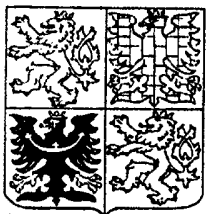


ČESKÁ
REPUBLIKA

(19)



ÚŘAD
PRŮMYSLOVÉHO
VLASTNICTVÍ

ZVEŘEJNĚNÁ PŘIHLÁŠKA VYNÁLEZU

(12)

(22) 25.08.93
(32) 10.09.92, 17.03.93
(31) 92/4230267, 93/4308451
(33) DE, DE
(40) 18.05.94

(21) 1748-93

(13) A3

5(51)

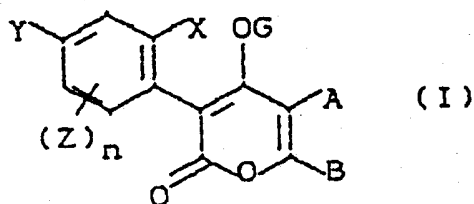
C 07 D 309/38
C 07 D 311/74
C 07 D 311/94
C 07 D 407/04
C 07 D 407/12
C 07 D 405/04
C 07 D 409/04
C 07 D 493/04
C 07 D 495/04
A 61 K 31/35
A 01 N 43/16

(71) BAYER AKTIENGESELLSCHAFT, Leverkusen, DE;

(72) Fischer Reiner dr., Monheim, DE;
Krebs Andreas dr., Odenthal, DE;
Lieb Folker dr., Leverkusen, DE;
Ruther Michael dr., Monheim, DE;
Stetter Jörg dr., Wuppertal, DE;
Erdelen Christoph dr., Leichlingen, DE;
Wachendorff-Neumann Ulrike dr., Monheim, DE;
Lürssen Klaus dr., Bergisch Gladbach, DE;
Santel Hans-Joachim dr., Leverkusen, DE;
Schmidt Robert R. dr., Bergisch Gladbach, DE;

(54) Deriváty 3-aryl-pyronu

(57) Řešení se týká 3-aryl-pyronu obecného vzorce I, které mají velmi dobrou účinnost jako prostředky pro potírání škůdců, především jako arthropodocidy, nematocidy a herbicidy, jakož i jako ektoparasitocidy a endoparasitocidy. Dále se řešení týká způsobů výroby sloučenin.



Deriváty 3-aryl-pyronu

Oblast techniky

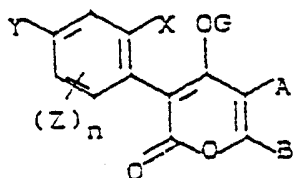
Vynález se týká nových derivátů 3-aryl-pyronu, způsobu jejich výroby a jejich použití jako prostředků pro potírání škůdců.

Dosavadní stav techniky

Určité deriváty fenyl-pyronu, nesubstituované ve fenylovém kruhu, jsou již známy (viz například A.M. Chirazi, T. Kappe a E. Ziegler, Arch. Pharm. 309, 558 /1976/ a K.-H. Boltze a K. Heidenbluth, Chem. Ber. 91, 2849 a Bull. Soc. Chim. France 1962, 365-369), přičemž pro tyto sloučeniny není uváděna možná použitelnost jako prostředků pro potírání škůdců.

Podstata vynálezu

Předmětem předloženého vynálezu jsou nové substituované deriváty 3-aryl-pyronu obecného vzorce I



ve kterém

- A značí vodíkový atom, atom halogenu, popřípadě substituované zbytky ze skupiny zahrnující alkylovou skupinu, cykloalkylovou skupinu, alkenylovou skupinu, alkinylovou skupinu, arylalkylovou skupinu, arylovou skupinu, hetarylalkylovou skupinu a hetarylovou skupinu, nebo značí skupinu $-\text{COR}^1$, $-\text{CO}_2\text{R}^1$, $-\text{CN}$, $-\text{CONR}^1\text{R}^2$, $-\text{SO}_2\text{R}^1$ nebo $-\text{P}(\text{O})(\text{OR}^1)(\text{OR}^2)$,

příčemž

R^1 a R^2 nezávisle na sobě značí vodíkový atom nebo popřípadě substituované zbytky ze skupiny zahrnující alkylovou skupinu, alkenylovou skupinu, arylalkylovou skupinu, arylovou skupinu, hetarylalkylovou skupinu a hetarylovou skupinu, nebo

R^1 a R^2 společně značí popřípadě substituované alkylenové skupiny, které mohou být přerušeny jedním nebo několika heteroatomy ;

- B značí vodíkový atom nebo popřípadě substituované zbytky ze skupiny zahrnující alkylovou skupinu, cykloalkylovou skupinu, alkenylovou skupinu, alkinylovou skupinu, arylalkylovou skupinu, arylovou skupinu, hetarylalkylovou skupinu a hetarylovou skupinu, nebo

A a B společně tvoří popřípadě substituované alkylenové nebo alkenylové skupiny, které mohou být přerušené jedním nebo několika heteroatomy nebo heteroskupinami, popřípadě tyto mohou obsahovat ;

- X značí atom halogenu, alkylovou skupinu nebo alkoxylovou skupinu ;

- Y značí vodíkový atom, atom halogenu, alkylovou skupinu, halogenalkylovou skupinu nebo alkoxyskupinu ;
- Z značí vodíkový atom, atom halogenu, alkylovou skupinu nebo alkoxyskupinu ;
- n značí celé číslo 1 , 2 nebo 3 ; a
- G značí ekvivalent kovového iontu, amoniový iont nebo skupiny $-\text{COR}^3$, $-\text{C}(=\text{L})-\text{MR}^4$, $-\text{SO}_2-\text{R}^5$, $-\text{P}(=\text{L})\text{R}^6\text{R}^7$ a $-\text{CONR}^8\text{R}^9$,

příčemž

- R^3 značí popřípadě substituované zbytky ze skupiny zahrnující alkylovou skupinu, alkenylovou skupinu, alkoxyalkylovou skupinu, polyalkoxyalkylovou skupinu, alkylthioalkylovou skupinu, cykloalkylovou skupinu, popřípadě přerušenou jedním nebo několika heteroatomy, arylalkylovou skupinu, arylovou skupinu, hetarylalkylovou skupinu, hetarylovou skupinu, aryloxyalkylovou skupinu a hetaryloxyalkylovou skupinu ;
- R^4 značí popřípadě substituované zbytky ze skupiny zahrnující alkylovou skupinu, alkenylovou skupinu, alkoxyalkylovou skupinu, polyalkoxyalkylovou skupinu, arylovou skupinu a arylalkylovou skupinu ;
- R^5 , R^6 a R^7 značí nezávisle na sobě popřípadě substituované zbytky ze skupiny zahrnující alkylovou skupinu, alkoxyskupinu, alkylthioskupinu, alkylaminoskupinu, dialkylaminoskupinu, alkenylthioskupinu, alkynylthioskupinu, cykloalkylthioskupinu, arylovou skupinu, aryloxyskupinu a arylthioskupinu ;
- R^8 a R^9 značí nezávisle na sobě vodíkový atom nebo

popřípadě substituované zbytky ze skupiny zahrnující alkylovou skupinu, alkenylovou skupinu, cykloalkylovou skupinu, alkoxyalkylovou skupinu, nebo společně tvoří popřípadě substituovanou alkylenovou skupinu, která může být přerušena jedním nebo několika heteroatomy nebo heteroskupinami ;

- L značí kyslíkový atom nebo atom síry ; a
M značí kyslíkový atom nebo atom síry.

příčemž když B značí fenylovou skupinu a X methoxyskupinu, potom neznačí jeden ze substituentů A, G, Y a Z vodíkový atom.

Sloučeniny obecného vzorce I se mohou vyskytovat v závislosti na substituentech jako geometrické a/nebo optické isomery nebo směsi isomerů různého složení. Jak čisté isomery, tak také směsi isomerů, jejich výroba a použití, jakož i prostředky, obsahující tyto isomerní látky, jsou součástí předloženého vynálezu. V následujícím se pro jednoduchost hovoří vždy pouze o sloučeninách obecného vzorce I, i když se tím míní jak čisté sloučeniny, jak také případné směsi s různými podíly daných isomerních sloučenin.

Dále bylo zjištěno, že nové sloučeniny obecného vzorce I mají velmi dobrou účinnost jako prostředky pro potírání škůdců, především jako arthropodicydy, nematocidy a herbicidy, jakož i jako ektoparasitocidy a endoparasitocidy.

Dále bylo zjištěno, že se nové deriváty 3-aryl-pyronu obecného vzorce I získají tak, že se

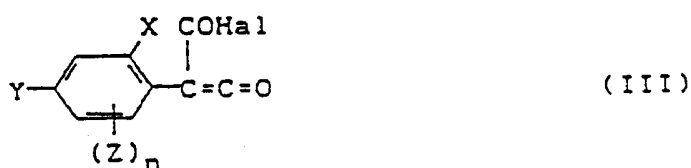
- a) pro výrobu sloučenin, ve kterých G značí vodíkový atom,

nechají reagovat karbonylové sloučeniny obecného vzorce II



ve kterém mají A a B výše uvedený význam,

s halogenidy ketenokyselin obecného vzorce III



ve kterém mají X, Y, Z a n výše uvedený význam a

Hal značí atom halogenu, výhodně chloru nebo bromu,

za přítomnosti zředovacího prostředku a popřípadě za přítomnosti kyselého katalysátoru ; a

b) pro výrobu sloučenin obecného vzorce I, ve kterém značí G skupinu $-COR^3$,

nechají reagovat sloučeniny obecného vzorce I, ve kterém značí G vodíkový atom, které je možno získat podle varianty a),

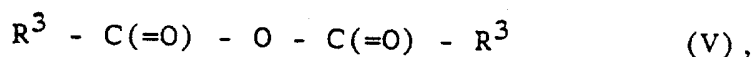
a) s halogenidy kyselin obecného vzorce IV



ve kterém má R^3 výše uvedený význam a

Hal značí atom halogenu, výhodně chloru nebo bromu,
nebo

β) s anhydridy karboxylových kyselin obecného vzorce V



ve kterém má R^3 výše uvedený význam,

popřípadě za přítomnosti zředovacího činidla a popřípadě za
přítomnosti činidla vázajícího kyseliny ; a

c) pro výrobu sloučenin obecného vzorce I , ve kterém
G značí skupinu $-C(L)-MR^4$, přičemž L značí kyslí-
kový atom,

nechají reagovat sloučeniny obecného vzorce I , ve kterém
značí G vodíkový atom, které je možno získat postupem
podle varianty a) ,

se sloučeninami obecného vzorce VI



ve kterém mají R^4 a M výše uvedený význam,

popřípadě za přítomnosti zředovacího činidla a popřípadě za
přítomnosti činidla vázajícího kyseliny ; a

d) pro výrobu sloučenin obecného vzorce I , ve kterém

značí G skupinu $-C(L)-MR^4$, přičemž L značí atom síry,

nechají reagovat sloučeniny obecného vzorce I, ve kterém značí G vodíkový atom, které je možno získat postupem podle varianty a),

a) se sloučeninami obecného vzorce VII



ve kterém mají R^4 a M výše uvedený význam,

popřípadě za přítomnosti zředovacího činidla a popřípadě za přítomnosti činidla vázajícího kyseliny, nebo

β) se sirovodíkem CS_2 a potom s alkylhalogenidy obecného vzorce VIII



ve kterém má R^4 výše uvedený význam a

Hal^1 značí atom halogenu, výhodně chloru, bromu nebo jodu,

popřípadě za přítomnosti zředovacího činidla a popřípadě za přítomnosti činidla vázajícího kyseliny ; a

e) pro výrobu sloučenin obecného vzorce I, ve kterém značí G skupinu $-SO_2R^5$,

nechají reagovat sloučeniny obecného vzorce I , ve kterém značí G vodíkový atom, které je možno získat postupem podle varianty a) ,

s chloridy sulfonových kyselin obecného vzorce IX



ve kterém má R^5 výše uvedený význam,

popřípadě za přítomnosti zředovacího činidla a popřípadě za přítomnosti činidla vázajícího kyseliny ; a

f) pro výrobu sloučenin obecného vzorce I , ve kterém značí G skupinu $-P(L)R^6R^7$,

nechají reagovat sloučeniny obecného vzorce I , ve kterém značí G vodíkový atom, které je možno získat postupem podle varianty a) ,

se sloučeninami obecného vzorce X



ve kterém mají R^6 , R^7 a L výše uvedený význam a

Hal značí atom halogenu, výhodně chloru nebo bromu

popřípadě za přítomnosti zředovacího činidla a popřípadě za přítomnosti činidla vázajícího kyseliny ; a

g) pro výrobu sloučenin obecného vzorce I , ve kterém značí G ekvivalent kovového iontu nebo amoniový

iont,

nechají reagovat sloučeniny obecného vzorce I , ve kterém značí G vodíkový atom, které je možno získat postupem podle varianty a) ,

hydroxidy kovů nebo s aminy, výhodně monoalkylaminy, dialkylaminy nebo trialkylaminy ; a

h) pro výrobu sloučenin obecného vzorce I , ve kterém značí G skupinu $-C(L)R^8R^9$,

nechají reagovat sloučeniny obecného vzorce I , ve kterém značí G vodíkový atom, které je možno získat postupem podle varianty a) ,

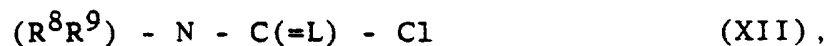
α) se sloučeninami obecného vzorce XI



ve kterém mají R^8 a L výše uvedený význam

popřípadě za přítomnosti zředovacího činidla a popřípadě za přítomnosti činidla vázajícího kyseliny, nebo

β) se sloučeninami obecného vzorce XII



ve kterém mají R^8 , R^9 a L výše uvedený význam,

popřípadě za přítomnosti zředovacího činidla a po-

případě za přítomnosti činidla vázajícího kyseliny.

Alkylová skupina jako taková nebo jako součást jiné skupiny, například alkoxylové skupiny, alkylthioskupiny nebo halogenalkylové skupiny, značí v obecných vzorcích přímou nebo rozvětvenou alkylovou skupinu s výhodně 1 až 20 uhlíkovými atomy, obzvláště výhodně 1 až 18 uhlíkovými atomy, zcela obzvláště výhodně 1 až 16 uhlíkovými atomy. Alkyl obsahuje výhodně 1 až 8 uhlíkových atomů, obzvláště výhodně 1 až 6 uhlíkových atomů a zcela obzvláště výhodně 1 až 4 uhlíkové atomy, přičemž speciálně je možno jmenovat metylovou skupinu, ethylovou skupinu, n-propylovou skupinu, isopropylovou skupinu, n-butylovou skupinu, isobutylovou skupinu, sek.-butylovou skupinu a terc.-butylovou skupinu.

Cykloalkylová skupina jako taková nebo jako součást jiné skupiny, například cykloalkylthioskupiny, obsahuje v obecných vzorcích výhodně 3 až 10 uhlíkových atomů, obzvláště výhodně 3 až 7 uhlíkových atomů a zcela obzvláště výhodně 3 až 6 uhlíkových atomů, přičemž speciálně je možno jmenovat cyklopropylovou skupinu, cyklobutylovou skupinu, cyklopentylovou skupinu a cyklohexylovou skupinu. V případě, že je cykloalkylová skupina přerušena jedním nebo několika heteroatomy nebo heteroskupinami, jedná se o stejné nebo různé, výhodně 1 nebo 2 heteroatomy nebo heteroskupiny. Jako heteroatomy přicházejí v úvahu výhodně kyslík nebo síra a jako heteroskupiny výhodně skupina NH nebo N-alkylová skupina s 1 až 4 uhlíkovými atomy.

Alkenylová skupina a alkinylová skupina jako takové nebo jako součásti jiných skupin, jako je například alkenylthioskupina a alkynylthioskupina, značí v obecných vzorcích přímé nebo rozvětvené alkenylové nebo alkinylové

skupiny s výhodně jednou dvojnou nebo trojnou vazbou a výhodně se 2 až 8 uhlíkovými atomy, obzvláště se 3 až 6 uhlíkovými atomy a zcela obzvláště výhodně se 3 nebo 4 uhlíkovými atomy, přičemž speciálně je možno jmenovat allylovou skupinu a propargylovou skupinu.

Arylová skupina jako taková nebo jako součást jiných skupin, například aryloxyskupiny nebo arylthioskupiny, značí v obecných vzorcích výhodně naftylovou skupinu a fenylovou skupinu, obzvláště výhodně fenylovou skupinu.

Aralkylová skupina značí v obecných vzorcích výhodně naftylalkylovou skupinu nebo fenylalkylovou skupinu, obzvláště výhodně fenylalkylovou skupinu. Alkylová část je zde přímá nebo rozvětvená a obsahuje výhodně 1 až 6 uhlíkových atomů, obzvláště výhodně 1 až 4 uhlíkové atomy a zcela obzvláště výhodně 1 nebo 2 uhlíkové atomy. Speciálně je možno jmenovat benzylovou skupinu a fenylethylovou skupinu.

Hetarylová skupina jako taková nebo jako součást jiných skupin, například hetarylalkylové skupiny nebo hetaryloxyalkylové skupiny, značí v obecných vzorcích heteroaromatické pětičlenné až sedmičlenné kruhy s výhodně 1 až 3, obzvláště s 1 nebo 2 stejnými nebo různými heteroatomy. Jako heteroatomy přicházejí v úvahu výhodně kyslík, síra nebo dusík. Příkladně a výhodně je možno uvést pyrrylovou skupinu, furylovou skupinu, thienylovou skupinu, thiazolylovou skupinu, pyrazolylovou skupinu a pyrimidinylovou skupinu.

V hetarylalkylových skupinách a hetaryloxyalkylových skupinách obecných vzorců má hetaryl výše uvedené významy.

Alkylové sučásti jsou přímé nebo rozvětvené a obsahují výhodně 1 až 6 uhlíkových atomů, obzvláště výhodně 1 až 4 uhlíkové atomy a zcela obzvláště výhodně 1 nebo 2 uhlíkové atomy, přičemž speciálně je možno jmenovat hetarylmethylovou skupinu a hetaryloxymethylovou skupinu.

V alkylthioskupinách, alkoxykupinách, halogenalkylových skupinách, halogenalkoxylových skupinách, alkoxyalkylových skupinách, alkylthioalkylových skupinách, polyalkoxyalkylových skupinách, aryloxyalkylových skupinách, hetaryloxyalkylových skupinách, alkylaminoskupinách a dialkylaminoskupinách mají příslušné alkylové části významy již uvedené výše.

Halogenalkylová skupina a halogenalkoxykupina obsahují výhodně 1 až 8 uhlíkových atomů, obzvláště 1 až 5 uhlíkových atomů a zcela obzvláště 1 až 5 stejných nebo různých atomů halogenu. Jako atomy halogenu přichází v úvahu především fluor, chlor, brom a/nebo jod, obzvláště fluor, chlor a/nebo brom a zcela obzvláště výhodně fluor a/nebo chlor. Jako příklady je možno jmenovat trifluormethylovou skupinu, chlor-difluormethylovou skupinu, brommethylovou skupinu, 2,2,2-trifluorethylovou skupinu a pentafluorethylovou skupinu.

V aryloxyalkylových skupinách a hetaryloxyalkylových skupinách mají v obecných vzorcích arylové, popřípadě hetarylové části, významy již uvedené výše pro odpovídající zbytky.

V alkenylthioskupinách, alkinylthioskupinách a cykloalkylthioskupinách mají v obecných vzorcích alkenylové, alkinylové a cykloalkylové části významy, uvedené již výše

pro tyto zbytky.

V aryloxyskupinách a arylthioskupinách mají v obecných vzorcích arylové části významy, uvedené již výše pro arylové skupiny.

V polyalkoxyskupinách v obecných vzorcích jsou obsaženy výhodně 2 až 4, obzvláště 2 až 3 a zcela obzvláště výhodně 2 alkoxylové zbytky, přičemž alkylové části mají výše uvedený význam.

Když dva substituenty obecných vzorců, jako například A a B, R^1 a R^2 , jakož i R^8 a R^9 tvoří společně alkylenovou skupinu nebo alkenylenovou skupinu, je tato skupina přímá nebo rozvětvená a obsahuje výhodně 2 až 7 uhlíkových atomů, obzvláště výhodně 2 až 6 uhlíkových atomů a zcela obzvláště výhodně 2 až 5 uhlíkových atomů. Alkenylenové skupiny obsahují jednu nebo více dvojných vazeb, výhodně jednu nebo dvě, obzvláště výhodně jednu dvojnou vazbu. Alkylenové skupiny nebo alkenylenové skupiny mohou být přerušeny jedním nebo několika, stejnými nebo různými, heteroatomy nebo heteroskupinami, jako je například kyslík, síra nebo dusík a skupina $-OCO-$, popřípadě mohou takovéto skupiny obsahovat. Jako příklady je možno uvést skupiny $-(CH_2)_4-$, $-(CH_2)_5-$, $-(CH_2)_2-O-(CH_2)_2-$, $-(CH_2)_2-S-(CH_2)_2-$ nebo $-O-CO-CH_2-$.

Halogen značí v obecných vzorcích, pokud není definováno jinak, fluor, chlor, brom a/nebo jod, výhodně fluor, chlor a/nebo brom a zcela obzvláště výhodně fluor a/nebo chlor.

Ekvivalent kovového iontu značí v obecných vzorcích ekvivalent kovového kationtu, výhodně kationtu kovu

alkalické zeminy nebo alkalického kovu, obzvláště iontu vápníku, sodíku, hořčíku nebo draslíku, zcela obzvláště výhodně vápníku, sodíku nebo draslíku.

Amoniový iont značí v obecných vzorcích výhodně monoalkylamoniový iont, dialkylamoniový iont nebo trialkylamoniový iont, přičemž alkylové zbytky obsahují výhodně 1 až 6 uhlíkových atomů, obzvláště 1 až 4 uhlíkové atomy a zcela obzvláště výhodně jeden nebo dva uhlíkové atomy. Alkylové zbytky mohou být jednou nebo několikrát, výhodně jednou substituované, přičemž jako substituenty je možno uvést výhodně například hydroxyskupinu nebo atom halogenu.

n značí v obecných vzorcích výhodně číslo 1 nebo 2, obzvláště výhodně 1, přičemž substituent Z se výhodně nachází v poloze 6 fenylového kruhu.

Popřípadě substituované skupiny, uváděné v obecných vzorcích, mohou nést jeden nebo několik, výhodně jeden až tři, obzvláště jeden nebo dva stejné nebo různé substituenty. Jako tyto substituenty je možno příkladně a výhodně uvést :

alkylovou skupinu s výhodně 1 až 8 uhlíkovými atomy, obzvláště s 1 až 6 uhlíkovými atomy a zcela obzvláště výhodně s 1 až 4 uhlíkovými atomy, jako je například methylová skupina, ethylová skupina, n-propylová skupina, isopropylová skupina, n-butylová skupina, isobutylová skupina a terc.-butylová skupina ; alkoxylovou skupinu s výhodně 1 až 8 uhlíkovými atomy, obzvláště s 1 až 6 uhlíkovými atomy a zcela obzvláště výhodně s 1 až 4 uhlíkovými atomy, jako je například methoxylová skupina,

ethoxylová skupina, n-propoxylová skupina, isopropoxylová skupina, n-butoxylová skupina, isobutoxylová skupina a terc.-butoxylová skupina ; alkylthioskupinu s výhodně 1 až 8 uhlíkovými atomy, obzvláště s 1 až 6 uhlíkovými atomy a zcela obzvláště výhodně s 1 až 4 uhlíkovými atomy, jako je například methylthioskupina, ethylthioskupina, n-propylthioskupina, isopropylthioskupina, n-butylthioskupina, isobutylthioskupina a terc.-butylthioskupina ; halogenalkylovou skupinu a halogenalkoxyskupinu s výhodně 1 až 8 uhlíkovými atomy, obzvláště s 1 až 6 uhlíkovými atomy a zcela obzvláště výhodně s 1 až 4 uhlíkovými atomy a s výhodně 1 až 7 atomy halogenu, obzvláště s 1 až 5 atomy halogenu a zcela obzvláště výhodně s 1 až 3 atomy halogenu, přičemž atomy halogenu jsou stejné nebo různé a jako atomy halogenu je možno výhodně uvést fluor, chlor nebo brom, obzvláště brom, jako je například trifluormethyllová skupina nebo trifluormethoxyskupina ; hydroxyskupinu; atom halogenu, výhodně fluoru, chloru, bromu a jodu, obzvláště fluoru, chloru a bromu ; kyanoskupinu ; nitroskupinu ; fenylovou skupinu, popřípadě substituovanou výše uvedenými zbytky ; alkylkarbonyloxyskupinu s výhodně 1 až 6 uhlíkovými atomy, obzvláště s 1 až 4 uhlíkovými atomy a zcela obzvláště výhodně jedním nebo dvěma uhlíkovými atomy v alkylové skupině, nebo heteroalifatický nebo heteroaromatický zbytek, jako je například pyridylová skupina, furylová skupina nebo tetrahydrofurylová skupina.

Substituent A značí v obecných vzorcích výhodně vodíkový atom ; atom halogenu, obzvláště chloru nebo fluoru; popřípadě halogenem substituované zbytky ze skupiny zahrnující alkylovou skupinu s 1 až 10 uhlíkovými atomy, alkenylovou skupinu se 3 až 10 uhlíkovými atomy, alkylovou skupinu se 3 až 10 uhlíkovými atomy a cykloalky-

lovou skupinu se 3 až 10 uhlíkovými atomy ; popřípadě halogenem, nitroskupinou, alkylovou skupinou s 1 až 8 uhlíkovými atomy, alkoxy skupinou s 1 až 8 uhlíkovými atomy, alkylthioskupinou s 1 až 8 uhlíkovými atomy, halogenalkylovou skupinou s 1 až 8 uhlíkovými atomy, halogenalkoxy skupinou s 1 až 8 uhlíkovými atomy a/nebo kyanoskupinou substituované zbytky ze skupiny zahrnující fenylovou skupinu, naftylovou skupinu, hetarylovou skupinu, fenylalkylovou skupinu s 1 až 6 uhlíkovými atomy v alkylové části a hetarylalkylovou skupinu s 1 až 6 uhlíkovými atomy v alkylové části, nebo značí skupiny $-\text{COR}^1$, $-\text{CO}_2\text{R}^1$, $-\text{CN}$, $-\text{CONR}^1\text{R}^2$, $-\text{SO}_2\text{R}^1$ a $-\text{P}(\text{O})(\text{OR}^1)(\text{OR}^2)$,

příčemž

R^1 a R^2 nezávisle na sobě značí vodíkový atom ; popřípadě halogenem substituované zbytky ze skupiny zahrnující alkylovou skupinu s 1 až 10 uhlíkovými atomy a alkenylovou skupinu se 3 až 10 uhlíkovými atomy ; popřípadě halogenem, nitroskupinou, alkylovou skupinou s 1 až 8 uhlíkovými atomy, alkoxy skupinou s 1 až 8 uhlíkovými atomy, alkylthioskupinou s 1 až 8 uhlíkovými atomy, halogenalkylovou skupinou s 1 až 8 uhlíkovými atomy, halogenalkoxy skupinou s 1 až 8 uhlíkovými atomy a/nebo kyanoskupinou substituované zbytky ze skupiny zahrnující fenylovou skupinu, naftylovou skupinu, hetarylovou skupinu, fenylalkylovou skupinu s 1 až 6 uhlíkovými atomy v alkylové části a hetarylalkylovou skupinu s 1 až 6 uhlíkovými atomy v alkylové části ; nebo R^1 a R^2 společně značí alkylenovou skupinu se 2 až 7 uhlíkovými atomy, která je popřípadě přerušena atomem dusíku, kyslíku nebo síry.

Substituent A značí v obecných vzorcích obzvláště výhodně vodíkový atom ; atom halogenu ; popřípadě halogenem substituované zbytky ze skupiny zahrnující alkylovou skupinu

s 1 až 8 uhlíkovými atomy, alkenylovou skupinu se 3 až 8 uhlíkovými atomy, alkinylovou skupinu se 3 až 8 uhlíkovými atomy a cykloalkylovou skupinu se 3 až 8 uhlíkovými atomy ; popřípadě halogenem, nitroskupinou, alkylovou skupinou s 1 až 4 uhlíkovými atomy, alkoxy skupinou s 1 až 4 uhlíkovými atomy, alkylthioskupinou s 1 až 4 uhlíkovými atomy, halogenalkylovou skupinou s 1 až 4 uhlíkovými atomy, halogenalkoxy skupinou s 1 až 4 uhlíkovými atomy a/nebo kyanoskupinou substituované zbytky ze skupiny zahrnující fenylovou skupinu, naftylovou skupinu, hetarylovou skupinu, fenylalkylovou skupinu s 1 až 4 uhlíkovými atomy v alkylové části a hetarylalkylovou skupinu s 1 až 4 uhlíkovými atomy v alkylové části, nebo značí skupiny $-\text{COR}^1$, $-\text{CO}_2\text{R}^1$, $-\text{CN}$, $-\text{CONR}^1\text{R}^2$, $-\text{SO}_2\text{R}^1$ a $-\text{P}(\text{O})(\text{OR}^1)(\text{OR}^2)$, přičemž

R^1 a R^2 nezávisle na sobě značí vodíkový atom ; popřípadě halogenem substituované zbytky ze skupiny zahrnující alkylovou skupinu s 1 až 8 uhlíkovými atomy a alkenylovou skupinu se 3 až 8 uhlíkovými atomy ; popřípadě halogenem, nitroskupinou, alkylovou skupinou s 1 až 4 uhlíkovými atomy, alkoxy skupinou s 1 až 4 uhlíkovými atomy, alkylthioskupinou s 1 až 4 uhlíkovými atomy, halogenalkylovou skupinou s 1 až 4 uhlíkovými atomy, halogenalkoxy skupinou s 1 až 4 uhlíkovými atomy a/nebo kyanoskupinou substituované zbytky ze skupiny zahrnující fenylovou skupinu, hetarylovou skupinu, fenylalkylovou skupinu s 1 až 4 uhlíkovými atomy v alkylové části a hetarylalkylovou skupinu s 1 až 4 uhlíkovými atomy v alkylové části ; nebo R^1 a R^2 společně značí alkylenovou skupinu se 2 až 6 uhlíkovými atomy, která je popřípadě přerušena atomem dusíku, kyslíku nebo síry.

Substituent A značí v obecných vzorcích zcela

obzvláště výhodně vodíkový atom ; atom halogenu ; popřípadě halogenem substituované zbytky ze skupiny zahrnující alkylovou skupinu s 1 až 6 uhlíkovými atomy, alkenylovou skupinu se 3 až 6 uhlíkovými atomy, alkinylovou skupinu se 3 až 6 uhlíkovými atomy a cykloalkylovou skupinu se 3 až 6 uhlíkovými atomy ; popřípadě halogenem, nitroskupinou, alkylovou skupinou s 1 až 4 uhlíkovými atomy, alkoxyskupinou s 1 až 4 uhlíkovými atomy, alkylthioskupinou s 1 až 4 uhlíkovými atomy, halogenalkylovou skupinou s 1 až 4 uhlíkovými atomy, halogenalkoxyskupinou s 1 až 4 uhlíkovými atomy a/nebo kyanoskupinou substituované zbytky ze skupiny zahrnující fenylovou skupinu, fenylalkylovou skupinu s 1 až 2 uhlíkovými atomy v alkylové části, thienylovou skupinu, furylovou skupinu, thiazolylovou skupinu, pyridylovou skupinu a pyrazolylovou skupinu, nebo značí skupiny $-\text{COR}^1$, $-\text{CO}_2\text{R}^1$, $-\text{CN}$, $-\text{CONR}^1\text{R}^2$, $-\text{SO}_2\text{R}^1$ a $-\text{P}(\text{O})(\text{OR}^1)(\text{OR}^2)$, přičemž

R^1 a R^2 nezávisle na sobě značí vodíkový atom ; popřípadě halogenem substituované zbytky ze skupiny zahrnující alkylovou skupinu s 1 až 6 uhlíkovými atomy a alkenylovou skupinu se 3 až 6 uhlíkovými atomy ; nebo popřípadě halogenem, nitroskupinou, alkylovou skupinou s 1 až 4 uhlíkovými atomy, alkoxyskupinou s 1 až 4 uhlíkovými atomy, alkylthioskupinou s 1 až 4 uhlíkovými atomy, halogenalkylovou skupinou s 1 až 4 uhlíkovými atomy, halogenalkoxyskupinou s 1 až 4 uhlíkovými atomy a/nebo kyanoskupinou substituovanou fenylovou skupinu.

V obzvláště významné formě provedení předloženého vynálezu značí substituent A vodíkový atom, atom chloru nebo fluoru, popřípadě halogenem substituované zbytky ze skupiny zahrnující alkylovou skupinu s 1 až 4 uhlíkovými atomy, fenylovou skupinu a benzylovou skupinu.

nebo

A a B tvoří společně alkennylovou skupinu se 3 až 5 uhlíkovými atomy, popřípadě přerušenu atomy kyslíku nebo síry, výhodně skupiny $-\text{CH}_2-\text{CH}(\text{CH}_3)-(\text{CH}_2)_2-$, $-(\text{CH}_2)_3-$, $-(\text{CH}_2)_4-$, $-(\text{CH}_2)_5-$, $-\text{CH}_2\text{O}(\text{CH}_2)_2-$ nebo $-\text{CH}_2-\text{S}(\text{CH}_2)_2-$.

Substituent B značí v obecných vzorcích výhodně vodíkový atom ; popřípadě atomem halogenu, kyanoskupinou, alkylovou skupinou s 1 až 6 uhlíkovými atomy, alkylthioskupinou s 1 až 6 uhlíkovými atomy, alkylkarbonyloxy-skupinou s 1 až 6 uhlíkovými atomy v alkylové části nebo fenylovou skupinou substituovaný zbytek, vybraný ze skupiny zahrnující alkylovou skupinu s 1 až 10 uhlíkovými atomy, alkenylovou skupinu se 3 až 10 uhlíkovými atomy, alkinylovou skupinu se 3 až 10 uhlíkovými atomy a cykloalkylovou skupinu se 3 až 10 uhlíkovými atomy ; nebo popřípadě halogenem, kyanoskupinou, nitroskupinou, alkylovou skupinou s 1 až 8 uhlíkovými atomy, alkoxyskupinou s 1 až 8 uhlíkovými atomy, alkylthioskupinou s 1 až 8 uhlíkovými atomy, halogenalkylovou skupinou s 1 až 8 uhlíkovými atomy a/nebo halogenalkoxyskupinou s 1 až 8 uhlíkovými atomy substituovaný zbytek ze skupiny zahrnující fenylovou skupinu, naftylovou skupinu, hetarylovou skupinu, fenylalkylovou skupinu s 1 až 6 uhlíkovými atomy v alkylové části a hetarylalkylovou skupinu s 1 až 6 uhlíkovými atomy v alkylové části ;

a

A a B v obecných vzorcích tvoří společně výhodně alkylenovou nebo alkenylenovou skupinu se vždy 2 až 7 uhlíkovými atomy, které jsou popřípadě substituované alkylovou skupinou s 1 až 8 uhlíkovými atomy, halogenalkylovou skupinou s 1 až 6 uhlíkovými atomy, alkoxyskupinou s 1 až

6 uhlíkovými atomy, alkylthioskupinou s 1 až 6 uhlíkovými atomy a/nebo atomem halogenu, přičemž uvedené skupiny mohou být přerušeny dusíkovým atomem, atomem síry, kyslíkovým atomem nebo skupinou $-O-CO-$, popřípadě tyto skupiny mohou obsahovat.

Substituent B značí v obecných vzorcích obzvláště výhodně vodíkový atom ; popřípadě atomem halogenu, kyanoskupinou, alkylovou skupinou s 1 až 4 uhlíkovými atomy, alkylthioskupinou s 1 až 4 uhlíkovými atomy, alkylkarbonyloxy skupinou s 1 až 4 uhlíkovými atomy v alkylové části nebo fenylovou skupinou substituovaný zbytek, vybraný ze skupiny zahrnující alkylovou skupinu s 1 až 8 uhlíkovými atomy, alkenylovou skupinu se 3 až 8 uhlíkovými atomy, alkinylovou skupinu se 3 až 8 uhlíkovými atomy a cykloalkylovou skupinu se 3 až 8 uhlíkovými atomy; nebo popřípadě halogenem, kyanoskupinou, nitroskupinou, alkylovou skupinou s 1 až 6 uhlíkovými atomy, alkoxy skupinou s 1 až 6 uhlíkovými atomy, alkylthioskupinou s 1 až 6 uhlíkovými atomy, halogenalkylovou skupinou s 1 až 6 uhlíkovými atomy a/nebo halogenalkoxy skupinou s 1 až 6 uhlíkovými atomy substituovaný zbytek ze skupiny zahrnující fenylovou skupinu, naftylovou skupinu, hetarylovou skupinu, fenylalkylovou skupinu s 1 až 4 uhlíkovými atomy v alkylové části a hetarylalkylovou skupinu s 1 až 4 uhlíkovými atomy v alkylové části ;

a

A a B v obecných vzorcích tvoří společně výhodně alkylenovou nebo alkenylenovou skupinu se vždy 2 až 6 uhlíkovými atomy, které jsou popřípadě substituované alkylovou skupinou s 1 až 4 uhlíkovými atomy, halogenalkylovou skupinou s 1 až 4 uhlíkovými atomy a s 1 až 5 atomy

halogenu, alkoxy skupinou s 1 až 4 uhlíkovými atomy, a/nebo atomem halogenu, přičemž uvedené skupiny mohou být přerušeny dusíkovým atomem, atomem síry, kyslíkovým atomem nebo skupinou -O-CO-, popřípadě tyto skupiny mohou obsahovat.

Substituent B značí v obecných vzorcích zcela obzvláště výhodně vodíkový atom ; popřípadě kyanoskupinou, methoxy skupinou, ethoxy skupinou, isopropoxy skupinou, methylthio skupinou, ethylthio skupinou, atomem halogenu, alkylkarbonyloxy skupinou s 1 až 4 uhlíkovými atomy v alkylové části nebo fenylovou skupinou substituovaný zbytek, vybraný ze skupiny zahrnující alkylovou skupinu s 1 až 6 uhlíkovými atomy, alkenylovou skupinu se 3 až 6 uhlíkovými atomy, alkinylovou skupinu se 3 až 6 uhlíkovými atomy a cykloalkylovou skupinu se 3 až 6 uhlíkovými atomy; nebo popřípadě halogenem, kyanoskupinou, nitroskupinou, alkylovou skupinou s 1 až 4 uhlíkovými atomy, alkoxy skupinou s 1 až 4 uhlíkovými atomy, alkylthio skupinou s 1 až 4 uhlíkovými atomy, halogenalkylovou skupinou s 1 až 4 uhlíkovými atomy a/nebo halogenalkoxy skupinou s 1 až 4 uhlíkovými atomy substituovaný zbytek ze skupiny zahrnující fenylovou skupinu, fenylalkylovou skupinu s 1 až 2 uhlíkovými atomy v alkylové části, thienylovou skupinu, furylovou skupinu, thiazolylovou skupinu, pyridylovou skupinu a pyrazolylovou skupinu ;

a

A a B v obecných vzorcích tvoří společně výhodně alkylenovou nebo alkenylenovou skupinu se vždy 2 až 5 uhlíkovými atomy, které jsou popřípadě substituované alkylovou skupinou s 1 až 4 uhlíkovými atomy, trifluormethylovou skupinou, trichlormethylovou skupinou, pentafluorethylovou skupinou, trifluordichlorethylovou skupinou,

methoxyskupinou, ethoxyskupinou a/nebo atomem halogenu, přičemž uvedené skupiny mohou být přerušeny atomem síry, nebo kyslíkovým atomem, popřípadě tyto skupiny mohou obsahovat.

Při obzvláště významné formě provedení předloženého vynálezu značí substituent B vodíkový atom, popřípadě atomem halogenu, kyanoskupinou, methoxyskupinou nebo methylthioskupinou substituovanou alkylovou skupinu s 1 až 4 uhlíkovými atomy ; nebo popřípadě halogenem, nitroskupinou, alkylovou skupinou s 1 až 4 uhlíkovými atomy a/nebo alkoxyskupinou s 1 až 4 uhlíkovými atomy, substituovaný zbytek ze skupiny zahrnující fenylovou skupinu, furylovou skupinu, thiazolylovou skupinu a pyridylovou ;
a

A a B tvoří společně skupiny $-(CH_2)_3-$, $-(CH_2)_4-$, $-(CH_2)_5-$, $-CH_2-$, $-CH(CH_3)(CH_2)_2-$, $-CH_2O-(CH_2)_2-$ a $-CH_2S-(CH_2)_2-$, které mohou být popřípadě substituované trifluormethylovou skupinou nebo methoxyskupinou, jako je například skupina $-(CH_2)_3-CHCl-$, $-(CH_2)_3-CH(OCH_3)-$, $-(CH_2)_3-CH(CH_3)-CH_2-$, $-C(CH_3)_2-O-C(CH_3)_2-$ nebo $-CH_2-O-C(CH_3)_2-$.

V obecných vzorcích značí X výhodně atom halogenu, alkylovou skupinu s 1 až 6 uhlíkovými atomy nebo alkoxyskupinu s 1 až 6 uhlíkovými atomy, obzvláště výhodně atom halogenu, alkylovou skupinu s 1 až 4 uhlíkovými atomy nebo alkoxyskupinu s 1 až 4 uhlíkovými atomy a zcela obzvláště výhodně atom fluoru, chloru nebo bromu, methylovou skupinu, ethylovou skupinu, n-propylovou skupinu, iso-propylovou skupinu, methoxyskupinu a ethoxyskupinu a v obzvláště významné formě provedení vynálezu značí methylovou

skupinu.

V obecných vzorcích značí Y výhodně vodíkový atom, atom halogenu, alkylovou skupinu s 1 až 6 uhlíkovými atomy, alkoxy skupinu s 1 až 6 uhlíkovými atomy, nebo halogenalkylovou skupinu s 1 až 6 uhlíkovými atomy, obzvláště výhodně vodíkový atom, atom halogenu, alkylovou skupinu s 1 až 4 uhlíkovými atomy, alkoxy skupinu s 1 až 4 uhlíkovými atomy nebo halogenalkylovou skupinu s 1 až 4 uhlíkovými atomy a zcela obzvláště výhodně vodíkový atom, atom fluoru, chloru nebo bromu, alkylovou skupinu s 1 až 4 uhlíkovými atomy nebo trifluormethylovou skupinu a v obzvláště významné formě provedení vynálezu značí methylovou skupinu.

V obecných vzorcích značí Z výhodně vodíkový atom, atom halogenu, alkylovou skupinu s 1 až 6 uhlíkovými atomy, nebo alkoxy skupinu s 1 až 6 uhlíkovými atomy, obzvláště výhodně vodíkový atom, atom halogenu, alkylovou skupinu s 1 až 4 uhlíkovými atomy nebo alkoxy skupinu s 1 až 4 uhlíkovými atomy a zcela obzvláště výhodně vodíkový atom, atom fluoru, chloru nebo bromu, alkylovou skupinu s 1 až 4 uhlíkovými atomy methoxy skupinu nebo ethoxy skupinu a v obzvláště významné formě provedení vynálezu značí methylovou skupinu, především v poloze 6 fenylového kruhu.

V obecných vzorcích značí n číslo 1, 2 nebo 3, výhodně 1 nebo 2 a zcela obzvláště výhodně číslo 1, přičemž Z se nachází výhodně v poloze 6 fenylového kruhu.

Substituent G v obecných vzorcích značí výhodně vodíkový atom nebo skupiny $-\text{COR}^3$, $-\text{C}(=\text{L})-\text{MR}^4$, $-\text{SO}_2-\text{R}^5$, $-\text{P}(=\text{L})\text{R}^6\text{R}^7$ a $-\text{CONR}^8\text{R}^9$, obzvláště výhodně značí vodíkový

atom, nebo skupiny $-\text{COR}^3$, $-\text{C}(=\text{L})-\text{MR}^4$, nebo $-\text{CONR}^8\text{R}^9$ a zcela obzvláště výhodně značí vodíkový atom nebo skupiny $-\text{COR}^3$ nebo $-\text{C}(=\text{L})-\text{MR}^4$. Ve zcela obzvláště významné formě provedení vynálezu značí G vodíkový atom.

Substituent R^3 značí v obecných vzorcích výhodně popřípadě halogenem substituované zbytky, vybrané ze skupiny zahrnující alkylovou skupinu s 1 až 20 uhlíkovými atomy, alkenylovou skupinu se 2 až 20 uhlíkovými atomy, alkoxyalkylovou skupinu s 1 až 8 uhlíkovými atomy v alkylové i v alkoxylové části, alkylthioalkylovou skupinu s 1 až 8 uhlíkovými atomy v obou alkylových částech, polyalkoxyalkylovou skupinu s 1 až 8 uhlíkovými atomy v alkylové i v alkoxylových částech a popřípadě kyslíkem a/nebo sírou přerušenou cykloalkylovou skupinu se 3 až 8 uhlíkovými atomy ; popřípadě halogenem, nitroskupinou, alkylovou skupinou s 1 až 6 uhlíkovými atomy, alkoxyskupinou s 1 až 6 uhlíkovými atomy, halogenalkylovou skupinou s 1 až 6 uhlíkovými atomy a/nebo halogenalkoxyskupinou s 1 až 6 uhlíkovými atomy substituovanou fenylovou skupinu ; popřípadě halogenem, alkylovou skupinou s 1 až 6 uhlíkovými atomy, alkoxyskupinou s 1 až 6 uhlíkovými atomy, halogenalkylovou skupinou s 1 až 6 uhlíkovými atomy a/nebo halogenalkoxyskupinou s 1 až 6 uhlíkovými atomy substituovanou fenylalkylovou skupinu s 1 až 6 uhlíkovými atomy v alkylové části ; popřípadě halogenem a/nebo alkylovou skupinou s 1 až 6 uhlíkovými atomy substituovanou hetarylovou skupinu ; popřípadě halogenem a/nebo alkylovou skupinou s 1 až 6 uhlíkovými atomy substituovanou fenoxalkylovou skupinu s 1 až 6 uhlíkovými atomy v alkylové části nebo popřípadě halogenem, aminoskupinou a/nebo alkylovou skupinou s 1 až 6 uhlíkovými atomy substituovanou hetaryloxyalkylovou skupinu s 1 až 6 uhlíkovými atomy v alkylové

části.

Substituent R^3 značí v obecných vzorcích obzvláště výhodně popřípadě halogenem substituované zbytky, vybrané ze skupiny zahrnující alkylovou skupinu s 1 až 16 uhlíkovými atomy, alkenylovou skupinu se 2 až 16 uhlíkovými atomy, alkoxyalkylovou skupinu s 1 až 6 uhlíkovými atomy v alkylové i v alkoxylové části, alkylthioalkylovou skupinu s 1 až 6 uhlíkovými atomy v obou alkylových částech, polyalkoxyalkylovou skupinu s 1 až 6 uhlíkovými atomy v alkylové i v alkoxylových částech a popřípadě kyslíkem a/nebo sírou přerušenou cykloalkylovou skupinu se 3 až 7 uhlíkovými atomy ; popřípadě halogenem, nitroskupinou, alkylovou skupinou s 1 až 4 uhlíkovými atomy, alkoxyskupinou s 1 až 4 uhlíkovými atomy, halogenalkylovou skupinou s 1 až 3 uhlíkovými atomy a/nebo halogenalkoxyskupinou s 1 až 3 uhlíkovými atomy substituovanou fenylovou skupinu ; popřípadě halogenem, alkylovou skupinou s 1 až 4 uhlíkovými atomy, alkoxyskupinou s 1 až 4 uhlíkovými atomy, halogenalkylovou skupinou s 1 až 3 uhlíkovými atomy a/nebo halogenalkoxyskupinou s 1 až 3 uhlíkovými atomy substituovanou fenylalkylovou skupinu s 1 až 4 uhlíkovými atomy v alkylové části ; popřípadě halogenem a/nebo alkylovou skupinou s 1 až 6 uhlíkovými atomy substituovanou hetarylovou skupinu ; popřípadě halogenem a/nebo alkylovou skupinou s 1 až 4 uhlíkovými atomy substituovanou fenoxalkylovou skupinu s 1 až 5 uhlíkovými atomy v alkylové části nebo popřípadě halogenem, aminoskupinou a/nebo alkylovou skupinou s 1 až 4 uhlíkovými atomy substituovanou hetaryloxyalkylovou skupinu s 1 až 5 uhlíkovými atomy v alkylové části.

Substituent R^3 značí v obecných vzorcích zcela

obzvláště výhodně popřípadě fluorem a/nebo chlorem substituované zbytky, vybrané ze skupiny zahrnující alkylovou skupinu s 1 až 14 uhlíkovými atomy, alkenylovou skupinu se 2 až 14 uhlíkovými atomy, alkoxyalkylovou skupinu s 1 až 6 uhlíkovými atomy v alkylové části a s 1 až 4 uhlíkovými atomy alkoxylové části, alkylthioalkylovou skupinu s 1 až 6 uhlíkovými atomy v alkylové části a s 1 až 4 uhlíkovými atomy v thioalkylové části, polyalkoxyalkylovou skupinu s 1 až 4 uhlíkovými atomy v alkylové i v alkoxylových částech a popřípadě 1 nebo 2 kyslíky a/nebo sírami přerušenu cykloalkylovou skupinu se 3 až 6 uhlíkovými atomy ; popřípadě fluorem, chlorem, bromem, nitroskupinou, alkylovou skupinou s 1 až 3 uhlíkovými atomy, methoxyskupinou, ethoxyskupinou, trifluormethylovou skupinou, a/nebo trifluormethoxyskupinou substituovanou fenylovou skupinu ; popřípadě fluorem, chlorem, bromem, alkylovou skupinou s 1 až 3 uhlíkovými atomy, methoxyskupinou, ethoxyskupinou, trifluormethylovou skupinou a/nebo trifluormethoxyskupinou substituovanou fenylalkylovou skupinu s 1 až 3 uhlíkovými atomy v alkylové části ; popřípadě fluorem, chlorem, bromem, methylovou skupinou a/nebo ethylovou skupinou substituovaný zbytek ze skupiny zahrnující pyridylovou skupinu, pyrimidylovou skupinu, thiazolylovou skupinu a pyrazolylovou skupinu ; popřípadě fluorem, chlorem, methylovou skupinou a/nebo ethylovou skupinou substituovanou fenoxalkylovou skupinu s 1 až 4 uhlíkovými atomy v alkylové části nebo popřípadě fluorem, chlorem, aminoskupinou, methylovou skupinou a/nebo ethylovou skupinou substituovaný zbytek, vybraný ze skupiny zahrnující pyridyloxyalkylovou skupinu s 1 až 4 uhlíkovými atomy v alkylové části, pyrimidyloxyalkylovou skupinu s 1 až 4 uhlíkovými atomy v alkylové části a thiazolyloxyalkylovou skupinu s 1 až 4 uhlíkovými atomy v alkylové části.

V obzvláště významné formě provedení předloženého vynálezu značí substituent R^3 alkylovou skupinu s 1 až 6 uhlíkovými atomy nebo alkoxylovou skupinu s 1 až 6 uhlíkovými atomy.

Substituent R^4 značí v obecných vzorcích výhodně popřípadě halogenem substituované zbytky, vybrané ze skupiny zahrnující alkylovou skupinu s 1 až 20 uhlíkovými atomy, alkenylovou skupinu se 2 až 20 uhlíkovými atomy, alkoxyalkylovou skupinu s 1 až 8 uhlíkovými atomy v alkylové i v alkoxylové části nebo polyalkoxyalkylovou skupinu s 1 až 8 uhlíkovými atomy v alkylové i v alkoxylových částech nebo popřípadě halogenem, nitroskupinou, alkylovou skupinou s 1 až 6 uhlíkovými atomy, alkoxy skupinou s 1 až 6 uhlíkovými atomy a/nebo halogenalkylovou skupinou s 1 až 6 uhlíkovými atomy substituovanou fenylovou nebo benzylovou skupinu.

Substituent R^4 značí v obecných vzorcích obzvláště výhodně popřípadě halogenem substituované zbytky, vybrané ze skupiny zahrnující alkylovou skupinu s 1 až 16 uhlíkovými atomy, alkenylovou skupinu se 2 až 16 uhlíkovými atomy, alkoxyalkylovou skupinu s 1 až 6 uhlíkovými atomy v alkylové i v alkoxylové části nebo polyalkoxyalkylovou skupinu s 1 až 6 uhlíkovými atomy v alkylové i v alkoxylových částech nebo popřípadě halogenem, nitroskupinou, alkylovou skupinou s 1 až 4 uhlíkovými atomy, alkoxy skupinou s 1 až 3 uhlíkovými atomy a/nebo halogenalkylovou skupinou s 1 až 3 uhlíkovými atomy substituovanou fenylovou nebo benzylovou skupinu.

Substituent R^4 značí v obecných vzorcích zcela obzvláště výhodně popřípadě fluorem a/nebo chlorem substi-

tuované zbytky, vybrané ze skupiny zahrnující alkylovou skupinu s 1 až 14 uhlíkovými atomy, alkenylovou skupinu se 2 až 14 uhlíkovými atomy, alkoxyalkylovou skupinu s 1 až 6 uhlíkovými atomy v alkylové části a s 1 až 4 uhlíkovými atomy alkoxylové části nebo polyalkoxyalkylovou skupinu s 1 až 6 uhlíkovými atomy v alkylové části a s 1 až 4 uhlíkovými atomy alkoxylových částech nebo popřípadě fluorem, chlorem, nitroskupinou, alkylovou skupinou s 1 až 3 uhlíkovými atomy, methoxyskupinou, ethoxyskupinou a/nebo trifluormethylovou skupinou substituovanou fenylovou nebo benzylovou skupinu.

V obzvláště významné formě provedení předloženého vynálezu značí substituent R^4 alkylovou skupinu s 1 až 6 uhlíkovými atomy, která může být také substituovaná halogenem.

Substituenty R^5 , R^6 a R^7 značí v obecných vzorcích nezávisle na sobě výhodně popřípadě halogenem substituované zbytky, vybrané ze skupiny zahrnující alkylovou skupinu s 1 až 8 uhlíkovými atomy, alkoxykupinu s 1 až 8 uhlíkovými atomy, alkylthioskupinu s 1 až 8 uhlíkovými atomy, alkylaminoskupinu s 1 až 8 uhlíkovými atomy, dialkylaminoskupinu se vždy 1 až 8 uhlíkovými atomy v alkylech, alkenylthioskupinu se 2 až 5 uhlíkovými atomy, alkinylthioskupinu se 2 až 5 uhlíkovými atomy, cykloalkylthioskupinu se 3 až 7 uhlíkovými atomy, nebo popřípadě halogenem, nitroskupinou, kyanoskupinou, alkoxykupinou s 1 až 4 uhlíkovými atomy, alkylthioskupinou s 1 až 4 uhlíkovými atomy, halogenalkoxykupinou s 1 až 4 uhlíkovými atomy, halogenalkylthioskupinou s 1 až 4 uhlíkovými atomy, alkylovou skupinou s 1 až 4 uhlíkovými atomy a/nebo halogenalkylovou skupinou s 1 až 4 uhlíkovými atomy substituované zbytky, vybrané ze

skupiny zahrnující fenylovou skupinu, fenyloxyskupinu a fenylthioskupinu.

Substituenty R^5 , R^6 a R^7 značí v obecných vzorcích nezávisle na sobě obzvláště výhodně popřípadě halogenem substituované zbytky, vybrané ze skupiny zahrnující alkylovou skupinu s 1 až 6 uhlíkovými atomy, alkoxykupinu s 1 až 6 uhlíkovými atomy, alkylthioskupinu s 1 až 6 uhlíkovými atomy, alkylaminoskupinu s 1 až 6 uhlíkovými atomy, dialkylaminoskupinu se vždy 1 až 6 uhlíkovými atomy v alkylech, alkenylthioskupinu se 2 až 4 uhlíkovými atomy, alkynylthioskupinu se 2 až 4 uhlíkovými atomy, cykloalkylthioskupinu se 3 až 6 uhlíkovými atomy, nebo popřípadě halogenem, nitroskupinou, kyanoskupinou, alkoxykupinou s 1 až 3 uhlíkovými atomy, alkylthioskupinou s 1 až 3 uhlíkovými atomy, halogenalkoxykupinou s 1 až 3 uhlíkovými atomy, halogenalkylthioskupinou s 1 až 3 uhlíkovými atomy, alkylovou skupinou s 1 až 3 uhlíkovými atomy a/nebo halogenalkylovou skupinou s 1 až 3 uhlíkovými atomy substituované zbytky, vybrané ze skupiny zahrnující fenylovou skupinu, fenyloxyskupinu a fenylthioskupinu.

Substituenty R^5 , R^6 a R^7 značí v obecných vzorcích nezávisle na sobě zcela obzvláště výhodně popřípadě fluorem a/nebo chlorem substituované zbytky, vybrané ze skupiny zahrnující alkylovou skupinu s 1 až 4 uhlíkovými atomy, alkoxykupinu s 1 až 4 uhlíkovými atomy, alkylthioskupinu s 1 až 4 uhlíkovými atomy, alkylaminoskupinu s 1 až 4 uhlíkovými atomy nebo dialkylaminoskupinu se vždy 1 až 4 uhlíkovými atomy v alkylech, nebo popřípadě halogenem, nitroskupinou, kyanoskupinou, alkoxykupinou s 1 až 2 uhlíkovými atomy, alkylthioskupinou s 1 až 2 uhlíkovými atomy, fluoralkoxykupinou s 1 až 2 uhlíkovými atomy,

chloralkoxyskupinou s 1 až 2 uhlíkovými atomy, fluoralkylthioskupinou s 1 až 2 uhlíkovými atomy, chloralkylthioskupinou s 1 až 2 uhlíkovými atomy a/nebo alkylovou skupinou s 1 až 3 uhlíkovými atomy substituované zbytky, vybrané ze skupiny zahrnující fenylovou skupinu, fenyloxyskupinu a fenylthioskupinu.

V obzvláště významné formě provedení předloženého vynálezu značí substituenty R^5 , R^6 a R^7 nezávisle na sobě popřípadě halogenem substituovanou alkylovou skupinu s 1 až 6 uhlíkovými atomy.

Substituenty R^8 a R^9 značí v obecných vzorcích nezávisle na sobě výhodně vodíkový atom, popřípadě halogenem substituované zbytky ze skupiny zahrnující alkylovou skupinu s 1 až 20 uhlíkovými atomy, alkoxyskupinu s 1 až 20 uhlíkovými atomy, cykloalkylovou skupinu se 3 až 20 uhlíkovými atomy, alkenylovou skupinu se 2 až 8 uhlíkovými atomy nebo alkoxyalkylovou skupinu s 1 až 8 uhlíkovými atomy v alkylové i v alkoxylové části, nebo popřípadě halogenem, alkylovou skupinou s 1 až 20 uhlíkovými atomy, halogenalkylovou skupinou s 1 až 20 uhlíkovými atomy a/nebo alkoxyskupinou s 1 až 20 uhlíkovými atomy substituované zbytky, vybrané ze skupiny zahrnující fenylovou skupinu a benzylovou skupinu, nebo R^8 a R^9 tvoří společně alkylenovou skupinu se 2 až 6 uhlíkovými atomy, která může být přerušena atomem kyslíku a/nebo síry.

Substituenty R^8 a R^9 značí v obecných vzorcích nezávisle na sobě obzvláště výhodně vodíkový atom, popřípadě halogenem substituované zbytky ze skupiny zahrnující alkylovou skupinu s 1 až 16 uhlíkovými atomy, alkoxyskupinu

s 1 až 16 uhlíkovými atomy, cykloalkylovou skupinu se 3 až 16 uhlíkovými atomy, alkenylovou skupinu se 2 až 6 uhlíkovými atomy nebo alkoxyalkylovou skupinu s 1 až 6 uhlíkovými atomy v alkylové i v alkoxylové části, nebo popřípadě halogenem, alkylovou skupinou s 1 až 6 uhlíkovými atomy, halogenalkylovou skupinou s 1 až 6 uhlíkovými atomy a/nebo alkoxy skupinou s 1 až 6 uhlíkovými atomy substituované zbytky, vybrané ze skupiny zahrnující fenylovou skupinu a benzylovou skupinu, nebo R^8 a R^9 tvoří společně alkylenovou skupinu se 2 až 6 uhlíkovými atomy, která může být přerušena atomem kyslíku a/nebo síry.

Substituenty R^8 a R^9 značí v obecných vzorcích nezávisle na sobě zcela obzvláště výhodně vodíkový atom, popřípadě halogenem substituované zbytky ze skupiny, zahrnující alkylovou skupinu s 1 až 10 uhlíkovými atomy, alkoxy skupinu s 1 až 10 uhlíkovými atomy, nebo alkoxyalkylovou skupinu s 1 až 10 uhlíkovými atomy v alkylové i v alkoxylové části, nebo popřípadě halogenem, alkylovou skupinou s 1 až 4 uhlíkovými atomy, halogenalkylovou skupinou s 1 až 4 uhlíkovými atomy a/nebo alkoxy skupinou s 1 až 4 uhlíkovými atomy substituované zbytky, vybrané ze skupiny zahrnující fenylovou skupinu a benzylovou skupinu, nebo R^8 a R^9 tvoří společně alkylenovou skupinu se 2 až 4 uhlíkovými atomy, která může být přerušena atomem kyslíku a/nebo síry.

V obzvláště významné formě provedení předloženého vynálezu značí substituenty R^8 a R^9 nezávisle na sobě vodíkový atom nebo popřípadě halogenem substituovanou alkylovou skupinu s 1 až 6 uhlíkovými atomy.

Substituent L značí v obecných vzorcích výhodně, jakož i obzvláště výhodně a zcela obzvláště výhodně kyslíkový atom.

Substituent M značí v obecných vzorcích výhodně, jakož i obzvláště výhodně a zcela obzvláště výhodně kyslíkový atom.

Výše uváděné obecné nebo výhodné definice zbytků, popřípadě jejich vysvětlení, se mohou navzájem, tedy také mezi odpovídajícími výhodnými oblastmi, libovolně kombinovat. Jsou platné odpovídajícím způsobem jak pro konečné produkty, tak také pro předprodukty a meziprodukty.

Podle předloženého vynálezu jsou výhodné sloučeniny obecného vzorce I , ve kterých se vyskytují kombinace významů substituentů, uváděné výše jako výhodné.

Podle předloženého vynálezu jsou obzvláště výhodné sloučeniny obecného vzorce I , ve kterých se vyskytují kombinace významů substituentů, uváděné výše jako obzvláště výhodné.

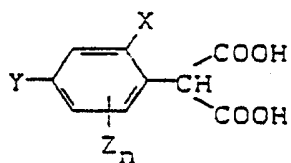
Podle předloženého vynálezu jsou zcela obzvláště výhodné sloučeniny obecného vzorce I , ve kterých se vyskytují kombinace významů substituentů, uváděné výše jako zcela obzvláště výhodné.

3-aryl-pyrony, potřebné jako výchozí látka pro provádění varianty b), c), d), e), f), g) a h) způsobu podle předloženého vynálezu, je možno získat podle varianty a) způsobu.

Halogenidy kyselin obecného vzorce IV , anhydridy kyselin obecného vzorce V , ester kyseliny chlormravenčí nebo thioester kyseliny mravenčí obecného vzorce VI , ester kyseliny chlormonothiomravenčí nebo ester kyseliny chlor-dithiomravenčí obecného vzorce VII , alkylhalogenidy obecného vzorce VIII , chloridy sulfonových kyselin obecného vzorce IX , sloučeniny fosforu obecného vzorce X , sloučeniny vzorců XI a XII , jakož i použité kovové hydroxidy a aminy, potřebné mimo jiné jako výchozí látky pro provádění variant b), c), d), e), f), g) a h) způsobu podle předloženého vynálezu, jsou o sobě známé sloučeniny organické a anorganické chemie.

Také karbonylové sloučeniny obecného vzorce II jsou o sobě známé sloučeniny organické chemie.

Sloučeniny obecného vzorce III jsou částečně známé (viz například Org. Prep. Proced. Int., 7(4), 155-158, 1975 a DE 19 45 703). Dosud neznámé takovéto sloučeniny se však dají vyrobit pomocí v principu známých metod jednoduchým způsobem. Tak se například získají halogenkarbonylketony obecného vzorce III , když se kyseliny arylmalonové obecného vzorce XIII



(XIII)

ve kterém mají X , Y , Z a n výše uvedený význam,

nechají reagovat s kyselými halogenidy, jako je například

thionylchlorid, chlorid fosforečný, chlorid fosforitý, oxalylchlorid, fosgen nebo thionylbromid, popřípadě za přítomnosti katalysátorů, jako je například diethylformamid, methyl-stearylformamid nebo trifenylfosfin.

Arylmalonové kyseliny obecného vzorce XIII jsou všeobecně známé sloučeniny organické chemie (viz například Organikum, VEB Deutscher Verlag der Wissenschaften, Berlín 1977, str. 517 a další).

Jako zředovací činidla se mohou při provádění varianty a) podle předloženého vynálezu použít všechna inertní organická rozpouštědla. Výhodně použitelné jsou uhlovodíky, jako je například toluen a xylen, dále ethery, jako je například dibutylether, glykoldimethylether a diglykoldimethylether a kromě toho polární rozpouštědla, jako je například dimethylsukfoxid, sulfolan, dimethylformamid a N-methylpyrrolidon.

Jako akceptory kyselin je možno při provádění varianty a) způsobu podle předloženého vynálezu použít všechny obvyklé akceptory kyselin.

Výhodně použitelné jsou terciární aminy, jako je například triethylamin, pyridin, diazabicyklooktan (DABCO), diazabicykloundekan (DBU), diazabicyklononen (DBN), Hünigova base a N,N-dimethylanilin.

Reakční teploty mohou při provádění varianty a) způsobu podle předloženého vynálezu kolísat v širokém rozmezí. Výhodně se pracuje při teplotě v rozmezí 0 °C až 250 °C, obzvláště v rozmezí 50 °C až 220 °C.

Varianta a) způsobu podle předloženého vynálezu se provádí účelně za normálního tlaku.

Při provádění varianty a) způsobu podle předloženého vynálezu se používají reakční komponenty obecných vzorců II a III a popřípadě akceptory kyselin účelně v ekvimolárním množství. Je však ale také možné jednu nebo druhou komponentu použít ve velikém přebytku, který může činit až 5 mol.

Jako zředovací činidla se mohou při provádění varianty b) α) způsobu podle předloženého vynálezu za použití halogenidů kyselin použít všechna rozpouštědla, inertní vůči těmto sloučeninám. Výhodně použitelné jsou uhlovodíky, jako je například benzin, benzen, toluen, xylen a tetralin, dále halogenované uhlovodíky, jako je například methylenchlorid, chloroform, tetrachlormethan, chlorbenzen a o-dichlorbenzen, ketony, jako je například aceton a methylisopropylketon, ethery, jako je například diethylether, tetrahydrofuran a dioxan, estery karboxylových kyselin, jako je například ethylester kyseliny octové a rovněž silně polární rozpouštědla, jako je například dimethylsulfoxid a sulfolan. Když to stabilita halogenidu kyseliny vůči hydrolyse dovolí, může se reakce provádět také za přítomnosti vody.

Když se použijí odpovídající kyselé halogenidy, tak přicházejí v úvahu jako činidla vázající kyseliny při reakci podle varianty b) α) způsobu podle předloženého vynálezu všechny obvyklé akceptory kyselin. Výhodně použitelné jsou terciární aminy, jako je například triethylamin, pyridin, diazabicyklooktan (DABCO), diazabicykloundekan (DBU), diazabicyklononen (DBN), Hünigova base a N,N-dimethylanilin, dále oxidy kovů alkalických zemin, jako je například

oxid hořečnatý a oxid vápenatý, uhličitany alkalických kovů a kovů alkalických zemin, jako je například uhličitán sodný, uhličitán draselný a uhličitán vápenatý, jakož i hydroxidy alkalických kovů, jako je například hydroxid sodný a hydroxid draselný.

Reakční teploty mohou při provádění varianty b)

α) způsobu podle předloženého vynálezu kolísat v širokém rozmezí. Výhodně se pracuje při teplotě v rozmezí -20°C až 150°C , obzvláště v rozmezí 0°C až 100°C .

Při provádění varianty b) α) způsobu podle předloženého vynálezu se používají výchozí látky obecného vzorce I a halogenid karboxylové kyseliny obecného vzorce V účelně v přibližně ekvimolárním množství. Je však ale také možné halogenid karboxylové kyseliny použít ve velikém přebytku, který může činit až 5 mol. Zpracování se může provádět pomocí obvyklých metod.

Když se při variantě b) β) způsobu podle předloženého vynálezu použijí jako reakční komponenty obecného vzorce V anhydridy karboxylových kyselin, tak se mohou jako zředovací činidla použít výhodně ta samá zředovací činidla, která výhodně přicházela v úvahu i při použití halogenidů kyselin. Jinak může fungovat jako zředovací činidlo také v přebytku použitý anhydrid karboxylové kyseliny. Také jako akceptory kyselin se mohou použít akceptory, používané při provádění varianty b) α) způsobu podle vynálezu.

Reakční teploty mohou při provádění varianty b)

β) způsobu podle předloženého vynálezu také při použití anhydridů karboxylových kyselin kolísat v širokém rozmezí.

Výhodně se pracuje při teplotě v rozmezí -20°C až 150°C , obzvláště v rozmezí 0°C až 100°C .

Při provádění varianty b) β) způsobu podle předloženého vynálezu se používají výchozí látky obecného vzorce I a anhydrid karboxylové kyseliny obecného vzorce V účelně v přibližně ekvimolárním množství. Je však ale také možné anhydrid karboxylové kyseliny použít ve velikém přebytku, který může činit až 5 mol. Zpracování se může provádět pomocí obvyklých metod.

Účelně se postupuje tak, že se zředovací činidlo a v přebytku přítomný anhydrid karboxylové kyseliny, jakož i vzniklá karboxylová kyselina, odstraní destilací nebo promytím organickým rozpouštědlem nebo vodou.

Když se při variantě c) způsobu použije odpovídající ester kyseliny chlormravenčí, popřípadě thioester kyseliny chlormravenčí, potom přicházejí při reakci v úvahu jako činidla vázající kyseliny všechny obvyklé akceptory kyselin.

Výhodně použitelné jsou terciární aminy, jako je například triethylamin, pyridin, 1,4-diazabicyklo[2.2.2]-oktan (DABCO), 1,8-diazabicyklo[5.4.0]undec-7-en (DBU), DBA, Hünigova base a N,N-dimethylanilin, dále oxidy kovů alkalických zemin, jako je například oxid hořečnatý a oxid vápenatý, uhličitany alkalických kovů a kovů alkalických zemin, jako je například uhličitán sodný, uhličitán draselný a uhličitán vápenatý, jakož i hydroxidy alkalických kovů, jako je například hydroxid sodný a hydroxid draselný.

Jako zředovací činidla se mohou při provádění varianty

c) způsobu podle předloženého vynálezu za použití esteru kyseliny chlormravenčí, popřípadě thioesteru kyseliny chlormravenčí, použít všechna rozpouštědla, inertní vůči těmto sloučeninám. Výhodně použitelné jsou uhlovodíky, jako je například benzin, benzen, toluen, xylen a tetralin, dále halogenované uhlovodíky, jako je například methylenchlorid, chloroform, tetrachlormethan, chlorbenzen a o-dichlorbenzen, ketony, jako je například aceton a methylisopropylketon, ethery, jako je například diethylether, tetrahydrofuran a dioxan, estery karboxylových kyselin, jako je například ethylester kyseliny octové a rovněž silně polární rozpouštědla, jako je například dimethylsulfoxid a také sulfolan.

Při použití esteru kyseliny chlormravenčí nebo thioesteru kyseliny chlormravenčí jako derivátů kyselin obecného vzorce VI mohou reakční teploty kolísat při variantě c) způsobu podle předloženého vynálezu v širokém rozmezí. Když se pracuje za přítomnosti zředovacího činidla a látky, vázající kyseliny, potom jsou reakční teploty všeobecně v rozmezí -20°C až 100°C , obzvláště v rozmezí 0°C až 50°C .

Varianta c) způsobu podle předloženého vynálezu se účelně provádí za normálního tlaku.

Při provádění varianty c)) způsobu podle předloženého vynálezu se používají výchozí látky obecného vzorce I a odpovídající ester kyseliny chlormravenčí, popřípadě thioester kyseliny chlormravenčí, obecného vzorce VI účelně v přibližně ekvimolárním množství. Je však ale také možné jednu nebo druhou komponentu použít ve větším přebytku, který může činit až 2 mol.

Zpracování se může provádět pomocí obvyklých metod. Účelně se postupuje tak, že se vysrážená sůl odstraní a zbylá reakční směs se potom zahustí pomocí odtažení zředovacího činidla.

Při variantě d) α) způsobu podle předloženého vynálezu se použije pro jeden mol výchozí sloučeniny obecného vzorce I asi jeden mol esteru kyseliny chlor-monothiomravenčí, popřípadě esteru kyseliny chlordithio-mravenčí, obecného vzorce VII, přičemž se reakce provádí při teplotě v rozmezí 0 °C až 120 °C, výhodně v rozmezí 20 °C až 60 °C.

Jako popřípadě přidávaná zředovací činidla přicházejí v úvahu všechna inertní organická rozpouštědla, jako jsou například ethery, amidy, alkoholy, sulfony a nebo sulfoxidy.

Jako výhodná zředovací činidla je zde možno uvést dimethylsulfoxid, tetrahydrofuran, dimethylformamid a dimethylsulfid.

Když se při výhodné formě provedení způsobu vytváří přídatkem silného deprotonizačního činidla, jako je například hydrid sodný nebo terc.-butylát draselný, enolátová sůl sloučeniny obecného vzorce I, může se od ní upustit dalším přídatkem činidla vázajícího kyseliny.

Když se používají činidla vázající kyseliny, přicházejí v úvahu obvyklé anorganické nebo organické base. Jako příklady je možno uvést hydroxid sodný, uhličitan sodný, uhličitan draselný, pyridin nebo triethylamin.

Reakce se může provádět za normálního tlaku nebo za tlaku zvýšeného, výhodně se pracuje za normálního tlaku. Zpracování se provádí obvyklými metodami.

Při variantě d) β) způsobu podle předloženého vynálezu se použije pro jeden mol výchozí sloučeniny obecného vzorce I ekvimolární množství, popřípadě přebytek sirného uhlovodíku. Reakce provádí výhodně při teplotě v rozmezí 0 °C až 50 °C, obzvláště v rozmezí 20 °C až 30 °C.

Často bývá účelné vyrobit ze sloučeniny obecného vzorce I nejprve přidavkem deprotonisačního činidla, jako je například terc.-butylát draselný nebo hydrid sodný, odpovídající sůl. Sloučenina obecného vzorce I se nechá reagovat tak dlouho se sirovovodíkem, dokud není ukončena tvorba meziprojektu, například po několikahodinovém míchání při teplotě místnosti.

Další reakce s alkylhalogenidem obecného vzorce VIII se provádí výhodně při teplotě v rozmezí 0 °C až 70 °C a obzvláště v rozmezí 20 °C až 50 °C. Při tom se používá alespoň ekvimolární množství alkylhalogenidu.

Pracuje se za normálního tlaku nebo za tlaku zvýšeného, výhodně za normálního tlaku.

Následující zpracování se opět provádí pomocí obvyklých metod.

Při variantě e) způsobu se používá na jeden mol výchozí sloučeniny obecného vzorce I asi jeden mol chloridu sulfonové kyseliny obecného vzorce IX, přičemž se

pracuje při teplotě v rozmezí 0 °C až 150 °C , výhodně 20 °C až 70 °C .

Jako popřípadě přidávaná zředovací činidla přicházejí v úvahu všechna inertní polární organická rozpouštědla, jako jsou například ethery, amidy, nitrily, alkoholy, sulfony, sulfoxidy nebo halogenované uhlovodíky, jako je methylenchlorid.

Jako výhodná zředovací činidla je možno jmenovat dimethylsulfoxid, tetrahydrofuran a dimethylformamid.

Když se při výhodné formě provedení způsobu vytváří přídatkem silného deprotonizačního činidla, jako je například hydrid sodný nebo terc.-butylát draselný, enolátová sůl sloučeniny obecného vzorce I , může se od ní upustit dalším přídatkem činidla vázajícího kyseliny.

Když se používají činidla vázající kyseliny, přicházejí v úvahu obvyklé anorganické nebo organické base. Jako příklady je možno uvést hydroxid sodný, uhličitan sodný, uhličitan draselný, pyridin nebo triethylamin.

Reakce se může provádět za normálního tlaku nebo za tlaku zvýšeného, výhodně se pracuje za normálního tlaku. Zpracování se provádí obvyklými metodami.

Při variantě e) způsobu se může popřípadě pracovat za podmínek fázového přenosu (viz například V. J. Spillane a kol.; J. Chem. Soc., Perkin Trans I, (3) 677-679 /1982/). V tomto případě se nechá reagovat jeden mol výchozí sloučeniny obecného vzorce I s 0,3 až 1,5 mol chloridu sulfonové kyseliny obecného vzorce IX , výhodně s 0,5 mol.

Pracuje se při teplotě v rozmezí 0°C až 150°C , výhodně 20°C až 70°C .

Jako katalysátory fázového přenosu se mohou použít všechny kvarterní amoniové soli, výhodně tetraoktylamoniumbromid a benzyltriethylamoniumchlorid. Jako organická rozpouštědla mohou v tomto případě sloužit všechna nepolární organická rozpouštědla, výhodně se však používá benzen a toluen.

Při variantě f) se používá na jeden mol sloučeniny obecného vzorce I jeden až dva mol, výhodně 1 až 1,3 mol fosforové sloučeniny obecného vzorce X , přičemž se pracuje při teplotě v rozmezí -40°C až 150°C , výhodně -10°C až 110°C .

Jako popřípadě přidávaná zředovací činidla přicházejí v úvahu všechna inertní polární organická rozpouštědla, jako jsou například ethery, amidy, nitrily, alkoholy, sulfidy, sulfony, sulfoxidy a podobně.

Jako výhodná zředovací činidla je možno jmenovat acetonitril, dimethylsulfoxid, tetrahydrofuran a dimethylformamid.

Jako popřípadě přidávaná činidla, vazající kyseliny, přicházejí v úvahu obvyklé anorganické nebo organické base, jako jsou hydroxidy a uhličitany. Jako příklady je možno uvést hydroxid sodný, uhličitán sodný, uhličitán draselný a pyridin

Reakce se může provádět za normálního tlaku nebo za tlaku zvýšeného, přičemž výhodně se pracuje za normálního

tlaku. Další zpracování se provádí pomocí obvyklých metod organické chemie. Čištění získaného konečného produktu se provádí výhodně krystalisací, chromatografickými metodami nebo pomocí takzvaného "nadestilování", to znamená odstraněním těkavých součástí ve vakuu.

Podstata varianty g) způsobu spočívá v reakci sloučenin obecného vzorce I s kovovými hydroxidy nebo s aminy.

Jako zředovací činidla se mohou při tomto způsobu podle předloženého vynálezu použít výhodně ethery, jako je například tetrahydrofuran, dioxan nebo diethylether, alkoholy, jako je například methylalkohol, ethylalkohol nebo isopropylalkohol, nebo také voda. Uvedený způsob se výhodně provádí za normálního tlaku. Reakční teploty jsou všeobecně v rozmezí -20°C až 100°C , výhodně 0°C až 50°C .

Při provádění varianty g) způsobu podle předloženého vynálezu se používají výchozí látky všeobecně přibližně v ekvimolárním množství. Je však ale také možné jednu nebo druhou komponentu použít ve větším přebytku, který může činit až 2 mol. Účelně se postupuje tak, že se reakční směs odtažením zředovacího činidla zahustí.

Při variantě h) a) způsobu se nechá reagovat pro jeden mol výchozí sloučeniny obecného vzorce I asi jeden mol isokyanátu obecného vzorce XI, přičemž se oracuje při teplotě v rozmezí 0°C až 100°C , výhodně v rozmezí 20°C až 50°C .

Jako popřípadě přidávaná zředovací činidla přicházejí v úvahu všechna inertní organická rozpouštědla, jako jsou

výhodně například ethery, amidy, nitrily, sulfony nebo sulfoxidy.

Pro urychlení reakce je možno také použít kaptalysátorů. Jako katalysátory je možno velmi výhodně použít organocínaté sloučeniny, jako je například dibutylcindilaurát. Při provádění reakce se výhodně pracuje za normálního tlaku.

Při variantě h) β) způsobu se nechá reagovat pro jeden mol výchozí sloučeniny obecného vzorce I asi jeden mol chloridu kyseliny karbamidové, popřípadě chloridu kyseliny thiokarbamidové, obecného vzorce XII, přičemž se oracuje při teplotě v rozmezí 0 °C až 150 °C, výhodně v rozmezí 20 °C až 70 °C.

Jako popřípadě přidávaná zředovací činidla přicházejí v úvahu všechna inertní polární organická rozpouštědla, jako jsou výhodně například ethery, amidy, alkoholy, sulfony nebo sulfoxidy.

Jako výhodná zředovací činidla je možno uvést dimethylsulfoxid, tetrahydrofuran a dimethylformamid.

Když se při výhodné formě provedení způsobu vytváří přídavkem silného deprotonisačního činidla, jako je například hydrid sodný nebo terc.-butylát draselný, enolátová sůl sloučeniny obecného vzorce I, může se od ní upustit dalším přídavkem činidla vázajícího kyseliny.

Když se používají činidla vázající kyseliny, přicházejí v úvahu obvyklé anorganické nebo organické base. Jako výhodné příklady je možno uvést hydroxid sodný,

uhličitan sodný, uhličitan draselný, pyridin nebo také triethylamin.

Reakce se může provádět za normálního tlaku nebo za tlaku zvýšeného, výhodně se pracuje za normálního tlaku. Zpracování se provádí obvyklými metodami.

Sloučeniny podle předloženého vynálezu obecného vzorce I se mohou použít pro potírání škůdců. Škůdci jsou nežádoucí živočišní škůdci, obzvláště hmyz, roztoči a nematody, kteří poškozují rostliny a vyšší živočichy. Ke škůdcům patří však také nežádoucí rostliny.

Účinné látky podle předloženého vynálezu jsou vhodné při dobré snášenlivosti pro rostliny a dobré toxicitě pro teplokrevné živočichy pro potírání živočišných škůdců, především anthropolů, obzvláště hmyzu, pavoukovitých a nematodů, kteří se vyskytují v zemědělství, lesnictví, v ochraně zásob a materiálu, jakož i v sektoru hygieny. Jsou účinné proti normálně citlivým a resistantním druhům, jakož i proti všem nebo jednotlivým vývojovým stadiím.

K výše uvažovaným škůdcům patří :

Z řádu Isopoda například *Oniscus asellus*, *Armadillidium vulgare*, *Porcellio scaber*.

Z řádu Diplopoda například *Blaniulus guttulatus*.

Z řádu Chilopoda například *Geophilus carpophagus*, *Scutigera spec.*

Z řádu Symphyla například *Scutigera immaculata*.

Z řádu Thysanura například *Lepisma saccharina*.

Z řádu Collembola například *Onychiurus armatus*.

Z řádu Orthoptera například *Blatta orientalis*, *periplaneta americana*, *Leucophaea maderae*, *Blattella germanica*, *Acheta domesticus*, *Gryllotalpa* spp., *Locusta migratoria migratorioides*, *Melanoplus differentialis*, *Schistocerca gregaria*.

Z řádu Dermaptera například *Forficula auricularia*.

Z řádu Isoptera například *Reticulitermes* spp..

Z řádu Anoplura například *Phylloxera vastatrix*, *Pemphigus* spp., *Pediculus humanus corporis*, *Haematopinus* spp., *Linognathus* spp.

Z řádu Mallophaga například *Trichodectes* spp., *Damalinae* spp.

Z řádu Thysanoptera například *Hercinothrips femoralis*, *Thrips tabaci*.

Z řádu Heteroptera například *Euryhaster* spp., *Dysdercus intermedius*, *Piesma quadrata*, *Cimex lectularius*, *Rhodnius prolixus*, *Triatoma* spp.

Z řádu Homoptera například *Aleurodes brassicae*, *Bemisia tabaci*, *Trialeurodes vaporariorum*, *Aphis gossypii*, *Brevicoryne brassicae*, *Cryptomyzus ribis*, *Aphis fabae*, *Doralis pomi*, *Eriosoma lanigerum*, *Hyalopterus arundinis*, *Macrosiphum avenae*, *Myzus* spp., *Phorodon humuli*, *Rhopalosiphum padi*, *Empoasca* spp., *Euscelis bilobatus*,

Nephotetix cincticeps, *Lecanium corni*, *Saissetia oleae*,
Laodelphax striatellus, *Nilaparvata lugens*, *Aonidiella*
aurantii, *Aspidiotus hederae*, *Pseudococcus* spp. *Psylla* spp.

Z řádu *Lepidoptera* například *Pectinophora gossypiella*,
Bupalus piniarius, *Cheimatobia brumata*, *Lithocolletis*
blancardella, *Hyponomeuta padella*, *Plutella maculipennis*,
Malacosoma neustria, *Euproctis chrysorrhoea*, *Lymantria* spp.
Bucculatrix thurberiella, *Phyllocnistis citrella*, *Agrotis*
spp., *Euxoa* spp., *Feltia* spp.,
Earias insulana, *Heliothis* spp., *Spodoptera exigua*, *Mamestra*
brassicae, *Panolis flammea*, *Prodenia litura*, *Spodoptera*
spp., *Trichoplusia ni*, *Carpocapsa pomonella*, *Pieris* spp.,
Chilo spp., *Pyrausta nubilalis*, *Ephestia kuehniella*,
Galleria mellonella, *Tineola bisselliella*, *Tinea*
pellionella, *Hofmannophila pseudospretella*, *Cacoecia podana*,
Capua reticulana, *Choristoneura fumiferana*, *Clysis*
ambigua, *Homona magnanima*, *Tortrix viridana*.

Z řádu *Coleoptera* například *Anobium punctatum*, *Rhizopertha*
dominica, *Acanthoscelides obtectus*, *Hylotrupes bajulus*,
Agelastica alni, *Leptinotarsa decemlineata*, *Phaedon*
cochleariae, *Liabrotica* spp., *Psylliodes chrysocephala*,
Epilachna varivestis, *Atomaria* spp., *Oryzaephilus*
surinamensis, *Anthonomus* spp., *Sitophilus* spp.,
Otiorrhynchus sulcatus, *Cosmopolites sordidus*,
Ceuthorrhynchus assimilis, *Hypera postica*, *Dermestes* spp.,
Trogoderma spp., *Anthrenus* spp., *Attagenus* spp., *Lyctus*
spp., *Meligethes aeneus*, *Ptinus* spp., *Niptus hololeucus*,
Gibbium psyllodes, *Tribolium* spp., *Tenebrio molitor*,
Agriotes spp., *Conoderus* spp., *Melolontha melolontha*,
Amphimallon solstitialis, *Costelytra zealandica*.

Z řádu Hymenoptera například *Diprion* spp., *Hoplocampa* spp., *Lasius* spp., *Monomorium pharaonis*, *Vespa* spp.

Z řádu Diptera například *Aedes* spp., *Anopheles* spp., *Culex* spp., *Drosophila melanogaster*, *Musca* spp., *Fania* spp., *Calliphora erythrocephala*, *Lucilia* spp., *Chrysomyia* spp., *Cuterebra* spp., *Gastrophilus* spp., *Hyppobosca* spp., *Stomoxys* spp., *Oestrus* spp., *Hypoderma* spp., *Tabanus* spp., *Tannia* spp., *Bibio hortulanus*, *Oscinella frit*, *Phorbia* spp., *Pegomyia hyoscyami*, *Ceratitis capitata*, *Dacus oleae*, *Tipula paludosa*.

Z řádu Siphonaptera například *Xenopsylla cheopis*, *Ceratophyllus* spp..

Z řádu Arachnida například *Scorpio maurus*, *Latrodectus mactans*.

Z řádu Acarina například *Acarus siro*, *Argas* spp., *Ornithodoros* spp., *Dermanyssus gallinae*, *Eriophyes ribis*, *Phyllocoptura oleivora*, *Boophilus* spp., *Rhipicephalus* spp., *Amblyomma* spp., *Hyalomma* spp., *Ixodes* spp., *Psoroptes* spp., *Chorioptes* spp., *Sarcoptes* spp., *Tarsonemus* spp., *Bryobia praetiosa*, *Panonychus* spp. a *Tetranychus* spp..

K nematodům, parazitujících na rostlinách, patří :

Pratylenchus spp., *Radopholus similis*, *Ditylenchus dipsaci*, *Tylenchulus semipentrans*, *Heterodera* spp., *Meloidogyne* spp., *Aphelenchoides* spp., *Longidorus* spp., *Xiphinema* spp. a *Trichodorus* spp..

Vedle toho vykazují účinné látky podle předloženého

vynálezu také dobrou fungicidní účinnost a dají se použít pro potírání onemocnění rostlin, jako například proti původcům onemocnění skvrnami na výhoncích (*Pyricularia oryzae*).

Účinné látky podle předloženého vynálezu mohou být k dispozici pro použití jako insekticidy, akaricidy a nematocidy ve svých na trhu běžných přípravcích, jakož i v aplikačních formách, připravených z těchto přípravků, ve směsi s jinými účinnými látkami, jako jsou insekticidy, vábící látky, sterilanty, akaricidy, nematocidy, fungicidy, růstově regulační látky nebo herbicidy. K insekticidům se počítají například estery kyseliny fosforečné, karbamáty, estery karboxylových kyselin, chlorované uhlovodíky, fenylmočoviny, látky vyrobené pomocí mikroorganismů a podobně.

Účinné látky podle předloženého vynálezu mohou být dále k dispozici pro použití ve svých na trhu běžných přípravcích, jakož i v aplikačních formách z těchto přípravků vyrobených, ve směsi se synergicky působícími látkami. Synergicky působícími látkami jsou sloučeniny, pomocí kterých se účinek účinné látky zvyšuje, bez toho, že by tato synergicky působící látka musela být sama aktivně účinná.

Obsah účinné látky v aplikačních formách, připravených z na trhu obvyklých přípravků, může kolísat v širokém rozmezí. Koncentrace účinné látky v aplikační formě může být v rozmezí 0,0000001 až 95 % hmotnostních, výhodně v rozmezí 0,0001 až 1 % hmotnostní.

Aplikace se provádí způsoby, obvyklými pro dané

aplikační formy.

Sloučeniny podle předloženého vynálezu jsou vhodné také obzvláště pro zpracování vegetativního a generativního množícího materiálu, jako je například osivo obilí, kukuřice, zeleniny a podobně, nebo také cibulek, sazenic a podobně.

Při použití proti hygienickým škůdcům a škůdcům na zásobách se vyznačují účinné látky výrazným residuálním účinkem na dřevo a půdu, jakož i dobrou stabilitou vůči alkáliím na zavápněném podkladě.

Účinné látky podle předloženého vynálezu se mohou použít také jako herbicidy, výhodně jako defolianty, desikanty, prostředky pro umrtvování nati a obzvláště jako prostředky pro ničení plevelů. Pod pojmem plevel se rozumí v nejširším smyslu všechny rostliny, které vyrůstají na zahradách, kde jsou nežádoucí. Zda působí látky podle předloženého vynálezu jako totální nebo selektivní herbicidy, to záleží v podstatě na použitém množství.

Účinné látky podle předloženého vynálezu se mohou použít například u následujících rostlin :

Dvojděložné plevely rodů :

Sinapis, Lepidium, Galium, Stellaria, Matricaria, Anthemis, Galinsoga, Chenopodium, Urtica, Senecio, Amaranthus, Portulaca, Xanthium, Convolvulus, Ipomoea, Polygonum, Sesbania, Ambrosia, Cirsium, Carduus, Sonchus, Solanum, Rorippa, Rotala, Lindernia, Lamium, Veronica, Abutilon, Emex, Datura, Viola, Galeopsis,

Papaver, Centaurea, Trifolium, Ranunculus a Taraxacum.

Dvojděložné kultury rodů :

Gossypium, Glycine, Beta, Daucus, Phaseolus, Pisum, Solanum, Linum, Ipomoea, Vicia, Nicotiana, Lycopersicon, Arachis, Brassica, Lactuca, Cucumis a Cucurbita.

Jednoděložné plevely rodů :

Echinochloa, Setaria, Panicum, Digitaria, Phleum, Poa, Festuca, Eleusine, Brachiaria, Lolium, Bromus, Avena, Cyperus, Sorghum, Agropyron, Cynodon, Monochoria, Fimbristylis, Sagittaria, Eleocharis, Scirpus, Paspalum, Ischaemum, Sphenoclea, Dactyloctenium, Agrostis, Alopecurus a Apera.

Jednoděložné kultury rodů :

Oryza, Zea, Triticum, Hordeum, Avena, Sorghum, Panicum, Saccharum, Ananas, Asparagus a Allium.

Použití účinných látek podle předloženého vynálezu však není v žádném případě omezeno na uvedené rody, ale je rozšířeno stejným způsobem také na ostatní rostliny.

Sloučeniny podle předloženého vynálezu jsou vhodné v závislosti na koncentraci pro totální potření plevelů například v průmyslových zařízeních a kolejových zařízeních a na cestách a prostranstvích se stromovým porostem nebo bez něho. Rovněž tak se mohou uvedené sloučeniny použít pro potírání plevelů v trvalých kulturách, jako jsou například lesy, ozdobné dřeviny, ovocné sady, vinice, citrusové

plantáže, ořechové plantáže, banánovníkové plantáže, kávovníkové plantáže, čajové plantáže, gumovníkové plantáže, olejnicové plantáže, kakaovníkové plantáže, plantáže bobulového ovoce a chmelnice, na ozdobných a sportovních trávnicích a na pastvinách a pro selektivní potírání plevelů v jednoletých kulturách.

Sloučeniny podle předloženého vynálezu obecného vzorce I jsou vhodné obzvláště pro selektivní potírání jednoděložných plevelů ve dvouděložných kulturách, jak procesem před vzejitím, tak také procesem po vzejití.

Účinné látky podle předloženého vynálezu se mohou použít jak jako takové nebo ve svých přípravcích, tak také ve směsích se známými herbicidy pro potírání plevelů, přičemž jsou zde vždy možné hotové přípravky nebo tankové směsi.

Pro směsi přicházejí v úvahu známé herbicidy, jako jsou například anilidy, jako je například Diflufenican a Propanil ; arylkarboxylové kyseliny, jako je například kyselina dichlorpikolinová, Dicamba a Picloram ; aryloxyalkanové kyseliny, jako je například 2,4 D , 2,4 DB , 2,4 DP , Fluoroxypyr , MCPA , MCPP a Triclopyr ; estery kyselin aryloxy-fenoxy-alkanových, jako je například Diclofop-methyl, Fenoxaprop-ethyl, Fluazifop-butyl, Haloxyfop-methyl a Quizalofop-ethyl; azinony, jako je například Chloridazon a Norflurazon; karbamáty, jako je například Chlorpropham, Desmedipham, Phenmedipham a Propham; chloracetanilidy, jako například Alachlor, Acetochlor, Butachlor, Metazachlor Metolachlor, Pretilaclor a Propachlor; dinitroaniliny, jako například Oryzalin, Pendimethalin a Trifluralin; diphenylethery, jako například

Acifluorfen, Bifenox, Fluoroglycofen, Fomesafen, Halosafen, Lactofen a Oxyfluorfen; močoviny, jako například Chlortoluron, Diuron, Fluometuron, Isoproturon, Linuron a Methabenzthiazuron; hydroxylaminy, jako například Alloxydim, Clethodim, Cycloxydim, Sethoxydim a Tralkoxydim; imidazolinony, jako například Imazethapyr, Imazamethabenz, Imazapyr a Imazaquin; nitrily, jako například Bromoxynil, Dichlobenil a Ioxynil; oxyacetamidy, jako například Mefenacet; sulfonmočoviny, jako například Amidosulfuron, Bensulfuron-methyl, Chlorimuron-ethyl, Chlorsulfuron, Cinosulfuron, Metsulfuron-methyl, Nicosulfuron, Primisulfuron, Pyrazosulfuron-ethyl, Thifensulfuron-methyl, Triasulfuron a Tribenuron-methyl; thiolcarbamaty, jako například Butylate, Cycloate, Diallate, EPTC, Esprocarb, Molinate, Prosulfocarb, Thiobencarb a Triallate; triiaziny, jako například Atrazin, Cyanazin, Simazin, Simetryne, Terbutryne a Terbutylazin; triazinony jako například Hexazinon, Metamitron a Metribuzin; a ostatní jako například Aminotriazol, Benfuresate, Bentazone, Cinmethylin, Clomazone, Clopyralid, Difenzoquat, Dithiopyr, Ethofumesate, Fluorochloridone, Glufosinate, Glyphosate, Isoxaben, Pyridate, Quinchlorac, Quinmerac, Sulphosate a Tridiphane.

Také jsou možné směsi s jinými známými účinnými látkami, jako jsou například fungicidy, insekticidy, akaricidy, nematocidy, ochranné látky proti okusu ptáky, hnojivé látky pro rostliny a prostředky pro zlepšení struktury půdy.

Účinné látky mohou být používány jako takové, ve formě svých přípravků nebo ve formě aplikačních forem, připravených z těchto přípravků dalším naředěním. Jako aplikační formy je možno uvést roztoky, suspense, emulze, prášky,

pasty a granuláty. Aplikace přípravků se provádí obvyklými způsoby, například litím, stříkáním, postřikem nebo poprašováním.

Účinné látky podle předloženého vynálezu se mohou aplikovat jak před vzejitím rostliny, tak také po jejím vzejití.

Účinné látky se mohou také zapracovat do půdy před setím.

Používané množství účinné látky se může pohybovat v širokém rozmezí. Závisí v podstatě na druhu požadovaného efektu. Všeobecně je množství účinné látky mezi 10 g a 10 kg na jeden hektar plochy půdy, výhodně je v rozmezí 50 g až 5 kg na hektar.

Pro výrobu prostředků pro potírání škůdců se mohou účinné látky podle předloženého vynálezu převést na obvyklé přípravky, jako jsou roztoky, emulse, suspence, prášky, pěny, pasty, granuláty, aerosoly, přírodní a syntetické látky, impregnované účinnou látkou, mikrokapsle v polymer-ních látkách a zapouzdřovací hmoty pro osivo, dále na přípravky s hořlavými přísadami, jako jsou kouřové patrony, dýmovnice, kouřové spirály a podobně, jakož i na ostatní možné přípravky.

Účinné látky mohou být v závislosti na svých odpovídajících fyzikálních a/nebo chemických vlastnostech převáděny na obvyklé přípravky, jako roztoky, emulse, suspence, prášky, pěny, pasty, granuláty, aerosoly, přírodní a syntetické látky, impregnované účinnou látkou, mikrokapsle v polymerních látkách a zapouzdřovací hmoty pro osivo, dále

na přípravky s hořlavými přísadami, jako jsou kouřové patrony, dýmovnice, kouřové spirály a podobně, jakož i na ostatní možné přípravky.

Uvedené přípravky se vyrábějí pomocí známých způsobů, například smísením účinné látky s plnivy, tedy kapalnými rozpouštědly, za tlaku kapalnými plyny a/nebo pevnými nosiči, popřípadě za použití povrchově aktivních činidel, tedy emulgačních prostředků a/nebo dispergačních prostředků a/nebo pěnotvorných činidel. V případě využití vody jako plniva se mohou použít organická rozpouštědla jako pomocná rozpouštědla.

Jako kapalná rozpouštědla přicházejí v podstatě v úvahu :

Aromáty, jako je například xylen, toluen nebo alkylnaftaleny, chlorované aromáty nebo chlorované alifatické uhlovodíky, jako je například chlorbenzeny, chlorethyleny nebo methylenchlorid, alifatické uhlovodíky, jako je například cyklohexan nebo parafiny a ropné frakce, alkoholy, jako je například butylalkohol nebo glykol, jakož i jejich ethery a estery, ketony, jako je například aceton, methyl-ethylketon, methylišobutylketon nebo cyklohexanon, silně polární rozpouštědla, jako je například dimethylformamid a dimethylsulfoxid, jakož i voda.

Jako za tlaku kapalně plyny se v souvislosti s plnivy nebo nosnými látkami rozumí takové kapaliny, které jsou za normální teploty a normálního tlaku plynné, jako jsou například hnací plyny pro aerosoly. Mezi těmito lze jmenovat halogenované uhlovodíky, jakož i butan, propan, dusík a oxid uhličitý.

Jako pevné nosné látky přicházejí v úvahu :
Přírodní horninové moučky, jako jsou například kaoliny, jíly, mastek, křída, křemen, attapulgit, montmorillonit nebo křemelina a syntetické horninové moučky, jako je například syntetická vysoce dispersní kyselina křemičitá, oxid hlinitý a křemičitany.

Jako pevné nosné látky pro granuláty přicházejí v úvahu :
Rozdrcené a frakcionované přírodní horniny, jako je například kalcit, mramor, pemza, sepiolit, dolomit, jakož i syntetické granuláty z anorganických a organických mouček, jakož i granuláty z organického materiálu, jako jsou například piliny, skořápky kokosových ořechů, kukuřičné palice a tabákové stopky.

Jako emulgační a/nebo pěnotvorné prostředky přicházejí v úvahu :
Neionogenní a aniontové emulgátory, jako jsou estery polyoxyethylenu a mastných kyselin a ethery polyoxyethylenu a mastných alkoholů, například alkylarylpolyglykol-ether, alkylsulfonáty, alkylsulfáty, arylsulfonáty, jakož i bílkovinné hydrolysáty.

Jako dispergační činidla přicházejí v úvahu :
Lignin-sulfitové výluhy a methylcelulosa.

V přípravcích je možno použít prostředky pro zvýšení přilnavosti, jako je karboxymethylcelulosa nebo přírodní a syntetické, práškovité, zrnité nebo latexovité polymery, například arabskou gumu, polyvinylalkohol, polyvinylacetát, jakož i přírodní fosfolipidy, například kefaliny a lecitiny a syntetické fosfolipidy. Dalšími aditivy mohou být

minerální a vegetabilní oleje.

V přípravcích se mohou také použít barviva, jako jsou anorganické pigmenty, například oxidy železa, oxid titaničitý a kyanoželezitá modř, a organická barviva, například alizarinová barviva, azobarviva a metalftalokyaninová barviva.

Dále se v přípravcích mohou vyskytovat stopová hnojiva, jako jsou například soli železa, manganu, boru, mědi, kobaltu, molybdenu a zinku.

Přípravky obsahují všeobecně účinnou látku v rozmezí 0,1 až 95 % hmotnostních, výhodně v rozmezí 0,5 až 90 % hmotnostních.

Účinné látky podle předloženého vynálezu se mohou vyskytovat ve svých obchodně obvyklých přípravcích, nebo se mohou vyskytovat v aplikačních formách, z těchto přípravků připravených, ve směsi s jinými účinnými látkami, jako jsou například insekticidy, vábící látky, sterilanty, akaricidy, nematocidy, fungicidy, růstově regulační látky nebo herbicidy. K insekticidům se počítají například estery kyseliny fosforečné, karbamáty, estery karboxylových kyselin, chlorované uhlovodíky, fenylmočoviny, látky vyrobené pomocí mikroorganismů a podobně.

Prostředky podle předloženého vynálezu obsahují výhodně vedle alespoň jedné sloučeniny obecného vzorce I a vedle podstatných maziv a pomocných látek alespoň jednu povrchově aktivní látku.

Účinné látky jsou vhodné při dobré toxicitě pro

teplokrevné také pro potírání škůdců u živočichů (ektoparasiti a endoparasiti) jako jsou arthropodi, především hmyz a pavoukovití (ektoparasiti), cestodeni, trematodeni, nematodi a acantocephaleni (endoparasiti), kteří se vyskytují při chovu a pěstování zvířat u domácích zvířat, užitkových zvířat, jakož i u zvířat v zoologických zahradách, laboratorních zvířat, pokusných zvířat a zvířat chovaných pro potěšení. Jsou při tom účinné vůči všem nebo jednotlivým vývojovým stádiím škůdců, jakož i proti resistantním a normálně citlivým druhům škůdců.

Potíráním škůdců na zvířatech se mají potlačit onemocnění a jejich přenos, případy smrti a snížení výkonů (například při produkci masa, mléka, vlny, kůže a vajec), takže použitím účinných látek je umožněn hospodárnější a jednodušší chov zvířat, popřípadě v určitých oblastech je teprve možný.

Ke škůdcům patří:

Z řádu Anoplura například *Haematopinus* spp., *Linognathus* spp., *Solenopotes* spp., *Pediculus* spp., *Pthirus* spp.;

Z řádu Mallophaga například *Trimenopon* spp., *Menopon* spp., *Eomenacanthus* spp., *Menacanthus* spp., *Trichodectes* spp., *Felicola* spp., *Damalinae* spp., *Bovicola* spp.;

Z řádu Diptera například *Chrysops* spp., *Tabanus* spp., *Musca* spp., *Hydrotaea* spp., *Muscina* spp., *Haematobosca* spp., *Haematobia* spp., *Stomoxys* spp., *Fannia* spp., *Glossina* spp., *Lucilia* spp., *Calliphora* spp., *Auchmoramyia* spp., *Cordylobia* spp., *Cochliomyia* spp., *Chrysomyia* spp., *Sarcophaga* spp., *Wohlfartia* spp., *Gasterophilus* spp., *Oedemagena* spp.,

Hypoderma spp., Oestrus spp., Rhinoestrus spp., Melophagus spp., Hippobosca spp..

Z řádu Siphonaptera například Ctenocephalides spp., Echidnophaga spp., Ceratophyllus spp..

Z řádu Metastigmata například Hyalomma spp., Rhipicephalus spp., Boophilus spp., Amblyomma spp., Haemophysalis spp., Dermacentor spp., Ixodes spp., Argas spp., Ornithodoros spp., Otobius spp.;

Z řádu Mesastigmata například Dermanyssus spp., Ornithonyssus spp., Pneumonyssus spp..

Z řádu Prostigmata například Cheyletiella spp., Psorergates spp., Myobia spp., Demodex spp., Neotrombicula spp.;

Z řádu Astigmata například Acarus spp., Myocoptes spp., Psoroptes spp., Chorioptes spp., Otodectes spp., Sarcoptes spp., Notoedres spp., Knemidocoptes spp., Neoknemidocoptes spp., Lytodites spp., Laminosioptes spp..

K endoparasitům patří:

Z řádu Pseudophyllidea například: Diphyl lobothrium spp., Spirometra spp., Schistocephalus spp., Ligula spp., Bothridium spp., Diphlogonoporus spp..

Z řádu Cyclophyllidea například: Mesocestoides spp., Anoplocephala spp., Paranoplocephala spp., Moniezia spp., Thysanosomsa spp., Thysaniezia spp., Avitellina spp., Stilesia spp., Cittotaenia spp., Andyra spp., Bertiella spp., Taenia spp., Echinococcus spp., Hydatigera spp..

Davainea spp., Raillietina spp., Hymenolepis spp.,
Echinolepis spp., Echinocotyle spp., Diorchis spp.,
Dipylidium spp., Joyeuxiella spp., Diplopylidium spp..

Z podtřídy Monogenea například Gyrodactylus spp.,
Dactylogyrus spp., Polystoma spp..

Z podtřídy Digenea například: Diplostomum spp.,
Posthodiplostomum spp., Schistosoma spp., Trichobilharzia
spp., Ornithobilharzia spp., Austroilharzia spp.,
Gigantobilharzia spp., Leucochloridium spp., Brachylaima
spp., Echinostoma spp., Echinoparyphium spp., Echinochasmus
spp., Hypoderaeum spp., Fasciola spp., Fasciolides spp.,
Fasciolopsis spp., Cyclocoelum spp., Typhlocoelum spp.,
Paramphistomum spp., Calicophoron spp., Cotylophoron spp.,
Gigantocotyle spp., Fischoederius spp., Gastrothylacus spp.,
Notocotylus spp., catatropis spp., Plagiorchis spp.,
Prosthogonimus spp., Dicrocoelium spp., Eurytrema spp.,
Troglotrema spp., Paragonimus spp., Collyriclum spp.,
Nanophyetus spp., Opisthorchis spp., Clonorchis spp.,
Metorchis spp., Heterophyes spp., Metagonimus spp..

Z řádu Enoplida například: Trichuris spp., Capillaria spp.,
Trrichomosoides spp., Trichinella spp..

Z řádu Rhabditia například: Micronema spp., Strongyloides spp..

Z řádu Strongylida například: Strongylus spp.,
Triodontophorus spp., Oesophagodontus spp., Trichonema spp.,
Gyalocephalus spp., Cyliodopharynx spp., Poterostomum
spp., Cyclocorcus spp., Cylicostephanus spp.,
Oesophagostomum spp., Chabertia spp., Stephanurus
spp., Ancylostoma spp., Uncinaria spp., Bunostomum

spp., *Globocephalus* spp., *Syngamus* spp., *Cyathostoma* spp.,
Metastrongylus spp., *Dictyocaulus* spp., *Muellerius*
spp., *Protostrongylus* spp., *Neoststrongylus* spp., *Cystocaulus*
spp., *Pneumoststrongylus* spp., *Spicocaulus* spp.,
Elaphoststrongylus spp., *Parelaphoststrongylus* spp., *Crenosoma*
spp., *Paracrenosoma* spp., *Angiostrongylus* spp.,
Aelurostrongylus spp., *filaroides* spp., *Parafilaroides* spp.,
Trichostrongylus spp., *Haemonchus* spp., *Ostertagia* spp.,
Marshallagia spp., *Cooperia* spp., *Nematodirus* spp.,
Hyoststrongylus spp., *Obeliscoides* spp., *Amidostromum* spp.,
Ollulanus spp..

Z řádu *Oxyurida* například: *Oxyuris* spp., *Enterobius* spp.,
Passalurus spp., *Syphacia* spp., *Aspiculuris* spp., *Heterakis*
spp..

Z řádu *Spirurida* například: *Gnathostoma* spp., *Physaloptera*
spp., *Thelazia* spp., *Gongylonema* spp., *Habronema* spp.,
Parabronema spp., *Draschia* spp., *Dracunculus* spp..

Z řádu *Filariida* například: *Stephanofilaria* spp.,
Parafilaria spp., *Setaria* spp., *Loa* spp., *Dirofilaria* spp.,
Litomosoides spp., *Brugia* spp., *Vuchereria* spp., *Onchocerca*
spp.,

Z řádu *Gigantorhynchida* například: *Filicollis* spp.,
Moniliformis spp., *Macracanthorhynchus* spp., *Prosthenorhchs*
spp.,

K užitkovým a chovným zvířatům patří savci, jako jsou
například krávy, koně, ovce, prasata, kozy, velbloudi, vodní
bůvoly, osli, králíci, sobi, kožešinová zvířata, jako jsou
norci, činčily a mývali, ptáci, jako jsou kuřata, husy,
krůty a kachny, sladkovodní a slánovodní ryby, jako jsou

pstruzi, kapři, úhoři, plazi a hmyzt, jako jsou medonosné včely a bourec morušový.

K laboratorním a pokusným zvířatům patří myši, krysy, morčata, zlatí křečci, psi a kočky.

Ke zvířatům, chovaným pro potěšení, patří obzvláště psi a kočky.

Aplikace se může provádět jak profylakticky, tak také terapeuticky.

Aplikace účinných látek může probíhat přímo nebo ve formě vhodných přípravků enterálně, parenterálně, dermálně, nasálně, zpracováním okolí nebo pomocí tvarových tělísek obsahujících účinnou látku, jako jsou například proužky, destičky, pásy, obojky, ušní známky, měřicí pásy a značkovací zařízení.

Enterální aplikace účinné látky probíhá například orálně ve formě prášků, čípků, tablet, kapslí, past, nápojů, granulátů, drenů, bolí, medikovaného krmiva nebo pitné vody. Dermální aplikace se provádí formou máčení, postřikování (spreje), lázní, omývání, nalévání (pour-on a spot-on) a pudrování. Parenterální aplikace se provádí například formou injekcí (intramuskulárně, subkutánně, intravenosně, intraperitoneálně) nebo také formou implantátů.

Jako vhodné přípravky je možno uvést :

Roztoky, jako jsou injekční roztoky, orální roztoky, koncentráty pro orální aplikaci po zředění, roztoky pro upo-

třebení na kůži nebo do tělních dutin, nalévací přípravky
aMželé ;

emulze a suspense pro orální nebo deremální aplikaci, jakož
i pro injekce polppevné přípravky ;

přípravky u nichž je účinná látka zapracována do masťového
základu nebo do emulsního základu olej ve vodě nebo voda v
oleji ;

pevné přípravky, jako jsou prášky, premixy nebo koncentráty,
granuláty, pelety, tablety, boli a kapsle ;

aerosoly a inhaláty, tvarová tělesa, obsahující účinnou
látku.

Injekční roztoky se aplikují intravenosně, intramuskulárně a subkutánně.

Injekční roztoky se vyrobí tak, že se účinná látka rozpustí ve vhodném rozpouštědle a přidají se eventuelní přísady, jako jsou látky zprostředkující rozpouštění, kyseliny, base, pufovací soli, antioxidanty a konzervační prostředky. Tyto roztoky se sterilně filtrují a rozplňují se do obalů.

Jako rozpouštědla je možno uvést fyziologicky přijatelná rozpouštědla, jako je například voda, alkoholy, jako je ethylalkohol, butylalkohol, benzylalkohol a glycerol, uhlovodíky, propylenglykol, polyethylenglykoly, N-methylpyrrolidon, jakož i jejich směsi.

Účinné látky se dají popřípadě také rozpustit ve fy-

ziologicky přijatelných rostlinných nebo syntetických olejích, které jsou vhodné pro injekce.

Jako látky zprostředkující rozpouštění je možno uvést rozpouštědla, která podporují rozpuštění účinné látky ve hlavním rozpouštědle nebo potlačují jeho vysrážení. Jako příklady je možno jmenovat polyvinylpyrrolidon, polyoxyethylovaný ricinový olej nebo polyoxyethylovanný sorbitanester.

Jako konservační činidla je možno uvést benzylalkohol, trichlorbutanol, estery kyseliny p-hydroxybenzoové a n-butilalkohol.

Orální roztoky se aplikují přímo. Koncentráty se orálně aplikují po svém předchozím naředění na aplikační koncentraci. Orální roztoky a koncentráty se vyrobí stejně, jako je uvedeno u injekčních roztoků, přičemž však není třeba dodržovat sterilní práci.

Roztoky pro aplikaci na kůži se nakapávají, natírají, roztírají nebo nastříkují. Tyto roztoky se vyrobí stejně, jako je uvedeno u injekčních roztoků.

Může být také výhodné, přidávat při výrobě zahušťovací činidla. Jako příklady zahušťovacích činidel je možno uvést anorganická zahušťovací činidla, jako jsou bentonity, koloidní kyselina křemičitá nebo monostearát hlinitý, nebo organická zahušťovací činidla, jako jsou deriváty celulosy, polyvinylalkoholy a jejich kopolymery, akryláty a metakryláty.

Gely se nanáší nebo roztírají na kůži, nebo se vnášejí do tělních dutin. Gely se vyrobí tak, že se do

roztoků, vyrobených stejným postupem jako injekční roztoky, přidá tolik zahušťovacího činidla, že vznikne čirá hmota o konsistenci podobné masti. Jako zahušťovací činidla se použijí zahušťovadla uvedená výše.

Nalévací přípravky se nalijí nebo nastříkají na ohraňčené oblasti kůže, přičemž účinná látka proniká kůží a systemicky působí.

Nalévací přípravky se vyrobí tak, že se účinná látka rozpustí, suspenduje nebo emulguje ve vhodném rozpouštědle nebo směsi rozpouštědel, která jsou přijatelná pro pokožku. Popřípadě se mohou přidat další pomocné látky, jako jsou barviva, látky podporující resorpci, antioxidanty, ochranné látky proti působení světla nebo činidla pro zlepšení přilnavosti.

Jako rozpouštědla je možno uvést :
vodu, alkanoly, glykoly, polyethylenglykoly, polypropylen-glykoly, glycerol, aromatické alkoholy, jako je například benzylalkohol, fenylethanol a fenoxylethanol, estery, jako je například ethylester kyseliny octové, butylester kyseliny octové nebo benzylester kyseliny benzoové, ethery, jako jsou alkylenglykolalkylethery, například dipropylanglykolmono-methylether a diethylenglykolmonobutylether, ketony, jako je například aceton a methylethylketon, aromatické a/nebo alifatické uhlovodíky, rostlinné nebo syntetické oleje, dimethylformamid, dimethylacetamid, N-methylpyrrolidon a 2,2-dimethyl-4-oxy-methylen-1,3-dioxolan.

Jako barviva je možno použít všech barviv, která jsou přípustná pro živočichy a která mohou být rozpuštěna nebo suspendována.

Jako látky podporující resorpci je možno uvést například dimethylsulfoxid, oleje, jako je isopropylmyristát, di-propylenglykolpelargonát, silikonové oleje, estery mastných kyselin, triglyceridy a mastné alkoholy.

Jako antioxidanty je možno uvést sulfity a metabisulfity, jako je například metabisulfit draselný, dále kyselinu askorbovou, butylhydroxytoluen, butylhydroxyanisol a tokoferol.

Jako prostředek pro ochranu proti působení světla je možno například uvést kyselinu novantisolovou.

Prostředky pro zlepšení přilnavosti jsou například deriváty celulosy, deriváty škrobu, polyakryláty a přírodní polymery, jako jsou algináty a želatina.

Emulze se mohou aplikovat orálně, dermálně nebo jako injekční roztoky.

Emulze jsou buď typu voda v oleji nebo typu olej ve vodě.

Uvedené emulze se vyrobí tak, že se účinná látka rozpustí buď v hydrofobní fázi nebo v hydrofilní fázi a tato se homogenisuje s rozpouštědlem druhé fáze za pomoci vhodných emulgátorů a popřípadě dalších pomocných látek, jako jsou barviva, látky podporující resorpci, konzervační látky, antioxidanty, ochranné látky proti působení světla a látky zvyšující viskozitu.

Jako hydrofobní fáze (oleje) je možno uvést :

Parafinové oleje, silikonové oleje, přírodní rostlinné oleje, jako je například sezamový olej, mandlový olej a ricinový olej, syntetické glyceridy, jako je například biglycerid kyseliny kapryl/kaprinové, směs triglyceridů s rostlinnými mastnými kyselinami o délce řetězce C_8 až C_{12} nebo s jinými speciálně zvolenými přírodními mastnými kyselinami, směsi parciálních glyceridů nasycených nebo nenasycených, eventuálně také hydroxylové skupiny obsahujících mastných kyselin a monoglyceridy a diglyceridy mastných kyselin C_8/C_{10} .

Dále je možno uvést estery mastných kyselin, jako je například ethylstearát, di-n-butyryl-adipát, hexylester kyseliny laurové, dipropylen-glykolpelargonát, estery rozvětvených mastných kyselin se střední délkou řetězce s nasycenými mastnými alkoholy o délce řetězce C_{16} - C_{18} , isopropylmyristát, isopropylpalmitát, estery kyseliny kapryl/kaprinové s nasycenými mastnými alkoholy o délce řetězce C_{12} - C_{18} , isopropylstearát, oleylester kyseliny olejové, decylester kyseliny olejové, ethyloleát, ethylester kyseliny mléčné, voskovité estery mastných kyselin, dibutylftalát, diisopropylester kyseliny adipové, směsi posledně jmenovaných esterů a podobně.

Rovněž je možno uvést mastné alkoholy, jako je například isotridecylalkohol, 2-oktyldodekanol, cetylstearylalkohol a oleylalkohol.

Nakonec je možno ještě uvést mastné kyseliny, jako je například kyselina olejová a její směsi.

Jako hydrofilní fázi je možno uvést :

Vudu, alkoholy, jako je například propylenglykol, glycerol, sorbitol a jejich směsi

Jako emulgátory mohou sloužit :

Neionogenní tensidy, jako je například polyoxyethylovaný ricinový olej, polyoxyethylovaný sorbitan-monooleát, sorbitanmonostearát, glycerolmonostearát, polyoxyethylstearát a alkylfenolpolyglykoethery ;

ampholytické tensidy, jako je například di-Na-lauryl- β -imidipropionát nebo lecitin ;

anionaktivní tensidy, jako je například natriumlaurylsulfát, sulfáty etherů mastných alkoholů a monoethanolaminová sůl esteru kyseliny mono/dialkylpolyglykoether-ortthofosforečné ;

kationaktivní tensidy, jako je například cetyltrimethylamoniumpchlorid.

Jako další pomocné látky je možno jmenovat látky zvyšující viskozitu a stabilisující emulsi, jako je například karboxymethylcelulosa, methylcelulosa a jiné deriváty celulosy a škrobu, polyakryláty, algináty, želatinu, arabskou gumu, polyvinylpyrrolidon, polyvinylalkohol, kopolymery methylvinyletheru a anhydridu kyseliny maleinové, polyethylenglykoly, vosky, koloidní kyselina křemičitá nebo směsi uvedených látek.

Suspense je možno aplikovat orálně, dermálně nebo jako injekce. Vyrobí se tak, že se účinná látka suspenduje v

nosné kapalně, popřípadě za přídavku dalších pomocných látek, jako jsou například smáčedla, barviva, látky podporující resorpci, konzervační látky, antioxidanty a ochranné látky proti působení světla.

Jako nosné kapaliny je možno uvést všechna homogenní rozpouštědla a směsi rozpouštědel.

Jako smáčedla (dispergační činidla) je možno uvést již výše jmenované tensidy.

Další použitelné pomocné látky byly již uvedeny výše.

Polopevné přípravky se mohou aplikovat orálně nebo dermálně. Liší se od výše popsanych suspensí a emulsí pouze svojí vyšší viskositou.

Pro výrobu pevných přípravků se účinná látka smísí s vhodným nosným materiálem, popřípadě za přídavku pomocných látek a tato směs se převede na požadovanou formu.

Jako nosné látky je možno jmenovat všechny fyziologicky přijatelné pevné inertní látky. Jako takové slouží anorganické a organické látky. Anorganické látky jsou například chlorid sodný, uhličitany, jako je uhličitán vápenatý, hydrogenuhličitany, oxidy hliníku, kyseliny křemičité, jílové minerály, srážený nebo koloidní oxid křemičitý a fosforečnany.

Jako organické látky je možno jmenovat například cukry, celulosu, živné látky a krmiva, jako je práškové mléko, masová moučka, obilné mouky a šroty a škroby.

Jako pomocné látky je možno uvést konservační látky, antioxidanty a barviva, které byly již uváděny výše.

Dalšími vhodnými pomocnými látkami jsou mazadla a maziva, jako je například stearát hořečnatý, kyselina stearová, mastek a bentonit, látky podporující rozpadání, jako jsou například škroby nebo příčně zesítený polyvinylpyrolidon, pojiva, jako jsou například škroby, želatina nebo lineární polyvinylpyrolidon, jakož i za sucha působící pojiva, jako je například mikrokrytalická celulóza.

Předložený vynález se týká tedy také sloučenin obecného vzorce I pro použití jako ektoparasiticide a endoparasiticide, jakož i použití sloučenin obecného vzorce I pro výrobu prostředků pro potírání ektoparasitů a endoparasitů.

Účinné látky se mohou v přípravcích vyskytovat také ve směsi se synergicky působícími látkami nebo s jinými účinnými látkami, které působí proti patogenním endoparasitům. Takovéto účinné látky jsou například L-2,3,5,6-tetrahydro-6-fenyl-imidazothiazol, benzimidazolkarbamát, Praziquantel, Pyrantel nebo Febantel.

Přípravky určené pro použití obsahují účinnou látku v koncentraci 10 ppm až 20 % hmotnostních, výhodně 0,1 až 10 % hmotnostních.

Přípravky, které se před aplikací ředí, obsahují účinnou látku v koncentraci 0,5 až 90 % hmotnostních, výhodně 5 až 50 % hmotnostních.

Všeobecně se ukázalo jako výhodné pro dosažení účin-

ných výsledků aplikovat množství asi 1 mg až asi 100 mg účinné látky na jeden kilogram tělesné hmotnosti za jeden den.

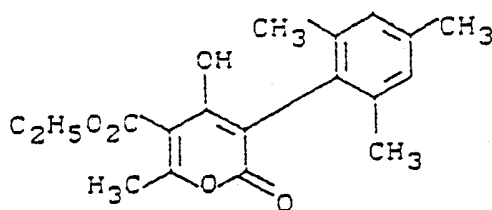
Sloučeniny podle předloženého vynálezu se výhodně používají jako arthropodicydy a herbicidy v oblasti ochrany rostlin, domácnosti a hygieny, jakož i při ochraně zásob, obzvláště výhodně při ochraně rostlin.

Příklady provedení vynálezu

V následujících příkladech provedení je blíže objasněna výroba sloučenin obecného vzorce I podle předloženého vynálezu ve výrobních příkladech a doložena biologická účinnost v biologických příkladech.

Pokud není uvedeno výslovně jinak, představují procentické údaje % hmotnostní.

P ř í k l a d 1



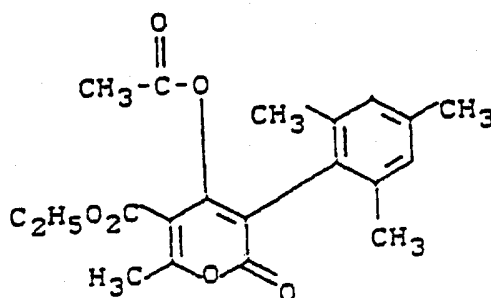
Ke 22,2 g (0,1 mol) chlorkarbonyl-2,4,6-trimethyl-fenyl-ketenu ve 200 ml absolutního toluenu se přikape při

teplotě 20 °C a za zamezení přístupu vlhkosti 13,0 g (0,1 mol) ethylesteru kyseliny acetové a reakční směs se potom zahřívá po dobu 3 hodin pod zpětným chladičem. Toluénová fáze se potom promyje vodou, rozpouštědlo se oddestiluje a získaný zbytek se chromatografuje na 1 kg silikagelu (35 až 70 μ m) za použití směsi toluen/aceton (20 : 1 objemově). Získá se takto 17,9 g 5-ethoxy-4-hydroxy-6-methyl-3-(2,4,6-trimethyl-fenyl)-pyronu.

Výtěžek : 57 % teorie

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 , TMS interní standard) : δ = 2,23 (s, 3H), 2,70 (s, 3H), 6,90 (s, 2H) a 11,75 (s, 1H) .

P ř í k l a d 2



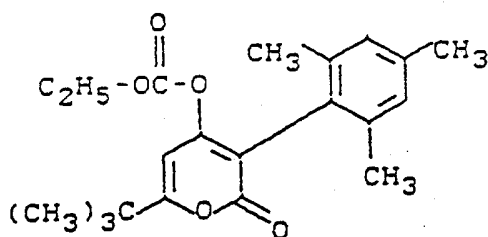
Ke 3,2 g (10 mmol) 5-ethoxykarbonyl-4-hydroxy-6-methyl-3-(2,4,6-trimethylfenyl)-pyronu v 50 ml ethylesteru kyseliny octové se přikape při teplotě 0 °C 1,0 g (10 mmol) triethylaminu a potom 0,8 g (10 mmol) acetylchloridu. Reakční směs se míchá po dobu 20 hodin při teplotě 20 °C , přefiltruje se, organická fáze se promyje polokoncentrovaným roztokem chloridu sodného, vysuší se pomocí bezvodého síranu sodného a rozpouštědlo se ve vakuu odpaří. Získaný zbytek se chromatografuje na silikagelu (35 - 70 μ m) za pomoci směsi toluen/aceton (40 : 1

objemově). Získá se takto 2,9 g 4-acetoxy-5-ethoxykarbonyl-6-methyl-3-(2,4,6-trimethylfenyl)-pyronu.

Výtěžek : 81 % teorie

Teplota tání : 107 - 109 °C .

P ř í k l a d 3



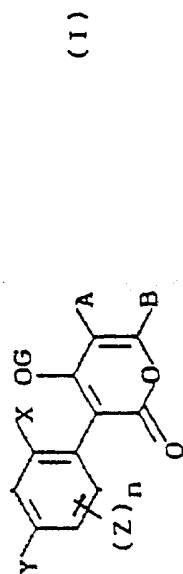
Ke 5,7 g (20 mmol) 4-hydroxy-6-terc.-butyl-3-(2,4,6-trimethyl-fenyl)-pyronu v 50 ml ethylesteru kyseliny octové se přikape 2,0 g (20 mmol) triethylaminu a potom 2,2 g (20 mmol) ethylesteru kyseliny chlormravenčí ve 20 ml ethylesteru kyseliny octové při teplotě 0 °C . Reakční směs se míchá po dobu 20 hodin při teplotě 20 °C , potom se přefiltruje, organická fáze se promyje polokoncentrovaným roztokem chloridu sodného, vysuší se pomocí bezvodého síranu sodného a rozpouštědlo se ve vakuu odpaří. Získaný zbytek se chromatografuje na silikagelu (35 - 70 μm) za pomoci směsi toluen/aceton (20 : 1 objemově). Získá se takto 6,0 g 4-ethoxykarbonyloxy-6-terc.-butyl-3-(2,4,6-trimethylfenyl)-pyronu.

Výtěžek : 84 % teorie

Teplota tání : 92 - 94 °C .

Analogickým způsobem jako je uvedeno v příkladech výroby a podle obecných údajů, uvedených v popisné části, se získají deriváty 3-aryl-pyronu obecného vzorce I, uvedené podle vzorců v následující tabulce 1.

Tabulka 1

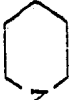


Př.	X	Y	(Z) _n	A	B	G	t.t. (°C)	¹ H-NMR(CDCl ₃)[ppm], δ:
4	CH ₃	H	6-CH ₃	CO ₂ C ₂ H ₅	CH ₃	H	147-149	
5	CH ₃	CH ₃	6-CH ₃	CO ₂ H	CH ₃	H	240-242	
6	CH ₃	CH ₃	6-CH ₃	CO ₂ -i-C ₄ H ₉	CH ₃	H	1,04 (d, J=3 Hz, 6H) 4,18 (d, J=3 Hz, 2H) 6,99 (s, 2H)	
7	CH ₃	CH ₃	6-CH ₃	CO ₂ CH ₂ CH=CH ₂	CH ₃	H	2,70 (s, 3H), 4,84 (d, J=3 Hz), 6,90 (s, 2H) u. 11,65 (s, 1H)	
8	CH ₃	CH ₃	6-CH ₃	CO ₂ CH ₂ C ₆ H ₅	CH ₃	H	2,48 (s, 3H), 5,43 (s, 2H), 6,88 (s, 2H) u. 11,65 (s, 1H) (D-DMF)	
9	CH ₃	CH ₃	6-CH ₃	CO ₂ CH ₂ - 	CH ₃	H	2,73 (s, 3H), 3,73-4,43 (m, 4H), 6,85 (s, 2H)	

Tabulka 1 (pokračování)

Př.	X	Y	(Z) _n	A	B	G	t.t. (°C) ¹ H-NMR(CDC1 ₃)[ppm], δ:
10	CH ₃	CH ₃	6-CH ₃	CN	C ₆ H ₅	H	244-246
11	CH ₃	CH ₃	6-CH ₃	CN	C(CH ₃) ₃	H	144-146
12	CH ₃	CH ₃	6-CH ₃	CN	3,4-(CH ₃ O) ₂ -C ₆ H ₃	H	250-253
13	CH ₃	CH ₃	6-CH ₃	CN	2-Cl-C ₆ H ₄	H	272-274
14	CH ₃	CH ₃	6-CH ₃	CO ₂ C ₂ H ₅	2-F-C ₆ H ₄	H	181-183
15	CH ₃	CH ₃	6-CH ₃	CO ₂ C ₂ H ₅	4-NO ₂ -C ₆ H ₄	H	194-197
16	CH ₃	CH ₃	6-CH ₃	CO ₂ C ₂ H ₅	CH(CH ₃) ₂	H	1,20 (d, J=3Hz, 6H) 3,93 (q, J=3Hz, 1H) 6,91 (s, 2H)
17	CH ₃	CH ₃	6-CH ₃	CO ₂ C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	H	127-130
18	CH ₃	CH ₃	6-CH ₃	CON  O CH ₃		H	2,10 (s, 6H), 2,28 (s, 3H), 2,31 (s, 3H) 3,45-3,80 (m, 3H)

Tabulka 1 (pokračování)

Př.	X	Y	(Z) _n	A	B	G	t _{1H} ^t . (°C)	t _{1H} -NMR(CDCl ₃) [ppm], δ:
19	CH ₃	CH ₃	6-CH ₃	CONH-3-Br-C ₆ H ₄	CH ₃	H	120-122	
20	CH ₃	CH ₃	6-CH ₃	CON- 	CH ₃	H	193-195	
21	CH ₃	CH ₃	6-CH ₃	SO ₂ C ₆ H ₅	CH ₃	H	2,10 (s, 6H), 2,29 (s, 3H), 2,60 (s, 3H)	7,12-7,92 (m, 5H)
22	CH ₃	CH ₃	6-CH ₃	SO ₂ CH ₃	CH ₃	H	2,11 (s, 6H), 2,29 (s, 3H), 2,74 (s, 3H)	3,25 (s, 3H)
23	CH ₃	CH ₃	6-CH ₃	SO ₂ -4-Cl-C ₆ H ₄	CH ₃	H	199-202	
24	CH ₃	CH ₃	6-CH ₃	P(O)(OCH ₃) ₂	CH ₃	H	149-152	
25	CH ₃	CH ₃	6-CH ₃	COCH ₃	CH ₃	H	156-158	
26	CH ₃	CH ₃	6-CH ₃	COC ₆ H ₅	CH ₃	H	148-150	
27	CH ₃	CH ₃	6-CH ₃	COCH ₃	C ₆ H ₅	H	125-127	

T a b u l k a 1 (pokračování)

Př.	X	Y	(Z) _n	A	B	G	t.t. (°C) ¹ H-NMR(CDCl ₃)[ppm], δ:
28	CH ₃	CH ₃	6-CH ₃	COCF ₃	CH ₃	H	164-167
29	CH ₃	CH ₃	6-CH ₃	COCH ₃	CHCl ₂ *)	H	2,12 (s, 6H), 3,60 (s, 2H), 6,83 (s, 2H)
30	CH ₃	CH ₃	6-CH ₃	COCHCl ₂	CH ₃		6,93 (s, 2H), směr
31	CH ₃	CH ₃	6-CH ₃	H	C(CH ₃) ₃	H	261-263
32	CH ₃	CH ₃	6-CH ₃	CH ₃	CH ₃	H	160-162
33	CH ₃	CH ₃	6-CH ₃	CH(CH ₃) ₂	CH ₃	H	135-137
34	CH ₃	CH ₃	6-CH ₃	H	CH ₃	H	261-263
35	CH ₃	CH ₃	6-CH ₃	C ₂ H ₅	CH ₃	H	1,11 (t, J=3Hz, 3H) 2,44 (q, J=3Hz, 2H) 6,95 (s, 2H)
36	CH ₃	CH ₃	6-CH ₃	C ₈ H ₁₇	CH ₃	H	0,88 (t, J=3,2Hz, 3H) 1,21-1,62 (m, 12H) 2,40 (t, J=2,4Hz, 2H) 6,80 (s, 2H)

*) směr

Tabulka 1 (pokračování)

Př.	X	Y	(Z) _n	A	B	G	t.t. (°C)	¹ H-NMR(CDCl ₃) (ppm), δ:
37	CH ₃	CH ₃	6-CH ₃	C ₃ H ₇	C ₂ H ₅	H	1,00 (t, J=3,7Hz, 3H) 1,13 (t, J=3,7Hz, 3H) 2,10 (s, 6H), 2,29 (s, 3H)	
38	CH ₃	CH ₃	6-CH ₃	CH ₃ CH-C ₂ H ₅	C ₂ H ₅ *)	H	0,80-1,05 (m), 1,20-1,38 (m), 1,98 (s, 3H) (směs)	
39	CH ₃	CH ₃	6-CH ₃	CH ₃	CH ₂ CHC ₂ H ₅ CH ₃	H		
40	CH ₃	CH ₃	6-CH ₃	CH(CH ₃) ₂	CH ₂ CH(CH ₂) ₃	H	1,00 (d, J=3Hz, 6H) 1,29 (d, J=3Hz, 6H) 2,50 (d, J=3Hz, 2H) 3,00 (Quintet, J=3Hz, 1H)	
41	CH ₃	CH ₃	6-CH ₃	H	CH ₂ OCOCH ₃	H	185-186	
42	CH ₃	CH ₃	6-CH ₃	4-Cl-C ₆ H ₄ -S-	CH ₃	H	2,10 (s, 6H), 2,28 (s, 3H) 2,56 (s, 3H), 7,08 and 7,23 (AB-System, J=4,5Hz, 4H)	

*) směs

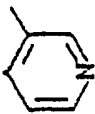
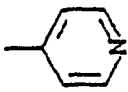
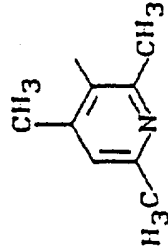
T a b u l k a 1 (pokračování)

Př.	X	Y	(Z) _n	A	B	G	t.t. (°C) 1H-NMR(CDCl ₃)(ppm), δ:
43	CH ₃	CH ₃	6-CH ₃	CH ₂ C ₆ H ₅	CH ₃	H	2,07 (s, 6H), 2,25 (s, 3H), 2,29 (s, 3H) 3,80 (s, 2H)
44	CH ₃	CH ₃	6-CH ₃	C ₂ H ₅	CH ₃	H	155-157
45	CH ₃	CH ₃	6-CH ₃	H	CH=CH-C ₆ H ₅	H	Fp. 122-124
46	CH ₃	CH ₃	6-CH ₃	H	C ₆ H ₅	H	306-308
47	CH ₃	CH ₃	6-CH ₃	H	2-Cl-C ₆ H ₄	H	245-247
48	CH ₃	CH ₃	6-CH ₃	H	2-CH ₃ -4-CH ₃ -C ₆ H ₃	H	238-240
49	CH ₃	CH ₃	6-CH ₃	H	3-CF ₃ -C ₆ H ₄	H	258-260
50	CH ₃	CH ₃	6-CH ₃	H	3-NO ₂ -4-CH ₃ -C ₆ H ₃	H	228-230
51	CH ₃	CH ₃	6-CH ₃	H	2-F-C ₆ H ₄	H	246-248
52	CH ₃	CH ₃	6-CH ₃	H	4-F-C ₆ H ₄	H	>300
53	CH ₃	CH ₃	6-CH ₃	H	4-Cl-C ₆ H ₄	H	>300
54	CH ₃	CH ₃	6-CH ₃	H	2-CH ₃ -4-CH ₃ -5-CH ₃ -C ₆ H ₂	H	239-241
55	CH ₃	CH ₃	6-CH ₃	C ₂ H ₅	C ₆ H ₅	H	193-195

Tabulka 1 (pokračování)

Př.	X	Y	(Z) _n	A	B	G	t.t. (°C) ¹ H-NMR (CDCl ₃) [ppm], δ:
56	CH ₃	CH ₃	6-CH ₃	H		H	254-255
57	CH ₃	CH ₃	6-CH ₃	H		H	264-266
58	CH ₃	CH ₃	6-CH ₃	H		H	292-294
59	CH ₃	CH ₃	6-CH ₃	H		H	321-324
60	CH ₃	CH ₃	6-CH ₃	H		H	299-301
61	CH ₃	CH ₃	6-CH ₃	H		H	310-312
62	CH ₃	CH ₃	6-CH ₃	H		H	246

Tabulka 1 (pokračování)

Př.	X	Y	(Z) _n	A	B	G	t.t. (°C) ¹ H-NMR (CDCl ₃) (ppm), δ:
63	CH ₃	CH ₃	6-CH ₃	H		H	266-268
64	CH ₃	CH ₃	6-CH ₃	H		H	268-270
65	CH ₃	CH ₃	6-CH ₃	H		H	292-294
66	CH ₃	CH ₃	6-CH ₃	C ₆ H ₅	C ₂ H ₅ *	H	1,24 (t, J=3,8 Hz, 3H) 3,90 (s, 2H), 6,78 (s, 2H), směs
67	CH ₃	CH ₃	6-CH ₃	CH ₃	CH ₂ C ₆ H ₅	H	174-176
68	CH ₃	CH ₃	6-CH ₃	CH ₃	-(CH ₂) ₄ -	H	241-243
69	CH ₃	CH ₃	6-CH ₃	CH ₃	-(CH ₂) ₃ -	H	204-206
70	CH ₃	CH ₃	6-CH ₃	CH ₃	-S-(CH ₂) ₂ -	H	193-195
71	CH ₃	CH ₃	6-CH ₃	CH ₃	-CH ₂ O(CH ₂) ₂ -	H	

*) směs

Tabulka 1 (pokračování)

Př.	X	Y	(Z) _n	A	B	G	t.t. (°C)	¹ H-NMR (CDCl ₃) [ppm], δ:
72	CH ₃	CH ₃	6-CH ₃		-CH ₂ S(CH ₂) ₂ -	H	204-206	
73	CH ₃	CH ₃	6-CH ₃		-CO ₂ -CH ₂ - CH ₃	H	228-230	
74	CH ₃	CH ₃	6-CH ₃		-CH-(CH ₂) ₃ - CH ₃	H	1,13 (d, J=3Hz, 3H) 1,20 (d, J=3Hz, 3H) 2,11 (s, 6H), 2,13 (s, 6H); směr	
75	CH ₃	CH ₃	6-CH ₃		-(CH ₂) ₂ -CH-CH ₂ - CH ₃	H		
76	CH ₃	CH ₃	6-CH ₃		-CH ₂ -CH-(CH ₂) ₂ - CH ₃	H	1,10 (d, J=3,7Hz, 3H) 2,10 (s, 6H), 2,28 (s, 3H)	
77	CH ₃	CH ₃	6-CH ₃		-(CH ₂) ₅ -	H	147-149	
78	CH ₃	CH ₃	6-CH ₃	CO ₂ C ₂ H ₅	CH ₃	COC(CH ₃) ₃	124-127	
79	CH ₃	CH ₃	6-CH ₃	CO ₂ C ₂ H ₅	CH ₃	COC(CH ₃) ₂	118-120	
80	CH ₃	CH ₃	6-CH ₃	CH ₃	CH ₃	COC(CH ₃) ₃	159-162	
81	CH ₃	CH ₃	6-CH ₃	CH ₃	CH ₃	COCH ₃	116-118	

T a b u l k a 1 (pokračování)

Př.	X	Y	(Z) _n	A	B	G	t, t. (°C) 1H-NMR(CDCl ₃)[ppm], δ:
82	CH ₃	CH ₃	6-CH ₃	CH ₃	CH ₃	COCH(CH ₃) ₂	112-114
83	CH ₃	CH ₃	6-CH ₃	H	C(CH ₃) ₃	COC(CH ₃) ₃	126-128
84	CH ₃	CH ₃	6-CH ₃	H	C(CH ₃) ₃	COCH ₃	1,83 (s, 9H), 2,28 (s, 3H), 6,03 (s, 1H), 6,85 (s, 2H)
85	CH ₃	CH ₃	6-CH ₃	H	C(CH ₃) ₃	COCH(CH ₃) ₂	182-185
86	CH ₃	CH ₃	6-CH ₃	CH(CH ₃) ₂	CH ₃	COCCH ₃	1,23 (d, J=3,2Hz, 6H), 1,78 (s, 3H), 2,38 (s, 3H), 2,93 (Quintet, J=3,2Hz, 1H)
87	CH ₃	CH ₃	6-CH ₃	CO ₂ C ₂ H ₅	CH ₃	CO ₂ C ₂ H ₅	96-99
88	CH ₃	CH ₃	6-CH ₃	CH ₃	CH ₃	CO ₂ C ₂ H ₅	1,08 (t, J=2,8Hz, 2H), 1,95 (s, 3H), 2,10 (s, 3H), 2,33 (s, 3H)
89	CH ₃	CH ₃	6-CH ₃	H	C(CH ₃) ₂ CH ₂ F	H	211-214
90	CH ₃	CH ₃	6-CH ₃	H	C(CH ₃) ₂ CH ₂ OC ₂ H ₅	H	167-168

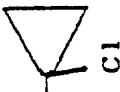
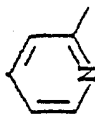
Tabulka 1 (pokračování)

Př.	X	Y	(Z) _n	A	B	G	t.t., (°C) ¹ H-NMR(CDCl ₃)(ppm), δ:
91	CH ₃	CH ₃	6-CH ₃	H	C(CH ₃) ₂ CH ₂ CN	H	152-155
92	CH ₃	CH ₃	6-CH ₃	H	C(CH ₃) ₂ CN	H	243-246
93	CH ₃	CH ₃	6-CH ₃	H	C(CH ₃) ₂ CHCl ₂	H	187-190
94	CH ₃	CH ₃	6-CH ₃	H	C(CH ₃) ₂ SC ₂ H ₅	H	171-173
95	CH ₃	CH ₃	6-CH ₃	H	C(CH ₃) ₂ (CH ₂) ₂ CN	H	234-236
96	CH ₃	CH ₃	6-CH ₃	H	C(CH ₃) ₂ OCOCCH ₃	H	172-175
97	CH ₃	CH ₃	6-CH ₃	H		H	293-295
98	CH ₃	CH ₃	6-CH ₃	H	3-CH ₃ O-C ₆ H ₄	H	207-208
99	CH ₃	CH ₃	6-CH ₃	H	4-CH ₃ O-C ₆ H ₄	H	267
100	CH ₃	CH ₃	6-CH ₃	H	2,4-Cl ₂ -C ₆ H ₃	H	268-270
101	CH ₃	CH ₃	6-CH ₃	H	2,4,5-Cl ₃ -C ₆ H ₂	H	95-97
102	CH ₃	CH ₃	6-CH ₃	H	2,3,4-Cl ₃ -C ₆ H ₂	H	269-271

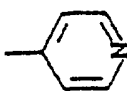
T a b u l k a 1 (pokračování)

Př.	X	Y	(Z) _n	A	B	G	t.t. (°C) ¹ H-NMR (CDCl ₃) (ppm), δ:
103	CH ₃	CH ₃	6-CH ₃	H	C ₆ F ₅	H	241
104	CH ₃	CH ₃	6-CH ₃	H	2,4-Cl ₂ -C ₆ H ₃	H	234-237
105	CH ₃	CH ₃	6-CH ₃	H	2,4-Br ₂ -C ₆ H ₃	H	300
106	CH ₃	CH ₃	6-CH ₃	CH ₃	C ₆ H ₅	H	183
107	CH ₃	CH ₃	6-CH ₃	CH(CH ₃) ₂	C ₆ H ₅	H	166-169
108	CH ₃	CH ₃	6-CH ₃	C ₃ H ₇	C ₆ H ₅	H	183-185
109	CH ₃	CH ₃	6-CH ₃	CH ₃	4-F-C ₆ H ₉	H	242-244
110	CH ₃	CH ₃	6-CH ₃	CH ₃	4-Cl-C ₆ H ₉	H	207-208
111	CH ₃	CH ₃	6-CH ₃	CH ₃	3,4-Cl ₂ -C ₆ H ₃	H	230-233
112	CH ₃	CH ₃	6-CH ₃	H	4-CF ₃ -C ₆ H ₄	H	318-320
113	CH ₃	CH ₃	6-CH ₃	H	4-CF ₃ O-C ₆ H ₄	H	269-271
114	CH ₃	CH ₃	6-CH ₃	H	4-Cl-2-F-C ₆ H ₉	H	293-295
115	CH ₃	CH ₃	6-CH ₃	H	2,6-F ₂ -C ₂ H ₃	H	248-250

Tabulka 1 (pokračování)

Př.	X	Y	(Z) _n	A	B	G	t.t. (°C) ¹ H-NMR(CDCl ₃)(ppm), δ:
116	CH ₃	CH ₃	6-CH ₃	C ₆ H ₅	CH ₃ :	H	97-100
117	CH ₃	CH ₃	6-CH ₃	C ₆ H ₅	CH(CH ₃) ₂	H	143-145
118	CH ₃	CH ₃	6-CH ₃	2-Cl-C ₆ H ₄	C(CH ₃)(CH ₂ F) ₂	H	259-261
119	CH ₃	CH ₃	6-CH ₃	2-F-C ₆ H ₉	C(CH ₃)(CH ₂ F) ₂	H	210
120	CH ₃	CH ₃	6-CH ₃	2-Cl-C ₆ H ₉	2-Cl-C ₆ H ₉	H	140
121	CH ₃	CH ₃	6-CH ₃	2,4-Cl ₂ -C ₅ H ₃	C(CH ₃) ₃	H	214
122	CH ₃	CH ₃	6-CH ₃	2-Cl-C ₆ H ₉	C(CH ₃) ₃	H	167-170
123	CH ₃	CH ₃	6-CH ₃	F	C ₆ H ₅	H	272-273
124	CH ₃	CH ₃	6-CH ₃	Cl		H	100-103
125	CH ₃	CH ₃	6-CH ₃	Cl	C(CH ₃) ₂ CH(CH ₃) ₂	H	214-127
126	CH ₃	CH ₃	6-CH ₃	F	C(CH ₃) ₃	H	192-194
127	CH ₃	CH ₃	6-CH ₃	Cl	C(CH ₃) ₃	H	197-200
128	CH ₃	CH ₃	6-CH ₃	H		H	298-300

Tabulka 1 (pokračování)

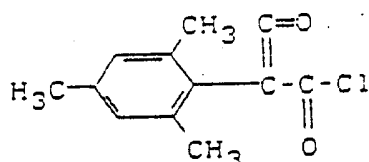
Př.	X	Y	(Z) _n	A	B	G	t.t. (°C) ¹ H-NMR(CDCl ₃)(ppm), δ:
129	CH ₃	CH ₃	6-CH ₃	CH ₃		H	317-319
130	CH ₃	CH ₃	6-CH ₃	-C(CH ₃) ₂ OC(CH ₃) ₂ -		H	197-198
131	CH ₃	CH ₃	6-CH ₃	-(CH ₂) ₃ CH[C(CH ₃) ₃]-		H	172-175
132	CH ₃	CH ₂	6-CH ₃	-CH ₂ CH[C(CH ₃) ₃](CH ₂) ₂ -		H	188-191
133	CH ₃	CH ₃	6-CH ₃	-(CH ₂) ₂ CH(CF ₃)CH ₂ -		H	96
134	CH ₃	CH ₃	6-CH ₃	-(CH ₂) ₃ CH(OCH ₃)-		H	66-69
135	CH ₃	CH ₃	6-CH ₃	-(CH ₂) ₃ CHCl-		H	156-158
136	CH ₃	CH ₃	6-CH ₃	-CH ₂ CH(OCH ₃)(CH ₂) ₂		H	182
137	CH ₃	H	H	CH ₃	CH ₃	H	152-155
138	CH ₃	CH ₃	H	CH ₃	CH ₃	H	187-189
139	Cl	Cl	H	CH ₃	CH ₃	H	226-229
140	Cl	H	6-Cl	CH ₃	CH ₃	H	262-264

Tabulka 1 (pokračování)

Př.	X	Y	(Z) _n	A	B	G	t.t. (°C) ¹ H-NMR(CDCl ₃)(ppm), δ:
141	CH ₃	CH ₃	6-CH ₃	(CH ₂) ₃		CO ₂ CH ₃	136-138
142	CH ₃	CH ₃	6-CH ₃	(CH ₂) ₃		COCH ₃	138-139
143	CH ₃	CH ₃	6-CH ₃	(CH ₂) ₃		COCH(CH ₃) ₂	132-134
144	CH ₃	CH ₃	6-CH ₃	(CH ₂) ₃		COC(CH ₃) ₃	156-158
145	CH ₃	CH ₃	6-CH ₃	(CH ₂) ₃		CO ₂ C ₂ H ₅	140-142
146	CH ₃	CH ₃	6-CH ₃	H	C ₆ H ₅	COCH ₃	163-165
147	CH ₃	CH ₃	6-CH ₃	H	C ₆ H ₅	CO ₂ CH ₃	146-149
148	CH ₃	CH ₃	6-CH ₃	H	C ₆ H ₅	CO(CH ₂) ₂ Cl	101-104
149	CH ₃	CH ₃	6-CH ₃	H	4-Cl-C ₆ H ₄	CO(CH ₂)Cl	103-105
150	CH ₃	CH ₃	6-CH ₃	H	CH ₃	COCH ₃	112-113
151	CH ₃	CH ₃	6-CH ₃	H	CH ₃	CO ₂ CH ₃	134-136
152	CH ₃	CH ₃	6-CH ₃	H	CH ₃	CO(C(CH ₃) ₃)	102-104

Výroba výchozích sloučenin vzorce III

P ř í k l a d III-1



444,5 g (2 mol) kyseliny mesitylmalonové se při teplotě v rozmezí 75 až 80 °C suspenduje v 1000 ml methylcyklohexanu a k této suspensi se v průběhu 3 hodin přikape 714 g (6 mol) thionylchloridu. Potom se reakční směs pomalu zahřeje a po dobu 8 hodin se pod zpětným chladičem míchá dále při teplotě lázně v rozmezí 110 až 120 °C .

Přebytečný thionylchlorid se společně s rozpouštědlem oddestiluje za tlaku 1 kPa při teplotě lázně až 80 °C . Získaný zbytek se po ochlazení zředí trojnásobným množstvím petroletheru, přefiltruje se, zahustí a predestiluje.

Získá se takto 373 g (84 % teorie) mesitylchlor-karbonylketenu o teplotě varu 96 °C / 45 Pa .

Analogickým způsobem a za zohlednění údajů v popisné části ke způsobu podle předloženého vynálezu je možno vyrobit ostatní výchozí sloučeniny obecného vzorce III.

P ř í k l a d A

Test s larvami Phaeton

Rozpouštědlo : 7 hmotnostních dílů dimethylformamidu

Emulgátor : 1 hmotnostní díl alkylarylpolyglykoetheru

Pro výrobu účelného přípravku účinné látky se smísí jeden hmotnostní díl účinné látky s udaným množstvím rozpouštědla a udaným množstvím emulgátoru a tento koncentrát se naředí vodou na požadovanou koncentraci.

Listy zelí (*Brassica oleracea*) se zpracují namočením do přípravku s účinnou látkou o požadované koncentraci a osadí se larvami *Phaeton cochleariae*, dokud jsou listy ještě vlhké.

Po požadované době se stanovuje úhyn larev v % . Při tom značí 100 % , že všechny larvy byly usmrceny ; 0 % značí, že nebyla usmrcena žádná larva.

Při tomto testu vykazaly například sloučeniny podle příkladů 46, 47 a 65 při příkladné koncentraci účinné látky 0,1 % po 7 dnech 100% úhyn larev.

P ř í k l a d B

Test-Plutella

Rozpouštědlo : 7 hmotnostních dílů dimethylformamidu

Emulgátor : 1 hmotnostní díl alkylarylpolyglykoetheru

Pro výrobu účelného přípravku účinné látky se smísí jeden hmotnostní díl účinné látky s udaným množstvím rozpouštědla a udaným množstvím emulgátoru a tento koncentrát se naředí vodou na požadovanou koncentraci.

Listy zelí (*Brassica oleracea*) se zpracují namočením do přípravku s účinnou látkou o požadované koncentraci a osadí se housenkami *Plutella maculipennis*, dokud jsou listy ještě vlhké.

Po požadované době se stanovuje úhyn v %. Při tom značí 100 % , že všechny housenky byly usmrceny ; 0 % značí, že nebyla usmrcena žádná housenka.

Při tomto testu vykazaly například sloučeniny podle příkladů 38, 46, 52, 53, 61, 81 a 88 při příkladné koncentraci účinné látky 0,1 % po 7 dnech 100% úhyn larev.

P ř í k l a d C

Test-Nephotettix

Rozpouštědlo : 7 hmotnostních dílů dimethylformamidu

Emulgátor : 1 hmotnostní díl alkylarylpolyglykoetheru

Pro výrobu účelného přípravku účinné látky se smísí jeden hmotnostní díl účinné látky s udaným množstvím rozpouštědla a udaným množstvím emulgátoru a tento koncentrát se naředí vodou na požadovanou koncentraci.

Zárodečné lístky rýže (*Oryza sativa*) se zpracují namočením do přípravku s účinnou látkou o požadované koncentraci a osadí se larvami *Nephotettix cincticeps*, dokud jsou listy ještě vlhké.

Po požadované době se stanovuje úhyn larev v %. Při tom značí 100 %, že všechny larvy byly usmrceny ; 0 % značí, že nebyla usmrcena žádná larva.

Při tomto testu vykázaly například sloučeniny podle příkladů 3, 31, 32, 34, 35, 37, 51, 52, 56, 58, 62, 65, 68, 69, 71, 74, 84 a 85 při příkladné koncentraci účinné látky 0,1 % po 6 dnech 100% úhyn larev.

P ř í k l a d D

Test-Aphis (systemický účinek)

Rozpouštědlo : 7 hmotnostních dílů dimethylformamidu

Emulgátor : 1 hmotnostní díl alkylarylpolglykoletheru

Pro výrobu účelného přípravku účinné látky se smísí jeden hmotnostní díl účinné látky s udaným množstvím rozpouštědla a udaným množstvím emulgátoru a tento koncentrát se naředí vodou na požadovanou koncentraci.

Vždy 20 ml přípravku s účinnou látkou o požadované koncentraci se polijí rostliny fazolí (*Vicia faba*), které jsou silně napadené černými mšicemi (*Aphis fabae*) tak, aby přípravek účinné látky pronikl do půdy aniž by byly smočeny výhonky. Účinná látka se přijímá kořeny a vede se zpět do výhonků.

Po požadované době se stanovuje úhyn v %. Při tom značí 100 %, že všechny mšice byly usmrceny ; 0 % značí, že nebyla usmrcena žádná mšice.

Při tomto testu vykázaly například sloučeniny podle příkladů 32 a 38 při příkladné koncentraci účinné látky 0,1 % 100% úhyn mšic.

P ř í k l a d E

Test-Tetranychus (OP-resistant)

Rozpouštědlo : 7 hmotnostních dílů dimethylformamidu

Emulgátor : 1 hmotnostní díl alkylarylpolyglykoletheru

Pro výrobu účelného přípravku účinné látky se smísí jeden hmotnostní díl účinné látky s udaným množstvím rozpouštědla a udaným množstvím emulgátoru a tento koncentrát se naředí vodou na požadovanou koncentraci.

Rostliny fazolí (*Vicia faba*), které jsou silně napadené všemi vývojovými stadii *Tetranychus urticae* se zpracují ponořením do přípravku účinné látky požadované koncentrace.

Po požadované době se stanovuje úhyn v %. Při tom značí 100 %, že všechna stadia byla usmrcena ; 0 % značí, že nedošlo k žádnému usmrcení.

Při tomto testu vykázaly například sloučeniny podle příkladů 3, 31, 84, 85 a 88 při příkladné koncentraci

účinné látky 0,01 % po 7 dnech 100% úhyn.

P ř í k l a d F

Test před vzejitím

Rozpouštědlo : 5 hmotnostních dílů acetonu

Emulgátor : 1 hmotnostní díl alkylarylpolyglykoetheru

Pro výrobu účelného přípravku účinné látky se smísí jeden hmotnostní díl účinné látky s udaným množstvím rozpouštědla a udaným množstvím emulgátoru a tento koncentrát se naředí vodou na požadovanou koncentraci.

Semena testovaných rostlin se vysejí do normální půdy a po 24 hodinách se polijí přípravkem účinné látky. Při tom se zachovává množství vody pro plošnou jednotku účelně konstantní. Koncentrace účinné látky v přípravku nehraje žádnou roli, důležité je pouze aplikované množství účinné látky na plošnou jednotku. Po třech týdnech se zjišťuje stupeň poškození rostlin v % poškození ve srovnání s vývinem nezpracované kontroly. Při hodnocení značí :

0 % = žádný účinek (jako nezpracovaná kontrola)
100 % = totální zničení .

Při tomto testu byly příkladným aplikovaným množstvím 500 g/ha při dobré až velmi dobré snášenlivosti vůči soje dosaženy výsledky, uvedené v následující tabulce :

T a b u l k a

Rostlina	% účinku	sloučenina z příkladu
Digitaria	90-100	31, 32, 33, 34, 35, 38, 46, 52, 53, 60, 62, 63, 68, 69, 81, 84, 88
Echinochloa	70-100	31, 32, 33, 34, 37, 46, 38, 52, 53, 56, 63, 68, 69, 81, 84
Panicum	95-100	31, 32, 33, 34, 35, 37, 38, 46, 52, 53, 56, 60, 62, 63, 68, 69, 81, 84, 88
Setaria	70-100	31, 32, 33, 34, 35, 37, 38, 52, 53, 56, 60, 63, 68, 69, 81, 84, 88

P ř í k l a d G

Test s resistantními larvami *Lucilia cuprina*

Emulgátor : 35 hmotnostních dílů ethylenglykolmonomethyl-
etheru
35 hmotnostních dílů nonylfenolpolyglykoletheru

Pro výrobu účelného přípravku účinné látky se smísí tři hmotnostní díly účinné látky se sedmi hmotnostními díly výše uvedené směsi a tento koncentrát se naředí vodou na požadovanou koncentraci.

Asi 20 resistantních larev *Lucilia cuprina* se vloží do testovací trubičky, která obsahuje asi 1 cm³ koňského masa a 0,5 ml přípravku účinné látky. Po uplynutí 24 hodin se zjišťuje stupeň úhynu.

Při tomto testu vykázaly například sloučeniny podle příkladů 32, 38 a 46 při příkladné koncentraci účinné látky 1000 ppm 100% úhyn.

P ř í k l a d H

Test-*Trichinella spiralis* in vitro

Larvy *Trichinella* se izolují ze svaloviny myši a promyjí se v 0,9% roztoku chloridu sodného, doplněného 20 µg/ml Sisomycimu a 2 µg/ml Clortimazolu. Vlastní inkubace asi 20 jedinců pro měření probíhá ve 2 ml roztoku, sestávajícího z 10 g Bacto Casitone, 5 g kvasnic (kvasnicový extrakt), 2,5 g glukosy, 0,4 g dihydrogenfos-

forečnanu draselného, a 0,4 g hydrogenfosforečnanu draselného pro 500 ml (pH = 7,2) a obsahujícího 10 µg/ml Sisomycinu a 1 µg/ml Clotrimazolu.

10 mg testované substance se rozpustí v 0,5 ml dimethylsulfoxidu a přidá se ho tolik k inkubačnímu mediu, aby konečná koncentrace činila 10, 10 a 1 µg/ml. Po 5 dnech inkubace při teplotě 19 °C se pokus vyhodnotí. Vyhodnocení se provádí podle následující škály

- 0 = žádný účinek, počet žijících larev a červů je menší než u kontroly
- 2 = dobrý účinek, jsou viditelní usmrcení jedinci
- 3 = velmi dobrý účinek, všichni jedinci jsou mrtvi.

Při tomto testu vykazaly například sloučeniny podle příkladů 13, 14, 15, 18, 26, 37 a 56 při příkladné koncentraci účinné látky 100 ppm velmi dobrý účinek (100% úhyn) .

P ř í k l a d I

Test-Nippostrongylus in vitro

Nippostrongylus se izolují z tenkého střeva krys a promyjí se v 0,9% roztoku chloridu sodného, doplněného 29 µg/ml Sisomycinu a 2 µg/ml Clotrimazolu. Vlastní inkubace vždy pěti samčích a samičích jedinců Nippostrongylus se provádí v 1,0 ml media, které je vybráno pro stanovení aktivity acetylcholinesterasy. Stanovení enzymu se provádí podle metody Rapsona a kol. 1987 (E.B. Rapson, D.C. Jenkins a A.S. Chilwan) , Improved detection of

anthelmintic activity in an in vitro screen utilizing adult *Nippostrongylus brasiliensis*, Parasitol. Res. 1987 73, 190 až 191.

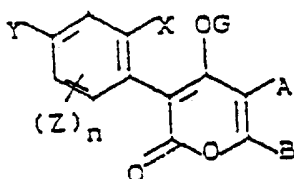
Pro vyhodnocení plytí následující škála :

- 3 = plný účinek, 100% inhibice enzymu
- 2 = dobrý účinek, přes 75 % inhibice
- 1 = špatný účinek, méně než 50% inhibice .

Při tomto testu vykázaly například sloučeniny podle příkladu 1 při příkladné koncentraci účinné látky 100 ppm úplný účinek (100% inhibice) .

P A T E N T O V É N Á R O K Y

1. Deriváty 3-aryl-pyronu obecného vzorce I



ve kterém

A značí vodíkový atom, atom halogenu, popřípadě substituované zbytky ze skupiny zahrnující alkylovou skupinu, cykloalkylovou skupinu, alkenylovou skupinu, alkinylovou skupinu, arylalkylovou skupinu, arylovou skupinu, hetarylalkylovou skupinu a hetarylovou skupinu, nebo značí skupinu $-\text{COR}^1$, $-\text{CO}_2\text{R}^1$, $-\text{CN}$, $-\text{CONR}^1\text{R}^2$, $-\text{SO}_2\text{R}^1$ nebo $-\text{P}(\text{O})(\text{OR}^1)(\text{OR}^2)$,

příčemž

R^1 a R^2 nezávisle na sobě značí vodíkový atom nebo popřípadě substituované zbytky ze skupiny zahrnující alkylovou skupinu, alkenylovou skupinu, arylalkylovou skupinu, arylovou skupinu, hetarylalkylovou skupinu a hetarylovou skupinu, nebo

R^1 a R^2 společně značí popřípadě substituované alkylenové skupiny, které mohou být přerušeny

jedním nebo několika heteroatomy ;

B značí vodíkový atom nebo popřípadě substituované zbytky ze skupiny zahrnující alkylovou skupinu, cykloalkylovou skupinu, alkenylovou skupinu, alkinylovou skupinu, arylalkylovou skupinu, arylovou skupinu, hetarylalkylovou skupinu a hetarylovou skupinu, nebo

A a B společně tvoří popřípadě substituované alkylenové nebo alkenylové skupiny, které mohou být přerušené jedním nebo několika heteroatomy nebo heteroskupinami, popřípadě tyto mohou obsahovat ;

X značí atom halogenu, alkylovou skupinu nebo alkoxylovou skupinu ;

Y značí vodíkový atom, atom halogenu, alkylovou skupinu, halogenalkylovou skupinu nebo alkoxy skupinu ;

Z značí vodíkový atom, atom halogenu, alkylovou skupinu nebo alkoxy skupinu ;

n značí celé číslo 1 , 2 nebo 3 ; a

G značí ekvivalent kovového iontu, amoniový iont nebo skupiny $-\text{COR}^3$, $-\text{C}(=\text{L})-\text{MR}^4$, $-\text{SO}_2-\text{R}^5$, $-\text{P}(=\text{L})\text{R}^6\text{R}^7$ a $-\text{CONR}^8\text{R}^9$,

příčemž

R^3 značí popřípadě substituované zbytky ze skupiny zahrnující alkylovou skupinu, alkenylovou skupinu, alkoxyalkylovou skupinu, polyalkoxyalkylovou skupinu, alkylthioalkylovou skupinu, cykloalkylovou skupinu, popřípadě přerušenou jedním nebo několika heteroatomy, arylalkylovou skupinu, arylovou skupinu, hetarylalkylovou skupinu, hetarylovou skupinu, aryloxyalkylovou

skupinu a hetaryloxyalkylovou skupinu ;

R^4 značí popřípadě substituované zbytky ze skupiny zahrnující alkylovou skupinu, alkenylovou skupinu, alkoxyalkylovou skupinu, polyalkoxyalkylovou skupinu, arylovou skupinu a arylalkylovou skupinu ;

R^5 , R^6 a R^7 značí nezávisle na sobě popřípadě substituované zbytky ze skupiny zahrnující alkylovou skupinu, alkoxyskupinu, alkylthioskupinu, alkylaminoskupinu, dialkylaminoskupinu, alkenylthioskupinu, alkinylthioskupinu, cykloalkylthioskupinu, arylovou skupinu, aryloxyskupinu a arylthioskupinu ;

R^8 a R^9 značí nezávisle na sobě vodíkový atom nebo popřípadě substituované zbytky ze skupiny zahrnující alkylovou skupinu, alkenylovou skupinu, cykloalkylovou skupinu, alkoxyalkylovou skupinu, nebo společně tvoří popřípadě substituovanou alkylenovou skupinu, která může být přerušena jedním nebo několika heteroatomy nebo heteroskupinami ;

L značí kyslíkový atom nebo atom síry ; a

M značí kyslíkový atom nebo atom síry,

příčemž když B značí fenylovou skupinu a X methoxyskupinu, potom neznačí jeden ze substituentů A, G, Y a Z vodíkový atom.

2. Deriváty aryl-pyronu podle nároku 1 , obecného vzorce I ,

ve kterém

A značí vodíkový atom ; atom halogenu ; popřípadě halogenem substituované zbytky ze skupiny zahrnující alkylovou skupinu s 1 až 10 uhlíkovými atomy, alkenylovou skupinu se 3 až 10 uhlíkovými atomy, alkinylovou skupinu se 3 až 10 uhlíkovými atomy a cykloalkylovou skupinu se 3 až 10 uhlíkovými atomy ; popřípadě halogenem, nitroskupinou, alkylovou skupinou s 1 až 8 uhlíkovými atomy, alkoxyskupinou s 1 až 8 uhlíkovými atomy, alkylthioskupinou s 1 až 8 uhlíkovými atomy, halogenalkylovou skupinou s 1 až 8 uhlíkovými atomy, halogenalkoxyskupinou s 1 až 8 uhlíkovými atomy a/nebo kyanoskupinou substituované zbytky ze skupiny zahrnující fenylovou skupinu, naftylovou skupinu, hetarylovou skupinu, fenylalkylovou skupinu s 1 až 6 uhlíkovými atomy v alkylové části a hetarylalkylovou skupinu s 1 až 6 uhlíkovými atomy v alkylové části, nebo značí skupiny $-\text{COR}^1$, $-\text{CO}_2\text{R}^1$, $-\text{CN}$, $-\text{CONR}^1\text{R}^2$, $-\text{SO}_2\text{R}^1$ a $-\text{P}(\text{O})(\text{OR}^1)(\text{OR}^2)$,

příčemž

R^1 a R^2 nezávisle na sobě značí vodíkový atom ; popřípadě halogenem substituované zbytky ze skupiny zahrnující alkylovou skupinu s 1 až 10 uhlíkovými atomy a alkenylovou skupinu se 3 až 10 uhlíkovými atomy ; popřípadě halogenem, nitroskupinou, alkylovou skupinou s 1 až 8 uhlíkovými atomy, alkoxyskupinou s 1 až 8 uhlíkovými atomy, alkylthioskupinou s 1 až 8 uhlíkovými atomy, halogenalkylovou skupinou s 1 až 8 uhlíkovými atomy, halogenalkoxyskupinou s 1 až 8 uhlíkovými atomy a/nebo kyano-

skupinou substituované zbytky ze skupiny zahrnující fenylovou skupinu, naftylovou skupinu, hetarylovou skupinu, fenylalkylovou skupinu s 1 až 6 uhlíkovými atomy v alkylové části a hetarylalkylovou skupinu s 1 až 6 uhlíkovými atomy v alkylové části ; nebo R^1 a R^2 společně značí alkylenovou skupinu se 2 až 7 uhlíkovými atomy, která je popřípadě přerušena atomem dusíku, kyslíku nebo síry ;

- B značí vodíkový atom ; popřípadě atomem halogenu, kyanoskupinou, alkylovou skupinou s 1 až 6 uhlíkovými atomy, alkylthioskupinou s 1 až 6 uhlíkovými atomy, alkylkarbonyloxyskupinou s 1 až 6 uhlíkovými atomy v alkylové části nebo fenylovou skupinou substituovaný zbytek, vybraný ze skupiny zahrnující alkylovou skupinu s 1 až 10 uhlíkovými atomy, alkenylovou skupinu se 3 až 10 uhlíkovými atomy, alkinylovou skupinu se 3 až 10 uhlíkovými atomy a cykloalkylovou skupinu se 3 až 10 uhlíkovými atomy ; nebo popřípadě atomem halogenu, kyanoskupinou, nitroskupinou, alkylovou skupinou s 1 až 8 uhlíkovými atomy, alkoxyskupinou s 1 až 8 uhlíkovými atomy, alkylthioskupinou s 1 až 8 uhlíkovými atomy, halogenalkylovou skupinou s 1 až 8 uhlíkovými atomy a/nebo halogenalkoxyskupinou s 1 až 8 uhlíkovými atomy substituovaný zbytek ze skupiny zahrnující fenylovou skupinu, naftylovou skupinu, hetarylovou skupinu, fenylalkylovou skupinu s 1 až 6 uhlíkovými atomy v alkylové části a hetarylalkylovou skupinu s 1 až 6 uhlíkovými atomy v alkylové části
a

A a B tvoří společně přímou nebo ruzvětvenou alkylenovou

nebo alkenylenovou skupinu se vždy 2 až 7 uhlíkovými atomy, které jsou popřípadě substituované alkylovou skupinou s 1 až 8 uhlíkovými atomy, halogenalkylovou skupinou s 1 až 6 uhlíkovými atomy, alkoxy skupinou s 1 až 6 uhlíkovými atomy, alkylthioskupinou s 1 až 6 uhlíkovými atomy a/nebo atomem halogenu, přičemž uvedené skupiny mohou být přerušeny dusíkovým atomem, atomem síry, kyslíkovým atomem nebo skupinou $-O-CO-$, popřípadě tyto skupiny mohou obsahovat ;

- X značí atom halogenu, alkylovou skupinu s 1 až 6 uhlíkovými atomy nebo alkoxylovou skupinu s 1 až 6 uhlíkovými atomy ;
- Y značí vodíkový atom, atom halogenu, alkylovou skupinu s 1 až 6 uhlíkovými atomy, halogenalkylovou skupinu s 1 až 6 uhlíkovými atomy nebo alkoxy skupinu s 1 až 6 uhlíkovými atomy ;
- Z značí vodíkový atom, atom halogenu, alkylovou skupinu s 1 až 6 uhlíkovými atomy nebo alkoxy skupinu s 1 až 6 uhlíkovými atomy ;
- n značí celé číslo 1 nebo 2 ;
- G značí vodíkový atom nebo skupiny $-COR^3$, $-C(=L)-MR^4$, $-SO_2-R^5$, $-P(=L)R^6R^7$ a $-CONR^8R^9$,
přičemž

R^3 značí popřípadě halogenem substituované zbytky ze skupiny zahrnující alkylovou skupinu s 1 až 20 uhlíkovými atomy, alkenylovou skupinu se 2 až 20 uhlíkovými atomy, alkoxyalkylovou skupinu s 1 až 8 uhlíkovými atomy v alkylové i v alkoxylové části, alkylthioalkylovou skupinu s 1 až 8 uhlíkovými atomy v obou alkylových částech,

polyalkoxyalkylovou skupinu s 1 až 8 uhlíkovými atomy v alkylové i v alkoxylových částech a popřípadě kyslíkem a/nebo sírou přerušenou cykloalkylovou skupinu se 3 až 8 uhlíkovými atomy ; popřípadě halogenem, nitroskupinou, alkylovou skupinou s 1 až 6 uhlíkovými atomy, alkoxyskupinou s 1 až 6 uhlíkovými atomy, halogenalkylovou skupinou s 1 až 6 uhlíkovými atomy a/nebo halogenalkoxyskupinou s 1 až 6 uhlíkovými atomy substituovanou fenylovou skupinu ; popřípadě halogenem, alkylovou skupinou s 1 až 6 uhlíkovými atomy, alkoxyskupinou s 1 až 6 uhlíkovými atomy, halogenalkylovou skupinou s 1 až 6 uhlíkovými atomy a/nebo halogenalkoxyskupinou s 1 až 6 uhlíkovými atomy substituovanou fenylalkylovou skupinu s 1 až 6 uhlíkovými atomy v alkylové části ; popřípadě halogenem a/nebo alkylovou skupinou s 1 až 6 uhlíkovými atomy substituovanou hetarylovou skupinu ; popřípadě halogenem a/nebo alkylovou skupinou s 1 až 6 uhlíkovými atomy substituovanou fenoxalkylovou skupinu s 1 až 6 uhlíkovými atomy v alkylové části nebo popřípadě halogenem, aminoskupinou a/nebo alkylovou skupinou s 1 až 6 uhlíkovými atomy substituovanou hetaryloxyalkylovou skupinu s 1 až 6 uhlíkovými atomy v alkylové části ;

R⁴ značí popřípadě halogenem substituované zbytky, vybrané ze skupiny zahrnující alkylovou skupinu s 1 až 20 uhlíkovými atomy, alkenylovou skupinu se 2 až 20 uhlíkovými atomy, alkoxyalkylovou skupinu s 1 až 8 uhlíkovými atomy v alkylové

i v alkoxylové části nebo polyalkoxyalkylovou skupinu s 1 až 8 uhlíkovými atomy v alkylové i v alkoxylových částech nebo popřípadě halogenem, nitroskupinou, alkylovou skupinou s 1 až 6 uhlíkovými atomy, alkoxyskupinou s 1 až 6 uhlíkovými atomy a/nebo halogenalkylovou skupinou s 1 až 6 uhlíkovými atomy substituovanou fenylovou nebo benzylovou skupinu ;

R^5 , R^6 a R^7 značí nezávisle na sobě popřípadě halogenem substituované zbytky, vybrané ze skupiny zahrnující alkylovou skupinu s 1 až 8 uhlíkovými atomy, alkoxyskupinu s 1 až 8 uhlíkovými atomy, alkylthioskupinu s 1 až 8 uhlíkovými atomy, alkylaminoskupinu s 1 až 8 uhlíkovými atomy, dialkylaminoskupinu se vždy 1 až 8 uhlíkovými atomy v alkylech, alkenylthioskupinu se 2 až 5 uhlíkovými atomy, alkynylthioskupinu se 2 až 5 uhlíkovými atomy, a cykloalkylthioskupinu se 3 až 7 uhlíkovými atomy, nebo popřípadě halogenem, nitroskupinou, kyanoskupinou, alkoxyskupinou s 1 až 4 uhlíkovými atomy, alkylthioskupinou s 1 až 4 uhlíkovými atomy, halogenalkoxyskupinou s 1 až 4 uhlíkovými atomy, halogenalkylthioskupinou s 1 až 4 uhlíkovými atomy, alkylovou skupinou s 1 až 4 uhlíkovými atomy a/nebo halogenalkylovou skupinou s 1 až 4 uhlíkovými atomy substituované zbytky, vybrané ze skupiny zahrnující fenylovou skupinu, fenyloxyskupinu a fenylthioskupinu ;

R^8 a R^9 značí nezávisle na sobě vodíkový atom, popřípadě halogenem substituované zbytky ze

skupiny zahrnující alkylovou skupinu s 1 až 20 uhlíkovými atomy, alkoxyskupinu s 1 až 20 uhlíkovými atomy, cykloalkylovou skupinu se 3 až 10 uhlíkovými atomy, alkenylovou skupinu se 2 až 8 uhlíkovými atomy nebo alkoxyalkylovou skupinu s 1 až 8 uhlíkovými atomy v alkylové i v alkoxylové části, nebo popřípadě halogenem, alkylovou skupinou s 1 až 20 uhlíkovými atomy, halogenalkylovou skupinou s 1 až 20 uhlíkovými atomy a/nebo alkoxyskupinou s 1 až 20 uhlíkovými atomy substituované zbytky, vybrané ze skupiny zahrnující fenylovou skupinu a benzylovou skupinu, nebo R^8 a R^9 tvoří společně alkylenovou skupinu se 2 až 6 uhlíkovými atomy, která může být přerušena atomem kyslíku a/nebo síry ;

L značí kyslíkový atom nebo atom síry a

M značí kyslíkový atom nebo atom síry,

příčemž když B značí fenylovou skupinu a X methoxyskupinu, potom neznačí jeden ze substituentů A, G, Y a Z vodíkový atom.

3. Deriváty aryl-pyronu podle nároku 1 obecného vzorce I ,

ve kterém

A značí vodíkový atom ; atom halogenu ; popřípadě halogenem substituované zbytky ze skupiny zahrnující alkylovou skupinu s 1 až 8 uhlíkovými atomy, alkeny-

lovou skupinu se 3 až 8 uhlíkovými atomy, alkinylovou skupinu se 3 až 8 uhlíkovými atomy a cykloalkylovou skupinu se 3 až 8 uhlíkovými atomy ; popřípadě halogenem, nitroskupinou, alkylovou skupinou s 1 až 4 uhlíkovými atomy, alkoxykupinou s 1 až 4 uhlíkovými atomy, alkylthioskupinou s 1 až 4 uhlíkovými atomy, halogenalkylovou skupinou s 1 až 4 uhlíkovými atomy, halogenalkoxykupinou s 1 až 4 uhlíkovými atomy a/nebo kyanoskupinou substituované zbytky ze skupiny zahrnující fenylovou skupinu, naftylovou skupinu, hetarylovou skupinu, fenylalkylovou skupinu s 1 až 4 uhlíkovými atomy v alkylové části a hetarylalkylovou skupinu s 1 až 4 uhlíkovými atomy v alkylové části, nebo značí skupiny $-\text{COR}^1$, $-\text{CO}_2\text{R}^1$, $-\text{CN}$, $-\text{CONR}^1\text{R}^2$, $-\text{SO}_2\text{R}^1$ a $-\text{P}(\text{O})(\text{OR}^1)(\text{OR}^2)$,

příčemž

R^1 a R^2 nezávisle na sobě značí vodíkový atom ; popřípadě halogenem substituované zbytky ze skupiny zahrnující alkylovou skupinu s 1 až 8 uhlíkovými atomy a alkenylovou skupinu se 3 až 8 uhlíkovými atomy ; popřípadě halogenem, nitroskupinou, alkylovou skupinou s 1 až 4 uhlíkovými atomy, alkoxykupinou s 1 až 4 uhlíkovými atomy, alkylthioskupinou s 1 až 4 uhlíkovými atomy, halogenalkylovou skupinou s 1 až 4 uhlíkovými atomy, halogenalkoxykupinou s 1 až 4 uhlíkovými atomy a/nebo kyanoskupinou substituované zbytky ze skupiny zahrnující fenylovou skupinu, hetarylovou skupinu, fenylalkylovou skupinu s 1 až 4 uhlíkovými atomy

v alkylové části a hetarylalkylovou skupinu s 1 až 4 uhlíkovými atomy v alkylové části ; nebo R^1 a R^2 společně značí alkylenovou skupinu se 2 až 6 uhlíkovými atomy, která je popřípadě přerušena atomem dusíku, kyslíku nebo síry ;

B značí vodíkový atom ; popřípadě atomem halogenu, kyanoskupinou, alkylovou skupinou s 1 až 4 uhlíkovými atomy, alkylthioskupinou s 1 až 4 uhlíkovými atomy, alkylkarbonyloxyskupinou s 1 až 4 uhlíkovými atomy v alkylové části nebo fenylovou skupinou substituovaný zbytek, vybraný ze skupiny zahrnující alkylovou skupinu s 1 až 8 uhlíkovými atomy, alkenylovou skupinu se 3 až 8 uhlíkovými atomy, alkinylovou skupinu se 3 až 8 uhlíkovými atomy a cykloalkylovou skupinu se 3 až 8 uhlíkovými atomy ; nebo popřípadě halogenem, kyanoskupinou, nitroskupinou, alkylovou skupinou s 1 až 6 uhlíkovými atomy, alkoxyskupinou s 1 až 6 uhlíkovými atomy, alkylthioskupinou s 1 až 6 uhlíkovými atomy, halogenalkylovou skupinou s 1 až 6 uhlíkovými atomy a/nebo halogenalkoxyskupinou s 1 až 6 uhlíkovými atomy substituovaný zbytek ze skupiny zahrnující fenylovou skupinu, naftylovou skupinu, hetaryllovou skupinu, fenylalkylovou skupinu s 1 až 4 uhlíkovými atomy v alkylové části a hetarylalkylovou skupinu s 1 až 4 uhlíkovými atomy v alkylové části ;
a

A a B tvoří společně výhodně alkylenovou nebo alkenylenovou skupinu se vždy 2 až 6 uhlíkovými atomy, které jsou popřípadě substituované alkylovou skupinou s 1 až 4 uhlíkovými atomy, halogenalkylovou skupinou s 1 až 4 uhlíkovými atomy a s 1 až 5 atomy halogenu,

alkoxyskupinou s 1 až 4 uhlíkovými atomy, a/nebo atomem halogenu, přičemž uvedené skupiny mohou být přerušeny dusíkovým atomem, atomem síry, kyslíkovým atomem nebo skupinou -O-CO-, popřípadě tyto skupiny mohou obsahovat ;

- X značí atom halogenu, alkylovou skupinu s 1 až 4 uhlíkovými atomy nebo alkoxylovou skupinu s 1 až 4 uhlíkovými atomy ;
- Y značí vodíkový atom, atom halogenu, alkylovou skupinu s 1 až 4 uhlíkovými atomy, alkoxylovou skupinu s 1 až 4 uhlíkovými atomy nebo halogenalkylovou skupinu s 1 až 4 uhlíkovými atomy ;
- Z značí vodíkový atom, atom halogenu, alkylovou skupinu s 1 až 4 uhlíkovými atomy nebo alkoxylovou skupinu s 1 až 4 uhlíkovými atomy ;
- n značí číslo 1 nebo 2 ;
- G značí vodíkový atom nebo skupiny $-\text{COR}^3$,
 $-\text{C}(=\text{L})-\text{MR}^4$ nebo $-\text{CONR}^8\text{R}^9$,
přičemž
- R^3 značí popřípadě halogenem substituované zbytky ze skupiny zahrnující alkylovou skupinu s 1 až 16 uhlíkovými atomy, alkenylovou skupinu se 2 až 16 uhlíkovými atomy, alkoxyalkylovou skupinu s 1 až 6 uhlíkovými atomy v alkylové i v alkoxylové části, alkylthioalkylovou skupinu s 1 až 6 uhlíkovými atomy v obou alkylových částech, polyalkoxyalkylovou skupinu s 1 až 6 uhlíkovými atomy v alkylové i v alkoxylových částech a po-

případě kyslíkem a/nebo sírou přerušenou cykloalkylovou skupinu se 3 až 7 uhlíkovými atomy ; popřípadě halogenem, nitroskupinou, alkylovou skupinou s 1 až 4 uhlíkovými atomy, alkoxykupinou s 1 až 4 uhlíkovými atomy, halogenalkylovou skupinou s 1 až 3 uhlíkovými atomy a/nebo halogenalkoxykupinou s 1 až 3 uhlíkovými atomy substituovanou fenylovou skupinu ; popřípadě halogenem, alkylovou skupinou s 1 až 4 uhlíkovými atomy, alkoxykupinou s 1 až 4 uhlíkovými atomy, halogenalkylovou skupinou s 1 až 3 uhlíkovými atomy a/nebo halogenalkoxykupinou s 1 až 3 uhlíkovými atomy substituovanou fenylalkylovou skupinu s 1 až 4 uhlíkovými atomy v alkylové části ; popřípadě halogenem a/nebo alkylovou skupinou s 1 až 6 uhlíkovými atomy substituovanou hetarylovou skupinu ; popřípadě halogenem a/nebo alkylovou skupinou s 1 až 4 uhlíkovými atomy substituovanou fenoxalkylovou skupinu s 1 až 5 uhlíkovými atomy v alkylové části nebo popřípadě halogenem, aminoskupinou a/nebo alkylovou skupinou s 1 až 4 uhlíkovými atomy substituovanou hetaryloxyalkylovou skupinu s 1 až 5 uhlíkovými atomy v alkylové části ;

R⁴ značí popřípadě halogenem substituované zbytky, vybrané ze skupiny zahrnující alkylovou skupinu s 1 až 16 uhlíkovými atomy, alkenylovou skupinu se 2 až 16 uhlíkovými atomy, alkoxyalkylovou skupinu s 1 až 6 uhlíkovými atomy v alkylové i v alkoxylové části nebo polyalkoxyalkylovou skupinu s 1 až 6 uhlíkovými atomy v alkylové

i v alkoxylových částech nebo popřípadě halogenem, nitroskupinou, alkylovou skupinou s 1 až 4 uhlíkovými atomy, alkoxyskupinou s 1 až 3 uhlíkovými atomy a/nebo halogenalkylovou skupinou s 1 až 3 uhlíkovými atomy substituovanou fenylovou nebo benzylovou skupinu ;

R^8 a R^9 značí nezávisle na sobě vodíkový atom, popřípadě halogenem substituované zbytky ze skupiny zahrnující alkylovou skupinu s 1 až 16 uhlíkovými atomy, alkoxyskupinu s 1 až 16 uhlíkovými atomy, cykloalkylovou skupinu se 3 až 16 uhlíkovými atomy, alkenylovou skupinu se 2 až 6 uhlíkovými atomy nebo alkoxyalkylovou skupinu s 1 až 6 uhlíkovými atomy v alkylové i v alkoxylové části, nebo popřípadě halogenem, alkylovou skupinou s 1 až 6 uhlíkovými atomy, halogenalkylovou skupinou s 1 až 6 uhlíkovými atomy a/nebo alkoxyskupinou s 1 až 6 uhlíkovými atomy substituované zbytky, vybrané ze skupiny zahrnující fenylovou skupinu a benzylovou skupinu, nebo R^8 a R^9 tvoří společně alkylenovou skupinu se 2 až 6 uhlíkovými atomy, která může být přerušena atomem kyslíku a/nebo síry ;

L značí atom kyslíku nebo síry a

M značí atom kyslíku nebo síry ,

příčemž když B značí fenylovou skupinu a X methoxyskupinu, potom neznačí jeden ze substituentů A, G, Y a Z vodíkový atom.

4. Deriváty 3-aryl-pyronu podle nároku 1 obecného vzorce I ,

ve kterém

- A značí vodíkový atom, atom halogenu, popřípadě halogenem substituované zbytky ze skupiny zahrnující alkylovou skupinu s 1 až 4 uhlíkovými atomy, fenylovou skupinu a benzylovou skupinu, nebo
A a B tvoří společně alkenylovou skupinu se 3 až 5 uhlíkovými atomy, popřípadě přerušenu atomy kyslíku nebo síry ;
- B značí vodíkový atom, popřípadě atomem halogenu, kyanoskupinou, methoxyskupinou nebo methylthioskupinou substituovanou alkylovou skupinu s 1 až 4 uhlíkovými atomy ; nebo popřípadě halogenem, nitroskupinou, alkylovou skupinou s 1 až 4 uhlíkovými atomy a/nebo alkoxyskupinou s 1 až 4 uhlíkovými atomy, substituovaný zbytek ze skupiny zahrnující fenylovou skupinu, furylovou skupinu, thiazolylovou skupinu a pyridylovou skupinu ;
a
A a B tvoří společně skupiny $-(CH_2)_3-$, $-(CH_2)_4-$, $-(CH_2)_5-$, $-CH_2-$, $-CH(CH_3)(CH_2)_2-$, $-CH_2O-(CH_2)_2-$ a $-CH_2S-(CH_2)_2-$, které mohou být popřípadě substituované trifluormethylovou skupinou nebo methoxyskupinou ;
- X značí methylovou skupinu ;
Y značí methylovou skupinu ;
Z značí methylovou skupinu a

G značí vodíkový atom nebo skupinu $-\text{COR}^3$,
příčemž

R^3 značí alkylovou skupinu s 1 až 6 uhlíkovými
atomy nebo alkokyskupinu s 1 až 6 uhlíkovými
atomy .

5. Způsob výroby derivátů 3-aryl-pyronu obecného vzorce
I podle nároku 1 ,

v y z n a č u j í c í s e t í m , že se

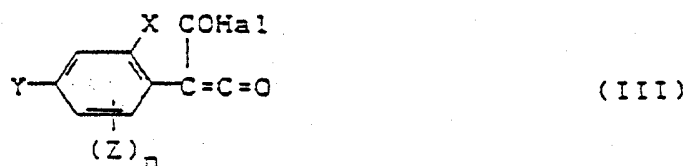
a) pro výrobu sloučenin, ve kterých G značí vodíkový
atom,

nechají reagovat karbonylové sloučeniny obecného vzorce II



ve kterém mají A a B výše uvedený význam,

s halogenidy ketenkyselin obecného vzorce III



ve kterém mají X , Y , Z a n výše uvedený význam a

Hal znaší atom halogenu, výhodně chloru nebo bromu,

za přítomnosti zředovacího prostředku a popřípadě za
přítomnosti kyselého katalysátoru ; a

- b) pro výrobu sloučenin obecného vzorce I , ve kterém značí G skupinu $-\text{COR}^3$,

nechají reagovat sloučeniny obecného vzorce I , ve kterém značí G vodíkový atom, které je možno získat podle varianty a),

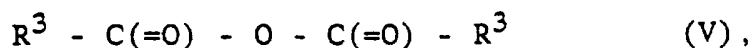
- α) s halogenidy kyselin obecného vzorce IV



ve kterém má R^3 výše uvedený význam a

Hal značí atom halogenu, výhodně chloru nebo bromu, nebo

- β) s anhydridy karboxylových kyselin obecného vzorce V



ve kterém má R^3 výše uvedený význam,

popřípadě za přítomnosti zředovacího činidla a popřípadě za přítomnosti činidla vázajícího kyseliny ; a

- c) pro výrobu sloučenin obecného vzorce I , ve kterém G značí skupinu $-\text{C}(\text{L})-\text{MR}^4$, přičemž L značí kyslíkový atom,

nechají reagovat sloučeniny obecného vzorce I , ve kterém značí G vodíkový atom, které je možno získat

postupem podle varianty a) ,

se sloučeninami obecného vzorce VI



ve kterém mají R^4 a M výše uvedený význam,

popřípadě za přítomnosti zředovacího činidla a popřípadě za přítomnosti činidla vázajícího kyseliny ; a

- d) pro výrobu sloučenin obecného vzorce I , ve kterém značí G skupinu $-C(L)-MR^4$, přičemž L značí atom síry,

nechají reagovat sloučeniny obecného vzorce I , ve kterém značí G vodíkový atom, které je možno získat postupem podle varianty a) ,

- α) se sloučeninami obecného vzorce VII



ve kterém mají R^4 a M výše uvedený význam,

popřípadě za přítomnosti zředovacího činidla a popřípadě za přítomnosti činidla vázajícího kyseliny, nebo

- β) se sirovodíkem CS_2 a potom s alkylhalogenidy obecného vzorce VIII



ve kterém má R^4 výše uvedený význam a

Hal^1 značí atom halogenu, výhodně chloru, bromu nebo jodu,

popřípadě za přítomnosti zředovacího činidla a popřípadě za přítomnosti činidla vázajícího kyseliny ; a

- e) pro výrobu sloučenin obecného vzorce I , ve kterém značí G skupinu $-SO_2R^5$,

nechají reagovat sloučeniny obecného vzorce I , ve kterém značí G vodíkový atom, které je možno získat postupem podle varianty a) ,

s chloridy sulfonových kyselin obecného vzorce IX



ve kterém má R^5 výše uvedený význam,

popřípadě za přítomnosti zředovacího činidla a popřípadě za přítomnosti činidla vázajícího kyseliny ; a

- f) pro výrobu sloučenin obecného vzorce I , ve kterém značí G skupinu $-P(L)R^6R^7$,

nechají reagovat sloučeniny obecného vzorce I , ve kterém značí G vodíkový atom, které je možno získat postupem podle varianty a) ,

se sloučeninami obecného vzorce X



ve kterém mají R^6 , R^7 a L výše uvedený význam a

Hal značí atom halogenu, výhodně chloru nebo bromu,

popřípadě za přítomnosti zředovacího činidla a popřípadě za přítomnosti činidla vázajícího kyseliny ; a

- g) pro výrobu sloučenin obecného vzorce I , ve kterém značí G ekvivalent kovového iontu nebo amoniový iont,

nechají reagovat sloučeniny obecného vzorce I , ve kterém značí G vodíkový atom, které je možno získat postupem podle varianty a) ,

hydroxidy kovů nebo s aminy, výhodně monoalkylaminy, dialkylaminy nebo trialkylaminy ; a

- h) pro výrobu sloučenin obecného vzorce I , ve kterém značí G skupinu $-C(L)R^8R^9$,

nechají reagovat sloučeniny obecného vzorce I , ve kterém značí G vodíkový atom, které je možno získat postupem podle varianty a) ,

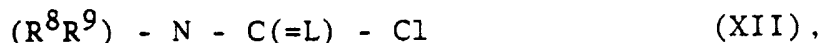
- a) se sloučeninami obecného vzorce XI



ve kterém mají R^8 a L výše uvedený význam

popřípadě za přítomnosti zředovacího činidla a popřípadě za přítomnosti činidla vázajícího kyseliny, nebo

β) se sloučeninami obecného vzorce XII



ve kterém mají R^8 , R^9 a L výše uvedený význam,

popřípadě za přítomnosti zředovacího činidla a popřípadě za přítomnosti činidla vázajícího kyseliny.

6. Prostředek pro potírání škůdců,

v y z n a č u j í c í s e t í m , že obsahuje alespoň jednu sloučeninu obecného vzorce I podle nároku 1 .

7. Arthropodicidní, nematocidní a herbicidní prostředek,

v y z n a č u j í c í s e t í m , že obsahuje alespoň jednu sloučeninu obecného vzorce I podle nároku 1 .

8. Použití sloučenin obecného vzorce I podle nároku 1 pro potírání škůdců při ochraně rostlin, v oblasti hospodářství, v oblasti hygieny a při ochraně zásob.

9. Použití sloučenin obecného vzorce I podle nároku 1 pro potírání arthropodů, nematodů a nežádoucích porostů rostlin při ochraně rostlin, v oblasti domácnosti, hygieny a ochrany zásob.

10. Způsob potírání škůdců v oblasti ochrany rostlin, hospodářství, hygieny a ochrany zásob,

v y z n a ě u j í c í s e t í m , že se nechají působit sloučeniny obecného vzorce I podle nároku 1 na škůdce a/nebo jejich životní prostředí.

11. Způsob výroby prostředků pro potírání škůdců, v y z n a ě u j í c í s e t í m , že se sloučeniny obecného vzorce I podle nároku 1 smísí s plnidly a/nebo povrchově aktivními činidly.

12. Sloučeniny obecného vzorce I podle nároku 1 pro potírání ektoparasitů a endoparasitů u živočichů.

13. Použití sloučenin obecného vzorce I podle nároku 1 pro výrobu prostředků pro potírání ektoparasitů a endoparasitů.