



ÚŘAD PRO VYNÁLEZY
A OBJEVY

POPIS VYNÁLEZU K PATENTU

252469

(11)

(B2)

(22) Přihlášeno 29 06 83
(21) PV 1087-84
(32) (31) (33) Právo přednosti od 30 06 82
(393553) Spojené státy americké

(40) Zveřejněno 15 01 87

(45) Vydáno 15 07 88

(51) Int. Cl.⁴

A 01 N 47/34

C 07 C 127/22

C 07 C 157/12

(72) Autor vynálezu

CHOU DAVID TEH-WEI, RALEIGH, CAIN PAUL ALFRED, GARY, SEVERNÍ KAROLINA
(Sp. st. a.)

(73) Majitel patentu

UNION CARBIDE CORPORATION, DANBURY, CONNECTICUT (Sp. st. a.)

(54) Způsob výroby 1-(alkylfenoxyaryl)-3-benzoylmočoviny

Uvádí se nový způsob výroby 1-(alkylfenoxyfenyl)-3-benzoylmočoviny. Nové močoviny jsou vhodné jako účinné látky insekticidního prostředku.

Tento vynález se obecně týká nového způsobu výroby 1-(alkylfenoxymethyl)-3-benzoylmočoviny.

Již před tímto vynálezem bylo v patentové literatuře popsáno několik benzoylmočoviny, které mají pesticidní účinek. Například US patent č. 3 992 553 udělený dne 16. listopadu 1976 a US patent č. 4 041 177 udělený dne 9. srpna 1977 uvádějí určité benzoylureidodifenylethery, u kterých bylo zjištěno, že mají insekticidní vlastnosti.

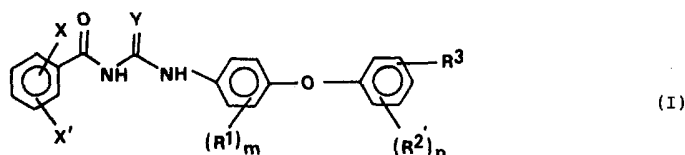
Podobně US patenty č. 3 748 356 a 3 933 908 také popisují určité substituované benzoylmočoviny a uvádějí, že prostředky mají silný insekticidní účinek. V US patentu č. 4 148 902 uděleném dne 10. dubna 1979 jsou zmíněny substituované (fenylamino)karbonyl pyridinkarboxamidy a je zde chráněn způsob potlačování hmyzu, a kromě toho složení samotného prostředku.

Další údaje o benzoylmočovínách v patentové literatuře se najdou v US patentech č. 4 166 124, 4 083 977, 4 160 834, 4 264 605, 4 064 267, 4 005 223, 4 123 449, 4 068 002, 4 194 005, 4 275 077, 4 173 639, 3 989 842 a německých spisech DOS 29 01 334 (EP 013-414) a DE 31 04 407 (EP 57-888).

Při provádění vynálezu se může dosáhnout dále uvedeného cíle vynálezu, kterým je nový způsob výroby nových 1-(alkylfenoxymethyl)-3-benzoylmočoviny.

Z širokého hlediska se tento vynález týká nového způsobu výroby 1-(alkylfenoxymethyl)-3-benzoylmočoviny.

Benzoylmočoviny vyrobitelné podle vynálezu se mohou vyjádřit obecným vzorcem I



kde

X a X' navzájem nezávisle značí vodík, halogen, alkyl, halogenalkyl, polyhalogenalkyl, alkoxy skupinu nebo polyhalogenalkoxy skupinu, kde alkylová část každé skupiny obsahuje 1 až 4 atomy uhlíku,

Y představuje kyslík nebo síru,

m a n znamenají 0 až 4,

R₁ znamená vodík, halogen, alkyl, halogenalkyl, polyhalogenalkyl nebo alkoxy skupinu, kde alkylová část každé skupiny obsahuje 1 až 4 atomy uhlíku,

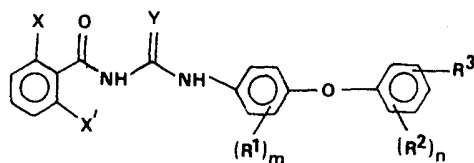
R₂ znamená vodík, halogen, alkyl, polyhalogenalkyl, polyhalogenalkoxy skupinu, kde alkylová část každé skupiny obsahuje 1 až 4 atomy uhlíku, alkylsulfonyl, alkoxy skupinu, alkylthio skupinu, dialkylaminoskupinu, kde alkylová část každé skupiny obsahuje 1 až 8 atomů uhlíku, skupinu CN, NO₂, CO₂R₄, CONHR₄, ve které R₄ značí alkyl s 1 až 8 atomy uhlíku,

R₃ znamená alkyl s 1 až 12 atomy uhlíku,

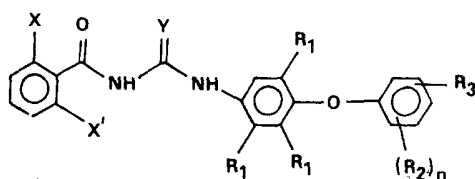
s podmínkou, že m nemůže být 0 nebo 1, když n je menší než 2.

Jak již bylo uvedeno výše, vynález se týká nového způsobu výroby 1-(alkylfenoxymethyl)-3-benzoylmočoviny, které nalézají použití v insekticidních prostředcích.

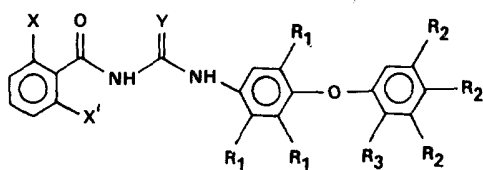
Výhodné deriváty benzoylmočoviny spadající do rozsahu obecného vzorce I jsou sloučeniny obecných vzorců II až IV



(II),



(III),

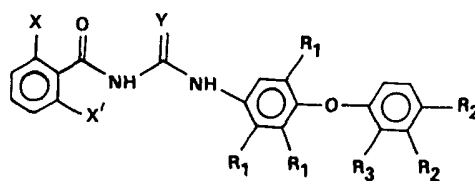


(IV),

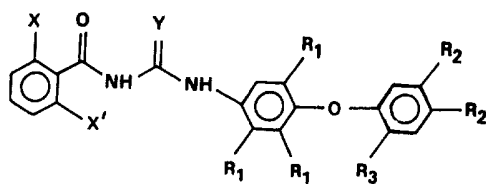
kde

X, X', Y, R₁, R₂, R₃, n a m mají výše uvedený význam.

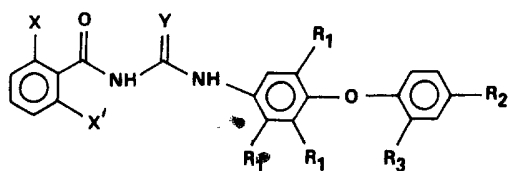
Zvláště výhodné benzoylmočoviny jsou sloučeniny obecných vzorců V až VIII



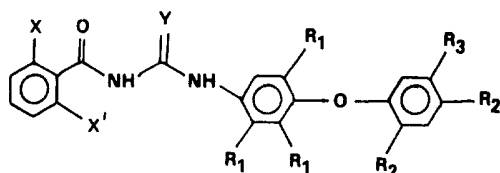
(V),



(VI),



(VII),



(VIII),

kde

X, X', Y, R₁, R₂ a R₃ mají výše uvedený význam.

Dále uvedené deriváty benzoylmočoviny jsou ilustrací sloučenin zahrnutých do výše uvedených vzorců, které se mohou vyrobit způsobem podle tohoto vynálezu:

1-/4-(2-methyl-3,4-dichlorfenoxy)-3,6-dimethyl-5-chlorfenyl/-3-(2,6-difluorbenzoyl)močovina,

1-/4-(2-methyl-3,4-dichlorfenoxy)-3,6-dimethyl-5-chlorfenyl/-3-(2-chlorbenzoyl)močovina,

1-/4-(2-methylfenoxy)-3,6-dimethyl-5-chlorfenyl/-3-(2,6-difluorbenzoyl)močovina,

1-/4-(2-methylfenoxy)-3,6-dimethyl-5-chlorfenyl/-3-(2,6-dichlorbenzoyl)močovina,

1-/4-(2-methylfenoxy)-3,6-dimethyl-5-chlorfenyl/-3-(2-chlorbenzoyl)močovina,

1-/4-(2-methylfenoxy)-3,6-dimethyl-5-chlorfenyl/-3-(2-chlorbenzoyl)thiomočovina,

1-/4-(2-methylfenoxy)-3,6-dimethyl-5-chlorfenyl/-3-(2-methylbenzoyl)thiomočovina,

1-/4-(2-methylfenoxy)-2,3,5,6-tetramethylfenyl/-3-(2,6-dimethylbenzoyl)močovina,

1-/4-(2-methylfenoxy)-2,3,5,6-tetramethylfenyl/-3-(2,6-methylbenzoyl)thiomočovina,

1-/4-(2-methylfenoxy)-2,3,5,6-tetramethylfenyl/-3-(2,6-difluorbenzoyl)močovina,

1-/4-(2-methylfenoxy)-2,3,5,6-tetramethylfenyl/-3-(2,6-dichlorbenzoyl)močovina,
1-/4-(2-methylfenoxy)-2,3,5-trimethylfenyl/-3-(2,6-dichlorbenzoyl)močovina,
1-/4-(2-methylfenoxy)-3,5-dichlorfenyl/-3-(2,6-difluorbenzoyl)močovina,
1-/4-(2-methyl-4-bromfenoxy)-3,6-dimethyl-5-chlorfenyl/-3-(2,6-difluorbenzoyl)močovina,
1-/4-(2-methyl-4-bromfenoxy)-3,6-dimethyl-5-chlorfenyl/-3-(2-chlorbenzoyl)močovina,
1-/4-(2-methyl-4-bromfenoxy)-3,6-dimethyl-5-chlorfenyl/-3-(2-chlorbenzoyl)thiomočovina,
1-/4-(2-methyl-4-bromfenoxy)-3,6-dimethyl-5-chlorfenyl/-3-(2-methylbenzoyl)thiomočovina,
1-/4-(2-methyl-4-bromfenoxy)-2,3,5,6-tetramethylfenyl/-3-(2,6-difluorbenzoyl)močovina,
1-/4-(2-methyl-4-bromfenoxy)-2,3,5,6-tetramethylfenyl/-3-(2,6-difluorbenzoyl)močovina,
1-/4-(2-methyl-4-bromfenoxy)-3,5-dimethylfenyl/-3-(2,6-difluorbenzoyl)močovina,
1-/4-(2-methyl-4-bromfenoxy)-3,5-dichlorfenyl/-3-(2-chlorbenzoyl)močovina,
1-/4-(2-brom-4-methylfenoxy)-3,6-dimethyl-5-chlorfenyl/-3-(2,6-dichlorbenzoyl)močovina,
1-/4-(2-brom-4-methylfenoxy)-3,6-dimethyl-5-chlorfenyl/-3-(2-chlorbenzoyl)močovina,
1-/4-(2-brom-4-methylfenoxy)-2,3,5,6-tetramethylfenyl/-3-(2-chlorbenzoyl)močovina,
1-/4-(2-brom-4-methylfenoxy)-3,5-dichlorfenyl/-3-(2,6-difluorbenzoyl)močovina,
1-/4-(2-brom-4-methylfenoxy)-3,5-dimethylfenyl/-3-(2-methylbenzoyl)thiomočovina,
1-/4-(2-methyl-4-terc.butylfenoxy)-3,6-dimethyl-5-chlorfenyl/-3-(2,6-difluorbenzoyl)-
močovina,
1-/4-(2-methyl-4-terc.butylfenoxy)-3,6-dimethyl-5-chlorfenyl/-3-(2-chlorbenzoyl)močovina,
1-/4-(2-methyl-4-terc.butylfenoxy)-2,3,5,6-tetramethylfenyl/-3-(2,6-difluorbenzoyl)mo-
čovina,
1-/4-(2-methyl-4-terc.butylfenoxy)-3,5-dichlorfenyl/-3-(2-methylbenzoyl)thiomočovina,
1-/4-(2-methyl-4-chlorfenoxy)-3,6-dimethyl-5-chlorfenyl/-3-(2,6-difluorbenzoyl)močovina,
1-/4-(2-methyl-4-chlorfenoxy)-3,5-dichlorfenyl/-3-(2-methylbenzoyl)thiomočovina,
1-/4-(2-methyl-4-chlorfenoxy)-2,3,5,6-tetramethylfenyl/-3-(2,6-difluorbenzoyl)močovina,
1-/4-(2-methyl-4-chlorfenoxy)-3,6-dimethyl-5-chlorfenyl/-3-(2,6-dimethoxybenzoyl)močovina,
1-/4-(4-nonylfenoxy)-3,6-dimethyl-5-chlorfenyl/-3-(2,6-difluorbenzoyl)močovina,
1-/4-(4-nonylfenoxy)-2,3,5,6-tetramethylfenyl/-3-(2-chlorbenzoyl)thiomočovina,
1-/4-(4-nonylfenoxy)-3,5-dichlorfenyl/-3-(2,6-difluorbenzoyl)močovina,

1-/4-(4-nonylfenoxy)-3,5-dimethylfenyl/-3-(2-methylbenzoyl)močovina,
1-/4-(2-chlor-4-methylfenoxy)-3,6-dimethyl-5-chlorfenyl/-3-(2,6-difluorbenzoyl)močovina,
1-/4-(2-chlor-4-methylfenoxy)-3,6-dimethyl-5-chlorfenyl/-3-(2-chlorbenzoyl)thiomočovina,
1-/4-(2-chlor-4-methylfenoxy)-3,5-dichlorfenyl/-3-(2,6-difluorbenzoyl)močovina,
1-/4-(2-chlor-4-methylfenoxy)-2,3,5,6-tetramethylfenyl/-3-(2,6-difluorbenzoyl)močovina,
1-/4-(3,4,5-trimethylfenoxy)-3,6-dimethyl-5-chlorfenyl/-3-(2,6-difluorbenzoyl)močovina,
1-/4-(3,4,5-trimethylfenoxy)-3,6-dimethyl-5-chlorfenyl/-3-(2-chlorbenzoyl)thiomočovina,
1-/4-(3,4,5-trimethylfenoxy)-2,3,5,6-tetramethylfenyl/-3-(2-methylbenzoyl)thiomočovina,
1-/4-(3,4,5-trimethylfenoxy)-3,5-dichlorfenyl/-3-(2,6-difluorbenzoyl)močovina,
1-/4-(2,3,5-trimethylfenoxy)-3,6-dimethyl-5-chlorfenyl/-3-(2,6-dimethoxybenzoyl)močovina,
1-/4-(2,3,5-trimethylfenoxy)-2,3,5,6-tetramethylfenyl/-3-(2,6-difluorbenzoyl)močovina,
1-/4-(2,3,5-trimethylfenoxy)-3-isopropylfenyl/-3-(2-methylbenzoyl)thiomočovina,
1-/4-(2,3,5-trimethylfenoxy)-3-trifluormethylfenyl/-3-(2,6-difluorbenzoyl)močovina,
1-/4-(2-methyl-4-trifluormethylfenoxy)-3,6-dimethyl-5-chlorfenyl/-3-(2,6-difluorbenzoyl)-
močovina,
1-/4-(2-methyl-4-trifluormethylfenoxy)-3,6-dimethyl-5-chlorfenyl/-3-(2-chlorbenzoyl)thio-
močovina,
1-/4-(2-methyl-4-trifluormethylfenoxy)-3,5-dichlorfenyl/-3-(2,6-dimethoxybenzoyl)močo-
vina,
1-/4-(2-methyl-4-trifluormethylfenoxy)-2,3,5-trimethylfenyl/-3-(2-methylbenzoyl)thiomo-
čovina,
1-/4-(2,4-dimethylfenoxy)-2,3,6-trimethylfenyl/-3-(2-chlorbenzoyl)močovina,
1-/4-(3,5-dimethylfenoxy)-2,6-dimethylfenyl/-3-(2,6-difluorbenzoyl)močovina,
1-/4-(2-methyl-4-methoxyfenoxy)-3,6-dimethyl-5-chlorfenyl/-3-(2,6-difluorbenzoyl)močo-
vina,
1-/4-(2-methyl-4-dimethylaminofenoxy)-3,6-dimethyl-5-chlorfenyl/-3-(2,6-difluorbenzoyl)-
močovina,
1-/4-(2-methyl-4-methylthiofenoxy)-3,6-dimethyl-5-chlorfenyl/-3-(2,6-difluorbenzoyl)-
močovina,
1-/4-(2-methyl-4-methylsulfonylfenoxy)-3,6-dimethyl-5-chlorfenyl/-3-(2,6-difluorbenzoyl)-
močovina,
1-/4-(2-methyl-4-dimethylaminofenoxy)-3,5-dimethylfenyl/-3-(2-methylbenzoyl)močovina

1-/4-(2-methyl-4-methoxyfenoxy)-3-chlor-6-methylfenyl/-3-(2-methylbenzoyl)močovina,

1-/4-(2-methyl-4-methoxyfenoxy)-3,6-dimethyl-5-chlorfenyl/-3-(3,4-dichlorbenzoyl)-močovina,

1-/4-(2,3-dimethyl-4-bromfenoxy)-3,6-dimethyl-5-chlorfenyl/-3-(2-chlorbenzoyl)močovina,

1-/4-(2,5-dimethyl-4-chlorfenoxy)-3,6-dimethyl-5-chlorfenyl/-3-(2,6-difluorbenzoyl)-močovina,

1-/4-(2,5-dimethylfenoxy)-3,6-dimethyl-5-chlorfenyl/-3-(2,6-difluorbenzoyl)močovina,

1-/4-(2,5-dimethylfenoxy)-3,6-dimethyl-5-chlorfenyl/-3-(2-chlorbenzoyl)močovina,

1-/4-(2,5-dimethyl-4-ethoxykarbonylfenoxy)-3,6-dimethyl-5-chlorfenyl/-3-(2,6-difluorbenzoyl)močovina,

1-/4-(2,5-dimethyl-4-ethoxykarbonylfenoxy)-3,6-dimethyl-5-chlorfenyl/-3-(2-chlorbenzoyl)-močovina,

1-/4-(2-methyl-4-trifluormethylfenoxy)-3,6-dimethyl-5-chlorfenyl/-3-(2-chlorbenzoyl)-močovina,

1-/4-(2,5-dimethyl-4-trifluormethylfenoxy)-3,6-dimethyl-5-chlorfenyl/-3-(2,6-difluorbenzoyl)močovina,

1-/4-(2,5-dimethyl-4-trifluormethylfenoxy)-3,6-dimethyl-5-chlorfenyl/-3-(2-chlorbenzoyl)-močovina,

1-/4-(2,5-dimethyl-4-trifluormethoxyfenoxy)-3,6-dimethyl-5-chlorfenyl/-3-(2,6-difluorbenzoyl)močovina,

1-/4-(2,5-dimethyl-4-trifluormethoxyfenoxy)-3,6-dimethyl-5-chlorfenyl/-3-(2-chlorbenzoyl)-močovina,

1-/4-(2,5-dimethyl-4-methoxyfenoxy)-3,6-dimethyl-5-chlorfenyl/-3-(2,6-difluorbenzoyl)-močovina,

1-/4-(2,5-dimethyl-4-methoxyfenoxy)-3,6-dimethyl-5-chlorfenyl/-3-(2-chlorbenzoyl)močovina,

1-/4-(3,5-dimethyl-4-chlorfenoxy)-3,6-dimethyl-5-chlorfenyl/-3-(2,6-difluorbenzoyl)močovina,

1-/4-(2,4,5-trimethylfenoxy)-3,6-dimethyl-5-chlorfenyl/-3-(2,6-difluorbenzoyl)močovina,

1-/4-(2,4,5-trimethylfenoxy)-3,6-dimethyl-5-chlorfenyl/-3-(2-chlorbenzoyl)močovina,

1-/4-(2,5-dimethyl-4-bromfenoxy)-3,6-dimethyl-5-chlorfenyl/-3-(2,6-difluorbenzoyl)močovina,

1-/4-(2,5-dimethyl-4-kyanofenoxy)-3,6-dimethyl-5-chlorfenyl/-3-(2,6-difluorbenzoyl)-močovina,

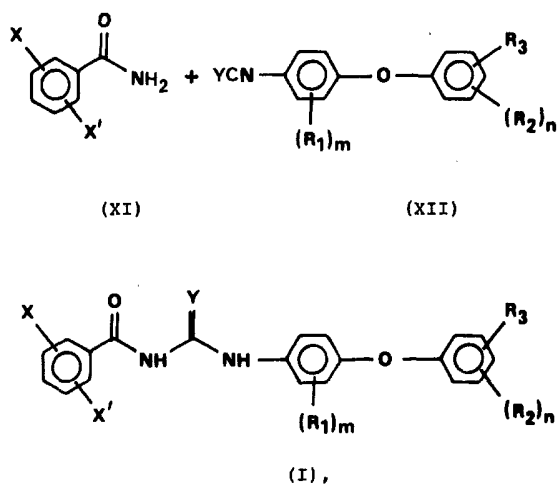
1-/4-(2,5-dimethyl-4-kyanofenoxy)-3,6-dimethyl-5-chlorfenyl/-3-(2-chlorbenzoyl)močovina,

- 1-/4-(2-methyl-4-kyanofenoxy)-3,6-dimethyl-5-chlorfenyl/-3-(2,6-difluorbenzoyl)močovina,
 1-/4-(2-methyl-4-kyanofenoxy)-3,6-dimethyl-5-chlorfenyl/-3-(2-chlorbenzoyl)močovina,
 1-/4-(2,4-dimethylfenoxy)-3,6-dimethyl-5-chlorfenyl/-3-(2,6-difluorbenzoyl)močovina,
 1-/4-(2,4-dimethylfenoxy)-3,6-dimethyl-5-chlorfenyl/-3-(2-chlorbenzoyl)močovina,
 1-/4-(2,5-dichlor-4-methylfenoxy)-3,6-dimethyl-5-chlorfenyl/-3-(2,6-difluorbenzoyl)-
 močovina,
 1-/4-(2,5-dichlor-4-methylfenoxy)-3,6-dimethyl-5-chlorfenyl/-3-(2-chlorbenzoyl)močovina,
 1-/4-(2-methyl-4,5-dichlorfenoxy)-3,6-dimethyl-5-chlorfenyl/-3-(2,6-difluorbenzoyl)-
 močovina,
 1-/4-(2-methyl-4,5-dichlorfenoxy)-3,6-dimethyl-5-chlorfenyl/-3-(2-chlorbenzoyl)močovina,
 1-/4-(2,5-dimethyl-4-chlorfenoxy)-3-methylfenyl/-3-(2,6-difluorbenzoyl)močovina a podob-
 ně.

Nové benzoylmočoviny podle tohoto vynálezu se mohou vhodně vyrábět dále popsanou metodou.

Nové sloučeniny mohou vyrábět reakcí alkylfenoxyfenylisokyanátu obecného vzorce XII s benzamidem obecného vzorce XI podle schématu I.

Schéma I



kde

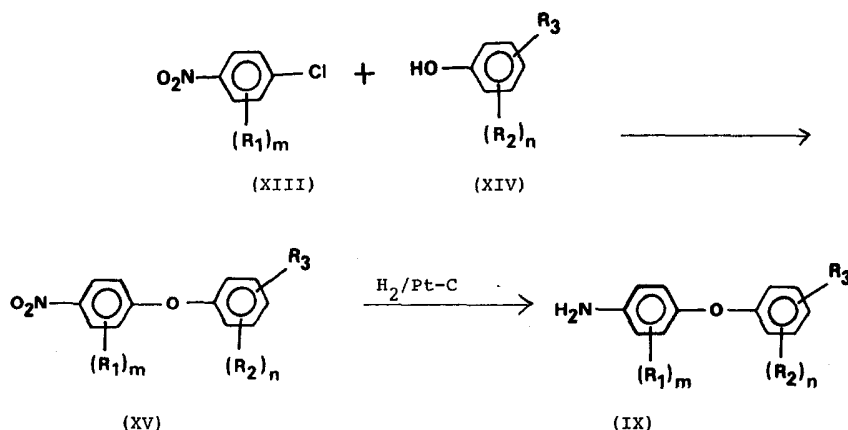
X, X', Y, R₁, R₂, R₃, m a n mají význam uvedený u obecného vzorce I.

Obecně se reakce ilustrovaná ve schématu I může provádět v organických rozpouštědlech, jako aromatických uhlovodících, halogenovaných uhlovodících a podobně. Rozpouštědlem, jako je toluen a 1,2-dichlorethan, se dává přednost. Tyto reakce probíhají za teplot v rozmezí od teploty místnosti do 150 °C.

Meziprodukty uvedené ve schématu I se mohou vyrábět podle obecně přijatelných postupů.

Anilin se může vyrobit podle schématu II uvedeného dále.

Schéma II



kde

R_1 , R_2 , R_3 , m a n mají význam uvedený u obecného vzorce I.

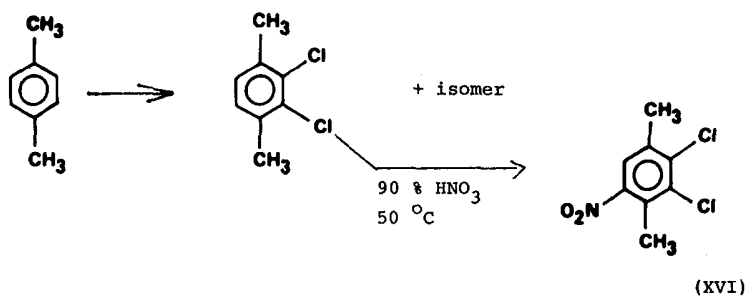
Reakce substituovaného chlornitrobenzenu obecného vzorce XIII se substituovaným fenolem obecného vzorce XIV probíhá v přítomnosti báze při zvýšené teplotě za vzniku substituovaného nitroetheru obecného vzorce XV. Redukce nitroetheru obecného vzorce XV na anilin obecného vzorce IX se může dosáhnout pod vodíkovou atmosférou za použití heterogenního hydrogenačního katalyzátoru. Mezi vhodné katalyzátory se zahrnuje platina nebo palladium na uhlí nebo Raneyův nikl.

Tlak v rozmezí od 14 do 689 kPa se může použít za teploty místnosti. Vhodná rozpouštědla zahrnují aromatický uhlovodík nebo alkohol. Redukce nitroetheru obecného vzorce XV na anilin obecného vzorce IX se může také dosáhnout chemickou metodou za použití postupu, který uvedl E. Enders a kol. v britském patentu č. 1 456 964.

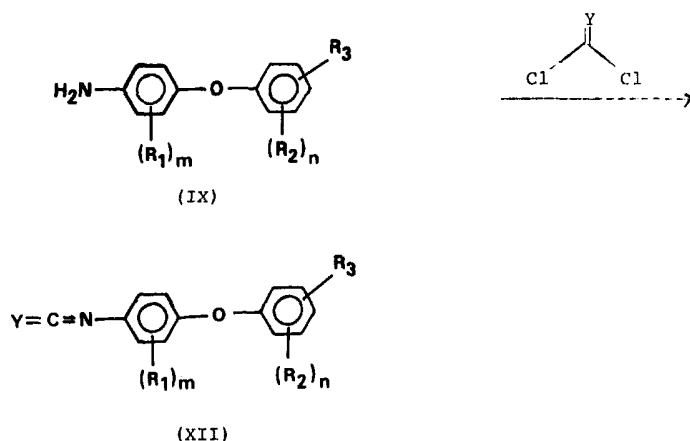
Meziprodukty jako substituovaný chlornitrobenzen a substituovaný fenol jsou dostupné na trhu nebo se mohou vyrobit metodou dobře známou z chemické literatury.

Zvláštní chlornitrobenzen obecného vzorce XVI se vyrábí postupem naznačeným ve schématu III.

Schéma III



Anilin se může převést na isokyanát nebo isothiokyanát obecného vzorce XII reakcí s fosgenem nebo thiofosgenem, jak je znázorněno dále:



kde

Y, R_1 , R_2 , R_3 , m a n mají význam uvedený u obecného vzorce I.

Sloučeniny zahrnuté do tohoto vynálezu se mohou používat jako insekticidy metodami známými odborníkům v oboru. Insekticidní prostředky obsahující sloučeniny jako účinnou látku budou obvykle obsahovat nosič a/nebo ředidlo, buď v kapalném nebo pevném stavu.

Vhodná kapalná ředidla nebo nosiče zahrnují vodu, destiláty získané z ropy nebo jiné kapalně nosiče společně s povrchově aktivním prostředkem nebo bez něho. Kapalně koncentráty se mohou připravovat zředěním jedné z těchto sloučenin nefytotoxickým rozpouštědlem, jako acetone, xylenem, nitrobenzenem, cyklohexanonem nebo dimethylformamidem a dispergováním účinné látky ve vodě pomocí vhodných povrchově aktivních emulgačních a dispergačních prostředků.

Volba dispergačního nebo emulgačního prostředku a jejich použité množství se řídí povahou prostředku a schopností prostředku usnadnit dispergování účinné látky. Obvykle je žádoucí použít tak malé množství dispergačního nebo emulgačního prostředku jak jen je možné, které tvoří požadovanou disperzi účinné látky v postřiku tak, že déšť nemůže opětovně emulgovat účinnou látku poté, co byla aplikována na rostlinu a z této rostliny ji smýt.

Mohou se používat neionogenní, aniontové nebo kationtové dispergační nebo emulgační prostředky, jako jsou například kondenzační produkty alkylenoxidu s fenolem nebo organickými kyselinami, alkylarylsulfonáty, komplexní ether-alkoholy, kvarterní amoniové sloučeniny a podobně.

Při přípravě smáčitelného prášku, popraše nebo granulovaných prostředků se účinná složka disperguje v příslušně rozmělněném pevném nosiči a také na něm, jak je například hlínka, mastek, bentonit, rozsvíková zemina, valchařská hlína a podobně.

Při výrobě smáčitelných prášků mohou být obsaženy svrchu uvedené dispergační prostředky, stejně jako ligninsulfonáty.

Požadované množství účinné látky v prostředku může být použito na ošetřený hektar ve formě od 11,2 do 22 460 litrů nebo více kapalně nosiče a/nebo ředidla nebo ve formě asi od 5,6 do 560 kg inertního pevného nosiče a/nebo ředidla. Koncentrace v kapalných koncentrátech bude obvykle kolísat asi od 10 do 95 % hmotnostních a v pevných prostředcích bude asi od 0,5 do 90 % hmotnostních.

Uspokojující postřiky, popraše nebo granule pro běžné použití obsahují od asi 0,26 do 16,8 kg účinné složky na hektar.

Insekticidy zde zahrnuté chrání před napadením hmyzem rostliny nebo jiný materiál, na který se použily. Tyto insekticidy mají relativně vysokou zůstatkovou toxicitu. S ohledem na rostliny mají vysoké rozpětí bezpečnosti, pokud se použijí v dostačujícím množství k usmrcení nebo zapuzení hmyzu, nespalují nebo nepoškozují rostliny a odolávají povětrnostním podmínkám, včetně smytí způsobenému deštěm, rozkladu ultrafialovým zářením, oxidací nebo hydrolyze v přítomnosti vlhkosti nebo alespoň takovém rozkladu, oxidací a hydrolyze, jaká by materiálně snížila požadované pesticidní vlastnosti účinných látek nebo způsobila nežádoucí vlastnosti, například fytotoxicitu, účinných látek.

Účinné látky jsou chemicky tak inertní, že jsou smáčitelné v podstatě se všemi jinými složkami uvedených postřiků a mohou se použít na půdu po vysetí semen nebo na kořeny rostlin bez poškození semen nebo kořenů rostlin. Směsi účinných sloučenin se mohou používat, je-li to žádoucí, stejně jako kombinace účinných látek podle tohoto vynálezu s jinými biologicky účinnými sloučeninami nebo přísadami.

Následující příklady ilustrují nejlepší způsob provedení tohoto vynálezu.

P ř í k l a d 1

Způsob výroby 3-chlor-2,5-dimethyl-4-(2,4-dimethylfenoxy)fenylisokyanátu

Jednolitrová tříhrdlá baňka s kulatým dnem, vybavená teploměrem, nálevkou k dodatečnému vyrovnání tlaku, kondenzátorem naplněným suchým ledem a trubicí k zavádění dusíku a odvádění plynu se naplní 12,5% roztokem fosgenu v toluenu (198 ml, 21,4 g, 216,3 mmol fosgenu).

Reakční nádoba se ochladí na teplotu 0 °C a během 30 minut se přikape roztok 3-chlor-2,5-dimethyl-4-(2,4-dimethylfenoxy)anilinu (20,0 g, 72,5 mmol) v toluenu (200 ml). Výsledná heterogenní směs se nechá ohřát na teplotu místnosti a potom refluxuje 3 hodiny. Během této doby se reakční prostředí stane homogenní.

Reakční směs se potom vyčistí od přebytku fosgenu. Roztok se potom nechá ochladit a odpaří za sníženého tlaku. Získá se produkt jako slabě bělavá pevná látka. Destilací při teplotě varu 138 až 155 °C za tlaku 6,7 Pa se dostane čistý isokyanát 9 (21,8 g, 72,2 mmol, 99 %), teplota tání 63 až 66 °C ve formě voskovité bílé látky.

P ř í k l a d 2

Způsob výroby 1-/4-(2,4-dimethylfenoxy)-3-chlor-2,5-dimethylfenyl-/3-(2,6-difluorbenzoyl)močoviny

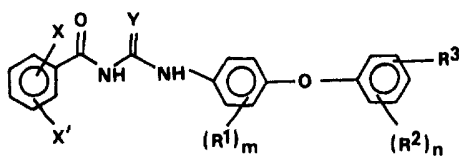
3-chlor-2,5-dimethyl-4-(2,4-dimethylfenoxy)fenylisokyanát z (3,84 g, 12,73 mmol) se přidá k suspenzi 2,6-difluorbenzamidů (2,00 g, 12,73 mmol) v toluenu (25 ml) za teploty místnosti. Směs se potom zahřívá za refluxu po dobu 17 hodin. Během této doby se amid rozpustí. Reakční nádoba se potom ochladí a rozpouštědlo odpaří za sníženého tlaku. Takto se získá surová močovina, jako bílý prášek ve výtěžku 89 %.

P ř í k l a d 3 až 216

Podobným způsobem jako se použil v předcházejících příkladech a za použití jednoho ze schémat syntézy popsanych výše se vyrobí jiné deriváty močoviny. Identita substituentů v obecném vzorci a analytické údaje jsou uvedeny v následující tabulce I.

T a b u l k a I

1-(alkylfenoxyaryl)-3-benzoylmočoviny obecného vzorce



Příklad	Vzorec	XX'	Y	R ₁	R ₂	R ₃
1	C ₂₂ H ₂₆ Cl ₂ F ₂ N ₂ O ₃	2,6-F ₂	O	3,5-Cl	2-CH ₃	4-CH ₃
2	C ₂₂ H ₁₇ Cl ₃ N ₂ O ₃	2-Cl	O	3,5-Cl	2-CH ₃	4-CH ₃
3	C ₂₂ H ₁₆ Cl ₄ N ₂ O ₃	2,6-Cl ₂	O	3,5-Cl	2-CH ₃	4-CH ₃
4	C ₂₄ H ₂₂ F ₂ N ₂ O ₃	2,6-F ₂	O	3,5-(CH ₃) ₂	2-CH ₃	4-CH ₃
5	C ₂₄ H ₂₂ ClFN ₂ O ₃	2,6-ClF	O	3,5-(CH ₃) ₂	2-CH ₃	4-CH ₃
6	C ₂₄ H ₂₃ ClN ₂ O ₃	2-Cl	O	3,5-(CH ₃) ₂	2-CH ₃	4-CH ₃
7	C ₂₄ H ₂₂ Cl ₂ N ₂ O ₃	2,6-Cl ₂	O	3,5-(CH ₃) ₂	2-CH ₃	4-CH ₂
8	C ₂₄ H ₂₂ Cl ₂ N ₂ O ₃	2-Cl	O	3,5,6-CH ₃ ClCH ₃	2-CH ₃	4-CH ₃
9	C ₂₄ H ₂₁ Cl ₃ N ₂ O ₃	2,6-Cl ₂	O	3,5,6-CH ₃ ClCH ₃	2-CH ₃	4-CH ₃
10	C ₂₄ H ₂₁ Cl ₂ FN ₂ O ₃	2,6-ClF	O	3,5,6-CH ₃ ClCH ₃	2-CH ₃	4-CH ₃
11	C ₂₄ H ₂₁ ClF ₂ N ₂ O ₃	2,6-F ₂	O	3,5,6-CH ₃ ClCH ₃	2-CH ₃	4-CH ₃
12	C ₂₂ H ₁₅ Cl ₅ N ₂ O ₃	2-Cl	O	3,5-Cl ₂	2,3,4-CH ₃ ClCl	5-CH ₃
13	C ₂₂ H ₁₄ Cl ₆ N ₂ O ₃	2,6-Cl ₂	O	3,5-Cl ₂	2,3,4-CH ₃ ClCl	5-CH ₃
14	C ₂₂ H ₁₄ Cl ₅ FN ₂ O ₃	2,6-ClF	O	3,5-Cl ₂	2,3,4-CH ₃ ClCl	5-CH ₃
15	C ₂₂ H ₁₄ Cl ₄ F ₂ N ₂ O ₃	2,6-F ₂	O	3,5-Cl ₂	2,3,4-CH ₃ ClCl	5-CH ₃
16	C ₂₄ H ₂₂ Cl ₂ N ₂ O ₂ S	2-Cl	S	3,5,6-CH ₃ ClCH ₃	2-CH ₃	4-CH ₃
17	C ₂₄ H ₂₂ Cl ₂ N ₂ O ₃	2-Cl	O	3,5,6-CH ₃ ClCH ₃	3-CH ₃	5-CH ₃
18	C ₂₄ H ₂₂ Cl ₂ N ₂ O ₂ S	2-Cl	S	3,6-(CH ₃) ₂ -5-Cl	3-CH ₃	5-CH ₃
19	C ₂₄ H ₂₁ Cl ₃ N ₂ O ₃	2,6-Cl ₂	O	3,6-(CH ₃) ₂ -5-Cl	3-CH ₃	5-CH ₃
20	C ₂₄ H ₂₁ ClF ₂ N ₂ O ₃	2,6-F ₂	O	3,6-(CH ₃) ₂ -5-Cl	3-CH ₃	5-CH ₃
21	C ₂₆ H ₂₆ Cl ₂ N ₂ O ₃	2-Cl	O	3,6-(CH ₃) ₂ -5-Cl	H	4-terc.- -butyl
22	C ₂₆ H ₂₆ Cl ₂ N ₂ O ₂ S	2-Cl	S	3,6-(CH ₃) ₂ -5-Cl	H	4-terc.- -butyl

pokračování tabulky I

Příklad	Vzorec	XX'	Y	R ₁	R ₂	R ₃
23	C ₂₆ H ₂₅ Cl ₃ N ₂ O ₃	2,6-Cl ₂	O	3,6-(CH ₃) ₂ -5-Cl	H	4-terc.- -butyl
24	C ₂₆ H ₂₅ ClF ₂ N ₂ O ₃	2,6-F ₂	O	3,6-(CH ₃) ₂ -5-Cl	H	4-terc.- -butyl
25	C ₂₃ H ₂₀ Cl ₂ N ₂ O ₃	2-Cl	O	3,6-(CH ₃) ₂ -5-Cl	H	4-CH ₃
26	C ₂₃ H ₂₀ Cl ₂ N ₂ O ₂ S	2-Cl	S	3,6-(CH ₃) ₂ -5-Cl	H	4-CH ₃
27	C ₂₃ H ₁₉ Cl ₃ N ₂ O ₃	2,6-Cl ₂	O	3,6-(CH ₃) ₂ -5-Cl	H	4-CH ₃
28	C ₂₃ H ₁₉ ClF ₂ N ₂ O ₃	2,6-F ₂	O	3,6-(CH ₃) ₂ -5-Cl	H	4-CH ₃
29	C ₂₃ H ₂₀ Cl ₂ N ₂ O ₃	2-Cl	O	3,6-(CH ₃) ₂ -5-Cl	H	2-CH ₃
30	C ₂₃ H ₁₉ ClF ₂ N ₂ O ₃	2,6-F ₂	O	3,6-(CH ₃) ₂ -5-Cl	H	2-CH ₃
31	C ₂₃ H ₂₀ Cl ₂ N ₂ O ₂ S	2-Cl	S	3,6-(CH ₃) ₂ -5-Cl	H	2-CH ₃
32	C ₂₃ H ₁₉ Cl ₃ N ₂ P ₃	2,6-Cl ₂	O	3,6-(CH ₃) ₂ -5-Cl	H	2-CH ₃
33	C ₂₃ H ₁₉ BrCl ₂ N ₂ O ₃	2-Cl	O	3,6-(CH ₃) ₂ -5-Cl	4-Br	2-CH ₃
34	C ₂₃ H ₁₉ BrClFN ₂ O ₂ S	2-F	S	3,6-(CH ₃) ₂ -5-Cl	4-Br	2-CH ₃
35	C ₂₃ H ₁₈ BrCl ₃ N ₂ O ₂	2,6-Cl ₂	O	3,6-(CH ₃) ₂ -5-Cl	4-Br	2-CH ₃
36	C ₂₃ H ₁₉ BrCl ₂ N ₂ O ₂ S	2-Cl	S	3,6-(CH ₃) ₂ -5-Cl	4-Br	2-CH ₃
37	C ₂₃ H ₁₈ BrClF ₂ N ₂ O ₃	2,6-F ₂	O	3,6-(CH ₃) ₂ -5-Cl	4-Br	2-CH ₃
38	C ₂₃ H ₁₉ BrCl ₂ N ₂ O ₃	2-Cl	O	3,6-(CH ₃) ₂ -5-Cl	2-Br	4-CH ₃
39	C ₂₃ H ₁₈ BrCl ₃ N ₂ O ₃	2,6-Cl ₂	O	3,6-(CH ₃) ₂ -5-Cl	2-Br	4-CH ₃
40	C ₂₃ H ₁₈ BrClF ₂ N ₂ O ₃	2,6-F ₂	O	3,6-(CH ₃) ₂ -5-Cl	2-Br	4-CH ₃
41	C ₂₃ H ₁₉ BrCl ₂ N ₂ O ₂ S	2-Cl	S	3,6-(CH ₃) ₂ -5-Cl	2-Br	4-CH ₃
42	C ₂₃ H ₁₉ Cl ₂ N ₂ O ₃	2-Cl	O	3,6-(CH ₃) ₂ -5-Cl	4-Cl	2-CH ₃
43	C ₂₃ H ₁₈ Cl ₄ N ₂ O ₃	2,6-Cl ₂	O	3,6-(CH ₃) ₂ -5-Cl	4-Cl	2-CH ₃
44	C ₂₃ H ₁₈ Cl ₂ F ₂ N ₂ O ₃	2,6-F ₂	O	3,6-(CH ₃) ₂ -5-Cl	4-Cl	2-CH ₃
45	C ₂₃ H ₁₉ Cl ₃ N ₂ O ₂ S	2-Cl	S	3,6-(CH ₃) ₂ -5-Cl	4-Cl	2-CH ₃
46	C ₂₃ H ₁₉ Cl ₃ N ₂ O ₃	2-Cl	O	3,6-(CH ₃) ₂ -5-Cl	2-Cl	4-CH ₃
47	C ₂₃ H ₁₈ Cl ₄ N ₂ O ₃	2,6-Cl ₂	O	3,6-(CH ₃) ₂ -5-Cl	2-Cl	4-CH ₃

pokračování tabulky I

Příklad	Vzorec	XX'	Y	R ₁	R ₂	R ₃
48	C ₂₃ H ₁₈ Cl ₂ F ₂ N ₂ O ₃	2,6-F ₂	O	3,6-(CH ₃) ₂ -5-Cl	2-Cl	4-CH ₃
49	C ₂₃ H ₁₉ Cl ₃ N ₂ O ₂ S	2-Cl	S	3,6-(CH ₃) ₂ -5-Cl	2-Cl	4-CH ₃
50	C ₃₁ H ₃₆ Cl ₂ N ₂ O ₃	2-Cl	O	3,6-(CH ₃) ₂ -5-Cl	H	4-n-O ₉ H ₁₉
51	C ₃₁ H ₃₅ Cl ₃ N ₂ O ₃	2,6-Cl ₂	O	3,6-(CH ₃) ₂ -5-Cl	H	4-n-C ₉ H ₁₉
52	C ₃₁ H ₃₆ Cl ₂ N ₂ O ₂ S	2-Cl	S	3,6-(CH ₃) ₂ -5-Cl	H	4-n-C ₉ H ₁₉
53	C ₂₅ H ₂₅ ClN ₂ O ₂ S	2-CH ₃	S	3,6-(CH ₃) ₂ -5-Cl	2-CH ₃	4-CH ₃
54	C ₂₄ H ₂₂ ClFN ₂ O ₂ S	2-F	S	3,6-(CH ₃) ₂ -5-Cl	2-CH ₃	4-CH ₃
55	C ₃₁ H ₃₅ ClF ₂ N ₂ O ₃	2,6-F ₂	O	3,6-(CH ₃) ₂ -5-Cl	H	4-n-C ₉ H ₁₉
56	C ₂₇ H ₂₈ Cl ₂ N ₂ O ₃	2-Cl	O	3,6-(CH ₃) ₂ -5-Cl	2-CH ₃	4-terc.- -butyl
57	C ₂₇ H ₂₇ ClF ₂ N ₂ O ₃	2,6-F ₂	O	3,6-(CH ₃) ₂ -5-Cl	2-CH ₃	4-terc.- -butyl
58	C ₂₇ H ₂₈ Cl ₂ N ₂ O ₂ S	2-Cl	S	3,6-(CH ₃) ₂ -5-Cl	2-CH ₃	4-terc.- -butyl
59	C ₂₇ H ₂₈ ClFN ₂ O ₂ S	2-F	S	3,6-(CH ₃) ₂ -5-Cl	2-CH ₃	4-terc.- -butyl
60	C ₂₅ H ₂₄ Cl ₂ N ₂ O ₃	2-Cl	O	3,6-(CH ₃) ₂ -5-Cl	2,3-(CH ₃) ₂	5-CH ₃
61	C ₂₅ H ₂₃ Cl ₃ N ₂ O ₃	2,6-Cl ₂	O	3,6-(CH ₃) ₂ -5-Cl	2,3-(CH ₃) ₂	5-CH ₃
62	C ₂₅ H ₂₃ Cl ₂ FN ₂ O ₃	2,6-ClF	O	3,6-(CH ₃) ₂ -5-Cl	2,3-(CH ₃) ₂	5-CH ₃
63	C ₂₅ H ₂₃ ClF ₂ N ₂ O ₃	2,6-F ₂	O	3,6-(CH ₃) ₂ -5-Cl	2,3-(CH ₃) ₂	5-CH ₃
64	C ₂₅ H ₂₄ Cl ₂ N ₂ O ₂ S	2-Cl	S	3,6-(CH ₃) ₂ -5-Cl	2,3-(CH ₃) ₂	5-CH ₃
65	C ₂₅ H ₂₄ ClFN ₂ O ₂ S	2-F	S	3,6-(CH ₃) ₂ -5-Cl	2,3-(CH ₃) ₂	5-CH ₃
66	C ₂₆ H ₂₇ ClN ₂ O ₂ S	2-CH ₃	S	3,6-(CH ₃) ₂ -5-Cl	2,3-(CH ₃) ₂	5-CH ₃
67	C ₂₅ H ₂₄ Cl ₂ N ₂ O ₃	2-Cl	O	3,6-(CH ₃) ₂ -5-Cl	3,4-(CH ₃) ₂	5-CH ₃
68	C ₂₅ H ₂₃ Cl ₃ N ₂ O ₃	2,6-Cl ₂	O	3,6-(CH ₃) ₂ -5-Cl	3,4-(CH ₃) ₂	5-CH ₃
69	C ₂₅ H ₂₃ Cl ₂ FN ₂ O ₃	2,6-ClF	O	3,6-(CH ₃) ₂ -5-Cl	3,4-(CH ₃) ₂	5-CH ₃
70	C ₂₅ H ₂₃ ClF ₂ N ₂ O ₃	2,6-F ₂	O	3,6-(CH ₃) ₂ -5-Cl	3,4-(CH ₃) ₂	5-CH ₃
71	C ₂₅ H ₂₄ Cl ₂ N ₂ O ₂ S	2-Cl	S	3,6-(CH ₃) ₂ -5-Cl	3,4-(CH ₃) ₂	5-CH ₃

pokračování tabulky I

Příklad	Vzorec	XX'	Y	R ₁	R ₂	R ₃
72	C ₂₅ H ₂₄ ClFN ₂ O ₂ S	2-F	S	3,6-(CH ₃) ₂ -5-Cl	3,4-(CH ₃) ₂	5-CH ₃
73	C ₂₆ H ₂₇ ClN ₂ O ₂ S	2-CH ₃	S	3,6-(CH ₃) ₂ -5-Cl	3,4-(CH ₃) ₂	5-CH ₃
74	C ₂₅ H ₂₄ Cl ₂ N ₂ O ₃	2-6	O	3,6-(CH ₃) ₂ -5-Cl	H	2-i-C ₃ H ₇
75	C ₂₅ H ₂₃ ClF ₂ N ₂ O ₃	2,6-F ₂	O	3,6-(CH ₃) ₂ -5-Cl	H	2-i-C ₃ H ₇
76	C ₂₅ H ₂₅ ClN ₂ O ₃	2-CH ₃	O	3,6-(CH ₃) ₂ -5-Cl	2-CH ₃	4-CH ₃
77	C ₂₄ H ₁₂ ClFN ₂ O ₃	2-F	O	3,6-(CH ₃) ₂ -5-Cl	2-CH ₃	4-CH ₃
78	C ₂₅ H ₂₆ N ₂ O ₃	2-CH ₃	O	3,5-(CH ₃) ₂	2-CH ₃	4-CH ₃
79	C ₂₅ H ₂₆ N ₂ O ₂ S	2-CH ₃	O	3,5-(CH ₃) ₂	2-CH ₃	4-CH ₃
80	C ₂₄ H ₂₃ FN ₂ O ₃	2-F	O	3,5-(CH ₃) ₂	2-CH ₃	4-CH ₃
81	C ₂₄ H ₂₂ Cl ₂ N ₂ O ₄	2-Cl	O	3,6-(CH ₃) ₂ -5-Cl	2-OCH ₃	4-CH ₃
82	C ₂₄ H ₂₁ Cl ₃ N ₂ O ₄	2,6-Cl ₂	O	3,6-(CH ₃) ₂ -5-Cl	2-OCH ₃	4-CH ₃
83	C ₂₄ H ₂₁ Cl ₂ FN ₂ O ₄	2,6-ClF	O	3,6-(CH ₃) ₂	2-OCH ₃	4-CH ₃
84	C ₂₄ H ₂₁ ClF ₂ H ₂ O ₄	2,6-F ₂	O	3,6-(CH ₃) ₂	2-OCH ₃	4-CH ₃
85	C ₂₅ H ₂₅ ClN ₂ O ₄	2-CH ₃	O	3,6-(CH ₃) ₂	2-OCH ₃	4-CH ₃
86	C ₂₄ C ₂₂ ClFN ₂ O ₃ S	2-F	S	3,6-(CH ₃) ₂	2-OCH ₃	4-CH ₃
87	C ₂₄ H ₂₃ ClN ₂ O ₂ S	2-Cl	S	3,5-(CH ₃) ₂	2-CH ₃	4-CH ₃
88	C ₂₄ H ₂₂ Cl ₂ N ₂ O ₃ S	2-Cl	O	3,6-(CH ₃) ₂ -5-Cl	4-SCH ₃	3-CH ₃
89	C ₂₄ H ₂₁ ClF ₂ N ₂ O ₃ S	2,6-F ₂	O	3,6-(CH ₃) ₂ -5-Cl	4-SCH ₃	3-CH ₃
90	C ₂₆ H ₂₇ Cl ₂ N ₃ O ₃	2-Cl	O	3,6-(CH ₃) ₂ -5-Cl	3-CH ₃ ,4-N(CH ₃) ₂	5-CH ₃
91	C ₂₆ H ₂₆ ClF ₂ N ₃ O ₃	2,6-F ₂	O	3,6-(CH ₃) ₂ -5-Cl	3-CH ₃ ,4-N(CH ₃) ₂	5-CH ₃
92	C ₂₆ H ₂₆ Cl ₃ N ₃ O ₃	2,6-Cl ₂	O	3,6-(CH ₃) ₂ -5-Cl	N(CH ₃) ₂	5-CH ₃
93	C ₂₆ H ₂₆ Cl ₂ FN ₃ O ₃	2,6-ClF	O	3,6-(CH ₃) ₂ -5-Cl	N(CH ₃) ₂	5-CH ₃
94	C ₂₆ H ₂₇ ClFN ₃ O ₃	2-F	O	3,6-(CH ₃) ₂ -5-Cl	N(CH ₃) ₂	5-CH ₃
95	C ₂₇ H ₃₀ ClN ₃ O ₃	2-CH ₃	O	3,6-(CH ₃) ₂ -5-Cl	N(CH ₃) ₂	5-CH ₃
96	C ₂₃ H ₂₀ Cl ₂ N ₂ O ₃	2-Cl	O	2-CH ₃ -5-Cl	2-CH ₃	4-CH ₃
97	C ₂₃ H ₁₉ ClF ₂ N ₂ O ₃	2,6-F ₂	O	2-CH ₃ -5-Cl	2-CH ₃	4-CH ₃

pokračování tabulky I

Příklad	Vzorec	XX'	Y	R ₁	R ₂	R ₃
98	C ₂₂ H ₁₇ BrCl ₂ N ₂ O ₃	2-Cl	O	2-CH ₃ -5-Cl	4-Br	2-CH ₃
99	C ₂₂ H ₁₆ BrClF ₂ N ₂ O ₃	2,6-F ₂	O	C-CH ₃ -5-Cl	4-Br	2-CH ₃
100	C ₂₃ H ₂₀ BrClN ₂ O ₃	2-Cl	O	3-CH ₃	2-CH ₃ -4-Br	6-CH ₃
101	C ₂₃ H ₁₉ BrF ₂ N ₂ O ₃	2,6-F ₂	O	3-CH ₃	2-CH ₃ -4-Br	6-CH ₃
102	C ₂₃ H ₂₀ Cl ₂ N ₂ O ₃	2-CH ₃	O	2-CH ₃ -5-Cl	4-Cl	2-CH ₃
103	C ₂₄ H ₂₃ ClN ₂ O ₃	2-CH ₃	O	2-CH ₃ -5-Cl	4-CH ₃	2-CH ₃
104	C ₂₃ H ₂₀ ClFN ₂ O ₃	2-F	O	2-CH ₃ -5-Cl	4-CH ₃	2-CH ₃
105	C ₂₂ H ₁₇ Cl ₃ FN ₂ O ₃	2-F	O	2-CH ₃ -5-Cl	4-Cl	2-CH ₃
106	C ₂₃ H ₂₀ BrFN ₂ O ₃	2-F	O	3-CH ₃	4-Br-6-CH ₃	2-CH ₃
107	C ₂₄ H ₂₃ BrN ₂ O ₃	2-CH ₃	O	3-CH ₃	4-Br-6-CH ₃	2-CH ₃
108	C ₂₂ H ₁₇ BrClFN ₂ O ₃	2-F	O	2-CH ₃ -5-Cl	4-Br-	2-CH ₃
109	C ₂₃ H ₂₀ BrClN ₂ O ₃	2-CH ₃	O	2-CH ₃ -5-Cl	4-Br	2-CH ₃
110	C ₂₃ H ₂₀ BrClN ₂ O ₃	2-Cl	O	3,5-(CH ₃) ₂	4-Br	2-CH ₃
111	C ₂₃ H ₂₀ BrFN ₂ O ₃	2-F	O	3,5-(CH ₃) ₂	4-Br	2-CH ₃
112	C ₂₃ H ₁₉ BrClFN ₂ O ₃	2-Cl-6-F	O	3,5-(CH ₃) ₂	4-Br	2-CH ₃
113	C ₂₃ H ₁₉ BrF ₂ N ₂ O ₃	2,6-F ₂	O	3,5-(CH ₃) ₂	4-Br	2-CH ₃
114	C ₂₃ H ₁₉ BrClFN ₂ O ₃	2,6-ClF	O	2,5-(CH ₃) ₂	4-Br	2-CH ₃
115	C ₂₃ H ₁₈ BrF ₂ N ₂ O ₃	2,6-F ₂	O	2,5-(CH ₃) ₂	4-br	2-CH ₃
116	C ₂₃ H ₂₀ BrClN ₂ O ₃	2-Cl	O	2,5-(CH ₃) ₂	4-Br	2-CH ₃
117	C ₂₃ H ₂₀ Cl ₂ N ₂ O ₃	2-Cl	O	2,5-(CH ₃) ₂	2-Cl	4-CH ₃
118	C ₂₃ H ₂₀ ClFN ₂ O ₃	2-F	O	2,5-(CH ₃) ₂	2-Cl	4-CH ₃
119	C ₂₄ H ₂₃ ClN ₂ O ₃	2-CH ₃	O	2,5-(CH ₃) ₂	2-Cl	4-CH ₃
120	C ₂₄ H ₂₃ ClN ₂ O ₃	H ₂	O	3,6-(CH ₃) ₂ -5-Cl	2-CH ₃	4-CH ₃
121	C ₂₃ H ₂₀ BrClN ₂ O ₃	H ₂	O	3,6-(CH ₃) ₂ -5-Cl	4-Br	2-CH ₃
122	C ₂₄ H ₂₂ ClFN ₂ O ₃	2-F	O	3,6-(CH ₃) ₂ -5-Cl	2-CH ₃	5-CH ₃
123	C ₂₄ H ₂₂ Cl ₂ N ₂ O ₃	2-Cl	O	3,6-(CH ₃) ₂ -5-Cl	2-CH ₃	5-CH ₃

pokračování tabulky 1

Příklad	Vzorec	XX'	Y	R ₁	R ₂	R ₃
124	C ₂₄ H ₂₁ ClF ₂ N ₂ O ₃	2,6-F ₂	O	3,6-(CH ₃) ₂ -5-Cl	2-CH ₃	5-CH ₃
125	C ₂₅ H ₂₅ ClN ₂ O ₃	2-CH ₃	O	3,6-(CH ₃) ₂ -5-Cl	2-CH ₃	5-CH ₃
126	C ₂₆ H ₂₆ Cl ₂ N ₂ O ₃	2-Cl	O	2-CH ₃ -5-Cl	2-CH ₃	4-terc.- -butyl
127	C ₂₆ H ₂₆ ClFN ₂ O ₃	2-F	O	2-CH ₃ -5-Cl	2-CH ₃	4-terc.- -butyl
128	C ₂₆ H ₂₅ ClF ₂ N ₂ O ₃	2,6-F ₂	O	2-CH ₃ -5-Cl	2-CH ₃	4-terc.- -butyl
129	C ₂₇ H ₂₉ ClN ₂ O ₃	2-CH ₃	O	2-CH ₃ -5-Cl	2-CH ₃	4-terc.- -butyl
130	C ₂₆ H ₂₆ Cl ₂ N ₂ O ₃	2-Cl	O	3,6-(CH ₃) ₂ -5-Cl	H	2-sek.- -butyl
131	C ₂₆ H ₂₆ ClFN ₂ O ₃	2-F	O	3,6-(CH ₃) ₂ -5-Cl	H	2-sek.- -butyl
132	C ₂₆ H ₂₅ Cl ₂ FN ₂ O ₃	2-Cl,6-F	O	3,6-(CH ₃) ₂ -5-Cl	H	2-sek.- -butyl
133	C ₂₆ H ₂₅ ClF ₂ N ₂ O ₃	2,6-F ₂	O	3,6-(CH ₃) ₂ -5-Cl	H	2-sek.- -butyl
134	C ₂₄ H ₂₂ Cl ₂ N ₂ O ₃	2-Cl	O	3,6-(CH ₃) ₂ -5-Cl	2-CH ₃	3-CH ₃
135	C ₂₄ H ₂₁ Cl ₂ FN ₂ O ₃	2-Cl,6-F	O	3,6-(CH ₃) ₂ -5-Cl	2-CH ₃	3-CH ₃
136	C ₂₄ H ₂₁ ClF ₂ N ₂ O ₃	2,6-F ₂	O	3,6-(CH ₃) ₂ -5-Cl	2-CH ₃	3-CH ₃
137	C ₂₄ H ₂₁ Cl ₃ N ₂ O ₃	2-Cl	O	3,6-(CH ₃) ₂ -5-Cl	2-CH ₃ -4-Cl	3-CH ₃
138	C ₂₄ H ₂₀ Cl ₃ FN ₂ O ₃	2-Cl,6-F	O	3,6-(CH ₃) ₂ -5-Cl	2-CH ₃ -4-Cl	3-CH ₃
139	C ₂₄ H ₂₀ Cl ₂ F ₂ N ₂ O ₃	2,6-F ₂	O	3,6-(CH ₃) ₂ -5-Cl	2-CH ₃ -4-Cl	3-CH ₃
140	C ₂₃ H ₂₀ Cl ₂ N ₂ O ₃	2-Cl	O	3-CH ₃	2-CH ₃ -4-Cl	3-CH ₃
141	C ₂₃ H ₁₉ Cl ₂ FN ₂ O ₃	2-Cl,6-F	O	3-CH ₃	2-CH ₃ -4-Cl	3-CH ₃
142	C ₂₃ H ₁₉ ClF ₂ N ₂ O ₃	2,6-F ₂	O	3-CH ₃	2-CH ₃ -4-Cl	3-CH ₃
143	C ₂₄ H ₂₁ Cl ₃ N ₂ O ₃	2-Cl	O	3,6-(CH ₃) ₂ -5-Cl	2-CH ₃ -4-Cl	5-CH ₃
144	C ₂₄ H ₂₀ Cl ₂ FN ₂ O ₃	2-Cl,6-F	O	3,6-(CH ₃) ₂ -5-Cl	2-CH ₃ -4-Cl	5-CH ₃
145	C ₂₄ H ₂₀ Cl ₂ F ₂ N ₂ O ₃	2,6-F ₂	O	3,6-(CH ₃) ₂ -5-Cl	2-CH ₃ -4-Cl	5-CH ₃

pokračování tabulky I

Příklad	Vzorec	XX'	Y	R ₁	R ₂	R ₃
146	C ₂₄ H ₂₁ Cl ₃ N ₂ O ₃	2-Cl	O	3,6-(CH ₃) ₂ -5-Cl	3-CH ₃ -4-Cl	5-CH ₃
147	C ₂₄ H ₂₀ Cl ₂ F ₂ N ₂ O ₃	2,6-F ₂	O	3,6-(CH ₃) ₂ -5-Cl	3-CH ₃ -4-Cl	5-CH ₃
148	C ₂₄ H ₂₁ BrCl ₂ N ₂ O ₃	2-Cl	O	3,6-(CH ₃) ₂ -5-Cl	2-CH ₃ -4-Br	3-CH ₃
149	C ₂₄ H ₂₀ BrCl ₂ F ₂ N ₂ O ₃	2,6-F ₂	O	3,6-(CH ₃) ₂ -5-Cl	2-CH ₃ -4-Br	3-CH ₃
150	C ₂₃ H ₂₀ BrCl ₂ N ₂ O ₃	2-Cl	O	3-CH ₃	2-CH ₃ -4-Br	3-CH ₃
151	C ₂₃ H ₁₉ BrF ₂ N ₂ O ₃	2,6-F ₂	O	3-CH ₃	2-CH ₃ -4-Br	3-CH ₃
152	C ₂₃ H ₂₀ Cl ₂ N ₂ O ₃	2-Cl	O	3-CH ₃	2-CH ₃ -4-Cl	5-CH ₃
153	C ₂₃ H ₁₉ Cl ₂ F ₂ N ₂ O ₃	2,6-F ₂	O	3-CH ₃	2-CH ₃ -4-Cl	5-CH ₃
154	C ₂₄ H ₂₁ BrF ₂ N ₂ O ₃	2,6-F ₂	O	3,5-(CH ₃) ₂	2-CH ₃ -4-Br	3-CH ₃
155	C ₂₆ H ₂₅ BrCl ₂ N ₂ O ₃	2-Cl	O	3,6-(CH ₃) ₂ -5-Cl	4-Br	2-sek.- -butyl
156	C ₂₆ H ₂₄ BrClF ₂ N ₂ O ₃	2,6-F ₂	O	3,6-(CH ₃) ₂ -5-Cl	4-Br	2-sek.- -butyl
157	C ₂₅ H ₂₂ ClF ₃ N ₂ O ₃	2-CF ₃	O	3,6-(CH ₃) ₂ -5-Cl	2-CH ₃	4-CH ₃
158	C ₂₅ H ₂₄ Cl ₂ N ₂ O ₃	2-Cl	O	3,6-(CH ₃) ₂ -5-Cl	2,4-(CH ₃) ₂	5-CH ₃
159	C ₂₅ H ₂₃ ClF ₂ N ₂ O ₃	2,6-F ₂	O	3,6-(CH ₃) ₂ -5-Cl	2,4-(CH ₃) ₂	5-CH ₃
160	C ₂₄ H ₂₁ Cl ₃ N ₂ O ₃	2-Cl	O	3,6-(CH ₃) ₂ -5-Cl	2-Cl,4-CH ₃	5-CH ₃
161	C ₂₄ H ₂₀ Cl ₂ F ₂ N ₂ O ₃	2,6-F ₂	O	3,6-(CH ₃) ₂ -5-Cl	2-Cl,4-CH ₃	5-CH ₃
162	C ₂₃ H ₁₈ Cl ₄ N ₂ O ₄	2-Cl	O	3,6-(CH ₃) ₂ -5-Cl	2,4-Cl ₂	5-CH ₃
163	C ₂₃ H ₁₇ Cl ₃ F ₂ N ₂ O ₃	2,6-F ₂	O	3,6-(CH ₃) ₂ -5-Cl	2,4-Cl ₂	5-CH ₃
164	C ₂₂ H ₁₆ BrCl ₃ N ₂ O ₃	2-Cl	O	3,5-Cl ₂	2-CH ₃ ,4-Br	5-CH ₃
165	C ₂₂ H ₁₅ BrCl ₂ F ₂ N ₂ O ₃	2,6-F ₂	O	3,5-Cl ₂	2-CH ₃ ,4-Br	5-CH ₃
166	C ₂₄ H ₂₁ BrCl ₂ N ₂ O ₃	2-Cl	O	3,6-(CH ₃) ₂ -5-Cl	2-CH ₃ ,4-Br	5-CH ₃
167	C ₂₄ H ₂₀ BrClF ₂ N ₂ O ₃	2,6-F ₂	O	3,6-(CH ₃) ₂ -5-Cl	2-CH ₃ ,4-Br	5-CH ₃
168	C ₂₃ H ₂₀ Cl ₂ N ₂ O ₂ S	2-Cl	S	2-CH ₃ -5-Cl	2-CH ₃	4-CH ₃
169	C ₂₂ H ₁₇ Cl ₃ N ₂ O ₂ S	2-Cl	S	2-CH ₃ -5-Cl	4-Cl	2-CH ₃
170	C ₂₃ H ₂₀ Cl ₂ N ₂ O ₂ S	2-CH ₃	S	2-CH ₃ -5-Cl	4-Cl	2-CH ₃

pokračování tabulky I

Příklad	Vzorec	XX ⁻	Y	R ₁	R ₂	R ₃
171	C ₂₄ H ₂₃ BrN ₂ O ₂ S	2-CH ₃	S	3-CH ₃	2-CH ₃ , 4-Br	6-CH ₃
172	C ₂₂ H ₁₇ BrCl ₂ N ₂ O ₂ S	2-Cl	S	2-CH ₃ , 5-Cl	4-Br	2-CH ₃
173	C ₂₃ H ₂₀ BrClN ₂ O ₂ S	2-Cl	S	3-CH ₃	2-CH ₃ -4-Br	6-CH ₃
174	C ₂₄ H ₂₃ ClN ₂ O ₂ S	H ₂	S	3,6-(CH ₃) ₂ -5-Cl	2-CH ₃	4-CH ₃
175	C ₂₃ H ₂₀ Cl ₂ N ₂ O ₂ S	H ₂	S	3,6-(CH ₃) ₂ -5-Cl	4-Cl	2-CH ₃
176	C ₂₄ H ₂₁ Cl ₃ N ₂ O ₂ S	2-Cl	S	3,6-(CH ₃) ₂ -5-Cl	3-CH ₃ -4-Cl	5-CH ₃
177	C ₂₄ H ₂₁ BrCl ₂ N ₂ O ₂ S	2-Cl	S	3,6-(CH ₃) ₂ -5-Cl	2-CH ₃ -4-Br	3-CH ₃
178	C ₂₃ H ₂₀ BrClN ₂ O ₂ S	2-Cl	S	3-CH ₃	2-CH ₃ -4-Br	3-CH ₃
179	C ₂₀ H ₂₀ Cl ₂ N ₂ O ₂ S	2-Cl	S	3-CH ₃	2-CH ₃ -4-Cl	5-CH ₃
180	C ₂₆ H ₂₅ BrCl ₂ N ₂ O ₂ S	2-Cl	S	3,6-(CH ₃) ₂ -5-Cl	4-Br	2-sek.- -butyl
181	C ₂₄ H ₂₁ ClF ₂ N ₂ O ₂ S	2,6-F ₂	S	3,6-(CH ₃) ₂ -5-Cl	2-CH ₃	4-CH ₃
182	C ₂₄ H ₁₉ Cl ₂ N ₃ O ₃	2-Cl	O	3,6-(CH ₃) ₂ -5-Cl	4-CN	2-CH ₃
183	C ₂₄ H ₁₈ ClF ₂ N ₂ O ₃	2,6-F ₂	O	3,6-(CH ₃) ₂ -5-Cl	4-CN	2-CH ₃
184	C ₂₅ H ₂₁ Cl ₂ N ₃ P ₃	2-Cl	O	3,6-(CH ₃) ₂ -5-Cl	4-CN, 5-CH ₃	2-CH ₃
185	C ₂₅ H ₂₀ ClF ₂ N ₃ O ₃	2,6-F ₂	O	3,6-(CH ₃) ₂ -5-Cl	4-CN, 5-CH ₃	2-CH ₃
186	C ₂₆ H ₂₃ ClF ₂ N ₂ O ₅	2,6-F ₂	O	3,6-(CH ₃) ₂ -5-Cl	4-CO ₂ C ₂ H ₅	2-CH ₃
187	C ₂₆ H ₂₄ Cl ₂ N ₂ O ₅	2-Cl	O	3,6-(CH ₃) ₂ -5-Cl	4-CO ₂ C ₂ H ₅	2-CH ₃

T a b u l k a I - pokračování: II. část

Příklad	% vypočteno			% nalezeno		
	C	H	N	C	H	N
1	56,79	3,47	6,02	56,61	3,35	6,08
2	56,97	3,70	6,04	56,84	3,61	6,02
3	53,03	3,24	5,62	52,38	3,15	5,72
4	67,91	5,23	6,60	67,23	5,10	6,62
5	65,35	5,03	6,35	65,22	5,03	6,29
6	68,16	5,47	6,63	68,12	5,58	6,48
7	63,02	4,85	6,13	58,72	4,16	6,33
8	63,03	4,85	6,12	63,33	4,94	6,09
9	58,61	4,30	5,70	58,28	4,21	5,64
10	60,64	4,45	5,89	60,79	4,42	5,82
11	62,82	4,61	6,10	62,94	4,88	6,03

pokračování tabulky I: II. část

Příklad	% vypočteno			% nalezeno		
	C	H	N	C	H	N
12	49,61	2,84	5,26	49,99	2,90	5,21
13	46,60	2,49	4,94	46,74	2,53	4,94
14	47,99	2,56	5,09	47,21	2,80	5,01
15	49,47	2,64	5,24	49,44	2,74	5,17
16	60,89	4,68	5,92	61,13	4,83	6,05
17	63,03	4,85	6,12	62,64	4,73	6,40
18	60,89	4,68	5,92	61,12	4,73	5,94
19	58,61	4,30	5,70	58,41	4,26	5,71
20	62,82	4,61	6,10	63,23	4,67	6,08
21	64,34	5,40	5,77	64,03	5,36	5,98
22	62,27	5,23	5,59	62,06	5,43	5,79
23	60,07	4,85	5,39	60,25	4,92	5,50
24	64,14	5,17	5,75	64,60	5,32	5,73
25	62,31	4,55	6,32	62,22	4,66	6,23
26	60,13	4,39	6,10	59,84	4,38	5,98
27	57,82	4,01	5,86	58,09	4,02	5,85
28	62,10	4,30	6,30	62,05	4,41	6,19
29	62,31	4,55	6,32	61,83	4,56	6,34
30	62,10	4,30	6,30	62,02	4,50	6,79
31	60,13	4,39	6,10	60,72	4,66	6,08
32	57,82	4,01	5,86	57,95	4,22	5,95
33	52,90	3,67	5,36	53,18	3,68	5,47
34	52,94	3,67	5,37	53,13	3,68	5,37
35	49,62	3,26	5,03	49,60	3,29	4,99
36	51,32	3,56	5,20	51,63	3,53	5,20
37	52,75	3,46	5,35	52,27	3,40	5,43
38	52,90	3,67	5,36	52,43	3,68	5,31
39	49,62	3,26	5,03	49,75	3,23	5,00
40	52,75	3,46	5,35	52,97	3,49	5,31
41	51,32	3,56	5,20	50,70	3,55	5,00
42	57,82	4,01	5,86	57,51	4,00	5,66
43	53,93	3,54	5,49	54,22	3,55	5,55
44	57,64	3,78	5,84	57,50	3,84	5,81
45	55,94	3,88	5,67	55,98	3,94	5,60
46	57,82	4,01	5,86	58,20	4,17	5,72
47	53,93	3,54	5,49	53,91	3,51	5,50
48	57,64	3,78	5,84	57,82	3,84	5,73
49	55,94	3,88	5,67	55,78	3,91	5,55
50	67,02	6,53	5,04	66,06	6,47	5,14
51	63,11	5,98	4,75	60,04	5,58	5,03
52	65,14	6,35	4,90	64,36	6,35	4,86
53	66,28	5,56	6,18	65,12	5,73	5,98
54	63,08	4,85	6,13	62,91	4,83	6,14
55	66,84	6,33	5,03	66,16	6,48	4,78
56	64,93	5,65	5,61	64,84	5,71	5,56
57	64,74	5,43	5,59	64,70	5,73	5,65
58	62,91	5,48	5,43	62,96	5,58	5,38
59	64,98	5,66	5,61	65,24	5,85	5,52
60	63,69	5,13	5,94	63,68	5,30	5,99
61	59,36	4,58	5,54	59,52	4,82	5,47
62	61,35	4,74	5,72	61,49	4,81	5,77

pokračování tabulky I: II. část

Příklad	% vypočteno			% nalezeno		
	C	H	N	C	H	N
63	63,49	4,90	5,92	63,58	5,20	5,92
64	61,59	4,96	5,75	61,78	5,12	5,77
65	63,74	5,14	5,95	63,85	5,22	5,94
66	66,86	5,83	6,00	67,35	5,86	5,91
67	63,69	5,13	5,94	63,68	5,21	5,87
68	59,36	4,58	5,54	59,68	4,80	5,31
69	61,35	4,74	5,72	61,60	4,84	5,79
70	63,49	4,90	5,92	63,35	4,97	5,83
71	61,59	4,96	5,75	61,65	5,05	5,70
72	63,74	5,14	5,95	64,29	5,17	5,91
73	66,86	5,83	6,00	67,60	6,13	6,13
74	63,70	5,13	5,94	63,94	5,26	5,87
75	63,50	4,90	5,92	63,36	5,08	5,80
76	68,72	5,77	6,41	67,84	5,65	6,30
77	65,38	5,03	6,35	65,25	5,13	6,21
78	74,60	6,51	6,96	74,81	6,66	6,88
79	71,74	6,26	6,69	72,14	6,42	6,54
80	70,92	5,70	6,89	71,09	5,70	6,98
81	60,90	4,68	5,92	60,85	4,57	5,84
82	56,77	4,17	5,52	56,53	4,14	5,37
83	58,67	4,31	5,70	59,07	4,47	5,63
84	60,70	4,46	5,90	60,98	4,19	5,72
85	66,29	5,56	6,18	66,57	5,56	6,29
86	60,95	4,69	5,93	60,63	4,58	5,71
87	65,67	5,28	6,38	66,09	5,50	6,27
88	58,90	5,43	5,72	58,63	4,58	5,68
89	58,72	4,31	5,71	58,62	4,29	5,91
90	62,40	5,44	8,40	62,56	5,44	8,52
91	62,22	5,22	8,37	62,81	4,93	8,20
92	58,38	4,90	7,86	58,28	5,02	7,99
93	60,24	5,06	8,10	60,15	5,13	7,77
94	64,52	5,62	8,68	64,57	5,63	8,64
95	67,56	6,30	8,75	67,21	6,38	8,38
96	62,31	4,55	6,32	62,65	4,92	6,27
97	62,10	4,31	6,30	62,45	4,78	6,30
98	51,99	3,37	5,51	52,51	3,49	5,56
99	51,84	3,16	5,50	51,70	3,32	5,37
100	56,58	4,13	5,74	57,19	4,34	5,77
101	56,41	3,91	5,72	56,96	4,14	5,66
102	62,31	4,55	6,32	62,36	4,51	6,38
103	68,16	5,48	6,62	68,37	5,55	6,53
104	64,72	4,72	6,56	65,29	4,77	6,63
105	59,08	3,83	6,26	59,48	3,80	6,24
106	58,56	4,27	5,94	59,37	4,43	5,82
107	61,62	4,96	5,99	62,83	5,22	5,85
108	53,74	3,48	5,70	53,75	3,59	5,43
109	56,63	4,13	5,74	56,84	4,09	5,64
110	56,63	4,13	5,74	56,64	4,16	5,64
111	58,61	4,28	5,94	58,59	4,54	5,79
112	54,62	3,79	5,54	54,66	3,82	5,50
113	56,46	3,91	5,72	56,61	4,30	5,61

pokračování tabulky I: II. část

Příklad	% vypočteno			% nalezeno		
	C	H	N	C	H	N
114	54,62	3,79	5,54	54,96	3,90	5,36
115	56,46	3,91	5,72	56,76	4,07	5,59
116	56,63	4,13	5,74	56,64	4,20	5,64
117	62,31	4,55	6,32	62,21	4,69	6,09
118	64,72	4,55	6,32	64,93	4,82	6,54
119	68,16	5,48	6,62	68,20	5,61	6,62
120	68,16	5,48	6,62	68,01	5,78	6,42
121	56,63	4,13	5,74	57,07	4,56	5,69
122	65,38	5,03	6,35	65,74	5,17	6,25
123	63,03	4,85	6,12	63,14	5,13	6,06
124	62,86	4,62	6,11	62,90	4,67	6,01
125	68,72	5,77	6,41	68,94	5,66	6,27
126	64,34	5,40	5,77	64,93	5,49	5,73
127	66,59	5,59	5,97	66,81	5,72	5,91
128	64,13	5,18	5,75	64,36	5,24	5,72
129	69,74	6,29	6,02	69,85	6,41	5,98
130	64,34	5,40	5,77	63,51	5,28	6,07
131	66,59	5,59	5,97	65,73	6,30	6,36
132	62,04	5,00	5,56	61,06	4,86	5,79
133	64,13	5,18	5,75	64,51	5,35	5,85
134	63,03	4,85	6,12	63,35	5,39	6,36
135	60,64	4,45	5,89	61,29	4,46	5,78
136	62,82	4,61	6,10	63,04	4,89	6,21
137	58,61	4,30	5,70	58,87	4,53	5,70
138	56,54	3,95	5,50	57,41	4,27	5,57
139	58,43	4,09	5,68	58,59	4,27	5,65
140	62,31	4,55	6,32	62,63	4,62	6,38
141	59,88	4,15	6,07	60,54	4,54	6,06
142	62,10	4,30	6,30	62,55	4,62	6,27
143	58,61	4,30	5,70	58,47	4,30	5,63
144	56,54	3,95	5,50	56,88	4,05	5,39
145	58,43	4,09	5,68	58,72	4,18	5,68
146	58,61	4,30	5,70	58,59	4,34	5,53
147	58,43	4,09	5,68	58,38	4,17	5,53
148	53,75	3,95	5,22	53,72	4,03	5,53
149	53,60	3,75	5,21	53,27	3,78	5,07
150	56,63	4,13	5,74	56,52	4,22	5,76
151	56,46	3,91	5,72	56,65	4,09	5,94
152	62,31	4,55	6,32	62,17	4,65	6,30
153	62,10	4,30	6,30	61,95	4,42	6,19
154	teplota tání 194 až 197 °C					
155	55,34	4,46	4,96	55,49	4,42	4,87
156	55,19	4,28	4,95	55,78	4,28	4,81
157	61,17	4,52	5,71	61,45	4,66	5,63
158	63,70	5,13	5,94	63,64	5,24	6,03
159	63,50	4,90	5,92	63,75	5,18	6,63
160	58,61	4,30	5,70	59,19	4,68	5,60
161	58,43	4,09	5,68	58,64	4,36	5,64
162	53,93	3,54	5,47	54,16	3,79	5,41
163	53,77	3,34	5,45	53,57	3,42	5,58
164	48,69	2,97	5,16	49,39	3,01	5,07

pokračování tabulky I: II část

Příklad	% vypočteno			% nalezeno		
	C	H	N	C	H	N
165	48,56	2,78	5,15	49,05	2,86	5,08
166	53,75	3,76	5,22	53,96	4,04	5,20
167	53,60	3,75	5,21	53,69	3,78	5,16
168	60,13	4,39	6,10	60,58	4,55	6,05
169	55,07	3,57	5,84	55,86	3,61	5,64
170	60,13	4,39	6,10	60,14	4,32	6,08
171	59,58	4,79	5,79	60,48	5,04	5,71
172	50,40	3,27	5,34	50,32	3,37	5,22
173	54,78	4,00	5,56	55,82	4,37	5,04
174	65,67	5,28	6,38	66,57	5,41	6,35
175	60,13	4,39	6,10	60,39	4,69	6,13
176	56,76	4,17	5,52	59,96	4,25	5,57
177	52,19	3,83	5,07	52,61	3,92	4,91
178	54,83	4,00	5,56	54,98	4,18	5,57
179	60,13	4,39	6,10	60,62	4,61	6,13
180	53,81	4,34	4,83	54,16	4,36	5,20
181	60,69	4,46	5,90	60,35	4,57	5,98
182	61,55	4,09	8,79	61,68	4,48	8,32
183	61,35	3,86	8,94	63,16	4,42	8,35
184	62,25	4,39	8,71	62,21	4,59	8,50
185	62,06	4,17	8,68	61,72	4,46	8,49
186	teplota tání 176 až 179 °C					
187	teplota tání 188 až 190 °C					

Určité reprezentativní příklady nových sloučenin se zkoušely ke stanovení jejich insekticidního účinku proti určitým druhům hmyzu, včetně housenek a brouků. Nové sloučeniny se také testovaly na fytotoxicitu pro hospodářsky důležité užitkové rostliny, zahrnující bob, soju srstnatou, kukuřici, rajče a bavlnu. U nových sloučenin se dále hodnotila toxicita pro savce.

Suspenze testovaných sloučenin se vyrobila rozpuštěním 1 g sloučeniny v 50 ml acetonu, ve kterém bylo rozpuštěno 0,1 g (10 % hmotnostních sloučeniny) alkylfenoxypolyethoxyethanolové povrchově aktivní látky, jako emulgačního nebo dispergačního prostředku.

Výsledný roztok se zamíchal do 150 ml vody a dostalo se zhruba 200 ml suspenze obsahující sloučeninu v jemně rozmělněné formě. Takto připravená zásobní suspenze obsahovala 0,5 % hmotnostních sloučeniny.

Testovací koncentrace v dílech na milion dílů, uvedeno hmotnostně, použité při testech popsaných dále se dostaly vhodným zředěním zásobní suspenze vodou. Testovací postupy byly takovéto:

Test na listech postříkaných vnadidlem pro můry *Spodoptera eridania* (Cram.)

Testovaný hmyz tvoří larvy můry *Spodoptera eridania* (Cram.) pěstované na rostlinách fazolu Tendergreen za teploty $26,5 \pm 3$ °C a relativní vlhkosti 50 ± 5 %.

Testované sloučeniny se upraví zředěním zásobní suspenze vodou za vzniku suspenze obsahující 500 dílů testované sloučeniny na milion dílů konečného prostředku. Rostliny fazolu Tendergreen o standardní výšce a stáří pěstované v květináčích se umístí na otočný stůl

a postříkají 100 až 110 ml prostředku obsahujícího testované sloučeniny za použití De Vilbisova rozstřikovače za tlaku vzduchu 27,6 kPa. Tato aplikace, která trvá 25 sekund, stačí k navlhčení rostlin do skápnutí. Ke kontrolnímu stanovení se 100 až 110 ml roztoku vody, acetonu a emulgátoru neobsahujícího testovanou sloučeninu také nastříká na zamořené rostliny.

Když párové listy oschnou, oddělí se a každý se umístí na 9centimetrové Petriho misce vyložené mokřým filtračním papírem. Pět náhodně vybraných larev se vnese do každé misky a ty se uzavřou.

Uzavřené misky se označí a udržují za teploty 26,5 až 29,5 °C po dobu tří dnů. Třebaže by larvy mohly snadno zkonzumovat celý list během 24 hodin, nepřidává se jim více potravy. Larvy, které nebyly schopné se pohybovat po délce těla ani po dloubnutí, považují se za mrtvé. Pro různé úrovně koncentrace se zaznamenává procento úmrtnosti. Test na postříkaných listech pro *Epilachna varivestis* (Muls.).

Testovaný hmyz tvoří larvy brouka *Epilachna varivestis* (Muls.) ve stadiu čtvrtého instaru pěstované na rostlinách bobku Tendergreen za teploty 26,5 ± 3 °C a relativní vlhkosti 50 ± 5 %.

Testované sloučeniny se upraví zředěním zásobní suspenze vodou za vzniku suspenze obsahující 500 dílů testované sloučeniny na milion dílů konečného prostředku. Rostliny fazolu Tendergreen o standardní výšce a stáří pěstované v kořenáčích se umístí na otočný stůl a postříkají 100 až 110 ml prostředku obsahujícího testované sloučeniny za použití De Vilbisova rozstřikovače za tlaku vzduchu 27,6 kPa.

Tato aplikace, která trvá 25 sekund stačí k navlhčení rostlin do skápnutí. Ke kontrolnímu stanovení se 100 až 110 ml roztoku vody, acetonu a emulgátoru neobsahujícího testovanou sloučeninu také nastříká na zamořené rostliny.

Když párové listy oschnou, oddělí se a každý se umístí na 9centimetrové Petriho misce vyložené mokřým filtračním papírem. Pět náhodně vybraných larev se vnese do každé misky a ty se uzavřou. Uzavřené misky se označí a udržují za teploty 26,5 ± 3 °C po dobu tří dnů.

Třebaže by larvy mohly snadno zkonzumovat celý list během 24 až 48 hodin, nepřidává se jim více potravy. Larvy, které nebyly schopné se pohybovat po délce těla ani po dloubnutí, považují se za mrtvé.

Test na listech postříkaných vnařidlem pro *Heliothis virescens*, F. a *Heliothis zea* (Boddie).

Testovaný hmyz tvoří larvy šedivky *Heliothis virescens*, F. o hmotnosti asi 4,5 mg a šedivky *Heliothis zea* (Boddie) o hmotnosti asi 2,5 mg vždy ve stadiu druhého instaru, získané na trhu a pěstované na umělé dietě a při teplotě 26,5 ± 3 °C a relativní vlhkosti 50 ± 5 %.

Za použití podobného postupu jako je uveden výše, avšak při náhradě mladého fazolu rostlinami bavlníku se ošetřené a oschlé listy bavlníku vnesou do 9centimetrových Petriho misek, které se uspořádají do skupin o 10 miskách. Do každé se vnese 10 náhodile vybraných larev a misky se uzavřou. Uzavřené misky se označí a udržují za teploty 26,5 ± 3 °C pět dní.

Biologické vlastnosti určitých reprezentativních příkladů sloučenin podle tohoto vynálezu jsou uvedeny v tabulce II dále.

T a b u l k a II

Biologické vlastnosti reprezentativních benzoylmočovín

Příklad

Účinek 500 ppm

S. e. (1)

E. v. (2)

	S. e. (1)	E. v. (2)
1	A	A
2	A	A
3	A	A
4	A	A
4	A	A
5	A	A
6	A	A
7	A	A
8	A	A
9	A	A
10	A	A
11	A	A
12	A	A
13	A	A
14	A	A
15	A	A
16	A	A
17	A	A
18	A	A
19	A	A
20	A	A
21	A	A
22	A	A
23	A	A
24	A	A
25	A	A
26	A	A
27	A	A
28	A	A
29	A	A
30	A	A
31	A	A
32	A	A
33	A	A
34	A	A
35	A	A
36	A	A
37	A	A
38	A	A
39	A	A
40	A	A
41	A	A
42	A	A
43	A	A
44	A	A
45	A	A
46	A	A
47	A	A
48	A	A

pokračování tabulky II

Příklad	0činek 500 ppm	
	S. e. (1)	E. v. (2)
49	A	A
50	A	A
51	A	A
52	A	A
53	A	A
54	A	A
55	A	A
56	A	A
57	A	A
58	A	A
59	A	A
60	A	A
61	A	A
62	A	A
63	A	A
64	A	A
65	A	A
66	A	A
67	C	A
68	C	A
69	A	A
70	A	A
71	C	A
72	C	A
73	C	A
74	A	A
75	A	A
76	A	A
77	A	A
78	A	A
79	A	A
80	A	A
81	A	A
82	A	A
83	A	A
84	A	A
85	A	A
86	A	A
87	A	A
88	A	A
89	A	A
90	C	A
91	A	A
92	C	A
93	A	A
94	A	A
95	A	A
96	A	A
97	A	C
98	A	A
99	A	A

pokračování tabulky II

Příklad

účinek 500 ppm

s. e. (1) E. v. (2)

101	B	B
102	A	A
103	A	A
104	A	A
105	A	A
106	A	B
107	A	A
108	A	A
109	A	A
110	A	A
111	A	A
112	A	A
113	A	A
114	A	A
115	A	A
116	A	A
117	A	A
118	A	A
119	A	C
120	A	A
121	A	C
122	A	A
123	A	A
124	A	A
125	A	A
126	A	A
127	A	A
128	A	A
129	A	A
130	A	A
131	A	A
132	A	A
133	A	A
134	A	A
135	A	A
136	A	A
137	A	A
138	A	A
139	A	A
140	A	A
141	A	A
142	A	A
143	A	A
144	A	A
145	A	A
146	A	A
147	A	A
148	A	A
149	A	A
150	A	A
151	A	A

pokračování tabulky II

Příklad	Účinek 500 ppm	
	S. e. (1)	E. v. (2)
152	A	A
153	A	A
154	A	A
155	A	A
156	A	A
157	A	A
158	A	A
159	A	A
160	A	A
161	A	A
162	A	A
163	A	A
164	A	A
165	A	A
166	A	A
167	A	A
168	A	A
169	A	A
170	A	A
172	A	A
174	A	A
175	A	A
176	C	A
177	A	A
178	A	A
179	A	A
180	A	C
181	A	A
182	A	A
183	A	A

Vysvětlivky

- 1) *Spodoptera eridania* (Cram.)
- 2) *Epilachna varivestis* (Muls.)
- 3) Hodnocení: A = úplné potlačení
B = částečné potlačení
C = potlačení se neprojevovalo

P ř í k l a d y 212 až 217

Za účelem předvedení vyššího biologického účinku proti *Spodoptera eridania* (Cram.) se representativní benzoylmočoviny porovnávají se známými produkty. Výsledky jsou uvedeny v tabulce III dále:

T a b u l k a III

Porovnání representativních benzoylmočovín s již dříve známými úzce příbuznými sloučeninami proti *Spodoptera eridania* (Cram.)

Sloučenina	Použitá dávka (ppm)	Procento potlačení po 5 dnech
1-(4-chlorfenyl)-3-(2,6-difluor- benzoyl)močovina ¹⁾	10 5	100 40
1-/4-(4-methylfenylthio)-fenyl/- -3-(2,6-dichlorbenzoyl)močovina ²⁾	500 125 31	40 30 10
1-/4-(2,4-dimethylfenoxy)- -3-chlorfenyl/-3-(2-chlor- benzoyl)močovina ³⁾	125 31 8	100 30 20
1-/4-(2,4-dimethylfenoxy)- -3,6-dimethyl-5-chlorfenyl/- -3-(2-chlorbenzoyl)močovina (příklad 8)	2 1	100 100
1-/4-(2,4-dimethylfenoxy)- -2,5-dimethyl-3-chlorfenyl/- -3-(2-chlorbenzoyl)thiomočo- vina (příklad 16)	2 1	100 90
1-/4-(2,4-dimethylfenoxy)-3,5- -dimethylfenyl/-3-(2,6-difluor- benzoyl)močovina (příklad 4)	8 2	100 100

Vysvětlivky:

- 1) Dimilin, známá sloučenina
- 2) sloučenina již dříve známá z německého zveřejňovacího spisu č. 2 901 334
- 3) sloučenina již dříve známá z německého zveřejňovacího spisu DE č. 3 104 407
(EP 57-888)

P ř í k l a d y 218 až 220

Za účelem předvedení vyššího biologického účinku proti šedivkám se reprezentativní benzoylmočoviny porovnávají se známými produkty. Výsledky jsou uvedeny v tabulkách IV a v dále.

T a b u l k a IV

Porovnání reprezentativních benzoylmočovín s již dříve známými úzce příbuznými sloučeninami proti *Heliothis zea* (Boddie)

Sloučenina	LD ₅₀ (ppm) <i>Heliothis zea</i> (Boddie)
1-(4-chlorfenyl)-3-(2,6-difluor- benzoyl)močovina ¹⁾	500
1-/4-(4-methylfenylthio)-fenyl/-3- -(2,6-dichlorbenzoyl)močovina ²⁾	100

pokračování tabulky IV

Sloučenina	LD ₅₀ (ppm) Heliothis zea (Boddie)
------------	--

1-/4-(2,4-dimethylfenoxy)-3- -chlorfenyl/-3-(2,6-difluorbenzoyl)- močovina ³⁾	100
1-/4-(2,4,5-trimethylfenoxy)-3,6- -dimethyl-5-chlorfenyl/-3-(3,6- difluorbenzoyl)močovina (příklad 159)	0,4
1-/4-(2,5-dimethyl-4-chlorfenoxy)- -3,6-dimethyl-5-chlorfenyl/-3-(2,6- difluorbenzoyl)močovina (příklad 145)	0,7

Vysvětlivky:

- 1) Dimilin, známá sloučenina
- 2) sloučenina již dříve známá z německého zveřejňovacího spisu č. 2 901 334
- 3) sloučenina již dříve známá z německého zveřejňovacího spisu DE č. 3 104 407 (EP 57-888)

T a b u l k a V

Porovnání representativních benzoylmočovín s již dříve známými úzce příbuznými sloučeninami proti *Heliothis virescens*, F.

Sloučenina	LD ₅₀ (ppm) <i>Heliothis virescens</i> , F.
------------	---

1-(4-chlorfenyl)-3-(2,6-difluorbenzoyl)močovina ¹⁾	31
1-/4-(4-methylfenylthio)fenyl/-3- -(2,6-dichlorbenzoyl)močovina ²⁾	100
1-/4-(2,4-dimethylfenoxy)-3-chlorfenyl/-3-(2,6-difluorbenzoyl)močovina ³⁾	100
1-/4-(2,5-dimethyl-4-chlorfenoxy)- -3,6-dimethyl-5-chlorfenyl/-3-(2,6- difluorbenzoyl)močovina (příklad 145)	0,63
1-/4-(2-methyl-4-terc.-butylfenoxy)- -3,6-dimethyl-5-chlorfenyl/-3-(2,6- difluorbenzoyl)močovina (příklad 157)	2,4

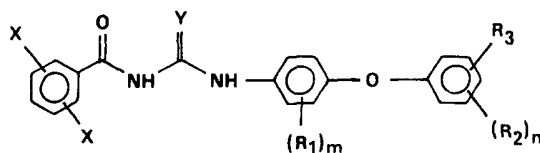
Vysvětlivky:

- 1) Dimilin, známá sloučenina
- 2) sloučenina již dříve známá z německého zveřejňovacího spisu č. 2 901 334
- 3) sloučenina již dříve známá z německého zveřejňovacího spisu DE č. 3 104 407 (EP 57-888)

I když vynález byl ilustrován předcházejícími příklady, nelze je chápat jako omezení na látky zde použité. Vynález zahrnuje všeobecně oblast, jak je uvedeno dále. Mohou se učinit různé modifikace a provedení, aniž by se tím odchýlilo od smyslu a rozsahu vynálezu.

PŘEDMĚT VYNÁLEZU

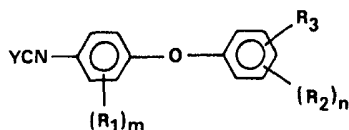
Způsob výroby 1-(alkylfenoxymethyl)-3-benzoylmočoviny obecného vzorce



kde

- X a X⁻ navzájem nezávisle značí vodík, halogen, alkyl, halogenalkyl, polyhalogenalkyl, alkoxy skupinu nebo polyhalogenalkoxy skupinu, kde alkylová část každé skupiny obsahuje 1 až 4 atomy uhlíku,
- Y představuje kyslík nebo síru,
- m a n znamenají 0 až 4,
- R₁ znamená vodík, halogen, alkyl, halogenalkyl, polyhalogenalkyl nebo alkoxy skupinu, kde alkylová část každé skupiny obsahuje 1 až 4 atomy uhlíku,
- R₂ znamená vodík, halogen, alkyl, polyhalogenalkyl, polyhalogenalkoxy skupinu, kde alkylová část každé skupiny obsahuje 1 až 4 atomy uhlíku, alkylsulfonfyl, alkoxy skupinu, alkylthio skupinu, dialkylaminoskupinu, kde alkylová část každé skupiny obsahuje 1 až 8 atomů uhlíku, skupinu CN, NO₂, CO₂R₄, CONHR₄, ve které R₄ značí alkyl s 1 až 8 atomy uhlíku,
- R₃ znamená alkyl s 1 až 12 atomy uhlíku,

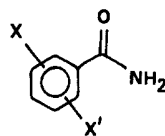
s podmínkou, že m nemůže být 0 nebo 1, když n je menší než 2, vyznačující se tím, že se nechá reagovat alkylfenoxymethylisokyanát nebo alkylfenoxymethylisothiokyanát obecného vzorce



kde

R₁, R₂, R₃, m a n mají výše uvedený význam,

s benzamidem obecného vzorce



kde

X a X' mají výše uvedený význam,

a potom se připravená sloučenina izoluje.