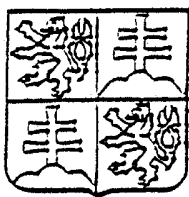


ČESKÁ A SLOVENSKÁ
FEDERATIVNÍ
REPUBLIKA
(19)



FEDERÁLNÍ ÚŘAD
PRO VYNÁLEZY

ZVEŘEJNĚNÁ PŘIHLÁŠKA VYNÁLEZU

(12)

(21) 01103-92

(13) A3

(22) 10.04.92

(32) 18.04.91

(31) 91/08369

(33) GB

(40) 18.11.92

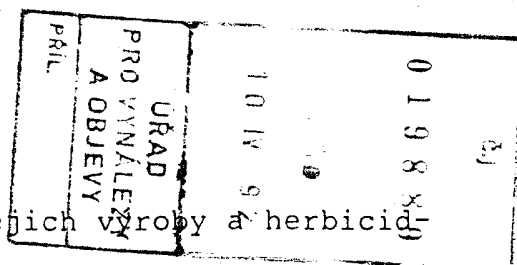
5(51) C 07 D 401/04.
A 01 N 43/52.
43/40
//(C 07 D 401/04.
213:54;
235:16)

(71) RHONE-POULENC AGRICULTURE Ltd., Ongar, GB

(72) Cramp Michael Colin, Ongar, GB
Pearson Christopher John, Ongar, GB

(54) Benzimidazolylové deriváty, způsob jejich výroby
a herbicidní kompozice tyto deriváty obsahující

(57) Benzimidazolylové deriváty obecného vzorce I, ve kterém Y znamená případně substituovanou alkylovou, alkenylovou, alkinylovou nebo cykloalkylovou skupinu nebo -OR, -SR, -SO₂R, atom halogenu, O-aryl, kyano, -NR₂, R⁷ aryl, aralkyl nebo nitro, R⁸ znamená -OH, -NR₂ nebo -XM, A znamená -SO₂B, Y¹ znamená případně substituovanou alkylovou, alkenylovou nebo alkinylovou skupinu nebo případně substituovanou cykloalkylovou skupinu nebo -SR, -OR, -OR¹, atom halogenu, aryl, aralkyl, -O-aryl, nebo -NR₂, n znamená nulu nebo celé číslo od 1 do 3, m znamená celé číslo od 1 do 4, R znamená případně substituovanou alkylovou nebo cykloalkylovou skupinu, R^{1a} znamená případně substituovanou alkenylovou nebo alkinylovou skupinu, R² a R³ nezávisle znamenají atom vodíku, R⁴ aryl nebo aralkyl, X znamená atom kyslíku nebo síry, M znamená případně substituovanou alkylovou skupinu, případně substituovanou cykloalkylovou skupinu nebo aryl, aralkyl, alkenylovou, alkinylovou, alkylovou nebo iminovou skupinu, B znamená případně substituovanou alkylovou skupinu, případně substituovanou cykloalkylovou skupinu, aryl, aralkyl nebo NR₂, a jejich zemědělsky přijatelné soli, způsob jejich výroby a herbicidní kompozice, které uvedené deriváty obsahují jako účinnou látku.



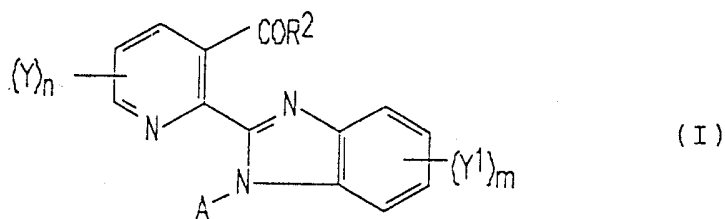
Benzimidazolylové deriváty, způsob jejich výroby a herbicidní kompozice tyto deriváty obsahující

Oblast techniky

Vynález se týká nových benzimidazolylových derivátů, způsobu jejich výroby a herbicidních kompozic, které tyto deriváty obsahují jako účinnou látku.

Podstata vynálezu

Předmětem vynálezu jsou benzimidazolylové deriváty obecného vzorce I



ve kterém

Y znamená
přímou nebo rozvětvenou alkylovou, alkenylovou nebo alkinylovou skupinu s nejvýše 8 uhlíkovými atomy, která je případně substituována jednou nebo více skupinami R^1 , které mohou být totožné nebo odlišné, skupinu zvolenou z množiny zahrnující skupinu -OR, skupinu -SR, skupinu $-SO_2R^3$, atom halogenu, 0-arylovou skupinu, kyano-skupinu, skupinu $-NR^4R^5$, arylovou skupinu, aralkylovou skupinu nebo nitro-skupinu, nebo cykloalkylovou skupinu se 3 až 6 uhlíkovými atomy, kte-

je případně substituována jednou nebo více skupinami R^1 , které mohou být totožné nebo odlišné,

Y^1

znamená

přímou nebo rozvětvenou alkylovou, alkenylovou nebo alkinylovou skupinu s nejvýše 8 uhlíkovými atomy, která je případně substituována jednou nebo více skupinami R^1 , které mohou být totožné nebo odlišné, nebo cykloalkylovou skupinu se 3 až 6 uhlíkovými atomy, která je případně substituována jednou nebo více skupinami R^1 , které mohou být totožné nebo odlišné, nebo skupinu zvolenou z množiny zahrnující skupinu -SR, skupinu -OR, skupinu -OR^{1a}, atom halogenu, arylovou skupinu, aralkylovou skupinu, 0-arylovou skupinu nebo -NR⁷R⁸,

R^2

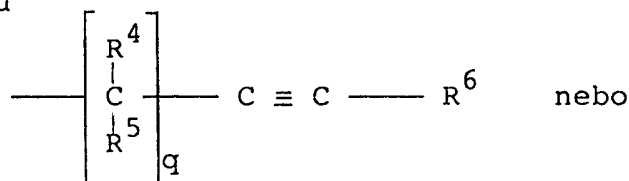
znamená

skupinu -OH nebo skupinu -NR⁷R⁸, nebo skupinu -X-M, ve které X znamená atom kyslíku nebo atom síry a

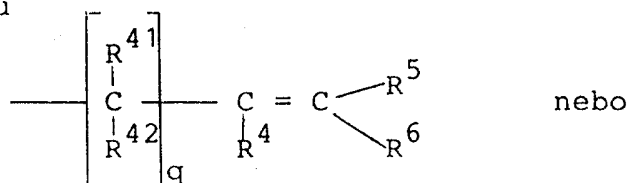
M

znamená

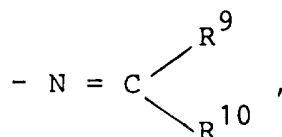
přímou nebo rozvětvenou alkylovou skupinu obsahující nejvýše 8 uhlíkových atomů, která je případně substituována jednou nebo více skupinami R^1 , které mohou být totožné nebo odlišné, nebo cykloalkylovou skupinu se 3 až 6 uhlíkovými atomy, která je případně substituována jednou nebo více skupinami R^1 , které mohou být totožné nebo odlišné, nebo skupinu zvolenou z množiny zahrnující arylovou skupinu a aralkylovou skupinu, nebo skupinu



skupinu



skupinu



A znamená skupinu $-SO_2B$,

B znamená

přímou nebo rozvětvenou alkylovou skupinu s nejvýše 6 uhlíkovými atomy, která je případně substituována jednou nebo více skupinami, které mohou být totožné nebo odlišné a které jsou zvolené z množiny zahrnující skupinu $-OR^3$, $-SR^3$ a atom halogenu, nebo cykloalkylovou skupinu obsahující 3 až 8 uhlíkových atomů, která je případně substituována jednou nebo více skupinami, které mohou být totožné nebo odlišné a které jsou zvoleny z množiny zahrnující skupinu $-OR^3$, $-SR^3$, R^3 a atom halogenu, nebo skupinu zvolenou z množiny zahrnující arylovou skupinu, aralkylovou skupinu a skupinu $-NR^7R^8$,

R znamená

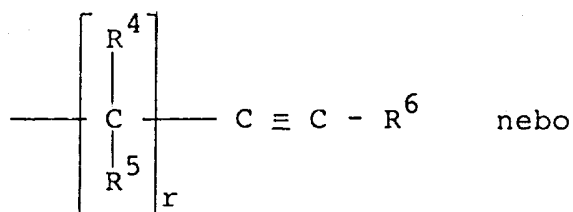
přímou nebo rozvětvenou alkylovou skupinu s nejvýše 8 uhlíkovými atomy, která je případně substituována jednou nebo více skupinami R^1 , které mohou být totožné nebo odlišné, nebo cykloalkylovou skupinu se 3 až 6 uhlíkovými atomy, která je případně substituována jednou nebo více skupinami R^3 , které mohou být totožné nebo odlišné,

R^1 znamená

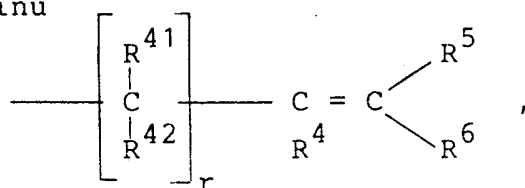
cykloalkylovou skupinu se 3 až 6 uhlíkovými atomy nebo skupinu zvolenou z množiny zahrnující skupinu $-OR^3$, skupinu $-SR^3$, atom halogenu, skupinu R^3 nebo 0-arylovou skupinu,

R^{1a} znamená

skupinu



skupinu



R^3 znamená přímou nebo rozvětvenou alkylovou skupinu s nejvýše 6 uhlíkovými atomy, která je případně substituována jedním nebo více atomy halogenu, které mohou být totožné nebo odlišné,

R^1 , R^{41} , R^{42} a R^5 , které mohou být totožné nebo odlišné, každý znamená atom vodíku nebo přímou nebo rozvětvenou alkylovou skupinu s nejvýše 6 uhlíkovými atomy, která je případně substituována jedním nebo více atomy halogenu, které mohou být totožné nebo odlišné,

R^6 znamená skupinu zvolenou z množiny zahrnující skupinu R^4 a aralkylovou skupinu,

R^7 a R^8 , které mohou být totožné nebo odlišné, každý znamená atom vodíku nebo skupinu zvolenou z množiny zahrnující skupinu R , skupinu $-\text{OR}^3$, skupinu $-\text{SR}^3$, atom halogenu, skupinu R^3 , 0-arylovou skupinu, arylovou skupinu nebo aralkylovou skupinu, nebo R^7 a R^8 mohou společně s atomem dusíku, ke kterému jsou vázány, tvořit heterocyklickou skupinu se 3 až 6 uhlíkovými atomy v kruhu a žádným, 1 nebo 2 heteroatomy v kruhu zvolenými z množiny zahrnující atom dusíku, atom kyslíku a atom síry,

R^9 a R^{10} , které mohou být totožné nebo odlišné, každý znamená atom vodíku nebo

přímou nebo rozvětvenou alkylovou skupinu s nejvýše 8 uhlíkovými atomy, která může být substituována jednou nebo více skupinami, které mohou být totožné nebo odlišné a které jsou zvoleny z množiny zahrnující atom halogenu, skupinu $-\text{OR}$ a skupinu $-\text{S}(\text{O})_s\text{R}$, ve které s znamená nulu, 1 nebo 2, nebo fenylovou skupinu, která je případně substituována jednou až čtyřmi skupinami, které mohou být totožné nebo odlišné a které jsou zvoleny z množiny zahrnující nitro-skupinu, skupinu R ,

skupinu $-NR^4R^5$, atom halogenu nebo skupinu $-S(O)_sR$,
nebo

5- nebo 6-člennou heterocyklickou skupinu obsahující
3 až 5 uhlíkových atomů v kruhu a jeden nebo více he-
teroatomů v kruhu zvolených z množiny zahrnující atom
dusíku, atom síry a atom kyslíku, například thienylo-
vou skupinu, furylovou skupinu, piperidylovou skupinu,
thiazolylovou skupinu, která je případně substituová-
na jednou nebo více skupinami R^1 , které mohou být to-
tožné nebo odlišné nebo

R^9 a R^{10} mohou společně s atomem dusíku, ke kterému
jsou vázány, tvořit heterocyklickou skupinu obsahující
4 nebo 5 uhlíkových atomů v kruhu, která může být pří-
padně substituována 1 až 3 skupinami R^3 , které mohou
být totožné nebo odlišné,

arylová skupina znamená

fenylovou skupinu, která je případně substituována 1
až 4 skupinami, které mohou být totožné nebo odlišné
a které jsou zvolené z množiny zahrnující skupinu $-OR^3$,
skupinu $-SR^3$, atom halogenu a skupinu R^3 , nebo

5- nebo 6-člennou heterocyklickou skupinu obsahující
3 až 5 uhlíkových atomů v kruhu a jeden nebo více he-
teroatomů v kruhu, které jsou zvolené z množiny zahrnu-
jící atom dusíku, atom síry a atom kyslíku, například
thienylovou skupinu, furylovou skupinu, piperidylovou
skupinu, thiazolylovou skupinu, která je případně sub-
stituována jednou nebo více skupinami, které mohou být
totožné nebo odlišné a které jsou zvoleny z množiny
zahrnující skupinu $-OR^3$, skupinu $-SR^3$, atom halogenu
a skupinu R^3 ,

aralkylová skupina znamená $-(CR^4R^5)_p$ -arylovou skupinu,
například benzylovou skupinu,

m znamená celé číslo od 1 do 4, přičemž skupiny Y^1 jsou
totožné nebo odlišné v případě, že m je větší než 1,

n znamená nulu nebo celé číslo od 1 do 3,

p znamená 1 nebo 2,

q znamená celé číslo od 1 do 3,

r znamená celé číslo od 1 do 5, přičemž v případě, že r , p nebo q je větší než 1, potom skupiny $-CR^4R^5-$ a skupiny $-CR^{41}R^{42}-$ mohou být totožné nebo odlišné, s výhradou spočívající v tom, že jedna ze skupin Y^1 znamená skupinu $-OR^{1a}$ buď v poloze 4 nebo v poloze 5 benzimidazolového kruhu, přičemž v případě, že n znamená 2 nebo 3, potom dvě skupiny Y , které jsou vzájemně přilehlé v poloze 5 a v poloze 6 pyridinového, tvoří společně s atomem uhlíku, ke kterému jsou připojeny, kondenzovaný fenylový kruh nebo mohou tvořit alifatický nebo aromatický kruh mající 5 nebo 6 atomů v kruhu a ne více než 2 heteroatomy v kruhu, které jsou zvoleny z množiny zahrnující atom kyslíku a atom síry, například thieno/2,3-b/pyridinový kruh, thieno/3,2-b/pyridinový kruh, furo/2,3-b/pyridinový kruh, furo/3,2-b/pyridinový kruh, 3,4-dihydropyrano/3,2-b/pyridinový kruh, 2,3-dihydropyrano/3,2-b/pyridinový kruh nebo 2,3-dihydropyrano/3,2-b/pyridinový kruh, a jejich zemědělsky přijatelné soli, přičemž výše uvedené sloučeniny mají cenné herbicidní vlastnosti.

Kromě toho mohou v některých případech obecné substituenty poskytovat optické isomery a/nebo stereoisomery. Jedná se o obecné substituenty Y , Y^1 , R^2 a A . Všechny tyto isomerní formy sloučenin obecného vzorce I rovněž spadají do rozsahu vynálezu.

Pod pojmem "zemědělsky přijatelné soli" se rozumí soli, jejichž kationty a anionty jsou známé a akceptované v oboru přípravy soli pro zemědělské a zahradnické použití. Výhodně jsou těmito solemi ve vodě rozpustné soli.

Vhodnými solemi vytvořenými z kyselých sloučenin obecného vzorce I, tj. ze sloučenin obecného vzorce I, majících karboxylovou skupinu, a bází jsou soli alkalických kovů (například sodné a draselné soli), soli kovů alkalických zemin (například vápenaté a hořečnaté soli), amonné soli a soli odvozené od aminů (například od diethanolaminu, triethanolaminu,

oktylaminu, dioktylmethylaminu a morfolinu).

Vhodnými adičními solemi s kyselinami vytvořenými ze sloučenin obecného vzorce I majících aminovou skupinu jsou soli s anorganickými kyselinami, například hydrochloridy, sulfáty, fosfáty a nitráty, a soli s organickými kyselinami, například soli sloučenin obecného vzorce I s kyselinou octovou. Výhodnými solemi jsou soli, ve kterých R^2 znamená skupinu -XW, kde W znamená kationt zvolený z množiny zahrnující alkalické kovy (například sodík, draslík nebo lithium) nebo amoniové soli obecného vzorce $-NR^{11}R^{12}R^{13}R^{14}$, ve kterém R^{11} , R^{12} , R^{13} a R^{14} , které mohou být totožné nebo odlišné, každý znamená

atom vodíku nebo

přímou nebo rozvětvenou alkylovou skupinu obsahující nejvýše 6 uhlíkových atomů, která je případně substituována skupinou -OH, nebo aralkylovou skupinu, přičemž ne více než dva ze substituentů R^{11} až R^{14} znamená aralkylovou skupinu.

Je samozřejmé, že všude tam, kde je v popisné části učiněn odkaz na sloučeniny obecného vzorce I, se rozumí, že tyto sloučeniny zahrnují i uvedené soli, pokud tento výklad je v souladu s kontextem.

Sloučeniny obecného vzorce I, ve kterém R^2 znamená alkoxylovou skupinu, alkenyloxy-skupinu nebo alkinyloxy-skupinu, jsou obzvláště užitečnými meziprodukty při přípravě ostatních sloučenin obecného vzorce I.

S ohledem na herbicidní vlastnosti jsou obzvláště důležitými sloučeninami sloučeniny obecného vzorce I, ve kterém:

- a) A znamená skupinu $-SO_2NR^7R^8$ a/nebo
- b) R^2 znamená skupinu -OH nebo skupinu -XM a/nebo
- c) Y znamená alkylovou skupinu s 1 nebo 2 uhlíkovými atomy, která je případně substituována jedním nebo

více atomy halogenu, například methylovou skupinu, ethylovou skupinu nebo trifluormethylovou skupinu a/nebo

- d) Y^1 znamená skupinu -OR, například methoxylovou skupinu nebo ethoxylovou skupinu, nebo atom halogenu, například atom fluoru nebo atom chloru, nebo skupinu -OR^{1a} nebo skupinu -NR⁷R⁸ a/nebo
- e) m znamená 1 nebo 2 a/nebo
- f) R⁷ a R⁸, které mohou být totožné nebo odlišné, každý znamená přímou nebo rozvětvenou alkylovou skupinu obsahující nejvýše 4 uhlíkové atomy, která je případně substituována jedním nebo více atomy, které mohou být totožné nebo odlišné a které jsou zvoleny z množiny zahrnující atom fluoru a atom chloru a/nebo
- g) X znamená atom kyslíku a/nebo
- h) R⁴, R⁴¹, R⁴², R⁵ a R⁶, které mohou být totožné nebo odlišné, každý znamená atom vodíku nebo přímou nebo rozvětvenou alkylovou skupinu obsahující nejvýše 4 uhlíkové atomy, která je případně substituována jedním nebo více atomy halogenu a/nebo
- i) n znamená nulu, 1 nebo 2 a/nebo
- j) r znamená 1 nebo 2, nejvýhodněji 1,

příčemž ostatní obecné substituenty mají výše uvedený význam.

Další výhodnou skupinou sloučenin jsou sloučeniny obecného vzorce I, ve kterém:

- B znamená skupinu -SO₂NMe₂,
- R² znamená skupinu -OH nebo skupinu -X-M,
- M znamená methylovou skupinu nebo 2-propinylovou skupinu nebo draselný nebo isopropylamoniový kationt,

- X znamená atom kyslíku,
- Y¹ znamená skupinu -OR^{1a} v poloze 4 benzimidazolového kruhu,
- R^{1a} znamená 2-propenylovou skupinu, 2-propinylovou skupinu nebo 2-butylovou skupinu,
- Y znamená methylovou skupinu, ethylovou skupinu nebo dvě skupiny Y v poloze 5 a poloze 6 pyridinového kruhu tvoří společně s atomem uhlíku, ke kterému jsou vázány, kondenzovaný fenylový kruh,
- m znamená 1 a
- n znamená 1 nebo 2.

S ohledem na herbicidní vlastnosti jsou obzvláště důležité následující sloučeniny podle vynálezu:

1. kyselina 2-/1-(N,N-dimethylsulfamoyl)-4-(2-propenyloxy)-benzimidazol-2-yl/pyridin-3-karboxylová,
2. kyselina 2-/1-(N,N-dimethylsulfamoyl)-4-(2-propenyloxy)-benzimidazol-2-yl/-6-methylpyridin-3-karboxykarboxylová,
3. kyselina 2-/1-(N,N-dimethylsulfamoyl)-4-(2-propenyloxy)-benzimidazol-2-yl/-5-methylpyridin-3-karboxylová,
4. kyselina 2-/1-(N,N-dimethylsulfamoyl)-4-(2-propenyloxy)-benzimidazol-2-yl/-5-ethylpyridin-3-karboxylová,
5. kyselina 2-/1-(N,N-dimethylsulfamoyl)-4-(2-propenyloxy)-benzimidazol-2-yl/chinolin-3-karboxylová,
6. kyselina 2-/1-(N,N-dimethylsulfamoyl)-4-(2-propinyloxy)-benzimidazol-2-yl/pyridin-3-karboxylová,
7. kyselina 2-/1-(N,N-dimethylsulfamoyl)-4-(2-propinyloxy)-benzimidazol-2-yl/-6-methylpyridin-3-karboxylová,

8. kyselina 2-/1-(N,N-dimethylsulfamoyl)-4-(2-propinyloxy)-benzimidazol-2-yl/-5-methylpyridin-3-karboxylová,
9. kyselina 2-/1-(N,N-dimethylsulfamoyl)-4-(2-propinyloxy)-benzimidazol-2-yl/chinolin-3-karboxylová,
10. kyselina 2-/1-(N,N-dimethylsulfamoyl)-4-(2-propinyloxy)-benzimidazol-2-yl/-5-ethylpyridin-3-karboxylová,
11. kyselina 2-/1-(N,N-dimethylsulfamoyl)-4-(2-butyloxy)-benzimidazol-2-yl/pyridin-3-karboxylová,
12. kyselina 2-/1-(N,N-dimethylsulfamoyl)-4-(2-butyloxy)-benzimidazol-2-yl/chinolin-3-karboxylová,
13. kyselina 2-/1-(N,N-dimethylsulfamoyl)-5-(2-propinyloxy)-benzimidazol-2-yl/pyridin-3-karboxylová,
14. 2-propinyl-2-/1-(N,N-dimethylsulfamoyl)-4-(2-propinyl-oxy)benzimidazol-2-yl/-5-methylpyridin-3-karboxylát,
15. isopropylamonium-2-/1-(N,N-dimethylsulfamoyl)-4-(2-propenyloxy)benzimidazol-2-yl/pyridin-3-karboxylát a
16. methyl-2-/1-N,N-dimethylsulfamoyl-4-(2-propenyloxy)-benzimidazol-2-yl/pyridin-3-karboxylát.

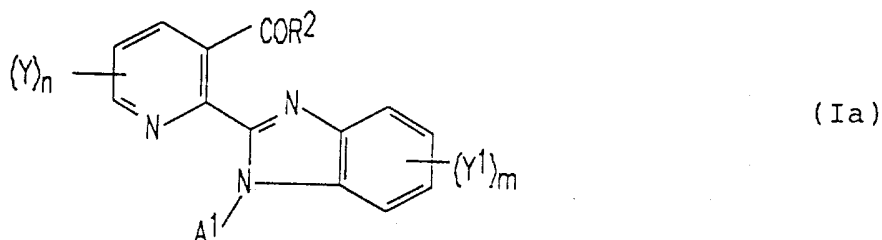
Uvedené číslování výše uvedených sloučenin je použito i v následující části popisu.

Sloučeniny obecného vzorce I mohou být připraveny použitím známých metod nebo použitím modifikovaných známých metod (tj. metod, které již byly použity nebo popsány v literatuře), například použitím metod, které jsou popsány dále. Jestliže některé obecné substituenty nejsou v následující části popisu specificky definovány, potom to znamená, že "mají výše uvedený význam", který souhlasí s první definicí každého obecného substituentu v popisné části.

Je samozřejmé, že v popisu následujících postupů mo-

hou být použité sekvence reakčních stupňů prováděny v různém pořadí a že k získání požadovaných sloučenin mohou být použity vhodné ochranné skupiny.

V souladu s vynálezem mohou být sloučeniny obecného vzorce I, ve kterém A znamená skupinu SO_2B a R^2 znamená skupinu $-\text{XM}$ nebo skupinu $-\text{NR}^7\text{R}^8$, připraveny reakcí sloučeniny obecného vzorce $\text{Cl}-\text{SO}_2\text{B}$ se sloučeninou obecného vzorce Ia



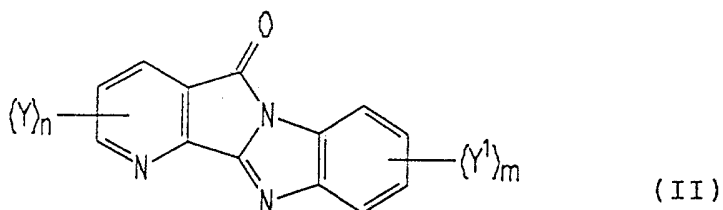
ve kterém A^1 znamená atom vodíku a R^2 znamená skupinu $-\text{XM}$ nebo skupinu $-\text{NR}^7\text{R}^8$, v přítomnosti činidla vázajícího kyselinu, jakým je uhličitán draselný, triethylamin, 1,8-diazabicyklo-5.9.0/-7-undecen nebo hydrid sodný, výhodně v bezvodém prostředí za použití aprotického polárního rozpouštědla, jakým je například ether (zejména tetrahydrofuran) nebo nitril, při teplotě, která se obecně pohybuje od teploty 25°C do teploty varu pod zpětným chladičem použitého rozpouštědla.

Podle dalšího znaku vynálezu mohou být sloučeniny obecného vzorce I, ve kterém R^2 znamená skupinu $-\text{XW}$, ve které X znamená atom kyslíku, připraveny ze sloučenin obecného vzorce I, ve kterém R^2 znamená skupinu $-\text{OH}$, reakcí s odpovídající bází.

Podle dalšího znaku vynálezu mohou být sloučeniny obecného vzorce I, ve kterém R^2 znamená skupinu $-\text{OH}$, připraveny hydrolýzou sloučenin obecného vzorce I, ve kterém R^2

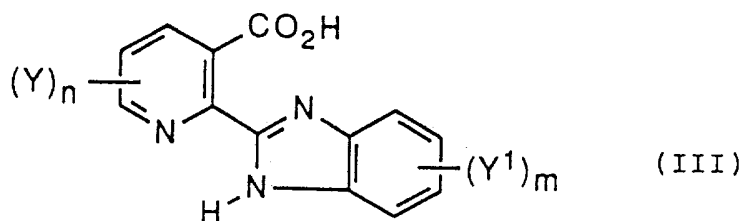
znamená skupinu -XM, za použití anorganické báze, například hydroxidu lithného, ve směsi vody a alkoholu, například methanolu, při teplotě 0 až 25 °C.

Meziprodukty pro přípravu sloučenin obecného vzorce I se připraví použitím modifikovaných známých metod. Sloučeniny obecného vzorce Ia, ve kterém A^1 znamená atom vodíku a R^2 znamená skupinu -XM nebo skupinu NR^7R^8 , mohou být připraveny reakcí sloučeniny obecného vzorce II



s alkoxidem alkalického kovu nebo alkoxidem kovu alkalických zemin obecného vzorce XMM' , ve kterém M' znamená kationt alkalického kovu nebo kovu alkalických zemin, v aprotickém rozpouštědle při teplotě 0 °C až teplotě varu rozpouštědla, nebo s alkoholem, thiolem nebo oximem obecného vzorce $H-XM$, nebo s aminem obecného vzorce HNR^7R^8 . Reakce s $H-XM$ nebo HNR^7R^8 se obecně provádí v polárním organickém rozpouštědle v přítomnosti činidla vázajícího kyselinu, jakým je pyridin nebo triethylamin.

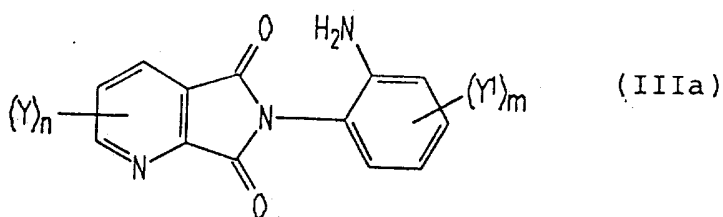
Sloučeniny obecného vzorce Ia, ve kterém A^1 znamená atom vodíku a R^2 znamená skupinu -XM nebo $-NR^7R^8$, mohou být připraveny reakcí sloučeniny obecného vzorce III



s alkoholem, thiolem nebo oximem obecného vzorce $H-XM$ nebo aminem obecného vzorce HNR^7R^8 v přítomnosti kopulačního činidla, jakým je například N,N -dicyklohexylkarbodiimid, v přítomnosti inertního rozpouštědla, jakým je dichlormethan, při teplotě $0^\circ C$ až teplotě varu pod zpětným chladičem použitého rozpouštědla.

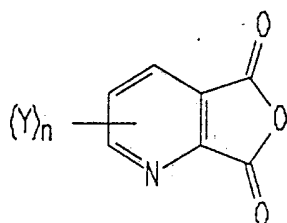
Sloučeniny obecného vzorce Ia, ve kterém A^1 znamená atom vodíku a R^2 znamená skupinu $-XM$, ve které X znamená atom kyslíku a M má výše uvedený význam s výjimkou skupiny $-N=CR^9R^{10}$, mohou být připraveny reakcí sloučeniny obecného vzorce III se sloučeninou obecného vzorce $H-OM$ v přítomnosti plynného chlorovodíku, přičemž sloučenina obecného vzorce $H-OM$ plní rovněž funkci rozpouštědla a tato reakce se provádí za podmínek velmi dobře známých esterifikačních postupů.

Sloučeniny obecného vzorce Ia, ve kterém A^1 znamená atom vodíku a R^2 znamená skupinu $-XM$, ve které X znamená atom kyslíku a M má výše uvedený význam s výjimkou skupiny $-N=CR^9R^{10}$, mohou být připraveny zahříváním sloučeniny obecného vzorce IIIa

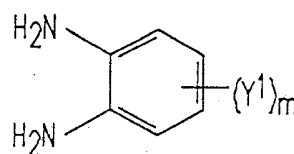


ve výše vroucí sloučenině obecného vzorce H-OM, ve kterém M má výše uvedený význam, například v ethoxyethanolu, při teplotě 50 °C až teplotě varu pod zpětným chladičem použitého rozpouštědla.

Sloučeniny obecného vzorce II mohou být získány reakcí anhydridu obecného vzorce IV s 1,2-fenylendiaminem obecného vzorce V



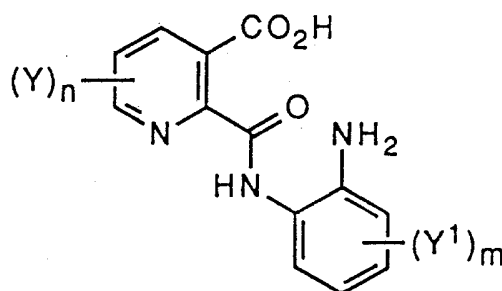
(IV)



(V)

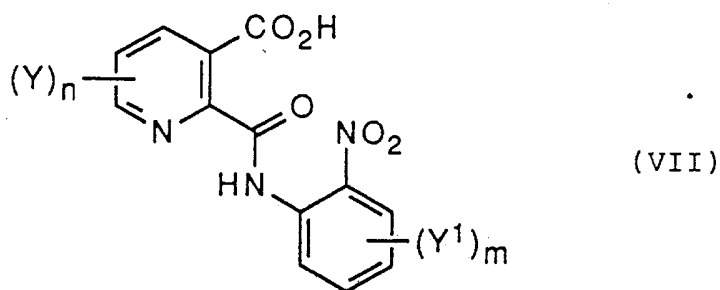
zahříváním na teplotu 110 až 190 °C po dobu 1 až 3 hodin buď v nepřítomnosti rozpouštědla nebo v rozpouštědle, jakým je například xylen, dichlorbenzen nebo kyselina octová, následným přidáním anhydridu kyseliny octové a zahříváním na teplotu 70 °C až teplotu varu použitého rozpouštědla.

Sloučeniny obecného vzorce III mohou být připraveny cyklizací sloučenin obecného vzorce VI



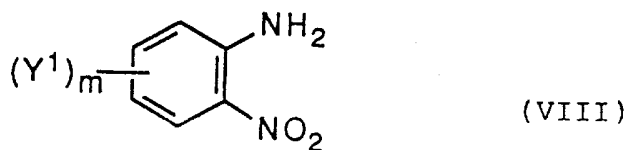
(VI)

Tato reakce může být provedena v anorganickém rozpouštědle, jakým je ethoxyethanol, zahříváním na teplotu varu pod zpětným chladičem. Sloučeniny obecného vzorce VI mohou být získány reakcí anhydridu obecného vzorce IV s 1,2-fenylendi-aminem obecného vzorce V v inertním organickém rozpouštědle, například v chloroformu, při teplotě 0 °C až teplotě varu pod zpětným chladičem použitého rozpouštědla. Sloučeniny obecného vzorce VI mohou být rovněž získány redukcí sloučenin obecného vzorce VII



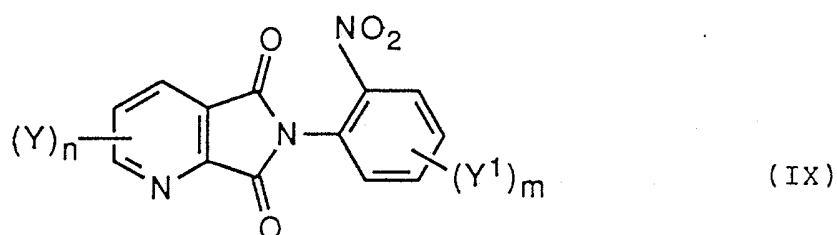
Tato reakce může být provedena v ethanolu v přítomnosti chlorovodíku a jemně rozemletého železa při teplotě 20 až 70 °C.

Sloučeniny obecného vzorce VII mohou být získány reakcí anhydridu obecného vzorce IV s 2-nitroanilinem obecného vzorce VIII



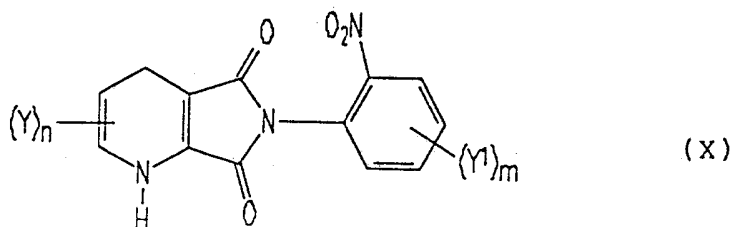
v organickém rozpouštědle, například v chloroformu nebo tetrahydrofuranu, při teplotě 20 °C až teplotě varu použitého rozpouštědla.

Sloučeniny obecného vzorce IIIa mohou být připraveny redukcí sloučenin obecného vzorce IX



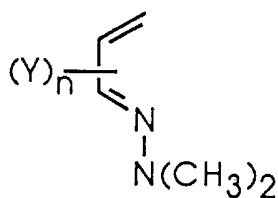
v ethanolu v přítomnosti chlorovodíku a jemně rozemletého železa při teplotě 20 až 70 °C, nebo ve směsi ethanolu a vody v přítomnosti sirníku sodného při teplotě 20 °C až teplotě varu směsi rozpouštědel.

Sloučeniny obecného vzorce IV, ve kterém n znamená 1, mohou být připraveny oxidací dihydropyridinu obecného vzorce X

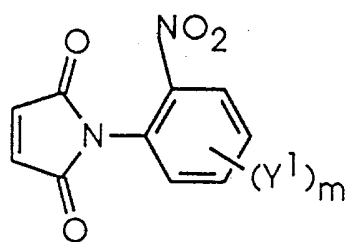


ve kterém n znamená 1, v přítomnosti oxidačního činidla, jakým

je oxid manganičitý v organickém rozpouštědle, jakým je kyselina octová, při teplotě 20 až 80 °C. Tato oxidace může být alternativně provedena za použití síry v inertním uhlovodíkovém rozpouštědle, jakým je například toluen, zahříváním na teplotu varu rozpouštědla pod zpětným chladičem. Sloučeniny obecného vzorce X, ve kterém n znamená 1, mohou být získány reakcí azabutadienu obecného vzorce XI, ve kterém n znamená 1, s maleinimidem obecného vzorce XII



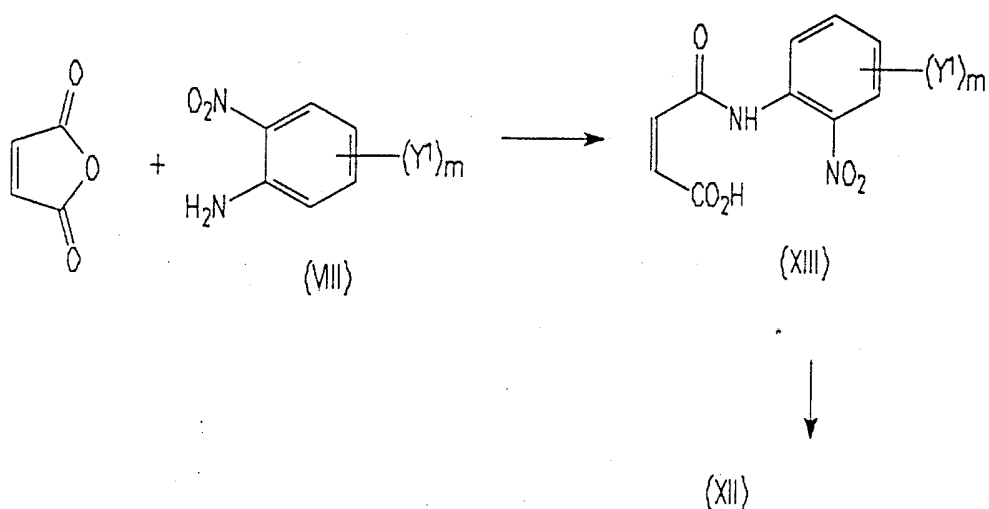
(XI)



(XII)

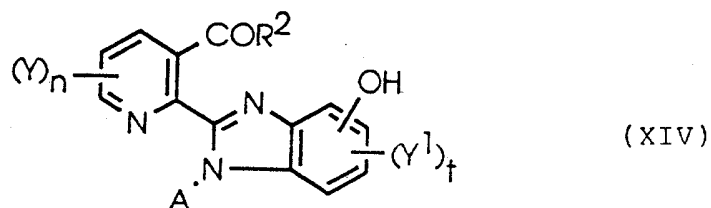
v polárním aprotickém rozpouštědle, například v acetonitrilu, při teplotě 0 až 40 °C a následným zpracováním reakční směsi za použití silikagelu.

Maleinimid obecného vzorce XII může být připraven reakcí 2-nitroanilinu obecného vzorce VIII s anhydridem kyseliny maleinové v organickém rozpouštědle, například v chloroformu, zahříváním na teplotu varu rozpouštědla pod zpětným chladičem a následnou cyklizací meziprojektu obecného vzorce XIII zahříváním v kyselině octové na teplotu varu pod zpětným chladičem v přítomnosti octanu sodného:



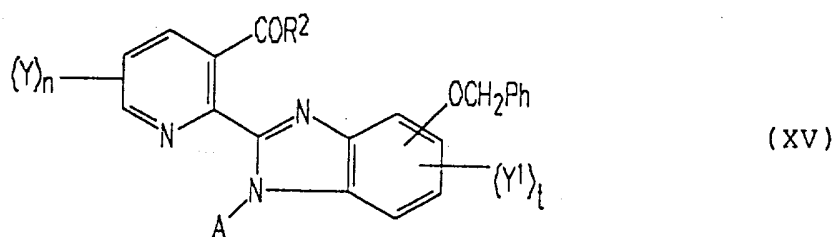
Azabutadieny obecného vzorce XI, ve kterém m znamená 1, mohou být získány postupem, popsáným Waldner-em a kol. v Helvetica Chimica Acta, 1988, 71, 493.

Podle dalšího znaku vynálezu mohou být sloučeniny obecného vzorce I, ve kterém m znamená 1 nebo 2, jedna ze skupin Y¹ znamená skupinu -OR^{1a}, která zaujímá polohu 4 nebo polohu 5 benzimidazolového kruhu, R² znamená skupinu -X-M, ve které X znamená kyslík a M znamená přímou nebo rozvětvenou alkylovou skupinu obsahující nejvýše 8 uhlíkových atomů, nebo cykloalkylovou skupinu obsahující 3 až 6 uhlíkových atomů a skupina Y má výše uvedený význam s výjimkou alkenylové skupiny nebo alkinylové skupiny, atomu chloru, atomu bromu nebo atomu jodu, připraveny reakcí hydroxybenzimidazolu obecného vzorce XIV



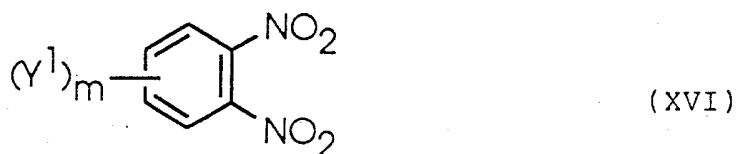
ve kterém t znamená 0 nebo 1 a hydroxy-skupina zaujímá polohu 4 nebo polohu 5 benzimidazolového kruhu, se sloučeninou obecného vzorce $R^{1a}-L$, ve kterém L znamená odštěpitelnou skupinu, například tosylovou skupinu nebo atom halogenu (například atom chloru, atom bromu a atom jodu) za účelem převedení hydroxy-skupiny v poloze 4 nebo poloze 5 benzimidazolového kruhu na skupinu $-OR^{1a}$. Tato reakce se obecně provádí v přítomnosti báze, jakou je uhličitán draselný, v inertním organickém rozpouštědle, například v acetonu nebo dimethylformamidu, při teplotě 90°C až teplotě varu rozpouštědla pod zpětným chladičem.

Sloučeniny obecného vzorce XIV mohou být připraveny hydrogenolýzou benzyloxybenzimidazolu obecného vzorce XV



ve kterém t znamená nulu nebo 1, v protickém rozpouštědle, jakým je methanol, v přítomnosti vodíku nebo donoru vodíku, jakým je 1,4-cyklohexadien, a hydrogenačního katalyzátoru, jakým je například paladium na uhlí. Tato reakce se obecně provádí při okolní teplotě a za atmosférického tlaku. Sloučeniny obecného vzorce XV mohou být připraveny použitím výše popsaných metod.

1,2-Fenylendiaminy obecného vzorce V mohou být získány redukcí nitroanilinů obecného vzorce VIII nebo dinitrobenzenů obecného vzorce XVI



Tato redukce může být provedena polárním protickém rozpouštědle, například ve směsi ethanolu a vody, v přítomnosti sirníku sodného při teplotě 20 °C až teplotě varu použitého rozpouštědla, nebo v kyselině chlorovodíkové v přítomnosti chloridu cínatého při teplotě 40 až 90 °C.

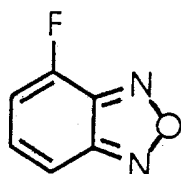
Diaminy obecného vzorce V, ve kterých m znamená 1 a Y¹ znamená skupinu -OR^{1a} v poloze 3 benzenového kruhu, mohou být připraveny redukcí 2,1,3-benzoxadiazolu obecného vzorce XVII



ve kterém Y¹ znamená skupinu -OR^{1a}. Tato redukce může být provedena ve směsi vody a methanolu zahříváním na teplotu varu pod zpětným chladičem v přítomnosti kyseliny chlorovodíkové a jemně rozemletého železa.

Sloučeniny obecného vzorce XVII, ve kterém Y¹ znamená

skupinu $-OR^{1a}$, mohou být připraveny reakcí 4-fluor-2,1,3-benzoxadiazolu vzorce XVIII



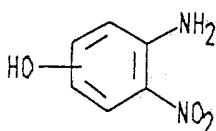
(XVIII)

s alkoholem obecného vzorce $H-OR^{1a}$. Tato reakce se typicky provádí v acetonu v přítomnosti báze, jakou je uhličitan draselný, při teplotě $0^{\circ}C$ až teplotě varu pod zpětným chladičem použitého rozpouštědla.

Konverze 4-fluor-2,1,3-benzoxadiazolu obecného vzorce XVIII na sloučeninu obecného vzorce XVII, ve kterém Y^1 znamená skupinu $-OR^{1a}$, se vhodně provádí reakcí uvedeného 4-fluor-2,1,3-benzoxadiazolu s alkokidem obecného vzorce $M'-OR^{1a}$, ve kterém M' znamená kationt alkalického kovu (například kationt sodíku nebo draslíku) za použití odpovídajícího alkoholu obecného vzorce $H-OR^{1a}$ jakožto reakčního rozpouštědla při teplotě $20^{\circ}C$ až teplotě varu použitého alkoholu.

4-Fluor-2,1,3-benzoxadiazol vzorce XVIII může být připraven postupem, popsáním L.Di Nunno a kol v Journal of the Chemical Society (C), 1433, 1970.

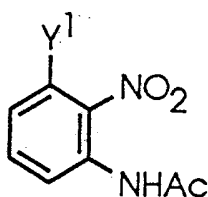
Nitroaniliny obecného vzorce VIII, ve kterém m znamená 1 a Y^1 znamená skupinu $-OR^{1a}$, mohou být připraveny alkylací aminonitrofenolu obecného vzorce XIX.



(XIX)

působením alkylačního činidla obecného vzorce R^{1a} -halogen (ve kterém halogen například znamená atom chloru, atom bromu nebo atom jodu) v přítomnosti báze jakou je například uhličitán draselný, v inertním rozpouštědle, například v acetonu nebo v dimethylformamidu, při teplotě 0°C až teplotě varu použitého rozpouštědla pod zpětným chladičem.

Nitroaniliny obecného vzorce VIII, ve kterém m znamená 1 a skupina Y^1 zaujímá polohu 3 benzenového kruhu, mohou být připraveny hydrolýzou acetanilidů obecného vzorce XX



(XX)

Tato hydrolýza se obecně provádí ve vodném roztoku hydroxidu sodného v alkoholickém rozpouštědle, jakým je ethanol, při teplotě 25°C až teplotě varu rozpouštědla pod zpětným chladičem.

Acetanilidy obecného v zorce XX, ve kterém Y^1 znamená

skupinu $-OR^{1a}$, mohou být připraveny přesmykem 3-nitro-skupiny ve 2,3-dinitroacetanilidu působením alkoholu $H-OR^{1a}$. Reakce 2,3-dinitroacetanilidu s alkoholy se obvykle provádí za použití alkoholu $H-OR^{1a}$ jakožto rozpouštědla v přítomnosti alespoň jednoho ekvivalentu odpovídajícího alkoxidu obecného vzorce $Z-OR^{1a}$, ve kterém Z znamená sodík, draslík nebo lithium, při teplotě $20^{\circ}C$ až teplotě varu použitého rozpouštědla.

2,3-Dinitroacetanilidy mohou být připraveny za použití postupu, popsaného F.L.Greenwood-em a kol. v Journal of Organic Chemistry, 797, 20, 1955.

2-Nitroaniliny obecného vzorce VIII, dinitrobenzeny obecného vzorce XIV a anhydridy obecného vzorce IV jsou buď známé nebo mohou být připraveny použitím známých metod nebo použitím vhodně modifikovaných známých metod.

Sloučeniny obecného vzorce Ia jsou novými sloučeninami a jako takové tvoří rovněž součást vynálezu.

V následující části popisu bude vynález blíže objasněn pomocí konkrétních příkladů jeho provedení, přičemž tyto příklady mají pouze ilustrační charakter a nikterak neomezuji rozsah vynálezu, který je jednoznačně vymezen formulací patentových nároků. Příprava sloučenin obecného vzorce I podle vynálezu je ilustrována v příkladech zatímco příprava meziproduktů je ilustrována v referenčních příkladech. Pokud není výslovně uvedeno jinak, jsou všechna procentická množství hmotnostními procentickými množstvími.

Příklady provedení vynálezu

Příklad 1

Příprava kyseliny 2-/1-N,N-dimethylsulfamoyl-4-(2-propenyl-oxy)benzimidazol-2-yl/pyridin-3-karboxylové
(sloučenina 1)

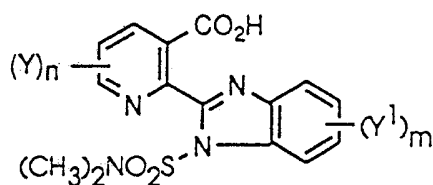
K míchané suspenzi methyl-2-/1-N,N-dimethylsulfamoyl-4-(2-propenyloxy)benzimidazol-2-yl/pyridin-3-karboxylátu (2,22 g) v methanolu (20 ml) se při okolní teplotě přidá roztok hydroxidu lithného (0,67 g) ve vodě. Po 45 minutovém míchání se methanol odpaří a zbytek se zředí vodou a postupně promyje ethylacetátem a diethyletherem. Vodný roztok se potom okyselí a získaný gumovitý produkt se extrahuje ethylacetátem, vysuší a odpaří, čímž se získá požadovaná sloučenina ve formě bílého pevného produktu.

Výtěžek produktu: 2,1 g (98 %),

teplota tání: 80-83 °C.

Z odpovídajících výchozích sloučenin se stejným způsobem získají následující produkty, jejich chemické struktury a teploty tání jsou uvedeny v tabulce 1.

Tabulka 1



Sloučenina číslo	n	Y	m	Y1	Teplota tání(°C)
2	1	6-CH ₃	1	4-OCH ₂ CH=CH ₂	141.6-147.5
3	1	5-CH ₃	1	4-OCH ₂ CH=CH ₂	101-104
4	1	5-C ₂ H ₅	1	4-OCH ₂ CH=CH ₂	137-145
5	2	5-CH=CH-CH=CH-6	1	4-OCH ₂ CH=CH ₂	133-135
6	0	.	1	4-OCH ₂ C≡CH	174-175

Tabulka 1 (pokračování)

7	1	6-CH ₃	1	4-OCH ₂ C≡CH	232-234
8	1	5-CH ₃	1	4-OCH ₂ C≡CH	147-149
9	2	5-CH=CH-CH=CH-6	1	4-OCH ₂ C≡CH	180 dec.
10	1	5-C ₂ H ₅	1	4-OCH ₂ C≡CH	160-161
11	0	-	1	4-OCH ₂ C≡CCH ₃	104-107
12	2	5-CH=CH-CH=CH-6	1	4-OCH ₂ C≡CCH ₃	176-178
13	0	-	1	5-OCH ₂ C≡CH	134.5-134.7

Příklad 2

Příprava methyl-2-/1-N,N-dimethylsulfamoyl-4-(2-propenyloxy)-benzimidazol-2-yl/pyridin-3-karboxylátu
(sloučenina 16)

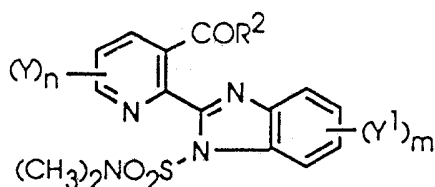
Směs bezvodého uhličitanu draselného (11,2 g) a methyl-2-/4-(2-propenyloxy)-1H-benzimidazol-2-yl/pyridin-3-karboxylátu (10 g) v acetonitrilu se za míchání zahřívá k varu pod zpětným chladičem po dobu dvou hodin. Potom se přidá dimethylsulfamoylchlorid (11,63 g) a směs se zahřívá na teplotu varu pod zpětným chladičem po dobu 12 hodin. Po ochlazení a filtraci se odpaří rozpouštědlo a získaný olej se roztře s etherem. Takto získaný pevný produkt se přečistí chromatograficky, čímž se získá požadovaná sloučenina ve formě bílého pevného produktu.

Výtěžek: 3,2 g (23 %),
teplota tání 127-128 °C.

Za použití odpovídajících výchozích látek se stejným

způsobem získají sloučeniny, jejichž chemické struktury, teploty tání a nukleární magnetickorezonanční spektra jsou uvedeny v následující tabulce 2.

Tabulka 2



Sloučenina číslo	n	Y	m	Y ¹	R ² **	Teplota tání(°C)
-	1	6-CH ₃	1	4-OCH ₂ CH=CH ₂	M	neizolován
14	1	5-CH ₃	1	4-OCH ₂ CH=CH ₂	P	107-111
-	1	5-C ₂ H ₅	1	4-OCH ₂ CH=CH ₂	M	guma NMR(a)
-	2	5-CH=CH-CH=CH-6	1	4-OCH ₂ CH=CH ₂	M	guma NMR(b)
-	0	-	1	4-OCH ₂ C≡CH	M	170.5-171.5
-	1	6-CH ₃	1	4-OCH ₂ C≡CH	M	neizolován
-	1	5-CH ₃	1	4-OCH ₂ C≡CH	P	107-111
-	2	5-CH=CH-CH=CH-6	1	4-OCH ₂ C≡CH	M	175-176
-	1	5-C ₂ H ₅	1	4-OCH ₂ C≡CH	P	guma NMR(c)
-	0	-	1	4-OCH ₂ C≡CCH ₃	M	166-167
-	2	5-CH=CH-CH=CH-6	1	4-OCH ₂ C≡CCH ₃	M	175-176
-	0	-	1	5-OCH ₂ C≡CH	M	NMR(d)

Poznámka:

** v tabulce pro R²: M znamená -OCH₃, P znamená -OCH₂Y ≡ CH.

H^1 NMR.

(a) (DMSO- d_6) δ = 1.25 (3H, t), 2.70 (6H, s), 3.65 (3H, s), 4.75 (2H, d), 5.3 (1H, d), 5.4 (1H, dd), 6.10 (1H, m), 7.0 (1H, d), 7.4 (1H, t), 7.5 (1H, d), 8.3 (1H, s), 8.8 (1H, s) ppm.

(b) (DMSO- d_6) δ = 2.85 (6H, s), 3.75 (3H, s), 4.80 (2H, d), 5.30 (1H, d), 5.45 (1H, d), 6.1 (1H, m), 7.00 (1H, d), 7.4 (1H, t), 7.5 (1H, d), 7.85 (1H, t), 8.00 (1H, t), 8.10 (1H, d), 8.35 (1H, d), 9.20 (1H, s) ppm.

(c) (CDCl₃) δ = 1.37 (3H, t), 2.20 (1H, t), 2.50 (1H, t), 2.83 (2H, q), 2.88, (6H, s), 4.55 (2H, d), 4.98 (2H, d), 7.00 (1H, d), 7.33 (1H, t), 7.57 (1H, t), 8.30 (1H, d), 8.68 (1H, d) ppm.

(d) (DMSO- d_6) δ = 2.85 (6H, s), 3.60 (1H, t), 3.68 (3H, s), 4.41 (2H, d), 7.15 (1H, dd), 7.48 (1H, d), 7.77 (2H, m), 8.45 (1H, d), 8.90 (1H, d) ppm.

Příklad 3

Příprava isopropylamonium-2-/1-(N,N-dimethylsulfamoyl-4-(2-propenyloxy)benzimidazol-2-yl/pyridin-3-karboxylát
(sloučenina 15)

K míchanému roztoku kyseliny 2-/1-(N,N-dimethylsulfamoyl-4-(2-propenyloxy)benzimidazol-2-yl/pyridin-3-karboxylové (0,4 g) v acetonu (10 ml) se přidá isopropylamin (0,1 ml). Získaný roztok se míchá po dobu 10 minut, načež se odpaří, čímž se získá bílý pěnový produkt, který se rozetře s hexanem za vzniku požadované sloučeniny ve formě bílého hygroskopického pevného produktu.

Výtěžek: 0,36 g (78 %),

teplota tání: 95-100 °C (za rozkladu).

Referenční příklad 1

Příprava 7-(2-propenyloxy)pyrido/2',3':3,4/pyrrolo/1,2-a/benz-

imidazol-5-onu

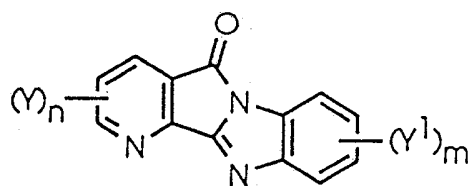
Roztok anhydridu kyseliny chinolinové (127 g) a 3-(2-propenyloxy)-1,2-benzendiaminu (140 g) v ledové kyselině octové se zahřívá na teplotu varu pod zpětným chladičem pod inertní atmosférou po dobu 3 hodin. Reakční směs se potom ochladí, přidá se anhydrid kyseliny octové a reakční směs se znovu zahřívá na teplotu varu pod zpětným chladičem po dobu 3 hodin. Po ponechání v klidu při okolní teplotě po dobu 48 hodin se vyloučená krystalická sraženina odfiltruje a vysuší, čímž se získá požadovaná sloučenina ve formě žlutavě červenohnědého pevného produktu.

Výtěžek: 23 %,

teplota tání: 174,5 °C.

Za použití odpovídajících výchozích látek se stejným způsobem získají sloučeniny, jejichž struktury a teploty tání, resp. nukleární magnetickorezonanční spektra jsou uvedeny v následující tabulce 3.

Tabulka 3



n	Y	m	Y ¹	Teplota tání(°C)
1	2-CH ₃	1	7-OCH ₂ CH=CH ₂	NMR(1)
1	3-CH ₃	1	7-OCH ₂ CH=CH ₂	194-196
1	3-C ₂ H ₅	1	7-OCH ₂ CH=CH ₂	171.5-173.5
0	-	1	7-OCH ₂ C≡CH	170
1	2-CH ₃	1	7-OCH ₂ C≡CH	203-205

Tabulka 3 (pokračování)

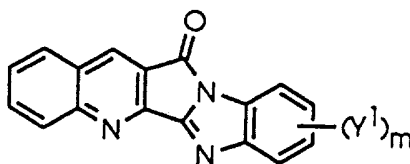
1	3-CH ₃	1	7-OCH ₂ C≡CH	neizolován
1	3-C ₂ H ₅	1	7-OCH ₂ C≡CH	neizolován
0	-	1	7-OCH ₂ C≡CCH ₃	240-242
0	-	1	8(9)-OCH ₂ C≡CH	neizolován

H¹ NMR.

(l) (CDCl₃) d= 2.6 (3H, s), 4.85 (2H, d), 5.3 (1H, d), 5.5 (1H, d),
6.0-6.2 (1H, m), 6.9 (1H, m), 7.3 (2H, m), 7.4 (1H, d), 8.1 (1H, d) ppm.

Stejným způsobem se z anhydridu kyseliny chinolin-2,3-dikarboxylové a odpovídajícího 1,2-benzendiaminu získají sloučeniny, jejich chemické struktury a teploty tání, resp. nukleární magnetickorezonanční spektra jsou uvedeny v následující tabulce 4.

Tabulka 4



m	Y ¹	Teplota tání (°C)
1	4-OCH ₂ CH=CH ₂	NMR (m)
1	4-OCH ₂ C=CH	247-248
1	4-OCH ₂ C=CCH ₃	269-270

H^1 NMR.

(m) (DMSO- d_6) δ = 4.85 (2H, d), 5.35 (1H, d), 5.50 (1H, d), 6.10 (1H, m), 6.95 (1H, d), 7.40 (2H, m), 7.75 (1H, t), 7.95 (1H, t), 8.15 (2H, t), 8.95 (1H, s) ppm.

Referenční příklad 2

Příprava methyl-2-/4-(2-propenyloxy)-1H-benzimidazol-2-yl/-pyridin-3-karboxylátu

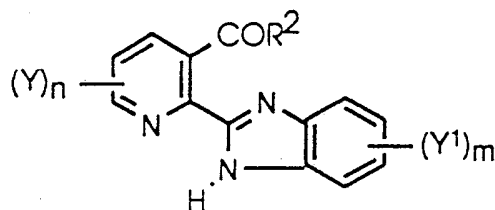
Směs 7-(2-propenyloxy)pyrido/2',3':3,4/pyrrolo/1,2-a/-benzimidazol-5-onu (54 g), triethylaminu (22 g) a methanolu v dichlormethanu se míchá při okolní teplotě po dobu 12 hodin. Roztok se potom postupně promyje vodou, 0,5M kyselinou chlorovodíkovou, 0,5M roztokem hydroxidu sodného a solankou. Po vysušení se rozpouštědlo odpaří, čímž se získá požadovaná sloučenina ve formě bílého pevného produktu.

Výtěžek: 34,4 g (57 %),

teplota tání: 122,5-124 °C.

Za použití odpovídajících výchozích látek se stejným způsobem získají sloučeniny, jejichž chemické struktury a teploty tání, resp. nukleární magnetickorezonanční spektra jsou uvedeny v následující tabulce 5.

Tabulka 5



n	Y	m	Y ¹	R ² **	Teplota tání (°C)
1	6-CH ₃	1	4-OCH ₂ CH=CH ₂	M	NMR (e)
1	5-CH ₃	1	4-OCH ₂ CH=CH ₂	P	90-92
1	5-C ₂ H ₅	1	4-OCH ₂ CH=CH ₂	M	guma NMR (f)
2	5-CH=CH-CH=CH-6	1	4-OCH ₂ CH=CH ₂	M	NMR (g)
0	-	1	4-OCH ₂ C≡CH	M	74-76
1	6-CH ₃	1	4-OCH ₂ C≡CH	M	70-72
1	5-CH ₃	1	4-OCH ₂ C≡CH	P	136.8-141.2
2	5-CH=CH-CH=CH-6	1	4-OCH ₂ C≡CH	M	NMR (h)
1	5-C ₂ H ₅	1	4-OCH ₂ C≡CH	P	guma NMR (i)
0	-	1	4-OCH ₂ C≡CCH ₃	M	guma NMR (j)
2	5-CH=CH-CH=CH-6	1	4-OCH ₂ C≡CCH ₃	M	guma NMR (k)
0	-	1	5-OCH ₂ C≡CH	M	neizolován

Poznámka**

V tabulce pro R²: M znamená -OCH₃, P znamená -OCH₂C = CH.

¹H NMR.

(e) (CDCl₃) d= 2.6 (3H, s), 4.0 (3H, s), 4.3 (2H, m), 5.2-5.5 (2H, m), 6.1 (1H, br m), 6.7 (1H, d), 7.1-7.3 (3H, m), 7.4 (1H, br s), 7.8 (1H, d) ppm.

(f) (CDCl₃) d= 1.25 (3H, t), 2.65 (2H, q), 3.95 (3H, s), 4.70 (2H, d), 5.30 (1H, d), 5.40 (1H, d), 6.00 (1H, m), 6.65 (1H, d), 7.05 (1H, t), 7.20 (1H, d), 7.60 (1H, d), 8.45 (1H, d) ppm.

(g) (CDCl₃) d= 4.00 (3H, s), 4.75 (2H, d), 5.25 (1H, d), 5.40 (1H, d),
6.10 (1H, m), 6.05 (1H, d), 7.10 (1H, t), 7.2 (1H, m), 7.55 (1H, t), 7.70 (1H, t),
7.80 (1H, d), 8.05 (1H, d), 8.30 (1H, s) ppm.

(h) (CDCl₃) d= 2.55 (1H, t), 4.05 (3H, s), 5.00 (2H, br s), 6.85 (1H, d),
7.20 (1H, t), 7.30 (1H, br d), 7.60 (1H, t), 7.80 (1H, t), 7.85 (1H, d), 8.10 (1H, d),
8.35 (1H, s) ppm.

(i) (CDCl₃) d= 1.25 (3H, t), 2.40 (1H, t), 2.45 (1H, t), 2.70 (2H, q),
4.90 (2H, d), 5.05 (2H, d), 6.75 (1H, d), 7.10 (1H, t), 7.20 (1H, d), 7.65 (1H, d),
8.45 (1H, d) ppm.

(j) (CDCl₃) d= 1.90 (3H, s), 4.00 (3H, s), 4.80 (2H, s), 6.52 (1H, d),
7.20 (1H, d), 7.25-7.45 (2H, m), 7.87 (1H, d), 8.70 (1H, m), 10.05 ppm.

(k) (CDCl₃) d= 1.85 (3H, s), 3.90 (3H, s), 5.05 (2H, s), 6.80 (1H, d),
7.20 (2H, m), 7.77 (1H, t), 7.98 (1H, t), 8.17 (2H, t), 8.70 (1H, s), 13.20 (1H, br
s) ppm.

Referenční příklad 3

Příprava 3-(2-propenyloxy)-1,2-benzendiaminu

Směs 2-nitro-6-(2-propenyloxy)benzenaminu (19,4 g) a
sirníku sodného (50 g) v ethanolu a vodě se zahřívá na teplo-
tu varu pod zpětným chladičem po dobu 12 hodin. Rezultující
hnědý roztok se potom zahustí za sníženého tlaku a extrahuje
ethylacetátem. Sloučené extrakty se promyjí solankou, vysuší
a odpaří, čímž se získá požadovaná sloučenina ve formě hnědé
kapaliny.

Výtěžek: 12,9 g,

¹H NMR (CDCl₃): d= 3,5(4H, b s),
4,6(2H, d),
5,3-5,5(2H, dd),

6,0-6,2(1H,m),
6,4(2H,m),
6,7(1H,t) ppm.

Stejným způsobem se připraví následující sloučeniny:

3-(2-propinyloxy)-1,2-benzendiamin,
 H^1 NMR (DMSO D_6) δ = 3,52(1H,t),
4,3(4H,br s),
4,69(2H,d),
6,26(1H,d),
6,30(1H,d),
4,48 ppm;

4-(2-propinyloxy)-1,2-benzendiamin ve formě hnědého oleje.

Referenční příklad 4

Příprava 2-nitro-6-(2-propenyloxy)benzenaminu

K míchanému roztoku 2-amino-3-nitrofenolu (4,62 g, připraven postupem popsáním E.Fourneau a J.Trefouel-em v Bull. Soc. Chim. France, 1927, 41, 448) v acetonu se po částech přidá bezvodý uhličitán draselný (4,14 g). Potom se přidá allylbromid (3,63 g) a směs se zahřívá na teplotu varu pod zpětným chladičem pod inertní atmosférou. Po ochlazení se reakční směs nalije do vody a extrahuje ethylacetátem. Organická vrstva se postupně promyje 2N roztokem uhličitanu sodného, 2N roztokem hydroxidu sodného a solankou. Organické extrakty se vysuší nad síranem hořečnatým a potom odpaří, čímž se získá požadovaná sloučenina ve formě tmavé kapaliny.

Výtěžek: 5 g,

H^1 NMR ($CDCl_3$): δ = 4,6(2H,d),
5,3(2H,m),
6,0-6,2(1H,m),
6,4(2H,b s),
6,6(1H,t),
6,9(1H,d),
7,8(1H,d) ppm.

Stejným způsobem se připraví následující sloučeniny:

2-nitro-6-(2-propinyloxy)benzenamin,

teplota tání: 72-73 °C;

2-nitro-4-(2-propinyloxy)benzendiamin,

teplota tání: 105,5-106,5 °C.

Referenční příklad 5

Příprava 3-(2-butyloxy)-1,2-benzendiaminu

K míchané suspenzi železného prášku (23,5 g) a 4-(2-butyloxy)-2,1,3-benzoxadiazolu (13,2 g) v 50% vodném roztoku ethanolu (70 ml) se přidá roztok koncentrované kyseliny chlorovodíkové (3 ml) v 50% vodném roztoku ethanolu (9 ml) a směs se zahřívá na teplotu varu pod zpětným chladičem po dobu 24 hodin. Reakční směs se potom zalkalizuje ještě za horka na hodnotu pH 10 přidáním 15% roztoku hydroxidu draselného v ethanolu. Reakční směs se potom za horka zfiltruje a filtrát se odpaří k suchu. Černý zbytek se rozpustí ve vodě, roztok se zfiltruje a filtrát se extrahuje dichlormethanem. Po vysušení a odpaření organické fáze se získá požadovaná sloučenina ve formě temně hnědého oleje.

Výtěžek: 10,35 g (84 %),

$^1\text{H NMR}$ (DMSO- d_6)	$\delta = 1,83(3\text{H}, \text{s}),$
	$4,00(2\text{H}, \text{br s}),$
	$4,50(2\text{H}, \text{br s}),$
	$4,64(2\text{H}, \text{s}),$
	$6,28(2\text{H}, \text{m}),$
	$6,38(1\text{H}, \text{t})\text{ppm}.$

Stejným způsobem se připraví 3-(but-3-in-1-oxy)-1,2-benzendiamin.

$^1\text{H NMR}$ (DMSO- d_6)	$\delta = 2,38(1\text{H}, \text{br s}),$
	$2,55(2\text{H}, \text{m}),$
	$3,8(4\text{H}, \text{m}),$
	$4,3(2\text{H}, \text{br s}),$
	$6,2(2\text{H}, \text{m}),$
	$6,3(1\text{H}, \text{m})\text{ppm}.$

Referenční příklad 6

Příprava 4-(2-butyloxy)-2,1,3-benzoxadiazolu

K míchané suspenzi bezvodého uhličitanu draselného (0,75 g) ve 2-butan-1-olu (0,38 g) a acetonu (5 ml) se přidá 4-fluor-2,1,3-benzoxadiazolu (0,5 g). Reakční směs se potom míchá při okolní teplotě po dobu 3 hodin, načež se zahřívá na teplotu varu pod zpětným chladičem po dobu 20 hodin. Reakční směs se potom nechá vychladnout, nalije se do vody a extrahuje se etherem. Etherové extrakty se sloučí, promyjí vodou, vysuší a odpaří, čímž se získá požadovaná sloučenina ve formě světležlutého pevného produktu.

Výtěžek: 0,44 g (65 %),

^1H NMR (DMSO- d_6):
d= 1,88(3H,t),
5,05(2H,q),
6,92(1H,m),
7,57(2H,m)ppm.

Stejným způsobem se připraví 4-(but-3-in-1-oxy)-2,1,3-benzoxadiazol.

^1H NMR (DMSO- d_6):
d= 2,49(1H,t),
2,78(2H,m),
4,35(2H,t),
6,90(1H,d),
7,5(2H,m)ppm.

Předmětem vynálezu je rovněž způsob kontroly růstu plevelů (tj. nežádoucí vegetace) v dané lokalitě, jehož podstata spočívá v tom, že se do uvedené lokality aplikuje herbicidně účinné množství alespoň jednoho benzimidazolylového derivátu obecného vzorce I nebo jeho zemědělsky přijatelné soli. Za tímto účelem se uvedené benzimidazolylové deriváty normálně používají ve formě herbicidních kompozic (tj. v kombinaci s kompatibilními ředidly nebo nosiči a/nebo povrchově aktivními činidly vhodnými pro použití v herbicidních kompozicích), jejichž příklady budou uvedeny dále.

Sloučeniny obecného vzorce I vykazují herbicidní účinnost vůči dvouděložním (tj. širokolistým) a jednoděložním (tj. travním) plevelům při preemergentní a/nebo postemergentní aplikaci.

Pod pojmem "preemergentní aplikace" se rozumí aplikace do půdy, ve které jsou přítomná semena nebo semenáče, a to ještě před vzejitím plevelů nad povrch půdy. Pod pojmem "postemergentní aplikace" se rozumí aplikace na vzdušné nebo obnažené části plevelů, které již vzešly nad povrch půdy. Sloučeniny obecného vzorce I mohou být například použity pro kontrolu růstu:

širokolistých plevelů, jakými například jsou:

Abutilon theophrasti,
Amaranthus retroflexus,
Bidens pilosa,
Chenopodium album,
Galium aparine,
Ipomoea spp, například *Ipomoea purpurea*,
Sesbania exaltata,
Sinapis arvensis,
Solanum nigrum a
Xanthium strumarium, a

travních plevelů, jakými například jsou:

Alopecurus myosuroides,
Avena fatua,
Digitaria sanguinalis,
Echinochloa crus-galli,
Eleusine indica a
Setaria spp, například *Setaria faberii* nebo *Setaria viridis*, a

šáchorovitých plevelů, jakým je například *Cyperus esculentus*.

Aplikovaná množství sloučenin obecného vzorce I se mění v závislosti na povaze plevele, použité herbicidní kompozici, době aplikace, klimatických a půdních podmínkách a (v případě

použití ke kontrole růstu plevelů na plochách, na kterých rostou užitkové plodiny) na povaze užitkových plodin. V případě, že se sloučeniny obecného vzorce I aplikují na plochy, na kterých rostou užitkové plodiny, potom musí být aplikační dávka dostatečná k tomu, aby došlo k vyhubení plebele, avšak bez podstatného permanentního poškození užitkové plodiny. Jestliže se respektují tyto faktory, potom aplikační dávky od 0,01 do 5 kg účinné látky na hektar poskytují dobré výsledky. Je však samozřejmé, že mohou být použity i vyšší nebo nižší aplikační dávky, což závisí na každém daném konkrétním problému hubení plevelů, který je třeba řešit.

Sloučeniny obecného vzorce I mohou být použity pro selektivní kontrolu růstu plevelů, například pro kontrolu růstu výše zmíněných plevelových druhů, preemergentní nebo postemergentní aplikací směřovaným nebo nesměrovaným způsobem, například směřovaným nebo nesměrovaným postřikem, na lokalitu zamořenou plevelem, kterou je plocha použitá nebo určená k růstu užitkových plodin, například obilovin, zejména pšenice, ječmene, žita, kukuřice a rýže, sóji, polních a zakrslých fazolí, hrachu, vojtěšky, bavlny, podzemnice, lnu, cibule, mrkve, zelí, řepky olejnaté, slunečnice, cukrové řepy, nebo permanentní nebo setá lučina, a to před nebo po zasetí užitkové plodiny nebo před nebo po vzejití užitkové plodiny. Za účelem selektivní kontroly plevelů v lokalitě zamořené plevelem, kterou je plocha použitá nebo určená k růstu užitkových plodin, například k růstu výše uvedených užitkových plodin, jsou obzvláště vhodné aplikační dávky od 0,01 do 4,0 kg, výhodně od 0,01 do 2,0 kg, účinné látky na hektar zamořené lokality.

Sloučeniny obecného vzorce I mohou být rovněž použity pro kontrolu růstu plevelů, zejména pro kontrolu růstu výše zmíněných plevelových druhů, preemergentní nebo postemergentní aplikací v sadech nebo na jiných plochách s porostem stromů, jakými jsou například lesy, háje a parky, a plantáže, například plantáže cukrové třtiny, olejnaté palmy nebo kaučovníků. Za tímto účelem mohou být sloučeniny obecného vzorce

I aplikovaný směrovaným nebo nesměrovaným způsobem (například směrovaným nebo nesměrovaným postřikem) na plevely nebo na půdu, na které se očekává růst plevelů, a to před nebo po zasažení stromů nebo rostlin, v množství od 0,25 do 5,0 kg, výhodně od 0,5 do 4,0 kg, účinné látky na hektar zamořené lokality.

Sloučeniny obecného vzorce I mohou být rovněž použity pro kontrolu růstu plevelů, zejména pro kontrolu výše uvedených plevelových druhů, v lokalitě, která není plochou, na které rostou užitkové plodiny, avšak ve které není přesto růst plevelů žádoucí.

Příklady takových ploch, které nejsou použity ani určeny pro růst užitkových plodin, jsou letištní plochy, průmyslové pozemky, železniční násypy, krajnice silnic a břehy řek, závlahových kanálů a ostatní vodních kanálů, křovinatých pozemků, úhorů nebo neobdělávaných pozemků a zejména všechny plochy, na kterých není růst plevelů žádoucí vzhledem k možnosti vznícení a vzniku požáru. Pro tyto účely, kdy se požaduje totální herbicidní účinek, jsou aplikační dávky účinných sloučenin obvykle vyšší než aplikační dávky použité při aplikaci na plochy s pěstováním užitkových plodin. Přesné dávkování bude záviset na hustotě vegetace a na požadovaném stupni herbicidního účinku.

Při těchto aplikacích se dosáhne vhodných výsledků preemergentní nebo postemergentní aplikací, zejména preemergentní aplikací, směrovaným nebo nesměrovaným způsobem (například směrovaným nebo nesměrovaným postřikem) za použití aplikačních dávek od 1,0 do 20,0 kg, výhodně od 5,0 do 10,0 kg, účinné látky na hektar zamořené lokality.

V případě, že se kontrola růstu plevelů provádí preemergentní aplikací, potom mohou být sloučeniny obecného vzorce I inkorporovány do půdy, ve které se očekává vzejití plevelů. Je však třeba uvést, že v případě, kdy se sloučeniny obecného vzorce I použijí pro kontrolu růstu plevelů postemergentní aplikací, t.j. aplikací na vzdušné nebo obnažené části již vzešlých plevelů, potom sloučeniny obecného vzorce

I přichází rovněž do styku s půdou a mohou takto rovněž provádět premergentní kontrolu růstu později klíčících plevelů v půdě.

V případě, že je žádoucí dlouhodobá kontrola růstu plevelů, potom může být aplikace sloučenin obecného vzorce I případně zopakována.

Předmětem vynálezu je rovněž herbicidní kompozice vhodná pro výše uvedené herbicidní použití, jejíž podstata spočívá v tom, že obsahuje jeden nebo více benzimidazolylových derivátů obecného vzorce I nebo jejich zemědělsky přijatelných solí v kombinaci s jedním nebo více zemědělsky přijatelnými ředidly nebo nosiči, výhodně v dispergované formě v ředidle nebo nosiči, a/nebo povrchově aktivními činidly /tj. ředidly nebo nosiči a/nebo povrchově aktivními činidly typu, který je obecně akceptován jako vhodný pro použití v herbicidních kompozicích a který je kompatibilní se sloučeninami obecného vzorce I/. Pojem " v dispergované formě" zahrnuje kompozice, ve kterých jsou sloučeniny obecného vzorce I rozpuštěny v jiných složkách.

Výraz "herbicidní kompozice" je zde použit v širokém smyslu této specifikace a zahrnuje nejen kompozice , které jsou schopné použití jako herbicidy, ale také koncentráty, které musí být před použitím zředěny. Výhodně uvedené herbicidní kompozice obsahují od 0,05 do 90 % hmotnosti jedné nebo více sloučenin obecného vzorce I.

Uvedené herbicidní kompozice mohou obsahovat jak ředidlo nebo nosič, tak i povrchově aktivní činidlo (například smáčecí, dispergační nebo emulgační činidlo). Povrchově aktivní činidla, která mohou být použita v herbicidních kompozicích podle vynálezu, mohou být povrchově aktivními činidly iontového nebo neionogenního typu, jakými jsou například sulforicinooleáty, kvartérní amoniové deriváty, produkty založené na kondenzačních produktech ethylenoxidu s alkyl a polyarylfenoly, například nonyl- nebo oktylfenoly, nebo este-

ry karboxylových kyselin a anhydrosorbitolů, které se učiní rozpustnými etherifikací volných hydroxylových skupin kondenzací s ethylenoxidem, dále soli alkalických kovů a kovů alkalických zemin esterů kyseliny sírové a silfonových kyselin, například dinonyl- a dioktylnatriumsulfosukcináty, a soli alkalických kovů a kovů alkalických zemin vysokomolekulárních derivátů sulfonových kyselin, například lignosulfonát sodný nebo vápenatý a alkylbenzensulfonát sodný nebo vápenatý.

Herbicidní kompozice podle vynálezu mohou vhodně obsahovat až 10 % hmotnosti, například od 0,05 do 10 % hmotnosti, povrchově aktivního činidla, přičemž herbicidní kompozice podle vynálezu mohou obsahovat i vyšší množství povrchově aktivního činidla, například až 15 % hmotnosti v kapalných emulgovatelných suspensních koncentrátech a až 25 % hmotnosti v kapalných ve vodě rozpustných koncentrátech.

Příklady vhodných pevných ředidel nebo nosičů jsou křemičitan hlinitý, talek, kalcinovaná magnésie, křemelina, fosforečnan vápenatý, práškový korek, adsorpční saze a hlínky, zejména kaolin a bentonit. Pevné herbicidní kompozice (které mohou mít formu popraše, granulátu nebo smáčitelného prášku) se výhodně připraví společným rozemletím sloučenin obecného vzorce I s pevnými ředidly nebo impregnací pevných nosičů roztoky sloučenin obecného vzorce I v těkavých rozpouštědlech a odpařením rozpouštědel a případným rozemletím takto získaného produktu na prášek. Granulované formulace mohou být připraveny adsorpcí sloučenin obecného vzorce I (rozpuštěných ve vhodných rozpouštědlech, která mohou být případně těkavými rozpouštědly) na pevná ředidla nebo nosiče v granulované formě a následným případným odpařením rozpouštědel, nebo granulováním práškových výše uvedeným způsobem získaných herbicidních kompozic. Pevné herbicidní kompozice, zejména smáčitelné prášky a granuláty, mohou obsahovat smáčecí nebo dispergační činidla (například výše popsaných typů), která v případě, že jsou pevná, mohou rovněž sloužit jako ředidla nebo nosiče.

Kapalné herbicidní kompozice podle vynálezu mohou mít formu vodných, organických nebo vodně-organických roztoků, suspenzí a emulzí, ve kterých může být zabudováno povrchově aktivní činidlo. Vhodnými kapalnými ředidly, která mohou být použita v kapalných herbicidních kompozicích podle vynálezu, jsou voda, glykoly, tetrahydrofurfurylalkohol, acetofenon, cyklohexanon, isoforon, toluen, xylen, minerální, živočišné a rostlinné oleje a lehké aromatické a naftenické frakce ropy (a směsi těchto ředidel). Povrchově aktivní činidla, která mohou být použita v kapalných kompozicích, mohou být povrchově aktivními činidly iontového nebo neionogenního typu (například povrchově aktivními činidly, které již byly popsány výše) a mohou v případě, že jsou kapalná, sloužit rovněž jako ředidla nebo nosiče.

Prášky, dispergovatelné granuláty a kapalné kompozice ve formě koncentrátů mohou být zředěny vodou, nebo jinými vhodnými ředidly, například minerálními nebo rostlinnými oleji, zejména v případě kapalných koncentrátů, ve kterých je ředidlem nebo nosičem olej, za vzniku herbicidní kompozice, která je schopna použití.

Je-li to žádoucí, může být kapalná kompozice sloučeniny obecného vzorce I použita ve formě samo-emulgačních koncentrátů obsahujících účinné látky rozpuštěné v emulgačních činidlech nebo rozpouštědlech obsahujících emulgační činidla kompatibilní s účinnými látkami, přičemž se pouhým přidáním vody k takovému koncentrátu získá herbicidní kompozice schopná použití.

Kapalné koncentráty, ve kterých je ředidlem nebo nosičem olej, mohou být použity bez dalšího ředění za použití elektrostatické rozprašovací techniky.

Herbicidní kompozice podle vynálezu mohou rovněž obsahovat v případě potřeby konvenční přísady, jakými jsou adheziva, ochranné koloidy, zahušťovadla, penetrační činidla, stabilizátory, sekvestrační činidla, činidla proti vylučo-

vání fází ze směsi, kolorační činidla a inhibitory koroze. Tyto přísady mohou rovněž sloužit jako nosiče nebo ředidla.

Pokud není výslovně uvedeno jinak, jsou následující procentické údaje hmotnostními procentickými údaji. Výhodnými herbicidními kompozicemi podle vynálezu jsou :

vodné suspenzní koncentráty, které obsahují od 10 do 70 % jedné nebo několika sloučenin obecného vzorce I, od 2 do 10 % povrchově aktivního činidla, od 0,1 do 5 % zahušťovadla a od 15 do 87,9 % vody;

smáčitelné prášky, které obsahují od 10 do 90 % jedné nebo několika sloučenin obecného vzorce I, od 2 do 10 % povrchově aktivního činidla a od 8 do 88 % pevného ředidla nebo nosiče;

ve vodě rozpustné nebo ve vodě dispergovatelné prášky, které obsahují od 10 až 99 % jedné nebo několika sloučenin obecného vzorce I, od 2 do 40 % uhličitanu sodného a od 0 do 88 % pevného ředidla;

kapalné ve vodě rozpustné koncentráty, které obsahují od 5 do 50 %, například od 10 do 30 %, jedné nebo několika sloučenin obecného vzorce I, od 5 do 25 % povrchově aktivního činidla a od 25 do 90 %, například 45 až 85 %, s vodou mísitelného rozpouštědla, jakým je například dimethylformamid, nebo směsi s vodou mísitelného rozpouštědla a vody;

kapalné emulgovatelné suspenzní koncentráty, které obsahují od 10 do 70 % jedné nebo několika sloučenin obecného vzorce I, od 5 do 15 % povrchově aktivního činidla, od 0,1 do 5 % zahušťovadla a od 10 do 84,8 % organického rozpouštědla;

granuláty, které obsahují od 1 do 90 %, například 2 až 10 %, jedné nebo několika sloučenin obecného vzorce I, od 0,5 do 7 %, například 0,5 až 2 %, povrchově aktiv-

ního činidla a od 3 do 98,5 %, například 88 až 97,5 %, granulovaného nosiče a

emulgovatelné koncentráty, které obsahují 0,05 až 90 %, výhodně od 1 do 60 %, jedné nebo více sloučenin obecného vzorce I, od 0,01 do 10 %, výhodně od 1 do 10 %, povrchově aktivního činidla a od 9,99 do 99,94 %, výhodně od 39 do 98,99 %, organického rozpouštědla.

Herbicidní kompozice podle vynálezu mohou rovněž obsahovat sloučeniny obecného vzorce I v kombinaci, výhodně v homogenně dispergované formě, s jednou nebo více pesticidně účinnými sloučeninami a případně s jedním nebo více pesticidně přijatelnými ředidly nebo nosiči, povrchově aktivními činidly a výše uvedenými konvenčními přísadami. Příklady dalších pesticidně účinných sloučenin, kterou mohou být zahrnuty v herbicidních kompozicích podle vynálezu nebo které mohou být použity současně s herbicidními kompozicemi podle vynálezu, jsou herbicidy (například za účelem zvětšení spektra kontrolovaných plevelů), například:

alachlor, tj. 2-chlor-2',6'-diethyl-N-(methoxymethyl)acetanilid,
atrazine, tj. 2-chlor-4-ethylamino-6-isopropylamino-1,3,5-triazin,
bromoxynil, tj. 3,5-dibrom-4-hydroxybenzonitril,
chlortoluron, tj. N'-(3-chlor-4-methylfenyl)-N,N-dimethylmočovina,
cyanazin, tj. 2-chlor-4-(1-kyano-1-methylethylamino)-6-ethylamino-1,3,5-triazin,
2,4-D, tj. kyselina 2,4-dichlorfenoxycetová,
dicamba, tj. kyselina 3,6-dichlor-2-methoxybenzoová,
difenzoquat, tj. 1,2-dimethyl-3,5-difenylpyrazoliové soli,
flampropmethyl, tj. methyl-N-2-(N-benzoyl-3-chlor-4-fluorani-lino)propionát,
fluometuron, tj. N'-(3-trifluormethylfenyl)-N,N-dimethylmočovina,

isoproturon, tj. N'-(4-isopropylfenyl)-N,N-dimethylmočovina, nicosulfuron, tj. 2-(4',6'-dimethoxypyrimidin-2'-ylkarbamoyl-sulfamoyl)-N,N-dimethylnikotinamid,

insekticidy, například syntetické pyrethroidy, například permethrin a cypermethrin, a

fungicidy, například karbamáty, například methyl-N-(1-butylkarbamoylbenzimidazol-2-yl)karbamát, a triazoly, například 1-(4-chlorfenoxy)-3,3-dimethyl-1-(1,2,4-triazol-1-yl)butan-2-on.

Pesticidně účinné sloučeniny nebo jiné biologicky účinné materiály, které mohou být zahrnuty do kompozic podle vynálezu nebo které mohou být použity současně s herbicidními kompozicemi podle vynálezu, jakými jsou například výše uvedené sloučeniny, a které jsou kyselé, mohou být případně použity ve formě konvenčních derivátů, například ve formě solí alkalických kovů, amoniových solí a esterů.

Předmětem vynálezu je rovněž výrobek, který obsahuje alespoň jeden benzimidazolylový derivát obecného vzorce I nebo výhodně výše popsanou herbicidní kompozici a výhodně herbicidní koncentrát, který musí být před použitím zředěn, v zásobníku pro výše uvedený derivát nebo deriváty obecného vzorce I nebo herbicidní kompozici a návod, který je fyzicky připojen k uvedenému zásobníku a který obsahuje informace o tom, jakým způsobem má být uvnitř obsažený derivát nebo deriváty obecného vzorce I nebo uvedená herbicidní kompozice použit, resp. použita za účelem kontroly růstu plevelů. Uvedený zásobník bude obvyklým zásobníkem, který je používán pro skladování chemických látek, které jsou při normální okolní teplotě pevné, a herbicidních kompozic, zejména ve formě koncentrátů, a který má obvyklou formu plechovky, která může na vnitřní straně nalakována, nebo nádoby z plastické hmoty nebo skla a v případě, že je obsah zásobníku pevný a je například tvořen granulovanou herbicidní kompozicí, potom může mít zásobník formu krabice z lepenky, plastické hmoty nebo plechu nebo pytle. Tento zásobník bude mít dostatečný obsah k tomu, aby

pojmul množství benzimidazolylového derivátu nebo herbicidní kompozice, potřebné k ošetření alespoň jednoho akru pozemku za účelem kontroly růstu plevelu, avšak neměl by mít větší velikost, než je velikost, která je ještě vhodná pro nenáročnou manipulaci s takovým zásobníkem. Návod bude se zásobníkem fyzicky spojen například tak, že bude natištěn přímo na zásobníku nebo na štítku, který bude na zásobníku nalepen nebo který bude spojen se zásobníkem ve formě visačky. Instrukce obsažené v tomto návodu budou uvádět, že obsah zásobníku se po případném zředění aplikuje za účelem kontroly růstu plebele v aplikační dávce od 0,01 do 20 kg účinné látky na hektar způsobem, který je v návodu popsán.

V následující části popisu budou uvedeny příklady herbicidních kompozic podle vynálezu.

Příklad C1

Rozpustný koncentrát má následující složení:

účinná látka (sloučenina 1)	20 % hm./obj.
33% (hm./obj.) roztok hydroxidu draselného	10 % obj./obj.
tetrahydrofurfurylalkohol	10 % obj./obj.
voda	do 100 objemů.

Tento koncentrát se připraví mícháním tetrahydrofurfurylalkoholu, účinné látky (sloučenina 1) a 90 % z celkového použitého objemu vody a pomalým přidáváním roztoku hydroxidu draselného až k dosažení stálé hodnoty pH 7-8, načež se objem doplní vodou.

Stejným způsobem mohou být připraveny i ostatní koncentráty tak, že se použitý benzimidazolylový derivát (sloučenina 1) nahradí ostatními sloučeninami obecného vzorce I.

Příklad C2

Smáčitelný prášek má následující složení:

účinná látka	50 % hm./hm.
dodecylbenzensulfonát sodný	3 % hm./hm.
lignosulfonát sodný	5 % hm./hm.
formaldehydalkylnaftalensulfonát sodný	2 % hm./hm.
mikrojemný oxid křemičitý	3 % hm./hm.
kaolin	37 % hm./hm..

Tento smáčitelný prášek se připraví smíšením uvedených složek a semletím uvedené směsi ve vzduchovém tryskovém mlýnu.

Stejným způsobem mohou být připraveny i další smáčitelné prášky tak, že se použitý benzimidazolylový derivát (sloučenina 1) nahradí ostatními sloučeninami obecného vzorce I.

Příklad C3

Ve vodě rozpustný prášek má následující složení:

účinná látka (sloučenina 1)	50 % hm./hm.
dodecylbenzensulfonát sodný	1 % hm./hm.
mikrojemný oxid křemičitý	2 % hm./hm.
hydrogenuhlíčitan sodný	62 % hm./hm.

Ve vodě rozpustný prášek se připraví smíšením uvedených složek a rozemletím směsi v kladivovém mlýnu.

Stejným způsobem mohou být připraveny i další ve vodě rozpustné prášky tak, že se použitý benzimidazolylový derivát (sloučenina 1) nahradí ostatními sloučeninami obecného vzorce I.

V následující části popisu je uvedeno použití reprezentativních sloučenin obecného vzorce I při herbicidních aplikacích.

Způsoby použití herbicidních sloučenin

a) Obecná metodika

Vhodná množství sloučenin použitých pro ošetření rostlin

se rozpustí v acetonu za vzniku roztoků ekvivalentních aplikačním dávkám 4000 g testované sloučeniny na hektar. Tyto roztoky se potom aplikují za použití standardních laboratorních rozprašovačů uvolňujících 290 litrů postřiku kapaliny na hektar.

b) Preemergentní kontrola růstu plevelů

Semena rostlin byla zaseta do čtvercových plastických kořenáčů, majících délku strany 70 mm a hloubku 75 mm a naplněných nesterilní půdou. Do kořenáčů byla zaseta následující množství semen:

Přibližný počet semen/kořenáč	
<u>Plevelé</u>	
1) <u>širokolisté plevelé</u>	
Abutilon theophrasti	10
Amaranthus retroflexus	20
Galium aparine	10
Ipomoea purpurea	10
Sinapis arvensis	15
Xanthium strumarium	2
2) <u>travní plevelé</u>	
Alopecurus myosuroides	15
Avena fatua	10
Echinochloa crus-galli	15
Setaria viridis	20
3) <u>šáchorovité plevelé</u>	
Cyperus esculentus	3
<u>Užitkové plodiny</u>	
1) <u>širokolisté užitkové plodiny</u>	
Bavlna	3
Sója	3

Tabulka (pokračování)

2) travní užitkové plodiny

Kukuřice	2
Rýže	6
Pšenice	6

Sloučeniny podle vynálezu byly aplikovány na povrch půdy obsahující sena způsobem uvedeným v odstavci a). Pro každý plevel a každou užitkovou plodinu byl vyčleněn jeden kořenáč, který nebyl vystaven postřiku vůbec a jeden kořenáč, který byl vystaven postřiku samotného acetonu (kontrolní vzorky). Po provedeném postřiku se kořenáče umístí ve skleníku na kapilární rohož, kde se zavlažují zkrápěním. Po 24 dnech od aplikace testovaných sloučenin se vizuálně vyhodnotí poškození rostlin. Získané výsledky se vyjádří jako procentická redukce růstu plevelů nebo užitkových plodin ve srovnání se stavem rostlin v kontrolních kořenáčích.

c) Postemergentní kontrola růstu plevelů

Plevele a užitkové rostliny se zasejí do čtvercových kořenáčů, majících délku strany 70 mm a hlobku 75 mm a naplněných kořenáčovým kompostem (John Innes), s výjimkou plevelu *Amaranthus*, který se zasadí ve stádiu sazenice a převede se do kořenáčů týden před postřikem. Rostliny se potom nechají růst ve skleníku až do okamžiku, kdy jsou schopné postřiku testovanými sloučeninami. V jednotlivých kořenáčích byly následující počty rostlin v následujících růstových stádiích.

	Počet rostlin/kořenáč	Růstové stádium
<u>1) Širokolisté plevele</u>		
<i>Abutilon theophrasti</i>	3	1-2 listy
<i>Amaranthus retroflexus</i>	4	1-2 listy

Tabulka (pokračování)

Galium aparine	3	1. přeslen
Ipomoea purpurea	3	1-2 listy
Sinapis arvensis	4	2 listy
Xanthium strumarium	1	2-3 listy

2) Travní plevel

Alopecurus myosuroides	8-12	1-2 listy
Avena fatua	12-18	1-2 listy
Echinochloa crus-galli	4	2-3 listy
Setaria viridis	15-25	1-2 listy

3) Šáchorovité plevel

Cyperus esculentus	3	3 listy
--------------------	---	---------

1) Širokolisté užitkové plodiny

Bavlna	2	1 list
Sója	2	2 listy

2) Travní užitkové plodiny

Kukuřice	2	2-3 listy
Rýže	4	2-3 listy
Pšenice	5	2-3 listy

Sloučeniny použité k ošetření rostlin se aplikují na rostliny způsobem uvedeným v odstavci a). Pro každý plevel a každou užitkovou plodinu se vyhradí jeden kořenáč, který se nevystaví postřiku vůbec, a jeden kořenáč, který se vystaví postřiku samotného acetonu. Po provedeném postřiku se kořenáče uloží do skleníku na kapilární rohož, kde se zavlaží zkrápěním jednou po 24 hodinách a potom regulovanou spodní závlahou. 20 až 24 dnů po postřiku se provede vizuální vyhodnocení poškození rostlin. Získané výsledky se vyjádří jako procentická redukce růstu nebo poškození užitkových plodin nebo plevelů, ve srovnání s rostlinami v kontrolních kořenech.

Reprezentativní sloučeniny podle vynálezu, použité v aplikační dávce 4000 g/ha nebo v dávce nižší, vykazují znamenitou úroveň herbicidní účinnosti při výše popsaných testech, přičemž při preemergentní nebo postemergentní aplikaci způsobují 90% redukci růstu jednoho nebo více plevelových druhů a jsou dobře tolerovány jednou nebo více užitkovými plodinami.

Jestliže se sloučeniny 4, 5, 9, 11, 12, 14 a 15 aplikují preemergentně v aplikační dávce 1000 g/ha, způsobují tyto sloučeniny alespoň 90% redukci růstu jednoho nebo více plevelových druhů a jsou přitom tolerovány jednou nebo více užitkovými plodinami.

Jestliže se sloučeniny 2, 3, 5, 7, 8, 9, 12 a 14 aplikují postemergentně v aplikační dávce 1000 g/ha, způsobují tyto sloučeniny alespoň 90% redukci růstu jednoho nebo více plevelových druhů a jsou přitom tolerovány jednou nebo více užitkovými plodinami.

Jestliže jsou sloučeniny 1, 2, 3, 6, 7, 8 a 15 aplikovány preemergentně v aplikační dávce 1000 g/ha, způsobují tyto sloučeniny alespoň 90% redukci růstu všech plevelových druhů.

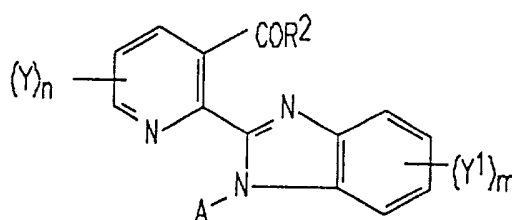
Jestliže se sloučeniny 1 a 6 aplikují postemergentně v aplikační dávce 250 g/ha, způsobují tyto sloučeniny alespoň 90% redukci růstu jednoho nebo více plevelových druhů a jsou tolerovány jednou nebo více užitkovými plodinami.

P A T E N T O V É

N Á R O K Y

PRÁČE
PROVÁDĚNÍ
OBJEVY
0198610
26 10 1

1. Benzimidazolylové deriváty obecného vzorce I



(I)

ve kterém

Y znamená
 přímou nebo rozvětvenou alkylovou, alkenylovou nebo
 alkinylovou skupinu s nejvýše 8 uhlíkovými atomy, kte-
 rá je případně substituována jednou nebo více skupina-
 mi R^1 , které mohou být totožné nebo odlišné,
 skupinu zvolenou z množiny zahrnující skupinu -OR,
 skupinu -SR, skupinu $-SO_2R^3$, atom halogenu, 0-arylovou
 skupinu, kyano-skupinu, skupinu $-NR^4R^5$, arylovou sku-
 pinu, aralkylovou skupinu nebo nitro-skupinu, nebo
 cykloalkylovou skupinu se 3 až 6 uhlíkovými atomy, kte-

je případně substituována jednou nebo více skupinami R^1 , které mohou být totožné nebo odlišné,

Y^1

znamená

přímou nebo rozvětvenou alkylovou, alkenylovou nebo alkinylovou skupinu s nejvýše 8 uhlíkovými atomy, která je případně substituována jednou nebo více skupinami R^1 , které mohou být totožné nebo odlišné, nebo cykloalkylovou skupinu se 3 až 6 uhlíkovými atomy, která je případně substituována jednou nebo více skupinami R^1 , které mohou být totožné nebo odlišné, nebo skupinu zvolenou z množiny zahrnující skupinu -SR, skupinu -OR, skupinu -OR^{1a}, atom halogenu, arylovou skupinu, aralkylovou skupinu, 0-arylovou skupinu nebo -NR⁷R⁸,

R^2

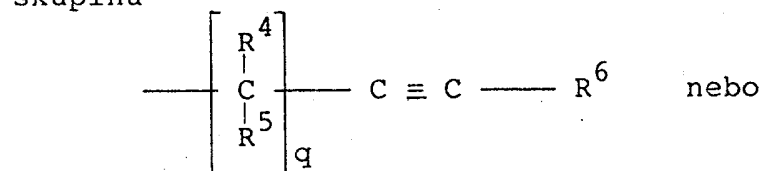
znamená

skupinu -OH nebo skupinu -NR⁷R⁸, nebo skupinu -X-M, ve které X znamená atom kyslíku nebo atom síry a

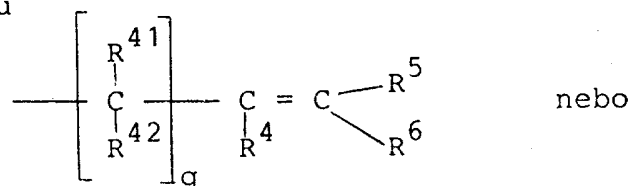
M

znamená

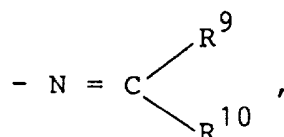
přímou nebo rozvětvenou alkylovou skupinu obsahující nejvýše 8 uhlíkových atomů, která je případně substituována jednou nebo více skupinami R^1 , které mohou být totožné nebo odlišné, nebo cykloalkylovou skupinu se 3 až 6 uhlíkovými atomy, která je případně substituována jednou nebo více skupinami R^1 , které mohou být totožné nebo odlišné, nebo skupinu zvolenou z množiny zahrnující arylovou skupinu a aralkylovou skupinu, nebo skupinu



skupinu



skupinu



A znamená skupinu $-SO_2B$,

B znamená

přímou nebo rozvětvenou alkylovou skupinu s nejvýše 6 uhlíkovými atomy, která je případně substituována jednou nebo více skupinami, které mohou být totožné nebo odlišné a které jsou zvolené z množiny zahrnující skupinu $-OR^3$, $-SR^3$ a atom halogenu, nebo cykloalkylovou skupinu obsahující 3 až 8 uhlíkových atomů, která je případně substituována jednou nebo více skupinami, které mohou být totožné nebo odlišné a které jsou zvoleny z množiny zahrnující skupinu $-OR^3$, $-SR^3$, R^3 a atom halogenu, nebo skupinu zvolenou z množiny zahrnující arylovou skupinu, aralkylovou skupinu a skupinu $-NR^7R^8$,

R znamená

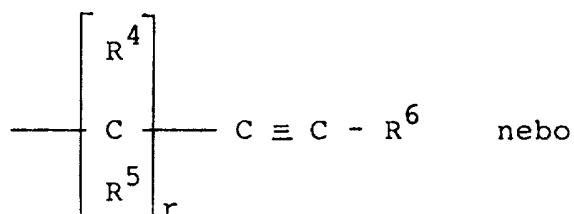
přímou nebo rozvětvenou alkylovou skupinu s nejvýše 8 uhlíkovými atomy, která je případně substituována jednou nebo více skupinami R^1 , které mohou být totožné nebo odlišné, nebo cykloalkylovou skupinu se 3 až 6 uhlíkovými atomy, která je případně substituována jednou nebo více skupinami R^3 , které mohou být totožné nebo odlišné,

R^1 znamená

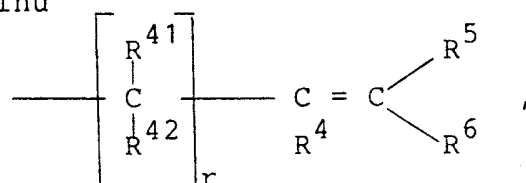
cykloalkylovou skupinu se 3 až 6 uhlíkovými atomy nebo skupinu zvolenou z množiny zahrnující skupinu $-OR^3$, skupinu $-SR^3$, atom halogenu, skupinu R^3 nebo 0-arylovou skupinu,

R^{1a} znamená

skupinu



skupinu



- R^3 znamená přímou nebo rozvětvenou alkylovou skupinu s nejvýše 6 uhlíkovými atomy, která je případně substituována jedním nebo více atomy halogenu, které mohou být totožné nebo odlišné,
- R^1 , R^{41} , R^{42} a R^5 , které mohou být totožné nebo odlišné, každý znamená atom vodíku nebo přímou nebo rozvětvenou alkylovou skupinu s nejvýše 6 uhlíkovými atomy, která je případně substituována jedním nebo více atomy halogenu, které mohou být totožné nebo odlišné,
- R^6 znamená skupinu zvolenou z množiny zahrnující skupinu R^4 a aralkylovou skupinu,
- R^7 a R^8 , které mohou být totožné nebo odlišné, každý znamená atom vodíku nebo skupinu zvolenou z množiny zahrnující skupinu R, skupinu $-OR^3$, skupinu $-SR^3$, atom halogenu, skupinu R^3 , 0-arylovou skupinu, arylovou skupinu nebo aralkylovou skupinu, nebo R^7 a R^8 mohou společně s atomem dusíku, ke kterému jsou vázány, tvořit heterocyklickou skupinu se 3 až 6 uhlíkovými atomy v kruhu a žádným, 1 nebo 2 heteroatomy v kruhu zvolenými z množiny zahrnující atom dusíku, atom kyslíku a atom síry,
- R^9 a R^{10} , které mohou být totožné nebo odlišné, každý znamená atom vodíku nebo přímou nebo rozvětvenou alkylovou skupinu s nejvýše 8 uhlíkovými atomy, která může být substituována jednou nebo více skupinami, které mohou být totožné nebo odlišné a které jsou zvoleny z množiny zahrnující atom halogenu, skupinu $-OR$ a skupinu $-S(O)_sR$, ve které s znamená nulu, 1 nebo 2, nebo fenylovou skupinu, která je případně substituována jednou až čtyřmi skupinami, které mohou být totožné nebo odlišné a které jsou zvoleny z množiny zahrnující nitro-skupinu, skupinu R,

skupinu $-NR^4R^5$, atom halogenu nebo skupinu $-S(O)_sR$,
nebo

5- nebo 6-člennou heterocyklickou skupinu obsahující
3 až 5 uhlíkových atomů v kruhu a jeden nebo více he-
teroatomů v kruhu zvolených z množiny zahrnující atom
dusíku, atom síry a atom kyslíku, například thienylo-
vou skupinu, furylovou skupinu, piperidylovou skupinu,
thiazolylovou skupinu, která je případně substituová-
na jednou nebo více skupinami R^1 , které mohou být to-
tožné nebo odlišné nebo

R^9 a R^{10} mohou společně s atomem dusíku, ke kterému
jsou vázány, tvořit heterocyklickou skupinu obsahující
4 nebo 5 uhlíkových atomů v kruhu, která může být pří-
padně substituována 1 až 3 skupinami R^3 , které mohou
být totožné nebo odlišné,

arylová skupina znamená

fenylovou skupinu, která je případně substituována 1
až 4 skupinami, které mohou být totožné nebo odlišné
a které jsou zvolené z množiny zahrnující skupinu $-OR^3$,
skupinu $-SR^3$, atom halogenu a skupinu R^3 , nebo

5- nebo 6-člennou heterocyklickou skupinu obsahující
3 až 5 uhlíkových atomů v kruhu a jeden nebo více he-
teroatomů v kruhu, které jsou zvolené z množiny zahrnu-
jící atom dusíku, atom síry a atom kyslíku, například
thienylovou skupinu, furylovou skupinu, piperidylovou
skupinu, thiazolylovou skupinu, která je případně sub-
stituována jednou nebo více skupinami, které mohou být
totožné nebo odlišné a které jsou zvoleny z množiny
zahrnující skupinu $-OR^3$, skupinu $-SR^3$, atom halogenu
a skupinu R^3 ,

aralkylová skupina znamená $-(CR^4R^5)_p$ -arylovou skupinu,
například benzylovou skupinu,

m znamená celé číslo od 1 do 4, přičemž skupiny Y^1 jsou
totožné nebo odlišné v případě, že m je větší než 1,

n znamená nulu nebo celé číslo od 1 do 3,

p znamená 1 nebo 2,

q znamená celé číslo od 1 do 3,

r znamená celé číslo od 1 do 5,
příčem v případě, že r , p nebo q je větší než 1, potom skupiny $-\text{CR}^4\text{R}^5-$ a skupiny $-\text{CR}^{41}\text{R}^{42}-$ mohou být totožné nebo odlišné,
s výhradou spočívající v tom, že jedna ze skupin Y^1 znamená skupinu $-\text{OR}^{1a}$ buď v poloze 4 nebo v poloze 5 benzimidazolového kruhu,
příčemž v případě, že n znamená 2 nebo 3, potom dvě skupiny Y , které jsou vzájemně přilehlé v poloze 5 a v poloze 6 pyridinového, tvoří společně s atomem uhlíku, ke kterému jsou připojeny, kondenzovaný fenylový kruh nebo mohou tvořit alifatický nebo aromatický kruh mající 5 nebo 6 atomů v kruhu a ne více než 2 heteroatomy v kruhu, které jsou zvoleny z množiny zahrnující atom kyslíku a atom síry, například thieno/2,3-b/pyridinový kruh, thieno/3,2-b/pyridinový kruh, furo/2,3-b/pyridinový kruh, furo/3,2-b/pyridinový kruh, 3,4-dihydropyrano/3,2-b/pyridinový kruh, 2,3-dihydropyrano/3,2-b/pyridinový kruh nebo 2,3-dihydropyrano/3,2-b/pyridinový kruh,
a jejich zemědělsky přijatelné soli.

2. Sloučenina podle nároku 1 obecného vzorce I, ve kterém
- a) A znamená skupinu $-\text{SO}_2\text{NR}^7\text{R}^8$ a/nebo
 - b) R^2 znamená skupinu $-\text{OH}$ nebo skupinu $-\text{XM}$ a/nebo
 - c) Y znamená alkylovou skupinu s 1 nebo 2 uhlíkovými atomy, která je případně substituována jedním nebo více atomy halogenu, například methylovou skupinu, ethylovou skupinu nebo trifluormethylovou skupinu a/nebo
 - d) Y^1 znamená skupinu $-\text{OR}$, například methoxylovou skupinu nebo ethoxylovou skupinu, nebo atom halogenu, například atom fluoru nebo atom chloru, nebo skupinu $-\text{OR}^{1a}$ nebo skupinu $-\text{NR}^7\text{R}^8$ a/nebo
 - e) m znamená 1 nebo 2 a/nebo
 - f) R^7 a R^8 , které mohou být totožné nebo odlišné, každý

znamená přímou nebo rozvětvenou alkylovou skupinu obsahující nejvýše 4 uhlíkové atomy, která je případně substituována jedním nebo více atomy, které mohou být totožné nebo odlišné a které jsou zvoleny z množiny zahrnující atom fluoru a atom chloru a/nebo

- g) X znamená atom kyslíku a/nebo
- h) R^4 , R^{41} , R^{42} , R^5 a R^6 , které mohou být totožné nebo odlišné, každý znamená atom vodíku nebo přímou nebo rozvětvenou alkylovou skupinu obsahující nejvýše 4 uhlíkové atomy, která je případně substituována jedním nebo více atomy halogenu a/nebo
- i) n znamená nulu, 1 nebo 2 a/nebo
- j) r znamená 1 nebo 2, nejvýhodněji 1,

příčemž ostatní obecné substituenty mají výše uvedený význam.

3. Sloučenina podle nároku 1 nebo 2 obecného vzorce I, ve kterém

- B znamená skupinu $-\text{SO}_2\text{NMe}_2$,
- R^2 znamená skupinu $-\text{OH}$ nebo skupinu $-\text{X-M}$,
- M znamená methylovou skupinu nebo 2-propinylovou skupinu nebo draselný nebo isopropylamoniový kationt,
- X znamená atom kyslíku,
- Y^1 znamená skupinu $-\text{OR}^{1a}$ v poloze 4 benzimidazolového kruhu,
- R^{1a} znamená 2-propenylovou skupinu, 2-propinylovou skupinu nebo 2-butylovou skupinu,
- Y znamená methylovou skupinu, ethylovou skupinu nebo dvě skupiny Y v poloze 5 a poloze 6 pyridinového kruhu tvo-

ří společně s atomem uhlíku, ke kterému jsou vázány, kondenzovaný fenylový kruh,

m znamená 1 a

n znamená 1 nebo 2.

4. Sloučenina podle nároku 1, 2 nebo 3, kterou je

kyselina 2-/1-(N,N-dimethylsulfamoyl)-4-(2-propenyloxy)-benzimidazol-2-yl/pyridin-3-karboxylová,

kyselina 2-/1-(N,N-dimethylsulfamoyl)-4-(2-propenyloxy)-benzimidazol-2-yl/-6-methylpyridin-3-karboxykarboxylová,

kyselina 2-/1-(N,N-dimethylsulfamoyl)-4-(2-propenyloxy)-benzimidazol-2-yl/-5-methylpyridin-3-karboxylová,

kyselina 2-/1-/N,N-dimethylsulfamoyl)-4-(2-propenyloxy)-benzimidazol-2-yl/-5-ethylpyridin-3-karboxylová,

kyselina 2-/1-(N,N-dimethylsulfamoyl)-4-(2-propenyloxy)-benzimidazol-2-yl/chinolin-3-karboxylová,

kyselina 2-/1-(N,N-dimethylsulfamoyl)-4-(2-propinyloxy)-benzimidazol-2-yl/pyridin-3-karboxylová,

kyselina 2-/1-(N,N-dimethylsulfamoyl)-4-(2-propinyloxy)-benzimidazol-2-yl/-6-methylpyridin-3-karboxylová,

kyselina 2-/1-(N,N-dimethylsulfamoyl)-4-(2-propinyloxy)-benzimidazol-2-yl/-5-methylpyridin-3-karboxylová,

kyselina 2-/1-(N,N-dimethylsulfamoyl)-4-(2-propinyloxy)-benzimidazol-2-yl/chinolin-3-karboxylová,

kyselina 2-/1-(N,N-dimethylsulfamoyl)-4-(2-propinyloxy)-benzimidazol-2-yl/-5-ethylpyridin-3-karboxylová,

kyselina 2-/1-(N,N-dimethylsulfamoyl)-4-(2-butyloxy)-benzimidazol-2-yl/pyridin-3-karboxylová,

kyselina 2-/1-(N,N-dimethylsulfamoyl)-4-(2-butyloxy)-
benzimidazol-2-yl/chinolin-3-karboxylová,

kyselina 2-/1-(N,N-dimethylsulfamoyl)-5-(2-propinyloxy)-
benzimidazol-2-yl/pyridin-3-karboxylová nebo jejich ze-
mědělsky přijatelná sůl nebo

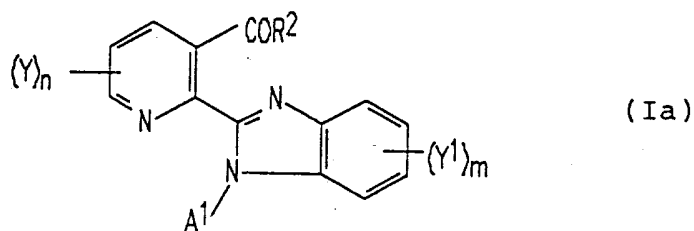
2-propinyl-2-/1-(N,N-dimethylsulfamoyl)-4-(2-propinyl-
oxy)benzimidazol-2-yl/-5-methylpyridin-3-karboxylát,

isopropylamonium-2-/1-(N,N-dimethylsulfamoyl)-4-(2-pro-
penyloxy)benzimidazol-2-yl/pyridin-3-karboxylát nebo

methyl-2-/1-N,N-dimethylsulfamoyl-4-(2-propenyloxy)-
benzimidazol-2-yl/pyridin-3-karboxylát.

5. Způsob přípravy sloučenin obecného vzorce I podle ná-
roku 1, v y z n a č e n ý t í m , že zahrnuje:

a) v případě, že R^2 znamená skupinu -XM nebo skupinu $-NR^7R^8$,
reakci sloučeniny obecného vzorce $ClSO_2B$ se sloučeninou obec-
ného vzorce Ia

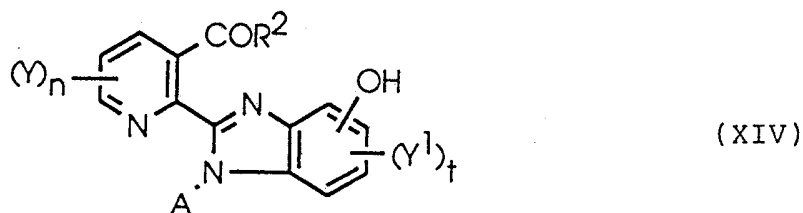


ve kterém A^1 znamená atom vodíku, R^2 znamená skupinu -XM ne-
bo skupinu $-NR^7R^8$ a ostatní obecné substituenty mají významy
uvedené v nároku 1, v přítomnosti činidla vázajícího kyselinu,

b) v případě, že R^2 znamená skupinu $-OH$, hydrolýzu sloučeniny obecného vzorce I, ve kterém R^2 znamená skupinu $-XM$,

c) v případě, že m znamená 1 nebo 2, jedna ze skupin Y^1 znamená skupinu $-OR^{1a}$, která zaujímá polohu 4 nebo polohu 5 benzimidazolového kruhu, R^2 znamená skupinu $-X-M$, ve které X znamená atom kyslíku a M znamená přímou nebo rozvětvenou alkylovou skupinu obsahující nejvýše 8 uhlíkových atomů, nebo cykloalkylovou skupinu obsahující 3 až 6 uhlíkových atomů a Y má význam uvedený v nároku 1 s výjimkou alkenylové skupiny, nebo alkinylové skupiny nebo atomu chloru, atomu bromu nebo atomu jodu,

reakci hydroxybenzimidazolu obecného vzorce XIV



ve kterém t znamená 0 nebo 1 a hydroxylová skupina zaujímá polohu 4 nebo polohu 5 benzimidazolového kruhu, se sloučeninou obecného vzorce $R^{1a}-L$, ve kterém L znamená odštěpitelnou skupinu, za účelem převedení hydroxy-skupiny v poloze 4 nebo v poloze 5 benzimidazolového kruhu na skupinu $-OR^{1a}$,

a případnou následnou konverzi takto získané sloučeniny na její sůl.

6. Herbicidní kompozice, v y z n a č e n á t í m , že jako účinnou složku obsahuje herbicidně účinné množství benzimidazolylového derivátu obecného vzorce I podle některého

z nároků 1 až 4 nebo jeho zemědělsky přijatelné soli v kombinaci se zemědělsky přijatelným ředidlem nebo nosičem a/nebo povrchově aktivním činidlem.

7. Herbicidní kompozice podle nároku 6, v y z n a č e n á t í m , že obsahuje 0,05 až 90 % hmotnosti účinné složky.

8. Herbicidní kompozice podle nároku 6 nebo 7, v y z n a č e n á t í m , že má kapalnou formu a že obsahuje 0,05 až 25 % hmotnosti povrchově aktivního činidla.

9. Herbicidní kompozice podle některého z nároku 6, 7 nebo 8, vyznačená tím, že má formu vodného suspenzního koncentrátu, smáčitelného prášku, ve vodě rozpustného nebo ve vodě dispergovatelného prášku, kapalného ve vodě rozpustného koncentrátu, kapalného emulgovatelného suspenzního koncentrátu, granulátu nebo emulgovatelného koncentrátu.

10. Způsob kontroly růstu plevelů v dané lokalitě, v y z n a č e n ý t í m , že se do uvedené lokality aplikuje herbicidně účinné množství benzimidazolylového derivátu obecného vzorce I podle některého z nároků 1 až 4 nebo jeho zemědělsky přijatelné soli.

11. Způsob podle nároku 10, v y z n a č e n ý t í m , že v případě, že je danou lokalitou plocha použitá nebo určená pro růst užitkových plodin, aplikuje se účinná sloučenina v množství 0,01 až 4,0 kg/ha.

12. Způsob podle nároku 10, v y z n a č e n ý t í m , že v případě, že uvedenou lokalitou je plocha, která není použita ani není určena pro růst užitkových plodin, aplikuje se účinná sloučenina v množství 1,0 až 20,0 kg/ha.

13. Sloučenina obecného vzorce Ia definovaná v nároku 4.

Zastupující
JUDr. J. TRÁPEČOVÁ
advokátka
17000 Praha 7, U Průhonu 36