

PŘÍHLÁŠKA VYNÁLEZU

zveřejněná podle § 31 zákona č. 527/1990 Sb.

(19)
ČESKÁ
REPUBLIKA



ÚŘAD
PRŮMYSLVÉHO
VLASTNICTVÍ

(22) Přihlášeno: **02.12.1999**

(32) Datum podání prioritní přihlášky: **04.12.1998 06.08.1999**

(31) Číslo prioritní přihlášky: **1998/19855850 1999/19936514**

(33) Země priority: **DE DE**

(40) Datum zveřejnění přihlášky vynálezu: **13.02.2002**
(Věstník č. 2/2002)

(86) PCT číslo: **PCT/EP99/09413**

(87) PCT číslo zveřejnění: **WO00/34273**

(21) Číslo dokumentu:

2001 - 1960

(13) Druh dokumentu: **A3**

(51) Int. Cl. ⁷:

C 07 D 413/12

C 07 D 403/12

C 07 D 231/06

C 07 D 261/04

A 01 N 43/56

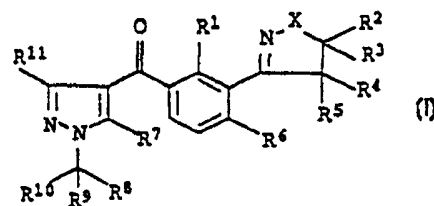
(71) Přihlašovatel:

BASF AKTIENGESELLSCHAFT, Ludwigshafen, DE;

sloučenin nebo prostředků je obsahujících k regulaci nežádoucích rostlin.

(72) Původce:

Neidlein Ulf Dr., Mannheim, DE;
Götz Norbert Dr., Worms, DE;
Baumann Ernst Dr., Dudenhofen, DE;
von Deyn Wolfgang Dr., Neustadt, DE;
Kudis Steffen Dr., Mannheim, DE;
Langemann Klaus Dr., Worms, DE;
Mayer Guido Dr., Neustadt, DE;
Mißlitz Ulf Dr., Neustadt, DE;
Witschel Matthias Dr., Ludwigshafen, DE;
Otten Martina Dr., Ludwigshafen, DE;
Westphalen Karl-Otto Dr., Speyer, DE;
Walter Helmut Dr., Obrigheim, DE;



(I)

(74) Zástupce:

Švorčík Otakar JUDr., Hálkova 2, Praha 2, 12000;

(54) Název přihlášky vynálezu:

3-(Heterocyclyl)-substituované benzoylpyrazoly

(57) Anotace:

Jsou popsány 3-(heterocyclyl)-substituované benzoylpyrazoly obecného vzorce I, ve kterém X je atom kyslíku, skupina vzorce NH nebo N-alkylová skupina; R¹ je alkylová skupina; R², R³, R⁴ a R⁵ jsou atom vodíku, alkylová skupina nebo halogenalkylová skupina; R⁶ je atom halogenu, nitroskupina, halogenalkylová skupina, alkoxy skupina, halogenalkoxy skupina, alkylthio skupina, halogenalkylthio skupina uhlíku, alkylsulfonylová skupina nebo halogenalkylsulfonylová skupina; R⁷ je hydroxylová skupina, alkoxy skupina, alkenyloxy skupina, alkylsulfonyloxy skupina, alkylkarbonyloxy skupina, alkylthiokarbonyloxy skupina, fenylsulfonyloxy skupina nebo fenylkarbonyloxy skupina, ve kterých fenylové zbytky mohou být substituované; R⁸ a R⁹ jsou alkylová skupina, R¹⁰ je atom vodíku nebo alkylová skupina; R¹¹ je atom vodíku nebo alkylová skupina; a jejich zemědělsky využitelné soli, meziprodukty a způsoby jejich přípravy a použití těchto

10.10.01

PV 2001 - 1960

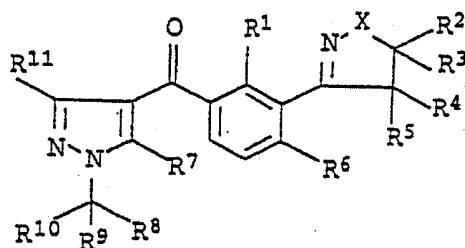
3-(Heterocyklyl)-substituované benzoylpyrazoly

Oblast techniky

Tento vynález se týká nových 3-(heterocyklyl)-
-substituovaných benzoylpyrazolů a jejich zemědělsky
využitelných solí, meziproductů, a způsobů jejich přípravy
a použití těchto sloučenin nebo prostředků je obsahujících
pro regulaci nežádoucích rostlin.

Podstata vynálezu

Tento vynález se týká nových 3-(heterocyklyl)-
-substituovaných benzoylpyrazolů obecného vzorce I:



(I)

ve kterém

X je atom kyslíku, skupina vzorce NH nebo N(C₁₋₆ alkylová) skupina;

R¹ je alkylová skupina s 1 až 6 atomy uhlíku;

R², R³, R⁴ a R⁵ jsou atom vodíku, alkylová skupina s 1 až 4 atomy uhlíku nebo halogenalkylová skupina s 1 až 4

atomy uhlíku;

R⁶ je atom halogenu, nitroskupina, halogenalkylová skupina s 1 až 4 atomy uhlíku, alkoxykupina s 1 až 4 atomy uhlíku, halogenalkoxykupina s 1 až 4 atomy uhlíku, alkylthioskupina s 1 až 4 atomy uhlíku, halogenalkylthioskupina s 1 až 4 atomy uhlíku, alkylsulfonylová skupina s 1 až 4 atomy uhlíku nebo halogenalkylsulfonylová skupina s 1 až 4 atomy uhlíku;

R⁷ je hydroxylová skupina, alkoxykupina s 1 až 6 atomy uhlíku, alkenyloxyskupina se 3 až 6 atomy uhlíku, alkylsulfonyloxyskupina s 1 až 6 atomy uhlíku, alkylkarbonyloxyskupina s 1 až 6 atomy uhlíku, C₁₋₄(alkylthio)karbonyloxyskupina, fenylsulfonyloxyskupina nebo fenylkarbonyloxyskupina, ve kterých fenylový zbytek dvou naposledy uvedených substituentů může být částečně nebo zcela halogenovaný a/nebo může nést 1 až 3 následující skupiny:

nitroskupinu, kyanoskupinu, alkylovou skupinu s 1 až 4 atomy uhlíku, halogenalkylovou skupinu s 1 až 4 atomy uhlíku, alkoxykupinu s 1 až 4 atomy uhlíku nebo halogenalkoxykupinu s 1 až 4 atomy uhlíku;

R⁸ a R⁹ jsou alkylová skupina s 1 až 4 atomy uhlíku;

R¹⁰ je atom vodíku nebo alkylová skupina s 1 až 4 atomy uhlíku;

kde počet atomů uhlíku ve zbytcích R⁸, R⁹ a R¹⁰ činí dohromady nanejvýš 7,

R^{1-4} je atom vodíku nebo alkylová skupina s 1 až 4 atomy uhlíku;

a jejich zemědělsky využitelných solí.

Vynález se navíc týká meziproductů a způsobů přípravy sloučenin obecného vzorce I, prostředků, které je obsahují a použití těchto derivátů nebo prostředků, které je obsahují, k regulaci plevelných rostlin.

Deriváty kyseliny pyrazol-4-ylbenzoové jsou popsány v literatuře například v patentových publikacích WO 96-26206 a WO 98-31681.

Herbicidní vlastnosti sloučenin doposud známých v oboru a jejich snášenlivost s kulturními rostlinami však není uspokojivá.

Cílem tohoto vynálezu je poskytnutí nových, zvláště herbicidně aktivních, sloučenin s vylepšenými vlastnostmi.

Původci zjistili, že tohoto cíle se dosáhne 3-(heterocyklyl)-substituovanými benzoylpyrazoly obecného vzorce I a jejich herbicidním působením.

Původci dále našli herbicidní prostředky, které obsahují sloučeniny obecného vzorce I, a které mají velmi dobré herbicidní působení. Navíc našli způsoby přípravy těchto prostředků a způsoby regulace nežádoucí vegetace za použití sloučenin obecného vzorce I.

V závislosti na substitučním vzorci mohou sloučeniny

obecného vzorce I obsahovat jedno nebo více chirálních center, v těchto případech se vyskytují jako enantiomery nebo jako směsi diastereomerů. Vynález poskytuje jak čisté enantiomery nebo diastereomery, tak jejich směsi.

Sloučeniny obecného vzorce I se mohou rovněž vyskytovat ve formě jejich zemědělsky vhodných solí, typ soli je obvykle nepodstatný. Soli takových kationtů nebo adiční soli takových kyselin jsou obecně vhodné tam, kde jejich kationty nebo anionty, neovlivňují nepříznivě herbicidní působení sloučenin obecného vzorce I.

Vhodnými kationty jsou zejména ionty alkalických kovů, výhodně lithia, sodíku a draslíku, kovů alkalických zemin, výhodně vápníku a hořčíku a přechodných kovů, výhodně manganu, mědi, zinku a železa, a rovněž amoniový kation, ve kterém pokud je to žádoucí mohou být 1 až 4 atomy vodíku nahrazeny alkylovou skupinou s 1 až 4 atomy uhlíku, hydroxyalkylovou skupinou s 1 až 4 atomy uhlíku, C_{1-4} alkoxy- C_{1-4} alkylovou skupinou, hydroxy- C_{1-4} alkoxy- C_{1-4} alkylovou skupinou, fenylovou nebo benzylovou skupinou, výhodně amoniem, dimethylamoniem, diisopropylamoniem, tetramethylamoniem, tetrabutylamoniem, 2-(2-hydroxyeth-1-oxy)eth-1-ylamoniem, di(2-hydroxyeth-1-yl)amoniem nebo trimethylbenzylamoniem, dále fosfoniovými ionty, sulfoniovými ionty, výhodně tri(C_{1-4} alkyl)sulfoniem.

Anionty vhodných adičních solí kyselin jsou primárně chlorid, bromid, fluorid, hydrogensíran, síran, dihydrogenfosforečnan, hydrogenfosforečnan, dusičnan, hydrogenuhlíčitan, uhličitan, hexafluorokřemičitan, hexafluorofosforečnan, ^{bež}oát, a anionty alkanoových

kyselin s 1 až 4 atomy uhlíku, výhodně formiat, acetat, propionat a butyrat.

Části organických molekul uvedené jako substituenty R^1 až R^{11} nebo jako zbytky na fenylových kruzích jsou soubornými pojmy pro individuální výčty jednotlivých členů skupin. Všechny uhlovodíkové řetězce, to jest všechny části alkylové, alkylkarbonylové nebo halogenalkylové, alkoxyčásti, halogenalkoxyčásti, alkylkarbonyloxyčásti, (alkylthio)karbonyloxyčásti, alkylsulfonyloxyčásti, alkylthiočásti, halogenalkylthiočásti, části alkylsulfonylové, halogenalkylsulfonylové a alkenylové a alkenoxyčásti, mohou být přímé nebo rozvětvené. Pokud není uvedeno jinak nesou halogenované zbytky výhodně 1 až pět stejných nebo různých atomů halogenu. Pojem "halogen" představuje v každém případě atom fluoru, chloru, bromu nebo jodu. Pokud je uveden počet atomů uhlíku v řetězci nebo kruhu u složených skupin, není-li uvedeno jinak, označuje počet těchto atomů v alkylu, cykloalkylu nebo nenasycených obdobách těchto skupin.

Příkladem dalších významů jsou:

- alkylová skupina s 1 až 4 atomy uhlíku a alkylové části alkylkarbonylové skupiny s 1 až 4 atomy uhlíku a alkylkarbonyloxyskupiny s 1 až 4 atomy uhlíku: například skupina methylová, ethylová, propylová, 1-methylethylová, butylová, 1-methylpropylová, 2-methylpropylová a 1,1-dimethylethylová.
- alkylová skupina s 1 až 6 atomy uhlíku a alkylové části alkylkarbonylové skupiny s 1 až 6 atomy uhlíku a alkylkarbonyloxyskupiny s 1 až 6 atomy uhlíku: alkylová skupina s 1 až 4 atomy uhlíku, jak byl uveden výše, a rovněž například skupina pentylová, 1-methylbutylová, 2-methylbutylová, 3-methylbutylová, 2,2-

10.10.01

- dimethylpropylová, 1-ethylpropylová, hexylová,
1,1-dimethylpropylová, 1,2-dimethylpropylová,
1-methylpentylová, 2-methylpentylová, 3-methyl-
pentylová, 4-methylpentylová, 1,1-dimethylbutylová,
1,2-dimethylbutylová, 1,3-dimethylbutylová, 2,2-dime-
thylbutylová, 2,3-dimethylbutylová, 3,3-dimethyl-
butylová, 1-ethylbutylová, 2-ethylbutylová, 1,1,2-
-trimethylpropylová, 1-ethyl-1-methylpropylová a
1-ethyl-3-methylpropylová;
- haloalkylová skupina s 1 až 4 atomy uhlíku: alkylové
skupiny s 1 až 4 atomy uhlíku, jak byly uvedeny výše,
které jsou částečně nebo zcela substituovány atomem
fluoru, chloru, bromu a/nebo iodu, to jest například
skupina chlormethylová, dichlormethylová,
trichlormethylová, fluormethylová, difluormethylová,
trifluormethylová, chlorfluormethylová, dichlor-
fluormethylová, chlordifluormethylová, brommethylová,
iodmethylová, 1-fluorethylová, 1-chlorethylová,
1-bromethylová, 1-iodethylová, 2-fluorethylová,
2-chlorethylová, 2-bromethylová, 2-iodethylová,
2,2-difluorethylová, 2,2,2-trifluorethylová,
2-chlor-2-fluorethylová, 2-chlor-2,2-difluorethylová,
2,2-dichlor-2-fluorethylová, 2,2,2-trichlorethylová,
pentafluorethylová, 2-fluorpropylová, 3-fluor-
propylová, 2,2-difluorpropylová, 2,3-difluor-
propylová, 2-chlorpropylová, 3-chlorpropylová,
2,3-dichlorpropylová, 2-brompropylová, 3-brom-
propylová, 3,3,3-trifluorpropylová, 3,3,3-tri-
chlorpropylová, 2,2,3,3,3-pentafluorpropylová,
heptafluorpropylová, 1-(fluormethyl)-2-fluorethylová,
1-(chlormethyl)-2-chlorethylová, 1-(brommethyl)-2-
-bromethylová, 4-fluorbutylová, 4-chlorbutylová,

4-brombutylová a nonafluorbutylová;

- alkoxykupina s 1 až 4 atomy uhlíku: například methoxykupina, ethoxykupina, propoxykupina, 1-methylethoxykupina, butoxykupina, 1-methylpropoxykupina, 2-methylpropoxykupina a 1,1-dimethylethoxykupina;
- alkoxykupina s 1 až 6 atomy uhlíku: alkoxykupiny s 1 až 4 atomy uhlíku, jak byly uvedeny výše, a rovněž například pentyloxykupina, 1-methylbutoxykupina, 2-methylbutoxykupina, 3-methylbutoxykupina, 1,1-dimethylpropoxykupina, 1,2-dimethylpropoxykupina, 2,2-dimethylpropoxykupina, 1-ethylpropoxykupina, hexyloxykupina, 1-methylpentyloxykupina, 2-methylpentyloxykupina, 3-methylpentyloxykupina, 4-methylpentyloxykupina, 1,1-dimethylbutoxykupina, 1,2-dimethylbutoxykupina, 1,3-dimethylbutoxykupina, 2,2-dimethylbutoxykupina, 2,3-dimethylbutoxykupina, 3,3-dimethylbutoxykupina, 1-ethylbutoxykupina, 2-ethylbutoxykupina, 1,1,2-trimethylpropoxykupina, 1,2,2-trimethylpropoxykupina, 1-ethyl-1-methylpropoxykupina a 1-ethyl-2-methylpropoxykupina;
- halogenalkoxykupina s 1 až 4 atomy uhlíku: alkoxykupiny s 1 až 4 atomy uhlíku, jak byly uvedeny výše, které jsou částečně nebo zcela substituovány atomem fluoru, chloru, bromu a/nebo iodu, to jest například fluormethoxykupina, difluormethoxykupina, trifluormethoxykupina, chlordinfluormethoxykupina, bromdifluormethoxykupina, 2-fluorethoxykupina, 2-chlorethoxykupina, 2-bromethoxykupina,

10.10.01

- 2-iodethethoxyskupina, 2,2-difluorethethoxyskupina, 2,2,2-trifluorethoxyskupina, 2-chlor-2-fluorethoxyskupina, 2-chlor-2,2-difluorethoxyskupina, 2,2-dichlor-2-fluorethoxyskupina, 2,2,2-trichlorethoxyskupina, pentafluorethoxyskupina, 2-fluorpropoxyskupina, 3-fluorpropoxyskupina, 2-chlorpropoxyskupina, 3-chlorpropoxyskupina, 2-brompropoxyskupina, 3-brompropoxyskupina, 2,2-difluorpropoxyskupina, 2,3-difluorpropoxyskupina, 2,3-dichlorpropoxyskupina, 3,3,3-trifluorpropoxyskupina, 3,3,3-trichlorpropoxyskupina, 2,2,3,3,3-pentafluorpropoxyskupina, heptafluorpropoxyskupina, 1-(fluormethyl)-2-fluorethoxyskupina, 1-(chloromethyl)-2-chlorethoxyskupina, 1-(brommethyl)-2-bromethoxyskupina, 4-fluorbutoxyskupina, 4-chlorbutoxyskupina, 4-brombutoxyskupina a nonafluorbutoxyskupina;
- alkylthioskupina s 1 až 4 atomy uhlíku a alkylthiočást z C_{1-4} (alkylthio)karbonyloxyskupiny: například methylthioskupina, ethylthioskupina, propylthioskupina, 1-methylethylthioskupina, butylthioskupina, 1-methylpropylthioskupina, 2-methylpropylthioskupina, a 1,1-dimethylethylthioskupina;
 - halogenalkylthioskupina s 1 až 4 atomy uhlíku: alkylthioskupiny s 1 až 4 atomy uhlíku, jak byly uvedeny výše, které jsou částečně nebo zcela substituovány atomem fluoru, chloru, bromu a/nebo iodu, to jest například fluormethylthioskupina, difluormethylthioskupina, trifluormethylthioskupina, chlordinfluormethylthioskupina, bromdifluormethylthioskupina, 2-fluorethylthioskupina, 2-chlorethylthioskupina, 2-bromethylthioskupina, 2-iodethylthioskupina,

10.10.01

2,2-difluorethylthioskupina, 2,2,2-trifluorethylthioskupina, 2,2,2-trichlorethylthioskupina, 2-chlor-2-fluorethylthioskupina, 2-chlor-2,2-difluorethylthioskupina, 2,2-dichlor-2-fluorethylthioskupina, pentafluorethylthioskupina, 2-fluorpropylthioskupina, 3-fluorpropylthioskupina, 2-chlorpropylthioskupina, 3-chlorpropylthioskupina, 2-brompropylthioskupina, 3-brompropylthioskupina, 2,2-difluorpropylthioskupina, 2,3-difluorpropylthioskupina, 2,3-dichlorpropylthioskupina, 3,3,3-trifluorpropylthioskupina, 3,3,3-trichlorpropylthioskupina, 2,2,3,3,3-pentafluorpropylthioskupina, heptafluorpropylthioskupina, 1-(fluormethyl)-2-fluorethylthioskupina, 1-(chloromethyl)-2-chlorethylthioskupina, 1-(bromomethyl)-2-bromethylthioskupina, 4-fluorbuthylthioskupina, 4-chlorbuthylthioskupina, 4-brombuthylthioskupina a nonafluorbuthylthioskupina.

- alkylsulfonylová skupina s 1 až 4 atomy uhlíku (C_{1-4} alkyl-S(=O)₂-) a alkylsulfonylové části z alkylsulfonyloxyskupiny s 1 až 4 atomy uhlíku: například skupina methylsulfonylová, ethylsulfonylová, propylsulfonylová, 1-methylethylsulfonylová, butylsulfonylová, 1-methylpropylsulfonylová, 2-methylpropylsulfonylová a 1,1-dimethylpropylsulfonylová.

- alkylsulfonylová skupina s 1 až 6 atomy uhlíku a alkylsulfonylové části z alkylsulfonyloxyskupiny s 1 až 6 atomy uhlíku: alkylsulfonylové skupiny s 1 až 4 atomy uhlíku, jak byly uvedeny výše, a rovněž například skupina pentylsulfonylová, 1-methyl-

butylsulfonylová, 2-methylbutylsulfonylová,
3-methylbutylsulfonylová, 1,1-dimethylpropyl-
sulfonylová, 1,2-dimethylpropylsulfonylová,
2,2-dimethylpropylsulfonylová, 1-ethylpropyl-
sulfonylová, hexylsulfonylová, 1-methylpentyl-
sulfonylová, 2-methylpentylsulfonylová, 3-methyl-
pentylsulfonylová, 4-methylpentylsulfonylová,
1,1-dimethylbutylsulfonylová, 1,2-dimethylbutyl-
sulfonylová, 1,3-dimethylbutylsulfonylová, 2,2-di-
methylbutylsulfonylová, 2,3-dimethylbutylsulfonylová,
3,3-dimethylbutylsulfonylová, 1-ethylbutylsulfo-
nylová, 2-ethylbutylsulfonylová, 1,1,2-trimethyl-
propylsulfonylová, 1,2,2-trimethylpropylsulfonylová,
1-ethyl-1-methylpropylsulfonylová a 1-ethyl-2-
-methylpropylsulfonylová;

- halogenalkylsulfonylová skupina s 1 až 4 atomy uhlíku:
alkylsulfonylové skupiny s 1 až 4 atomy uhlíku, jak
byly uvedeny výše, které jsou částečně nebo zcela
substituovány atomem fluoru, chloru, bromu a/nebo
iodu, to jest například skupina fluormethylsulfo-
nylová, difluormethylsulfonylová, trifluormethyl-
sulfonylová, chlordinfluormethylsulfonylová,
bromdifluormethylsulfonylová, 2-fluorethylsulfo-
nylová, 2-chlorethylsulfonylová, 2-bromethyl-
sulfonylová, 2-iodethylsulfonylová, 2,2-difluorethyl-
sulfonylová, 2,2,2-trifluorethylsulfonylová, 2-chlor-
-2-fluorethylsulfonylová, 2-chlor-2,2-difluor-
ethylsulfonylová, 2,2-dichlor-2-fluorethyl-
sulfonylová, 2,2,2-trichlorethylsulfonylová,
pentafluorethylsulfonylová, 2-fluorpropylsulfonylová,
3-fluorpropylsulfonylová, 2-chlorpropylsulfonylová,
3-chlorpropylsulfonylová, 2-brompropylsulfonylová,

3-brompropylsulfonylová, 2,2-difluorpropylsulfonylová, 2,3-difluorpropylsulfonylová, 2,3-dichlorpropylsulfonylová, 3,3,3-trifluorpropylsulfonylová, 3,3,3-trichlorpropylsulfonylová, 2,2,3,3,3-pentafluorpropylsulfonylová, heptafluorpropylsulfonylová, 1-(fluormethyl)-2-fluorethylsulfonylová, 1-(chlormethyl)-2-chlorethylsulfonylová, 1-(brommethyl)-2-bromethylsulfonylová, 4-fluorbutylsulfonylová, 4-chlorbutylsulfonylová, 4-brombutylsulfonylová a nonafluorbutylsulfonylová;

- alkenyloxyskupina se 3 až 6 atomy uhlíku: například prop-1-en-1-yloxyskupina, prop-2-en-1-yloxyskupina, 1-methylethylenyloxyskupina, buten-1-yloxyskupina, buten-2-yloxyskupina, buten-3-yloxyskupina, 1-methylprop-1-en-1-yloxyskupina, 2-methylprop-1-en-1-yloxyskupina, 1-methylprop-2-en-1-yloxyskupina, 2-methylprop-2-en-1-yloxyskupina, penten-1-yloxyskupina, penten-2-yloxyskupina, penten-3-yloxyskupina, penten-4-yloxyskupina, 1-methylbut-1-en-1-yloxyskupina, 2-methylbut-1-en-1-yloxyskupina, 3-methylbut-1-en-1-yloxyskupina, 1-methylbut-2-en-1-yloxyskupina, 2-methylbut-2-en-1-yloxyskupina, 3-methylbut-2-en-1-yloxyskupina, 1-methylbut-3-en-1-yloxyskupina, 2-methylbut-3-en-1-yloxyskupina, 3-methylbut-3-en-1-yloxyskupina, 1,1-dimethylprop-2-en-1-yloxyskupina, 1,2-dimethylprop-1-en-1-yloxyskupina, 1,2-dimethylprop-2-en-1-yloxyskupina, 1-ethylprop-1-en-2-yloxyskupina, 1-ethylprop-2-en-1-yloxyskupina, hex-1-en-1-yloxyskupina, hex-2-en-1-yloxyskupina, hex-3-en-1-

10.10.01

-yloxyskupina, hex-4-en-1-yloxyskupina, hex-5-en-1-yloxyskupina, 1-methylpent-1-en-1-yloxyskupina, 2-methylpent-1-en-1-yloxyskupina, 3-methylpent-1-en-1-yloxyskupina, 4-methylpent-1-en-1-yloxyskupina, 1-methylpent-2-en-1-yloxyskupina, 2-methylpent-2-en-1-yloxyskupina, 3-methylpent-2-en-1-yloxyskupina, 4-methylpent-2-en-1-yloxyskupina, 1-methylpent-3-en-1-yloxyskupina, 2-methylpent-3-en-1-yloxyskupina, 3-methylpent-3-en-1-yloxyskupina, 4-methylpent-3-en-1-yloxyskupina, 1-methylpent-4-en-1-yloxyskupina, 2-methylpent-4-en-1-yloxyskupina, 3-methylpent-4-en-1-yloxyskupina, 4-methylpent-4-en-1-yloxyskupina, 1,1-dimethylbut-2-en-1-yloxyskupina, 1,1-dimethylbut-3-en-1-yloxyskupina, 1,2-dimethylbut-1-en-1-yloxyskupina, 1,2-dimethylbut-2-en-1-yloxyskupina, 1,2-dimethylbut-3-en-1-yloxyskupina, 1,3-dimethylbut-1-en-1-yloxyskupina, 1,3-dimethylbut-2-en-1-yloxyskupina, 1,3-dimethylbut-3-en-1-yloxyskupina, 2,2-dimethylbut-3-en-1-yloxyskupina, 2,3-dimethylbut-1-en-1-yloxyskupina, 2,3-dimethylbut-2-en-1-yloxyskupina, 2,3-dimethylbut-3-en-1-yloxyskupina, 3,3-dimethylbut-1-en-1-yloxyskupina, 3,3-dimethylbut-2-en-1-yloxyskupina, 1-ethylbut-1-en-1-yloxyskupina, 1-ethylbut-2-en-1-yloxyskupina, 1-ethylbut-3-en-1-yloxyskupina, 2-ethylbut-1-en-1-yloxyskupina, 2-ethylbut-2-en-1-yloxyskupina, 2-ethylbut-3-en-1-yloxyskupina, 1,1,2-trimethylprop-2-en-1-yloxyskupina, 1-ethyl-1-methylprop-2-en-1-yloxyskupina, 1-ethyl-2-methylprop-1-en-1-yloxyskupina a 1-ethyl-2-methylprop-2-en-1-yloxyskupina;

- alkenylová skupina se se 3 až 6 atomy uhlíku:
 skupina prop-1-en-1-ylová, prop-2-en-1-ylová,
 1-methylethylenylová, buten-1-ylová, buten-2-ylová,
 buten-3-ylová, 1-methylprop-1-en-1-ylová, 2-methyl-
 prop-1-en-1-ylová, 1-methylprop-2-en-1-ylová,
 2-methylprop-2-en-1-ylová, penten-1-ylová, penten-2-
 -ylová, penten-3-ylová, penten-4-ylová, 1-methylbut-
 -1-en-1-ylová, 2-methylbut-1-en-1-ylová, 3-methylbut-
 -1-en-1-ylová, 1-methylbut-2-en-1-ylová, 2-methylbut-
 -2-en-1-ylová, 3-methylbut-2-en-1-ylová, 1-methylbut-
 -3-en-1-ylová, 2-methylbut-3-en-1-ylová, 3-methylbut-
 -3-en-1-ylová, 1,1-dimethylprop-2-en-1-ylová,
 1,2-dimethylprop-1-en-1-ylová, 1,2-dimethylprop-2-
 -en-1-ylová, 1-ethylprop-1-en-2-ylová, 1-ethyl-
 prop-2-en-1-ylová, hex-1-en-1-ylová, hex-2-en-
 -1-ylová, hex-3-en-1-ylová, hex-4-en-1-ylová,
 hex-5-en-1-ylová, 1-methylpent-1-en-1-ylová,
 2-methylpent-1-en-1-ylová, 3-methylpent-1-en-1-ylová,
 4-methylpent-1-en-1-ylová, 1-methylpent-2-en-1-ylová,
 2-methylpent-2-en-1-ylová, 3-methylpent-2-en-1-ylová,
 4-methylpent-2-en-1-ylová, 1-methylpent-3-en-1-ylová,
 2-methylpent-3-en-1-ylová, 3-methylpent-3-en-1-ylová,
 4-methylpent-3-en-1-ylová, 1-methylpent-4-en-1-ylová,
 2-methylpent-4-en-1-ylová, 3-methylpent-4-en-1-ylová,
 4-methylpent-4-en-1-ylová, 1,1-dimethylbut-2-en-
 -1-ylová, 1,1-dimethylbut-3-en-1-ylová, 1,2-di-
 methylbut-1-en-1-ylová, 1,2-dimethylbut-2-en-1-ylová,
 1,2-dimethylbut-3-en-1-ylová, 1,3-dimethylbut-1-en-
 -1-ylová, 1,3-dimethylbut-2-en-1-ylová, 1,3-di-
 methylbut-3-en-1-ylová, 2,2-dimethylbut-3-en-1-ylová,
 2,3-dimethylbut-1-en-1-ylová, 2,3-dimethylbut-2-en-
 -1-ylová, 2,3-dimethylbut-3-en-1-ylová, 3,3-dimethyl-

but-1-en-1-ylová, 3,3-dimethylbut-2-en-1-ylová,
1-ethylbut-1-en-1-ylová, 1-ethylbut-2-en-1-ylová,
1-ethylbut-3-en-1-ylová, 2-ethylbut-1-en-1-ylová,
2-ethylbut-2-en-1-ylová, 2-ethylbut-3-en-1-ylová,
1,1,2-trimethylprop-2-en-1-ylová, 1-ethyl-1-
-methylprop-2-en-1-ylová, 1-ethyl-2-methylprop-
-1-en-1-ylová a 1-ethyl-2-methylprop-2-en-1-ylová.

Fenylové kruhy jsou výhodně nesubstituované nebo nesou
1 až 3 atomy halogenu a/nebo 1 nitroskupinu, 1
kyanoskupinu, 1 nebo 2 skupiny methylové, trifluor-
methylové, methoxyskupiny nebo trifluormethoxyskupiny.

Důraz je kladen na ty 3-(heterocyklyl)-substituované
benzoylpyrazoly obecného vzorce I, ve kterých

R⁷ je hydroxylová skupina, alkoxyskupina s 1 až 6
atomy uhlíku, alkenyloxyskupina se 3 až 6 atomy
uhlíku, alkylsulfonyloxyskupina s 1 až 6 atomy uhlíku,
alkylkarbonyloxyskupina s 1 až 6 atomy uhlíku,
fenylsulfonyloxyskupina nebo fenylkarbonyloxyskupina,
ve kterých fenylový zbytek dvou naposledy uvedených
substituentů může být částečně nebo zcela halogenovaný
a/nebo může nést 1 až 3 následující skupiny:
nitroskupinu, kyanoskupinu, alkylovou skupinu s 1 až
4 atomy uhlíku, halogenalkylovou skupinu s 1 až 4
atomy uhlíku, alkoxyskupinu s 1 až 4 atomy uhlíku nebo
halogenalkoxyskupinu s 1 až 4 atomy uhlíku;

Výhodné jsou 3-(heterocyklyl)-substituované
benzoylpyrazoly obecného vzorce I, ve kterých

X je atom kyslíku;

R¹ je alkylová skupina s 1 až 4 atomy uhlíku;

zvláště výhodně methylová nebo ethylová skupina;

nejvýhodněji methylová skupina;

R², R³, R⁴ a R⁵ jsou atom vodíku, alkylová skupina s 1 až 4 atomy uhlíku nebo halogenalkylová skupina s 1 až 4 atomy uhlíku;

zvláště výhodně atom vodíku, methylová, ethylová, propylová, 1-methylethylová, fluormethylová nebo chlormethylová skupina;

nejvýhodněji atom vodíku, methylová, ethylová, nebo chlormethylová skupina;

R⁶ je alkylthioskupina s 1 až 4 atomy uhlíku nebo alkylsulfonylová skupina s 1 až 4 atomy uhlíku;

zvláště výhodně methylthioskupina, ethylthioskupina nebo 1-methyl-1-ethylthioskupina, methylsulfonylová skupina, ethylsulfonylová skupina, 1-methylethylsulfonylová skupina nebo propylsulfonylová skupina;

nejvýhodněji methylsulfonylová skupina, ethylsulfonylová skupina, 1-methylethylsulfonylová skupina nebo propylsulfonylová skupina;

R⁷ je hydroxylová skupina, alkoxykupina s 1 až 6 atomy uhlíku, alkenyloxyskupina se 3 až 6 atomy uhlíku, alkylsulfonyloxyskupina s 1 až 6 atomy uhlíku,

10.10.01

alkylkarbonyloxyskupina s 1 až 6 atomy uhlíku, C_{1-4} (alkylthio)karbonyloxyskupina, fenylsulfonyloxyskupina nebo fenylkarbonyloxyskupina, ve kterých fenylový zbytek dvou naposledy uvedených substituentů může být částečně nebo zcela halogenovaný a/nebo může nést 1 až 3 následující skupiny:

nitroskupinu, kyanoskupinu, alkylovou skupinu s 1 až 4 atomy uhlíku, halogenalkylovou skupinu s 1 až 4 atomy uhlíku, alkoxyskupinu s 1 až 4 atomy uhlíku nebo halogenalkoxyskupinu s 1 až 4 atomy uhlíku;

zvláště výhodně hydroxylová skupina, alkoxyskupina s 1 až 4 atomy uhlíku, alkenyloxyskupina se 3 až 6 atomy uhlíku, alkylsulfonyloxyskupina s 1 až 4 atomy uhlíku, alkylkarbonyloxyskupina s 1 až 4 atomy uhlíku, fenylsulfonyloxyskupina nebo fenylkarbonyloxyskupina, ve kterých fenylový zbytek dvou naposledy uvedených substituentů může být částečně nebo zcela halogenovaný a/nebo může nést 1 až 3 následující skupiny:

nitroskupinu, kyanoskupinu, alkylovou skupinu s 1 až 4 atomy uhlíku, halogenalkylovou skupinu s 1 až 4 atomy uhlíku, alkoxyskupinu s 1 až 4 atomy uhlíku nebo halogenalkoxyskupinu s 1 až 4 atomy uhlíku;

R^8 a R^9 jsou alkylová skupina s 1 až 4 atomy uhlíku;

zvláště výhodně skupina methylová, ethylová, propylová, 1-methyl-1-ethylová, butylová, 1-methyl-1-propylová a 2-methyl-1-propylová;

R^{10} je atom vodíku nebo alkylová skupina s 1 až 4 atomy

uhlíku;

zvláště výhodně alkylová skupina s 1 až 4 atomy uhlíku;

nejvýhodněji methylová, ethylová nebo propylová skupina;

R¹⁻¹ je atom vodíku nebo alkylová skupina s 1 až 4 atomy uhlíku;

zvláště výhodně atom vodíku nebo methylová skupina.

Zvláště výhodné jsou 3-(heterocyklyl)-substituované benzoylpyrazoly obecného vzorce I, ve kterých

X je atom kyslíku;

R¹ je alkylová skupina s 1 až 4 atomy uhlíku;

zvláště výhodně methylová nebo ethylová skupina;

nejvýhodněji methylová skupina;

R⁶ je alkylsulfonylová skupina s 1 až 4 atomy uhlíku;

zvláště výhodně methylsulfonylová skupina, ethylsulfonylová skupina, 1-methyl-1-ethylsulfonylová skupina nebo propylsulfonylová skupina;

R⁷ je hydroxylová skupina, alkylsulfonyloxyskupina s 1 až 6 atomy uhlíku, alkylkarbonyloxyskupina s 1 až 6 atomy uhlíku, fenylsulfonyloxyskupina nebo fenylkarbonyl-

10.10.01

oxyskupina, ve kterých fenylový zbytek dvou naposledy uvedených substituentů může být částečně nebo zcela halogenovaný a/nebo může nést 1 až 3 následující skupiny:

nitroskupinu, kyanoskupinu, alkylovou skupinu s 1 až 4 atomy uhlíku, halogenalkylovou skupinu s 1 až 4 atomy uhlíku, alkoxyskupinu s 1 až 4 atomy uhlíku nebo halogenalkoxyskupinu s 1 až 4 atomy uhlíku;

zvláště výhodně hydroxylová skupina;

R^8 a R^9 jsou alkylová skupina s 1 až 4 atomy uhlíku;

R^{10} je atom vodíku nebo alkylová skupina s 1 až 4 atomy uhlíku.

Velice výhodné jsou 3-(heterocyklyl)-substituované benzoylpyrazoly obecného vzorce I, ve kterých

R^8 je alkylová skupina se 2 až 4 atomy uhlíku, například ethylová, 1-methyl-1-ethylová, propylová nebo butylová skupina;

R^9 je alkylová skupina s 1 až 4 atomy uhlíku, například methylová, ethylová, propylová skupina nebo butylová skupina;

R^{10} je atom vodíku nebo alkylová skupina s 1 až 4 atomy uhlíku, například methylová nebo ethylová skupina.

Velice výhodné jsou rovněž 3-(heterocyklyl)-substituované benzoylpyrazoly obecného vzorce I, ve

10.10.01

kterých

R^8 je methylová skupina;

R^9 je alkylová skupina s 1 až 4 atomy uhlíku, například methylová, ethylová, propylová skupina nebo butylová skupina;

R^{10} je alkylová skupina s 1 až 4 atomy uhlíku, například methylová nebo ethylová skupina.

Velice výhodné jsou rovněž 3-(heterocyklyl)-substituované benzoylpyrazoly obecného vzorce I, ve kterých

R^8 a R^9 jsou methylová skupina;

R^{10} je atom vodíku.

Výhodné jsou rovněž 3-(heterocyklyl)-substituované benzoylpyrazoly obecného vzorce I, ve kterých

X je atom kyslíku;

R^1 je alkylová skupina s 1 až 4 atomy uhlíku;

zvláště výhodně methylová nebo ethylová skupina;

nejvýhodněji methylová skupina;

R^2 , R^3 , R^4 a R^5 jsou atom vodíku, alkylová skupina s 1 až 4 atomy uhlíku nebo halogenalkylová skupina s 1 až 4 atomy uhlíku;

zvláště výhodně atom vodíku, methylová, ethylová, propylová, 1-methyl-1-ethylová, chlormethylová nebo fluormethylová skupina;

nejvýhodněji atom vodíku, methylová, ethylová, nebo chlormethylová skupina;

R⁶ je atom halogenu, nitroskupina, halogenalkylová skupina s 1 až 4 atomy uhlíku, alkoxykupina s 1 až 4 atomy uhlíku nebo halogenalkoxykupina s 1 až 4 atomy uhlíku;

zvláště výhodně atom halogenu, jako je atom chloru nebo bromu, nitroskupina, halogenalkylová skupina s 1 až 2 atomy uhlíku, jako je difluormethylová nebo trifluormethylová skupina, alkoxykupina s 1 až 2 atomy uhlíku nebo halogenalkoxykupina s 1 až 2 atomy uhlíku, jako je difluoromethoxykupina nebo trifluoromethoxykupina;

R⁷ je hydroxylová skupina, alkoxykupina s 1 až 6 atomy uhlíku, alkenyloxykupina se 3 až 6 atomy uhlíku, alkylsulfonyloxykupina s 1 až 6 atomy uhlíku, alkylkarbonyloxykupina s 1 až 6 atomy uhlíku, C₁₋₄(alkylthio)karbonyloxykupina, fenylsulfonyloxykupina nebo fenylkarbonyloxykupina, ve kterých fenylový zbytek dvou naposledy uvedených substituentů může být částečně nebo zcela halogenovaný a/nebo může nést 1 až 3 následující skupiny:

nitroskupinu, kyanoskupinu, alkylovou skupinu s 1 až 4 atomy uhlíku, halogenalkylovou skupinu s 1 až 4

atomy uhlíku, alkoxy skupinu s 1 až 4 atomy uhlíku nebo halogenalkoxy skupinu s 1 až 4 atomy uhlíku;

zvláště výhodně hydroxylová skupina, alkoxy skupina s 1 až 4 atomy uhlíku, alkenyloxy skupina se 3 až 6 atomy uhlíku, alkylsulfonyloxy skupina s 1 až 4 atomy uhlíku, alkylkarbonyloxy skupina s 1 až 4 atomy uhlíku, fenylsulfonyloxy skupina nebo fenylkarbonyloxy skupina, ve kterých fenylový zbytek dvou naposledy uvedených substituentů může být částečně nebo zcela halogenovaný a/nebo může nést 1 až 3 následující skupiny:

nitroskupinu, kyanoskupinu, alkylovou skupinu s 1 až 4 atomy uhlíku, halogenalkylovou skupinu s 1 až 4 atomy uhlíku, alkoxy skupinu s 1 až 4 atomy uhlíku nebo halogenalkoxy skupinu s 1 až 4 atomy uhlíku;

R^8 a R^9 jsou alkylová skupina s 1 až 4 atomy uhlíku;

zvláště výhodně skupina methylová, ethylová, propylová, 1-methyl-1-ethylová, butylová, 1-methyl-1-propylová a 2-methyl-1-propylová;

R^{10} je atom vodíku nebo alkylová skupina s 1 až 4 atomy uhlíku;

zvláště výhodně alkylová skupina s 1 až 4 atomy uhlíku;

nejvýhodněji methylová, ethylová nebo propylová skupina;

R^{11} je atom vodíku nebo alkylová skupina s 1 až 4 atomy

uhlíku;

zvláště výhodně atom vodíku nebo methylová skupina.

Zvláště výhodné jsou 3-(heterocyklyl)-substituované benzoylpyrazoly obecného vzorce I, ve kterých

X je atom kyslíku;

R¹ je alkylová skupina s 1 až 4 atomy uhlíku;

zvláště výhodně methylová nebo ethylová skupina;

nejvýhodněji methylová skupina;

R⁶ je atom halogenu, nitroskupina, halogenalkylová skupina s 1 až 4 atomy uhlíku, alkoxyskupina s 1 až 4 atomy uhlíku nebo halogenalkoxyskupina s 1 až 4 atomy uhlíku;

zvláště výhodně atom halogenu, jako je atom chloru nebo bromu, nitroskupina, halogenalkylová skupina s 1 až 2 atomy uhlíku, jako je difluormethylová nebo trifluormethylová skupina, alkoxyskupina s 1 až 2 atomy uhlíku nebo halogenalkoxyskupina s 1 až 2 atomy uhlíku, jako je difluoromethoxyskupina;

R⁷ je hydroxylová skupina, alkylsulfonyloxyskupina s 1 až 6 atomy uhlíku, alkylkarbonyloxyskupina s 1 až 6 atomy uhlíku, fenylsulfonyloxyskupina nebo fenylkarbonyloxyskupina, ve kterých fenylový zbytek dvou naposledy uvedených substituentů může být částečně nebo zcela halogenovaný a/nebo může nést 1 až

3 následující skupiny:

nitroskupinu, kyanoskupinu, alkylovou skupinu s 1 až 4 atomy uhlíku, halogenalkylovou skupinu s 1 až 4 atomy uhlíku, alkoxykupinu s 1 až 4 atomy uhlíku nebo halogenalkoxykupinu s 1 až 4 atomy uhlíku;

zvláště výhodně hydroxylová skupina;

R^8 a R^9 jsou alkylová skupina s 1 až 4 atomy uhlíku;

R^{10} je atom vodíku nebo alkylová skupina s 1 až 4 atomy uhlíku.

Velice výhodné jsou 3-(heterocyklyl)-substituované benzoylpyrazoly obecného vzorce I, ve kterých

R^8 je alkylová skupina se 2 až 4 atomy uhlíku, například ethylová, 1-methyl-1-ethylová, propylová nebo butylová skupina;

R^9 je alkylová skupina s 1 až 4 atomy uhlíku, například methylová nebo ethylová skupina;

R^{10} je atom vodíku nebo alkylová skupina s 1 až 4 atomy uhlíku, například methylová nebo ethylová skupina.

Velice výhodné jsou rovněž 3-(heterocyklyl)-substituované benzoylpyrazoly obecného vzorce I, ve kterých

R^8 je methylová skupina;

10.10.01

R^9 je alkylová skupina s 1 až 4 atomy uhlíku, například methylová, ethylová, propylová skupina nebo butylová skupina;

R^{10} je alkylová skupina s 1 až 4 atomy uhlíku, například methylová nebo ethylová skupina.

Velice výhodné jsou rovněž 3-(heterocyklyl)-substituované benzoylpyrazoly obecného vzorce I, ve kterých

R^8 a R^9 jsou methylová skupina;

R^{10} je atom vodíku.

Výhodné jsou rovněž 3-(heterocyklyl)-substituované benzoylpyrazoly obecného vzorce I, ve kterých

X je $N(C_{1-6})$ alkylová skupina;

zvláště výhodně N-methylová, N-ethylová, N-(1-methyl-1-ethylová) nebo N-propylová skupina;

R^1 je alkylová skupina s 1 až 6 atomy uhlíku;

zvláště výhodně methylová nebo ethylová skupina;

nejvýhodněji methylová skupina;

R^2 , R^3 , R^4 a R^5 jsou atom vodíku, alkylová skupina s 1 až 4 atomy uhlíku nebo halogenalkylová skupina s 1 až 4 atomy uhlíku;

zvláště výhodně atom vodíku, methylová, ethylová, propylová, 1-methyl-1-ethylová, fluormethylová nebo chlormethylová skupina;

nejvýhodněji atom vodíku, methylová, ethylová, nebo chlormethylová skupina;

R⁶ je atom halogenu, nitroskupina, halogenalkylová skupina s 1 až 4 atomy uhlíku, alkoxyskupina s 1 až 4 atomy uhlíku, halogenalkoxy skupina s 1 až 4 atomy uhlíku, alkylthioskupina s 1 až 4 atomy uhlíku, halogenalkylthioskupina s 1 až 4 atomy uhlíku, alkylsulfonylová skupina s 1 až 4 atomy uhlíku nebo halogenalkylsulfonylová skupina s 1 až 4 atomy uhlíku;

zvláště výhodně atom halogenu, jako je atom fluoru, chloru nebo bromu, nitroskupina, halogenalkylová skupina s 1 až 4 atomy uhlíku, jako je difluormethylová nebo trifluormethylová skupina, alkoxyskupina s 1 až 4 atomy uhlíku, jako je methoxyskupina nebo ethoxyskupina, halogenalkoxy skupina s 1 až 4 atomy uhlíku, jako je difluormethoxy skupina, chlordinfluormethoxyskupina nebo trifluormethoxyskupina, alkylthioskupina s 1 až 4 atomy uhlíku, jako je methylthioskupina nebo ethylthioskupina, alkylsulfonylová skupina s 1 až 4 atomy uhlíku, jako je methylsulfonylová, ethylsulfonylová, 1-methyl-1-ethylsulfonylová nebo propylsulfonylová skupina;

R⁷ je hydroxylová skupina, alkoxyskupina s 1 až 6 atomy uhlíku, alkenyloxyskupina se 3 až 6 atomy uhlíku, alkylsulfonyloxyskupina s 1 až 6 atomy uhlíku, alkylkarbonyloxyskupina s 1 až 6 atomy uhlíku,

C_{1-4} (alkylthio)karbonyloxyskupina, fenylsulfonyl-oxyskupina nebo fenylkarbonyloxyskupina, ve kterých fenylový zbytek dvou naposledy uvedených substituentů může být částečně nebo zcela halogenovaný a/nebo může nést 1 až 3 následující skupiny:

nitroskupinu, kyanoskupinu, alkylovou skupinu s 1 až 4 atomy uhlíku, halogenalkylovou skupinu s 1 až 4 atomy uhlíku, alkoxyskupinu s 1 až 4 atomy uhlíku nebo halogenalkoxyskupinu s 1 až 4 atomy uhlíku;

zvláště výhodně hydroxylová skupina, alkoxyskupina s 1 až 4 atomy uhlíku, alkenyloxyskupina se 3 až 6 atomy uhlíku, alkylsulfonyloxyskupina s 1 až 4 atomy uhlíku, alkylkarbonyloxyskupina s 1 až 4 atomy uhlíku, fenylsulfonyloxyskupina nebo fenylkarbonyloxyskupina, ve kterých fenylový zbytek dvou naposledy uvedených substituentů může být částečně nebo zcela halogenovaný a/nebo může nést 1 až 3 následující skupiny:

nitroskupinu, kyanoskupinu, alkylovou skupinu s 1 až 4 atomy uhlíku, halogenalkylovou skupinu s 1 až 4 atomy uhlíku, alkoxyskupinu s 1 až 4 atomy uhlíku nebo halogenalkoxyskupinu s 1 až 4 atomy uhlíku;

R^8 a R^9 jsou alkylová skupina s 1 až 4 atomy uhlíku;

zvláště výhodně skupina methylová, ethylová, propylová, 1-methyl-1-ethylová, butylová, 1-methyl-1-propylová a 2-methyl-1-propylová;

R^{10} je atom vodíku nebo alkylová skupina s 1 až 4 atomy uhlíku;

zvláště výhodně alkylová skupina s 1 až 4 atomy uhlíku;

nejvýhodněji methylová, ethylová nebo propylová skupina;

R^{1-1} je atom vodíku nebo alkylová skupina s 1 až 4 atomy uhlíku;

zvláště výhodně atom vodíku nebo methylová skupina.

Zvláště výhodné jsou 3-(heterocyklyl)-substituované benzoylpyrazoly obecného vzorce I, ve kterých

R^7 je hydroxylová skupina, alkylsulfonyloxyskupina s 1 až 6 atomy uhlíku, alkylkarbonyloxyskupina s 1 až 6 atomy uhlíku, fenylsulfonyloxyskupina nebo fenylkarbonyloxyskupina, ve kterých fenylový zbytek dvou naposledy uvedených substituentů může být částečně nebo zcela halogenovaný a/nebo může nést 1 až 3 následující skupiny: nitroskupinu, kyanoskupinu, alkylovou skupinu s 1 až 4 atomy uhlíku, halogenalkylovou skupinu s 1 až 4 atomy uhlíku, alkoxyskupinu s 1 až 4 atomy uhlíku nebo halogenalkoxyskupinu s 1 až 4 atomy uhlíku;

zvláště výhodně hydroxylová skupina.

Výhodné jsou rovněž 3-(heterocyklyl)-substituované benzoylpyrazoly obecného vzorce I, ve kterých proměnné jsou, jak jsou definovány níže:

X je atom kyslíku;

R¹ je alkylová skupina s 1 až 4 atomy uhlíku;

zvláště výhodně methylová nebo ethylová skupina;

R², R³, R⁴ a R⁵ jsou atom vodíku, alkylová skupina s 1 až 4 atomy uhlíku nebo halogenalkylová skupina s 1 až 4 atomy uhlíku;

zvláště výhodně atom vodíku nebo halogenalkylová skupina s 1 až 4 atomy uhlíku;

R⁶ je alkylsulfonylová skupina s 1 až 4 atomy uhlíku;

zvláště výhodně methylsulfonylová skupina;

R⁷ je hydroxylová skupina, alkoxykupina s 1 až 6 atomy uhlíku, alkylkarbonyloxyskupina s 1 až 6 atomy uhlíku, C₁₋₄ (alkylthio)karbonyloxyskupina, fenylsulfonyloxyskupina nebo fenylkarbonyloxyskupina, ve kterých fenylový zbytek dvou naposledy uvedených substituentů může být částečně nebo zcela halogenovaný a/nebo může nést 1 až 3 následující skupiny:

nitroskupinu, kyanoskupinu, alkylovou skupinu s 1 až 4 atomy uhlíku, halogenalkylovou skupinu s 1 až 4 atomy uhlíku, alkoxykupinu s 1 až 4 atomy uhlíku nebo halogenalkoxykupinu s 1 až 4 atomy uhlíku;

zvláště výhodně hydroxylová skupina, alkoxykupina s 1 až 4 atomy uhlíku nebo fenylkarbonyloxyskupina, ve které fenylový zbytek může být (mezera) nebo zcela

10.10.01

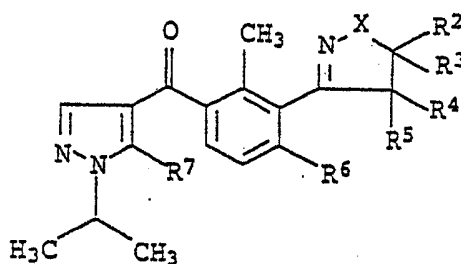
halogenovaný a/nebo může nést 1 až 3 halogenalkylové zbytky s 1 až 4 atomy uhlíku;

R^8 a R^9 jsou alkylová skupina s 1 až 4 atomy uhlíku;

R^{10} je atom vodíku nebo alkylová skupina s 1 až 4 atomy uhlíku;

R^{11} je atom vodíku nebo alkylová skupina s 1 až 4 atomy uhlíku.

Zejména jsou zvláště výhodné sloučeniny obecného vzorce Ia1 (=I, kde R^1 , R^8 a R^9 jsou methylová skupina; R^{10} a R^{11} jsou atom vodíku), obzvláště sloučeniny Ia1.1 až Ia1.300 z tabulky 1, kde definice zbytků X a R^1 až R^{11} mají pro sloučeniny podle tohoto vynálezu obzvláštní význam, nejen v kombinaci s ostatními, ale ve všech případech rovněž samotné.



Ia1

Tabulka 1

Čís.	X	R^2	R^3	R^4	R^5	R^6	R^7
Ia1.1	O	H	H	H	H	SCH ₃	OH
Ia1.2	O	H	H	H	H	SCH ₂ CH ₃	OH
Ia1.3	O	H	H	H	H	SO ₂ CH ₃	OH
Ia1.4	O	H	H	H	H	SO ₂ CH ₂ CH ₃	OH
Ia1.5	O	H	H	H	H	SO ₂ CH(CH ₃) ₂	OH

10.10.01

Ia1.6	O	H	H	H	H	SO ₂ (CH ₂) ₂ CH ₃	OH
Ia1.7	O	H	H	H	H	Cl	OH
Ia1.8	O	H	H	H	H	Br	OH
Ia1.9	O	H	H	H	H	NO ₂	OH
Ia1.10	O	H	H	H	H	CHF ₂	OH
Ia1.11	O	H	H	H	H	CF ₃	OH
Ia1.12	O	H	H	H	H	OCH ₃	OH
Ia1.13	O	H	H	H	H	OCH ₂ CH ₃	OH
Ia1.14	O	H	H	H	H	OCHF ₂	OH
Ia1.15	O	H	H	H	H	OCF ₃	OH
Ia1.16	O	CH ₃	H	H	H	SCH ₃	OH
Ia1.17	O	CH ₃	H	H	H	SCH ₂ CH ₃	OH
Ia1.18	O	CH ₃	H	H	H	SO ₂ CH ₃	OH
Ia1.19	O	CH ₃	H	H	H	SO ₂ CH ₂ CH ₃	OH
Ia1.20	O	CH ₃	H	H	H	SO ₂ CH(CH ₃) ₂	OH
Ia1.21	O	CH ₃	H	H	H	SO ₂ (CH ₂) ₂ CH ₃	OH
Ia1.22	O	CH ₃	H	H	H	Cl	OH
Ia1.23	O	CH ₃	H	H	H	Br	OH
Ia1.24	O	CH ₃	H	H	H	NO ₂	OH
Ia1.25	O	CH ₃	H	H	H	CHF ₂	OH
Ia1.26	O	CH ₃	H	H	H	CF ₃	OH
Ia1.27	O	CH ₃	H	H	H	OCH ₃	OH
Ia1.28	O	CH ₃	H	H	H	OCH ₂ CH ₃	OH
Ia1.29	O	CH ₃	H	H	H	OCHF ₂	OH
Ia1.30	O	CH ₃	H	H	H	OCF ₃	OH
Ia1.31	O	H	H	CH ₃	H	SCH ₃	OH
Ia1.32	O	H	H	CH ₃	H	SCH ₂ CH ₃	OH
Ia1.33	O	H	H	CH ₃	H	SO ₂ CH ₃	OH
Ia1.34	O	H	H	CH ₃	H	SO ₂ CH ₂ CH ₃	OH
Ia1.35	O	H	H	CH ₃	H	SO ₂ CH(CH ₃) ₂	OH
Ia1.36	O	H	H	CH ₃	H	SO ₂ (CH ₂) ₂ CH ₃	OH
Ia1.37	O	H	H	CH ₃	H	Cl	OH
Ia1.38	O	H	H	CH ₃	H	Br	OH

10.10.01

Ia1.39	O	H	H	CH ₃	H	NO ₂	OH
Ia1.40	O	H	H	CH ₃	H	CHF ₂	OH
Ia1.41	O	H	H	CH ₃	H	CF ₃	OH
Ia1.42	O	H	H	CH ₃	H	OCH ₃	OH
Ia1.43	O	H	H	CH ₃	H	OCH ₂ CH ₃	OH
Ia1.44	O	H	H	CH ₃	H	OCHF ₂	OH
Ia1.45	O	H	H	CH ₃	H	OCF ₃	OH
Ia1.46	O	CH ₃	CH ₃	H	H	SCH ₃	OH
Ia1.47	O	CH ₃	CH ₃	H	H	SCH ₂ CH ₃	OH
Ia1.48	O	CH ₃	CH ₃	H	H	SO ₂ CH ₃	OH
Ia1.49	O	CH ₃	CH ₃	H	H	SO ₂ CH ₂ CH ₃	OH
Ia1.50	O	CH ₃	CH ₃	H	H	SO ₂ CH(CH ₃) ₂	OH
Ia1.51	O	CH ₃	CH ₃	H	H	SO ₂ (CH ₂) ₂ CH ₃	OH
Ia1.52	O	CH ₃	CH ₃	H	H	Cl	OH
Ia1.53	O	CH ₃	CH ₃	H	H	Br	OH
Ia1.54	O	CH ₃	CH ₃	H	H	NO ₂	OH
Ia1.55	O	CH ₃	CH ₃	H	H	CHF ₂	OH
Ia1.56	O	CH ₃	CH ₃	H	H	CF ₃	OH
Ia1.57	O	CH ₃	CH ₃	H	H	OCH ₃	OH
Ia1.58	O	CH ₃	CH ₃	H	H	OCH ₂ CH ₃	OH
Ia1.59	O	CH ₃	CH ₃	H	H	OCHF ₂	OH
Ia1.60	O	CH ₃	CH ₃	H	H	OCF ₃	OH
Ia1.61	O	CH ₃	H	CH ₃	H	SCH ₃	OH
Ia1.62	O	CH ₃	H	CH ₃	H	SCH ₂ CH ₃	OH
Ia1.63	O	CH ₃	H	CH ₃	H	SO ₂ CH ₃	OH
Ia1.64	O	CH ₃	H	CH ₃	H	SO ₂ CH ₂ CH ₃	OH
Ia1.65	O	CH ₃	H	CH ₃	H	SO ₂ CH(CH ₃) ₂	OH
Ia1.66	O	CH ₃	H	CH ₃	H	SO ₂ (CH ₂) ₂ CH ₃	OH
Ia1.67	O	CH ₃	H	CH ₃	H	Cl	OH
Ia1.68	O	CH ₃	H	CH ₃	H	Br	OH
Ia1.69	O	CH ₃	H	CH ₃	H	NO ₂	OH
Ia1.70	O	CH ₃	H	CH ₃	H	CHF ₂	OH
Ia1.71	O	CH ₃	H	CH ₃	H	CF ₃	OH
Ia1.72	O	CH ₃	H	CH ₃	H	OCH ₃	OH
Ia1.73	O	CH ₃	H	CH ₃	H	OCH ₂ CH ₃	OH
Ia1.74	O	CH ₃	H	CH ₃	H	OCHF ₂	OH
Ia1.75	O	CH ₃	H	CH ₃	H	OCF ₃	OH
Ia1.76	O	H	H	CH ₃	CH ₃	SCH ₃	OH
Ia1.77	O	H	H	CH ₃	CH ₃	SCH ₂ CH ₃	OH

10.10.01

Ia1.78	O	H	H	CH ₃	CH ₃	SO ₂ CH ₃	OH
Ia1.79	O	H	H	CH ₃	CH ₃	SO ₂ CH ₂ CH ₃	OH
Ia1.80	O	H	H	CH ₃	CH ₃	SO ₂ CH(CH ₃) ₂	OH
Ia1.81	O	H	H	CH ₃	CH ₃	SO ₂ (CH ₂) ₂ CH ₃	OH
Ia1.82	O	H	H	CH ₃	CH ₃	Cl	OH
Ia1.83	O	H	H	CH ₃	CH ₃	Br	OH
Ia1.84	O	H	H	CH ₃	CH ₃	NO ₂	OH
Ia1.85	O	H	H	CH ₃	CH ₃	CHF ₂	OH
Ia1.86	O	H	H	CH ₃	CH ₃	CF ₃	OH
Ia1.87	O	H	H	CH ₃	CH ₃	OCH ₃	OH
Ia1.88	O	H	H	CH ₃	CH ₃	OCH ₂ CH ₃	OH
Ia1.89	O	H	H	CH ₃	CH ₃	OCHF ₂	OH
Ia1.90	O	H	H	CH ₃	CH ₃	OCF ₃	OH
Ia1.91	O	CH ₃	CH ₃	CH ₃	H	SCH ₃	OH
Ia1.92	O	CH ₃	CH ₃	CH ₃	H	SCH ₂ CH ₃	OH
Ia1.93	O	CH ₃	CH ₃	CH ₃	H	SO ₂ CH ₃	OH
Ia1.94	O	CH ₃	CH ₃	CH ₃	H	SO ₂ CH ₂ CH ₃	OH
Ia1.95	O	CH ₃	CH ₃	CH ₃	H	SO ₂ CH(CH ₃) ₂	OH
Ia1.96	O	CH ₃	CH ₃	CH ₃	H	SO ₂ (CH ₂) ₂ CH ₃	OH
Ia1.97	O	CH ₃	CH ₃	CH ₃	H	Cl	OH
Ia1.98	O	CH ₃	CH ₃	CH ₃	H	Br	OH
Ia1.99	O	CH ₃	CH ₃	CH ₃	H	NO ₂	OH
Ia1.100	O	CH ₃	CH ₃	CH ₃	H	CHF ₂	OH
Ia1.101	O	CH ₃	CH ₃	CH ₃	H	CF ₃	OH
Ia1.102	O	CH ₃	CH ₃	CH ₃	H	OCH ₃	OH
Ia1.103	O	CH ₃	CH ₃	CH ₃	H	OCH ₂ CH ₃	OH
Ia1.104	O	CH ₃	CH ₃	CH ₃	H	OCHF ₂	OH
Ia1.105	O	CH ₃	CH ₃	CH ₃	H	OCF ₃	OH
Ia1.106	O	CH ₃	H	CH ₃	CH ₃	SCH ₃	OH
Ia1.107	O	CH ₃	H	CH ₃	CH ₃	SCH ₂ CH ₃	OH
Ia1.108	O	CH ₃	H	CH ₃	CH ₃	SO ₂ CH ₃	OH
Ia1.109	O	CH ₃	H	CH ₃	CH ₃	SO ₂ CH ₂ CH ₃	OH
Ia1.110	O	CH ₃	H	CH ₃	CH ₃	SO ₂ CH(CH ₃) ₂	OH
Ia1.111	O	CH ₃	H	CH ₃	CH ₃	SO ₂ (CH ₂) ₂ CH ₃	OH
Ia1.112	O	CH ₃	H	CH ₃	CH ₃	Cl	OH
Ia1.113	O	CH ₃	H	CH ₃	CH ₃	Br	OH
Ia1.114	O	CH ₃	H	CH ₃	CH ₃	NO ₂	OH
Ia1.115	O	CH ₃	H	CH ₃	CH ₃	CHF ₂	OH
Ia1.116	O	CH ₃	H	CH ₃	CH ₃	CF ₃	OH
Ia1.117	O	CH ₃	H	CH ₃	CH ₃	OCH ₃	OH
Ia1.118	O	CH ₃	H	CH ₃	CH ₃	OCH ₂ CH ₃	OH
Ia1.119	O	CH ₃	H	CH ₃	CH ₃	OCHF ₂	OH

10.10.01

Ia1.120	O	CH ₃	H	CH ₃	CH ₃	OCF ₃	OH
Ia1.121	O	CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃	SCH ₃	OH
Ia1.122	O	CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃	SCH ₂ CH ₃	OH
Ia1.123	O	CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃	SO ₂ CH ₃	OH
Ia1.124	O	CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃	SO ₂ CH ₂ CH ₃	OH
Ia1.125	O	CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃	SO ₂ CH(CH ₃) ₂	OH
Ia1.126	O	CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃	SO ₂ (CH ₂) ₂ CH ₃	OH
Ia1.127	O	CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃	Cl	OH
Ia1.128	O	CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃	Br	OH
Ia1.129	O	CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃	NO ₂	OH
Ia1.130	O	CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃	CHF ₂	OH
Ia1.131	O	CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃	CF ₃	OH
Ia1.132	O	CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃	OCH ₃	OH
Ia1.133	O	CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃	OCH ₂ CH ₃	OH
Ia1.134	O	CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃	OCHF ₂	OH
Ia1.135	O	CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃	OCF ₃	OH
Ia1.136	O	CH ₂ Cl	H	H	H	SCH ₃	OH
Ia1.137	O	CH ₂ Cl	H	H	H	SCH ₂ CH ₃	OH
Ia1.138	O	CH ₂ Cl	H	H	H	SO ₂ CH ₃	OH
Ia1.139	O	CH ₂ Cl	H	H	H	SO ₂ CH ₂ CH ₃	OH
Ia1.140	O	CH ₂ Cl	H	H	H	SO ₂ CH(CH ₃) ₂	OH
Ia1.141	O	CH ₂ Cl	H	H	H	SO ₂ (CH ₂) ₂ CH ₃	OH
Ia1.142	O	CH ₂ Cl	H	H	H	Cl	OH
Ia1.143	O	CH ₂ Cl	H	H	H	Br	OH
Ia1.144	O	CH ₂ Cl	H	H	H	NO ₂	OH
Ia1.145	O	CH ₂ Cl	H	H	H	CHF ₂	OH
Ia1.146	O	CH ₂ Cl	H	H	H	CF ₃	OH
Ia1.147	O	CH ₂ Cl	H	H	H	OCH ₃	OH
Ia1.148	O	CH ₂ Cl	H	H	H	OCH ₂ CH ₃	OH
Ia1.149	O	CH ₂ Cl	H	H	H	OCHF ₂	OH
Ia1.150	O	CH ₂ Cl	H	H	H	OCF ₃	OH
Ia1.151	NCH ₃	H	H	H	H	SCH ₃	OH
Ia1.152	NCH ₃	H	H	H	H	SCH ₂ CH ₃	OH
Ia1.153	NCH ₃	H	H	H	H	SO ₂ CH ₃	OH
Ia1.154	NCH ₃	H	H	H	H	SO ₂ CH ₂ CH ₃	OH
Ia1.155	NCH ₃	H	H	H	H	SO ₂ CH(CH ₃) ₂	OH
Ia1.156	NCH ₃	H	H	H	H	SO ₂ (CH ₂) ₂ CH ₃	OH
Ia1.157	NCH ₃	H	H	H	H	Cl	OH
Ia1.158	NCH ₃	H	H	H	H	Br	OH
Ia1.159	NCH ₃	H	H	H	H	NO ₂	OH
Ia1.160	NCH ₃	H	H	H	H	CHF ₂	OH

10.10.01

Ia1.161	NCH ₃	H	H	H	H	CF ₃	OH
Ia1.162	NCH ₃	H	H	H	H	OCH ₃	OH
Ia1.163	NCH ₃	H	H	H	H	OCH ₂ CH ₃	OH
Ia1.164	NCH ₃	H	H	H	H	OCHF ₂	OH
Ia1.165	NCH ₃	H	H	H	H	OCF ₃	OH
Ia1.166	NCH ₃	CH ₃	H	H	H	SCH ₃	OH
Ia1.167	NCH ₃	CH ₃	H	H	H	SCH ₂ CH ₃	OH
Ia1.168	NCH ₃	CH ₃	H	H	H	SO ₂ CH ₃	OH
Ia1.169	NCH ₃	CH ₃	H	H	H	SO ₂ CH ₂ CH ₃	OH
Ia1.170	NCH ₃	CH ₃	H	H	H	SO ₂ CH(CH ₃) ₂	OH
Ia1.171	NCH ₃	CH ₃	H	H	H	SO ₂ (CH ₂) ₂ CH ₃	OH
Ia1.172	NCH ₃	CH ₃	H	H	H	Cl	OH
Ia1.173	NCH ₃	CH ₃	H	H	H	Br	OH
Ia1.174	NCH ₃	CH ₃	H	H	H	NO ₂	OH
Ia1.175	NCH ₃	CH ₃	H	H	H	CHF ₂	OH
Ia1.176	NCH ₃	CH ₃	H	H	H	CF ₃	OH
Ia1.177	NCH ₃	CH ₃	H	H	H	OCH ₃	OH
Ia1.178	NCH ₃	CH ₃	H	H	H	OCH ₂ CH ₃	OH
Ia1.179	NCH ₃	CH ₃	H	H	H	OCHF ₂	OH
Ia1.180	NCH ₃	CH ₃	H	H	H	OCF ₃	OH
Ia1.181	NCH ₃	H	H	CH ₃	H	SCH ₃	OH
Ia1.182	NCH ₃	H	H	CH ₃	H	SCH ₂ CH ₃	OH
Ia1.183	NCH ₃	H	H	CH ₃	H	SO ₂ CH ₃	OH
Ia1.184	NCH ₃	H	H	CH ₃	H	SO ₂ CH ₂ CH ₃	OH
Ia1.185	NCH ₃	H	H	CH ₃	H	SO ₂ CH(CH ₃) ₂	OH
Ia1.186	NCH ₃	H	H	CH ₃	H	SO ₂ (CH ₂) ₂ CH ₃	OH
Ia1.187	NCH ₃	H	H	CH ₃	H	Cl	OH
Ia1.190	NCH ₃	H	H	CH ₃	H	CHF ₂	OH
Ia1.191	NCH ₃	H	H	CH ₃	H	CF ₃	OH
Ia1.192	NCH ₃	H	H	CH ₃	H	OCH ₃	OH
Ia1.193	NCH ₃	H	H	CH ₃	H	OCH ₂ CH ₃	OH
Ia1.194	NCH ₃	H	H	CH ₃	H	OCHF ₂	OH
Ia1.195	NCH ₃	H	H	CH ₃	H	OCF ₃	OH
Ia1.196	NCH ₃	CH ₃	CH ₃	H	H	SCH ₃	OH
Ia1.197	NCH ₃	CH ₃	CH ₃	H	H	SCH ₂ CH ₃	OH
Ia1.198	NCH ₃	CH ₃	CH ₃	H	H	SO ₂ CH ₃	OH
Ia1.199	NCH ₃	CH ₃	CH ₃	H	H	SO ₂ CH ₂ CH ₃	OH
Ia1.200	NCH ₃	CH ₃	CH ₃	H	H	SO ₂ CH(CH ₃) ₂	OH

10.10.01

Ia1.201	NCH ₃	CH ₃	CH ₃	H	H	SO ₂ (CH ₂) ₂ CH ₃	OH
Ia1.202	NCH ₃	CH ₃	CH ₃	H	H	Cl	OH
Ia1.203	NCH ₃	CH ₃	CH ₃	H	H	Br	OH
Ia1.204	NCH ₃	CH ₃	CH ₃	H	H	NO ₂	OH
Ia1.205	NCH ₃	CH ₃	CH ₃	H	H	CHF ₂	OH
Ia1.206	NCH ₃	CH ₃	CH ₃	H	H	CF ₃	OH
Ia1.207	NCH ₃	CH ₃	CH ₃	H	H	OCH ₃	OH
Ia1.208	NCH ₃	CH ₃	CH ₃	H	H	OCH ₂ CH ₃	OH
Ia1.209	NCH ₃	CH ₃	CH ₃	H	H	OCHF ₂	OH
Ia1.210	NCH ₃	CH ₃	CH ₃	H	H	OCF ₃	OH
Ia1.211	NCH ₃	CH ₃	H	CH ₃	H	SCH ₃	OH
Ia1.212	NCH ₃	CH ₃	H	CH ₃	H	SCH ₂ CH ₃	OH
Ia1.213	NCH ₃	CH ₃	H	CH ₃	H	SO ₂ CH ₃	OH
Ia1.214	NCH ₃	CH ₃	H	CH ₃	H	SO ₂ CH ₂ CH ₃	OH
Ia1.215	NCH ₃	CH ₃	H	CH ₃	H	SO ₂ CH(CH ₃) ₂	OH
Ia1.216	NCH ₃	CH ₃	H	CH ₃	H	SO ₂ (CH ₂) ₂ CH ₃	OH
Ia1.217	NCH ₃	CH ₃	H	CH ₃	H	Cl	OH
Ia1.218	NCH ₃	CH ₃	H	CH ₃	H	Br	OH
Ia1.219	NCH ₃	CH ₃	H	CH ₃	H	NO ₂	OH
Ia1.220	NCH ₃	CH ₃	H	CH ₃	H	CHF ₂	OH
Ia1.221	NCH ₃	CH ₃	H	CH ₃	H	CF ₃	OH
Ia1.222	NCH ₃	CH ₃	H	CH ₃	H	OCH ₃	OH
Ia1.223	NCH ₃	CH ₃	H	CH ₃	H	OCH ₂ CH ₃	OH
Ia1.224	NCH ₃	CH ₃	H	CH ₃	H	OCHF ₂	OH
Ia1.225	NCH ₃	CH ₃	H	CH ₃	H	OCF ₃	OH
Ia1.226	NCH ₃	H	H	CH ₃	CH ₃	SCH ₃	OH
Ia1.227	NCH ₃	H	H	CH ₃	CH ₃	SCH ₂ CH ₃	OH
Ia1.228	NCH ₃	H	H	CH ₃	CH ₃	SO ₂ CH ₃	OH
Ia1.229	NCH ₃	H	H	CH ₃	CH ₃	SO ₂ CH ₂ CH ₃	OH
Ia1.230	NCH ₃	H	H	CH ₃	CH ₃	SO ₂ CH(CH ₃) ₂	OH
Ia1.231	NCH ₃	H	H	CH ₃	CH ₃	SO ₂ (CH ₂) ₂ CH ₃	OH
Ia1.232	NCH ₃	H	H	CH ₃	CH ₃	Cl	OH
Ia1.233	NCH ₃	H	H	CH ₃	CH ₃	Br	OH
Ia1.234	NCH ₃	H	H	CH ₃	CH ₃	NO ₂	OH
Ia1.235	NCH ₃	H	H	CH ₃	CH ₃	CHF ₂	OH
Ia1.236	NCH ₃	H	H	CH ₃	CH ₃	CF ₃	OH
Ia1.237	NCH ₃	H	H	CH ₃	CH ₃	OCH ₃	OH
Ia1.238	NCH ₃	H	H	CH ₃	CH ₃	OCH ₂ CH ₃	OH
Ia1.239	NCH ₃	H	H	CH ₃	CH ₃	OCHF ₂	OH

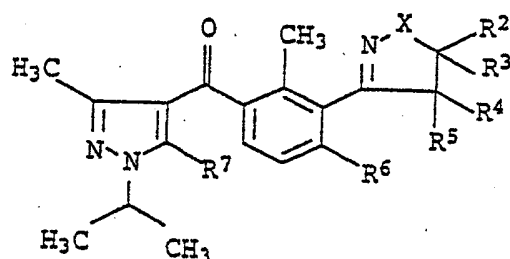
10.10.01

Ia1.240	NCH ₃	H	H	CH ₃	CH ₃	OCF ₃	OH
Ia1.241	NCH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃	H	SCH ₃	OH
Ia1.242	NCH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃	H	SCH ₂ CH ₃	OH
Ia1.243	NCH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃	H	SO ₂ CH ₃	OH
Ia1.244	NCH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃	H	SO ₂ CH ₂ CH ₃	OH
Ia1.245	NCH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃	H	SO ₂ CH(CH ₃) ₂	OH
Ia1.246	NCH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃	H	SO ₂ (CH ₂) ₂ CH ₃	OH
Ia1.247	NCH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃	H	Cl	OH
Ia1.248	NCH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃	H	Br	OH
Ia1.249	NCH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃	H	NO ₂	OH
Ia1.250	NCH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃	H	CHF ₂	OH
Ia1.251	NCH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃	H	CF ₃	OH
Ia1.252	NCH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃	H	OCH ₃	OH
Ia1.253	NCH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃	H	OCH ₂ CH ₃	OH
Ia1.254	NCH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃	H	OCHF ₂	OH
Ia1.255	NCH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃	H	OCF ₃	OH
Ia1.256	NCH ₃	CH ₃	H	CH ₃	CH ₃	SCH ₃	OH
Ia1.257	NCH ₃	CH ₃	H	CH ₃	CH ₃	SCH ₂ CH ₃	OH
Ia1.258	NCH ₃	CH ₃	H	CH ₃	CH ₃	SO ₂ CH ₃	OH
Ia1.259	NCH ₃	CH ₃	H	CH ₃	CH ₃	SO ₂ CH ₂ CH ₃	OH
Ia1.260	NCH ₃	CH ₃	H	CH ₃	CH ₃	SO ₂ CH(CH ₃) ₂	OH
Ia1.261	NCH ₃	CH ₃	H	CH ₃	CH ₃	SO ₂ (CH ₂) ₂ CH ₃	OH
Ia1.262	NCH ₃	CH ₃	H	CH ₃	CH ₃	Cl	OH
Ia1.263	NCH ₃	CH ₃	H	CH ₃	CH ₃	Br	OH
Ia1.264	NCH ₃	CH ₃	H	CH ₃	CH ₃	NO ₂	OH
Ia1.265	NCH ₃	CH ₃	H	CH ₃	CH ₃	CHF ₂	OH
Ia1.266	NCH ₃	CH ₃	H	CH ₃	CH ₃	CF ₃	OH
Ia1.267	NCH ₃	CH ₃	H	CH ₃	CH ₃	OCH ₃	OH
Ia1.268	NCH ₃	CH ₃	H	CH ₃	CH ₃	OCH ₂ CH ₃	OH
Ia1.269	NCH ₃	CH ₃	H	CH ₃	CH ₃	OCHF ₂	OH
Ia1.270	NCH ₃	CH ₃	H	CH ₃	CH ₃	OCF ₃	OH
Ia1.271	NCH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃	SCH ₃	OH
Ia1.272	NCH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃	SCH ₂ CH ₃	OH
Ia1.273	NCH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃	SO ₂ CH ₃	OH
Ia1.274	NCH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃	SO ₂ CH ₂ CH ₃	OH
Ia1.275	NCH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃	SO ₂ CH(CH ₃) ₂	OH
Ia1.276	NCH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃	SO ₂ (CH ₂) ₂ CH ₃	OH
Ia1.277	NCH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃	Cl	OH
Ia1.278	NCH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃	Br	OH
Ia1.279	NCH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃	NO ₂	OH

10.10.01

Ia1.280	NCH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃	CHF ₂	OH
Ia1.281	NCH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃	CF ₃	OH
Ia1.282	NCH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃	OCH ₃	OH
Ia1.283	NCH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃	OCH ₂ CH ₃	OH
Ia1.284	NCH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃	OCHF ₂	OH
Ia1.285	NCH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃	OCF ₃	OH
Ia1.286	NCH ₃	CH ₂ Cl	H	H	H	SCH ₃	OH
Ia1.287	NCH ₃	CH ₂ Cl	H	H	H	SCH ₂ CH ₃	OH
Ia1.288	NCH ₃	CH ₂ Cl	H	H	H	SO ₂ CH ₃	OH
Ia1.289	NCH ₃	CH ₂ Cl	H	H	H	SO ₂ CH ₂ CH ₃	OH
Ia1.290	NCH ₃	CH ₂ Cl	H	H	H	SO ₂ CH(CH ₃) ₂	OH
Ia1.291	NCH ₃	CH ₂ Cl	H	H	H	SO ₂ (CH ₂) ₂ CH ₃	OH
Ia1.292	NCH ₃	CH ₂ Cl	H	H	H	Cl	OH
Ia1.293	NCH ₃	CH ₂ Cl	H	H	H	Br	OH
Ia1.294	NCH ₃	CH ₂ Cl	H	H	H	NO ₂	OH
Ia1.295	NCH ₃	CH ₂ Cl	H	H	H	CHF ₂	OH
Ia1.296	NCH ₃	CH ₂ Cl	H	H	H	CF ₃	OH
Ia1.297	NCH ₃	CH ₂ Cl	H	H	H	OCH ₃	OH
Ia1.298	NCH ₃	CH ₂ Cl	H	H	H	OCH ₂ CH ₃	OH
Ia1.299	NCH ₃	CH ₂ Cl	H	H	H	OCHF ₂	OH
Ia1.300	NCH ₃	CH ₂ Cl	H	H	H	OCF ₃	OH

Mimořádně výhodné jsou rovněž sloučeniny obecného vzorce Ia2, zejména sloučeniny Ia2.1 až Ia2.300, které se od odpovídajících sloučenin Ia1.1 až Ia1.300 liší tím, že R¹¹ je methylová skupina.

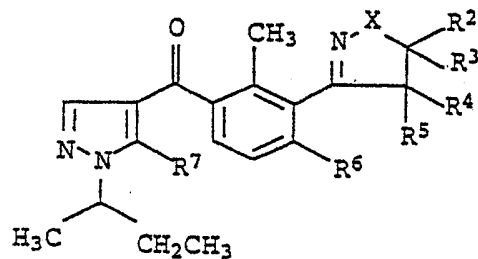


Ia2

Mimořádně výhodné jsou rovněž sloučeniny obecného vzorce Ia3, zejména sloučeniny Ia3.1 až Ia3.300, které se od odpovídajících sloučenin Ia1.1 až Ia1.300 liší tím, že

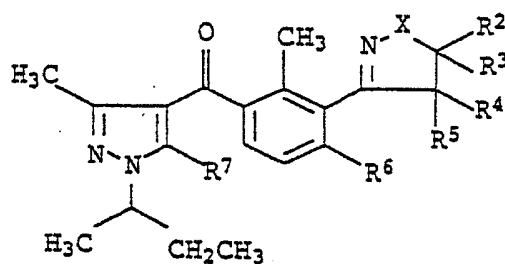
10.10.01

R^8 je ethylová skupina.



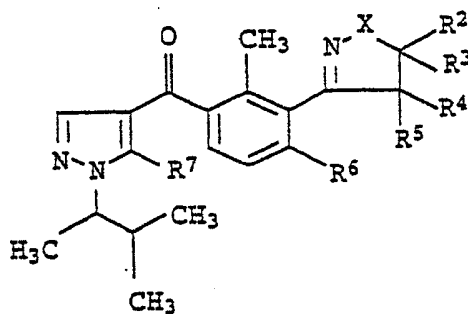
Ia3

Mimořádně výhodné jsou rovněž sloučeniny obecného vzorce Ia4, zejména sloučeniny Ia4.1 až Ia4.300, které se od odpovídajících sloučenin Ia1.1 až Ia1.300 liší tím, že R^8 je ethylová skupina a R^{11} je methylová skupina.



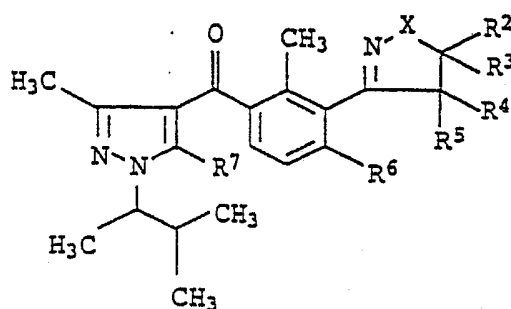
Ia4

Mimořádně výhodné jsou rovněž sloučeniny obecného vzorce Ia5, zejména sloučeniny Ia5.1 až Ia5.300, které se od odpovídajících sloučenin Ia1.1 až Ia1.300 liší tím, že R^8 je 1-methyl-1-ethylová skupina.



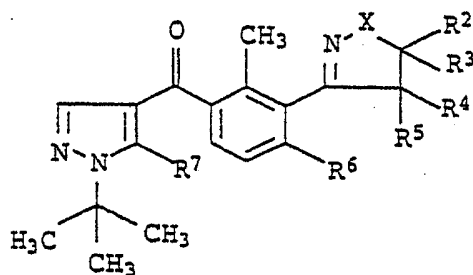
Ia5

Mimořádně výhodné jsou rovněž sloučeniny obecného vzorce Ia6, zejména sloučeniny Ia6.1 až Ia6.300, které se od odpovídajících sloučenin Ia1.1 až Ia1.300 liší tím, že R^8 je 1-methyl-1-ethylová skupina a R^{11} je methylová skupina.



Ia6

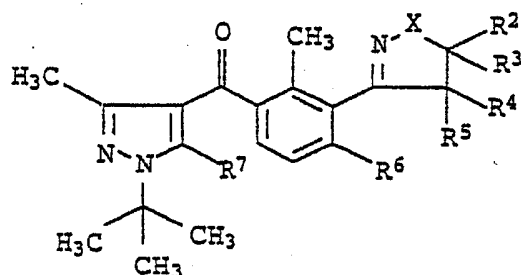
Mimořádně výhodné jsou rovněž sloučeniny obecného vzorce Ia7, zejména sloučeniny Ia7.1 až Ia7.300, které se od odpovídajících sloučenin Ia1.1 až Ia1.300 liší tím, že R^{10} je methylová skupina.



Ia7

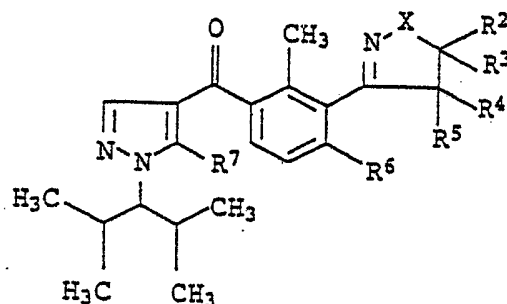
Mimořádně výhodné jsou rovněž sloučeniny obecného

vzorci Ia8, zejména sloučeniny Ia8.1 až Ia8.300, které se od odpovídajících sloučenin Ia1.1 až Ia1.300 liší tím, že R^{10} je methylová skupina a R^{11} je methylová skupina.



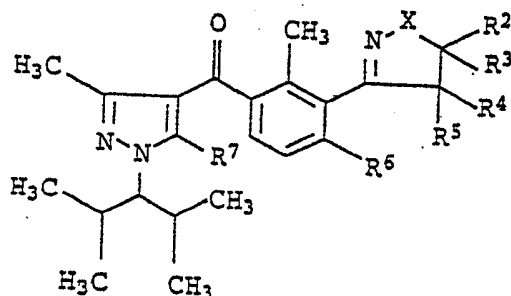
Ia8

Mimořádně výhodné jsou rovněž sloučeniny obecného vzorce Ia9, zejména sloučeniny Ia9.1 až Ia9.300, které se od odpovídajících sloučenin Ia1.1 až Ia1.300 liší tím, že R^8 a R^9 jsou 1-methyl-1-ethylové skupiny.



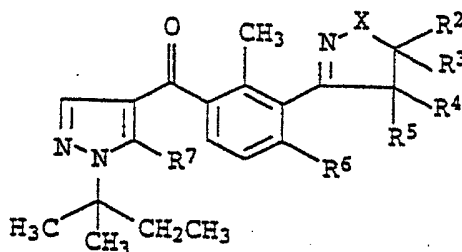
Ia9

Mimořádně výhodné jsou rovněž sloučeniny obecného vzorce Ia10, zejména sloučeniny Ia10.1 až Ia10.300, které se od odpovídajících sloučenin Ia1.1 až Ia1.300 liší tím, že R^8 a R^9 jsou 1-methyl-1-ethylové skupiny a R^{11} je methylová skupina.



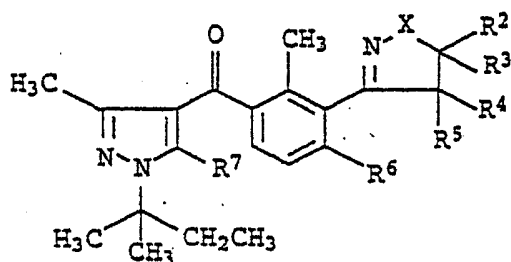
Ia10

Mimořádně výhodné jsou rovněž sloučeniny obecného vzorce Ia11, zejména sloučeniny Ia11.1 až Ia11.300, které se od odpovídajících sloučenin Ia1.1 až Ia1.300 liší tím, že R^s je ethylová skupina a R^{10} je methylová skupina.



Ia11

Mimořádně výhodné jsou rovněž sloučeniny obecného vzorce Ia12, zejména sloučeniny Ia12.1 až Ia12.300, které se od odpovídajících sloučenin Ia1.1 až Ia1.300 liší tím, že R^s je ethylová skupina a R^{10} a R^{11} jsou methylové skupiny.

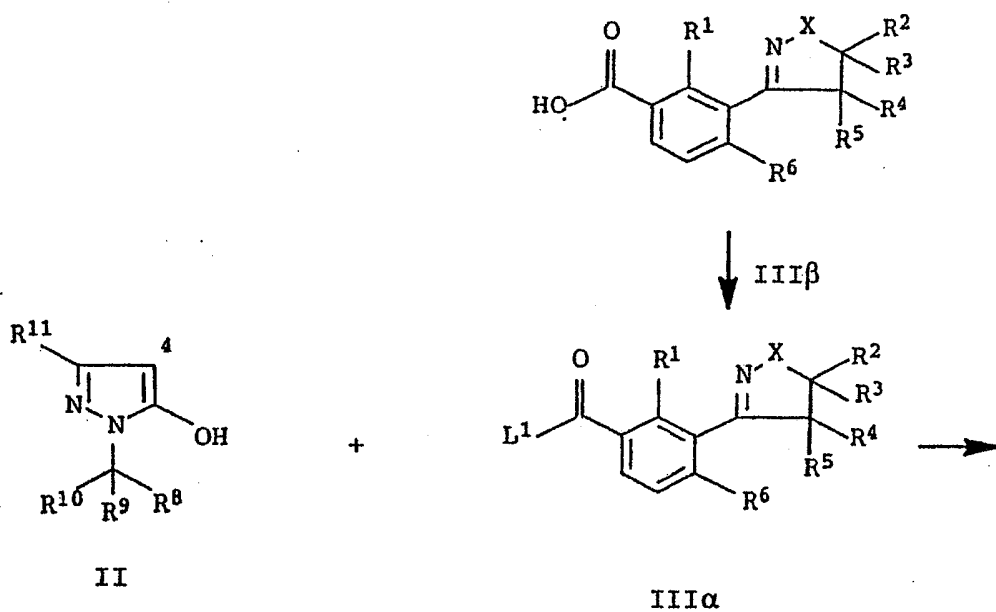


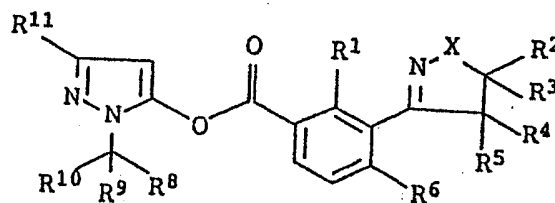
Ia12

3-(Heterocyklyl)-substituované benzoylpyrazoly obecného vzorce I se mohou získat různými způsoby, například postupy uvedenými níže.

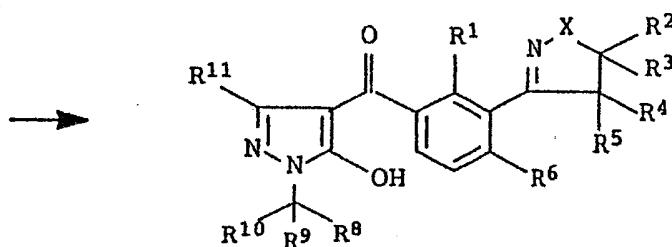
Postup A

Reakcí pyrazolů obecného vzorce II s aktivovanou kyselinou benzoovou III α nebo kyselinou benzoovou III β , která je výhodně aktivována na místě (in situ), se získá odpovídající acylační produkt IV a následným přesmykem se získá sloučenina obecného vzorce I, kde R⁷ je hydroxylová skupina.





IV

I, $R^7 = OH$

L^1 je nukleofilně nahraditelná odstupující skupina, jako je atom halogenu, například atom chloru nebo bromu, heteroarylová skupina, například imidazolylová skupina nebo pyridylová skupina, karboxylát, například acetát nebo trifluoracetát atd.

Aktivovaná kyselina benzoová může být použita přímo, jako je tomu v případě benzoylhalogenů, nebo vytvořena na místě (in situ), například za použití dicyklohexylkarbo-diimidu, trifenylfosfinu/esteru kyseliny azodikarboxylové, 2-pyridindisulfidu/trifenylfosfinu, karbonyldiimidazolu atd.

Může být výhodné provést acylační reakci za

přítomnosti báze. Reaktanty a pomocná báze se výhodně použijí v ekvimolárních množstvích. V určitých případech může být výhodný lehký přebytek pomocné báze, například od 1,2 do 1,5 molárních ekvivalentů, založené na sloučenině obecného vzorce II.

Vhodné pomocné báze jsou terciární alkylaminy, pyridin nebo uhličitany alkalických kovů. Pro použití jako rozpouštědla jsou vhodné například chlorované uhlovodíky, jako je methylenchlorid nebo 1,2-dichlorethan, aromatické uhlovodíky, jako je toluen, xylen nebo chlorbenzen, ethery, jako je diethylether, dimethoxyethan, tetrahydrofuran nebo dioxan, polární aprotická rozpouštědla, jako je acetonitril, dimethylformamid, nebo dimethylsulfoxid, nebo estery, jako je ethylacetát, nebo jejich směsi.

Pokud se jako složka aktivované karboxylové kyseliny použije benzoylhalogenid, může být výhodné při přidávání této reakční složky ochladit reakční směs na teplotu 0 až 10 °C. Následně se směs míchá při 20 až 100 °C, výhodně při 25 až 50 °C, dokud se reakce neukončí. Izolace (work-up) se provede pohodlným způsobem, například nalitím reakční směsi do vody a extrahováním hodnotných produktů. Zvláště vhodnými rozpouštědly pro tento účel jsou methylenchlorid, diethylether, dimethoxyethan, a ethylacetát. Organická fáze se vysuší a odstraní se rozpouštědlo, poté se surový ester použije na přesmyk bez jakékoliv další purifikace.

Přesmyk esterů na sloučeniny obecného vzorce I je výhodné provádět při 20 až 40 °C v rozpouštědle a za přítomnosti báze a, pokud je to vhodné, za použití kyanosloučeniny jako katalyzátoru.

Vhodnými sloučeninami jsou například acetonitril, methylenchlorid, 1,2-dichlorethan, dioxan, ethylacetát, dimethoxyethan, toluen nebo jejich směsi. Výhodnými rozpouštědly jsou acetonitril a dioxan.

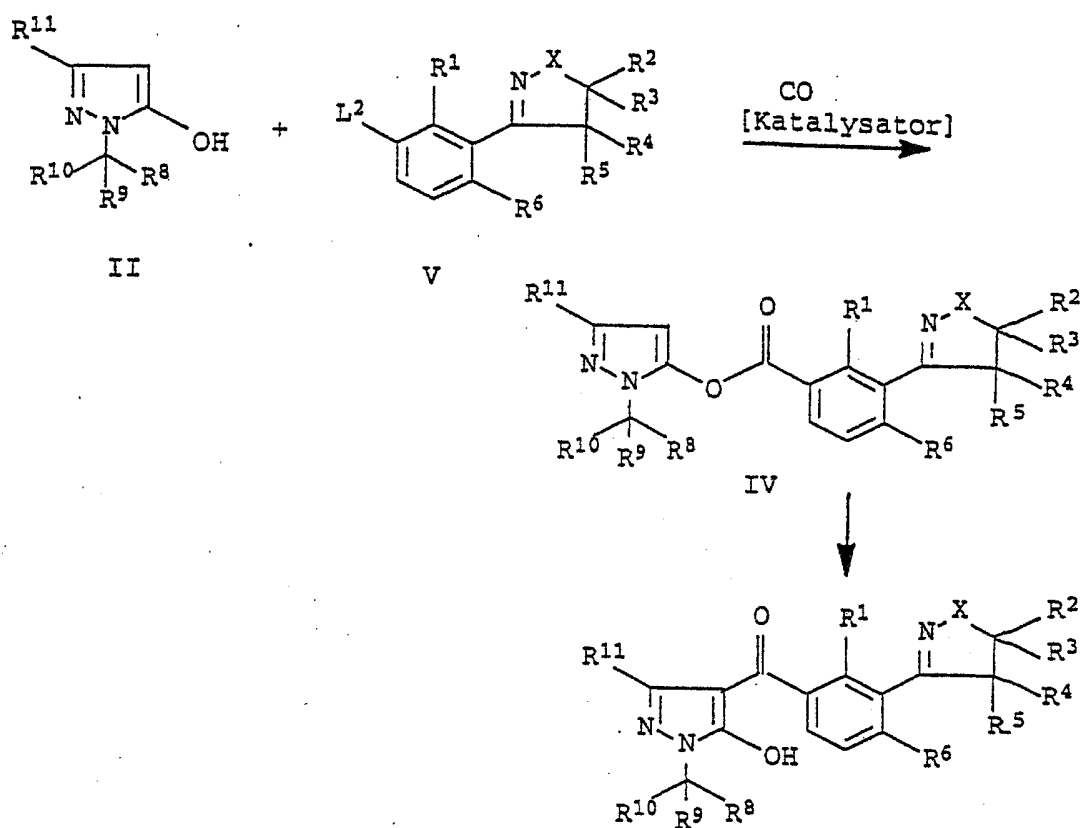
Vhodnými bázemi jsou terciární aminy, jako je triethylamin nebo pyridin nebo uhličitany alkalických kovů, jako je uhličitán sodný nebo uhličitán draselný, které se výhodně používají v ekvimolárním množství nebo až ve čtyřnásobném přebytku, v závislosti na esteru.

Vhodnými kyanosloučeninami jsou anorganické kyanidy a organické kyanosloučeniny, jako je acetokyanhydrid a trimethylsilylkyanid. Používají se v množství od 1 do 5 % molárních, v závislosti na esteru. Výhodně se použijí acetokyanhydrid nebo trimethylsilylkyanid, například v množství od 5 do 15, výhodně 10 % molárních, v závislosti na esteru.

Izolace (work-up) se provádí známým způsobem. Reakční směs se například okyselí ředěnou minerální kyselinou, jako je například 5% kyselina chlorovodíková nebo sírová, a extrahuje se organickým rozpouštědlem, například methylenchloridem nebo ethylacetátem. Organický extrakt může být extrahován 5 až 10% roztokem uhličitanu alkalického kovu, například roztokem uhličitanu sodného nebo draselného. Vodná fáze se okyselí a výsledná sraženina se zfiltruje sací filtrací a a/nebo extrahuje methylenchloridem nebo ethylacetátem, a směs se suší a koncentruje. (Příklady přípravy esterů hydroxypyrazolů a přesmyků esterů jsou uvedeny například v evropské patentové přihlášce EP-A 282 944 a v US patentu 4 643 757).

10.10.01

Je rovněž možné vytvořit acylační produkt obecného vzorce IV na místě (in situ) reakcí pyrazolu obecného vzorce II, nebo jeho soli alkalického kovu, s 3-(heterocyklilyl)benzenovým derivátem obecného vzorce V za přítomnosti oxidu uhelnatého, katalyzátoru a báze.



I, kde R⁷ = OH

L² je odstupující skupina, jako je atom halogenu, například atom chloru, bromu nebo iodu, nebo sulfonat, jako je mesylat nebo triflat; výhodný je atom bromu nebo triflat.

Acylační produkt obecného vzorce IV vede k reakci, přímo nebo nepřímo, čímž se získá 3-(heterocyklyl)-substituovaný benzoylpyrazol obecného vzorce I.

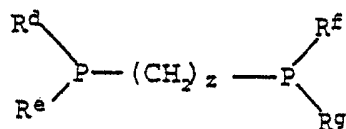
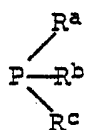
Vhodnými katalyzátory jsou paladiový komplexní ligandy, ve kterých je paladium přítomno v oxidačním stavu 0, kovové paladium, které je popřípadě absorbováno na nosič, a výhodně paladnaté soli. Reakce paladnatých solí a kovového paladia se výhodně provádí za přítomnosti komplexu ligandů.

Příkladem vhodného paladium(0)-ligandového komplexu je tetrakis(trifenylfosfin)paladium.

Kovové paladium je výhodně absorbováno na inertní nosič, jako je například aktivní uhlí, oxid křemičitý, oxid hlinitý, síran barnatý nebo uhličitán vápenatý. Reakce se výhodně provádí za přítomnosti komplexních ligandů, jako je například trifenylfosfin.

Komplexy vhodných paladnatých solí jsou paladiumacetat a chlorid paladnatý. Výhodná je přítomnost komplexních ligandů, jako je například trifenylfosfin.

Vhodnými komplexními ligandy pro paladium-ligandové komplexy, nebo za jejichž přítomnosti výhodně probíhá reakce s kovovým paladiem nebo paladnatými solemi, jsou terciární fosfiny, jejichž struktura je představována následujícími obecnými vzorci:



ve kterých

z je 1 až 4 a

zbytky R^a až R^e jsou alkylová skupina s 1 až 6 atomi uhlíku, cykloalkylová skupina se 3 až 6 atomi uhlíku, výhodně arylová skupina. Arylovou skupinou je například naftylová skupina a substituovaná nebo nesubstituovaná fenylová skupina, jako je například 2-tolylová skupina a zejména nesubstituovaná fenylová skupina.

Komplex paladiových solí může být připraven známým způsobem a vycházet z paladiových solí dostupných na trhu, jako je chlorid paladnatý nebo paladiumacetat a příslušných fosfinů, jako je například trifenylfosfin nebo 1,2-bis(difenylfosfin)ethan. Mnoho z komplexních paladiových solí je rovněž dostupných na trhu. Výhodnými paladiovými solemi jsou -binafthyl [(R)(+)-2,2'-bis-(difenylfosfin)-1,1']paladium(II)chlorid, bis(difenylfosfin)paladium(II)acetat a zejména bis(difenylfosfin)paladium(II)chlorid.

Paladiový katalyzátor se používá obvykle v koncentraci od 0,05 do 5 % molárních a výhodně v 1 až 3 % molárních.

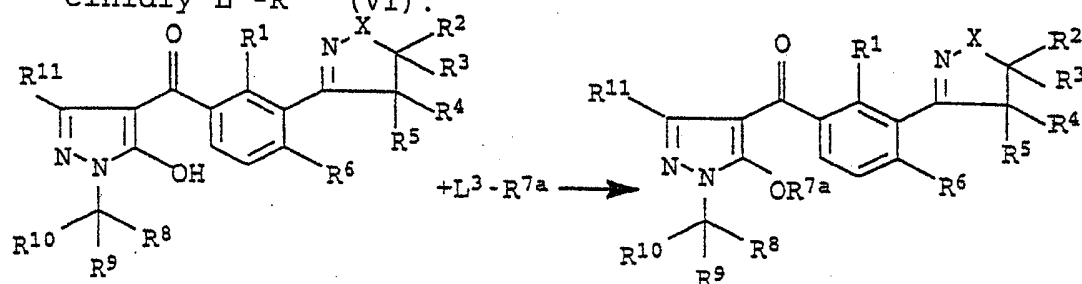
Vhodnými bázemi jsou terciární aminy, jako je například N-methylpiperidin, ethyldiizopropylamin, 1,8-bisdimethylaminonafthalen nebo zejména triethylamin. Vhodné jsou rovněž uhličitany alkalických kovů, jako je uhličitán sodný nebo uhličitán draselný. Vhodné jsou však rovněž směsi uhličitanu draselného a triethylaminu. Obvykle

se používají od 2 do 4 molárních ekvivalentů, zejména 2 molární ekvivalenty uhličitany alkalických kovů a od 1 do 4 molárních ekvivalentů, zejména 2 molární ekvivalenty, terciárních aminů, založeno na derivátech 3-(heterocylyl)-benzenu obecného vzorce V.

Vhodnými rozpouštědly jsou nitrily, jako je benzenonitril a acetonitril, amidy, jako je dimethylformamid, dimethylacetamid, tetra- C_{1-4} -alkylurea nebo N-methylpyrrolidon a výhodně ethery, jako je tetrahydrofuran a methyl-terc.-butylethery. Zvláště výhodné jsou ethery, jako je 1,4-dioxan a dimethoxyethan.

Postup B

Sloučeniny obecného vzorce I, ve kterých R^7 není hydroxylová skupina se získají reakcí sloučenin obecného vzorce I, ve kterých R^7 je hydroxylová skupina s alkylačními činidly, sulfonylačními činidly nebo acylačními činidly L^3-R^{7a} (VI).



I, $R^7 = OH$

VI

I, $R^7 = OR^{7a}$
($\equiv R^7 \neq OH$)

L^3 je nukleofilně nahraditelná odstupující skupina, jako je atom halogenu, například atom bromu nebo chloru, acyloxyskupina, například acetyloxyskupina nebo ethylkarbonyloxyskupina nebo alkylsulfonyloxyskupina, například methylsulfonyloxyskupina nebo trifluormethylsulfonyloxyskupina.

R^{7a} je alkylová skupina s 1 až 6 atomy uhlíku, alkenylová skupina se 3 až 6 atomy uhlíku, alkylsulfonylová skupina s 1 až 6 atomy uhlíku, alkylkarbonylová skupina s 1 až 6 atomy uhlíku, C_{1-4} (alkylthio)karbonylová skupina, fenylsulfonylová nebo fenylkarbonylová skupina, ve kterých fenylový zbytek dvou naposledy uvedených substituentů může být částečně nebo zcela halogenovaný a/nebo může nést 1 až 3 následující skupiny: nitroskupinu, kyanoskupinu, alkylovou skupinu s 1 až 4 atomy uhlíku, halogenalkylovou skupinu s 1 až 4 atomy uhlíku, alkoxykupinu s 1 až 4 atomy uhlíku nebo halogenalkoxykupinu s 1 až 4 atomy uhlíku.

Sloučeniny obecného vzorce VI mohou být použity přímo, jako je tomu například v případě sulfonylhalogenů nebo anhydridů kyseliny sulfonové, nebo mohou být vytvořeny na místě (in situ), například aktivované sulfonové kyseliny (za použití kyseliny sulfonové a dicyklohexylkarbonyldiimid, karbonyldiimidazol atd.).

Výchozí látky se obvykle používají v ekvimolárních množstvích. Může však být výhodné využít přebytek jedné nebo druhé látky.

Pokud je to vhodné, může být výhodné provést reakci za přítomnosti báze. Reaktanty a pomocná báze se výhodně použijí v ekvimolárních množstvích. V určitých případech může být výhodný lehký přebytek pomocné báze, například od 1,5 do 3 molárních ekvivalentů, v závislosti na sloučenině obecného vzorce I.

Vhodné pomocné báze jsou terciární alkylaminy, jako je triethylamin, pyridin, nebo uhličitany alkalických kovů,

například uhličitan sodný nebo uhličitan draselný a hydridy alkalických kovů, například hydrid sodný. Výhodné je použití triethylaminu a pyridinu.

Vhodnými rozpouštědly jsou například chlorované uhlovodíky, jako je methylenchlorid nebo 1,2-dichlorethan, aromatické uhlovodíky, jako je toluen, xylen nebo chlorbenzen, ethery, jako je diethylether, methyl-terc.-butylether, tetrahydrofuran a dioxan, polární aprotická rozpouštědla, jako je acetonitril, dimethylformamid, nebo dimethylsulfoxid, nebo estery, jako je ethylacetat, nebo jejich směsi.

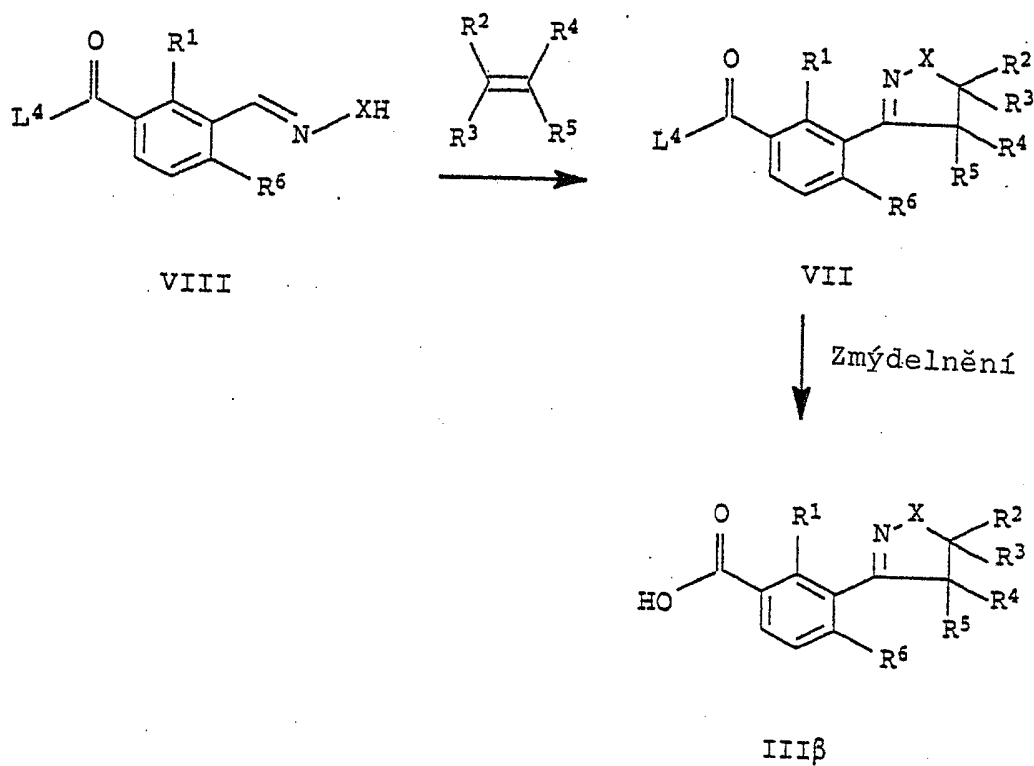
Reakční teplota se obecně pohybuje v rozmezí od 0 °C do teploty varu reakční směsi.

Izolace (work-up) může být provedena známým způsobem, čímž se získá produkt.

Pyrazoly obecného vzorce II použité jako výchozí látky jsou známy nebo mohou být připraveny známým způsobem (například evropská patentová přihláška EP-A 240 001 a J. Prakt. Chem. 315, 383 (1973)).

Aktivované benzoové kyseliny III α mohou být získány známým způsobem z benzoových kyselin III β . Ty lze z části získat hydrolýzou z odpovídajících esterů obecného vzorce VII. Ty mohou být připraveny konverzí oximu nebo hydrazonu obecného vzorce VIII na odpovídající halogenid kyseliny hydroxamové, zejména chlorid kyseliny hydroxamové, nebo halogenid karbohydrazidu; vytvořením nitriloxidu nebo nitriliminu na místě (in situ) a jeho reakcí s alkenem (nelze nalézt, například Chem. Ber. 106, 3258 až 3274

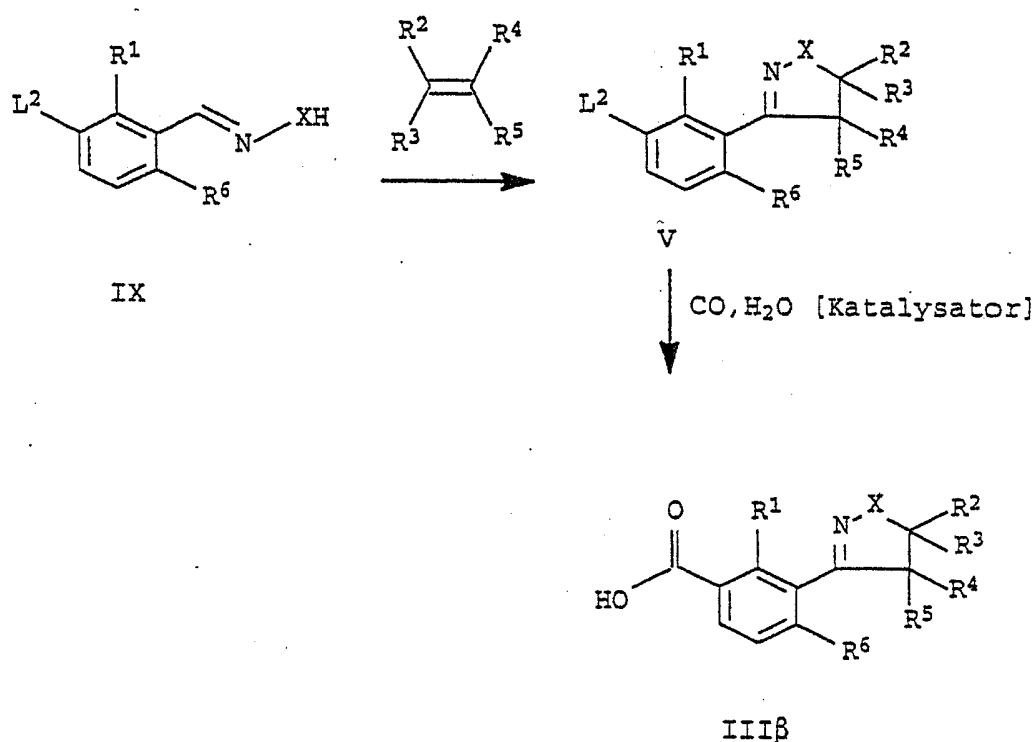
(1973)).



L⁴ označuje alkoxyskupinu s 1 až 6 atomy uhlíku.

Rovněž benzoové kyseliny IIIβ mohou být získány konverzí oximu nebo hydrazonu obecného vzorce IX na

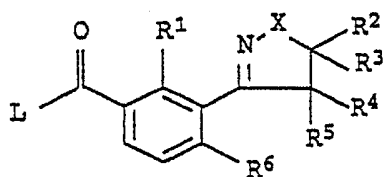
odpovídající nitriloxidy nebo nitriliminy a jejich reakcí s alkeny, čímž se získá odpovídající cykloadiční produkty (nelze nalézt, například Chem. Ber. 106, 3258 až 3274 (1973)). Proto například oxim obecného vzorce IX ($X=O$) je oxidován chlorečnanem sodným a reaguje se vhodným alkenem v inertním rozpouštědle, jako je methylenchlorid, chloroform, tetrahydrofuran, dioxan nebo acetonitril. Poté se produkt konvertuje za přítomnosti katalyzátoru a báze na kyselinu benzoovou za použití oxidu uhelnatého a vody.



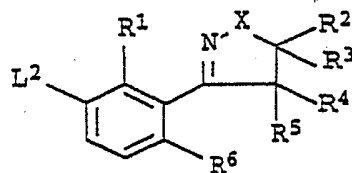
L^2 označuje odstupující skupinu, jako je atom halogenu, například atom chloru, bromu nebo iodu, nebo sulfonat, jako je mesylat nebo triflat; výhodně atom bromu nebo triflat.

Na karbonylační reakci se analogicky použije, co bylo uvedeno výše.

Sloučeniny obecných vzorců III a V jsou ve všech případech nové, jako jsou



III



V

kde ve všech případech proměnné R^1 , R^3 až R^6 a X jsou definovány pod obecným vzorcem I a

- R^2 je halogenalkylová skupina s 1 až 4 atomy uhlíku;
- L je hydroxylová skupina nebo zbytek, který může být odstraněn hydrolýzou, nebo
- L^2 je odstupující skupina, která může být nukleofilně nahrazena.

Příklady zbytků, které mohou být odstraněny hydrolýzou, jsou alkoxy skupina, fenoxyskupina, alkylthioskupina a fenylthioskupina, které mohou být nesubstituované nebo substituované, halogenidy, heteroarylové skupiny připojené přes atom dusíku, amino- a iminoskupina, které mohou být nesubstituované nebo substituované, atd.

Příklady nukleofilně odstranitelných odstupujících

skupin jsou atom halogenu, alkylsulfonyloxyskupina s 1 až 4 atomy uhlíku a halogenalkylsulfonyloxyskupina s 1 až 4 atomy uhlíku.

Výhodnými sloučeninami obecného vzorce III jsou ty sloučeniny, ve kterých L je atom halogenu, zejména atom chloru nebo bromu.

Výhodné jsou rovněž ty sloučeniny obecného vzorce III, ve kterých L je alkoxykupina s 1 až 6 atomy uhlíku.

Výhodné jsou rovněž ty sloučeniny obecného vzorce III, ve kterých L je hydroxylová skupina.

Ve vztahu k proměnným X, R¹, a R³ až R⁶, jsou zejména výhodná provedení sloučenin obecného vzorce III a V, odpovídající těmto sloučeninám obecného vzorce I.

Příklady provedení vynálezu

Příklady přípravy

4-[2-Methyl-3-(4,5-dihydroizoxazol-3-yl)-4-methylsulfonylbenzoyl]-5-hydroxy-1-(1,1-dimethyl-1-ethyl)-1H-pyrazol
(sloučenina 2.1)

Varianta 1

0,61 g (3,5 mmol) 1-(1,1-Dimethyl-1-ethyl)-5-hydroxy-1H-pyrazolu a 0,79 g (3,9 mmol) dicyklohexylkarbodiimidu se přidá do roztoku 1,0 g (3,5 mmol) 2-methyl-3-(4,5-dihydroizoxazol-3-yl)-4-methylsulfonylbenzoové kyseliny v dioxanu a směs se míchá při teplotě místnosti 12 hodin.

Nerozpustné složky se oddělí a poté se přidá 0,58 g (4,2 mmol) uhličitanu draselného a směs se 3 hodiny zahřívá pod zpětným chladičem. Poté se rozpouštědlo oddestiluje, odparek se přidá do 5% roztoku uhličitanu draselného a promyje methylenchloridem a toluenem, pH se za použití 10% kyseliny chlorovodíkové upraví na hodnotu 3 a směs se extrahuje methylenchloridem. Tento methylenchloridový roztok se suší a odstraní se rozpouštědlo. Tím se získá 0,81 g (teoreticky 57%) 4-[2-methyl-3-(4,5-dihydroizoxazol-3-yl)-4-methylsulfonylbenzoyl]-5-hydroxy-1-(1,1-dimethyl-1-ethyl)-1H-pyrazolu.

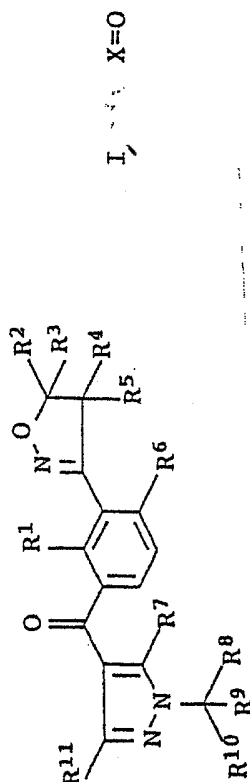
Teplota tání 195 až 198 °C.

Varianta 2

3,78 g (32 mmol) Thionylchloridu se přidá k roztoku 6 g (21,2 mmol) 2-methyl-3-(4,5-dihydroizoxazol-3-yl)-4-methylsulfonylbenzoové kyseliny v toluenu a směs se zahřívá pod refluxem po 4 hodiny. Rozpouštědlo se odstraní, odparek se přidá do dimethoxyethanu a po kapkách se přidá roztok 2,97 g (21,2 mmol) 1,1-dimethyl-1-ethyl-5-hydroxy-1H-pyrazolu v dimethoxyethanu. Směs se následně míchá 12 hodin při teplotě místnosti a 3,5 hodin se zahřívá pod zpětným chladičem. Směs se ochladí, rozpouštědlo se oddestiluje, odparek se přidá do 5% roztoku uhličitanu draselného a promyje methylenchloridem. Výsledná vodná fáze se za použití kyseliny chlorovodíkové upraví na hodnotu pH = 1 a výsledná sraženina se zfiltruje sací filtrací. Tím se získá 4,89 g (52%) 4-[2-methyl-3-(4,5-dihydroizoxazol-3-yl)-4-methylsulfonylbenzoyl]-5-hydroxy-1-(1,1-dimethyl-1-ethyl)-1H-pyrazolu.

Teplota tání 195 až 198 °C.

Navíc k výše uvedeným sloučeninám obsahuje tabulka 2 další 3-(heterocyklyl)-substituované benzoylpyrazoly obecného vzorce I, které byly připraveny nebo je lze připravit podobným způsobem.



Tabulka 2

Čís.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	R ⁸	R ⁹	R ¹⁰	R ¹¹	Fyzikální hodnoty teplota tání /°C/ ¹ H NMR /δ v ppm/
2.1	CH ₃	H	H	H	H	SO ₂ CH ₃	OH	CH ₃	CH ₃	CH ₃	H	195-198
2.2	CH ₃	H	H	H	H	SO ₂ CH ₃	OCH(CH ₃) ₂	CH ₃	CH ₃	CH ₃	H	olej 210-211
2.3	CH ₃	H	H	H	H	SO ₂ CH ₃	OCO[3-F-C ₆ H ₄]	CH ₃	CH ₃	CH ₃	H	olej
2.4	CH ₃	H	H	H	H	SO ₂ CH ₃	OCO[3,5-(CF ₃) ₂ -C ₆ H ₃]	CH ₃	CH ₃	CH ₃	H	olej
2.5	CH ₃	H	H	H	H	SO ₂ CH ₃	OCO[2,4-F ₂ -C ₆ H ₃]	CH ₃	CH ₃	CH ₃	H	145-148
2.6	CH ₃	H	H	H	H	SO ₂ CH ₃	OCO[3,5-F ₂ -C ₆ H ₃]	CH ₃	CH ₃	CH ₃	H	100-105
2.7	CH ₃	H	H	H	H	SO ₂ CH ₃	OCO[3-(CF ₃)-C ₆ H ₄]	CH ₃	CH ₃	CH ₃	H	90-93
2.8	CH ₃	H	H	H	H	SO ₂ CH ₃	OH	CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃	198-200
2.9	CH ₃	H	H	H	H	SO ₂ CH ₃	OH	CH ₃	CH ₃	H	H	203-205
2.10	CH ₂ -CH ₃	H	H	H	H	SO ₂ CH ₃	OH	CH ₃	CH ₃	CH ₃	H	75-80
2.11	CH ₃	H	H	H	H	SO ₂ CH ₃	OH	CH(CH ₃) ₂	CH ₃	H	H	90-95

500

2.12	CH ₃	H	H	H	H	H	SO ₂ CH ₃	OCOC ₆ H ₅		CH(CH ₃) ₂	CH ₃	H	H	95-100
2.13	CH ₃	CH ₂ Cl	H	H	H	H	SO ₂ CH ₃	OH		CH ₃	CH ₃	CH ₃	H	80-81
2.14	CH ₃	CH ₂ Cl	H	H	H	H	SO ₂ CH ₃	OH		CH ₃	CH ₃	H	H	75-84
2.15	CH ₃	CH ₂ Cl	H	H	H	H	SO ₂ CH ₃	OCO[3-F-C ₆ H ₄]		CH ₃	CH ₃	H	H	77-83
2.16	CH ₃	H	H	H	H	H	SO ₂ CH ₃	OH		CH(CH ₃) ₂	CH(CH ₃) ₂	H	H	120-125
2.17	CH ₃	CH ₂ Cl	CH ₂ Cl	H	H	H	SO ₂ CH ₃	OH		CH ₃	CH ₃	H	H	73-79
2.18	CH ₃	CH ₂ Cl	CH ₂ Cl	H	H	H	SO ₂ CH ₃	OH		CH ₃	CH ₃	CH ₃	H	73-78
2.19	CH ₃	H	H	H	H	H	SO ₂ CH ₃	OCH ₃		CH ₃	CH ₃	H	H	olej
2.20	CH ₃	H	H	H	H	H	SO ₂ CH ₃	OCH ₂ CH ₃		CH ₃	CH ₃	H	H	165-170
2.21	CH ₃	H	H	H	H	H	SO ₂ CH ₃	OCH(CH ₃) ₂		CH ₃	CH ₃	H	H	olej
2.22	CH ₃	H	H	H	H	H	SO ₂ CH ₃	OCOC ₆ H ₅		CH ₃	CH ₃	H	H	olej
2.23	CH ₃	H	H	H	H	H	SO ₂ CH ₃	OCO[3-F-C ₆ H ₄]		CH ₃	CH ₃	H	H	110-115
2.24	CH ₃	H	H	H	H	H	SO ₂ CH ₃	OCOCH ₃		CH ₃	CH ₃	H	H	80-85
2.25	CH ₃	H	H	H	H	H	SO ₂ CH ₃	OSO ₂ [4-CH ₃ -C ₆ H ₄]		CH ₃	CH ₃	H	H	95-100
2.26	CH ₃	H	H	H	H	H	SO ₂ CH ₃	OCOSCH ₃		CH ₃	CH ₃	H	H	143-145
2.27	CH ₃	H	H	H	H	H	SO ₂ CH ₃	OCOC ₆ H ₅		CH ₃	CH ₃	CH ₃	H	228-230

3-(Heterocyklyl)-substituované benzoylpyrazoly

obecného vzorce I, a jejich zemědělsky využitelné soli jsou vhodné jako herbicidy jak ve formě izomérních směsí, tak ve formě čistých izomérů. Herbicidní prostředky obsahující sloučeniny obecného vzorce I regulují vegetaci v neplodinných oblastech velice účinně, zvláště ve velkých aplikačních množstvích. Působí proti plevelům a škodlivým travinám mezi plodinami jako je pšenice, rýže, kukuřice, sója, a bavlna, aniž by způsobily významné poškození plodinám. Tento účinek je zjištěn hlavně u nízkých aplikačních množství.

V závislosti na určitém použitém způsobu aplikace mohou být sloučeniny obecného vzorce I nebo herbicidní prostředky, které je obsahují, využity u řady dalších plodin k eliminaci nežádoucích rostlin. Příklady vhodných plodin jsou následující:

Allium cepa, Ananas comosus, Arachis hypogea, Asparagus officinalis, Beta vulgaris sp. altissima, Beta vulgaris sp. rapa, Brassica napus var. napus, Brassica napus var. napobrassica, Brassica rapa var. silvestris, Camellia sinensis, Carthamus tinctorius, Carya illinoensis, Citrus limon, Citrus sinensis, Coffea arabica, (Coffea canephora, Coffea liberica), Cucumis sativus, Cynodon dactylon, Daucus carota, Elaeis guineensis, Fragaria vesca, Glycine max, Gossypium hirsutum (Gossypium arboreum, Gossypium herbaceum, Gossypium vitifolium), Helianthus annuus, Hevea brasiliensis, Hordeum vulgare, Humulus lupulus, Ipomea batatas, Juglans regia, Lens culinaris, Linum usitatissimum, Lycopersicon lycopersicum, Malus spec., Manihot esculenta, Medicago sativa, Musa spec., Nicotiana tabacum (N. rustica), Olea europea, Oryza sativa, Phaseolus lunatus, Phaseolus vulgaris, Picea abies, Pinus spec., Pisum sativum, Prunus avium, Prunus persica, Pyrus communis, Ribes sylvestre, Ricinus communis, Saccharum officinarum, Secale cereale, Solanum tuberosum, Sorghum bicolor (s. vulgare), Theobroma cacao, Trifolium pratense, triticum aestivum, Triticum durum, Vicia faba, Vitis vinifera a Zea mays.

Navíc mohou být sloučeniny obecného vzorce I použity rovněž u plodin, které tolerují působení herbicidů působících na oplození, včetně způsobů genového

inženýrství.

Sloučeniny obecného vzorce I nebo herbicidní prostředky, které je obsahují, mohou být použity například ve formě vodných roztoků připravených pro sprej, prášků, suspenzí, rovněž vysoce koncentrovaných vodných, olejových nebo jiných suspenzí nebo disperzí, emulzí, olejových disperzí, past, páškovacích prostředků, materiálů pro rozsévání rozhozem nebo granulí, prostřednictvím postřikování, rozprašování, práškování, rozsévání rozhozem nebo zalévání. Použití forem závisí na zamýšleném cíli; v každém případě by měli zaručit velmi jemnou distribuci aktivních sloučenin podle tohoto vynálezu.

Herbicidní prostředky obsahují herbicidně účinné množství nejméně jedné sloučeniny obecného vzorce I nebo zemědělsky využitelné soli sloučeniny obecného vzorce I a pomocné látky obvykle používané pro formulování látek k ochraně rostlin.

Vhodné inertní pomocné látky obecně zahrnují frakce minerálních olejů o střední až vysoké teplotě varu, jako je petrolej a motorová nafta, dále oleje uhelného dehtu a oleje rostlinného nebo živočišného původu, alifatické, cyklické a aromatické uhlovodíky, například parafiny, tetrahydronaftalen, alkylované naftaleny a jejich deriváty, alkylované benzeny a jejich deriváty, alkoholy, jako je methanol, ethanol, propanol, butanol a cyklohexanol, ketony, jako je cyklohexanon, nebo silně polární rozpouštědla, například aminy, jako je N-methylpyrrolidon a vodu.

Vodné formy použití mohou být připraveny

z emulzních koncentrátů, suspenzí, past, rozpustných prášků, smáčivých prášků, nebo ve vodě disperzibilních granulí, přidáním vody. K přípravě emulzí, past nebo olejových disperzí mohou být látky jako takové nebo rozpuštěné v oleji či rozpouštědla homogenizovány ve vodě prostřednictvím vlhčidla, pojidla, disperzního činidla nebo emulsifikačního činidla, a pokud je to žádoucí, rozpouštědla nebo oleje, které jsou vhodné k ředění ve vodě.

Vhodnými surfaktanty (adjuvans) jsou soli alkalických kovů, soli kovů alkalických zemin a amoniové soli aromatických sulfonových kyselin, například ligno-, fenol-, naftalen-, a dibutyl-naftalensulfonová kyselina, a mastné kyseliny, alkyl- a alkylarylsulfonáty, alkylsulfáty, laurylethersulfáty a sulfáty alifatických alkoholů a soli sulfátů hexa-, hepta- a oktadekanolů a rovněž alifatický alkohol glykoether, kondenzáty sulfátů naftalenu a jeho derivátů s formaldehydem, kondenzáty naftalenu nebo naftalensulfonových kyselin s fenolem a formaldehydem, polyoxyethylenoctylfenolether, ethoxylovaný izooktyl-, oktyl-, nebo nonylfenol, alkylfenyl- nebo tributylfenylpolyglykoether, alkylarylpolyetheralkoholy, izotridecylalkohol, kondenzáty alifatických alkoholů s ethylenoxidem, ethoxylovaný ricinový olej, polyoxyethylenalkylethery nebo polyoxypropylenalkylethery, laurylalkoholpolyglykoether, estery sorbitolu, ligninsulfit odpadních vod nebo methylcelulóza.

Prášky, materiály pro rozsévání rozhozem a práškovací prostředky mohou být připraveny mísením a mletím aktivních sloučenin společně s pevným nosičem.

Granule, například potahované granule, impregnované granule a homogenní granule mohou být připraveny navázáním aktivních sloučenin na pevné nosiče. Pevnýminosiči jsou minerální zeminy, jako jsou oxid křemičitý, silikagely, křemičitany, mastek, kaolin, vápenec, vápno, křída, jíl, spraš, hrnčířská hlína, dolomit, rozsivková zemina, síran vápenatý, síran hořečnatý, oxid hořečnatý, půdní syntetické látky, hnojiva jako jsou síran amonný, fosforečnan amonný a dusičnan amonný, močovina a produkty rostlinného původu, jako je obilná mouka, moučka z kůry stromů, dřevěná moučka a moučka ze skořápek ořechů, celulózové prášky a jiné pevné nosiče.

Koncentrace sloučenin obecného vzorce I v prostředcích připravených k použití se může pohybovat v širokém rozmezí. Obecně obsahují prostředky od 0,001 do 98 % hmotnostních, výhodně od 0,01 až 95 % hmotnostních, nejméně jedné aktivní sloučeniny. Aktivní sloučenina se používá v čistotě od 90 do 100 %, výhodně 95 až 100 % (podle NMR spektra).

Následující příklady prostředků ilustrují přípravu takových prostředků:

Příklad I

20 Hmotnostních dílů sloučeniny č. 2.8 se rozpustí ve směsi složené z 80 hmotnostních dílů alkylbenzenu, 10 hmotnostních dílů směsi 8 až 10 mol ethylenoxidu přidaných do 1 mol N-monoethanolamidu kyseliny oleové, 5 hmotnostních dílů dodecylbenzensulfonatu vápenatého a 5 hmotnostních dílů 40 mol směsi ethylenoxidu přidaného do 1 mol ricinivého oleje. Nalitím roztoku do 100 000 hmotnostních dílů vody a jemnou distribucí v ní se získá vodná disperze

10.10.01

obsahující 0.02 % hmotnostních aktivní sloučeniny.

Příklad II

20 Hmotnostních dílů sloučeniny č. 2.9 se rozpustí ve směsi složené ze 40 hmotnostních dílů cyklohexanonu, 30 hmotnostních dílů izobutanolu, 20 hmotnostních dílů směsi 7 mol ethylenoxidu přidaného do 1 mol izooktylfenolu a 10 hmotnostních dílů směsi 40 mol ethylenoxidu přidaného do 1 mol ricinivého oleje. Nalitím roztoku do 100 000 hmotnostních dílů vody a jemnou distribucí v ní se získá vodná disperze obsahující 0.02 % hmotnostních aktivní sloučeniny.

Příklad III

20 Hmotnostních dílů aktivní sloučeniny č. 2.3 se rozpustí ve směsi složené z 25 hmotnostních dílů cyklohexanonu, 65 hmotnostních dílů frakce minerálního oleje o teplotě varu 210 až 280 °C a z 10 hmotnostních dílů směsi 40 mol ethylenoxidu přidaného do 1 mol ricinivého oleje. Nalitím roztoku do 100 000 hmotnostních dílů vody a jemnou distribucí v ní se získá vodná disperze obsahující 0.02 % hmotnostních aktivní sloučeniny.

Příklad IV

20 Hmotnostních dílů aktivní sloučeniny č. 2.3 se důkladně smíchá se 3 hmotnostními díly diizobutyl-naftalen-sulfonátu sodného, 17 hmotnostními díly sodné soli kyseliny lignosulfonové ze sulfitových odpadních vod a se 60 hmotnostními díly práškového silikagelu a směr se mele v kladívkovém šrotovníku. Jemnou distribucí směsi ve 20

000 hmotnostních dílech vody se získá sprejová směs obsahující 0.1 % hmotnostních aktivní sloučeniny.

Příklad V

3 Hmotnostní díly aktivní sloučeniny č. 2.9 se smíchá s 97 hmotnostními díly jemně děleného kaolinu. Tím se získá prášek obsahující 3 % hmotnostní aktivní sloučeniny.

Příklad VI

20 Hmotnostních dílů aktivní sloučeniny č. 2.8 se důkladně smíchá se 2 hmotnostními díly dodecylbenzen-sulfonátu vápenatého, 8 hmotnostními díly alifatického alkoholu polyglykoetheru, 2 hmotnostními díly kondenzátu fenolu močoviny a formaldehydu a 68 hmotnostními díly parafinového minerálního oleje. Tím se získá stabilní olejová disperze.

Příklad VII

1 Hmotnostní díl aktivní sloučeniny č. 2.3 se rozpustí ve směsi složené ze 70 hmotnostních dílů cyklohexanonu, 20 hmotnostních dílů ethoxylovaného izooktyfenolu a 10 hmotnostních dílů ethoxylovaného ricinového oleje. Tím se získá stabilní emulzní koncentrát.

Příklad VIII

1 Hmotnostní díl aktivní sloučeniny č. 2.9 se rozpustí ve směsi složené ze 80 hmotnostních dílů cyklohexanonu, a 20 hmotnostních dílů Wettol^(R) EM 31 (neionické emulsifikační činidlo založené na ethoxylovaném ricinovém

oleji). Tím se získá stabilní emulzní koncentrát.

Sloučeniny obecného vzorce I nebo herbicidní prostředky mohou být aplikovány před vznikem ohrožení (pre-emergence) nebo následně (post-emergence). Pokud je aktivní sloučenina méně dobře tolerována určitou plodinou, mohou být použity takové aplikační techniky při kterých jsou herbicidní prostředky rozprašovány, za pomoci rozprašovacího zařízení tak, že přichází do co nejmenšího možného kontaktu, pokud vůbec, s listy citlivých plodin, zatímco aktivní sloučeniny zasáhnou listy nežádoucích rostlin rostoucích pod nimi nebo holého povrchu půdy (post-directed, lay-by - přesná citace).

Aplikační množství sloučeniny obecného vzorce I jsou od 0,001 do 3,0, výhodně 0,01 až 1,0 kg/ha aktivní látky, v závislosti na cíli regulace, ročním období, cílových rostlinách a růstovém stádiu.

K rozšíření spektra působení a dosažení synergických účinků, mohou být 3-(heterocyklyl)-substituované penzoylpyrazoly obecného vzorce I míchány se širokou řadou zástupců jiných herbicidně nebo růstově regulačně působících skupin sloučenin a poté aplikovány souběžně. Vhodnými složkami směsí jsou například 1,2,4-thiadiazoly, 1,3,4-thiadiazoly, amidy, kyselina amidofosforečná a její deriváty, aminotriazoly, anilidy, (hetero)aryloxyalkanoové kyseliny a jejich deriváty, kyselina benzoová a její deriváty, benzothiadiazinony, 2-(hetero)aroyl-1,3-cyklohexandiony, heteroarylarylketony, benzylizooxazolidinony, meta-CF₃-fenylové deriváty, karbamaty, kyselina chinolinkarboxylová a její deriváty, chloracetanilidy, deriváty cyklohexanonoximetheru, diaziny, kyselina

dichlorpropionová a její deriváty, dihydrobenzofurany, dihydrofuran-3-ony, dinitroaniliny, dinitrofenoly, difenylethery, dipyridyly, halogenkarboxylové kyseliny a jejich deriváty, močovina, 3-fenyluracily, imidazoly, imidazolinony, N-fenyl-3,4,5,6-tetrahydroftalimidy, oxadiazoly, oxirany, fenoly, estery kyseliny aryloxy- a heteroaryloxyfenoxypropionové, kyselina fenylactová a její deriváty, kyselina 2-fenylpropionová a její deriváty, pyrazoly, fenylpyrazoly, pyridaziny, kyselina pyridinkarboxylová a její deriváty, 2-pyrimidylové estery, sulfonamidy, sulfonylurea, triaziny, triazinony, triazolinony, triazolkarboxamidy a uracily.

Může být dále výhodné aplikovat sloučeniny obecného vzorce I samotné nebo ještě souběžně v kombinaci s jinými herbicidy, ve formě směsi s jinými látkami na ochranu plodin, například společně s látkami pro regulaci škůdců nebo fytopatogenních hub či bakterií. Zajímavá je rovněž mísitelnost s roztoky minerálních solí, které se využívají k léčbě nutričního nedostatku nebo nedostatku stopových prvků. Mohou být rovněž přidávány nefytotoxické oleje a olejové koncentráty.

Příklady použití

Herbicidní aktivita 3-(heterocyklyl)-substituovaných benzoylpyrazolů obecného vzorce I byla předvedena následujícími skleníkovými pokusy.

Použitými kultivačními nádobami jsou plastické květináče obsahující jako substrát hlinitopísčitou zeminu s přibližně 3,0 % humusu. Semena testovaných rostlin se vysejí odděleně pro každý druh.

Pro ošetření před vznikem ohrožení (pre-emergence treatment) se aktivní sloučeniny, které byly suspendovány nebo emulsifikovány ve vodě, aplikují přímo po vysetí, za použití jemně distribuujících trysek. Nádoby se jemně zavlaží, aby se vyvolalo klíčení a růst a následně se přikryjí prodyšnou plastikovou kápí, dokud rostliny nezakoření. Tento kryt způsobuje jednotné klíčení testovaných rostlin, pokud klíčení není nepříznivě ovlivněno aktivními sloučeninami.

Pro ošetření následně po vzniku ohrožení (post-emergence treatment) se testované rostliny nejprve nechají vyrůst do výšky 3 až 15 cm, v závislosti na habitu rostlin a teprve poté se ošetří aktivními sloučeninami, které byly suspendovány nebo emulsifikovány ve vodě. Pro tento účel se testované rostliny buď přímo vysejí a nechají vyrůst ve stejných nádobách, nebo se nejprve nechají vyrůst odděleně jako semenáčky a přesadí se do testovacích nádob pár dní před ošetřením. Aplikační množství pro následné ošetření (post-emergence treatment) jsou 0,5, 0,25, 0,125 nebo 0,0625 kg aktivní látky na hektar.

V závislosti na druhu se rostliny udržují při teplotě 10 až 25 °C nebo 20 až 35 °C. Testovací období je 2 až 4 týdny. Během této doby jsou rostliny sledovány a vyhodnocuje se jejich odpověď na individuální ošetření.

Vyhodnocení se provádí za použití škály od 0 do 100. 100 znamená žádné ohrožení rostlin nebo kompletní zničení minimálně nadzemních částí a 0 znamená žádné poškození nebo normální průběh růstu.

Rostlinami použitými při skleníkových pokusech jsou následující druhy:

Odborný název	Český název
<i>Abutilon theophrasti</i>	mračňák theoprastův
<i>Amaranthus retroflexus</i>	laskavec srstnatý (ohnutý)
<i>Avena fatua</i>	oves hluchý
<i>Chenopodium album</i>	merlík bílý
<i>Echinochloa crus galli</i>	ježatka kuří noha
<i>Polygonum persicaria</i>	rdesno červivec
<i>Setaria faberi</i>	bér faberův
<i>Setaria viridis</i>	bér zelený
<i>Sinapis alba</i>	hořčice bílá
<i>Solanum nigrum</i>	lilek černý

Při aplikačních množstvích 0,125 nebo 0,0625 kg/ha vykazovala sloučenina 2.3 (tabulka 2) velmi dobré působení proti nežádoucím rostlinám ježatce kuří noze (*Echinochloa crus galli*), laskavci srstnatému (*Amaranthus retroflexus*), merlíku bílému (*Chenopodium album*), rdesnu červivci

(*Polygonum persicaria*) a lilku černému (*Solanum nigrum*).

Sloučenina 2.8 (tabulka 2) vykazala velmi dobré účinky při následné (post-emergence) regulaci při aplikačních množstvích 0.5 až 0.25 kg/ha u plevelných rostlin ježatka kuří noha (*Echinochloa crus galli*), bér zelený (*Setaria viridis*), merlík bílý (*Chenopodium album*) a lilek černý (*Solanum nigrum*).

Velmi dobré je působení sloučeniny 2.9 (tabulka 2), pokud je aplikována při následném (post-emergence) způsobu v aplikačních množstvích 0,25 nebo 0,125 kg/ha na traviny oves hluchý (*Avena fatua*) a bér zelený (*Setaria viridis*) a na plevele laskavec srstnatý (*Amaranthus retroflexus*), rdesno červivec (*Polygonum persicaria*) a hořčici bílou (*Sinapis alba*).

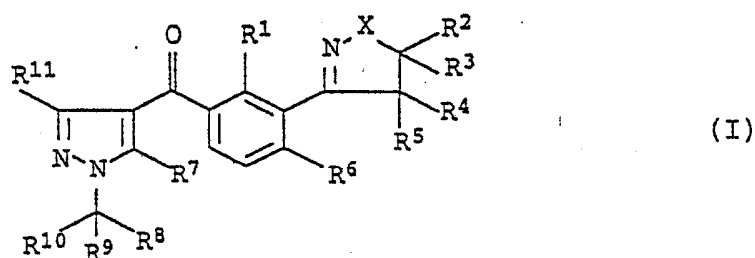
Podobně sloučenina 2.10 (tabulka 2) má, v aplikačních množstvích 0,25 nebo 0,125 kg/ha, velmi dobré účinky při následné (post-emergence) regulaci na nežádoucí rostliny ježatka kuří noha (*Echinochloa crus galli*), merlík bílý (*Chenopodium album*), hořčice bílá (*Sinapis alba*) a lilek černý (*Solanum nigrum*).

10.10.01

PV 2001-1960

P A T E N T O V É N Á R O K Y

1. 3-(heterocyklyl)-substituované benzoylpyrazoly
obecného vzorce I:



ve kterém

X je atom kyslíku, skupina vzorce NH nebo $N(C_{1-6})$ alkylová) skupina;

R^1 je alkylová skupina s 1 až 6 atomy uhlíku;

R^2 , R^3 , R^4 a R^5 jsou atom vodíku, alkylová skupina s 1 až 4 atomy uhlíku nebo halogenalkylová skupina s 1 až 4 atomy uhlíku;

R^6 je atom halogenu, nitroskupina, halogenalkylová skupina s 1 až 4 atomy uhlíku, alkoxy skupina s 1 až 4 atomy uhlíku, halogenalkoxy skupina s 1 až 4 atomy uhlíku, alkylthio skupina s 1 až 4 atomy uhlíku, halogenalkylthio skupina s 1 až 4 atomy uhlíku, alkylsulfonylová skupina s 1 až 4 atomy uhlíku nebo halogenalkylsulfonylová skupina s 1 až 4 atomy uhlíku;

R⁷ je hydroxylová skupina, alkoxykupina s 1 až 6 atomy uhlíku, alkenyloxyskupina se 3 až 6 atomy uhlíku, alkylsulfonyloxyskupina s 1 až 6 atomy uhlíku, alkylkarbonyloxyskupina s 1 až 6 atomy uhlíku, C₁₋₄(alkylthio)karbonyloxyskupina, fenylsulfonyloxyskupina nebo fenylkarbonyloxyskupina, ve kterých fenylový zbytek dvou naposledy uvedených substituentů může být částečně nebo zcela halogenovaný a/nebo může nést 1 až 3 následující skupiny:

nitroskupinu, kyanoskupinu, alkylovou skupinu s 1 až 4 atomy uhlíku, halogenalkylovou skupinu s 1 až 4 atomy uhlíku, alkoxykupinu s 1 až 4 atomy uhlíku nebo halogenalkoxykupinu s 1 až 4 atomy uhlíku;

R⁸ a R⁹ jsou alkylová skupina s 1 až 4 atomy uhlíku;

R¹⁰ je atom vodíku nebo alkylová skupina s 1 až 4 atomy uhlíku;

kde počet atomů uhlíku ve zbytcích R⁸, R⁹ a R¹⁰ činí dohromady nanejvýš 7,

R¹¹ je atom vodíku nebo alkylová skupina s 1 až 4 atomy uhlíku;

a jejich zemědělsky využitelné soli.

2. 3-(heterocyklyl)-substituované benzoylpyrazoly obecného vzorce I, podle nároku I, kde

X je atom kyslíku;

R^1 je alkylová skupina s 1 až 4 atomy uhlíku;

R^6 alkylthioskupina s 1 až 4 atomy uhlíku nebo
alkylsulfonylová skupina s 1 až 4 atomy uhlíku;

3. 3-(heterocyklyl)-substituované benzoylpyrazoly
obecného vzorce I, podle nároku I, kde

X je atom kyslíku;

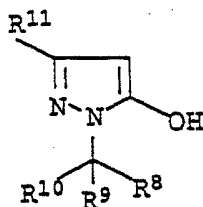
R^1 je alkylová skupina s 1 až 4 atomy uhlíku;

R^6 atom halogenu, nitroskupina, halogenalkylová skupina s
1 až 4 atomy uhlíku, alkoxyskupina s 1 až 4 atomy uhlíku nebo
halogenalkoxyskupina s 1 až 4 atomy uhlíku;

4. 3-(heterocyklyl)-substituované benzoylpyrazoly
obecného vzorce I, podle nároku I, kde

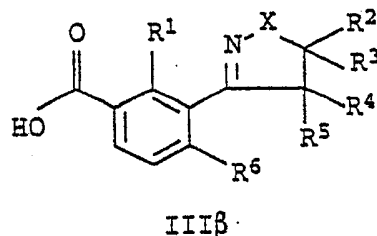
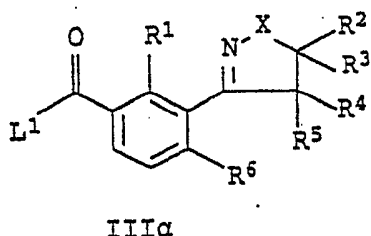
X je $N(C_{1-6}$ alkylová) skupina;

5. Způsob přípravy 3-(heterocyklyl)-substituovaných
benzoylpyrazolů obecného vzorce I, podle nároku I, kde
zbytek R^7 je hydroxylová skupina, v y z n a č u j í c í s
e t í m, že zahrnuje acylaci pyrazolu obecného vzorce II:



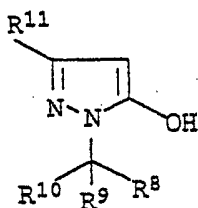
II

aktivovanou kyselinou benzoovou obecného vzorce III α nebo kyselinou benzoovou obecného vzorce III β :



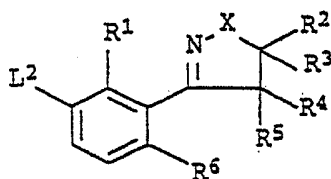
kde proměnné X, R¹až R⁶, R⁸ až R¹¹ jsou, jak byly definovány v nároku 1 a L¹ je nukleofilně nahraditelná odstupující skupina a acylační produkt přesmykující, za přítomnosti nebo nepřítomnosti katalyzátoru, čímž se získá sloučenina obecného vzorce I, kde zbytek R⁷ je hydroxylová skupina.

6. Způsob přípravy 3-(heterocyklyl)-substituovaných benzoylpyrazolů obecného vzorce I, kde zbytek R⁷ je hydroxylová skupina, podle nároku I, v y z n a č u j í c í s e t í m, že zahrnuje reakci pyrazolu obecného vzorce II:



II

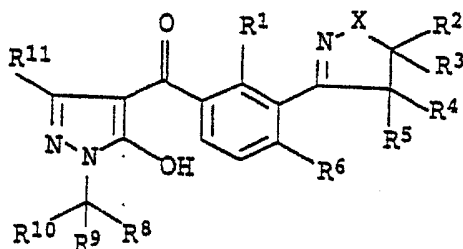
ve kterém proměnné R⁸ až R¹¹ jsou, jak byly definovány v nároku 1 nebo jejich soli alkalických kovů, s derivátem 3-(heterocyklyl)benzenu obecného vzorce V:



V

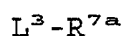
kde proměnné X, R¹ až R⁶ jsou, jak byly definovány v nároku 1 a L² je za přítomnosti oxidu uhelnatého, katalyzátoru a báze odstupující skupina.

7. Způsob přípravy 3-(heterocyklyl)-substituovaných benzoylpyrazolů obecného vzorce I, kde zbytek R⁷ není hydroxylová skupina, podle nároku I, v y z n a -
č u j í c í s e t í m, že zahrnuje reakci
3-(heterocyklyl)-substituovaných benzoylpyrazolů obecného vzorce I:



I

kde zbytek R⁷ je hydroxylová skupina, se sloučeninou obecného vzorce VI:



VI

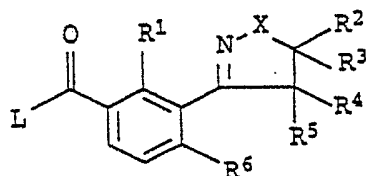
ve kterém

L^3 je nukleofilně nahraditelná odstupující skupina;

R^{7a} je alkylová skupina s 1 až 6 atomy uhlíku,
alkenylová skupina se 3 až 6 atomy uhlíku,
alkylsulfonylová skupina s 1 až 6 atomy uhlíku,
alkylkarbonylová skupina s 1 až 6 atomy uhlíku,
 C_{1-4} (alkylthio)karbonylová skupina, fenylsulfonylová
nebo fenylkarbonylová skupina, ve kterých fenylový
zbytek dvou naposledy uvedených substituentů může být
částečně nebo zcela halogenovaný a/nebo může nést 1 až
3 následující skupiny:

nitroskupinu, kyanoskupinu, alkylovou skupinu s 1 až
4 atomy uhlíku, halogenalkylovou skupinu s 1 až 4
atomy uhlíku, alkoxyskupinu s 1 až 4 atomy uhlíku nebo
halogenalkoxyskupinu s 1 až 4 atomy uhlíku.

8. Ester kyseliny benzoové obecného vzorce III:



III

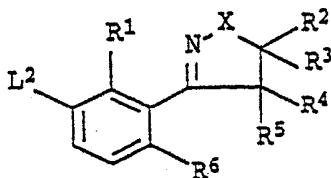
kde

proměnné X , R^1 a R^3 až R^6 jsou, jak byly definovány v nároku
1, a

R^2 je halogenalkylová skupina s 1 až 4 atomy uhlíku;

L je hydroxylová skupina nebo zbytek, který může být
odstraněn hydrolýzou.

9. Derivát 3-(heterocyklyl)benzenu obecného vzorce V:



V

kde proměnné X, R¹ až R⁶ jsou, jak byly definovány v nároku 1

R² je halogenalkylová skupina s 1 až 4 atomy uhlíku; a

L² nukleofilně nahraditelná odstupující skupina.

10. Prostředek, v y z n a č u j í c í s e t í m, že obsahuje herbicidně účinné množství nejméně jednoho 3-(heterocyklyl)-substituovaného benzoylpyrazolu nebo zemědělsky využitelné soli sloučeniny obecného vzorce I, podle některého z nároků 1 až 4 a pomocné látky obvykle používané pro formulování látek na ochranu plodin.

11. Způsob přípravy prostředků podle nároku 8, v y z n a č u j í c í s e t í m, že zahrnuje smísení herbicidně účinného množství nejméně jednoho 3-(heterocyklyl)-substituovaného benzoylpyrazolu nebo zemědělsky využitelné soli sloučeniny obecného vzorce I, podle některého z nároků 1 až 4 a pomocné látky obvykle používané pro formulování látek na ochranu plodin.

12. Způsob regulace nežádoucí vegetace, v y z n a č u j í c í s e t í m, že se herbicidně účinné

množství nejméně jednoho 3-(heterocyklyl)-substituovaného benzoylpyrazolu nebo zemědělsky využitelné soli sloučeniny obecného vzorce I, podle některého z nároků 1 až 4, nechá působit na rostliny, jejich vzrůst a/nebo semena.

13. Použití 3-(heterocyklyl)-substituovaných benzoylpyrazolů a/nebo zemědělsky jejich zemědělsky využitelných solí podle některého z nároků 1 až 4 jako herbicidů.