilzt.

Beispiel 3

A) Herstellung des Ausgangsmateriales

15 g 1-Phenyl-3-(3-trifluormethylphenyl)-2-propanon werden bei Eisbadtemperatur zu einer Äthylätherlösung von 70 g (tert.-Butoxy)-di(dimethylamino)ethan gegeben. Das Gemisch wird zum Verdampfen des Äthers erwärmt und dann zwei Stunden auf dem Dampfbad erhitzt. Die flüchtigen Bestandteile werden anschliessend unter Vakuum verdampft.

B) Cyclisierung

Der Rückstand wurde mit 15 g Methylamin-hydrochlorid, 40 ml 40% igem wässrigem Methylamin und 200 ml Äthanol vereinigt.

Das Reaktionsgemisch wird anschliessend 6 h auf dem Dampfbad erhitzt und dann zur Trockene eingedampft. Der Rückstand wird in Wasser aufgenommen und mit Methylenchlorid extrahiert. Die organische Schicht wird mit Wasser gewaschen, getrocknet und über eine Silicagelsäule mit Äthylacetat-Benzol chromatographiert. Durch Auffangen und Eindampfen der produkthaltigen Fraktionen erhält man 0,9 g 1-Methyl-3-phenyl-5-(3-trifluormethylphenyl)-4(1H)-pyridon, das bei 152 bis 156°C schmilzt.

C) Bromierung

Das nach dem Verfahren B) erhaltene Pyridon wurde anschliessend nach dem in Beispiel 1 unter C) beschriebenen Verfahren bromiert. Man erhielt dabei das 3-Brom-1-methyl-5-(3-trifluormethylphenyl)-4(1H)-pyridon, welches einen Schmelzpunkt von 167 bis 169°C besitzt. Die Ausbeute betrug 76%.

Beispiel 4

A) Herstellung des Ausgangsmateriales der Formel IV

Das zur Aminoformylierung verwendete Reagens wird hergestellt durch tropfenweise Zugabe von 30 g Dimethylformamid zu 20 g Phosgen in 150 ml Chloroform bei einer Temperatur von 0°C. Anschliessend werden 10 g des 1,3-Bis(3-chlorphenyl)-2-propanons in 50 ml Chloroform zugesetzt. Das Gemisch wird 3 h gerührt und dann mit 50 ml 40% igem wässrigem Methylamin versetzt.

B) Cyclisierung

Aus dem gemäss A) erhaltenen Gemisch wird das Chloroform abgedampft. Zu dem Rückstand werden 200 ml Äthanol und weitere 50 ml an 40% igem wässrigem Methylamin zugesetzt. Hierauf wird das Gemisch über Nacht zum Rückfluss erhitzt. Am Morgen extrahiert man das Produkt in der im obigen Beispiel beschriebenen Weise und chromatographiert das Ganze über eine Silicagelsäule mit Äthylacetat, das zunehmend grösser werdende Mengen Methanol enthält. Hierbei erhält man als Produkt 0,85 g des 3,5-Bis(3-chlorphenyl)-1-methyl-4(1H)-pyridons, das bei 164 bis 167°C schmilzt.

In den nachfolgenden Beispielen wurde das Ausgangsmaterial nach dem Verfahren gemäss Beispiel 1, Stufe A) hergestellt. Die anschliessende Cyclisierung wurde nach dem Verfahren gemäss Beispiel 1, Stufe B) durchgeführt.

Beispiel 5

A) Das hergestellte Ausgangsmaterial der Formel IV war das 1,5-Bis(dimethylamino)-2-(3-trifluormethylphenyl)-1,4-pentadien-3-on.

B) Cyclisierung

Das gemäss A) erhaltene Ausgangsmaterial wurde mit Methylamin-hydrochlorid zu dem 1-Methyl-3-(3-trifluormethylphenyl)-4(1H)-pyridon cyclisiert. Der Schmelzpunkt lag bei 122 bis 123°C, und die Ausbeute betrug 16%.

Beispiel 6

A) Das hergestellte Ausgangsmaterial der Formel IV war das 1,5-Bis(dimethylamino)-2-(3-carboxyphenyl)-4-phenyl-1,4-pentadien-3-on.

B) Cyclisierung

Das gemäss A) erhaltene Ausgangsmaterial wurde mit Methylamin-hydrochlorid zu dem 3-(3-Carboxyphenyl)-1-methyl-5-phenyl-4(1H)-pyridon-hydrochlorid cyclisiert. Der Schmelzpunkt lag bei 266 bis 268°C, und die Ausbeute betrug 10%ig.

Beispiel 7

A) Das hergestellte Ausgangsmaterial der Formel IV war das 1,5-Bis(dimethylamino)-2-(3-cyanophenyl)-4-phenyl-1,4-pentadien-3-on.

B) Cyclisierung

Das erhaltene Ausgangsmaterial wurde mit Methylamin zu dem 3-(3-Cyanophenyl)-1-methyl-5-phenyl-4(1H)-pyridon cyclisiert. Der Schmelzpunkt lag bei 164 bis 166°C, und die Ausbeute betrug 33 %.

Beispiel 8

A) Das hergestellte Ausgangsmaterial der Formel IV war das 1,5-Bis(dimethylamino)-2-(3-äthoxycarbonylphenyl)-4-phenyl-1,4-pentadien-3-on.

B) Cyclisierung

Das gemäss A) erhaltene Ausgangsmaterial wurde mit Methylamin-hydrochlorid zu dem 3-(3-Äthoxycarbonylphenyl)-1-methyl-5-phenyl-4(1H)-pyridon cyclisiert. Der Schmelzpunkt lag bei 167 bis 168°C, und die Ausbeute betrug 11 %.

Beispiel 9

A) Das hergestellte Ausgangsmaterial der Formel IV war das 2,4-Bis(3-cyanophenyl)-1,5-bis-(dimethylamino)-1,4-pentadien-3-on.

B) Cyclisierung

Das gemäss A) erhaltene Ausgangsmaterial wurde mit Methylamin zu dem 3,5-Bis(3-cyanophenyl)-1-methyl-4(1H)-pyridon cyclisiert. Der Schmelzpunkt lag bei 322 bis 327°C, und die Ausbeute betrug 22 %.

Beispiel 10

A) Das hergestellte Ausgangsmaterial der Formel IV war das 1,5-Bis(dimethylamino)-2-phenyl-4-(3-thienyl)-1,4-pentadien-3-on.

B) Cyclisierung

Das gemäss A) erhaltene Ausgangsmaterial wurde mit Methylamin zu dem 1-Methyl-3-phenyl-5-(3-thienyl)-4(1H)-pyridon cyclisiert. Das Produkt zeigte im NMR Maxima bei 204 und 495 CPS und aromatische Protonen bei 430 bis 460 CPS. Die Ausbeute betrug 34 %.

In den nachfolgenden Beispielen wurde das Ausgangsmaterial der Formel IV nach dem Verfahren gemäss Beispiel 2, Abschnitt A) hergestellt. Die Cyclisierung dieses Ausgangsmaterials erfolgte nach dem Verfahren gemäss Beispiel 2, Abschnitt B).

Beispiel 11

A) Das hergestellte Ausgangsmaterial der Formel IV war das 1,5-Bis(dimethylamino)-2-methyl-4-(3-trifluormethylphenyl)-1,4-pentadien-3-on.

B) Cyclisierung

Das gemäss A) erhaltene Ausgangsmaterial wurde mit Methylamin zu dem 1,3-Dimethyl-5-(3-trifluormethylphenyl)-4(1H)-pyridon cyclisiert. Der Schmelzpunkt lag bei 130°C bis 131°C, und die Ausbeute betrug 12 %.

Beispiel 12

A) Das hergestellte Ausgangsmaterial der Formel IV war das 1,5-Bis(dimethylamino)-2-methyl-4-phenyl-1,4-pentadien-3-on.

B) Cyclisierung

Das gemäss A) erhaltene Ausgangsmaterial wurde mit Methylamin zu dem 1,3-Dimethyl-5-phenyl-4(1H)-pyridon cyclisiert. Der Schmelzpunkt lag bei 111 bis 113°C, und die Ausbeute betrug 8 %.

Beispiel 13

A) Das hergestellte Ausgangsmaterial der Formel IV war das 1,5-Bis(dimethylamino)-2-(3-chlorphenyl)-4-methyl-1,4-pentadien-3-on.

B) Cyclisierung

Das gemäss A) erhaltene Ausgangsmaterial wurde mit Methylamin zu dem 3-(3-Chlorphenyl)-1,5-dimethyl-4(1H)-pyridon cyclisiert. Der Schmelzpunkt lag bei 143 bis 143,5°C, und die Ausbeute betrug 6 %.

Beispiel 14

A) Das hergestellte Ausgangsmaterial der Formel IV war das 1,5-Bis(dimethylamino)-2-äthyl-4-(3-trifluormethylphenyl)-1,4-pentadien-3-on.

B) Cyclisierung

Das gemäss A) erhaltene Ausgangsmaterial wurde mit Methylamin zu dem 3-Äthyl-1-methyl-5-(3-trifluormethylphenyl)-4(1H)-pyridon cyclisiert. Der Schmelzpunkt lag bei 95,5 bis 96,5°C, und die Ausbeute betrug 7 %.

Beispiel 15

A) Das hergestellte Ausgangsmaterial der Formel IV war das 1,5-Bis(dimethylamino)-2-cyclohexyl-4-(3-trifluormethylphenyl)-1,4-pentadien-3-on.

B) Cyclisierung

Das gemäss A) erhaltene Ausgangsmaterial der Formel IV wurde mit Methylamin zu dem 3-Cyclohexyl-1-methyl-5-(3-trifluormethylphenyl)-4(1H)-pyridon cyclisiert. Der Schmelzpunkt lag bei 174 bis 175°C, und die Ausbeute betrug 40 %.

Beispiel 16

A) Das hergestellte Ausgangsmaterial der Formel IV war das 1,5-Bis(dimethylamino)-2-isopropyl-4-(3-trifluormethylphenyl)-1,4-pentadien-3-on.

B) Cyclisierung

Das gemäss A) erhaltene Ausgangsmaterial wurde mit Methylamin zu dem 3-Isopropyl-1-methyl-5-(3-trifluormethylphenyl)-4(1H)-pyridon cyclisiert. Der Schmelzpunkt lag bei 98,5 bis 99,5°C und die Ausbeute betrug 10 %.

Beispiel 17

A) Das hergestellte Ausgangsmaterial der Formel IV war das 1,5-Bis(dimethylamino)-2-hexyl-4-(3-trifluormethylphenyl)-1,4-pentadien-3-on.

B) Cyclisierung

Das gemäss A) erhaltene Ausgangsmaterial wurde mit Methylamin zu dem 3-Hexyl-1-methyl-5-(3-trifluormethylphenyl)-4(1H)-pyridon cyclisiert. Der Schmelzpunkt lag bei 89,5 bis 90,5°C, und die Ausbeute betrug 7 %.

Beispiel 18

A) Das hergestellte Ausgangsmaterial der Formel IV war das 2-Benzyl-1,5-bis(dimethylamino)-4-(3-trifluormethylphenyl)-1,4-pentadien-3-on.

B) Cyclisierung

Das gemäss A) erhaltene Ausgangsmaterial wurde mit Methylamin zu dem 3-Benzyl-1-methyl-5-(3-trifluormethylphenyl)-4(1H)-pyridon cyclisiert. Der Schmelzpunkt lag bei 98 bis 100°C, und die Ausbeute betrug 18%.

Beispiel 19

A) Das hergestellte Ausgangsmaterial der Formel IV war das 1,5-Bis(dimethylamino)-2-butyl-4-(3-trifluormethylphenyl)-1,4-pentadien-3-on.

B) Cyclisierung

Das gemäss A) erhaltene Ausgangsmaterial wurde mit Methylamin zu dem 3-Butyl-1-methyl-5-(3-trifluormethylphenyl)-4(1H)-pyridon cyclisiert. Der Schmelzpunkt lag bei 82,5 bis 84°C, und die Ausbeute betrug 9%.

Beispiel 20

A) Das hergestellte Ausgangsmaterial der Formel IV war das 1,5-Bis(dimethylamino)-2-(3-cyclohexenyl)-4-(3-trifluormethylphenyl)-1,4-pentadien-3-on.

B) Cyclisierung

Das gemäss A) erhaltene Ausgangsmaterial wurde mit Methylamin zu dem 3-(3-Cyclohexenyl)-1-methyl-5-(3-trifluormethylphenyl)-4(1H)-pyridon cyclisiert. Der Schmelzpunkt betrug 194 bis 195°C, und die Ausbeute war 43%.

Beispiel 21

A) Das hergestellte Ausgangsmaterial der Formel IV war das 1,5-Bis(dimethylamino)-2-propyl-4-(3-trifluormethylphenyl)-1,4-pentadien-3-on.

B) Cyclisierung

Das gemäss A) erhaltene Ausgangsmaterial wurde mit Methylamin zu dem 1-Methyl-3-propyl-5-(3-trifluormethylphenyl)-4(1H)-pyridon cyclisiert. Der Schmelzpunkt lag bei 45 bis 47°C, und die Ausbeute betrug 3%.

Beispiel 22

A) Das hergestellte Ausgangsmaterial der Formel IV war das 1,5-Bis(dimethylamino)-2-(4-nitrophenyl)-4-phenyl-1,4-pentadien-3-on.

B) Cyclisierung

Das gemäss A) erhaltene Ausgangsmaterial wurde mit Methylamin zu dem 1-Methyl-3-(4-nitrophenyl)-5-phenyl-4(1H)-pyridon cyclisiert. Der Schmelzpunkt lag bei 212 bis 214°C, und die Ausbeute betrug 48%.

Beispiel 23

A) Das hergestellte Ausgangsmaterial der Formel IV war das 2,4-Bis(3,4-dimethoxyphenyl)-1,5-bis(dimethylamino)-1,4-pentadien-3-on.

B) Cyclisierung

Das gemäss A) erhaltene Ausgangsmaterial wurde mit Methylamin zu dem 3,5-Bis(3,4-dimethoxyphenyl)-1-methyl-4(1H)-pyridon cyclisiert. Dieses besass einen Schmelzpunkt von 182 bis 184°C, die Ausbeute betrug 1%.

Beispiel 24

A) Das hergestellte Ausgangsmaterial der Formel IV war das 1,5-Bis(dimethylamino)-2-äthoxycarbonyl-4-phenyl-1,4-pentadien-3-on.

B) Cyclisierung

Das gemäss A) erhaltene Ausgangsmaterial wurde mit Methylamin zu dem 3-Äthoxycarbonyl-1-methyl-5-phenyl-4(1H)-pyridon cyclisiert. Der Schmelzpunkt lag bei 107 bis 108°C, und die Ausbeute betrug 68%.

Beispiel 25

A) Das hergestellte Ausgangsmaterial der Formel IV war das 1,5-Bis(dimethylamino)-(2-furyl)-4-phenyl-1,4-pentadien-3-on.

B) Cyclisierung

Das gemäss A) hergestellte Ausgangsmaterial wurde unter Verwendung von Methylamin zu dem 3-(2-Furyl)-1-methyl-5-phenyl-4(1H)-pyridon cyclisiert. Der Schmelzpunkt lag bei 191 bis 192°C, und die Ausbeute betrug 69%.

Beispiel 26

A) Das hergestellte Ausgangsmaterial der Formel IV war das 1,5-Bis(dimethylamino)-2-cyano-4-(3-trifluormethylphenyl)-1,4-pentadien-3-on.

B) Cyclisierung

Das gemäss A) hergestellte Ausgangsmaterial wurde unter Verwendung von Methylamin zu dem 3-Cyano-1-methyl-5-(3-trifluormethylphenyl)-4(1H)-pyridon cyclisiert. Der Schmelzpunkt lag bei 228 bis 229°C, und die Ausbeute betrug 40%.

Beispiel 27

A) Das hergestellte Ausgangsmaterial der Formel IV war das 1,5-Bis(dimethylamino)-2-(3,4-dimethoxyphenyl)-4-phenyl-1,4-pentadien-3-on.

B) Cyclisierung

Das gemäss A) erhaltene Produkt wurde unter Verwendung von Methylamin zu dem 3-(3,4-Dimethoxyphenyl)-1-methyl-5-phenyl-4(1H)-pyridon cyclisiert. Der Schmelzpunkt lag bei 154 bis 157°C, und die Ausbeute betrug 4%.

Beispiel 28

A) Das hergestellte Ausgangsmaterial der Formel IV war das 1,5-Bis(dimethylamino)-2-(3-isopropenylphenyl)-4-phenyl-1,4-pentadien-3-on.

B) Cyclisierung

Das gemäss A) erhaltene Produkt wurde unter Verwendung von Methylamin zu dem 3-(3-Isopropenylphenyl)-1-methyl-5-phenyl-4(1H)-pyridon cyclisiert. Das Produkt zeigte im NMR Maxima bei 125, 214, 302 und 327 CPS und aromatische Protonen bei 420 bis 470 CPS. Die Ausbeute betrug 4%.

Beispiel 29

A) Das hergestellte Ausgangsmaterial der Formel IV war das 1,5-Bis(dimethylamino)-2-(3-äthylphenyl)-4-phenyl-1,4-pentadien-3-on.

B) Cyclisierung

Das gemäss A) erhaltene Produkt wurde mit Methylamin zu dem 3-(3-Äthylphenyl)-1-methyl-5-phenyl-4(1H)-pyridon cyclisiert. Der Schmelzpunkt lag bei 135 bis 137°C, und die Ausbeute betrug 5%.

Beispiel 30

A) Das hergestellte Ausgangsmaterial der Formel IV war das 1,5-Bis(dimethylamino)-2-(3-hexylphenyl)-4-phenyl-1,4-pentadien-3-on.

B) Cyclisierung

Das gemäss A) erhaltene Produkt wurde unter Verwendung von Methylamin zu dem 3-(3-Hexylphenyl)-1-methyl-5-phenyl-4(1H)-pyridon cyclisiert. Der Schmelzpunkt lag bei 93 bis 95°C, und die Ausbeute betrug 6%.

Beispiel 31

A) Das hergestellte Ausgangsmaterial der Formel IV war das 1,5-Bis(dimethylamino)-2-(4-äthylphenyl)-4-phenyl-1,4-pentadien-3-on.

B) Cyclisierung

Das gemäss A) erhaltene Ausgangsmaterial der Formel IV wurde unter Verwendung von Methylamin zu dem 3-(4-Äthylphenyl)-1-methyl-5-phenyl-4(1H)-pyridon cyclisiert. Der Schmelzpunkt lag bei 143 bis 145°C, und die Ausbeute betrug 6%.

Beispiel 32

A) Das hergestellte Ausgangsmaterial der Formel IV war das 1,5-Bis(dimethylamino)-2-(3-cyclohexylmethylphenyl)-4-phenyl-1,4-pentadien-3-on.

B) Cyclisierung

Das so erhaltene Ausgangsmaterial wurde unter Verwendung von Methylamin zu dem 3-(3-Cyclohexylmethylphenyl)-1-methyl-5-Phenyl-4(1H)-pyridon cyclisiert. Der Schmelzpunkt lag bei 147 bis 148°C, und die Ausbeute betrug 9%.

Beispiel 33

A) Das hergestellte Ausgangsmaterial der Formel IV war das 2-Benzylthio-1,5-bis(dimethylamino)-4-phenyl-1,4-pentadien-3-on.

B) Cyclisierung

Das so erhaltene Ausgangsmaterial wurde unter Verwendung von Methylamin zu dem 1-Methyl-3-phenyl-5-benzylthio-4(1H)-pyridon cyclisiert. Der Schmelzpunkt lag bei 155 bis 157°C, und die Ausbeute betrug 36%.

Beispiel 34

A) Das hergestellte Ausgangsmaterial der Formel IV war das 1,5-Bis(dimethylamino)-2-phenyl-4-phenylthio-1,4-pentadien-3-on.

B) Cyclisierung

Das gemäss A) erhaltene Ausgangsmaterial wurde unter Verwendung von Methylamin zu dem 1-Methyl-3-phenyl-5-phenylthio-4(1H)-pyridon cyclisiert. Der Schmelzpunkt lag bei 164 bis 165°C, und die Ausbeute betrug 18%.

Beispiel 35

A) Das erhaltene Ausgangsmaterial der Formel IV war das 1,5-Bis(dimethylamino)-2-phenoxy-4-phenyl-1,4-pentadien-3-on.

B) Cyclisierung

Das gemäss A) erhaltene Ausgangsmaterial wurde mit Methylamin zu dem 1-Methyl-3-phenoxy-5-phenyl-4(1H)-pyridon cyclisiert. Der Schmelzpunkt lag bei 176 bis 177°C, und die Ausbeute betrug 19%.

Beispiel 36

A) Das hergestellte Ausgangsmaterial der Formel IV war das 1,5-Bis(dimethylamino)-2-(3-nitrophenyl)-4-phenyl-1,4-pentadien-3-on.

B) Cyclisierung

Das gemäss A) hergestellte Ausgangsmaterial wurde unter Verwendung von Methylamin zu dem 1-Methyl-3-(3-nitrophenyl)-5-phenyl-4(1H)-pyridon cyclisiert. Der Schmelzpunkt lag bei 135 bis 136°C.

Anhand der folgenden Beispiele werden weitere Umsetzungsverfahren erläutert, denen nach dem erfindungsgemässen Verfahren hergestellte Produkte der Formel Ia unterworfen werden können, um weitere Produkte zu erzeugen, die ebenfalls unter die Formel Ia fallen.

Beispiel 37

Das nach dem Verfahren gemäss Beispiel 15 hergestellte 3-Cyclohexyl-1-methyl-5-(3-trifluormethylphenyl)-4(1H)-pyridon wurde zu dem 3-(3,4-Dibromcyclohexyl)-1-methyl-5-(3-trifluormethylphenyl)-4(1H)-pyridon-hydrobromid bromiert. Der Schmelzpunkt dieses Salzes betrug 196 bis 198°C. Die Ausbeute betrug 26%.

Beispiel 38

Das nach dem Verfahren gemäss Beispiel 34 erhaltene 1-Methyl-3-phenyl-5-phenylthio-4(1H)-pyridon wurde unter Verwendung von m-Chlorperbenzoesäure zu dem 1-Methyl-3-phenyl-5-phenylsulfonyl-4(1H)-pyridon oxidiert. Der Schmelzpunkt des Produktes betrug 218 bis 220°C, und die Ausbeute war 50%.

Beispiel 39

Die in der Folge angeführten Pyridone wurden nach dem in Beispiel 1 beschriebenen Verfahren hergestellt:

- 30 1-Methyl-3,5-bis(3-trifluormethylphenyl)-4(1H)-pyridon, Schmelzpunkt 152 bis 154°C.
- 3-Phenyl-1-(2,2,2-trifluoräthyl)-5-(3-trifluormethylphenyl)-4(1H)-pyridon, NMR: bei 256 CPS zentriertes Quartett, bei 420 bis 468 CPS aromatische Protonen.
- 35 3-(3-Bromphenyl)-5-(3-chlorphenyl)-1-methyl-4(1H)-pyridon, Schmelzpunkt 192°C.
- 3-(3-Chlorphenyl)-5-(4-chlorphenyl)-1-methyl-4(1H)-pyridon, Schmelzpunkt 170 bis 172°C
- 3-(2-Fluorphenyl)-1-methyl-5-(3-trifluormethylphenyl)-4(1H)-pyridon, Schmelzpunkt 152 bis 154°C
- 40 3-(2-Chlorphenyl)-5-(3-chlorphenyl)-1-methyl-4(1H)-pyridon, Schmelzpunkt 160 bis 161°C
- 3-(3-Methoxyphenyl)-1-methyl-5-(3-trifluormethylphenyl)-4(1H)-pyridon, Schmelzpunkt 113 bis 115°C
- 45 3-(4-Chlorphenyl)-1-methyl-5-(3-trifluormethylphenyl)-4(1H)-pyridon, Schmelzpunkt 153 bis 155°C
- 1-Allyl-3-phenyl-5-(3-trifluormethylphenyl)-4(1H)-pyridon, Schmelzpunkt 107 bis 109°C
- 3-(4-Isopropylphenyl)-1-methyl-5-phenyl-4(1H)-pyridon, Schmelzpunkt 159°C
- 50 3-(2-Chlorphenyl)-1-methyl-5-(3-trifluormethylphenyl)-4(1H)-pyridon, Schmelzpunkt 191 bis 193°C
- 3-(3-Fluorphenyl)-1-methyl-5-(3-trifluormethylphenyl)-4(1H)-pyridon, Schmelzpunkt 94 bis 96°C
- 55 3-(4-Fluorphenyl)-1-methyl-5-(3-trifluormethylphenyl)-4(1H)-pyridon, Schmelzpunkt 133 bis 134°C
- 3-(4-Methoxyphenyl)-1-methyl-5-(3-trifluormethylphenyl)-4(1H)-pyridon, Schmelzpunkt 162 bis 165°C
- 1-Methyl-3-(3-methylthiophenyl)-5-phenyl-4(1H)-pyridon, das durch das NMR-Spektrum identifiziert wird, in dem sich Maxima bei 144 und 227 CPS zeigen, wobei bei 420 bis 440 und 442 bis 458 CPS aromatische Protonen liegen
- 1-Methyl-3-phenyl-5-(4-trifluormethylphenyl)-4(1H)-pyridon, Schmelzpunkt 164 bis 166°C
- 60 3-(3-Benzoyloxyphenyl)-1-methyl-5-phenyl-4(1H)-pyridon, das bei 158 bis 160°C schmilzt
- 1-Methyl-3-phenyl-5-(2-thienyl)-4(1H)-pyridon, Schmelzpunkt 147 bis 148°C

- 3-(3-Isobutylphenyl)-1-methyl-5-phenyl-4(1H)-pyridon, NMR-Dubletts bei 54 und 147 CPS, ein Septett bei 113 CPS, aromatische Protonen bei 420 bis 460 CPS
- 3-(2,4-Dichlorphenyl)-5-phenyl-4(1H)-pyridon, das durch Infrarotanalyse sowie magnetische Kernresonanzmessung identifiziert wird
- 3-(2,4-Dichlorphenyl)-1-methyl-5-phenyl-4(1H)-pyridon, das bei 202 bis 204°C schmilzt und durch sein magnetisches Kernresonanzspektrum sowie durch Infrarotanalyse identifiziert wird.
- 3,5-Diphenyl-1-äthyl-4(1H)-pyridon, Schmelzpunkt 171°C
- 1-Allyl-3,5-diphenyl-4(1H)-pyridon, Schmelzpunkt 174°C
- 3,5-Diphenyl-1-isopropyl-4(1H)-pyridon, Schmelzpunkt 152°C
- 1-Cyanomethyl-3,5-diphenyl-4(1H)-pyridon, Schmelzpunkt 221 bis 224°C
- 3,5-Diphenyl-1-propyl-4(1H)-pyridon, das bei 172 bis 174°C schmilzt
- 3,5-Diphenyl-1-methoxy-4(1H)-pyridon, Schmelzpunkt 165°C
- 3-(3-Fluorphenyl)-1-methyl-5-phenyl-4(1H)-pyridon, Schmelzpunkt 133,5°C
- 3-(4-Bromphenyl)-1-methyl-5-phenyl-4(1H)-pyridon, Schmelzpunkt 172°C
- 3-(4-Methoxyphenyl)-1-methyl-5-phenyl-4(1H)-pyridon, Schmelzpunkt 165°C
- 3-(3-Chlorphenyl)-1-methyl-5-phenyl-4(1H)-pyridon, Schmelzpunkt 172,5°C
- 3-(4-Chlorphenyl)-1-methyl-5-phenyl-4(1H)-pyridon, Schmelzpunkt 141,5°C
- 1-Methyl-3-(1-naphthyl)-5-phenyl-4(1H)-pyridon, Maxima im NMR bei 204 und 483 CPS, aromatische Protonen bei 430 bis 470 CPS
- 3,5-Bis(3-chlorphenyl)-1-methyl-4(1H)-pyridon, Schmelzpunkt 164 bis 167°C
- 1-Methyl-3-(3-methylphenyl)-5-phenyl-4(1H)-pyridon (Komplex mit 0,5 Mol Benzol), Schmelzpunkt 79,5°C
- 1-Methyl-3-(4-methylphenyl)-5-methyl-4(1H)-pyridon, Schmelzpunkt 144,5°C
- 1-Methyl-3-(2-methylphenyl)-5-phenyl-4(1H)-pyridon, NMR-Maxima bei 133 und 201 CPS, aromatische Protonen bei 420 bis 440 sowie 442 bis 460 CPS
- 3-(4-Fluorphenyl)-1-methyl-5-phenyl-4(1H)-pyridon, Schmelzpunkt 166°C
- 1-Methyl-3-phenyl-5-(3-trifluormethylphenyl)-4(1H)-pyridon, Schmelzpunkt 152 bis 156°C
- 3-(3-Methoxyphenyl)-1-methyl-5-phenyl-4(1H)-pyridon, NMR-Maxima bei 200 und 220 CPS, aromatische Protonen bei 420 bis 440 sowie 442 bis 460 CPS
- 3-(3,4-Dichlorphenyl)-1-methyl-5-phenyl-4(1H)-pyridon, Schmelzpunkt 166,5°C
- 3-(2,5-Dichlorphenyl)-1-methyl-5-phenyl-4(1H)-pyridon, Schmelzpunkt 155,5°C
- 3-(2-Chlorphenyl)-1-methyl-5-phenyl-4(1H)-pyridon, Schmelzpunkt 145°C
- 3,5-Bis(3-fluorphenyl)-1-methyl-4(1H)-pyridon, Schmelzpunkt 149 bis 151°C
- 3-(3-Chlorphenyl)-5-(3-fluorphenyl)-1-methyl-4(1H)-pyridon, Schmelzpunkt 145 bis 146°C
- 3-(3,5-Dichlorphenyl)-1-methyl-5-phenyl-4(1H)-pyridon, Schmelzpunkt 131 bis 135°C
- 3,5-Bis(3-bromphenyl)-1-methyl-4(1H)-pyridon, Schmelzpunkt 216,5°C
- 3-(3-Bromphenyl)-1-methyl-5-phenyl-4(1H)-pyridon, Schmelzpunkt 172°C
- 3-(2-Fluorphenyl)-1-methyl-5-phenyl-4(1H)-pyridon, Schmelzpunkt 165°C
- 3-(3-Bromphenyl)-1-methyl-5-(3-trifluormethylphenyl)-4(1H)-pyridon, Schmelzpunkt 151 bis 153°C
- 1-(1-Carboxyäthyl)-3-phenyl-5-(3-trifluormethylphenyl)-4(1H)-pyridon, Schmelzpunkt 236 bis 237°C
- 1-Dimethylamino-3,5-diphenyl-4(1H)-pyridon, Schmelzpunkt 143°C
- 1-Methyl-3-(2-naphthyl)-5-phenyl-4(1H)-pyridon, Schmelzpunkt 101 bis 105°C
- 1-Äthyl-3-phenyl-5-(3-trifluormethylphenyl)-4(1H)-pyridon, Schmelzpunkt 98 bis 100°C
- 3-Phenyl-1-propyl-5-(3-trifluormethylphenyl)-4(1H)-pyridon, Triplettmaxima im NMR bei 60 und 230 CPS und ein Sextuplett bei 114 CPS
- 1-Methoxy-3-phenyl-5-(3-trifluormethylphenyl)-4(1H)-pyridon, NMR-Maximum bei 248 CPS
- 3-(3-Chlorphenyl)-1-methyl-5-(3-trifluormethylphenyl)-4(1H)-pyridon, Schmelzpunkt 133 bis 135°C
- 3-(4-Biphenyl)-1-methyl-5-phenyl-4(1H)-pyridon, Schmelzpunkt 186 bis 190°C
- 3-(3-Biphenyl)-1-methyl-5-phenyl-4(1H)-pyridon, Schmelzpunkt 186 bis 190°C
- 1-Methyl-3-(3-trifluormethylphenyl)-4(1H)-pyridon, Schmelzpunkt 122 bis 123°C
- 3-(3-Carboxyphenyl)-1-methyl-5-phenyl-4(1H)-pyridon, Schmelzpunkt 266 bis 268°C
- 3-(3-Cyanophenyl)-1-methyl-5-phenyl-4(1H)-pyridon, Schmelzpunkt 164 bis 166°C
- 3-(3-Äthoxycarbonylphenyl)-1-methyl-5-phenyl-4(1H)-pyridon, Schmelzpunkt 167 bis 168°C
- 3,5-Bis(3-cyanophenyl)-1-methyl-4(1H)-pyridon, Schmelzpunkt 322 bis 327°C
- 1-Methyl-3-phenyl-5-(3-thienyl)-4(1H)-pyridon, NMR-Maxima bei 204 und 495 CPS, aromatische Protonen bei 430 bis 460 CPS
- 1,3-Dimethyl-5-(3-trifluormethylphenyl)-4(1H)-pyridon, Schmelzpunkt 130 bis 131°C
- 1,3-Dimethyl-5-phenyl-4(1H)-pyridon, Schmelzpunkt 111 bis 113°C
- 3-(3-Chlorphenyl)-1,5-dimethyl-4(1H)-pyridon, Schmelzpunkt 143 bis 143,5°C
- 3-Äthyl-1-methyl-5-(3-trifluormethylphenyl)-4(1H)-pyridon, Schmelzpunkt 95,5 bis 96,5°C
- 3-Cyclohexyl-1-methyl-5-(3-trifluormethylphenyl)-4(1H)-pyridon, Schmelzpunkt 174 bis 175°C
- 3-Isopropyl-1-methyl-5-(3-trifluormethylphenyl)-4(1H)-pyridon, Schmelzpunkt 98,5 bis 99,5°C
- 3-Hexyl-1-methyl-5-(3-trifluormethylphenyl)-4(1H)-pyridon, Schmelzpunkt 89,5 bis 90,5°C
- 3-Benzyl-1-methyl-5-(3-trifluormethylphenyl)-4(1H)-pyridon, Schmelzpunkt 98 bis 100°C
- 3-Butyl-1-methyl-5-(3-trifluormethylphenyl)-4(1H)-pyridon, Schmelzpunkt 82,5 bis 84°C
- 3-(3-Cyclohexenyl)-1-methyl-5-(3-trifluormethylphenyl)-4(1H)-pyridon, Schmelzpunkt 194 bis 195°C
- 1-Methyl-3-propyl-5-(3-trifluormethylphenyl)-4(1H)-pyridon, Schmelzpunkt 45 bis 47°C
- 1-Methyl-3-(4-nitrophenyl)-5-phenyl-4(1H)-pyridon, Schmelzpunkt 212 bis 214°C
- 3,5-Bis(3,4-dimethoxyphenyl)-1-methyl-4(1H)-pyridon, Schmelzpunkt 182 bis 184°C
- 3-Äthoxycarbonyl-1-methyl-5-phenyl-4(1H)-pyridon, Schmelzpunkt 107 bis 108°C
- 3-(2-Furyl)-1-methyl-5-phenyl-4(1H)-pyridon, Schmelzpunkt 191 bis 192°C
- 3-Cyano-1-methyl-5-(3-trifluormethylphenyl)-4(1H)-pyridon, Schmelzpunkt 228 bis 229°C
- 3-(3,4-Dimethoxyphenyl)-1-methyl-5-phenyl-4(1H)-pyridon, Schmelzpunkt 154 bis 157°C
- 3-(3-Isopropenylphenyl)-1-methyl-5-phenyl-4(1H)-pyridon, NMR-Maxima bei 125, 214, 302 und 327 CPS, aromatische Protonen bei 420 bis 470 CPS
- 3-(3-Äthylphenyl)-1-methyl-5-phenyl-4(1H)-pyridon, Schmelzpunkt 135 bis 137°C

3-(3-Hexylphenyl)-1-methyl-5-phenyl-4(1H)-pyridon, Schmelzpunkt 93 bis 95°C

3-(4-Äthylphenyl)-1-methyl-5-phenyl-4(1H)-pyridon, Schmelzpunkt 143 bis 145°C

3-(3-Cyclohexylmethylphenyl)-1-methyl-5-phenyl-4(1H)-pyridon, Schmelzpunkt 147 bis 148°C

1-Methyl-3-phenyl-5-benzylthio-4(1H)-pyridon, Schmelzpunkt 155 bis 157°C

1-Methyl-3-phenyl-5-phenylthio-4(1H)-pyridon, Schmelzpunkt 164 bis 165°C

1-Methyl-3-phenoxy-5-phenyl-4(1H)-pyridon, Schmelzpunkt 176 bis 177°C

3-Methoxy-1-methyl-5-phenyl-4(1H)-pyridon, das bei 153–155°C schmilzt

3-(3-Äthoxyphenyl)-1-methyl-5-phenyl-4(1H)-pyridon, das bei 133–135°C schmilzt

3-(3-Isopropoxyphenyl)-1-methyl-5-phenyl-4(1H)-pyridon, NMR-Maxima bei 81, 209 sowie 276 CPS, aromatische Protonen bei 401 bis 468 CPS

3-(3-Cyanomethoxyphenyl)-1-methyl-5-phenyl-4(1H)-pyridon, NMR-Maxima bei 207 und 275 CPS, aromatische Protonen bei 396 bis 456 CPS

3-(3-Dodecyloxyphenyl)-1-methyl-5-phenyl-4(1H)-pyridon, NMR-Maxima bei 52, 207 und 234 CPS, ein breites Maximum bei 60 bis 122 CPS, aromatische Protonen bei 396 bis 461 CPS

1-Methyl-3-[3-(4-nitrophenoxy)phenyl]-5-phenyl-4(1H)-pyridon, NMR-Maxima bei 222 und 488,5 CPS, aromatische Protonen bei 414 bis 463 CPS

1-Methyl-3-(3-methylsulfonyloxyphenyl)-5-phenyl-4(1H)-pyridon, NMR-Maxima bei 185 und 213 CPS, aromatische Protonen bei 422 bis 472 CPS

3-(3-Hexyloxyphenyl)-1-methyl-5-phenyl-4(1H)-pyridon, NMR-Maxima bei 53, 214 und 239 CPS, ein breites Maximum bei 60 bis 120 CPS, aromatische Protonen bei 402 bis 465 CPS

3-(3-Decyloxyphenyl)-1-methyl-5-phenyl-4(1H)-pyridon, NMR-Maxima bei 53, 211 und 239 CPS, ein breites Maximum bei 62 bis 123 CPS, aromatische Protonen bei 404 bis 467 CPS

1-Methyl-3-phenyl-5-(3-propoxyphenyl)-4(1H)-pyridon, NMR-Maxima bei 54, 101,5, 208 und 232 CPS, aromatische Protonen bei 400 bis 463 CPS

3-(3-Cyclohexylmethoxyphenyl)-1-methyl-5-phenyl-4(1H)-pyridon, NMR-Maxima bei 214 und 226 CPS, ein breites Maximum bei 35 bis 124 CPS, aromatische Protonen bei 402 bis 466 CPS

1-Methyl-3-(3-octyloxyphenyl)-5-phenyl-4(1H)-pyridon, NMR-Maxima bei 52, 218 und 239 CPS, ein breites Maximum bei 58 bis 122 CPS, aromatische Protonen bei 403 bis 467 CPS

1-Methyl-3-(3-phenoxyphenyl)-5-phenyl-4(1H)-pyridon, NMR-Maximum bei 214 CPS, aromatische Protonen bei 410 bis 470 CPS

1-Methyl-3,5-diphenyl-4(1H)-pyridon-hydrojodid, Schmelzpunkt 110°C

1-Methyl-3,5-diphenyl-4(1H)-pyridon-hydrochlorid, Schmelzpunkt 187 bis 194°C

Beispiel 40

Nach dem in Beispiel 3 beschriebenen Verfahren wurde das 1-

Methyl-3,5-diphenyl-4(1H)-pyridon hergestellt.

Typische Salzverbindungen, in welche die nach dem erfindungsgemässen Verfahren hergestellten Pyridone der Formel Ia bzw. Pyridothione der Formel Ib, umgewandelt werden können, sind die Säureadditionssalze.

Aus dem erhaltenen Pyridon wurden die folgenden Salze hergestellt:

das 1-Methyl-3,5-diphenyl-4(1H)-pyridon-hydrojodid, Schmelzpunkt 110°C, Ausbeute 100 %;

das 1-Methyl-3,5-diphenyl-4(1H)-pyridon-hydrochlorid, Schmelzpunkt 187 bis 194°C, Ausbeute 100 %.

Beispiel 41

Anhand dieses Beispiels wird die Herstellung eines Pyridothiones der Formel Ib durch Umsetzung des entsprechenden Pyridones der Formel Ia mit Phosphorpentasulfid erläutert.

10 g des gemäss Beispiel 40 hergestellten 3,5-Diphenyl-1-methyl-4(1H)-pyridones werden mit 10 g Phosphorpentasulfid in 100 ml Pyridin vermischt, worauf man das erhaltene Gemisch 2 h unter Rückfluss erhitzt, anschliessend in eine grosse Menge Wasser giesst und eine Stunde rührt. Hierauf wird das Gemisch filtriert. Durch Umkristallisieren der erhaltenen Feststoffe gelangt man zu 9,8 g an 3,5-Diphenyl-1-methyl-4(1H)-pyridothion, das bei 168 bis 171°C schmilzt.

Beispiel 42

Nach dem in Beispiel 41 beschriebenen Verfahren wurden aus den entsprechenden Pyridonen die in der Folge angeführten Pyridothione hergestellt:

3-(3-Bromphenyl)-1-methyl-5-phenyl-4(1H)-pyridothion, Schmelzpunkt 185 bis 188°C, Ausbeute 59 %

1-Methyl-3-(4-chlorphenyl)-5-(3-trifluormethylphenyl)-4(1H)-pyridothion, Schmelzpunkt 239 bis 242°C, Ausbeute beträgt 25 %

1-Methyl-3-(3-methylphenyl)-5-(3-trifluormethylphenyl)-4(1H)-pyridothion, Schmelzpunkt 193 bis 196°C, Ausbeute beträgt 50 %

1-Methyl-3-(2-methylphenyl)-5-(3-trifluormethylphenyl)-4(1H)-pyridothion, Schmelzpunkt 193 bis 195°C, Ausbeute beträgt 35 %

1-Methyl-3-propyl-5-(3-trifluormethylphenyl)-4(1H)-pyridothion, Schmelzpunkt 145 bis 148°C, Ausbeute 40 %

1-Methyl-3-phenoxy-5-(3-trifluormethylphenyl)-4(1H)-pyridothion, Schmelzpunkt 127 bis 131°C, Ausbeute 40 %

3-Äthylthio-1-methyl-5-(3-trifluormethylphenyl)-4(1H)-pyridothion, Schmelzpunkt 136 bis 138°C, Ausbeute beträgt 55 %

3-Äthoxy-1-methyl-5-(3-trifluormethylphenyl)-4(1H)-pyridothion, Schmelzpunkt 153 bis 155°C, Ausbeute 5 %

3,5-Bis(3-chlorphenyl)-1-methyl-4(1H)-pyridothion, Schmelzpunkt 210 bis 212°C, Ausbeute 86 %

3-(3-Chlorphenyl)-1-methyl-5-phenyl-4(1H)-pyridothion, Schmelzpunkt 190 bis 193°C, Ausbeute 71 %

1-Methyl-3-phenyl-5-(3-trifluormethylphenyl)-4(1H)-pyridothion, Schmelzpunkt 210°C, Ausbeute 70 %.