

PŘIHLÁŠKA VYNÁLEZU

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

(21) Číslo dokumentu:

37-97

(19)

ČESKÁ
REPUBLIKA



ÚŘAD
PRŮMYSLOVÉHO
VLASTNICTVÍ

(22) Přihlášeno: **21. 06. 95**

(32) Datum podání prioritní přihlášky: **06.07.94**

(31) Číslo prioritní přihlášky: **94/4423612**

(33) Země priority: **DE**

(40) Datum zveřejnění přihlášky vynálezu: **17. 06. 98**
(Věstník č. 6/98)

(86) PCT číslo: **PCT/EP95/02396**

(87) PCT číslo zveřejnění: **WO 96/01256**

(13) Druh dokumentu: **A3**

(51) Int. Cl.⁶:

C 07 D 231/22
C 07 D 231/20
C 07 D 401/04
C 07 D 403/04
C 07 C 239/10
C 07 C 271/28
C 07 C 271/58
A 01 N 43/56

(71) Přihlášovatel:

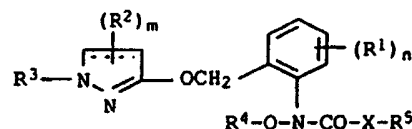
BASF AKTIENGESELLSCHAFT,
Ludwigshafen, DE;

(72) Původce:

Müller Bernd Dr., Frankenthal, DE;
König Hartmann Dr., Heidelberg, DE;
Kirstgen Reinhard Dr., Neustadt, DE;
Oberdorf Klaus Dr., Heidelberg, DE;
Röhl Franz Dr., Schifferstadt, DE;
Götz Norbert Dr., Worms, DE;
Sauter Hubert Dr., Mannheim, DE;
Lorenz Gisela Dr., Hambach, DE;
Ammermann Eberhard Dr., Heppenheim,
DE;

(74) Zástupce:

Koreček Ivan JUDr., Na baště sv. Jiří 9,
Praha 6, 16000;



(54) Název přihlášky vynálezu:

Derivát 2-[(dihydro)pyrazolyl-3 -oxymethy-
len]-anilidu, způsob jeho přípravy a me-
ziprodukt pro jeho přípravu

(57) Anotace:

Derivát 2-[/dihydro/pyrazolyl-3 -oxymethy-
len]anilidu obecného vzorce I, kde substi-
tuenty mají specifické významy a je vhodný
pro výrobu prostředků k účinnému potírání
hub a rostlinných škůdců a k preventivnímu
ošetřování plodin, osiva, materiálů a půdy.

CZ 37-97 A3

Derivát 2-[(dihydro)pyrazolyl-3'-oxymethylen]anilidu, způsob jeho přípravy a meziprodukt pro jeho přípravu

Oblast techniky

Vynález se týká derivátu 2-[(dihydro)pyrazolyl-3'-oxymethylen]anilidu, způsobu jeho přípravy a meziproduktů pro jeho přípravu a také se týká prostředků, které ho obsahují a které jsou vhodné pro potírání živočišných škůdců a škodlivých hub.

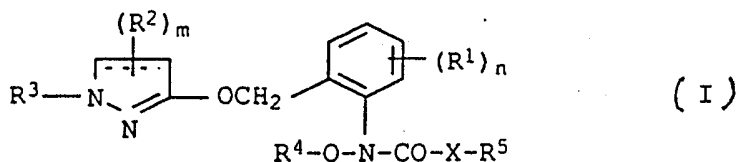
Dosavadní stav techniky

Ze světového patentového spisu číslo WO-A 93/15,046 jsou známy deriváty 2-[pyrazolyl-4-oxymethylen]anilidu, které jsou vhodné pro potírání živočišných škůdců a škodlivých hub.

Úkolem vynálezu je připravit látky, které by byly ještě účinnější než sloučeniny, známé ze stavu techniky.

Podstata vynálezu

Podstatou vynálezu jsou deriváty 2-[(dihydro)pyrazolyl-3'-oxymethylen]anilidu obecného vzorce I



kde znamená

— jednoduchou nebo dvojnou vazbu,

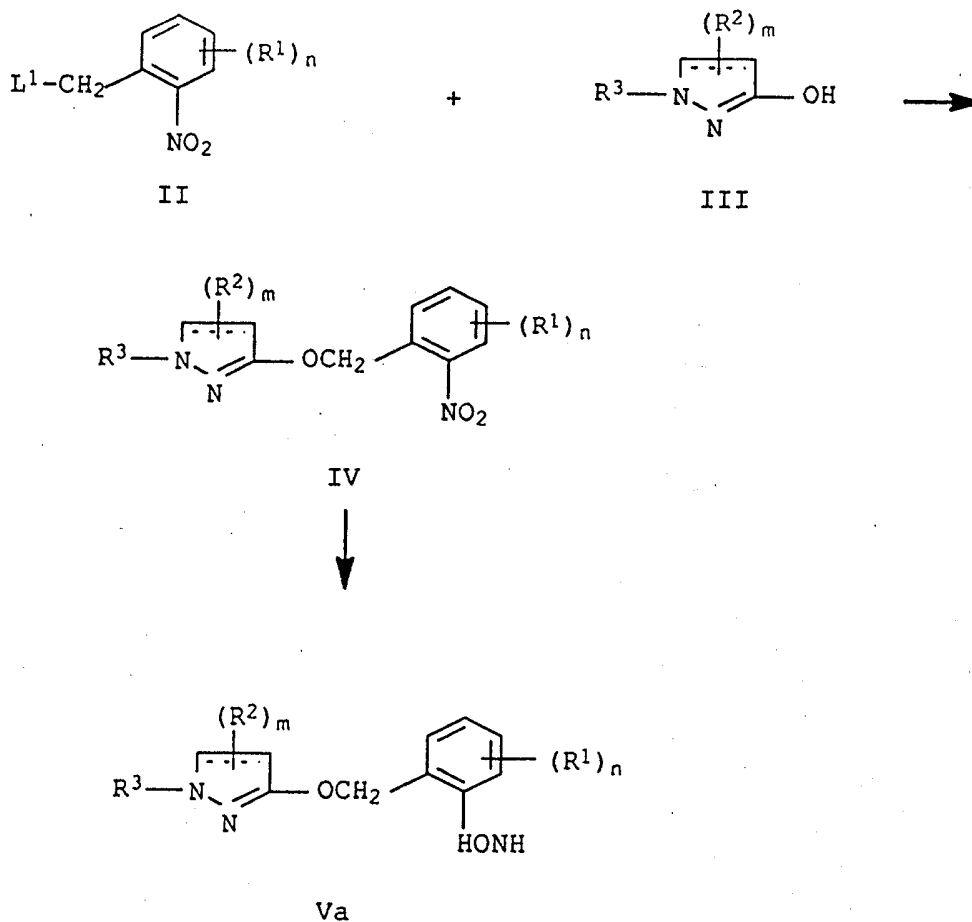
n 0, 1, 2, 3 nebo 4, přičemž R¹ jsou stejné nebo různé, po-

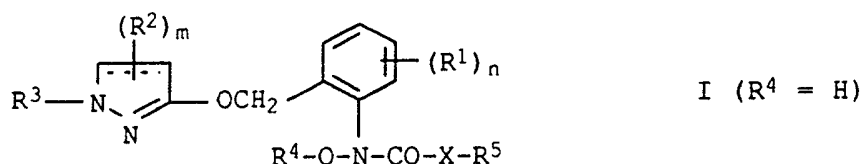
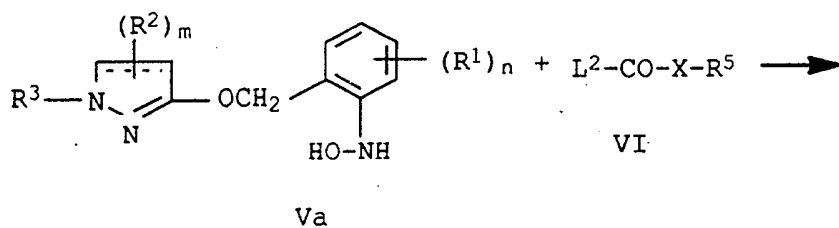
- kud je n větší než 1,
- m 0, 1 nebo 2, přičemž R^2 jsou stejné nebo různé, pokud je m větší než 1,
- X přímou vazbu, atom kyslíku nebo skupinu NR^a ,
- R^a atom vodíku, skupinu alkylovou, alkenylovou, alkinylovou, cykloalkylovou nebo cykloalkenylovou,
- R^1 nitroskupinu, kyanoskupinu nebo atom halogenu, popřípadě substituovanou skupinu alkylovou, alkenylovou, alkinylovou, alkoxykupinu, alkenyloxyskupinu nebo alkinylloxyskupinu nebo
- v případě, že n znamená 2, přidavně na sousední atomy kruhu vázaný, popřípadě substituovaný můstek, který má dva až tři členy ze souboru zahrnujícího skupinu s 3 nebo 4 atomy uhlíku, s 1 až 3 atomy uhlíku a 1 nebo 2 atomy dusíku, kyslíku a/nebo síry, přičemž tyto můstky spolu s kruhem, na který jsou vázány mohou vytvářet parciálně nenasycený nebo aromatický kruh,
- R^2 nitroskupinu, kyanoskupinu nebo atom halogenu, skupinu alkylovou s 1 až 4 atomy uhlíku, halogenalkylovou s 1 až 4 atomy uhlíku, alkoxykupinu s 1 až 4 atomy uhlíku, alkylthioskupinu s 1 až 4 atomy uhlíku nebo alkoxykarbonylovou skupinu s 1 až 4 atomy uhlíku v alkoxy podílu,
- R^3 skupinu alkylovou, alkenylovou nebo alkinylovou, popřípadě substituovaný nasyčený kruh, nebo kruh s jednou nebo se dvěma nenasycenými vazbami, který může obsahovat vedle atomů uhlíku jeden až tři atomy kyslíku, dusíku nebo síry jako heteroatomy kruhu, popřípadě jednokruhovou nebo dvoukruhovou aromatickou skupinu, která má vedle atomů uhlíku jeden až čtyři atomy dusíku nebo jeden nebo dva atomy dusíku a jeden atom kyslíku nebo síry nebo atom kyslíku nebo atom síry jakožto člen kruhu,
- R^4 atom vodíku, popřípadě substituovanou skupinu alkylovou, alkenylovou, alkinylovou, cykloalkylovou nebo cykloalkeny-

lovou, alkylkarbonylovou nebo alkoxykarbonylovou,
 R^5 skupinu alkylovou, alkenylovou, alkinylovou, cykloalkylo-
 vovou nebo cykloalkenylovou, nebo v případě, kdy znamená X
 skupinu NR^a také atom vodíku.

Deriváty 2-[(dihydro)pyrazolyl-3'-oxymethylen]anilidu obec-
 né vzorce I se mohou připravovat různými způsoby.

Sloučeniny obecného vzorce I, kde znamená R^4 atom vodíku a
 X přímou vazbu nebo atom kyslíku, se mohou získat například tak,
 že se převádí derivát benzylu obecného vzorce II v přítomnosti
 zásady reakcí s 3-hydroxy(dihydro)pyrazolem obecného vzorce III
 na odpovídající 2-[(dihydro)pyrazolyl-3-oxymethylen]nitrobenzol
 obecného vzorce IV a následně se redukuje na N-hydroxyanilin
 obecného vzorce Va a N-hydroxyanilin obecného vzorce Va se reakcí
 s karbonylovou sloučeninou obecného vzorce VI převádí na slouče-
 ninu obecného vzorce I.





přičemž znamená L^1 ve sloučenině obecného vzorce II a L^2 ve sloučenině obecného vzorce VI vždy nukleofilní zaměnitelnou skupinu, například atom halogenu (jako chloru, bromu a jodu) nebo alkylsulfonátovou nebo arylsulfonátovou skupinu (například methylsulfonátovou, trifluormethylsulfonátovou, fenylsulfonátovou a 4-methylfenylsulfonátovou skupinu).

Etherifikace sloučenin obecného vzorce II a III se zpravidla provádí při teplotě 0 až 80, s výhodou při teplotě 20 až 60 °C.

Jakožto vhodná rozpouštědla se uvádějí aromatické uhlovodíky, jako toluen, o-, m- nebo p-xylen, halogenované uhlovodíky jako methylenchlorid, chloroform a chlorbenzen, ethery jako dietylyether, diisopropylether, terc.-butylmethylether, dioxan, anisol a tetrahydrofuran, nitrily jako acetonitril a propionitril, alkoholy jako methanol, ethanol, n-propanol, i-propanol, n-butanol a terc.-butanol, ketony jako aceton, methylethylketon, jakož také dimethylsulfoxid, dimethylformamid, dimethylacetamid, 1,3-dimethylimidazolidin-2-on a 1,2-dimethyltetrahydro-2(1H)pyrimidin, zvláště však methylenchlorid, aceton, toluen, methyl-terc.-butylether a dimethylformamid. Mohou se také používat směsi uve-

dených rozpouštědel.

Jako zásady jsou vhodné anorganické sloučeniny, například hydroxidy alkalických kovů a kovů alkalických zemin (například hydroxid lithný, sodný, vápenatý a hořečnatý), hydridy alkalických kovů a kovů alkalických zemin (například hydrid lithný, sodný, draselný a vápenatý), amidy alkalických kovů (například lithiumamid, natriumamid a kaliumamid), uhličitany alkalických kovů a kovů alkalických zemin (například uhličitán lithný a vápenatý), hydrogenuhličitany alkalických kovů (například hydrogenuhličitán sodný), organokovové sloučeniny, zvláště alkyly alkalických kovů (například methyllithium, butyllithium a fenyllithium), alkylmagnesiumhalogeniny (například methylmagnesiumchlorid) jakož také alkoholáty alkalických kovů a kovů alkalických zemin (například natriummethanolát, natriumethanolát, kaliummethanolát, kalium-terc.-butanolát a dimethoxymagnesium) a kromě toho organické zásady, například terciární aminy jako trimethylamin, triethylamin, triisopropylethylamin a N-methylpiperidin, pyridin, substituované pyridiny jako collidin, lutidin a 4-dimethylaminopyridin jakož také ^{h'}cyklické aminy.

Obzvláště výhodnými zásadami pro účely vynálezu jsou hydroxid sodný, uhličitán draselný a kalium-terc.-butanolát.

Zásad se používá obecně v ekvimolárním množství, v nadbytku nebo popřípadě i jakožto rozpouštědla.

Pro reakci může být výhodné přidávat katalytické množství korunového etheru (například 18-Krown-6 nebo 15-Krown-5).

Reakce se také může provádět dvoufázově v roztoku hydroxidů nebo uhličitánů alkalických kovů nebo kovů alkalických zemin ve vodné nebo v organické fázi (například v aromatických a/nebo v halogenovaných uhlovodících). Jakožto katalyzátory přenosu fáze přicházejí v úvahu například amoniumhalogenidy a amoniumtetrafluorboráty (například benzyltriethylamoniumchlorid, benzyltributylamoniumbromid, tetrabutylamoniumchlorid, hexadecyltrimethylamoniumbromid nebo tetrabutylamoniumtetrafluoroborát) jakož také

fosfoniumhalogenidy (například tetrabutylfosfoniumchlorid, a tetrafenylfosfoniumbromid).

Pro reakci může být výhodné nechávat reagovat nejdříve 3-hydroxy(dihydro)pyrazol se zásadou na odpovídající hydroxylát, který se pak nechává reagovat s benzylovým derivátem.

Pro přípravu sloučenin obecného vzorce I potřebné výchozí látky obecného vzorce II jsou známy z evropského patentového spisu EP-A 513580 nebo se takové výchozí látky mohou připravit způsoby tam popsanými (Synthesis 1991, 181; Anal. Chim. Acta 185, str. 295, 1996; evropský patentový spis číslo EP-A 336567).

3-Hydroxypyrazoly obecného vzorce IIIa a 3-hydroxydihydropyrazoly obecného vzorce IIIb jsou rovněž známy z literatury nebo se mohou připravit způsoby v literatuře popsanými (IIIa: J. Heterocycl. Chem. 30, str. 49, 1993; Chem. Ber. 107, str. 1318, 1974; Chem. Pharm. Bull. 19, str. 1389, 1971; Tetrahedron Lett. 11, str. 875, 1970; Chem. Heterocycl. Comp. 5, str. 527, 1969, Chem. Ber. 102, str. 3260, 1969, Chem. Ber. 109, str. 261, 1976; J. Org. Chem. 31, str. 1538, 1966; Tetrahedron 43, str. 607, 1987; IIIb: J. Med. Chem. 19, str. 715, 1976).

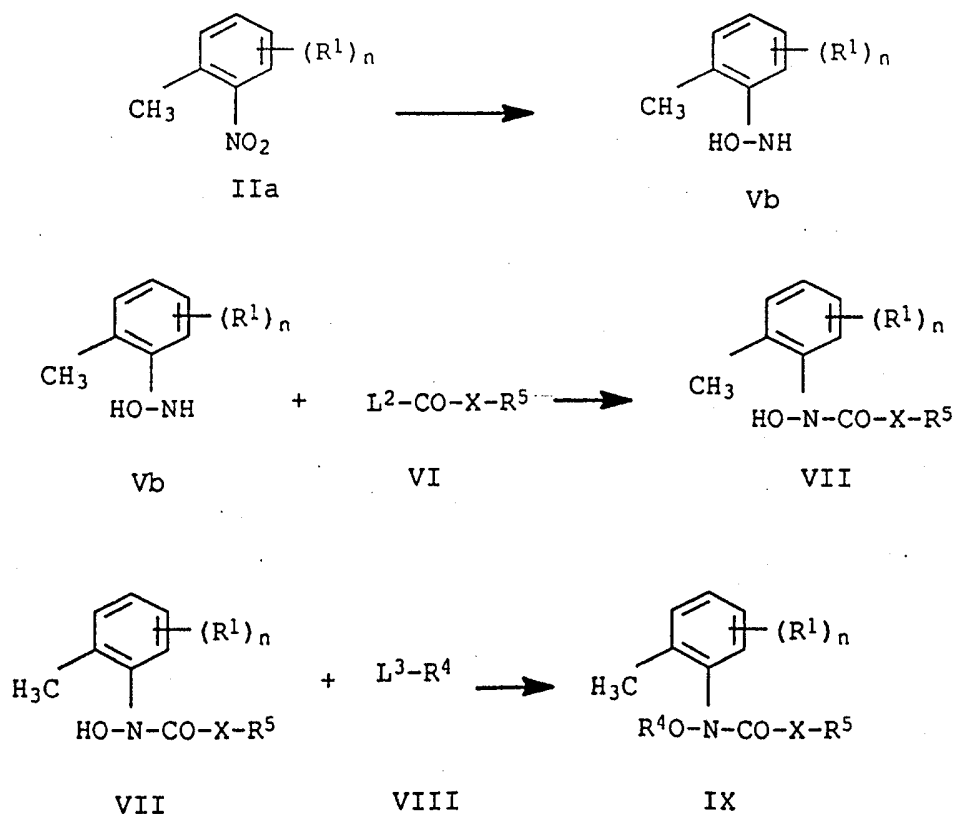
Obzvláště výhodně se získají 3-hydroxypyrazoly obecného vzorce IIIa způsobem podle německé přihlášky vynálezu číslo DE 4 15 484.4.

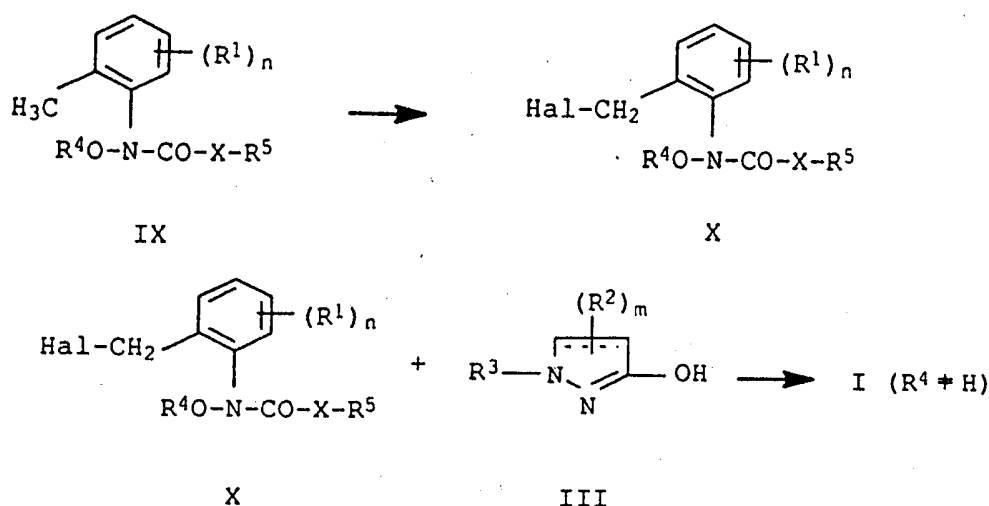
Redukce nitrosloučeniny obecného vzorce IV na odpovídající N-hydroxyaniliny obecného vzorce Va se provádí způsoby popsanými v literatuře například za použití kovů, jako zinku (Ann. Chem. 316, str. 278, 1901) nebo vodíkem (evropský patentový spis číslo EP-A 085890).

Reakce N-hydroxyanilinů obecného vzorce Va s karbonylovými sloučeninami obecného vzorce VI se provádí za alkalických podmínek a za podmínek podle shora popsané reakce sloučenin obecného vzorce II s 3-hydroxy(dihydro)pyrazoly obecného vzorce III. Zvláště se reakce provádí za teploty -10 až 30 °C. Výhodnými rozpouštědly jsou methylenchlorid, toluen, terc.-butylmethylether

nebo ethylacetát. Výhodnými zásadami jsou hydrogenuhličitan sodný, uhličitan draselný a vodný roztok hydroxidu sodného.

Kromě toho se sloučeniny obecného vzorce I, kde znamená X přímou vazbu nebo atom kyslíku, získají například tak, že se benzylový derivát obecného vzorce IIa nejdříve redukuje na odpovídající hydroxyanilin obecného vzorce Vb, hydroxyanilin obecného vzorce Vb se nechává reagovat s karbonylovou sloučeninou obecného vzorce VI na odpovídající anilid obecného vzorce VII, anilid obecného vzorce VII se převádí reakcí se sloučeninou obecného vzorce VIII na amid obecného vzorce IX, amid obecného vzorce IX se převádí na odpovídající benzylhalogenid obecného vzorce X a benzylhalogenid obecného vzorce X se převádí působením zásady reakcí s 3-hydroxy(dihydro)pyrazolem obecného vzorce III na sloučeninu obecného vzorce I.





V obecném vzorci X znamená Hal atom halogenu, zvláště chloru nebo bromu.

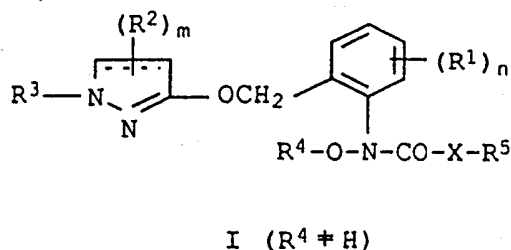
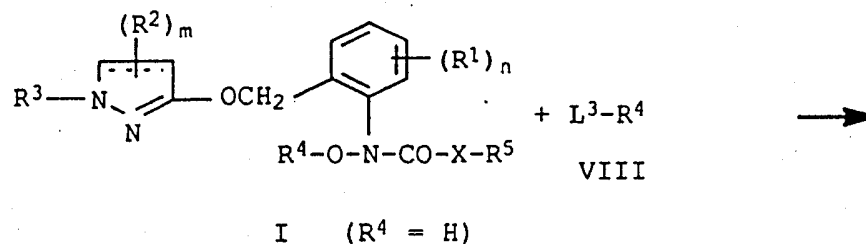
Symbol L^3 ve sloučenině obecného vzorce VIII znamená nukleofilní zaměnitelnou skupinu, například atom halogenu (jako chloru, bromu a jodu) nebo alkylsulfonátovou nebo arylsulfonátovou (například metylsulfonátovou, trifluormethylsulfonátovou, fenylsulfonátovou a 4-methylfenylsulfonátovou skupinu) a R^4 neznámá atom vodíku.

Reakce se provádí obdobně jako shora popsáno.

Halogenace sloučeniny obecného vzorce IX se provádí radikálově přičemž se může používat jako halogenačního prostředku například N-chlorsukcinimidu nebo N-bromsukcinimidu, elementárního halogenu (například chloru nebo bromu) nebo thionylchloridu, sulfurylchloridu, chloridu fosforitého nebo fosforečného a podobných sloučenin. Zpravidla se používá přídatně radikálového starteru (například azobisisobutyronitrilu) nebo se reakce provádí za ozarování (ultrafialovým světlem). Halogenace se provádí o sobě známým způsobem za použití obvyklých organických ředidel.

Sloučeniny obecného vzorce I, kde neznámá R^4 atom vodíku,

se získají kromě toho tak, že se odpovídající sloučenina obecného vzorce I, kde znamená R^4 atom vodíku, nechává reagovat se sloučeninou obecného vzorce VIII.

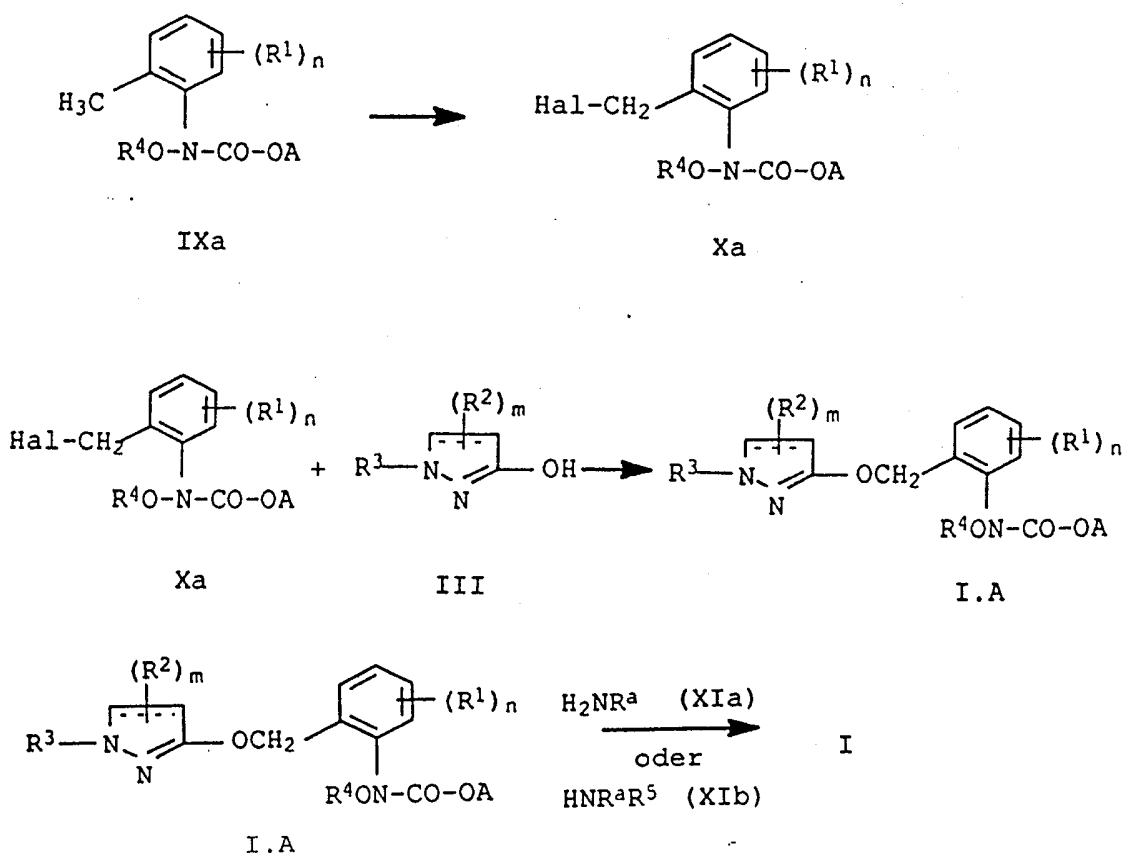


Reakce se provádí o sobě známým způsobem v inertním organickém rozpouštědle v přítomnosti zásady při teplotě 0 až 50 °C.

Jakožto zásady jsou vhodné hydrogenuhličitan sodný, uhličitan draselný, hydroxid sodný a vodný roztok hydroxidu sodného.

Jakožto rozpouštědla jsou vhodná aceton, dimethylformamid, toluen, terc.-butylmethylether, ethylester kyseliny octové a methanol.

Sloučeniny obecného vzorce I, kde znamená X skupinu NR^a , se získají s výhodou tak, že se benzylanilid obecného vzorce IXa převádí na odpovídající benzylhalogenid obecného vzorce Xa, benzylhalogenid obecného vzorce Xa se v přítomnosti zásady převádí reakcí s 3-hydroxy(dihydro)pyrazolem obecného vzorce III na sloučeninu obecného vzorce IA a sloučenina obecného vzorce IA se reakcí s primárním nebo se sekundárním aminem obecného vzorce XI převádí na sloučeninu obecného vzorce I.



Symbol A v obecném vzorci VIIa znamená alkylovou skupinu (zvláště alkylovou skupinu s 1 až 6 atomy uhlíku) nebo fenylovou skupinu. Symbol Hal v obecném vzorci VIIIa znamená atom halogenu (zvláště atom chloru nebo bromu).

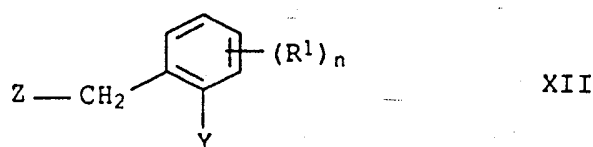
Reakce sloučeniny obecného vzorce IXa na Xa a Xa na IA se provádí za shora uvedených podmínek.

Reakce sloučeniny obecného vzorce IA s primárními nebo se sekundárními aminy obecného vzorce XIa popřípadě XIb se provádí při teplotě 0 až 100 °C v inertním rozpouštědle nebo ve směsi inertních rozpouštědel.

Jakožto rozpouštědla se hodí zvláště voda, ter.-butylmethylether a toluen nebo jejich směsi. Může být výhodné ke zlepšení rozpustnosti eduktů přidávat jedno z následujících rozpouštědel (jakožto zprostředkovatel rozpouštění): tetrahydrofuran, methanol, dimethylformamid a ethylenglykolether.

Aminy obecného vzorce XIa a XIb se zpravidla používají v nadbytku až 100 %, vztaženo na sloučeninu obecného vzorce X, nebo se jich může používat jako rozpouštědel. Z hlediska výtěžků může být výhodné provádět reakci pod tlakem.

Způsob přípravy sloučeniny obecného vzorce I probíhá přes meziprodukty obecného vzorce XII



kde znamená

n 0, 1, 2, 3 nebo 4, přičemž R^1 jsou stejné nebo různé, pokud je n větší než 1,

R^1 nitroskupinu, kyanoskupinu nebo atom halogenu, popřípadě substituovanou skupinu alkylovou, alkenylovou, alkinyllovou, alkoxykupinu, alkenyloxyskupinu nebo alkinylloxyskupinu nebo

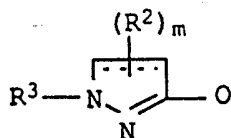
v případě, že n znamená 2, přídavně na sousední atomy kruhu vázaný, popřípadě substituovaný můstek, který má tři až čtyři členy ze souboru zahrnujícího skupinu s 3 nebo 4 atomy uhlíku, s 1 až 3 atomy uhlíku a s 1 nebo 2 atomy dusíku, kyslíku a/nebo síry, přičemž tento můstek spolu s kruhem, na který je vázán, může vytvářet parciálně nenasycený nebo aromatický kruh,

Y nitroskupinu, skupinu NHOH^- nebo NHOR^4 , kde znamená

R^4 popřípadě substituovanou skupinu alkylovou, alkenylovou, alkinyllovou, cykloalkylovou nebo cykloalkenylovou, alkyl-karbonylovou nebo alkoxykarbonylovou skupinu,

Z atom vodíku, hydroxylovou skupinu, merkaptoskupinu, kyanoskupinu, nitroskupinu, atom halogenu, alkylsulfonylovou skupinu s 1 až 6 atomy uhlíku, popřípadě substituovanou arylsufonylovou skupinu nebo skupinu obecného vzorce Z^a

kde znamená



----- jednoduchou nebo dvojnou vazbu,

m 0, 1 nebo 2, přičemž R^2 jsou stejné nebo různé, pokud je m větší než 1,

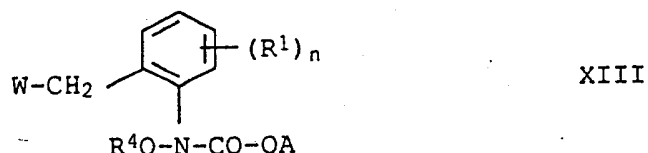
R^2 nitroskupinu, kyanoskupinu nebo atom halogenu, skupinu alkylovou s 1 až 4 atomy uhlíku, halogenalkylovou s 1 až 4 atomy uhlíku, alkoxy skupinu s 1 až 4 atomy uhlíku, alkylthioskupinu s 1 až 4 atomy uhlíku nebo alkoxykarbonylovou skupinu s 1 až 4 atomy uhlíku v alkoxy podílu,

R^3 popřípadě substituovanou alkylovou, alkenylovou nebo alkinylovou skupinu
popřípadě substituovaný nasycený kruh, nebo kruh s jednou nebo se dvěma nenasyčenými vazbami, který může obsahovat vedle atomů uhlíku jeden až tři atomy kyslíku, dusíku nebo síry jako heteroatomy kruhu,
popřípadě jednokruhovou nebo dvoukruhovou aromatickou skupinu, která má vedle atomů uhlíku jeden až čtyři atomy dusíku nebo jeden nebo dva atomy dusíku a jeden atom kyslíku nebo síry nebo atom kyslíku nebo atom síry jakožto člen kruhu.

Pro přípravu jsou obzvláště výhodnými meziprodukty obecného vzorce XII, kde znamená Y skupinu NHOH a Z skupinu Z^a .

Kromě toho jsou pro přípravu jsou obzvláště výhodnými meziprodukty obecného vzorce IX, kde znamená Y nitroskupinu a Z skupinu Z^a .

Pokud jde o sloučeniny obecného vzorce I, kde znamená X skupinu NR^a jsou výhodnými meziprodukty obecného vzorce XIII,



kde R^1 , R^4 a n mají shora uvedený význam a kde znamená

W atom vodíku, atom halogenu nebo skupinu Z^a a
 A alkylovou nebo fenylovou skupinu.

Obzvláště jsou výhodnými sloučeniny obecného vzorce XIII, kde znamená W atom vodíku, chloru nebo bromu nebo skupinu Z^a .

Kromě toho jsou výhodnými sloučeniny obecného vzorce XIII, kde znamená A alkylovou skupinu s 1 až 6 atomy uhlíku.

Obzvláště jsou také výhodnými sloučeniny obecného vzorce XIII, kde znamená A fenylovou skupinu.

Stejně jsou také výhodnými sloučeniny obecného vzorce XIII, kde znamená R^4 atom vodíku, methylovou nebo ethylovou skupinu.

Kromě toho jsou také výhodnými sloučeniny obecného vzorce XIII, kde znamená n 0 nebo 1.

Především jsou výhodnými sloučeniny obecného vzorce XIII, kde znamená

n nulu,

W atom vodíku, atom chloru nebo bromu nebo skupinu Z^a ,

R^4 atom vodíku, methylovou nebo ethylovou skupinu a

A fenylovou skupinu.

Sloučeniny obecného vzorce I mohou mít kyselé a zásadité skupiny, a proto mohou vytvářet adiční soli s kyselinami nebo se zásadami.

Jakožto kyseliny, vhodné pro vytáření adičních solí s kyselinami, se uvádějí například kyseliny minerální (například halogenovodíkové, jako chlorovodíková a bromovodíková kyselina, kyselina fosforečná, sírová a dusičná), kyseliny organické (například kyselina mravenčí, octová, šťavelová, mléčná, jantarová, vinná, citronová, salicylová, p-toluensulfonová, dodecylbenzensulfonová) a jiné protonové kyselé sloučeniny (například sacharin). Jakožto zásady, vhodné pro přípravu adičních produktů se zásadami, se uvádějí příkladně oxidy, hydroxidy, uhličitany a hydrogenuhlíčitany alkalických kovů, kovů alkalických zemin (například hydroxid nebo uhličitán draselný nebo sodný) nebo amoniové sloučeniny, například hydroxid amonný.

Následuje bližší vysvětlení shora uvedených symbolů, uváděných v obecných vzorcích.

Atomem halogenu se míní atom chloru, bromu, jodu nebo fluoru.

Alkylovou skupinou se míní uhlovodíková skupina s přímým nebo s rozvětveným řetězcem s 1 až 4 nebo až 10 atomy uhlíku, například skupina methylová, ethylová, propylová, 1-methylethylová, butylová, 1-methylpropylová, 2-methylpropylová a 1,1-dimethylethylová skupina.

Halogenalkylovou skupinou se míní uhlovodíková skupina s přímým nebo s rozvětveným řetězcem s 1 až 4 atomy uhlíku, shora definovaná, ve které jsou atomy vodíku částečně nebo plně nahrazeny atomy halogenu, jako jsou například skupina halogenalkylová s 1 nebo se 2 atomy uhlíku, například skupina chlormethylová, dichlormethylová, trichlormethylová, fluormethylová, difluormethylová, trifluormethylová, chlorfluormethylová, dichlorfluormethylová, chlordinfluormethylová, 1-fluorethylová, 2-fluorethylová, 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 a pentafluorethylová skupina.

Alkylkarbonylovou skupinou se míní alkylová skupina s přímým nebo s rozvětveným řetězcem s 1 až 10 atomy uhlíku (shora definovaná, vázaná přes karbonylovou skupinu).

Alkoxy skupinou se míní alkylová skupina s přímým nebo s rozvětveným řetězcem s 1 až 4 nebo až 10 atomy uhlíku (shora definovaná) vázaná přes atom kyslíku.

Alkoxyalkylkarbonylovou skupinou se míní alkylová skupina s přímým nebo s rozvětveným řetězcem s 1 až 4 atomy uhlíku (shora de-

finovaná, vázaná přes karbonylovou skupinu.

Alkylthioskupinou se míní alkylová skupina s přímým nebo s rozvětveným řetězcem s 1 až 4 nebo až 10 atomy uhlíku (shora definovaná) vázaná přes atom síry.

Popřípadě substituovanou alkylovou skupinou se míní uhlovodíková skupina s přímým nebo s rozvětveným řetězcem s 1 až 10 atomy uhlíku, například s 1 až 6 atomy uhlíku, jako skupina methylová, ethylová, propylová, 1-methylethylová, butylová, 1-methylpropylová, 2-methylpropylová a 1,1-dimethylethylová, pentylová, 1-methylbutylová, 2-methylbutylová, 3-methylbutylová, 2,2-dimethylpropylová, 1-ethylpropylová, hexylová, 1,1-dimethylpropylová, 1-methylpentylová, 2-methylpentylová, 3-methylpentylová, 4-methylpentylová, 1,1-dimethylbutylová, 1,2-dimethylbutylová, 1,3-dimethylbutylová, 1,2-dimethylbutylová, 2,3-dimethylbutylová, 3,3-dimethylbutylová, 1-ethylbutylová, 2-ethylbutylová, 1,1,2-trimethylpropylová, 1,2,2-trimethylpropylová, 1-ethyl-1-methylpropylová a 1-ethyl-2-methylpropylová skupina.

Popřípadě substituovanou alkenylovou skupinou se míní nenasycená uhlovodíková skupina s přímým nebo s rozvětveným řetězcem zvláště se 2 až 10 atomy uhlíku a s jednou dvojnou vazbou v libovolném místě, například alkenylová skupina s 2 až 6 atomy uhlíku, jako skupina ethenylová, 1-propenylová, 2-propenylová, 1-methylethylová, 1-butenylová, 2-butenylová, 3-butenylová, 1-methyl-1-propenylová, 2-methyl-1-propenylová 1-methyl-2-propenylová, 2-methyl-2-propenylová, 1-pentenylová, 2-pentenylová, 3-pentenylová, 4-pentenylová, 1-methyl-1-butenylová, 2-methyl-1-butenylová, 3-methyl-1-butenylová, 1-methyl-2-butenylová, 2-methyl-2-butenylová, 3-methyl-2-butenylová, 1-methyl-3-butenylová, 2-methyl-3-butenylová, 3-methyl-3-butenylová, 1,1-dimethyl-2-propenylová, 1,2-dimethyl-2-propenylová, 1,2-dimethyl-2-propenylová, 1-ethyl-

1-propenylová, 1-ethyl-2-propenylová, 1-hexenylová, 2-hexenylová, 3-hexenylová, 4-hexenylová, 5-hexenylová, 1-methyl-1-pentenylová, 2-methyl-1-pentenylová, 3-methyl-1-pentenylová, 4-methyl-1-pentenylová, 1-methyl-2-pentenylová, 2-methyl-2-pentenylová, 3-methyl-2-pentenylová, 4-methyl-2-pentenylová, 1-methyl-3-pentenylová, 2-methyl-3-pentenylová, 3-methyl-3-pentenylová, 4-methyl-3-pentenylová, 1-methyl-4-pentenylová, 2-methyl-4-pentenylová, 3-methyl-4-pentenylová, 4-methyl-4-pentenylová, 1,1-dimethyl-2-butenylová, 1,1-dimethyl-3-butenylová, 1,2-dimethyl-1-butenylová, 1,2-dimethyl-2-butenylová, 1,2-dimethyl-3-butenylová, 1,3-dimethyl-1-butenylová, 1,3-dimethyl-2-butenylová, 1,3-dimethyl-3-butenylová, 2,2-dimethyl-3-butenylová, 2,3-dimethyl-1-butenylová, 2,3-dimethyl-2-butenylová, 2,3-dimethyl-3-butenylová, 3,3-dimethyl-1-butenylová, 3,3-dimethyl-2-butenylová, 1-ethyl-1-butenylová, 1-ethyl-2-butenylová, 1-ethyl-3-butenylová, 2-ethyl-1-butenylová, 2-ethyl-2-butenylová, 2-ethyl-3-butenylová, 1,1,2-trimethyl-2-propenylová, 1-ethyl-1-methyl-2-propenylová, 1-ethyl-2-methyl-1-propenylová a 1-ethyl-2-methyl-2-propenylová skupina.

Popřípadě substituovanou alkenyloxskupinou se míní uhlovodíková skupina s přímým nebo s rozvětveným řetězcem s 3 až 10 atomy uhlíku (shora definovaná), která je vázána přes atom kyslíku.

Alkinylovou skupinou se míní uhlovodíková skupina s přímým nebo s rozvětveným řetězcem zvláště se 2 až 20 atomy uhlíku a s jednou trojnou vazbou v libovolném místě, například alkinylová skupina s 2 až 6 atomy uhlíku, jako skupina ethinylová, 1-propinylová, 2-propinylová, 1-butylylová, 2-butylylová, 3-butylylová, 1-methyl-2-propinylová, 1-pentylylová, 2-pentylylová, 3-pentylylová, 4-pentylylová, 1-methyl-2-butylylová, 1-methyl-3-butylylová, 2-methyl-3-butylylová, 3-methyl-1-butylylová, 2-methyl-1-butylylová, 3-methyl-1-butylylová, 1,1-dimethyl-2-propinylová, 1-e-

thyl-2-propinylová, 1-hexinylová, 2-hexinylová, 3-hexinylová, 4-hexinylová, 5-hexinylová, 1-methyl-2-pentinylová, 1-methyl-3-pentinylová, 1-methyl-4-pentinylová, 2-methyl-3-pentinylová, 2-methyl-4-pentinylová, 3-methyl-1-pentinylová, 3-methyl-4-pentinylová, 4-methyl-1-pentinylová, 4-methyl-2-pentinylová, 1,1-dimethyl-2-butylová, 1,1-dimethyl-3-butylová, 1,2-dimethyl-3-butylová, 1,2-dimethyl-3-butylová, 2,2-dimethyl-3-butylová, 1,3-dimethyl-1-butylová, 1-ethyl-2-butylová, 1-ethyl-3-butylová, 2-ethyl-3-butylová, 1-ethyl-1-methyl-2-propinylová skupina.

Popřípadě substituovanou alkinyloxyskupinou se míní alkinyllová skupina s přímým nebo s rozvětveným řetězcem zvláště se 3 až 10 atomy uhlíku (shora definovaná) vázaná přes atom kyslíku.

Popřípadě substituovanou cykloalkylovou skupinou se míní uhlovodíková skupina s jedním nebo se dvěma kruhy s 3 až 10 atomy uhlíku, například (bi)cykloalkylová skupina s 3 až 10 atomy uhlíku, jako skupina cyklopropylová, cyklobutylová, cyklopentylová, cyklohexylová, cykloheptylová, bornanylová, norbornanylová, dicyklohexylová, bicyklo[3,3,0]oktylová, bicyklo[3,2,1]oktylová, bicyklo[2,2,2]oktylová nebo bicyklo[3,3,1]nonylová skupina.

Popřípadě substituovanou cykloalkenylovou skupinou se míní uhlovodíková skupina s jedním nebo se dvěma kruhy s 5 až 10 atomy uhlíku a s jednou dvojnou vazbou v libovolné poloze, například (bi)cykloalkenylová skupina s 5 až 10 atomy uhlíku, jako skupina cyklopentenylová, cyklohexenylová, cykloheptenylová, bornenylová, norbornenylová, dicyklohexenylová, bicyklo[3,3,0]oktenylová skupina.

Na dvou sousedních atomech kruhu vázaným, popřípadě substituovaným můstkem, který má tři až čtyři členy ze souboru zahrnujícího skupinu se 3 nebo 4 atomy uhlíku, s 1 až 3 atomy uhlíku a

s 1 nebo 2 atomy dusíku, kyslíku a/nebo síry, přičemž tyto můstky spolu s kruhem, na který jsou vázány mohou vytvářet parciálně nenasyčený nebo aromatický kruh, se míní skupiny, které vytvářejí s kruhem, na který jsou vázány například systém chinolinylový, benzofuranylový a naftylový.

Popřípadě substituovaným nasyceným kruhem nebo kruhem s jednou nebo se dvěma nenasyčenými vazbami, který obsahuje vedle atomů uhlíku jeden až tři heteroatomy ze souboru zahrnujícího atom kyslíku, síry a dusíku jako členy kruhu se míní například karbocykly jako skupina cyklopropylová, cyklopentylová, cyklohexylová, cyklopent-2-enylová, cyklohex-2-enylová, pětičlenné až šestičlenné heterocyklické skupiny, nasycené nebo nenasyčené heterocyklické skupiny obsahující jeden až tři atomy dusíku a/nebo kyslíku nebo síry, jako jsou například skupina 2-tetrahydrofuranylová, 3-tetrahydrofuranylová, 2-tetrahydrothienylová, 3-tetrahydrothienylová, 2-pyrrolidinylová, 3-pyrrolidinylová, 3-isoxazolidinylová, 4-isoxazolidinylová, 5-isoxazolidinylová, 3-isothiazolidinylová, 4-isothiazolidinylová, 5-isothiazolidinylová, 3-pyrazolidinylová, 4-pyrazolidinylová, 5-pyrazolidinylová, 2-oxazolidinylová, 4-oxazolidinylová, 5-oxazolidinylová, 2-thiazolidinylová, 4-thiazolidinylová, 5-thiazolidinylová, 2-imidazolidinylová, 4-imidazolidinylová, 1,2,4-oxadiazolidin-3-ylová, 1,2,4-oxadiazolidin-5-ylová, 1,2,4-thiadiazolidin-3-ylová, 1,2,4-thiadiazolidin-5-ylová, 1,2,4-triazolidin-3-ylová, 1,3,4-oxadiazolidin-2-ylová, 1,3,4-thiadiazolidin-2-ylová, 1,3,4-triazolidin-2-ylová, 2,3-dihydrofur-2-ylová, 2,3-dihydrofur-3-ylová, 2,4-dihydrofur-2-ylová, 2,4-dihydrofur-3-ylová, 2,3-dihydrothien-2-ylová, 2,3-dihydrothien-3-ylová, 2,4-dihydrothien-2-ylová, 2,4-dihydrothien-3-ylová, 2,3-pyrrolin-2-ylová, 2,3-pyrrolin-3-ylová, 2,4-pyrrolin-2-ylová, 2,4-pyrrolin-3-ylová, 2,3-isoxazolin-3-ylová, 3,4-isoxazolin-3-ylová, 4,5-isoxazolin-3-ylová, 2,3-isoxazolin-4-ylová, 3,4-isoxazolin-4-ylová, 4,5-isoxazolin-4-ylová, 2,3-isoxazolin-5-ylová, 3,4-isoxazo-

lin-5-ylová, 4,5-isoxazolin-5-ylová, 2,3-isothiazolin-3-ylová, 3,4-isothiazolin-3-ylová, 4,5-isothiazolin-3-ylová, 2,3-isothiazolin-4-ylová, 3,4-isothiazolin-4-ylová, 4,5-isothiazolin-4-ylová, 2,3-isothiazolin-5-ylová, 3,4-isothiazolin-5-ylová, 4,5-isothiazolin-5-ylová, 2,3-dihydropyrazol-1-ylová, 2,3-dihydropyrazol-2-ylová, 2,3-dihydropyrazol-3-ylová, 2,3-dihydropyrazol-4-ylová, 2,3-dihydropyrazol-5-ylová, 3,4-dihydropyrazol-1-ylová, 3,4-dihydropyrazol-3-ylová, 3,4-dihydropyrazol-4-ylová, 3,4-dihydropyrazol-5-ylová, 4,5-dihydropyrazol-1-ylová, 4,5-dihydropyrazol-3-ylová, 4,5-dihydropyrazol-4-ylová, 4,5-dihydropyrazol-5-ylová, 2,3-dihydrooxazol-2-ylová, 2,3-dihydrooxazol-3-ylová, 2,3-dihydrooxazol-4-ylová, 2,3-dihydrooxazol-5-ylová, 3,4-dihydrooxazol-2-ylová, 3,4-dihydrooxazol-3-ylová, 3,4-dihydrooxazol-4-ylová, 3,4-dihydrooxazol-5-ylová, 2-piperidinylová, 3-piperidinylová, 4-piperidinylová, 1,3-dioxan-5-ylová, 2-tetrahydropyranylová, 4-tetrahydropyranylová, 2-tetrahydrothienylová, 3-tetrahydropyridazinylová, 4-tetrahydropyridazinylová, 2-tetrahydropyrimidinylová, 4-tetrahydropyrimidinylová, 5-tetrahydropyrimidinylová, 2-tetrahydropyrazinylová, 1,3,5-tetrahydrotriazin-2-ylová a 1,2,4-tetrahydrotriazin-3-ylová skupina, s výhodou skupina 2-tetrahydrofuran-2-ylová, 2-tetrahydrothienylová, 2-pyrrolidinylová, 3-isooxazolidinylová, 1,3,4-oxazolidin-2-ylová, 2,3-dihydrothien-2-ylová, 4,5-isoxazolin-3-ylová, 3-piperidinylová, 1,3-dioxan-5-ylová, 4-piperidinylová, 2-tetrahydropyranylová a 4-tetrahydropyranylová skupina.

Popřípadě substituovaným aromatickým systémem s jedním nebo se dvěma kruhy, který obsahuje vedle atomů uhlíku jeden až čtyři atomy dusíku nebo jeden nebo dva atomy dusíku a atom kyslíku nebo atom síry nebo jeden atom kyslíku nebo síry jako člen kruhu, se míní arylová skupina jako skupina fenylová nebo naftylová, s výhodou skupina fenylová a 1-naftylová nebo 2-naftylová a heteroarylové skupiny, například s pětičlenným kruhem obsahující je-

den až tři atomy dusíku a/nebo kyslíku nebo síry, jako jsou skupina 2-furylová, 3-furylová, 2-thienylová, 3-thienylová, 1-pyrrolylová, 2-pyrrolylová, 3-pyrrolylová, 3-oxazolylová, 4-oxazolylová, 5-oxazolylová, 3-isothiazolylová, 4-isothiazolylová, 5-isothiazolylová, 2-pyrazolylová, 3-pyrazolylová, 4-pyrazolylová, 5-pyrazolylová, 2-oxazolylová, 4-oxazolylová, 5-oxazolylová, 2-thiazolylová, 5-thiazolylová, 1-imidazolylová, 2-imidazolylová, 4-imidazolylová, 1,2,4-oxadiazol-3-ylová, 1,2,4-oxadiazol-5-ylová, 1,2,4-thiadiazol-3-ylová, 1,2,4-thiadiazol-5-ylová, 1,2,5-triazol-3-ylová, 1,2,3-triazol-4-ylová, 1,2,5-triazol-5-ylová, 5-tetrazolylová, 1,2,3,4-thiatriazol-5-ylová a 1,2,3,4-oxatriazol-5-ylová skupina zvláště však skupina 3-isoxazolylová, 5-isoxazolylová, 4-oxazolylová, 4-thiazolylová, 1,3,4-oxadiazol-2-ylová a 1,3,4-thiadiazol-2-ylová skupina.

Šestičlennou heteroaromatickou skupinou s jedním až čtyřmi atomy dusíku jakožto heteroatomy se mísí skupiny jako jsou skupina 2-pyridinylová, 3-pyridinylová, 4-pyridinylová, 3-pyridazinylová, 4-pyridazinylová, 2-pyrimidinylová, 4-pyrimidinylová, 5-pyrimidinylová, 2-pyrazinylová, 1,3,5-triazin-2-ylová, 1,2,4-triazin-3-ylová a 1,2,4,5-tetrazin-3-ylová, zvláště skupina 2-pyridinylová, 3-pyridinylová, 4-pyridinylová, 2-pyrimidinylová, 4-pyrimidinylová, 2-pyrazinylová a 4-pyridazinylová skupina.

Přídavné označení "popřípadě substituovaná" v případě skupiny alkylové, alkenylové a alkinylové znamená, že tyto skupiny mohou být částečně nebo plně halogenovány (to znamená, že atomy vodíku mohou být částečně nebo plně nahrazeny stejnými nebo různými halogenovými atomy, shora uvedenými, jako jsou s výhodou atom fluoru, chloru nebo bromu, zvláště pak atom fluoru a chloru) a/nebo mohou mít jednu až tři, zvláště jednu následující skupinu: alkoxyskupinu s 1 až 6 atomy uhlíku, halogenalkoxyskupinu s 1 až 6 atomy uhlíku, alkylthioskupinu s 1 až 6 atomy uhlíku, halogen-

alkylthioskupinu s 1 až 6 atomy uhlíku, alkylaminoskupinu s 1 až 6 atomy uhlíku, dialkylaminoskupinu s 1 až 6 atomy uhlíku, alkenyloxyskupinu s 2 až 6 atomy uhlíku, halogenalkenyloxyskupinu s 2 až 6 atomy uhlíku, alkinyloxyskupinu s 2 až 6 atomy uhlíku, halogenalkinyloxyskupinu s 2 až 6 atomy uhlíku, cykloalkylovou skupinu s 3 až 6 atomy uhlíku, cykloalkyloxyskupinu s 3 až 6 atomy uhlíku, cykloalkenylovou skupinu s 3 až 6 atomy uhlíku, cykloalkenyloxyskupinu s 3 až 6 atomy uhlíku.

Popřípadě substituovaným aromatickým systémem s jedním nebo se dvěma kruhy, který obsahuje vedle atomů uhlíku jeden až čtyři atomy dusíku nebo jeden nebo dva atomy dusíku a atom kyslíku nebo atom síry nebo jeden atom kyslíku nebo síry jako člen kruhu, se míní skupina (jak shora uvedeno), která je přímo nebo přes atom kyslíku (-O-), přes atom síry (-S-) nebo přes aminoskupinu (-NR^a-) vázána na substituenty, to znamená arylová skupina jako skupina fenylová nebo naftylová, s výhodou skupina fenylová a 1-naftylová nebo 2-naftylová a heteroarylové skupiny, například s pětičlenným kruhem obsahující jeden až tři atomy dusíku a/nebo kyslíku nebo síry, jako jsou skupina 2-furylová, 3-furylová, 2-thienylová, 3-thienylová, 1-pyrrolylová, 2-pyrrolylová, 3-pyrrolylová, 3-oxazolylová, 4-oxazolylová, 5-oxazolylová, 3-isothiazolylová, 4-isothiazolylová, 5-isothiazolylová, 2-pyrazolylová, 3-pyrazolylová, 4-pyrazolylová, 5-pyrazolylová, 2-oxazolylová, 4-oxazolylová, 5-oxazolylová, 2-thiazolylová, 5-thiazolylová, 1-imidazolylová, 2-imidazolylová, 4-imidazolylová, 1,2,4-oxadiazol-3-ylová, 1,2,4-oxadiazol-5-ylová, 1,2,4-thiadiazol-3-ylová, 1,2,4-thiadiazol-5-ylová, 1,2,5-triazol-3-ylová, 1,2,3-triazol-4-ylová, 1,2,5-triazol-5-ylová, 5-tetrazolylová, 1,2,3,4-thiatriazol-5-ylová a 1,2,3,4-oxatriazol-5-ylová skupina zvláště však skupina 3-isoxazolylová, 5-isoxazolylová, 4-oxazolylová, 4-thiazolylová, 1,3,4-oxadiazol-3-ylová a 1,3,4-thiadiazol-3-ylová skupina.

Šestičlennou heteroaromatickou skupinou s jedním až čtyřmi atomy dusíku jakožto heteroatomy se míní skupiny jako jsou skupina 2-pyridinylová, 3-pyridinylová, 4-pyridinylová, 3-pyridazinylová, 4-pyridazinylová, 2-pyrimidinylová, 4-pyrimidinylová, 5-pyrimidinylová, 2-pyrazinylová, 1,3,5-triazin-2-ylová, 1,2,4-triazin-3-ylová a 1,2,4,5-tetrazin-3-ylová, zvláště skupina 2-pyridinylová, 3-pyridinylová, 4-pyridinylová, 2-pyrimidinylová, 4-pyrimidinylová, 2-pyrazinylová a 4-pyridazinylová skupina.

Přídavné označení "popřípadě substituovaná" v případě skupiny cykloalkylové (nasycené, nenasycené nebo aromatické) znamená, že tato skupina může být částečně nebo plně halogenována (to znamená, že atomy vodíku mohou být částečně nebo plně nahrazeny stejnými nebo různými halogenovými atomy, shora uvedenými (s výhodou atomem fluoru, chloru nebo bromu, zvláště pak atom fluoru a chloru) a/nebo mohou mít jednu až tři, zvláště jednu skupinu shora uvedenou jako případné substituenty skupiny alkylové, alkenylové a alkinylové.

Aromatické nebo heteroaromatické jednokruhové nebo dvoukruhové systémy mohou být částečně nebo plně halogenovány, (to znamená, že atomy vodíku mohou být částečně nebo plně nahrazeny různými halogenovými atomy, shora uvedenými, jako jsou s výhodou atom fluoru, chloru nebo bromu, zvláště pak atom fluoru a chloru).

Tyto aromatické nebo heteroaromatické jednokruhové nebo dvoukruhové systémy mohou vedle atomů halogenu mít jeden až tři substituenty, jako jsou

nitroskupina

kyanoskupina a thiokyanátová skupina;

alkylová skupina zvláště s 1 až 6 atomy uhlíku, jak shora uvedeno, s výhodou skupina methylová, ethylová, 1-methylethylová, butylová, hexylová a především skupina methylová a 1-methylethylová skupina;

halogenalkylová skupina, jak shora uvedeno, s výhodou skupina trichlormethylová, difluormethylová, trifluormethylová, 2,2-difluorethylová, 2,2,2-trifluorethylová a pentafluorethylová skupina;

alkoxyskupina s 1 až 4 atomy uhlíku s výhodou methoxyskupina, ethoxyskupina, 1-methylethoxyskupina a 1,1-dimethylethoxyskupina, zvláště methoxyskupina;

halogenalkoxyskupina s 1 až 4 atomy uhlíku, zvláště halogenalkoxyskupina s 1 až 2 atomy uhlíku, s výhodou difluormethoxyskupina, trifluormethoxyskupina, 2,2,2-trifluormethoxyskupina a především difluormethoxyskupina;

alkylthioskupina 1 až 4 atomy uhlíku s výhodou methylthioskupina a 1-methylethylthioskupina a zvláště methylthioskupina;

alkylaminoskupina 1 až 4 atomy uhlíku jako methylaminoskupina, ethylaminoskupina, propylaminoskupina, 1-methylethylaminoskupina, butylaminoskupina, 1-methylpropylaminoskupina, 2-methylpropylaminoskupina, 1,1-dimethylethylaminoskupina a zvláště methylaminoskupina 1,1-dimethylethylaminoskupina a především methylaminoskupina;

dialkylaminoskupina 1 až 4 atomy uhlíku jako N,N-dimethylaminoskupina, N,N-diethylaminoskupina, N,N-dipropylaminoskupina, N,N-di-(methylethyl)aminoskupina, N,N-dibutylaminoskupina, N,N-di-(methylpropyl)aminoskupina, N,N-di-(1,1-methylethyl)aminoskupina;

na, N-ethyl-N-methylaminoskupina, N-methyl-N-propylaminoskupina, N-methyl-N-(1-methylethylaminoskupina, N-butyl-N-methylaminoskupina, N-methyl-N-(1-methylpropyl)aminoskupina, N-methyl-N-(2-methylpropyl)aminoskupina, N-(1,1-dimethylethyl)-N-methylaminoskupina, N-ethyl-N-propylaminoskupina, N-ethyl-N-(1-methylethyl)aminoskupina, N-butyl-N-ethylaminoskupina, N-ethyl-N-(1-methylpropyl)aminoskupina, N-ethyl-N-(2-methylpropyl)aminoskupina, N-ethyl-N-(1,1-dimethylethyl)aminoskupina, N-(1-methylethyl)-N-propylaminoskupina, N-butyl-N-propylaminoskupina, N-(1-methylpropyl)-N-propylaminoskupina, N-(2-methylpropyl)-N-propylaminoskupina, N-(1,1-dimethylethyl)-N-propylaminoskupina, N-butyl-N-(1-methylethyl)aminoskupina, N-(1-methylethyl)-N-(1-methylpropyl)aminoskupina, N-(1-methylethyl)-N-(2-methylpropyl)aminoskupina, N-(1,1-dimethylethyl)-N-(1-methylethyl)aminoskupina, N-butyl-N-(1-methylpropyl)aminoskupina, N-butyl-N-(2-methylpropyl)aminoskupina, N-butyl-N-(1,1-dimethylethyl)aminoskupina, N-(1-methylpropyl)-N-(2-methylpropyl)aminoskupina, N-(1-dimethylethyl)-N-(1-methylpropyl)aminoskupina a N-(1,1-dimethylethyl)-N-(2-methylpropyl)aminoskupina, s výhodou N,N-dimethylaminoskupina, N,N-diethylaminoskupina a především N,N-dimethylaminoskupina;

alkylkarbonylová skupina 1 až 6 atomů uhlíku v alkylovém podílu jako skupina methylkarbonylová, ethylkarbonylová, propylkarbonylová, 1-methylethylkarbonylová, butylkarbonylová, 1-methylpropylkarbonylová, 2-methylpropylkarbonylová, 1,1-di-methylethylkarbonylová, pentylkarbonylová, 1-methylbutylkarbonylová, 2-methylbutylkarbonylová, 3-methylbutylkarbonylová, 1,2-di-methylpropylkarbonylová, 2,2-dimethylpropylkarbonylová, 1-ethylpropylkarbonylová, hexylkarbonylová, 1-methylpentylkarbonylová, 2-methylpentylkarbonylová, 3-methylpentylkarbonylová, 4-methylpentylkarbonylová, 1,1-dimethylbutylkarbonylová, 1,2-dimethylbutylkarbonylová, 1,3-dimethylbutylkarbonylová, 2,2-dimethylbutylkarbonylová, 2,3-dimethylbutylkarbonylová, 3,3-dimethylbutylkarbonylová, 1-ethyl-

butylkarbonylová, 2-ethylbutylkarbonylová, 1,1,2-trimethylpropylkarbonylová, 1,2,2-trimethylpropylkarbonylová, 1-ethyl-1-methylpropylkarbonylová a 1-ethyl-1-methylpropylkarbonylová skupina, s výhodou skupina methylkarbonylová, ethylkarbonylová a 1,1-dimethylkarbonylová a především skupina ethylkarbonylová;

alkoxykarbonylová skupina 1 až 6 atomů uhlíku v alkylovém podílu jako skupina methoxykarbonylová, ethoxykarbonylová, propyloxykarbonylová, 1-methylethoxykarbonylová, butoxykarbonylová, 1-methylpropyloxykarbonylová, 2-methylpropyloxykarbonylová, 1,1-dimethylethyloxykarbonylová, pentyloxykarbonylová, 1-methylbutyloxykarbonylová, 2-methylbutyloxykarbonylová, 3-methylbutyloxykarbonylová, 1,2-di-methylpropyloxykarbonylová, 2,2-dimethylpropyloxykarbonylová, 1-ethylpropyloxykarbonylová, hexyloxykarbonylová, 1-methylpentyloxykarbonylová, 2-methylpentyloxykarbonylová, 3-methylpentyloxykarbonylová, 4-methylpentyloxykarbonylová, 1,1-dimethylbutyloxykarbonylová, 1,2-dimethylbutyloxykarbonylová, 1,3-dimethylbutyloxykarbonylová, 2,2-dimethylbutyloxykarbonylová, 2,3-dimethylbutyloxykarbonylová, 3,3-dimethylbutyloxykarbonylová, 1-ethylbutyloxykarbonylová, 2-ethylbutyloxykarbonylová, 1,1,2-trimethylpropyloxykarbonylová, 1,2,2-trimethylpropyloxykarbonylová, 1-ethyl-1-methylpropyloxykarbonylová a 1-ethyl-1-methylpropyloxykarbonylová skupina, s výhodou skupina methoxykarbonylová, ethoxykarbonylová a 1,1-dimethoxykarbonylová a především skupina ethoxykarbonylová;

alkylaminokarbonylová skupina 1 až 6 atomů uhlíku v alkylovém podílu jako skupina methylaminokarbonylová, ethylaminokarbonylová, propylaminokarbonylová, 1-methylethylaminokarbonylová, butylaminokarbonylová, 1-methylpropylaminokarbonylová, 2-methylpropylaminokarbonylová, 1,1-di-methylethylaminokarbonylová, pentylaminokarbonylová, 1-methylbutylaminokarbonylová, 2-methylbutylaminokarbonylová, 3-methylbutylaminokarbonylová, 1,2-di-methylpropylaminokarbonylová, 2,2-dimethylpropylaminokarbonylová, 1-ethylpro-

pylaminokarbonylová, hexylaminokarbonylová, 1-methylpentylaminokarbonylová, 2-methylpentylaminokarbonylová, 3-methylpentylaminokarbonylová, 4-methylpentylaminokarbonylová, 1,1-dimethylbutylaminokarbonylová, 1,2-dimethylbutylaminokarbonylová, 1,3-dimethylbutylaminokarbonylová, 2,2-dimethylbutylaminokarbonylová, 2,3-dimethylbutylaminokarbonylová, 3,3-dimethylbutylaminokarbonylová, 1-ethylbutylaminokarbonylová, 2-ethylbutylaminokarbonylová, 1,1,2-trimethylpropylaminokarbonylová, 1,2,2-trimethylpropylaminokarbonylová, 1-ethyl-1-methylpropylaminokarbonylová a 1-ethyl-1-methylpropylaminokarbonylová skupina, s výhodou skupina methylaminokarbonylová, ethylaminokarbonylová a 1,1-di-methylaminokarbonylová a především skupina ethylaminokarbonylová;

dialkylaminokarbonylová skupina 1 až 6 atomy uhlíku v alkylovém podílu, zvláště dialkylaminokarbonylová skupina 1 až 4 atomy uhlíku v alkylovém podílu jako skupina N,N-dimethylaminokarbonylová, N,N-diethylaminokarbonylová, N,N-dipropylaminokarbonylová, N,N-di-(1-methylethyl)aminokarbonylová, N,N-dibutylaminokarbonylová, N,N-di-(1-methylpropyl)aminokarbonylová, N,N-di-(2methylpropyl)aminokarbonylová, N,N-di-(1,1-dimethylethyl)aminokarbonylová, N-ethyl-N-methylaminokarbonylová, N-methyl-N-propylaminokarbonylová, N-methyl-N-(1-methylethyl)aminokarbonylová, N-butyl-N-methylaminokarbonylová, N-methyl-N-(1-methylpropyl)aminokarbonylová, N-methyl-N-(2-methylpropyl)aminokarbonylová, N-(1,1-dimethylethyl)-N-methylaminokarbonylová, N-ethyl-N-propylaminokarbonylová, N-ethyl-N-(1-methylethyl)aminokarbonylová, N-butyl-N-ethylaminokarbonylová, N-ethyl-N-(1-methylpropyl)aminokarbonylová, N-ethyl-N-(2-methylpropyl)aminokarbonylová, N-ethyl-N-(1,1-dimethylethyl)aminokarbonylová, N-(1-methylethyl)-N-propylaminokarbonylová, N-butyl-N-propylaminokarbonylová, N-(1-methylpropyl)-N-propylaminokarbonylová, N-(2-methylpropyl)-N-propylaminokarbonylová, N-(1,1-dimethylethyl)-N-propylaminokarbonylová, N-butyl-N-(1-methylethyl)aminokarbonylová, N-(1-methylethyl)-N-(1-methylpropyl)amino-

karbonylová, N-(1-methylethyl)-N-(2-methylpropyl)aminokarbonylová, N-(1,1-dimethylethyl)-N-(1-methylethyl)aminokarbonylová, N-butyl-N-(1-methylpropyl)aminokarbonylová, N-butyl-N-(2-methylpropyl)aminokarbonylová, N-butyl-N-(1,1-dimethylethyl)aminokarbonylová, N-(1-methylpropyl)-N-(2-methylpropyl)aminokarbonylová a N-(1,1-dimethylethyl)-N-(2-methylpropyl)aminokarbonylová skupina a zvláště N,N-dimethylaminokarbonylová skupina a N,N-diethylaminokarbonylová skupina a především N,N-dimethylaminokarbonylová skupina;

alkylkarboxylová skupina 1 až 6 atomů uhlíku v alkylovém podílu jako skupina methylkarboxylová, ethylkarboxylová, propylkarboxylová, 1-methylethylkarboxylová, butylkarboxylová, 1-methylpropylkarboxylová, 2-methylpropylkarboxylová, 1,1-di-methylethylkarboxylová, pentylkarboxylová, 1-methylbutylkarboxylová, 2-methylbutylkarboxylová, 3-methylbutylkarboxylová, 1,2-di-methylpropylkarboxylová, 2,2-dimethylpropylkarboxylová, 1-ethylpropylkarboxylová, hexylkarboxylová, 1-methylpentylkarboxylová, 2-methylpentylkarboxylová, 3-methylpentylkarboxylová, 4-methylpentylkarboxylová, 1,1-dimethylbutylkarboxylová, 1,2-dimethylbutylkarboxylová, 1,3-dimethylbutylkarboxylová, 2,2-dimethylbutylkarboxylová, 2,3-dimethylbutylkarboxylová, 3,3-dimethylbutylkarboxylová, 1-ethylbutylkarboxylová, 2-ethylbutylkarboxylová, 1,1,2-trimethylpropylkarboxylová, 1,2,2-trimethylpropylkarboxylová, 1-ethyl-1-methylpropylkarboxylová a 1-ethyl-1-methylpropylkarboxylová skupina, s výhodou skupina methylkarboxylová, ethylkarboxylová a 1,1-dimethylkarboxylová a především skupina methylkarboxylová a 1,1-dimethylethylkarboxylová;

alkylkarbonylaminoskupina 1 až 6 atomů uhlíku v alkylovém podílu jako methylkarbonylaminoskupina, ethylkarbonylaminoskupina, propylkarbonylaminoskupina, 1-methylethylkarbonylaminoskupina, butylkarbonylaminoskupina, 1-methylpropylkarbonylaminoskupina, 2-

methylpropylkarbonylamínoskupina, 1,1-di-methylethylkarbonylamínoskupina, pentylkarbonylamínoskupina, 1-methylbutylkarbonylamínoskupina, 2-methylbutylkarbonylamínoskupina, 3-methylbutylkarbonylamínoskupina, 1,2-di-methylpropylkarbonylamínoskupina, 2,2-di-methylpropylkarbonylamínoskupina, 1-ethylpropylkarbonylamínoskupina, hexylkarbonylamínoskupina, 1-methylpentylkarbonylamínoskupina, 2-methylpentylkarbonylamínoskupina, 3-methylpentylkarbonylamínoskupina, 4-methylpentylkarbonylamínoskupina, 1,1-dimethylbutylkarbonylamínoskupina, 1,2-dimethylbutylkarbonylamínoskupina, 1,3-dimethylbutylkarbonylamínoskupina, 2,2-dimethylbutylkarbonylamínoskupina, 2,3-dimethylbutylkarbonylamínoskupina, 3,3-dimethylbutylkarbonylamínoskupina, 1-ethylbutylkarbonylamínoskupina, 2-ethylbutylkarbonylamínoskupina, 1,1,2-trimethylpropylkarbonylamínoskupina, 1,2,2-trimethylpropylkarbonylamínoskupina, 1-ethyl-1-methyl-propylkarbonylamínoskupina a 1-ethyl-1-methylpropylkarbonylamínoskupina skupina, s výhodou methylkarbonylamínoskupina, ethylkarbonylamínoskupina a především ethylkarbonylamínoskupina; cykloalkylová skupina se 3 až 7 atomy uhlíku jako skupina cyklopropylová, cyklobutylová, cyklopentylová, cyklohexylová, cykloheptylová, s výhodou skupina cyklopropylová, cyklopentylová a cyklohexylová a především skupina cyklopropylová;

cykloalkoxyskupina se 3 až 7 atomy uhlíku jako cyklopropyloxyskupina, cyklobutyloxyskupina, cyklopentyloxyskupina, cyklohexyloxyskupina, cykloheptyloxyskupina, s výhodou cyklopentyloxyskupina a cyklohexyloxyskupina a především cyklohexyloxyskupina;

cykloalkoxyskupina se 3 až 7 atomy uhlíku jako cyklopropyloxyskupina, cyklobutyloxyskupina, cyklopentyloxyskupina, cyklohexyloxyskupina, cykloheptyloxyskupina, s výhodou cyklopentyloxyskupina a cyklohexyloxyskupina a především cyklohexyloxyskupina;

cykloalkylthioskupina se 3 až 7 atomy uhlíku jako cyklopropylthiokupina, cyklobutylthioskupina, cyklopentylthioskupina, cyklo-

hexylthioskupina, cykloheptylthioskupina s výhodou cykloheptylthioskupina;

cykloalkylaminoskupina se 3 až 7 atomy uhlíku jako cyklopropylaminoskupina, cyklobutylaminoskupina, cyklopentylaminoskupina, cyklohexylaminoskupina, cykloheptylaminoskupina, s výhodou cyklopropylaminoskupina a cyklohexylaminoskupina, zvláště cyklopropylaminoskupina.

Aromatické a heteroaromatické systémy s jedním nebo se dvěma kruhy mohou kromě shora uvedených substituentů mít také skupiny obecného vzorce $-CR' = NOR''$, kde znamená

R' atom vodíku, kyanoskupinu, alkylovou skupinu (zvláště alkylovou skupinu s 1 až 6 atomy uhlíku, především s 1 až 4 atomy uhlíku), halogenalkylovou skupinu (zvláště halogenalkylovou skupinu s 1 až 6 atomy uhlíku, především s 1 až 4 atomy uhlíku), alkenylovou skupinu (zvláště alkenylovou skupinu s 2 až 6 atomy uhlíku, především s 2 až 4 atomy uhlíku), halogenalkenylovou skupinu (zvláště halogenalkenylovou skupinu s 2 až 6 atomy uhlíku, především s 2 až 4 atomy uhlíku), alkinylovou skupinu (zvláště alkinylovou skupinu s 2 až 6 atomy uhlíku, především s 2 až 4 atomy uhlíku), halogenalkinylovou skupinu (zvláště halogenalkinylovou skupinu s 2 až 6 atomy uhlíku, především s 2 až 4 atomy uhlíku) a cykloalkylovou skupinu (zvláště cykloalkylovou skupinu s 3 až 8 atomy uhlíku, především s 3 až 6 atomy uhlíku),

R'' alkylovou skupinu (zvláště alkylovou skupinu s 1 až 6 atomy uhlíku, především s 1 až 4 atomy uhlíku), halogenalkylovou skupinu (zvláště halogenalkylovou skupinu s 1 až 6 atomy uhlíku, především s 1 až 4 atomy uhlíku), alkenylovou skupinu (zvláště alkenylovou skupinu s 2 až 6 atomy uhlíku, především s 2 až 4 atomy uhlíku), halogenalkenylovou skupinu (zvláště halogenalkenylovou skupinu s 2 až 6 atomy uhlíku, především

s 2 až 4 atomy uhlíku), alkinylovou skupinu (zvláště alkinylovou skupinu s 2 až 6 atomy uhlíku, především s 2 až 4 atomy uhlíku), halogenalkinylovou skupinu (zvláště halogenalkinylovou skupinu s 2 až 6 atomy uhlíku, především s 2 až 4 atomy uhlíku), a cykloalkylovou skupinu (zvláště cykloalkylovou skupinu s 3 až 8 atomy uhlíku, především s 3 až 6 atomy uhlíku).

Se zřetelem na biologické působení jsou výhodné sloučeniny obecného vzorce I, ve kterých znamená — — — dvojnou vazbu.

V této souvislosti jsou výhodnými sloučeniny obecného vzorce I, ve kterých znamená — — — jednoduchou vazbu.

Rovněž jsou výhodnými sloučeniny obecného vzorce I, ve kterých znamená n nulu nebo 1 a zvláště nulu.

Rovněž jsou výhodnými sloučeniny obecného vzorce I, ve kterých znamená R^1 atom halogenu, 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 halogenalkoxyskupinu s 1 až 2 atomy uhlíku.

Kromě toho jsou výhodnými sloučeniny obecného vzorce I, ve kterých znamená m nulu nebo 1.

Rovněž jsou výhodnými sloučeniny obecného vzorce I, ve kterých znamená R^2 nitroskupinu, atom halogenu, alkylovou skupinu s 1 až 4 atomy uhlíku, halogenalkylovou skupinu s 1 až 4 atomy uhlíku, alkoxyskupinu s 1 až 4 atomy uhlíku nebo alkoxykarbonylovou skupinu s 1 až 4 atomy uhlíku v alkoxy podílu.

Kromě toho jsou výhodnými sloučeniny obecného vzorce I, ve kterých znamená R^3 alkylovou skupinu s 1 až 4 atomy uhlíku nebo cykloalkylovou skupinu s 3 až 6 atomy uhlíku.

Kromě toho jsou výhodnými sloučeniny obecného vzorce I, ve kterých znamená R^3 popřípadě substituovanou aromatickou skupinu s jedním nebo se dvěma kruhy, která vedle atomů uhlíku může obsahovat až čtyři atomy dusíku nebo jeden nebo dva atomy dusíku a jeden atom kyslíku nebo síry nebo atom kyslíku nebo atom síry jakožto člen kruhu.

Obzvláště jsou výhodnými sloučeniny obecného vzorce I, ve kterých znamená R^3 fenylovou nebo benzylovou skupinu, přičemž fenylová skupina může být částečně nebo plně halogenována a/nebo může mít jako substituent

- jednu až tři skupiny ze souboru zahrnujícího kyanoskupinu, nitroskupinu alkylovou skupinu s 1 až 6 atomy uhlíku, halogenalkylovou skupinu s 1 až 4 atomy uhlíku, alkoxy skupinu s 1 až 4 atomy uhlíku, halogenalkoxy skupinu s 1 až 4 atomy uhlíku, alkoxyalkylovou skupinu s 1 až 4 atomy uhlíku v alkoxy podílu i v alkylovém podílu, cykloalkylovou skupinu s 3 až 6 atomy uhlíku, alkylkarbonylovou skupinu s 1 až 4 atomy uhlíku v alkylovém podílu, alkoxykarbonylovou skupinu s 1 až 4 atomy uhlíku v alkylovém podílu, fenylovou skupinu, fenoxyskupinu a fenylalkoxy skupinu s 1 až 4 atomy uhlíku v alkoxy podílu, přičemž samotná fenylová skupina je popřípadě částečně nebo plně halogenována a/nebo má popřípadě jeden až tři substituenty ze souboru zahrnujícího kyanoskupinu, nitroskupinu, alkylovou skupinu s 1 až 6 atomy uhlíku, halogenalkylovou skupinu s 1 až 2 atomy uhlíku, alkoxy skupinu s 1 až 4 atomy uhlíku, halogenalkoxy skupinu s 1 až 2 atomy uhlíku, cykloalkylovou skupinu s 3 až 6 atomy uhlíku, alkylkarbonylovou skupinu s 1 až 4 atomy uhlíku v alkylovém podílu a alkoxykarbonylovou skupinu s 1 až 4 atomy uhlíku v alkylovém podílu a/nebo
- skupinu $CR' = NOR''$, kde znamená R'' alkylovou skupinu s 1 až 6 atomy uhlíku a/nebo
- oxyalkoxymůstek s 1 až 3 atomy uhlíku v alkoxy podílu nebo halogenoxyalkoxymůstek s 1 až 3 atomy uhlíku v alkoxy podílu vytvořený dvěma sousedními atomy fenylového kruhu.

Kromě toho jsou obzvláště výhodnými sloučeniny obecného vzorce I, ve kterých znamená R^3 skupinu pyridylovou nebo pyrimidylovou skupinu, přičemž je popřípadě pyridylová skupina částečně nebo plně halogenována a/nebo má popřípadě jeden až tři substituenty ze souboru zahrnujícího kyanoskupinu, nitroskupinu, alky-

lovou skupinu s 1 až 6 atomy uhlíku, halogenalkylovou skupinu s 1 až 2 atomy uhlíku, alkoxy skupinu s 1 až 4 atomy uhlíku, halogenalkoxy skupinu s 1 až 2 atomy uhlíku, cykloalkylovou skupinu s 3 až 6 atomy uhlíku, alkylkarbonylovou skupinu s 1 až 4 atomy uhlíku v alkylovém podílu a alkoxykarbonylovou skupinu s 1 až 4 atomy uhlíku v alkylovém podílu.

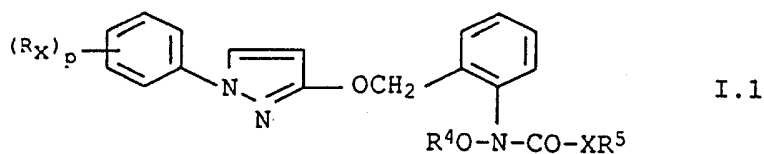
Kromě toho jsou obzvláště výhodnými sloučeniny obecného vzorce I, ve kterých znamená R^4 atom vodíku, alkylovou skupinu s 1 až 4 atomy uhlíku nebo halogenylkylovou skupinu s 1 až 2 atomy uhlíku.

Kromě toho jsou obzvláště výhodnými sloučeniny obecného vzorce I, ve kterých znamená R^5X skupinu methylovou, ethylovou, methoxyskupinu nebo methylaminoskupinu.

Příklady zvláště výhodných sloučenin obecného vzorce I jsou uvedeny v následujících tabulkách, kde se v prvním sloupci vždy uvádí číslo sloučeniny.

Tabulka I

Sloučeniny obecného vzorce I.1, kde znamená R^4 methylovou skupinu, R^5X methylovou skupinu a R^x_p odpovídá jedné řádce tabulky A.

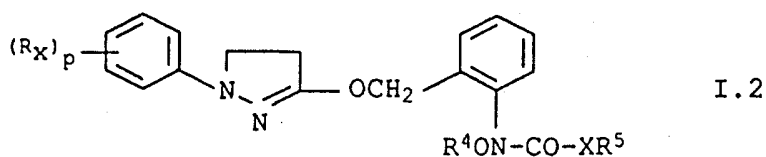


Tabulka II

Sloučeniny obecného vzorce I.1, kde znamená R^4 methylovou skupinu, R^5X ethylovou skupinu a R^x_p odpovídá jedné řádce tabulky A.

Tabulka III

Sloučeniny obecného vzorce I.2, kde znamená R^4 methylovou skupinu, R^5X ethylovou skupinu a R^x_p odpovídá jedné řádce tabulky A.



Tabulka IV

Sloučeniny obecného vzorce I.2, kde znamená R^4 methylovou skupinu, R^5X ethylovou skupinu a R^X_p odpovídá jedné řádce tabulky A.

Tabulka V

Sloučeniny obecného vzorce I.1, kde znamená R^4 methylovou skupinu, R^5X methoxyskupinu a R^X_p odpovídá jedné řádce tabulky A.

Tabulka VI

Sloučeniny obecného vzorce I.2, kde znamená R^4 methylovou skupinu, R^5X methoxyskupinu a R^X_p odpovídá jedné řádce tabulky A.

Tabulka VII

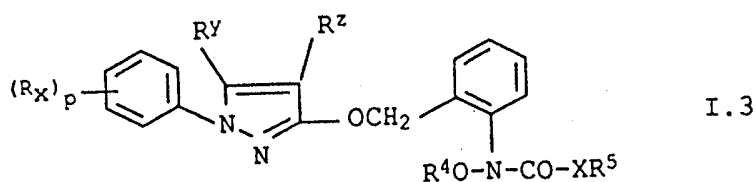
Sloučeniny obecného vzorce I.1, kde znamená R^4 methylovou skupinu, R^5X methylaminoskupinu a R^X_p odpovídá jedné řádce tabulky A.

Tabulka VIII

Sloučeniny obecného vzorce I.2, kde znamená R^4 methylovou skupinu, R^5X methylaminoskupinu a R^X_p odpovídá jedné řádce tabulky A.

Tabulka IX

Sloučeniny obecného vzorce I.3, kde znamená R^4 methylovou skupinu, R^5X methylovou skupinu, R^V atom vodíku, R^Z atom chloru a R^X_p odpovídá jedné řádce tabulky A.



Tabulka X

Sloučeniny obecného vzorce I.3, kde znamená R^4 methylovou skupinu, R^5X ethylovou skupinu, R^Y atom vodíku, R^Z atom chloru a R^X_p odpovídá jedné řádce tabulky A.

Tabulka XI

Sloučeniny obecného vzorce I.3, kde znamená R^4 methylovou skupinu, R^5X methoxyskupinu, R^Y atom vodíku, R^Z atom chloru a R^X_p odpovídá jedné řádce tabulky A.

Tabulka XII

Sloučeniny obecného vzorce I.3, kde znamená R^4 methylovou skupinu, R^5X methylaminoskupinu, R^Y atom vodíku, R^Z atom chloru a R^X_p odpovídá jedné řádce tabulky A.

Tabulka XIII

Sloučeniny obecného vzorce I.3, kde znamená R^4 methylovou skupinu, R^5X methylovou skupinu, R^Y methylovou skupinu, R^Z atom vodíku a R^X_p odpovídá jedné řádce tabulky A.

Tabulka XIV

Sloučeniny obecného vzorce I.3, kde znamená R^4 methylovou skupinu, R^5X ethylovou skupinu, R^Y methylovou skupinu, R^Z atom vodíku a R^X_p odpovídá jedné řádce tabulky A.

Tabulka XV

Sloučeniny obecného vzorce I.3, kde znamená R^4 methylovou skupinu, R^5X methoxyskupinu, R^V methylovou skupinu, R^Z atom vodíku a R^{X_p} odpovídá jedné řádce tabulky A.

Tabulka XVI

Sloučeniny obecného vzorce I.3, kde znamená R^4 methylovou skupinu, R^5X methylaminoskupinu, R^V methylovou skupinu, R^Z atom vodíku a R^{X_p} odpovídá jedné řádce tabulky A.

Tabulka XVII

Sloučeniny obecného vzorce I.3, kde znamená R^4 methylovou skupinu, R^5X methylovou skupinu, R^V trifluormethylovou skupinu, R^Z atom vodíku a R^{X_p} odpovídá jedné řádce tabulky A.

Tabulka XVIII

Sloučeniny obecného vzorce I.3, kde znamená R^4 methylovou skupinu, R^5X ethylovou skupinu, R^V trifluormethylovou skupinu, R^Z atom vodíku a R^{X_p} odpovídá jedné řádce tabulky A.

Tabulka XIX

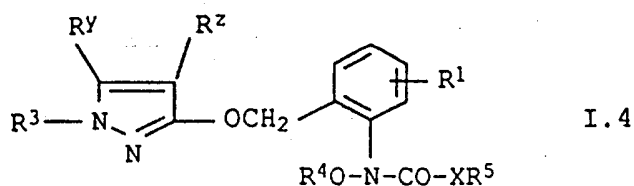
Sloučeniny obecného vzorce I.3, kde znamená R^4 methylovou skupinu, R^5X methoxyskupinu, R^V trifluormethylovou skupinu, R^Z atom vodíku a R^{X_p} odpovídá jedné řádce tabulky A.

Tabulka XX

Sloučeniny obecného vzorce I.3, kde znamená R^4 methylovou skupinu, R^5X methylaminoskupinu, R^V trifluormethylovou skupinu, R^Z atom vodíku a R^{X_p} odpovídá jedné řádce tabulky A.

Tabulka XXI

Sloučeniny obecného vzorce I.4, kde znamená R^5X methylovou skupinu a kombinace symbolů R^1 , R^y , R^z , R^3 a R^4 odpovídá jedné řádce tabulky B.



Tabulka XXII

Sloučeniny obecného vzorce I.4, kde znamená R^5X ethylovou skupinu a kombinace symbolů R^1 , R^y , R^z , R^3 a R^4 odpovídá jedné řádce tabulky B.

Tabulka XXIII

Sloučeniny obecného vzorce I.4, kde znamená R^5X methoxyskupinu a kombinace symbolů R^1 , R^y , R^z , R^3 a R^4 odpovídá jedné řádce tabulky B.

Tabulka XXIV

Sloučeniny obecného vzorce I.4, kde znamená R^5X methylaminoskupinu a kombinace symbolů R^1 , R^y , R^z , R^3 a R^4 odpovídá jedné řádce tabulky B.

Tabulka XXV

Sloučeniny obecného vzorce I.1, kde znamená R^4 atom vodíku, R^5X methylovou skupinu a R^x_p odpovídá jedné řádce tabulky A.

Tabulka XXVI

Sloučeniny obecného vzorce I.1, kde znamená R^4 atom vodíku, R^5X ethylovou skupinu a R^x_p odpovídá jedné řádce tabulky A.

Tabulka XXVII

Sloučeniny obecného vzorce I.2, kde znamená R^4 atom vodíku, R^5X methylovou skupinu a R^x_p odpovídá jedné řádce tabulky A.

Tabulka XXVIII

Sloučeniny obecného vzorce I.2, kde znamená R^4 atom vodíku, R^5X ethylovou skupinu a R^x_p odpovídá jedné řádce tabulky A.

Tabulka XXIX

Sloučeniny obecného vzorce I.1, kde znamená R^4 atom vodíku, R^5X methoxyskupinu a R^x_p odpovídá jedné řádce tabulky A.

Tabulka XXX

Sloučeniny obecného vzorce I.2, kde znamená R^4 atom vodíku, R^5X methoxyskupinu a R^x_p odpovídá jedné řádce tabulky A.

Tabulka XXXI

Sloučeniny obecného vzorce I.1, kde znamená R^4 atom vodíku, R^5X methylaminoskupinu a R^x_p odpovídá jedné řádce tabulky A.

Tabulka XXXII

Sloučeniny obecného vzorce I.2, kde znamená R^4 atom vodíku, R^5X methylaminoskupinu a R^x_p odpovídá jedné řádce tabulky A.

Tabulka XXXIII

Sloučeniny obecného vzorce I.3, kde znamená R^4 atom vodíku, R^5X methylovou skupinu, R^Y atom vodíku, R^Z atom chloru a $R^{\times p}$ odpovídá jedné řádce tabulky A.

Tabulka XXXIV

Sloučeniny obecného vzorce I.3, kde znamená R^4 atom vodíku, R^5X ethylovou skupinu, R^Y atom vodíku, R^Z atom chloru a $R^{\times p}$ odpovídá jedné řádce tabulky A.

Tabulka XXXV

Sloučeniny obecného vzorce I.3, kde znamená R^4 atom vodíku, R^5X methoxyskupinu, R^Y atom vodíku, R^Z atom chloru a $R^{\times p}$ odpovídá jedné řádce tabulky A.

Tabulka XXXVI

Sloučeniny obecného vzorce I.3, kde znamená R^4 atom vodíku, R^5X methylaminoskupinu, R^Y atom vodíku, R^Z atom chloru a $R^{\times p}$ odpovídá jedné řádce tabulky A.

Tabulka XXXVII

Sloučeniny obecného vzorce I.3, kde znamená R^4 atom vodíku, R^5X methylovou skupinu, R^Y methylovou skupinu, R^Z atom vodíku a $R^{\times p}$ odpovídá jedné řádce tabulky A.

Tabulka XXXVIII

Sloučeniny obecného vzorce I.3, kde znamená R^4 atom vodíku, R^5X

ethylovou skupinu, R^y methylovou skupinu, R^z atom vodíku a R^{x_p} odpovídá jedné řádce tabulky A.

Tabulka XXXIX

Sloučeniny obecného vzorce I.3, kde znamená R⁴ atom vodíku, R^{5X} methoxyskupinu, R^y methylovou skupinu, R^z atom vodíku a R^{x_p} odpovídá jedné řádce tabulky A.

Tabulka XXXX

Sloučeniny obecného vzorce I.3, kde znamená R⁴ atom vodíku, R^{5X} methylaminoskupinu, R^y methylovou skupinu, R^z atom vodíku a R^{x_p} odpovídá jedné řádce tabulky A.

Tabulka XXXXI

Sloučeniny obecného vzorce I.3, kde znamená R⁴ atom vodíku, R^{5X} methylovou kupinu, R^y trifluormethylovou skupinu, R^z atom vodíku a R^{x_p} odpovídá jedné řádce tabulky A.

Tabulka XXXXII

Sloučeniny obecného vzorce I.3, kde znamená R⁴ atom vodíku, R^{5X} ethylovou skupinu, R^y trifluormethylovou skupinu, R^z atom vodíku a R^{x_p} odpovídá jedné řádce tabulky A.

Tabulka XXXXIII

Sloučeniny obecného vzorce I.3, kde znamená R⁴ atom vodíku, R^{5X} methoxyskupinu, R^y trifluormethylovou skupinu, R^z atom vodíku a R^{x_p} odpovídá jedné řádce tabulky A.

Tabulka XXXXIV

Sloučeniny obecného vzorce I.3, kde znamená R^4 atom vodíku, R^5X methylaminoskupinu, R^Y trifluormethylovou skupinu, R^Z atom vodíku a R^{X_p} odpovídá jedné řádce tabulky A.

Tabulka A

	R^{X_p}
1	H
2	2-F
3	3-F
4	4-F
5	2,4-F ₂
6	2,4,6-F ₃
7	2,3,4,5,6-F ₅
8	2,3-F ₂
9	2-Cl
10	3-Cl
11	4-Cl
12	2,3-Cl ₂
13	2,4-Cl ₂
14	2,5-Cl ₂
15	2,6-Cl ₂
16	3,4-Cl ₂
17	3,5-Cl ₂
18	2,3,4-Cl ₃
19	2,3,5-Cl ₃
11	2,3,6-Cl ₃
12	2,4,5-Cl ₃
13	2,4,6-Cl ₃
14	3,4,5-Cl ₃
15	2,3,4,6-Cl ₄
16	2,3,5,6-Cl ₄

	R ^x _p
17	2,3,4,5,6-Cl ₅
18	2-Br
19	3-Br
20	4-Br
21	2,4-Br ₂
22	2,5-Br ₂
23	2,6-Br ₂
24	2,4,6-Br ₃
25	2,3,4,5,6-Br ₅
26	2-J
27	3-J
28	4-J
29	2,4-J ₂
30	2-Cl, 3-F
31	2-Cl, 4-F
32	2-Cl, 5-F
33	2-Cl, 6-F
34	2-Cl, 3-Br
35	2-Cl, 4-Br
36	2-Cl, 5-Br
37	2-Cl, 6-Br
38	2-Br, 3-Cl
39	2-Br, 4-Cl
40	2-Br, 5-Cl
41	2-Br, 3-F
42	2-Br, 4-F
43	2-Br, 5-F
44	2-Br, 6-F
45	2-F, 3-Cl
46	2-F, 4-Cl
47	2-F, 5-Cl
48	3-Cl, 4-F
49	3-Cl, 5-F
50	3-Cl, 4-Br
51	3-Cl, 5-Br
52	3-F, 4-Cl
53	3-F, 4-Br
54	3-Br, 4-Cl
55	3-Br, 4-F

	R ^x _p
56	2,6-Cl ₂ , 4-Br
57	2-CH ₃
58	3-CH ₃
59	4-CH ₃
60	2,3-(CH ₃) ₂
61	2,4-(CH ₃) ₂
62	2,5-(CH ₃) ₂
63	2,6-(CH ₃) ₂
64	3,4-(CH ₃) ₂
65	3,5-(CH ₃) ₂
66	2,3,5-(CH ₃) ₃
67	2,3,4-(CH ₃) ₃
68	2,3,6-(CH ₃) ₃
69	2,4,5-(CH ₃) ₃
70	2,4,6-(CH ₃) ₃
71	3,4,5-(CH ₃) ₃
72	2,3,4,6-(CH ₃) ₄
73	2,3,5,6-(CH ₃) ₄
74	2,3,4,5,6-(CH ₃) ₅
75	2-C ₂ H ₅
76	3-C ₂ H ₅
77	4-C ₂ H ₅
78	2,4-(C ₂ H ₅) ₂
79	2,6-(C ₂ H ₅) ₂
80	3,5-(C ₂ H ₅) ₂
81	2,4,6-(C ₂ H ₅) ₃
82	2-n-C ₃ H ₇
83	3-n-C ₃ H ₇
84	4-n-C ₃ H ₇
85	2-i-C ₃ H ₇
86	3-i-C ₃ H ₇
87	4-i-C ₃ H ₇
88	2,4-(i-C ₃ H ₇) ₂
89	2,6-(i-C ₃ H ₇) ₂
90	3,5-(i-C ₃ H ₇) ₂
91	2-s-C ₄ H ₉
92	3-s-C ₄ H ₉
93	4-s-C ₄ H ₉
94	2-t-C ₄ H ₉

	R ^x _p
95	3-t-C ₄ H ₉
96	4-t-C ₄ H ₉
97	4-n-C ₉ H ₁₉
98	2-CH ₃ , 4-t-C ₄ H ₉
99	2-CH ₃ , 6-t-C ₄ H ₉
100	2-CH ₃ , 4-i-C ₃ H ₇
101	2-CH ₃ , 5-i-C ₃ H ₇
102	3-CH ₃ , 4-i-C ₃ H ₇
103	2-cyclo-C ₆ H ₁₁
104	3-cyclo-C ₆ H ₁₁
105	4-cyclo-C ₆ H ₁₁
106	2-Cl, 4-C ₆ H ₅
107	2-Br, 4-C ₆ H ₅
108	2-OCH ₃
109	3-OCH ₃
110	4-OCH ₃
111	2-OC ₂ H ₅
112	3-O-C ₂ H ₅
113	4-O-C ₂ H ₅
114	2-O-n-C ₃ H ₇
115	3-O-n-C ₃ H ₇
116	4-O-n-C ₃ H ₇
117	2-O-i-C ₃ H ₇
118	3-O-i-C ₃ H ₇
119	4-O-i-C ₃ H ₇
120	2-O-n-C ₆ H ₁₃
121	3-O-n-C ₆ H ₁₃
122	4-O-n-C ₆ H ₁₃
123	2-O-CH ₂ C ₆ H ₅
124	3-O-CH ₂ C ₆ H ₅
125	4-O-CH ₂ C ₆ H ₅
126	2-O-(CH ₂) ₃ C ₆ H ₅
127	4-O-(CH ₂) ₃ C ₆ H ₅
128	2,3-(OCH ₃) ₂
129	2,4-(OCH ₃) ₂
130	2,5-(OCH ₃) ₂
131	2,6-(OCH ₃) ₂
132	3,4-(OCH ₃) ₂
133	3,5-(OCH ₃) ₂

	R ^x _p
134	2-O-t-C ₄ H ₉
135	3-O-t-C ₄ H ₉
136	4-O-t-C ₄ H ₉
137	3-(3'-Cl-C ₆ H ₄)
138	4-(4'-CH ₃ -C ₆ H ₄)
139	2-O-C ₆ H ₅
140	3-O-C ₆ H ₅
141	4-O-C ₆ H ₅
142	2-O-(2'-F-C ₆ H ₄)
143	3-O-(3'-Cl-C ₆ H ₄)
144	4-O-(4'-CH ₃ -C ₆ H ₄)
145	2,3,6-(CH ₃) ₃ , 4-F
146	2,3,6-(CH ₃) ₃ , 4-Cl
147	2,3,6-(CH ₃) ₃ , 4-Br
148	2,4-(CH ₃) ₂ , 6-F
149	2,4-(CH ₃) ₂ , 6-Cl
150	2,4-(CH ₃) ₂ , 6-Br
151	2-i-C ₃ H ₇ , 4-Cl, 5-CH ₃
152	2-Cl, 4-NO ₂
153	2-NO ₂ , 4-Cl
154	2-OCH ₃ , 5-NO ₂
155	2,4-Cl ₂ , 5-NO ₂
156	2,4-Cl ₂ , 6-NO ₂
157	2,6-Cl ₂ , 4-NO ₂
158	2,6-Br ₂ , 4-NO ₂
159	2,6-J ₂ , 4-NO ₂
160	2-CH ₃ , 5-i-C ₃ H ₇ , 4-Cl
161	2-CO ₂ CH ₃
162	3-CO ₂ CH ₃
163	4-CO ₂ CH ₃
164	2-CH ₂ -OCH ₃
165	3-CH ₂ -OCH ₃
166	4-CH ₂ -OCH ₃
167	2-Me-4-CH ₃ -CH(CH ₃)-CO
168	2-CH ₃ -4-(CH ₃ -C=NOCH ₃)
169	2-CH ₃ -4-(CH ₃ -C=NOC ₂ H ₅)
170	2-CH ₃ -4-(CH ₃ -C=NO-n-C ₃ H ₇)
171	2-CH ₃ -4-(CH ₃ -C=NO-i-C ₃ H ₇)
172	2,5-(CH ₃) ₂ -4-(CH ₃ -C=NOCH ₃)

	R ^x _p
173	2,5-(CH ₃) ₂ -4-(CH ₃ -C=NOC ₂ H ₅)
174	2,5-(CH ₃ -4-(CH ₃ -C=NO-n-C ₃ H ₇))
175	2,5-(CH ₃) ₂ -4-(CH ₃ -C=NO-i-C ₃ H ₇)
176	2-C ₆ H ₅
177	3-C ₆ H ₅
178	4-C ₆ H ₅
179	2-(2'-F-C ₆ H ₄)
180	2-CH ₃ , 5-Br
181	2-CH ₃ , 6-Br
182	2-Cl, 3-CH ₃
183	2-Cl, 4-CH ₃
184	2-Cl, 5-CH ₃
185	2-F, 3-CH ₃
186	2-F, 4-CH ₃
187	2-F, 5-CH ₃
188	2-Br, 3-CH ₃
189	2-Br, 4-CH ₃
190	2-Br, 5-CH ₃
191	3-CH ₃ , 4-Cl
192	3-CH ₃ , 5-Cl
193	3-CH ₃ , 4-F
194	3-CH ₃ , 5-F
195	3-CH ₃ , 4-Br
196	3-CH ₃ , 5-Br
197	3-F, 4-CH ₃
198	3-Cl, 4-CH ₃
199	3-Br, 4-CH ₃
200	2-Cl, 4,5-(CH ₃) ₂
201	2-Br, 4,5-(CH ₃) ₂
292	2-Cl, 3,5-(CH ₃) ₂
203	2-Br, 3,5-(CH ₃) ₂
204	2,6-Cl ₂ , 4-CH ₃
205	2,6-F ₂ , 4-CH ₃
206	2,6-Br ₂ , 4-CH ₃
207	2,4-Br ₂ , 6-CH ₃
208	2,4-F ₂ , 6-CH ₃
209	2,4-Br ₂ , 6-CH ₃
210	2,6-(CH ₃) ₂ , 4-F
211	2,6-(CH ₃) ₂ , 4-Cl

22.12.97

-404-

	R ^x _p
212	2,6-(CH ₃) ₂ , 4-Br
213	3,5-(CH ₃) ₂ , 4-F
214	3,5-(CH ₃) ₂ , 4-Cl
215	3,5-(CH ₃) ₂ , 4-Br
216	2-CF ₃
217	3-CF ₃
218	4-CF ₃
219	2-OCF ₃
220	3-OCF ₃
221	4-OCF ₃
222	3-OCH ₂ CHF ₂
223	2-NO ₂
224	3-NO ₂
225	4-NO ₂
226	2-CN
227	3-CN
228	4-CN
229	2-CH ₃ , 3-Cl
230	2-CH ₃ , 4-Cl
231	2-CH ₃ , 5-Cl
232	2-CH ₃ , 6-Cl
233	2-CH ₃ , 3-F
234	2-CH ₃ , 4-F
235	2-CH ₃ , 5-F
236	2-CH ₃ , 6-F
237	2-CH ₃ , 3-Br
238	2-CH ₃ , 4-Br
239	2-Pyridyl-2'
240	3-Pyridyl-3'
241	4-Pyridyl-4'

Tabulka B

	R ¹	R ^Y	R ^Z	R ³	R ⁴
334	H	H	H	Cyklohexyl	CH ₃
335	H	H	H	Benzyl	CH ₃
336	H	H	H	2-Pyridyl	CH ₃
337	H	H	H	5-Cl-pyri- dyl-2	CH ₃
338	H	H	H	5-CF ₃ -pyridyl -2	CH ₃
339	H	H	H	2-Pyrazinyl	CH ₃
340	H	H	Cl	Cyklohexyl	CH ₃
341	H	H	Cl	Benzyl	CH ₃
342	H	H	Cl	2-Pyridyl	CH ₃
343	H	H	Cl	5-Cl-pyri- dyl-2	CH ₃
344	H	H	Cl	5-CF ₃ -pyridyl -2	CH ₃
345	H	H	Cl	2-Pyrazinyl	CH ₃
346	H	CH ₃	H	Cyklohexyl	CH ₃
347	H	CH ₃	H	Benzyl	CH ₃
348	H	CH ₃	H	2-Pyridyl	CH ₃
349	H	CH ₃	H	5-Cl-pyri- dyl-2	CH ₃
350	H	CH ₃	H	5-CF ₃ -pyridyl -2	CH ₃
351	H	CH ₃	H	2-Pyrazinyl	CH ₃
352	H	H	H	Cyklohexyl	C ₂ H ₅
353	H	H	H	Benzyl	C ₂ H ₅
354	H	H	H	F.enyl	C ₂ H ₅
355	H	H	H	2-Pyridyl	C ₂ H ₅
356	H	H	H	5-Cl-pyri- dyl-2	C ₂ H ₅
357	H	H	H	5-CF ₃ -pyridyl -2	C ₂ H ₅
358	H	H	H	2-Pyrazinyl	C ₂ H ₅
359	H	H	Cl	Cyklohexyl	C ₂ H ₅
360	H	H	Cl	Benzyl	C ₂ H ₅
361	H	H	Cl	F.enyl	C ₂ H ₅
362	H	H	Cl	2-Pyridyl	C ₂ H ₅
363	H	H	Cl	5-Cl-pyri- dyl-2	C ₂ H ₅

	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	
364	H	H	Cl	5-CF ₃ -pyridyl-2	C ₂ H ₅
365	H	H	Cl	2-Pyrazinyl	C ₂ H ₅
366	H	CH ₃	H	Cyklohexyl	C ₂ H ₅
367	H	CH ₃	H	Benzyl	C ₂ H ₅
368	H	CH ₃	H	Fenyl	C ₂ H ₅
369	H	CH ₃	H	2-Pyridyl	C ₂ H ₅
370	H	CH ₃	H	5-Cl-pyridyl-2	C ₂ H ₅
371	H	CH ₃	H	5-CF ₃ -pyridyl-2	C ₂ H ₅
372	H	CH ₃	H	2-Pyrazinyl	C ₂ H ₅
373	H	H	H	Cyklohexyl	CH ₂ OCH ₃
374	H	H	H	Benzyl	CH ₂ OCH ₃
375	H	H	H	Fenyl	CH ₂ OCH ₃
376	H	H	H	2-Pyridyl	CH ₂ OCH ₃
377	H	H	H	5-Cl-pyridyl-2	CH ₂ OCH ₃
378	H	H	H	5-CF ₃ -pyridyl-2	CH ₂ OCH ₃
379	H	H	H	2-Pyrazinyl	CH ₂ OCH ₃
380	H	H	Cl	Cyklohexyl	CH ₂ OCH ₃
381	H	H	Cl	Benzyl	CH ₂ OCH ₃
382	H	H	Cl	Fenyl	CH ₂ OCH ₃
383	H	H	Cl	2-Pyridyl	CH ₂ OCH ₃
384	H	H	Cl	5-Cl-pyridyl-2	CH ₂ OCH ₃
385	H	H	Cl	5-CF ₃ -pyridyl-2	CH ₂ OCH ₃
386	H	H	Cl	2-Pyrazinyl	CH ₂ OCH ₃
387	H	CH ₃	H	Cyklohexyl	CH ₂ OCH ₃
388	H	CH ₃	H	Benzyl	CH ₂ OCH ₃
389	H	CH ₃	H	Fenyl	CH ₂ OCH ₃
390	H	CH ₃	H	2-Pyridyl	CH ₂ OCH ₃
391	H	CH ₃	H	5-Cl-pyridyl-2	CH ₂ OCH ₃
392	H	CH ₃	H	5-CF ₃ -pyridyl-2	CH ₂ OCH ₃
393	H	CH ₃	H	2-Pyrazinyl	CH ₂ OCH ₃
394	H	H	H	Cyklohexyl	CH ₂ C≡CH
395	H	H	H	Benzyl	CH ₂ C≡CH
396	H	H	H	Fenyl	CH ₂ C≡CH

	R ¹	R ^Y	R ^Z	R ³	R ⁴
397	H	H	H	2-Pyridyl	CH ₂ C≡CH
398	H	H	H	5-Cl-pyridyl-2	CH ₂ C≡CH
399	H	H	H	5-CF ₃ -pyridyl-2	CH ₂ C≡CH
400	H	H	H	2-Pyrazinyl	CH ₂ C≡CH
401	H	H	Cl	Cyklohexyl	CH ₂ C≡CH
402	H	H	Cl	Benzyl	CH ₂ C≡CH
403	H	H	Cl	Fenyl	CH ₂ C≡CH
404	H	H	Cl	2-Pyridyl	CH ₂ C≡CH
405	H	H	Cl	5-Cl-pyridyl-2	CH ₂ C≡CH
406	H	H	Cl	5-CF ₃ -pyridyl-2	CH ₂ C≡CH
407	H	H	Cl	2-Pyrazinyl	CH ₂ C≡CH
408	H	CH ₃	H	Cyklohexyl	CH ₂ C≡CH
409	H	CH ₃	H	Benzyl	CH ₂ C≡CH
410	H	CH ₃	H	Fenyl	CH ₂ C≡CH
411	H	CH ₃	H	2-Pyridyl	CH ₂ C≡CH
412	H	CH ₃	H	5-Cl-pyridyl-2	CH ₂ C≡CH
413	H	CH ₃	H	5-CF ₃ -pyridyl-2	CH ₂ C≡CH
414	H	CH ₃	H	2-Pyrazinyl	CH ₂ C≡CH
415	3-F	H	H	Cyklohexyl	CH ₃
416	3-F	H	H	Benzyl	CH ₃
417	3-F	H	H	Fenyl	CH ₃
418	3-F	H	H	2-Pyridyl	CH ₃
419	3-F	H	H	5-Cl-pyridyl-2	CH ₃
420	3-F	H	H	5-CF ₃ -pyridyl-2	CH ₃
421	3-F	H	H	2-Pyrazinyl	CH ₃
422	3-F	H	Cl	Cyklohexyl	CH ₃
423	3-F	H	Cl	Benzyl	CH ₃
424	3-F	H	Cl	Fenyl	CH ₃
425	3-F	H	Cl	2-Pyridyl	CH ₃
426	3-F	H	Cl	5-Cl-pyridyl-2	CH ₃
427	3-F	H	Cl	5-CF ₃ -pyridyl-2	CH ₃
428	3-F	H	Cl	2-Pyrazinyl	CH ₃

- 41 d-

	R ¹	R ^Y	R ^Z	R ³	R ⁴
429	3-F	CH ₃	H	Cy lohexyl	CH ₃
430	3-F	CH ₃	H	Benzyl	CH ₃
431	3-F	CH ₃	H	. enyl	CH ₃
432	3-F	CH ₃	H	2-Pyridyl	CH ₃
433	3-F	CH ₃	H	5-Cl-pyri- dyl-2	CH ₃
434	3-F	CH ₃	H	5-CF ₃ -pyridyl -2	CH ₃
435	3-F	CH ₃	H	2-Pyrazinyl	CH ₃
436	3-F	H	H	Cyklohexyl	C ₂ H ₅
437	3-F	H	H	Benzyl	C ₂ H ₅
438	3-F	H	H	. enyl	C ₂ H ₅
439	3-F	H	H	2-Pyridyl	C ₂ H ₅
440	3-F	H	H	5-Cl-pyri- dyl-2	C ₂ H ₅
441	3-F	H	H	5-CF ₃ -pyridyl -2	C ₂ H ₅
442	3-F	H	H	2-Pyrazinyl	C ₂ H ₅
443	3-F	H	Cl	Cyklohexyl	C ₂ H ₅
444	3-F	H	Cl	Benzyl	C ₂ H ₅
445	3-F	H	Cl	. enyl	C ₂ H ₅
446	3-F	H	Cl	2-Pyridyl	C ₂ H ₅
447	3-F	H	Cl	5-Cl-pyri- dyl-2	C ₂ H ₅
448	3-F	H	Cl	5-CF ₃ -pyridyl -2	C ₂ H ₅
449	3-F	H	Cl	2-Pyrazinyl	C ₂ H ₅
450	3-F	H	H	Cyklohexyl	CH ₂ OCH ₃
451	3-F	H	H	Benzyl	CH ₂ OCH ₃
452	3-F	H	H	. enyl	CH ₂ OCH ₃
453	3-F	H	H	2-Pyridyl	CH ₂ OCH ₃
454	3-F	H	H	5-Cl-pyri- dyl-2	CH ₂ OCH ₃
455	3-F	H	H	5-CF ₃ -pyridyl -2	CH ₂ OCH ₃
456	3-F	H	H	2-Pyrazinyl	CH ₂ OCH ₃
457	3-F	H	Cl	Cyklohexyl	CH ₂ OCH ₃
458	3-F	H	Cl	Benzyl	CH ₂ OCH ₃
459	3-F	H	Cl	. enyl	CH ₂ OCH ₃
460	3-F	H	Cl	2-Pyridyl	CH ₂ OCH ₃
461	3-F	H	Cl	5-Cl-pyri- dyl-2	CH ₂ OCH ₃

	R ¹	R ^Y	R ^Z	R ³	R ⁴
462	3-F	H	Cl	5-CF ₃ -pyridyl -2	CH ₂ OCH ₃
463	3-F	H	Cl	2-Pyrazinyl	CH ₂ OCH ₃
464	3-F	CH ₃	H	Cyklohexyl	CH ₂ OCH ₃
465	3-F	CH ₃	H	Benzyl	CH ₂ OCH ₃
466	3-F	CH ₃	H	Fenyl	CH ₂ OCH ₃
467	3-F	CH ₃	H	2-Pyridyl	CH ₂ OCH ₃
468	3-F	CH ₃	H	5-Cl-pyri- dyl-2	CH ₂ OCH ₃
469	3-F	CH ₃	H	5-CF ₃ -pyridyl -2	CH ₂ OCH ₃
470	3-F	CH ₃	H	2-Pyrazinyl	CH ₂ OCH ₃
471	3-F	H	H	Cyklohexyl	CH ₂ C≡CH
472	3-F	H	H	Benzyl	CH ₂ C≡CH
473	3-F	H	H	Fenyl	CH ₂ C≡CH
474	3-F	H	H	2-Pyridyl	CH ₂ C≡CH
475	3-F	H	H	5-Cl-pyri- dyl-2	CH ₂ C≡CH
476	3-F	H	H	5-CF ₃ -pyridyl -2	CH ₂ C≡CH
477	3-F	H	H	2-Pyrazinyl	CH ₂ C≡CH
478	3-F	H	Cl	Cyklohexyl	CH ₂ C≡CH
479	3-F	H	Cl	Benzyl	CH ₂ C≡CH
480	3-F	H	Cl	Fenyl	CH ₂ C≡CH
481	3-F	H	Cl	2-Pyridyl	CH ₂ C≡CH
482	3-F	H	Cl	5-Cl-pyri- dyl-2	CH ₂ C≡CH
483	3-F	H	Cl	5-CF ₃ -pyridyl -2	CH ₂ C≡CH
484	3-F	H	Cl	2-Pyrazinyl	CH ₂ C≡CH
485	3-F	CH ₃	H	Cyklohexyl	CH ₂ C≡CH
486	3-F	CH ₃	H	Benzyl	CH ₂ C≡CH
487	3-F	CH ₃	H	Fenyl	CH ₂ C≡CH
488	3-F	CH ₃	H	2-Pyridyl	CH ₂ C≡CH
489	3-F	CH ₃	H	5-Cl-pyri- dyl-2	CH ₂ C≡CH
490	3-F	CH ₃	H	5-CF ₃ -pyridyl -2	CH ₂ C≡CH
491	3-F	CH ₃	H	2-Pyrazinyl	CH ₂ C≡CH
492	6-Cl	H	H	Cyklohexyl	CH ₃
493	6-Cl	H	H	Benzyl	CH ₃
494	6-Cl	H	H	Fenyl	CH ₃

	R ¹	R ^Y	R ^Z	R ³	R ⁴
495	6-Cl	H	H	2-Pyridyl	CH ₃
496	6-Cl	H	H	5-Cl-pyri- dyl-2	CH ₃
497	6-Cl	H	H	5-CF ₃ -pyridyl -2	CH ₃
498	6-Cl	H	H	2-Pyrazinyl	CH ₃
499	6-Cl	H	Cl	Cyklohexyl	CH ₃
500	6-Cl	H	Cl	Benzyl	CH ₃
501	6-Cl	H	Cl	Fenyl	CH ₃
502	6-Cl	H	Cl	2-Pyridyl	CH ₃
503	6-Cl	H	Cl	5-Cl-pyri- dyl-2	CH ₃
504	6-Cl	H	Cl	5-CF ₃ -pyridyl -2	CH ₃
505	6-Cl	H	Cl	2-Pyrazinyl	CH ₃
506	6-Cl	CH ₃	H	Cyklohexyl	CH ₃
507	6-Cl	CH ₃	H	Benzyl	CH ₃
508	6-Cl	CH ₃	H	Fenyl	CH ₃
509	6-Cl	CH ₃	H	2-Pyridyl	CH ₃
510	6-Cl	CH ₃	H	5-Cl-pyri- dyl-2	CH ₃
511	6-Cl	CH ₃	H	5-CF ₃ -pyridyl -2	CH ₃
512	6-Cl	CH ₃	H	2-Pyrazinyl	CH ₃
513	6-Cl	H	H	Cyklohexyl	C ₂ H ₅
514	6-Cl	H	H	Benzyl	C ₂ H ₅
515	6-Cl	H	H	Fenyl	C ₂ H ₅
516	6-Cl	H	H	2-Pyridyl	C ₂ H ₅
517	6-Cl	H	H	5-Cl-pyri- dyl-2	C ₂ H ₅
518	6-Cl	H	H	5-CF ₃ -pyridyl -2	C ₂ H ₅
519	6-Cl	H	H	2-Pyrazinyl	C ₂ H ₅
520	6-Cl	H	Cl	Cyklohexyl	C ₂ H ₅
521	6-Cl	H	Cl	Benzyl	C ₂ H ₅
522	6-Cl	H	Cl	Fenyl	C ₂ H ₅
523	6-Cl	H	Cl	2-Pyridyl	C ₂ H ₅
524	6-Cl	H	Cl	5-Cl-pyri- dyl-2	C ₂ H ₅
525	6-Cl	H	Cl	5-CF ₃ -pyridyl -2	C ₂ H ₅
526	6-Cl	H	Cl	2-Pyrazinyl	C ₂ H ₅

	R ¹	R ^Y	R ^Z	R ³	R ⁴
527	6-Cl	CH ₃	H	Cyklohexyl	C ₂ H ₅
528	6-Cl	CH ₃	H	Benzyl	C ₂ H ₅
529	6-Cl	CH ₃	H	Fenyl	C ₂ H ₅
530	6-Cl	CH ₃	H	2-Pyridyl	C ₂ H ₅
531	6-Cl	CH ₃	H	5-Cl-pyridyl-2	C ₂ H ₅
532	6-Cl	CH ₃	H	5-CF ₃ -pyridyl-2	C ₂ H ₅
533	6-Cl	CH ₃	H	2-Pyrazinyl	C ₂ H ₅
534	6-Cl	H	H	Cyklohexyl	CH ₂ OCH ₃
535	6-Cl	H	H	Benzyl	CH ₂ OCH ₃
536	6-Cl	H	H	Fenyl	CH ₂ OCH ₃
537	6-Cl	H	H	2-Pyridyl	CH ₂ OCH ₃
538	6-Cl	H	H	5-Cl-pyridyl-2	CH ₂ OCH ₃
539	6-Cl	H	H	5-CF ₃ -pyridyl-2	CH ₂ OCH ₃
540	6-Cl	H	H	2-Pyrazinyl	CH ₂ OCH ₃
541	6-Cl	H	Cl	Cyklohexyl	CH ₂ OCH ₃
542	6-Cl	H	Cl	Benzyl	CH ₂ OCH ₃
543	6-Cl	H	Cl	Fenyl	CH ₂ OCH ₃
544	6-Cl	H	Cl	2-Pyridyl	CH ₂ OCH ₃
545	6-Cl	H	Cl	5-Cl-pyridyl-2	CH ₂ OCH ₃
546	6-Cl	H	Cl	5-CF ₃ -pyridyl-2	CH ₂ OCH ₃
547	6-Cl	H	Cl	2-Pyrazinyl	CH ₂ OCH ₃
548	6-Cl	CH ₃	H	Cyklohexyl	CH ₂ OCH ₃
549	6-Cl	CH ₃	H	Benzyl	CH ₂ OCH ₃
550	6-Cl	CH ₃	H	Fenyl	CH ₂ OCH ₃
551	6-Cl	CH ₃	H	2-Pyridyl	CH ₂ OCH ₃
552	6-Cl	CH ₃	H	5-Cl-pyridyl-2	CH ₂ OCH ₃
553	6-Cl	CH ₃	H	5-CF ₃ -pyridyl-2	CH ₂ OCH ₃
554	6-Cl	CH ₃	H	2-Pyrazinyl	CH ₂ OCH ₃
555	6-Cl	H	H	Cyklohexyl	CH ₂ C≡CH
556	6-Cl	H	H	Benzyl	CH ₂ C≡CH
557	6-Cl	H	H	Fenyl	CH ₂ C≡CH
558	6-Cl	H	H	2-Pyridyl	CH ₂ C≡CH
559	6-Cl	H	H	5-Cl-pyridyl-2	CH ₂ C≡CH

	R ¹	R ^Y	R ^Z	R ³	R ⁴
560	6-Cl	H	H	5-CF ₃ -pyridyl -2	CH ₂ C≡CH
561	6-Cl	H	H	2-Pyrazinyl	CH ₂ C≡CH
562	6-Cl	H	Cl	Cyklohexyl	CH ₂ C≡CH
563	6-Cl	H	Cl	Benzyl	CH ₂ C≡CH
564	6-Cl	H	Cl	F enyl	CH ₂ C≡CH
565	6-Cl	H	Cl	2-Pyridyl	CH ₂ C≡CH
566	6-Cl	H	Cl	5-Cl-pyri- dyl-2	CH ₂ C≡CH
567	6-Cl	H	Cl	5-CF ₃ -pyridyl -2	CH ₂ C≡CH
568	6-Cl	H	Cl	2-Pyrazinyl	CH ₂ C≡CH
569	6-Cl	CH ₃	H	Cyklohexyl	CH ₂ C≡CH
570	6-Cl	CH ₃	H	Benzyl	CH ₂ C≡CH
571	6-Cl	CH ₃	H	F enyl	CH ₂ C≡CH
572	6-Cl	CH ₃	H	2-Pyridyl	CH ₂ C≡CH
573	6-Cl	CH ₃	H	5-Cl-pyri- dyl-2	CH ₂ C≡CH
574	6-Cl	CH ₃	H	5-CF ₃ -pyridyl -2	CH ₂ C≡CH
575	6-Cl	CH ₃	H	2-Pyrazinyl	CH ₂ C≡CH
576	6-CH ₃	H	H	Cyklohexyl	CH ₃
577	6-CH ₃	H	H	Benzyl	CH ₃
578	6-CH ₃	H	H	F enyl	CH ₃
579	6-CH ₃	H	H	2-Pyridyl	CH ₃
580	6-CH ₃	H	H	5-Cl-pyri- dyl-2	CH ₃
581	6-CH ₃	H	H	5-CF ₃ -pyridyl -2	CH ₃
582	6-CH ₃	H	H	2-Pyrazinyl	CH ₃
583	6-CH ₃	H	Cl	Cyklohexyl	CH ₃
584	6-CH ₃	H	Cl	Benzyl	CH ₃
585	6-CH ₃	H	Cl	F enyl	CH ₃
586	6-CH ₃	H	Cl	2-Pyridyl	CH ₃
587	6-CH ₃	H	Cl	5-Cl-pyri- dyl-2	CH ₃
588	6-CH ₃	H	Cl	5-CF ₃ -pyridyl -2	CH ₃
589	6-CH ₃	H	Cl	2-Pyrazinyl	CH ₃
590	6-CH ₃	CH ₃	H	Cyklohexyl	CH ₃
591	6-CH ₃	CH ₃	H	Benzyl	CH ₃
592	6-CH ₃	CH ₃	H	F enyl	CH ₃

	R ¹	R ^y	R ^z	R ³	R ⁴
593	6-CH ₃	CH ₃	H	2-Pyridyl	CH ₃
594	6-CH ₃	CH ₃	H	5-Cl-pyridyl-2	CH ₃
595	6-CH ₃	CH ₃	H	5-CF ₃ -pyridyl-2	CH ₃
596	6-CH ₃	CH ₃	H	2-Pyrazinyl	CH ₃
597	6-CH ₃	H	H	Cyklohexyl	C ₂ H ₅
598	6-CH ₃	H	H	Benzyl	C ₂ H ₅
599	6-CH ₃	H	H	F enyl	C ₂ H ₅
600	6-CH ₃	H	H	2-Pyridyl	C ₂ H ₅
601	6-CH ₃	H	H	5-Cl-pyridyl-2	C ₂ H ₅
602	6-CH ₃	H	H	5-CF ₃ -pyridyl-2	C ₂ H ₅
603	6-CH ₃	H	H	2-Pyrazinyl	C ₂ H ₅
604	6-CH ₃	H	Cl	Cyklohexyl	C ₂ H ₅
605	6-CH ₃	H	Cl	Benzyl	C ₂ H ₅
606	6-CH ₃	H	Cl	F enyl	C ₂ H ₅
607	6-CH ₃	H	Cl	2-Pyridyl	C ₂ H ₅
608	6-CH ₃	H	Cl	5-Cl-pyridyl-2	C ₂ H ₅
609	6-CH ₃	H	Cl	5-CF ₃ -pyridyl-2	C ₂ H ₅
610	6-CH ₃	H	Cl	2-Pyrazinyl	C ₂ H ₅
611	6-CH ₃	CH ₃	H	Cyklohexyl	C ₂ H ₅
612	6-CH ₃	CH ₃	H	Benzyl	C ₂ H ₅
613	6-CH ₃	CH ₃	H	F enyl	C ₂ H ₅
614	6-CH ₃	CH ₃	H	2-Pyridyl	C ₂ H ₅
615	6-CH ₃	CH ₃	H	5-Cl-pyridyl-2	C ₂ H ₅
616	6-CH ₃	CH ₃	H	5-CF ₃ -pyridyl-2	C ₂ H ₅
617	6-CH ₃	CH ₃	H	2-Pyrazinyl	C ₂ H ₅
618	6-CH ₃	H	H	Cyklohexyl	CH ₂ OCH ₃
619	6-CH ₃	H	H	Benzyl	CH ₂ OCH ₃
620	6-CH ₃	H	H	F enyl	CH ₂ OCH ₃
621	6-CH ₃	H	H	2-Pyridyl	CH ₂ OCH ₃
622	6-CH ₃	H	H	5-Cl-pyridyl-2	CH ₂ OCH ₃
623	6-CH ₃	H	H	5-CF ₃ -pyridyl-2	CH ₂ OCH ₃
624	6-CH ₃	H	H	2-Pyrazinyl	CH ₂ OCH ₃

	R ¹	R ^y	R ^z	R ³	R ⁴
625	6-CH ₃	H	Cl	Cyklohexyl	CH ₂ OCH ₃
626	6-CH ₃	H	Cl	Benzyl	CH ₂ OCH ₃
627	6-CH ₃	H	Cl	Fenyl	CH ₂ OCH ₃
628	6-CH ₃	H	Cl	2-Pyridyl	CH ₂ OCH ₃
629	6-CH ₃	H	Cl	5-Cl-pyridyl-2	CH ₂ OCH ₃
630	6-CH ₃	H	Cl	5-CF ₃ -pyridyl-2	CH ₂ OCH ₃
631	6-CH ₃	H	Cl	2-Pyrazinyl	CH ₂ OCH ₃
632	6-CH ₃	CH ₃	H	Cyklohexyl	CH ₂ OCH ₃
633	6-CH ₃	CH ₃	H	Benzyl	CH ₂ OCH ₃
634	6-CH ₃	CH ₃	H	Fenyl	CH ₂ OCH ₃
635	6-CH ₃	CH ₃	H	2-Pyridyl	CH ₂ OCH ₃
636	6-CH ₃	CH ₃	H	5-Cl-pyridyl-2	CH ₂ OCH ₃
637	6-CH ₃	CH ₃	H	5-CF ₃ -pyridyl-2	CH ₂ OCH ₃
638	6-CH ₃	CH ₃	H	2-Pyrazinyl	CH ₂ OCH ₃
639	6-CH ₃	H	H	Cyklohexyl	CH ₂ C≡CH
640	6-CH ₃	H	H	Benzyl	CH ₂ C≡CH
641	6-CH ₃	H	H	Fenyl	CH ₂ C≡CH
642	6-CH ₃	H	H	2-Pyridyl	CH ₂ C≡CH
643	6-CH ₃	H	H	5-Cl-pyridyl-2	CH ₂ C≡CH
644	6-CH ₃	H	H	5-CF ₃ -pyridyl-2	CH ₂ C≡CH
645	6-CH ₃	H	H	2-Pyrazinyl	CH ₂ C≡CH
646	6-CH ₃	H	Cl	Cyklohexyl	CH ₂ C≡CH
647	6-CH ₃	H	Cl	Benzyl	CH ₂ C≡CH
648	6-CH ₃	H	Cl	Fenyl	CH ₂ C≡CH
649	6-CH ₃	H	Cl	2-Pyridyl	CH ₂ C≡CH
650	6-CH ₃	H	Cl	5-Cl-pyridyl-2	CH ₂ C≡CH
651	6-CH ₃	H	Cl	5-CF ₃ -pyridyl-2	CH ₂ C≡CH
652	6-CH ₃	H	Cl	2-Pyrazinyl	CH ₂ C≡CH
653	6-CH ₃	CH ₃	H	Cyklohexyl	CH ₂ C≡CH
654	6-CH ₃	CH ₃	H	Benzyl	CH ₂ C≡CH
655	6-CH ₃	CH ₃	H	Fenyl	CH ₂ C≡CH
656	6-CH ₃	CH ₃	H	2-Pyridyl	CH ₂ C≡CH
657	6-CH ₃	CH ₃	H	5-Cl-pyridyl-2	CH ₂ C≡CH

	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	
658	6-CH ₃	CH ₃	H	5-CF ₃ -pyridyl -2	CH ₂ C≡CH
659	6-CH ₃	CH ₃	H	2-Pyrazinyl	CH ₂ C≡CH
660	3-F	CH ₃	H	Cyclohexyl	C ₂ H ₅
661	3-F	CH ₃	H	Benzyl	C ₂ H ₅
662	3-F	CH ₃	H	Fenyl	C ₂ H ₅
663	3-F	CH ₃	H	2-Pyridyl	C ₂ H ₅
664	3-F	CH ₃	H	5-Cl-pyri- dyl-2	C ₂ H ₅
665	3-F	CH ₃	H	5-CF ₃ -pyridyl -2	C ₂ H ₅
666	3-F	CH ₃	H	2-Pyrazinyl	C ₂ H ₅

Sloučeniny obecného vzorce I podle vynálezu se hodí k potírání škodlivých hub a živočišných škůdců z třídy hmyzu, členovců pavoukovitých a hlístů oblych. Mohou se nasadit k ochraně rostlin i v sektoru hygieny, ochrany zásob a ve veterinářském úseku jako fungicidy a prostředky k potírání škůdců.

Ke škodlivému hmyzu patří z řádu motýlů (Lepidoptera) například

Adoxophyes orana, Agrotis ypsilon, Agrotis segetum, Alabama argillacea, Anticarsia gemmatilis, Argyroresthia conjugella, Autographa gamma, Cacoecia murinana, Capua reticulana, Choristoneura fumiferana, Chilo partellus, Choristoneura occidentalis, Cirphis unipuncta, Cnaphalocrocis medinalis, Crocidolomia binotalis, Cydia pomonella, Dendrolimus pini, Diaphania nitidalis, Diatraea grandiosella, Earias insulana, Elasmopalpus lignosellus, Eupoecilia ambiguella, Feltia subterranea, Grapholitha funebrana, Grapholitha molesta, Heliothis armigera, Heliothis virescens, Heliothis zea, Hellula undalis, Hibernia defoliaria, Hyphantria cunea, Hyponomeuta malinellus, Keiferia lycopersicella, Lambdina fiscellaria, Laphygma exigua, Leucoptera scitella, Lithocolletis blancardella, Lobesia botrana, Loxostege sticticalis, Lymantria dispar, Lymantria monacha, Lyonetia clerkella, Manduca sexta, Malacosoma neustria, Mamestra brassicae, Mocis repanda, Operophtera brumata, Orgyia pseudotsugata, Ostrinia nubilalis, Pandemis heparyana, Panolis flammea, Pectinophora gossypiella, Phthorimaea

operculella, Phyllocnistis citrella, Pieris brassicae, Plathypena scabra, Platynota stultana, Plutella xylostella, Prays citri, Prays oleae, Prodenia sunia, Prodenia ornithogalli, Pseudoplusia includens, Rhyacionia frustrana, Scrobipalpula absoluta, Sesamia inferens, Sparganothis pilleriana, Spodoptera frugiperda, Spodoptera littoralis, Spodoptera litura, Syllepta derogata, Synanthedon myopaeformis, Thaumtopoea pityocampa, Tortrix viridana, Trichoplusia ni, Tryporyza incertulas, Zeiraphera canadensis, Galleria mellonella und Sitotroga cerealella, Ephestia cautella, Tineola bisselliella;

Z řádu brouků (Coleoptera) například Agriotes

lineatus, Agriotes obscurus, Anthonomus grandis, Anthonomus pomorum, Apion vorax, Atomaria linearis, Blastophagus piniperda, Cassida nebulosa, Cerotoma trifurcata, Ceuthorrhynchus assimilis, Ceuthorrhynchus napi, Chaetocnema tibialis, Conoderus vespertinus, Crioceris asparagi, Dendroctonus refipennis, Diabrotica longicornis, Diabrotica 12-punctata, Diabrotica virgifera, Epilachna varivestis, Epitrix hirtipennis, Eutinobothrus brasiliensis, Hylobius abietis, Hypera brunneipennis, Hypera postica, Ips typographus, Lema bilineata, Lema melanopus, Leptinotarsa decemlineata, Limonius californicus, Lissorhoptrus oryzophilus, Melanotus communis, Meligethes aeneus, Melolontha hippocastani, Melolontha melolontha, Oulema oryzae, Ortiorrhynchus sulcatus, Otiorrhynchus ovatus, Phaedon cochleariae, Phyllopertha horticola, Phyllophaga sp., Phyllotreta chrysocephala, Phyllotreta nemorum, Phyllotreta striolata, Popillia japonica, Psylliodes napi, Scolytus intricatus, Sitona lineatus, Bruchus rufimanus, Bruchus pisorum, Bruchus lentis, Sitophilus granaria, Lasioderma serricorne, Oryzaephilus surinamensis, Rhyzopertha dominica, Sitophilus oryzae, Tribolium castaneum, Trogoderma granarium, Zabrotes subfasciatus;

Z řádu dvoukřídlých (Diptera) například Anastre-

pha ludens, Ceratitis capitata, Contarinia sorghicola, Dacus curbitae, Dacus oleae, Dasineura brassicae, Delia coarctata, Delia radicum, Hydrellia griseola, Hylemyia platura, Liriomyza sativae, Liriomyza trifolii, Mayetiola destructor, Orseolia oryzae, Oscinella frit, Pegomya hyoscyami, Phorbia antiqua, Phorbia bras-

sicae, *Phorbia coarctata*, *Rhagoletis cerasi*, *Rhagoletis pomonella*, *Tipula oleracea*, *Tipula paludosa*, *Aedes aegypti*, *Aedes vexans*, *Anopheles maculipennis*, *Chrysomya bezziana*, *Chrysomya hominivorax*, *Chrysomya macellaria*, *Cordylobia anthropophaga*, *Culex pipiens*, *Fannia canicularis*, *Gasterophilus intestinalis*, *Glossina morsitans*, *Haematobia irritans*, *Haplodiplosis equestris*, *Hypoderma lineata*, *Lucilia caprina*, *Lucilia cuprina*, *Lucilia sericata*, *Musca domestica*, *Muscina stabulans*, *Oestrus ovis*, *Tabanus bovinus*, *Simulium damnosum*;

Z řádu Tripse (Thysanoptera) například *Frankliniella fusca*, *Frankliniella occidentalis*, *Frankliniella tritici*, *Haplothrips tritici*, *Scirtothrips citri*, *Thrips oryzae*, *Thrips palmi*, *Thrips tabaci*;

Z řádu blanokřídlých (Hymenoptera) například *Athalia rosae*, *Atta cephalotes*, *Atta sexdens*, *Atta texana*, *Hoplocampa minuta*, *Hoplocampa testudinea*, *Iridomyrmes humilis*, *Iridomyrmex purpureus*, *Monomorium pharaonis*, *Solenopsis geminata*, *Solenopsis invicta*, *Solenopsis richteri*;

Z řádu štěnic (Heteroptera) například *Acrosternum hilare*, *Blissus leucopterus*, *Cyrtopeltis notatus*, *Dysdercus cingulatus*, *Dysdercus intermedius*, *Eurygaster integriceps*, *Euschistus impictiventris*, *Leptoglossus phyllopus*, *Lygus hesperus*, *Lygus lineolaris*, *Lygus pratensis*, *Nezara viridula*, *Piesma quadrata*, *Solubea insularis*, *Thyanta perditor*;

Z řádu vysávačů rostlin (Homoptera) například

Acyrtosiphon onobrychis, *Acyrtosiphon pisum*, *Adelges laricis*, *Aonidiella aurantii*, *Aphidula nasturtii*, *Aphis fabae*, *Aphis gossypii*, *Aphis pomi*, *Aulacorthum solani*, *Bemisia tabaci*, *Brachycaudus cardui*, *Brevicoryne brassicae*, *Dalbulus maidis*, *Dreyfusia nordmannianae*, *Dreyfusia piceae*, *Dysaphis radicola*, *Empoasca fabae*, *Eriosoma lanigerum*, *Laodelphax striatella*, *Macrosiphum avenae*, *Macrosiphum euphorbiae*, *Macrosiphon rosae*, *Megoura viciae*, *Metopolophium dirhodum*, *Myzus persicae*, *Myzus cerasi*, *Nephotettix cincticeps*, *Nilaparvata lugens*, *Perkinsiella saccharicida*, *Phoro-*

don humuli, Planococcus citri, Psylla mali, Psylla piri, Psylla pyricol, Quadraspidiotus perniciosus, Rhopalosiphum maidis, Saissetia oleae, Schizaphis graminum, Selenaspidus articulatus, Sitobion avenae, Sogatella furcifera, Toxoptera citricida, Trialeurodes abutilonea, Trialeurodes vaporariorum, Viteus vitifolii;

Z řádu termitů (Isoptera) například Calotermes

flavicollis, Leucotermes flavipes, Macrotermes subhyalinus, Odontotermes formosanus, Reticulitermes lucifugus, Termes natalensis;

Z řádu přímokřídých (Orthoptera) například

Gryllotalpa gryllotalpa, Locusta migratoria, Melanoplus bivittatus, Melanoplus femur-rubrum, Melanoplus mexicanus, Melanoplus sanguinipes, Melanoplus spretus, Nomadacris septemfasciata, Schistocerca americana, Schistocerca peregrina, Stauronotus maroccanus, Schistocerca gregaria, Acheta domestica, Blatta orientalis, Blattella germanica, Periplaneta americana;

Z řádu Arachnoidea například fytofágové roztoči jako

Aculops lycopersicae, Aculops pelekassi, Aculus schlechtendali, Brevipalpus phoenicis, Bryobia praetiosa, Eotetranychus carpini, Eutetranychus banksii, Eriophyes sheldoni, Oligonychus pratensis, Panonychus ulmi, Panonychus citri, Phyllocoptruta oleivora, Polyphagotarsonemus latus, Tarsonemus pallidus, Tetranychus cinnabarinus, Tetranychus kanzawai, Tetranychus pacificus, Tetranychus urticae, klíště jako Amblyomma americanum, Amblyomma variegatum, Argas persicus, Boophilus annulatus, Boophilus decoloratus, Boophilus microplus, Dermacentor silvarum, Hyalomma truncatum, Ixodes ricinus, Ixodes rubicundus, Ornithodoros moubata, Otobius megnini, Rhipicephalus appendiculatus a Rhipicephalus evertsi a na zvířatech parazitující roztoči jako Dermanyssus gallinae, Psoroptes ovis a Sarcoptes scabiei;

Z řádu hlísů obléhých například kořenové hlísty například

Meloidogyne hapla, Meloidogyne incognita, Meloidogyne javanica, cysty tvorbí Nematody, jako Globodera pallida, Globodera rostochiensis, Heterodera avenae, Heterodera glycines, He-

terodera schachtii, migratoričtí Endoparasiti a semi-endoparasitičtí Nematody, jako Heliocotylenchus multincinctus, Hirschmanniella oryzae, Hoplolaimus spp, Pratylenchus brachyurus, Pratylenchus fallax, Pratylenchus penetrans, Pratylenchus vulnus, Radopholus similis, Rotylenchus reniformis, Scutellonema bradys, Tylenchulus semipenetrans, nematody stonků a listů jako Anguina tritici, Aphelenchoides besseyi, Ditylenchus angustus, Ditylenchus dipsaci, virusvektory, jako Longidorus spp, Trichodorus christei, Trichodorus viruliferus, Xiphinema index, Xiphinema mediterraneum.

Účinné látky lze aplikovat jako takové, v prostředcích nebo z nich připravené formy použití, například jako přímo rozprašující roztoky, prášky, suspence nebo disperse, emulze, olejové disperse, pasty, naprašovadla, rozprašovadla, granuláty rozsřikováním, rozprašováním, mlžením, práškováním nebo poléváním. Aplikační formy se řídí podle účele použití; v každém případě však se zaručením nejjemnějšího rozptýlení účinných látek podle vynálezu.

Jako fungicidy jsou sloučeniny obecného vzorce I částečně systemicky účinné. Lze jich použít jako fungicidů na list i do půdy proti širokému spektru rostlinných patogenních hub, obzvláště třídy Ascomycetae, Deuteromycetae, Phycomycetae a Basidiomycetae.

Zvláštní význam mají při potírání mnoha hub na různých kulturních plodinách, jako je pšenice, žito, ječmen, oves, rýže, kukuřice, tráva, bavlna, soja, káva, cukrová třtina, víno, ovoce a okrasné rostliny a zelenina jako jsou okurky, fazole, dýňovité porosty i semena těchto rostlin.

Zejména se hodí k potírání následujících nemocí rostlin: Erysiphe graminis (pravá moučnatka) u obilí, Erysiphe cichoracearum a Sphaerotheca fuliginea na dýňovitých porostech, Podosphaera leocotricha na jablkách,

Uncinula necator na vinné révě,
druhy Puccinia na obilí,
druhy Rhizoctonia na bavlníku a trávě,
druhy Ustilago na obilí a cukrové třtině,
Venturia inaequalis (strupovitost) na jablkách,
druhy Helminthosporinu na obilí,
Septoria nodorum na pšenici,
Botrytis cinerea (šedá plíseň) na jahodách, vinné révě,
Cercospora arachidicola na podzemnici olejné,
Pseudocercospora herpotrichoides na pšenici, ječmeni,
Pyricularia oryzae na rýži,
Phytophthora infestans na bramborách a rajčatech,
druhy Fusarium a Verticillium
na různých rostlinách Plasmopara viticola na vinné révě,
druhy Alternaria na zelenině a ovoci.

Nových sloučenin lze používat také v ochraně materiálu, například k ochraně dřeva, papíru a textilií například proti Paecilomyces variotii.

Aplikovány mohou být v obvyklých formách, jako roztoky, emulze, suspence, prášky, pasty nebo granuláty. Forma použití se řídí podle příslušného účele použití; v každém případě má být zaručeno jemné a rovnoměrné rozdělení účinných látek.

Prostředky se vyrábějí známými způsoby, například nastavením účinné látky rozpouštědlem a/nebo nosiči, případně za použití emulgátorů a dispergátorů, přičemž v případě vody jako ředidla může být použito také jiných organických rozpouštědel jako pomocných rozpouštědel.

Jako pomocné látky při tom připadají v úvahu v podstatě:

rozpouštědla jako aromáty (například xylol), chlorované aromáty (například chlorbenzol), parafiny (například ropné frakce),

alkoholy (například methanol, butanol), ketony (například cyklohexanon), aminy (například ethanolamin, dimethylformamid) a voda;

nosiče, jako přírodní nerostné moučky (například kaoliny, oxid hlinitý, mastek, křída) a syntetické nerostné moučky (například vysoce dispergovaná kyselina křemičitá, silikáty);

emulgátory jako neiontogenní a aniontové emulgátory (například polyoxyethylen-mastný alkohol-ether, alkylsulfonáty a arylsulfonáty);

dispegrační činidla jako ligninsulfitové odpadní louhy a methylcelulóza.

Jako povrchově aktivní látky přicházejí v úvahu soli alkalických kovů, kovů alkalických zemin a amoniové soli kyseliny ligninsulfonové, naftalensulfonové, fenolsulfonové, dibutyl-naftalensulfonové, alkylarylsulfonáty, alkylsulfonáty, alkylsulfáty, sulfáty mastných alkoholů a mastné kyseliny i jejich soli s alkalickými kovy a s kovy alkalických zemin, soli sulfátovaného glykolesteru mastného alkoholu, kondenzační produkty sulfonovaného naftalenu a jeho derivátů s formaldehydem, kondenzační produkty naftalenu, případně kyseliny naftalensulfonové s fenolem a s formaldehydem, polyoxyethylenoktylphenol-ether, ethoxylovaný isooktylphenol, oktylphenol, nonylphenol, alkylphenolpolyglykoether, tributylphenylpolyglykoether, alkoholy alkylarylpolyetheru, isotridecylalkohol, kondenzáty ethylenoxidu mastných alkoholů, ethoxylovaný ricinový olej, polyoxyethylenalkylether, ethoxylovaný polyoxypropylen, laurylalkoholpolyglykoetheracetát, sorbitester, ligninsulfitové louhy a methylcelulóza.

Vodné prostředky lze připravovat z emulsních koncentrátů, past nebo smáčitelných prášků (stříkatelný prášek, olejové

disperse) přísadou vody. K přípravě emulsí, past nebo olejových dispersí je možno použít látek samotných nebo rozpuštěných v oleji nebo v rozpouštědle, homogenizací ve vodě pomocí smáčecích, dispergačních nebo emulgačních činidel. Dají se též připravovat koncentráty sestávající z účinné látky a smáčecích, dispergačních nebo emulgačních činidel, vhodné ke zředění vodou.

Práškové, rozprašovací a posypové prostředky se dají vyrábět mísením nebo společným mletím účinných látek s pevným nosičem.

Granuláty, například obalované, impregnační a homogenní granuláty lze vyrábět vázáním účinných látek na pevné nosiče.

Pevnými nosiči jsou například minerální hlínky, jako silikagel, kyseliny křemičité, křemičité gely, silikáty, mastek, kaolin, attahlinka, vápenec, vápno, křída, bolus, pálená hlínka, plavená hlínka, dolomit, diatomhlínka, síran vápenatý a hořečnatý, oxid hořečnatý, rozempleté plasty, hnojiva, jako například amoniumsulfát, amoniumfosfát, amonium nitrát, močoviny a rostlinné produkty, jako obilná mouka, moučka ze stromové kůry, dřevná moučka a moučka z ořechových skořápek a jiné pevné nosiče. Koncentrace účinných látek v prostředcích, připravených k použití mohou kolísat v širokých mezích.

Obecně obsahují prostředky hmotnostně 0,0001 až 95 % účinné látky.

S dobrým úspěchem lze látky podle vynálezu aplikovat způsobem ultranízkého objemu ("Ultra-Low-Volume" [ULV]), přičemž je možno nanášet prostředky s více než hmotnostně 95 % účinné látky nebo dokonce samotnou účinnou látku bez přísad.

Pro použití jako fungicidy se doporučují koncentrace hmotnostně 0,01 až 95%, s výhodou 0,5 až 90% účinné látky. Pro

použití jako insekticidy přicházejí v úvahu prostředky s obsahem účinné látky hmotnostně 0,0001 až 10%, s výhodou 0,01 až 1 %.

Účinné látky se při tom normálně nasazují v čistotě 90 až 100%, s výhodou 95 až 100% (podle spektra NMR).

Příkladně mají prostředky následující složení. Procenta a díly jsou míněny hmotnostně, pokud není uvedeno jinak.

I. Roztok 90 dílů sloučeniny obecného vzorce I a 10 dílů N-methyl-alfa-pyrrolidonu vhodný k použití ve formě nejjemnějších kapiček.

II. Roztok 20 dílů sloučeniny obecného vzorce I ve směsi obsahující 80 dílů alkylovaného benzenu, 10 dílů adičního produktu, 8 až 10 mol ethylenoxidu na 1 mol N-monoethanolamidu kyseliny olejové, 5 dílů vápenaté soli kyseliny dodecylbenzové, 5 dílů adičního produktu 40 mol ethylenoxidu a 1 mol ricinového oleje; jemným rozmělněním prostředku ve vodě se získá disperse.

III. Roztok 20 dílů sloučeniny obecného vzorce I ve směsi obsahující 40 dílů cyklohexanonu, 30 dílů isobutanolu, 20 dílů adičního produktu 7 mol ethylenoxidu na 1 mol isooktylphenolu a 10 dílů adičního produktu 40 mol ethylenoxidu a 1 mol ricinového oleje; jemným rozmělněním prostředku ve vodě se získá disperse.

IV. Vodná disperse 20 dílů sloučeniny podle vynálezu ve směsi obsahující 25 dílů cyklohexanonu, 65 dílů frakce minerálního oleje s teplotou varu 210 až 280 °C a 10 dílů adičního produktu 40 mol ethylenoxidu a 1 mol ricinového oleje; jemným rozmělněním prostředku ve vodě se získá disperse.

V. V kladivovém mlýnu mletá směs sestávající obsahující 20 dílů sloučeniny obecného vzorce I, 3 dílů sodné soli kyseliny diisobutyl-naftalin-alfa-sulfonové, 17 dílů sodné soli kyseliny ligninsulfonové ze sulfitového odpadního louhu a 60 dílů práškovitého gelu kyseliny křemičité; jemným rozmělněním prostředku ve vodě se získá disperse.

VI. Dokonalá směs 3 dílů sloučeniny obecného vzorce I a 87 dílů jemnozrnného kaolinu; tento rozprašovací prostředek obsahuje 3 % účinné látky.

VII. Dokonalá směs 30 dílů sloučeniny obecného vzorce I, 92 dílů práškovitého gelu kyseliny křemičité a 8 dílů parafinového oleje nastříknutého na gel kyseliny křemičité; tento prostředek dodává účinné látce dobrou přilnavost.

VIII. Stabilní vodná suspence obsahující 40 dílů sloučeniny obecného vzorce I, 10 dílů sodné soli močovinoformaldehydového kondenzátu kyseliny fenolsulfonové, 2 dílů křemeliny a 48 dílů vody, která se může dále ředit.

IX. Stabilní olejová disperse 20 dílů sloučeniny obecného vzorce I, 2 dílů vápenaté soli kyseliny dodecylbenzensulfonové, 8 dílů polyglykoletheru mastného alkoholu, 2 dílů sodné soli močovinoformaldehydového kondenzátu kyseliny fenolsulfonové a 68 dílů parafinového minerálního oleje.

X. V kladivovém mlýnu mletá směs obsahující z 10 dílů sloučeniny obecného vzorce I, 4 díly sodné soli kyseliny diisobutyl-naftalin-alfa-sulfonové, 20 dílů sodné soli kyseliny ligninsulfonové z odpadního sulfitového louhu, 38 dílů gelu kyseliny křemičité a 38 dílů kaolinu. Jemným rozptýlením směsi v 10 000 dílech vody se získá rozstříkovací suspence obsahující 0,1 dílů účinné látky.

Sloučenin sloučeniny obecného vzorce I se používá tak, že se houby nebo osivo, rostliny, materiály nebo půda, jež mají být proti houbám chráněny, ošetřují účinným množstvím účinné látky.

Ošetřování se provádí před infikováním materiálů, rostlin nebo osiva houbami nebo po něm.

Používaná množství je podle požadovaného účinku 0,02 až 3,0 kg účinné látky na hektar, s výhodou 0,1 až 1 kg/ha.

K ošetřování osiva se potřebuje obvykle 0,001 až 50 g s výhodou 0,01 až 10 g na kilogram osiva.

Použité množství účinné látky při potírání škůdců je ve volném prostoru 0,02 až 10, s výhodou 0,1 až 2,0 kg/ha.

Sloučeniny obecného vzorce I samotné nebo v kombinaci s herbicidy nebo fungicidy mohou být smíseny společně s jinými prostředky k ochraně rostlin, například s růstovými regulátory nebo s prostředky k hubení škůdců a bakterií. Zajímavá je také směšovatelnost s hnojivy nebo s roztoky minerálních solí, kterých lze použít k odstranění nedostatku výživných látek a stopových prvků.

Prostředky k ochraně rostlin a hnojiva se mohou k prostředkům podle vynálezu přidávat v hmotnostním poměru 1:10 až 10:1, případně teprve bezprostředně před aplikací (Tankmix). Při smísení s fungicidy nebo insekticidy se tak docílí v mnoha případech rozšíření účinného fungicidního spektra.

Bez záměru na jakémkoliv omezení má následující seznam fungicidů, se kterými může být sloučenin podle vynálezu společně použito, objasnit kombinační možnosti:

Síra, dithiokarbamáty a jejich deriváty, jako dimethyldithiokarbanát železitý, dimethyldithiokarbanát zinečnatý, ethylenbisdithiokarbanát zinečnatý, mangaethylenbisdithiokarbanát, manganethylendiaminbisdithiokarbanát zinečnatý, tetramethylthiuramidsulfidy, amoniový komplex N,N-ethylenbisdithiokarbamátu zinku, amoniový komplex N,N'-propylenbisdithiokarbamátu zinku, N,N'-polypropylenbis-(thiokarbamoyl)disulfid; nitroderiváty, jako dinitro-(1-methylheptyl)fenylkrotonát, 2-sec.-butyl-4,6-dinitrofenyl-3,3-dimethylakrylát, 2-sec.-butyl-4,6-dinitrofenylisopropylkarbonát, diisopropylester kyseliny 5-nitroisofthalové.

Heterocyklické látky, jako 2-heptadecyl-2-imidazolinacetát, 2,4-dichlor-6-(o-chloranilino)-s-triazin, 0,0-diethyl-ftalimidofosfonothionát, 5-amino-1-beta-[bis-1-(dimethylamino)fosfinyl]-3-fenyl-1,2,4-triazol, 2,3-dikyano-1,4-dithioantrachinon, 2-thio-1,3-dithiolo-beta-[4,5-b]chinoxalin, ethylester 1-(butylkarbamoyl)-2-benzimidazolkarbaminové kyseliny, 2-methoxykarbonylaminobenzimidazol, 2-(furyl)-(2)benzimidazol, 2-(thiazolyl)-(4)benzimidazol, N-(1,1,2,2-tetrachlorethylthio)-terahydroftalimid, N-trichlormethylthiotetrahydroftalimid, N-trichlormethylthioftalimid, diamid N-dichlorfluormethylthio-N',N'-dimethyl-N-fenyl kyseliny sírové, 5-ethoxy-3-trichlormethyl-1,2,3-thiadiazol, 2-rhodanmethylthiobenzthiazol, 1,4-dichlor-2,5-dimethoxybenzen, 4-(2-chlorfenylhydrazono)-3-methyl-5-isoxazonon, pyridin-2-thio-1-oxid, 8-hydroxychinolin, případně jeho měďná sůl, 2,3-dihydro-5-karboxanilido-6-methyl-1,4-oxathiin, 2,3-dihydro-5-karboxanilido-6-methyl-1,4-oxathiin-4,4-dioxid, anilid 5,6-dihydro-4H-pyran-3-karboxylové kyseliny, anilid 2-methyl-furan-3-karboxylové kyseliny, anilid 2,5-dimethylfuran-3-karboxylové kyseliny, anilid 2,4,5-trimethylfuran-3-karboxylové kyseliny, cyklohexylamid 2,5-dimethylfuran-3-karboxylové kyseliny, amid N-cyklohexyl-N-methoxy-2,5-dimethylfuran-3-karboxylové kyseliny, anilid 2-methylbenzoové kyseliny, anilid 2-jodbenzoové kyseliny, N-formyl-N-morfolin,

2,2,2-trichlorethylacetal, piperazin-1,4-diylbis-(1-(2,2,2-trichlorethyl)formamid, 1-(3,4-dichloranilino)-1-formylamino-2,2,2-trichlorethan, 2,6-dimethyl-N-tridecylmorfolin, případně jeho soli, 2,6-dimethyl-N-cyklododecylmorfolin, případně jeho soli, N-[3-(p-terc.-butylfenyl)-2-methylpropyl]-cis-2,6-dimethylmorfolin, N-[3-(p-terc.-butylfenyl)-2-methylpropyl]piperidin, 1-[2-(2,4-dichlorfenyl)-4-ethyl-1,3-dioxolan-2-yl-ethyl]-1H-1,2,4-triazol, 1-[2-(2,4-dichlorfenyl)-4-n-propyl-1,3-dioxolan-2-yl-ethyl]-1H-1,2,4-triazol, N-(n-propyl)-N-(2,4,6-trichlorfenoxyethyl)-N'-imidazolylmočovina, 1-(4-chlorfenoxy)-3,3-dimethyl-1-(1H-1,2,4-triazol-1-yl)-2-butanon, 1-(4-chlorfenoxy)-3,3-dimethyl-1-(1H-1,2,4-triazol-1-yl)-2-butanol, alfa-(2-chlorfenyl)-alfa-(4-chlorfenyl)-5-pyrimidinmethanol, 5-butyl-2-dimethylamino-4-hydroxy-6-methylpyrimidin, bis-(p-chlorfenyl)-3-pyridinmethanol, 1,2-bis-(3-ethoxykarbonyl-2-thioureido)benzol, 1,2-bis-(3-methoxykarbonyl-2-thioureido)benzol,

jakož i jiné fungicidy, jako dodecylguanidinacetát, 3-[3-(3,5-dimethyl-2-oxycyklohexyl-2-hydroxyethyl)glutarimid, hexachlorbenzol, DL-methyl-N-(2,6-dimethylfenyl)-N-furoyl(2)alaninát, DL-N-2,6-dimethylfenyl)-N-(2'-methoxyacetyl)alaninmethylester, N-(2,6-dimethylfenyl)-N-chloracetyl, DL-2-aminobutyrolakton, DL-N-(2,6-dimethylfenyl)-N-(fenylacetyl)alaninmethylester, 5-methyl-5-vinyl-3-(3,5-di-chlorfenyl)-2,4-dioxo-1,3-oxazolidin, 3-[3,5-dichlorfenyl-(5-methyl-5-methoxymethyl)-1,3-oxazolidin-2,4-dion, 3-(3,5-di-chlorfenyl)-1-isopropylkarbamoylhydantoin, imid N-(3,5-di-chlorfenyl)-1,2-dimethylcyklopropan-1,2-dikarboxylové kyseliny, 2-kyano-[N-(ethylaminokarbonyl)-2-methoximino)acetamid, 1-[2-(2,4-dichlorfenyl)pentyl]-1H-1,2,4-triazol, 2,4-difluor-alfa-(1H-1,2,4-triazolyl-1-methyl)benzhydrylalkohol, N-(3-chlor-2,6-dinitro-4-trifluormethylfenyl)-5-trifluormethyl-3-chlor-2-aminopyridin, 1-((bis-(4-fluorfenyl)methylsilyl)methyl)-1H-1,2,4-triazol.

Předpisů uvedených v následujících příkladech přípravy bylo použito s odpovídajícími obměnami výchozích sloučenin k získání dalších sloučenin obecného vzorce I. Takto získané sloučeniny jsou uvedeny v následující tabulce spolu s fyzikálními údaji. Procenta jsou míněna hmotnostně, pokud není uvedeno jinak.

Příklady provedení vynálezu

Příklad 1

Methylester N-(2-(N'-(p-methylfenyl)-4'-chlorpyrazolyl-3'-oxymethyl)fenyl)-N-methoxykarbaminové kyseliny (tabulka číslo 19)

Při teplotě místnosti se přes noc míchá směs 1,9 g methylesteru N-(2-brommethylyfenyl)-N-methoxykarbaminové kyseliny (o čistotě přibližně 75%, $\hat{=}$ 4,6 mmol) (podle patentového spisu číslo WO 93/15046), 1 g (4,8 mmol) N-(p-methylfenyl)-4-chlor-3-hydroxypyrazolu a 1 g (7,2 mmol) uhličitanu draselného v 15 ml dimethylformamidu. Reakční směs se zředí vodou a vodná fáze se extrahuje tři krát methyl-terc.-butyletherem. Spojené organické fáze se extrahují vodou, vysuší se síranem hořečnatým a zahustí se. Zbytek se čistí chromatografií na oxidu hlinitém za použití jako elučního činidla methylenchloridu. Získá se 1,4 g (68 % teorie) žádaného methylesteru N-(2-(N'-(p-methylfenyl)-4'-chlorpyrazolyl-3'-oxymethyl)fenyl)-N-methoxykarbaminové kyseliny v podobě světle žlutého oleje.

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 ; delta v ppm): 7,75 (s, 1H, pyrazolyl), 7,70 (m, 1H, fenyl), 7,5 (m, 6H, fenyl), 7,2 (d, 2H, fenyl), 5,4 (s, 2H, OCH_2), 3,75, 3,8 (2s, každé 3H, 2 x OCH_3), 2,35 (s, 3H, CH_3).

Příklad 2

N-Methyl-N'-methoxy-N'-(2-((N"-pyrazinyl)-pyrazolyl-3"-oxymethyl)fenyl)močovina (tabulka číslo 32)

a) Fenylester N-hydroxy-N-(2-methylfenyl)karbaminové kyseliny

Směs 350 g (čistota přibližně 80%, 2,3 mol, připraveno podle způsobu, který popsal Bamterger a kol., Ann. Chem. 316, str. 278, 1901) N-(2-methylfenyl)hydroxylaminu a 286,8 g (3,4 mol) hydrogenuhličitanu sodného v 700 ml methylenchloridu se smíchá za silného míchání při teplotě přibližně -10 °C se 447 g (2,85 mol) fenylchlorformiátu. Míchá se přibližně jednu hodinu při teplotě -10 °C, přikape se 600 ml vody, přičemž se teplota reakční směsi zvýší na 5 až 10 °C, vodná fáze se oddělí a ještě jednou se extrahuje methylenchloridem. Spojené organické fáze se extrahují vodou, vysuší se síranem hořečnatým a zahustí se. Zbytek vykřystaluje a vymíchá se s cyklohexanem. Získá se 407 g (72 % teorie) fenylesteru N-hydroxy-N-(2-methylfenyl)karbaminové kyseliny v podobě bezbarvé pevné látky.

b) Fenylester N-methoxy-N-(2-methylfenyl)karbaminové kyseliny

Směs 407 g (1,6 mol) fenylesteru N-hydroxy-N-(2-methylfenyl)karbaminové kyseliny (podle příkladu 2a) a 277 g (2,0 mol) uhličitanu draselného v 700 ml methylenchloridu se smíchá po kapkách s 211 g (1,67 mol) dimethylsulfátu. Reakční směs se přitom zahřeje na 40 °C. Míchá se přes noc při teplotě místnosti, načež se zfiltruje přes křemelinu. Filtrát se promyje roztokem amoniaku a vodou, vysuší se síranem hořečnatým a zahustí se. Zbytek vykřystaluje a vymíchá se s hexanem. Získá se 324 g (75 % teorie) fenylesteru N-methoxy-N-(2-methylfenyl)karbaminové kyseliny v podobě bezbarvé pevné látky.

¹H-NMR (CDCl₃; delta v ppm): 7,1 - 7,6 (m, 9H, fenyl), 3,8 (s, 3H, OCH₃), 2,4 (s, 3H, CH₃).

c) Fenylester N-methoxy-N-(2-brommethylfenyl)karbaminové kyseliny

Směs 324 g (1,3 mol) fenylesteru N-methoxy-N-(2-methylfe-

nyl)karbaminové kyseliny (příklad 2b), 258 g (1,45) N-bromsukcinimidu a 1 g azoisobutyrodinitrilu v 1 litru tetrachlormetanu se ozařuje přibližně šest hodin 300 W UV lampou, čímž se reakční směs zahřeje k varu. Přidá se 13 g N-bromsukcinimidu a ozařuje se dalších 8 hodin. Ochladí se na teplotu místnosti a vypadlý sukcinimid se odfiltruje. Organická fáze se extrahuje vodou, vysuší se síranem hořečnatým a zahustí se. Zbytek vykřystaluje a vymíchá se s cyklohexanem. Získá se 300 g (68 % teorie) žádaného fenylesteru N-methoxy-N-(2-brommethylfenyl)karbaminové kyseliny v podobě béžové pevné látky.

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 ; delta v ppm): 7,0 - 7,6 (m, 9H, fenyl), 4,65 (s, 3H, $\text{CH}_2\text{-Br}$), 3,9 (s, 3H, CH_3).

d) Fenylester N-methoxy-N-(2-(N'-pyrazinyl)pyrazolyl-3'-oxymethyl)fenyl)karbaminové kyseliny

Směs 3,1 g (9,2 mmol) fenylesteru N-methoxy-N-(2-brommethylfenyl)karbaminové kyseliny (příklad 2c), 1,5 g (9,2 mmol) N-pyrazinyl-3-hydroxypyrazolu a 2 g (14,5 mmol) uhličitanu draselného v 10 ml dimethylformamidu se míchá přes noc při teplotě místnosti. Reakční směs se zředí vodou a vodná fáze se extrahuje tři krát methyl-terc.-butyletherem. Spojené organické fáze se extrahují vodou, vysuší se síranem hořečnatým a zahustí se. Zbytek se čistí sloupcovou chromatografií za použití jako elučního činidla systému cyklohexan/ethylacetát. Získá se 2,4 g (63 % teorie) žádaného fenylesteru N-methoxy-N-(2-(N'-pyrazinyl)pyrazolyl-3'-oxymethyl)fenyl)karbaminové kyseliny v podobě žlutého oleje.

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 ; delta v ppm): 9,15 (d, 1H, pyrazolyl), 8,3 (m, 3H, pyrazinyl), 7,7 (m, 1H, fenyl), 7,1 - 7,6 (m, 8H, fenyl), 6,0 (d, 1H, pyrazolyl), 5,5 (s, 2H, OCH_2), 3,85 (s, 3H, OCH_3).

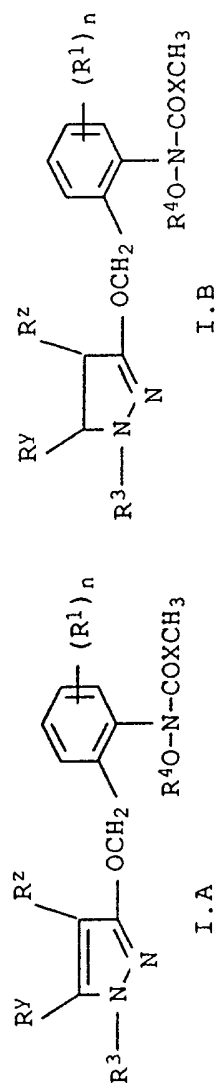
d) N-Methyl-N'-methoxy-N'-(2-((N"-pyrazinyl)-pyrazolyl-3"-oxy-

methyl)fenyl)močovina

Směs 1,9 g (4,6 mmol) fenylesteru N-methoxy-N-(2-(N'-pyrazinyl)pyrazolyl-3'-oxymethyl)fenyl)karbaminové kyseliny (příklad 2d) a 15 ml vodného methyaminového roztoku (40%) se míchá přes noc při teplotě místnosti. Reakční směs se zředí vodou a vodná fáze se extrahuje dva krát methylenchloridem. Spojené organické fáze se promyjí vodou, vysuší se síranem hořečnatým a zahustí se. Zbytek vykřystaluje a vymíchá se s cyklohexanem. Získá se 0,9 g (55 % teorie) žádané N-methyl-N'-methoxy-N'-(2-((N"-pyrazinyl)-pyrazolyl-3"-oxymethyl)fenyl)močoviny v podobě béžové pevné látky.

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 ; delta v ppm): 9,15 (d, 1H, pyrazolyl), 8,3 (m, 3H, pyrazinyl), 7,6 (m, 1H, fenyl), 7,35 (m, 3H, fenyl), 6,0 (m, 2H, pyrazinyl), 5,45 (s, 2H, OCH_2), 3,7 (s, 3H, OCH_3), 2,9 (d, 3H, NCH_3)

V následující tabulce se v prvním sloupci uvádí číslo sloučeniny a v posledním sloupci teplota tání ve $^{\circ}\text{C}$ nebo IR.



	Struktur	R ¹ _n	R ^Y	R ^Z	R ³	R ⁴	X	[°C], IR [cm ⁻¹]
1	I.A	H	H	H	C ₆ H ₅	CH ₃	O	1737, 1600, 1493, 1480, 1456, 1358, 1332, 755
2	I.A	H	H	H	4-Cl-C ₆ H ₄	CH ₃	O	1737, 1547, 1503, 1480, 1457, 1441, 1350, 1094, 1030, 936
3	I.A	H	H	H	2,4-Cl ₂ -C ₆ H ₃	CH ₃	O	1739, 1547, 1492, 1475, 1457, 1440, 1356, 1107, 1058, 1027
4	I.A	H	H	H	2-CH ₃ -C ₆ H ₄	CH ₃	O	1739, 1710, 1542, 1482, 1457, 1440, 1358, 1052, 1030, 763
5	I.A	H	H	H	3-CH ₃ -C ₆ H ₄	CH ₃	O	1738, 1593, 1545, 1494, 1483, 1457, 1441, 1357, 1056, 1032
6	I.A	H	H	H	4-CH ₃ -C ₆ H ₄	CH ₃	O	1738, 1544, 1519, 1482, 1456, 1440, 1393, 1358, 1243, 1031,

	Struktur	R ¹ _n	R ^y	R ^z	R ³	R ⁴	X	[°C], IR [cm ⁻¹]
7	I.A	H	H	H	2-Cl-C ₆ H ₄	CH ₃	O	1739, 1710, 1546, 1495, 1476, 1453, 1441, 1358, 1027, 757
8	I.A	H	H	H	3-Cl-C ₆ H ₄	CH ₃	O	1736, 1597, 1548, 1495, 1476, 1456, 1440, 1357, 1101, 771
9	I.A	H	H	H	2,6-Cl ₂ -C ₆ H ₃	CH ₃	O	1727, 1543, 1464, 1445, 1364, 1348, 791, 785, 749
10	I.A	H	H	H	3,5-Cl ₂ -C ₆ H ₄	CH ₃	O	120
11	I.A	H	H	H	2,5-Cl ₂ -C ₆ H ₃		O	1737, 1710, 1547, 1489, 1471, 1456, 1437, 1346, 1096, 1027
12	I.A	H	H	H	3,4-Cl ₂ -C ₆ H ₃	CH ₃	O	85
13	I.A	H	H	H	2-CH ₃ , 4-Cl-C ₆ H ₃	CH ₃	O	1738, 1710, 1543, 1494, 1480, 1457, 1441, 1358, 1100, 940
14	I.A	H	H	H	3-CF ₃ -C ₆ H ₄	CH ₃	O	1721, 1558, 1459, 1441, 1368, 1333, 1121, 1067, 793, 764
15	I.A	H	H	H	4-OCH ₃ -C ₆ H ₄	CH ₃	O	1737, 1541, 1517, 1483, 1457, 1442, 1359, 1250, 1056, 1032
16	I.A	H	CH ₃	H	C ₆ H ₅	CH ₃	O	1739, 1710, 1560, 1504, 1484, 1456, 1440, 1380, 1359, 760
17	I.A	H	H	CH ₃ O-CO	C ₆ H ₅	CH ₃	O	1720, 1702, 1570, 1540, 1446, 1372, 1357, 1285, 1119, 751
18	I.A	H	H	H	4-F-C ₆ H ₄	CH ₃	O	1737, 1546, 1516, 1482, 1457, 1440, 1359, 1233, 1031, 835

	Struk- tura	R ¹ _n	R ^y	R ^z	R ³	R ⁴	X	[°C], IR [cm ⁻¹]
19	I.A	H	H	Cl	4-CH ₃ -C ₆ H ₄	CH ₃	O	1738, 1554, 1509, 1456, 1440, 1358, 1253, 1118, 940, 760
20	I.A	H	3-F	H	2,4-Cl ₂ -C ₆ H ₃	CH ₃	O	90
21	I.A	H	3-F	H	2,4-Cl ₂ -C ₆ H ₃	CH ₃	O	109
22	I.A	H	H	H	3-OCH ₃ -C ₆ H ₄	CH ₃	O	1737, 1607, 1597, 1545, 1499, 1482, 1472, 1440, 1358
23	I.A	H	H	Cl	2,4-Cl ₂ -C ₆ H ₃	CH ₃	O	110
24	I.A	H	CF ₃	H	2,4-Cl ₂ -C ₆ H ₄	CH ₃	O	1739, 1507, 1486, 1457, 1359, 1250, 1190, 1139, 1109, 1092
25	I.A	H	CH ₃	H	2,4-Cl ₂ -C ₆ H ₃	CH ₃	O	1738, 1710, 1567, 1561, 1500, 1484, 1456, 1440, 1359, 1104
26	I.A	H	H	Cl	4-Cl-C ₆ H ₄	CH ₃	O	1729, 1553, 1511, 1497, 1438, 1356, 1332, 1265, 1122, 1112
27	I.A	H	H	H	3,4-(OCF ₂ O)-C ₆ H ₃	CH ₃	O	97
28	I.A	H	H	H	2-pyridyl	CH ₃	O	85
29	I.A	H	H	H	5-CF ₃ -pyridyl-2	CH ₃	O	81
30	I.A	H	H	H	2-pyrazinyl	CH ₃	O	87
31	I.B	H	H	H	C ₆ H ₅	CH ₃	O	1739, 1639, 1599, 1501, 1456, 1439, 1411, 1354, 1252, 752
32	I.A	H	H	H	2-pyrazinyl	CH ₃	NH	145
33	I.A	H	H	NO ₂	5-CF ₃ -pyridyl-2	CH ₃	O	126

	Struktur	R ¹ _n	R ^y	R ^z	R ³	R ⁴	X	[°C], IR [cm ⁻¹]
34	I.A	H	CH ₃	H	4-Cl-C ₆ H ₄	CH ₃	O	1738, 1561, 1500, 1456, 1440, 1359, 1094, 1010, 764
35	I.A	H	H	H	6-Cl-Pyridazin-3-yl	CH ₃	O	135
36	I.A	H	H	H	5-Cl-Pyridin-2-yl	CH ₃	O	77
37	I.A	H	H	CF ₃	Cyclohexyl	CH ₃	O	1743, 1496, 1456, 1441, 1359, 1272, 1262, 1176, 1124, 1029
38	I.A	H	H	Cl	5-Cl-Pyridin-2-yl	CH ₃	O	92
39	I.A	H	H ₃ CO ₂ C	H	CH ₂ C ₆ H ₅	CH ₃	O	71
40	I.A	H	H	H	C ₆ H ₅	H	O	1718, 1600, 1545, 1507, 1481, 1458, 1399, 1359, 1032, 757
41	I.A	H	H	H	C ₆ H ₅	CH ₃	NH	1675, 1600, 1545, 1508, 1479, 1462, 1399, 1355, 1054, 756
42	I.A	H	H	H	C ₆ H ₅	CH ₃	-	1680, 1600, 1545, 1507, 1480, 1456, 1359, 1056, 1032, 758
43	I.A	H	H	H	C ₆ H ₅	H	NH	1653, 1601, 1545, 1707, 1479, 1454, 1414, 1398, 1355, 755
44	I.A	H	H	H	C ₆ H ₅	CH ₃	CH ₂	1678, 1600, 1545, 1480, 1456, 1394, 1378, 1358, 1055, 756
45	I.A	H	H	H	C ₆ H ₅	H	-	1643, 1622, 1601, 1544, 1493, 1480, 1368, 1027, 759, 745
46	I.A	H	H	H	C ₆ H ₅	H	CH ₂	1619, 1600, 1550, 1495, 1482, 1462, 1454, 1358, 765, 753
47	I.A	H	H	H	2,4-Cl ₂ -phenyl	CH ₃	NH	130

	Struktur	R ¹ _n	R ^y	R ^z	R ³	R ⁴	X	[°C], IR [cm ⁻¹]
48	I.A	H	H	H	4-Cl-C ₆ H ₄	H	O	105
49	I.A	H	H	H	4-Cl-C ₆ H ₄	H	NH	1653, 1546, 1503, 1480, 1455, 1426, 1390, 1357, 1094, 1071
50	I.A	H	H	H	4-Cl-C ₆ H ₄	CH ₃	NH	1675, 1546, 1503, 1479, 1457, 1425, 1389, 1355, 936, 829
51	I.A	H	H	H	CH ₂ C ₆ H ₅	CH ₃	O	1737, 1709, 1537, 1488, 1456, 1439, 1359, 1325, 1032, 733
52	I.A	H	H	H	CH ₂ -[4-Cl-C ₆ H ₄]	CH ₃	O	1735, 1709, 1538, 1492, 1456, 1439, 1358, 1323, 1096, 761
53	I.A	H	H	H	2,4-(CH ₃) ₂ -C ₆ H ₃	CH ₃	O	92
54	I.A	H	H	Cl	2-Pyrazinyl	CH ₃	O	114
55	I.B	H	H	H	4-Cl-C ₆ H ₄	CH ₃	O	1740, 1639, 1599, 1495, 1456, 1439, 1415, 1355, 1251, 1092
56	I.A	H	H	H	2-Cl, 4-F-C ₆ H ₃	CH ₃	O	1737, 1547, 1505, 1494, 1480, 1457, 1441, 1358, 1258, 1028

Příklady účinnosti derivátu 2-[(dihydro)pyrazolyl-3'-oxymethylen]lanilidu obecného vzorce I podle vynálezu proti škodlivým houbám

Fungicidní účinnost derivátu 2-[(dihydro)pyrazolyl-3'-oxymethylen]lanilidu obecného vzorce I podle vynálezu lze dokázat následujícími zkouškami:

Připraví se účinné látky jako 20% emulze ve směsi obsahující hmotnostně 70 % cyklohexanonu, 20 % Nekanilu^R LN (Lutensol^R AP6 smáčedlo s emulgačním a dispergačním účinkem na bázi ethoxylovaných alkylfenolů) a 10 % Emulphoru^R EL (Emulan^R EL, emulgátor na bázi etoxylovaných mastných alkoholů) a zředí se vodou na požadovanou koncentraci.

Působení proti *Puccinia recondita* (rez pšeničná)

Listy semenáčků pšenice (druh "Kanzler") se popráší spórami rzi pšeničné (*Puccinia recondita*). Takto infikované rostliny se inkubují 24 hodin při teplotě 20 až 22 °C a relativní vlhkosti 90 až 95% a nato se ošetří prostředkem účinné látky. Po dalších 8 dnech při teplotě 20 až 22 °C a relativní vlhkosti 65 až 70% se vizuálně vyhodnotí míra vývoje hub.

Při této zkoušce vykazují rostliny, ošetřené sloučeninami 2 až 6, 8, 11 až 15, 18 až 20, 22, 23 a 26 až 29 podle vynálezu, napadení houbami nejvýše 5 %, zatímco rostliny ošetřené známou účinnou látkou z patentového spisu číslo W0-A 93/15046 (tabulka 7, příklad 8) vykazaly napadení z 25 %. Neošetřené rostliny vykazaly napadení ze 70 %.

V odpovídající zkoušce vykazaly rostliny ošetřené 250 ppm sloučeniny 1 podle vynálezu 3% napadení houbami, zatímco rostliny ošetřené známou účinnou látkou z patentového spisu číslo W0-A 93/15046 (tabulka 7, příklad 21) byly napadeny stejně

jako neošetřené rostliny ze 70 %.

V odpovídající zkoušce vykázaly rostliny ošetřené 250 ppm sloučeniny 1 až 8, 10 až 16, 18 až 20, 22, 23, 27 až 30, 34, 36 až 38, 41, 47 a 51 až 56 podle vynálezu nejvýše 15% napadení houbami, zatímco rostliny ošetřené 250 ppm známé účinné látky z patentového spisu číslo W0-A 93/15046 (tabulka 7, příklad 21) byly napadeny stejně jako neošetřené rostliny ze 70 %.

Působení proti *Plasmopara viticola*

Hrnkovaná vinná réva (druh "Müller Thurgau") se postříká prostředkem účinné látky. Po osmi dnech se rostliny postříkají suspenzí zoospor houby *Plasmopara viticola*. Takto infikované rostliny se inkubují pět dní při teplotě 20 až 30 °C a vysoké vlhkosti. Před posouzením se rostliny posléze uchovávají ve vysoké vlhkosti po dobu 16 hodin. Vizualně se vyhodnotí míra vývoje hub.

Při této zkoušce ukazují rostliny, ošetřené sloučeninami 1 až 3, 5, 6, 13, 15 a 29 podle vynálezu, napadení houbami nejvýše 10%, zatímco rostliny ošetřené známou účinnou látkou z patentového spisu číslo W0-A 93/15046 (tabulka 7, příklad 8) vykázaly napadení z 25 %. Neošetřené rostliny vykázaly napadení ze 70 %.

Působení proti *Botrytis cinerea* (šedá plíseň)

Semenáčky papriky (druh "Neusiedler Ideal Elite") ve stadiu 4 až 5 lístků se postříkají prostředkem účinné látky (použitá množství 500 ppm) do stavu ulpělých kapek. Po usušení se rostliny postříkají suspenzí konidií houby *Botrytis cinerea* a 5 dní se uchovávají při teplotě 20 až 24 °C a při vysoké relativní vlhkosti. Hodnocení napadení se provádí vizualně.

Při této zkoušce rostliny ošetřené sloučeninou číslo 1 jsou prosté napadení, zatímco rostliny ošetřené známou účinnou látkou z patentového spisu číslo W0-A 93/15046 (tabulka 2, číslo 21) vykázaly napadení 70% a neošetřené rostliny z 80 %.

Účinnost proti *Erysiphe graminis* var. *tritici*

Listy semenáčků pšenice (druh "Frühgold") se postříkají prostředkem účinné látky (použité množství 250 ppm) do stavu ulpělých kapek. Po 24 hodinách se rostliny popráší sporami *Erysiphe graminis* var. *tritici*. Ošetřené rostliny se inkubují po sedm dní při teplotě 20 až 22 °C a při relativní vlhkosti 75 až 80%. Hodnocení napadení se provádí vizuálně.

Při této zkoušce rostliny ošetřené sloučeninou číslo 1 jsou prosté napadení, zatímco rostliny ošetřené známou účinnou látkou z patentového spisu číslo W0-A 93/15046 (tabulka 7, číslo 21) vykázaly napadení z 25 % a neošetřené rostliny ze 70 %.

V odpovídající zkoušce vykázaly rostliny ošetřené 250 ppm sloučeniny 1 až 7, 10, 13, 14, 18 až 20, 27 až 29, 34, 36, 41 50 a 56 podle vynálezu nejvýše 15% napadení houbami, zatímco rostliny ošetřené 250 ppm známé účinné látky z patentového spisu číslo W0-A 93/15046 (tabulka 7, příklad 21) byly napadeny ze 40 %. Neošetřené rostliny vykázaly napadení ze 70 %.

V odpovídající zkoušce vykázaly rostliny ošetřené 16 ppm sloučeniny 1 až 7, 10, 13, 14, 18 až 20, 27 až 29, 34, 36, 41 50 a 56 podle vynálezu nejvýše 25% napadení houbami, zatímco rostliny ošetřené 250 ppm známé účinné látky z patentového spisu číslo W0-A 93/15046 (tabulka 7, příklad 21) byly napadeny ze 65 %. Neošetřené rostliny vykázaly napadení ze 70 %.

Příklady účinnosti proti živočišným škůdcům

Účinnost sloučenin obecného vzorce I proti živočišným škůdcům lze doložit následujícími zkouškami:

Účinné látky se připraví jako

- a) 0,1% roztok v acetonu,
- b) jako 10% emulze obsahující hmotnostně 70 % cyklohexanonu, 20 % Nekanilu^R LN (Lutensol^R AP6 smáčedlo s emulgačním a dispergačním účinkem na bázi ethoxylovaných alkylfenolů) a 10 % Emulphoru^R EL (emulgátor na bázi etoxylovaných mastných alkoholů) a podle požadované koncentrace se zředí v případě a) acetonem a v případě b) vodou.

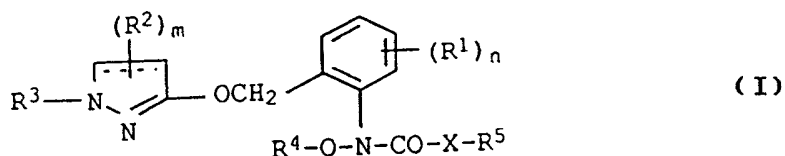
Po ukončení zkoušky se zjistí vždy nejnižší koncentrace, při které sloučeniny podle vynálezu v porovnání s neošetřenými kontrolními vzorky vyvolávají ještě 80% až 100% potlačení nebo mortalitu (práh účinnosti, případně minimální koncentrace).

Technická využitelnost

Derivát 2-[(dihydro)pyrazolyl-3'-oxymethylen]lanilidu pro výrobu prostředků k účinnému potírání hub a rostlinných škůdců a k preventivnímu ošetřování plodin, osiva, materiálu a půdy.

P A T E N T O V É N Á R O K Y

1. Derivát 2-[(dihydro)pyrazolyl-3'-oxymethylen]anilidu obecného vzorce I



kde znamená

 jednoduchou nebo dvojnou vazbu,

n 0, 1, 2, 3 nebo 4, přičemž R^1 jsou stejné nebo různé, pokud je n větší než 1,

m 0, 1 nebo 2, přičemž R^2 jsou stejné nebo různé, pokud je m větší než 1,

X přímou vazbu, atom kyslíku nebo skupinu NR^a ,

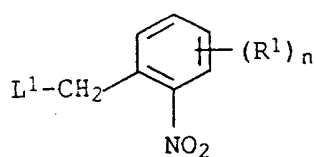
R^a atom vodíku, skupinu alkylovou, alkenylovou, alkinylovou, cykloalkylovou nebo cykloalkenylovou,

R^1 nitroskupinu, kyanoskupinu nebo atom halogenu, popřípadě substituovanou skupinu alkylovou, alkenylovou, alkinylovou, alkoxyskupinu, alkenyloxyskupinu nebo alkinylloxyskupinu nebo
v případě, že n znamená 2, přídavně na sousední atomy kruhu vázaný, popřípadě substituovaný můstek, který má tři až čtyři členy ze souboru zahrnujícího skupinu s 3 nebo 4 atomy uhlíku, s 1 až 3 atomy uhlíku a 1 nebo 2 atomy dusíku, kyslíku a/nebo síry, přičemž tyto můstky spolu s kruhem, na který jsou vázány mohou vytvářet parciálně nenasycený

nebo aromatický kruh,

- R^2 nitroskupinu, kyanoskupinu nebo atom halogenu, skupinu alkylovou s 1 až 4 atomy uhlíku, halogenalkylovou s 1 až 4 atomy uhlíku, alkoxykupinu s 1 až 4 atomy uhlíku, alkylthioskupinu s 1 až 4 atomy uhlíku nebo alkoxykarbonylovou skupinu s 1 až 4 atomy uhlíku v alkoxyodílu,
- R^3 skupinu alkylovou, alkenylovou nebo alkinylovou, popřípadě substituovaný nasycený kruh, nebo kruh s jednou nebo se dvěma nenasycenými vazbami, který může obsahovat vedle atomů uhlíku jeden až tři atomy kyslíku, dusíku nebo síry jako heteroatomy kruhu, popřípadě jednokruhovou nebo dvoukruhovou aromatickou skupinu, která má vedle atomů uhlíku jeden až čtyři atomy dusíku nebo jeden nebo dva atomy dusíku a jeden atom kyslíku nebo síry nebo atom kyslíku nebo atom síry jakožto člen kruhu,
- R^4 atom vodíku, popřípadě substituovanou skupinu alkylovou, alkenylovou, alkinylovou, cykloalkylovou nebo cykloalkenylovou, alkylkarbonylovou nebo alkoxykarbonylovou,
- R^5 skupinu alkylovou, alkenylovou, alkinylovou, cykloalkylovou nebo cykloalkenylovou, nebo v případě, kdy znamená X skupinu NR^a také atom vodíku.

2. Způsob přípravy derivátu 2-[(dihydro)pyrazolyl-3'-oxymethylen]anilidu podle nároku 1 obecného vzorce I, kde znamená R^4 atom vodíku a ostatní symboly mají v nároku 1 uvedený význam, vyznačující se tím, že se derivát benzylu obecného vzorce II

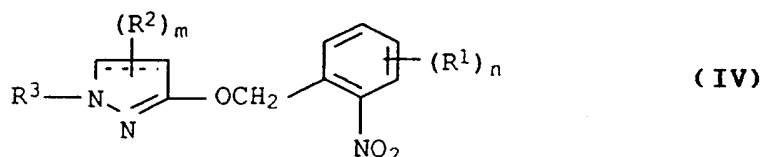


(II)

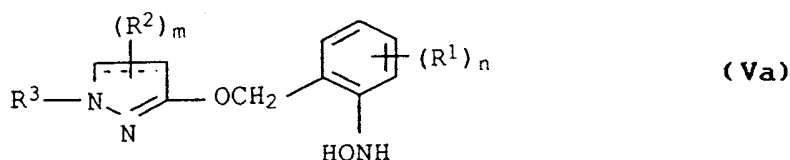
kde znamená L^1 nukleofilně zaměnitelnou skupinu a X přímou vazbu nebo atom kyslíku, v přítomnosti zásady nechává reagovat s 3-hydroxy(dihydro)pyrazolem obecného vzorce III



za získání odpovídajícího derivátu 2-[(dihydro)pyrazolyl-3'-oxymethylen]nitrobenzenu obecného vzorce IV



který se následně redukuje za získání N-hydroxyanilinu obecného vzorce Va



a N-hydroxyanilin obecného vzorce Va se nechává reagovat s karbo-nylovou sloučeninou obecného vzorce VI



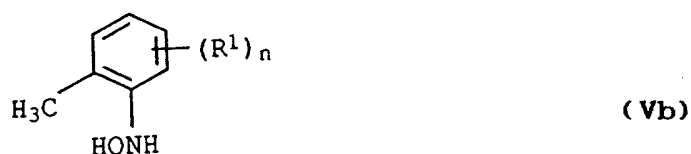
kde znamená L^2 atom halogenu, a ostatní symboly mají shora uvedený význam, za získání derivátu 2-[(dihydro)pyrazolyl-3'-oxymethylen]anilidu obecného vzorce I.

3. Způsob přípravy derivátu 2-[(dihydro)pyrazolyl-3'-oxymethylen]anilidu podle nároku 1 obecného vzorce I, kde neznámá R^4 atom vodíku, X znamená přímou vazbu nebo atom kyslíku a ostatní symboly mají v nároku 1 uvedený význam, v y z n a č u j í c í .

s e t í m, že se derivát benzylu obecného vzorce IIa



nejdříve redukuje na hydroxyanilin obecného vzorce Vb



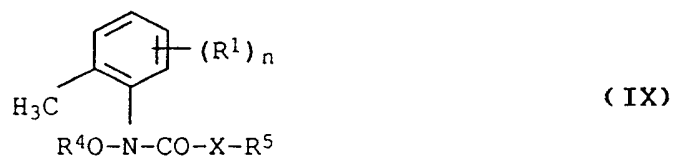
hydroxyanilin obecného vzorce Vb se nechává reagovat s karbonylovou sloučeninou obecného vzorce VI podle nároku 2 za získání anilidu obecného vzorce VII



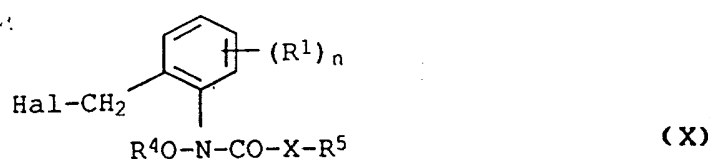
anilid obecného vzorce VII se nechává reagovat se sloučeninou obecného vzorce VIII



kde znamená L^3 nukleofilně zaměnitelnou skupinu a R^4 neznámá atom vodíku, za získání amidu obecného vzorce IX



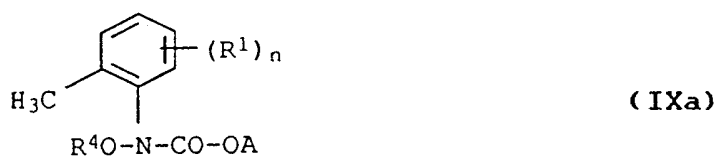
a amid obecného vzorce IX se převádí na benzylhalogenid obecného vzorce X



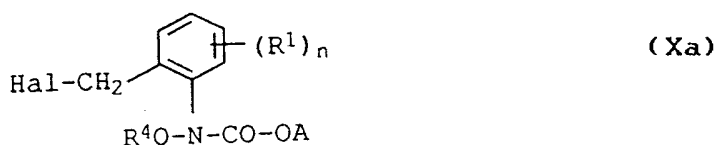
kde znamená Hal atom halogenu a benzylhalogenid obecného vzorce X se v přítomnosti zásdy nechává reagovat s 3-hydroxy(dihydro)pyrazolem obecného vzorce III podle nároku 2 za získání derivátu 2-[(dihydro)pyrazolyl-3'-oxymethylen]anilidu obecného vzorce I, přičemž jednotlivé nedefinované symboly mají shora uvedený význam.

4. Způsob přípravy derivátu 2-[(dihydro)pyrazolyl-3'-oxymethylen]anilidu podle nároku 1 obecného vzorce I, kde neznámá R^4 atom vodíku, X znamená přímou vazbu nebo atom kyslíku a ostatní symboly mají v nároku 1 uvedený význam, vyznačují se tím, že se odpovídající sloučenina obecného vzorce I, kde znamená R^4 atom vodíku a ostatní symboly mají v nároku 1 uvedený význam, nechává reagovat se sloučeninou obecného vzorce VIII podle nároku 3.

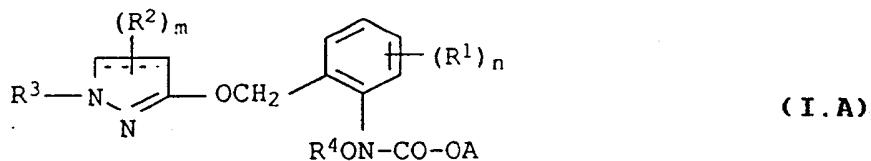
5. Způsob přípravy derivátu 2-[(dihydro)pyrazolyl-3'-oxymethylen]anilidu podle nároku 1 obecného vzorce I, kde znamená X skupinu NR^a a ostatní symboly mají v nároku 1 uvedený význam, vyznačují se tím, že se benzanilid obecného vzorce IXa



kde znamená A alkylovou nebo fenylovou skupinu, převádí na odpovídající benzylhalogenid obecného vzorce Xa



kde znamená Hal atom halogenu, benzylhalogenid obecného vzorce Xa se nechává reagovat v přítomnosti zásady s 3-hydroxy(dihydro)pyrazolem obecného vzorce III podle nároku 2 za získání sloučeniny obecného vzorce I.A



a sloučenina obecného vzorce I.A se nechává reagovat s aminem obecného vzorce XIa nebo XIb



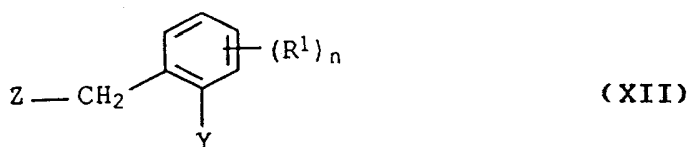
(XIa)



(XIb)

za získání derivátu 2-[(dihydro)pyrazolyl-3'-oxymethylen]anilidu obecného vzorce I, přičemž jednotlivé nedefinované symboly mají shora uvedený význam.

6. Meziprodukt obecného vzorce XII



kde znamená

n 0, 1, 2, 3 nebo 4, přičemž R¹ jsou stejné nebo různé, pokud je n větší než 1,

R¹ nitroskupinu, kyanoskupinu nebo atom halogenu, popřípadě substituovanou skupinu alkylovou, alkenylovou, alkinylou, alkoxykupinu, alkenyloxyskupinu nebo alkinylloxyskupinu nebo v případě, že n znamená 2, přídatně na sousední atomy kruhu

vázaný, popřípadě substituovaný můstek, který má tři až čtyři členy ze souboru zahrnujícího skupinu s 3 nebo 4 atomy uhlíku, s 1 až 3 atomy uhlíku a s 1 nebo 2 atomy dusíku, kyslíku a/nebo síry, přičemž tento můstek spolu s kruhem, na který je vázán, může vytvářet parciálně nenasycený nebo aromatický kruh,

Y nitroskupinu, skupinu NHOH- nebo NHOR^4 , kde znamená

R^4 popřípadě substituovanou skupinu alkylovou, alkenylovou, alkinylovou, cykloalkylovou nebo cykloalkenylovou, alkylkarbonylovou nebo alkoxykarbonylovou skupinu,

Z atom vodíku, hydroxylovou skupinu, merkaptoskupinu, kyanoskupinu, nitroskupinu, atom halogenu, alkylsulfonylovou skupinu s 1 až 6 atomy uhlíku, popřípadě substituovanou arylsulfonylovou skupinu nebo skupinu obecného vzorce Z^a



kde znamená

--- jednoduchou nebo dvojnou vazbu,

m 0, 1 nebo 2, přičemž R^2 jsou stejné nebo různé, pokud je m větší než 1,

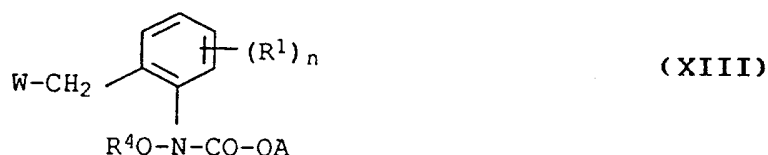
R^2 nitroskupinu, kyanoskupinu nebo atom halogenu, skupinu alkylovou s 1 až 4 atomy uhlíku, halogenalkylovou s 1 až 4 atomy uhlíku, alkoxykupinu s 1 až 4 atomy uhlíku, alkylthioskupinu s 1 až 4 atomy uhlíku nebo alkoxykarbonylovou skupinu s 1 až 4 atomy uhlíku v alkoxypodílu,

R^3 popřípadě substituovanou alkylovou, alkenylovou nebo alkinylovou skupinu
popřípadě substituovaný nasycený kruh, nebo kruh s jednou nebo se dvěma nenasycenými vazbami, který může obsahovat vedle atomů uhlíku jeden až tři atomy kyslíku, dusíku ne-

bo síry jako heteroatomy kruhu,
popřípadě jednokruhovou nebo dvoukruhovou aromatickou skupinu, která má vedle atomů uhlíku jeden až čtyři atomy dusíku nebo jeden nebo dva atomy dusíku a jeden atom kyslíku nebo síry nebo atom kyslíku nebo atom síry jakožto členy kruhu,

pro přípravu derivátu 2-[(dihydro)pyrazolyl-3'-oxymethylen]anilidu obecného vzorce I podle nároku 1.

7. Meziproduct obecného vzorce XIII,



kde R¹, R⁴ a n mají shora uvedený význam a kde znamená

W atom vodíku, atom halogenu,

A alkylovou nebo fenylovou skupinu.

pro přípravu derivátu 2-[(dihydro)pyrazolyl-3'-oxymethylen]anilidu obecného vzorce I podle nároku 1.

8. Prostředek k potírání živočišných škůdců a škodlivých hub v y z n a č u j í c í s e t í m , že obsahuje pevný nebo kapalný nosič a derivát 2-[(dihydro)pyrazolyl-3'-oxymethylen]anilidu podle nároku 1 obecného vzorce I.

9. Derivát 2-[(dihydro)pyrazolyl-3'-oxymethylen]anilidu obecného vzorce I podle nároku 1 pro výrobu prostředků k potírání živočišných škůdců a škodlivých hub.

10. Způsob potírání škodlivých hub, v y z n a č u j í c í

s e t í m, že se škodlivé houby, materiály, rostliny, půda nebo osivo, které se proti nim mají chránit ošetřují účinným množstvím derivátu 2-[(dihydro)pyrazolyl-3'-oxymethylen]anilidu podle nároku 1 obecného vzorce I.

11. Způsob potírání živočišných škůdců, v y z n a č u j í c í s e t í m, že se živočišní škůdci, materiály, rostliny, půda nebo osivo, které se proti nim mají chránit ošetřují účinným množstvím derivátu 2-[(dihydro)pyrazolyl-3'-oxymethylen]anilidu podle nároku 1 obecného vzorce I.