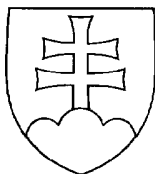


SLOVENSKÁ REPUBLIKA

(19)

SK



ÚRAD
PRIEMYSELNÉHO
VLASTNÍCTVA
SLOVENSKEJ REPUBLIKY

PATENTOVÝ SPIS

(11) Číslo dokumentu:

279 720

(21) Číslo prihlášky: 4007-88

(22) Dátum podania: 09.06.88

(31) Číslo prioritnej prihlášky: P 37 19 575.1,
P 38 03 523.5

(32) Dátum priority: 12.06.87, 05.02.88

(33) Krajina priority: DE, DE

(40) Dátum zverejnenia: 11.02.99

(45) Dátum zverejnenia udelenia vo Vestníku: 10.02.99

(86) Číslo PCT:

(13) Druh dokumentu: B6

(51) Int. C1⁶:

A 01N 43/653

A 01N 47/38

C 07D 249/12

C 07D 249/14

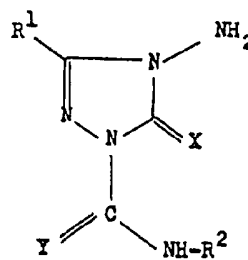
(73) Majiteľ patentu: BAYER AKTIENGESELLSCHAFT, Leverkusen, DE;

(72) Pôvodca vynálezu: Lindig Markus, Dr., Hilden, DE;
Findeisen Kurt, Dr., Odenthal, DE;
Müller Klaus-Helmut, Dr., Düsseldorf, DE;
Santel Hans-Joachim, Dr., Leverkusen, DE;
Schmidt Robert R., Dr., Berg.-Gladbach, DE;
Strang Harry, Dr., Düsseldorf, DE;
Feucht Dieter, Dr. Ing., Leverkusen, DE;

(54) Názov vynálezu: **Substituované triazolinóny, spôsob a medziprodukty na ich výrobu, ich použitie a herbicídny prostriedok s ich obsahom**

(57) Anotácia:

Nové zlúčeniny všeobecného vzorca (I), v ktorom R¹ je vodík, C₁₋₈-alkyl, C₃₋₇-cykloalkyl, halogén-C₁₋₄-alkyl alebo prípadne substituovaný C₆₋₁₀-aryl, R² je C₁₋₁₈-alkyl, C₂₋₈-alkenyl, C₂₋₈-alkinyl, halogén-C₁₋₈-alkyl, halogén-C₂₋₈-alkenyl, kyano-C₁₋₈-alkyl, C₁₋₆-alkoxy-C₁₋₆-alkyl, C₁₋₆-alkoxykarbonyl-C₁₋₆-alkyl, C₁₋₆-alkoxykarbonyl-C₂₋₆-alkenyl, C₁₋₆-alkylamino-C₁₋₆-alkyl, di-C₁₋₆-alkylamino-C₁₋₆-alkyl, prípadne substituovaný C₁₋₆-cykloalkyl alebo C₃₋₁₂-cykloalkyl-C₁₋₆-alkyl, prípadne substituovaný C₆₋₁₀-aryl-C₁₋₈-alkyl alebo C₆₋₁₀-aryl, X a Y znamenajú nezávisle od seba atóm kyslíka alebo atóm síry. Ďalej sa opisuje herbicídny prostriedok, ktorý ako účinnú zložku obsahuje aspoň jednu zlúčeninu všeobecného vzorca (I), v ktorom R¹ je C₁₋₄-alkyl alebo C₁₋₄-halogénalkyl, R² je C₁₋₁₀-alkyl, C₁₋₆-halogénalkyl, prípadne substituovaný C₃₋₁₂-cykloalkyl, C₂₋₈-alkinyl, prípadne substituovaný C₃₋₈-cykloalkyl-C₁₋₄-alkyl, X a Y znamenajú atóm kyslíka. Ďalej sa opisujú spôsoby výroby zlúčenín vzorca (I) a nové medziprodukty, ktoré sa pritom používajú.



(I)

Oblasť techniky

Vynález sa týka nových substituovaných triazolinónov, niekoľkých spôsobov ich prípravy a ich použitia ako herbicidov. Ďalej sa vynález týka nových medziproduktov, ktoré sa používajú pri výrobe uvedených nových substituovaných triazolinónov.

Doterajší stav techniky

Je známe, že určité heterocyklické zlúčeniny obsahujúce ako heteroatóm dusík, ako napríklad 4-amino-3-metyl-6-fenyl-1,2,4-triazín-5-ón alebo N-izobutyl-2-oximidazolidín-1-karboxamid (porov. napríklad DE-OS 23 64 474 a R. Wegler "Chemie der Pflanzenschutz- und Schädlingsbekämpfungsmittel, zv. 5, 219 (1977) majú herbicídne vlastnosti.

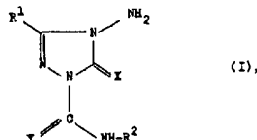
Herbicídna účinnosť týchto prv známych zlúčení proti burinám, ktoré sa dajú hubiť veľmi problematicky, nie je však rovnako ako ich znášanlivosť dôležitými kultúrnymi rastlinami úplne uspokojivá vo všetkých oblastiach použitia.

Ďalej sú známe určité substituované triazolinóny, ako napríklad 1-(N,N-dimetylkarbamoyl)-3-fenyl-4-amino-1,2,4-triazolín-5-ón (porov. J. Heterocycl. Chem. 17, 1691 - 1696 (1980), Org. Mass. Spectrom. 14, 369 - 378 (1979)).

O účinnosti týchto prv známych triazolinónov ako herbicidov však doteraz nebolo nič známe.

Podstata vynálezu

V súčasnosti boli nájdené nové substituované triazolinóny všeobecného vzorca (I)



v ktorom

R¹ znamená atóm vodíka, priamu alebo rozvetvenú alkylovú skupinu s 1 až 8 atómami uhlíka, cykloalkylovú skupinu s 3 až 7 atómami uhlíka v cykloalkylovej časti, prípadne aspoň raz, rovnako alebo rôzne atómom halogénu substituovanú arylovú skupinu so 6 až 10 atómami uhlíka alebo halogénalkylovú skupinu s 1 až 4 atómami uhlíka a s 1 až 9 rovnakými alebo rozdielnymi atómami halogénu,

R² znamená priamu alebo rozvetvenú alkylovú skupinu s 1 až 18 atómami uhlíka, alkenylovú skupinu s 2 až 8 atómami uhlíka, alkinylovú skupinu s 2 až 8 atómami uhlíka, halogénalkylovú skupinu s 1 až 8 atómami uhlíka a s 1 až 17 rovnakými alebo rozdielnymi atómami halogénu, halogénalkenylovú skupinu s 2 až 8 atómami uhlíka a s 1 až 15 rovnakými alebo rozdielnymi atómami halogénu, kyanoalkylovú skupinu s 1 až 8 atómami uhlíka, alkoxyalkylovú skupinu s 1 až 6 atómami uhlíka v alkoxylovej i alkylovej časti, alkoxykarbonylalkylovú skupinu so vždy s 1 až 6 atómami uhlíka v alkoxylovej i alkylovej časti, alkoxykarbonylalkenylovú skupinu s 1 až 6 atómami uhlíka v alkoxylovej časti a s 2 až 6 atómami uhlíka v alkenylovej časti, alkylaminoalkylovú skupinu s 1 až 6 atómami uhlíka v alkylových častiach, dialkylaminoalkylovú skupinu s 1 až 6 atómami uhlíka v alkylových častiach alebo vždy prípadne aspoň raz rovnako alebo rôzne sub-

stituovanú cykloalkylovú alebo cykloalkylalkylovú skupinu vždy s 3 až 12 atómami uhlíka v cykloalkylovej časti a s 1 až 6 atómami uhlíka v alkylovej časti s priamym alebo rozvetveným reťazcom, pričom ako substituenty prichádzajú do úvahy atóm halogénu, priama alebo rozvetvená alkylová skupina s 1 až 4 atómami uhlíka, halogénalkylová skupina s 1 až 4 atómami uhlíka, halogénalkylová skupina s 1 až 4 atómami uhlíka a s 1 až 9 rovnakými alebo rôznymi atómami halogénu alebo halogénalkenylová skupina s až 4 atómami uhlíka v priamom alebo rozvetvenom reťazci a s 1 až 5 rovnakými alebo rozdielnymi atómami halogénu,

ďalej R² znamená prípadne aspoň jednu, rovnako alebo rôzne substituovanú aralkylovú skupinu, alebo arylovú skupinu so 6 až 10 atómami uhlíka v arylovej časti a prípadne s 1 až 8 atómami uhlíka v priamej alebo v rozvetvenej alkylovej časti, pričom ako substituenty alkylovej skupiny prichádzajú prípadne do úvahy atómy halogénu a ako substituenty arylovej skupiny prichádzajú do úvahy atóm halogénu, priama alebo rozvetvená alkylová skupina s 1 až 6 atómami uhlíka, alebo alkoxy skupina s 1 až 6 atómami uhlíka,

X znamená atóm kyslíka alebo atóm síry a

Y znamená atóm kyslíka alebo atóm síry.

Predmetom predloženého vynálezu sú hlavne substituované triazolinóny všeobecného vzorca (I), v ktorom

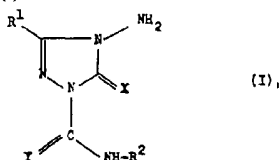
R¹ znamená atóm vodíka, priamu alebo rozvetvenú alkylovú skupinu s 1 až 8 atómami uhlíka, cykloalkylovú skupinu s 3 až 7 atómami uhlíka alebo prípadne aspoň raz, rovnako alebo rôzne atómom halogénu substituovanú arylovú skupinu so 6 až 10 atómami uhlíka, R² znamená priamu alebo rozvetvenú alkylovú skupinu s 1 až 18 atómami uhlíka, alkenylovú skupinu s 2 až 8 atómami uhlíka, alkinylovú skupinu s 2 až 8 atómami uhlíka, halogénalkylovú skupinu s 1 až 8 atómami uhlíka a s 1 až 17 rovnakými alebo rozdielnymi atómami halogénu, halogénalkenylovú skupinu s 2 až 8 atómami uhlíka a s 1 až 15 rovnakými alebo rozdielnymi atómami halogénu, kyanoalkylovú skupinu s 1 až 8 atómami uhlíka, alkoxyalkylovú skupinu s 1 až 6 atómami uhlíka v alkoxylovej i alkylovej časti alebo alkoxykarbonylalkylovú skupinu so vždy s 1 až 6 atómami uhlíka v alkoxylovej i alkylovej časti, dialkylaminoalkylovú skupinu s 1 až 6 atómami uhlíka v alkylových častiach alebo vždy prípadne aspoň raz rovnako alebo rôzne substituovanú cykloalkylovú, alebo cykloalkylalkylovú skupinu vždy s 3 až 8 atómami uhlíka v cykloalkylovej časti a s 1 až 6 atómami uhlíka v alkylovej časti s priamym alebo rozvetveným reťazcom, pričom ako substituenty prichádzajú do úvahy atóm halogénu, priama alebo rozvetvená alkylová skupina s 1 až 4 atómami uhlíka, halogénalkylová skupina s 1 až 4 atómami uhlíka a s 1 až 9 rovnakými alebo rôznymi atómami halogénu alebo halogénalkenylová skupina s až 4 atómami uhlíka v priamom alebo rozvetvenom reťazci a s 1 až 5 rovnakými alebo rozdielnymi atómami halogénu, ďalej R² znamená prípadne aspoň jednu, rovnako alebo rôzne substituovanú aralkylovú alebo arylovú skupinu so 6 až 10 atómami uhlíka v arylovej časti a prípadne s 1 až 8 atómami uhlíka v priamej alebo v rozvetvenej alkylovej časti, pričom ako substituenty alkylovej skupiny prichádzajú prípadne do úvahy atómy halogénu a ako substituenty arylovej skupiny prichádzajú do úvahy atóm halogénu, priama alebo rozvetvená alkylová skupina s 1 až 6 atómami uhlíka alebo alkoxy skupina s 1 až 6 atómami uhlíka,

X znamená atóm kyslíka alebo atóm síry a

Y znamená atóm kyslíka alebo atóm síry.

Zlúčeniny všeobecného vzorca (I) môžu byť prípadne prítomné v závislosti od druhu substituentov R^1 a R^2 ako geometrické a/alebo optické izoméry, alebo zmesi izomero-rov rozdielného zloženia. Tak čisté izoméry, ako i zmesi izomero-rov spadajú do rozsahu predloženého vynálezu.

Predmetom predloženého vynálezu je ďalej spôsob výroby nových substituovaných triazolinónov všeobecného vzorca (I)



v ktorom

R^1 znamená atóm vodíka, priamu alebo rozvetvenú alkylovú skupinu s 1 až 8 atómami uhlíka, cykloalkylovú skupinu s 3 až 7 atómami uhlíka v cykloalkylovej časti, prípadne aspoň raz, rovnako alebo rôzne atómom halogénu substituovanú arylovú skupinu so 6 až 10 atómami uhlíka alebo halogénalkylovú skupinu s 1 až 4 atómami uhlíka a s až 9 rovnakými alebo rozdielnymi atómami halogénu,

R^2 znamená priamu alebo rozvetvenú alkylovú skupinu s 1 až 18 atómami uhlíka, alkenylovú skupinu s 2 až 8 atómami uhlíka, alkylovú skupinu s 2 až 8 atómami uhlíka, halogénalkylovú skupinu s 1 až 8 atómami uhlíka a s 1 až 17 rovnakými alebo rozdielnymi atómami halogénu, halogénalkenylovú skupinu s 2 až 8 atómami uhlíka a s 1 až 15 rovnakými alebo rozdielnymi atómami halogénu, kvanoalkylovú skupinu s 1 až 8 atómami uhlíka, alkoxyalkylovú skupinu s 1 až 6 atómami uhlíka v alkoxylovej i alkylovej časti, alkoxykarbonylalkylovú skupinu vždy s 1 až 6 atómami uhlíka v alkoxylovej i alkylovej časti, alkoxykarbonylalkenylovú skupinu s 1 až 6 atómami uhlíka v alkoxylovej časti a s 2 až 6 atómami uhlíka v alkenylovej časti, alkylaluminoalkylovú skupinu s 1 až 6 atómami uhlíka v alkylových častiach, dialkylaminoalkylovú skupinu s 1 až 6 atómami uhlíka v alkylových častiach alebo vždy prípadne aspoň raz rovnako, alebo rôzne substituovanú cykloalkylovú, alebo cykloalkylalkylovú skupinu vždy s 3 až 12 atómami uhlíka v cykloalkylovej časti a s 1 až 6 atómami uhlíka v alkylovej časti s priamym alebo rozvetveným reťazcom, pričom ako substituenty prichádzajú do úvahy atóm halogénu, priama alebo rozvetvená alkylová skupina s 1 až 4 atómami uhlíka, halogénalkylová skupina s 1 až 4 atómami uhlíka, halogénalkylová skupina s 1 až 4 atómami uhlíka a s 1 až 9 rovnakými alebo rôznymi atómami halogénu, alebo halogénalkenylová skupina s až 4 atómami uhlíka v priamom alebo rozvetvenom reťazci a s 1 až 5 rovnakými alebo rozdielnymi atómami halogénu,

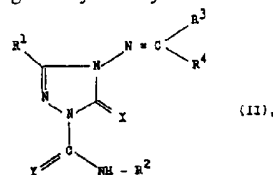
ďalej R^2 znamená prípadne aspoň jednu, rovnako alebo rôzne substituovanú aralkylovú skupinu, alebo arylovú skupinu so 6 až 10 atómami uhlíka v arylovej časti a prípadne s 1 až 8 atómami uhlíka v priamej alebo v rozvetvenej alkylovej časti, pričom ako substituenty alkylovej skupiny prichádzajú prípadne do úvahy atóm halogénu a ako substituenty arylovej skupiny prichádzajú do úvahy atóm halogénu, priama alebo rozvetvená alkylová skupina s 1 až 6 atómami uhlíka alebo alkoxy skupina s 1 až 6 atómami uhlíka,

X znamená atóm kyslíka alebo atóm síry a

Y znamená atóm kyslíka alebo atóm síry,

ktorý spočíva v tom, že sa

a) nechajú reagovať hydrazóny všeobecného vzorca (II)

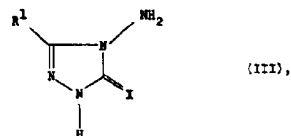


v ktorom

R^1 , R^2 , X a Y majú uvedené významy a

R^3 a R^4 znamenajú nezávisle od seba atóm vodíka, alkylovú skupinu, aralkylovú skupinu alebo arylovú skupinu, s kyselinou, prípadne v prítomnosti riedidla, alebo sa

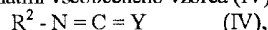
b) nechajú reagovať 1H-triazolinóny všeobecného vzorca (III)



v ktorom

R^1 a X majú uvedené významy,

s izo(tio)kvantrínmi všeobecného vzorca (IV)



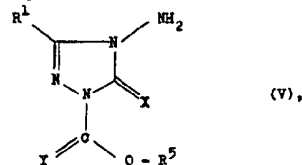
v ktorom

R^2 a Y majú uvedené významy,

prípadne v prítomnosti riedidla a prípadne v prítomnosti pomocného reakčného činidla,

alebo sa

c) nechajú reagovať triazolinóny všeobecného vzorca (V)

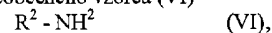


v ktorom

R^1 , X a Y majú uvedené významy a

R^5 znamená alkylovú skupinu, arylovú skupinu alebo aralkylovú skupinu,

s amínmi všeobecného vzorca (VI)



v ktorom

R^2 má uvedený význam,

prípadne v prítomnosti riedidla a prípadne v prítomnosti pomocného reakčného činidla.

Konečne sa zistilo, že nové substituované triazolinóny všeobecného vzorca (I) majú herbicídne vlastnosti.

Prekvapujúco majú substituované triazolinóny všeobecného vzorca (I) podľa tohto vynálezu značne vyššiu herbicídnu účinnosť proti burinám, ktoré sa dajú hubiť len problematicky, v porovnaní s dusíkatými heterocyklickými zlúčeninami, ktoré sú známe zo stavu techniky, ako je napríklad 4-amino-3-metyl-6-fenyl-1,2,4-triazín-5-ón, a ktoré sú po stránke chemickej a čo do účinku najbližšie príbuzné zlúčeniny.

Substituované triazolinóny podľa vynálezu sú všeobecne definované vzorcom (I). Výhodné sú také zlúčeniny všeobecného vzorca (I), v ktorom

R^1 znamená atóm vodíka, metylovú skupinu, etylovú skupinu, n-propylovú skupinu, izopropylovú skupinu, n-butylovú skupinu, izobutylovú skupinu, sek-butylovú skupinu, terc-butylovú skupinu, n-pentylovú skupinu, izopentylovú skupinu, n-hexylovú skupinu, izohexylovú skupinu, cyklopentylovú skupinu, cyklohexylovú skupinu, cyklopropylovú skupinu alebo vždy prípadne raz až trikrát rovnako alebo rozdielne substituovanú fenylovú skupinu, pričom ako substituenty prichádzajú do úvahy fluór, chlór a bróm,

R^2 znamená metylovú skupinu, etylovú skupinu, n-propylovú skupinu, izopropylovú skupinu, n-butylovú skupinu, izobutylovú skupinu, sek-butylovú skupinu alebo terc-butylovú skupinu, vždy priamu alebo rozvetvenú pentylovú skupinu, hexylovú skupinu, heptylovú skupinu, oktylovú skupinu, nonylovú skupinu, decylovú skupinu, dodecylovú skupinu, allylovú skupinu, vždy priamu alebo rozvetvenú butenylovú skupinu, pentenylovú skupinu alebo hexenylovú skupinu, propargylovú skupinu, vždy priamu alebo rozvetvenú butínylovú skupinu, pentínylovú skupinu alebo hexínylovú skupinu, priamu alebo rozvetvenú halogénalkylovú skupinu s 1 až 8 atómami uhlíka a s 1 až 9 rovnakými alebo rozdielnymi atómami halogénu, najmä fluóru, chlóru alebo brómu, vždy priamu alebo rozvetvenú halogénalkenylovú skupinu alebo halogénalkynylovú skupinu vždy s 3 až 8 atómami uhlíka a s 1 až 3 atómami halogénu, najmä fluóru alebo chlóru, vždy priamu alebo rozvetvenú kyanoalkylovú skupinu s 1 až 6 atómami uhlíka v alkylvej časti, alkoxyalkylovú skupinu, alkoxykarbonylalkylovú skupinu, dialkylaminoalkylovú skupinu vždy s 4 atómami uhlíka v jednotlivých alkylových, prípadne alkenylových častiach alebo znamená vždy prípadne raz až trikrát, rovnako alebo rôzne substituovanú cyklopropylovú skupinu, cyklopropylmetylovú skupinu, cyklopropyletylovú skupinu, cyklopentylovú skupinu, cyklohexylovú skupinu, cykloheptylovú skupinu, cyklooktylovú skupinu, cyklohexylmetylovú skupinu, cyklohexyletylovú skupinu, pričom ako substituenty prichádzajú do úvahy vždy atóm fluóru, chlór, bróm, metylová skupina, etylová skupina, n-propylová skupina, izopropylová skupina, n-butylová skupina, izobutylová skupina, sek-butylová skupina, alebo terc-butylová skupina alebo dichlórallylová skupina,

R^2 znamená okrem toho prípadne raz až trikrát rovnako alebo rôzne substituovanú benzylovú skupinu, fenytylovú skupinu, fenypropylovú skupinu, fenybutylovú skupinu, fenylopentylovú skupinu, fenylohexylovú skupinu, fenyloheptylovú skupinu, fenylovú skupinu alebo naftylovú skupinu, pričom ako substituenty fenylového zvyšku prichádzajú vždy do úvahy fluór, chlór, bróm, metylová skupina, etylová skupina, n-propylová skupina, izopropylová skupina, n-butylová skupina, izobutylová skupina, sek-butylová skupina, terc-butylová skupina, metoxy-skupina a etoxy-skupina,

X znamená atóm kyslíka alebo atóm síry a

Y znamená atóm kyslíka alebo atóm síry

Celkom obzvlášť výhodné sú zlúčeniny všeobecného vzorca (I), v ktorom

R^1 znamená atóm vodíka, metylovú skupinu, etylovú skupinu, n-propylovú skupinu, izopropylovú skupinu,

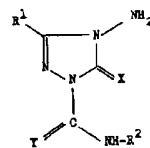
R^2 znamená atóm vodíka, vždy prípadne raz až trikrát atómom fluóru a/alebo atómom chlóru substituovanú metylovú skupinu, etylovú skupinu, n-propylovú skupinu, izopropylovú skupinu, n-butylovú skupinu, izobutylovú skupinu, sek-butylovú skupinu, terc-butylovú skupinu, allylovú skupinu, propargylovú skupinu, vždy priamu alebo rozvetvenú pentylovú skupinu, hexylovú skupinu, heptylovú skupinu, oktylovú skupinu, butenylovú skupinu, pentenylovú skupinu, hexenylovú skupinu, butynylovú skupinu, pentynylovú skupinu alebo hexynylovú skupinu;

okrem toho znamená vždy prípadne raz až trikrát rovnako alebo rôzne atómom fluóru, chlóru, metylovou skupinou, etylovou skupinou substituovanú cyklopropylovú skupinu, cyklopentylovú skupinu, cyklohexylovú skupinu, cyklopropylmetylovú skupinu, cyklopropyletylovú skupinu, cyklohexylmetylovú skupinu, cyklohexyletylovú skupinu alebo cykloheptylovú skupinu a konečne znamená benzylovú skupinu, fenylyetylovú skupinu alebo fenylovú skupinu,

X znamená atóm kyslíka alebo atóm síry a

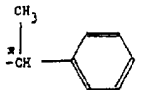
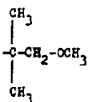
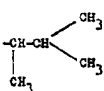
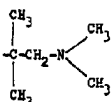
Y znamená atóm kyslíka alebo atóm síry.

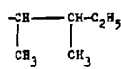
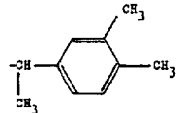
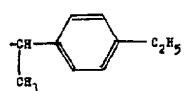
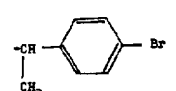
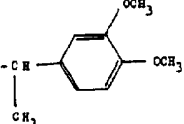
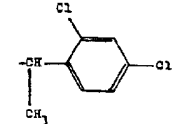
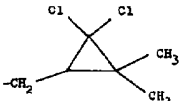
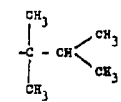
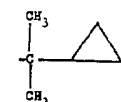
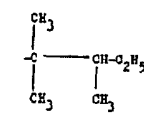
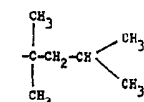
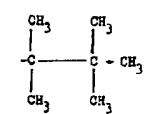
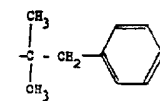
Jednotlivo možno okrem zlúčenín uvedených v príkladoch vyhotovenia uviesť nasledujúce substituované triazolinóny všeobecného vzorca (I)



R^1	R^2	X	Y
CH_3		O	O
CH_3		O	O
CH_3	$-C(CH_3)_3$	O	S
CH_3	$-C(CH_3)_3$	S	S
CH_3		S	S
C_2H_5	$-C(CH_3)_3$	O	O

SK 279720 B6

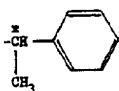
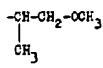
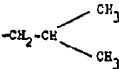
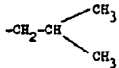
R ¹	R ²	X	Y
C ₂ H ₅	-C(CH ₃) ₃	O	S
C ₂ H ₅	-C(CH ₃) ₃	S	O
C ₂ H ₅		O	S
C ₂ H ₅		S	O
C ₂ H ₅		O	O
C ₂ H ₅		O	S
C ₂ H ₅		S	O
C ₂ H ₅		O	O
S - konfigurácia			
H	-C(CH ₃) ₃	O	O
H		O	O
H		O	O
H	-C(CH ₃) ₃	O	S
H	-C(CH ₃) ₃	S	O
H		O	S
H		S	O
CH ₃		O	O
CH ₃		O	O
CH ₃		O	O

R ¹	R ²	X	Y
CH ₃		O	O
CH ₃		O	O
CH ₃		O	O
CH ₃		O	O
CH ₃		O	O
CH ₃		O	O
CH ₃		O	O
CH ₃		O	O
CH ₃		O	O
CH ₃		O	O
CH ₃		O	O
CH ₃		O	O
CH ₃		O	O

R^1	R^2	X	Y
CH_3		0	0
CH_3		0	0
CH_3		0	0
CH_3	$-CH-(CH_2)_3-CH_3$ C_2H_5	0	0
CH_3	$-CH-(CH_2)_2-CH_3$ C_2H_5	0	0
CH_3	$-(CH_2)_3-CH$ $\swarrow$ CH_3 $\searrow$ CH_3	0	0
CH_3		0	0
CH_3	$-CH_2-CH$ $\swarrow$ OCH_3 $\searrow$ OCH_3	0	0
CH_3		0	0
CH_3	$-CH-CH_2-C$ CH_3 CH_3	0	0
CH_3		0	0
CH_3		0	S
CH_3		0	S

R - konfigurácia

R - konfigurácia

R ¹	R ²	X	Y
CH ₃		0	S
	S - konfigurácia		
CH ₃		0	S
CH ₃		0	S
CH ₃		0	S
CH ₃		0	S
CH ₃		0	S
CH ₃		0	S
CH ₃		0	S
CH ₃		0	S
CH ₃		S	0
CH ₃		S	0
CH ₃		S	0
CH ₃		S	0

Ďalším predmetom predloženého vynálezu je teda herbicídny prostriedok, ktorý spočíva v tom, že ako účinnú zložku obsahuje aspoň jeden substituovaný triazolinón všeobecného vzorca (I), v ktorom

R¹ znamená alkylovú skupinu s 1 až 4 atómami uhlíka alebo halogénalkylovú skupinu s 1 až 4 atómami uhlíka a s až 9 rovnakými alebo rozdielnymi atómami halogénu,

R² znamená alkylovú skupinu s 1 až 10 atómami uhlíka, halogénalkylovú skupinu s 1 až 6 atómami uhlíka a s 1 až 13 atómami halogénu, cykloalkylovú skupinu s 3 až 12 atómami uhlíka, ktorá je prípadne substituovaná alkylovou skupinou s 1 až 4 atómami uhlíka alebo halogénalkylovou skupinou s 1 až 4 atómami uhlíka; ďalej znamená alkynylovú skupinu s 2 až 8 atómami uhlíka, cykloal-

kylalkylovú skupinu s 3 až 8 atómami uhlíka v cyklickej časti a s 1 až 4 atómami uhlíka v alkylovej časti, pričom cykloalkylalkylová skupina je prípadne substituovaná v cykloalkylovej časti alkylovou skupinou s 1 až 4 atómami uhlíka alebo atómom halogénu, alebo znamená alkoxyalkylovú skupinu s 1 až 4 atómami uhlíka v alkoxylovej i alkylovej časti,

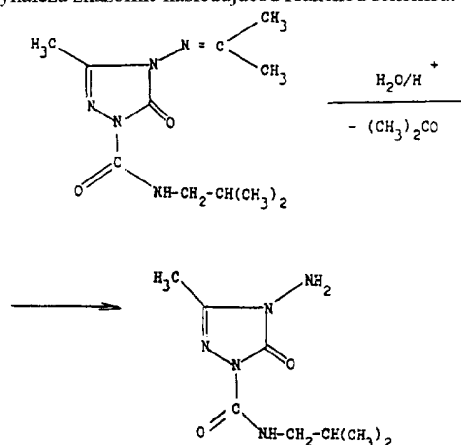
X znamená atóm kyslíka a

Y znamená atóm kyslíka.

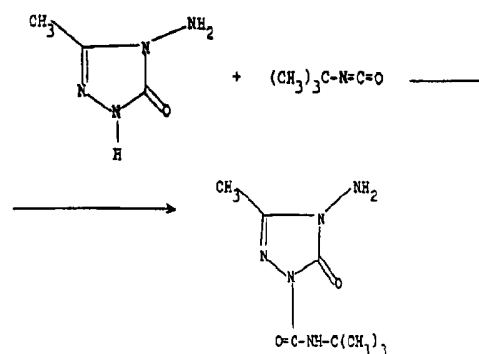
Predmetom vynálezu je rovnako použitie týchto substituovaných triazolinónov na hubenie burín, ako i spôsob výroby herbicídnych prostriedkov, ktorý spočíva v zmiešaní substituovaného triazolinónu definovaného s nosnou látkou a/alebo povrchovo aktívnou látkou.

V ďalšej časti bude bližšie opísaný spôsob prípravy zlúčenín všeobecného vzorca (I), ako i medziproduktov, ktoré sú pre tento postup potrebné.

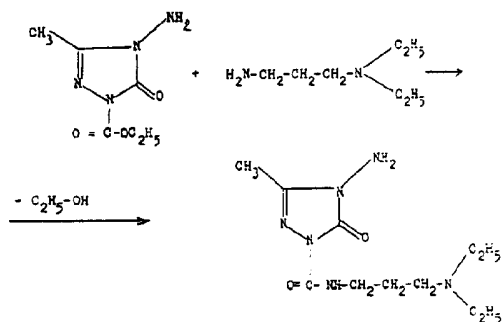
Ak sa použije pri postupe podľa vynálezu ako východisková látka napríklad 1-(N-izobutylkarbamoyl)-4-izopropylidénimino-3-metyl-1,2,4-triazolín-5-ón, potom možno priebeh reakcie podľa variantu a) postupu podľa vynálezu znázorniť nasledujúcou reakčnou schémou:



Ak sa použijú ako východiskové látky napríklad 4-amino-3-metyl-1,2,4-(1H)-triazolín-5-ón a tercbutylizokyanát, potom možno priebeh reakcie podľa variantu b) postupu podľa vynálezu znázorniť nasledujúcou reakčnou schémou:



Ak sa použijú ako východiskové látky napríklad 1-etoxy-karbonyl-4-amino-3-metyl-1,2,4-triazolín-5-ón a N,N-dietylpropán-1,3-diamín, potom možno priebeh reakcie podľa variantu c) postupu podľa vynálezu znázorniť nasledujúcou reakčnou schémou:

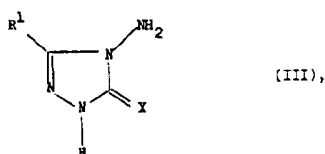


Hydrazóny, ktoré sú potrebné ako východiskové látky pri vykonávaní postupu podľa vynálezu (variant a), sú všeobecne definované vzorcom (II). V tomto vzorci majú symboly R^1 , R^2 , X a Y významy, ktoré už boli uvedené pre tieto substituenty ako výhodné v súvislosti s opisom zlúčenín všeobecného vzorca (I).

Substituenty R^3 a R^4 znamenajú výhodne vždy nezávisle od seba atóm vodíka, priamu alebo rozvetvenú alkylovú skupinu s 1 až 4 atómami uhlíka alebo znamenajú fenylovú skupinu alebo benzylovú skupinu.

Hydrazóny všeobecného vzorca (II) neboli doteraz známe. Tieto nové medziprodukty sú rovnako predmetom predloženého vynálezu.

Zlúčeniny všeobecného vzorca (II) sa pripravujú analogicky podľa známych postupov (porovnaj napr. Acta Pol. Pharm. 38, 153 - 162 (1981), prípadne C. A. 95, 203841j), napríklad tým, že sa nechajú reagovať 1-nesubstituované 4-aminotriazolinóny všeobecného vzorca (III)



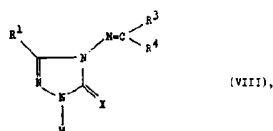
v ktorom

R^1 a X majú uvedený význam, s aldehydmi alebo ketónmi všeobecného vzorca (VII)



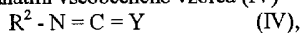
v ktorom

R^3 a R^4 majú uvedený význam, prípadne v prítomnosti riedidla, ako napríklad dichlórmetánu alebo toluénu a prípadne v prítomnosti katalyzátora, ako napríklad p-toluénsulfónovej kyseliny, pri teplotách medzi 40 °C a 120 °C, načo sa takto získané 1-nesubstituované triazolinónhydrazóny všeobecného vzorca (VIII)



v ktorom

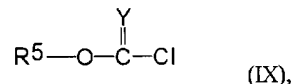
R^1 , R^3 , R^4 a X majú uvedený význam, buď v nasledujúcom druhom stupni nechajú reagovať s izo(tio) kyanátni všeobecného vzorca (IV)



v ktorom

R^2 a Y majú uvedený význam, prípadne v prítomnosti riedidla, ako napríklad dichlórmetánu alebo dioxánu a prípadne v prítomnosti pomoc-

ného reakčného činidla, ako napríklad trietylaminu, pri teplotách medzi 50 a 150 °C, alebo sa alternatívne v nasledujúcom druhom stupni nechajú reagovať s esterami (tio)chlórmravčej kyseliny všeobecného vzorca (IX)

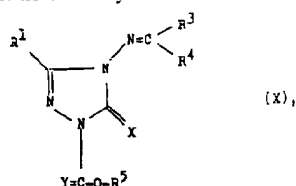


v ktorom

R^5 znamená alkylovú skupinu, aryllovú skupinu alebo arylalkylovú skupinu a

Y má uvedený význam,

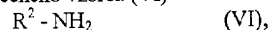
prípadne v prítomnosti riedidla ako napríklad tetrahydrofuránu a prípadne v prítomnosti pomocného reakčného činidla, ako napríklad hydridu sodného alebo terc-butoxidu draselného, pri teplotách medzi -20 °C a +40 °C, a takto získané triazolinóny všeobecného vzorca (X)



v ktorom

R^1 , R^3 , R^4 , R^5 , X a Y majú uvedený význam,

sa v nasledujúcom treťom stupni nechajú reagovať s aminmi všeobecného vzorca (VI)



v ktorom

R^2 má uvedený význam,

prípadne v prítomnosti riedidla, ako napríklad tetrahydrofuránu, ako i prípadne v prítomnosti bázy ako napríklad hydroxidu sodného alebo hydroxidu draselného, pri teplotách medzi 20 °C a 50 °C.

Pritom je rovnako možná a prípadne výhodná reakcia 1-nesubstituovaných triazolinón-hydrazónov všeobecného vzorca (VIII) s esterami (tio)chlórmravčej kyseliny všeobecného vzorca (IX) a nasledujúca reakcia takto získaných triazolinónov všeobecného vzorca (X) s aminmi všeobecného vzorca (VI) v jedinom reakčnom stupni (tzn., že sa reakcia vykonáva v jednej reakčnej nádobe) (porovnaj príklad 3).

1-nesubstituované 4-aminotriazolinóny všeobecného vzorca (III) sú známe zlúčeniny alebo sa môžu získavať analogicky podľa známych postupov (porovnaj napríklad J. Heterocycl. Chem. 16, 403 (1979), J. Heterocycl. Chem. 17, 1961 (1980), Europ. J. Med. Chem. 18, 215 (1983), Chem. Ber. 98, 3025 (1965 alebo Liebigs Ann. Chem. 637, 135 (1960)).

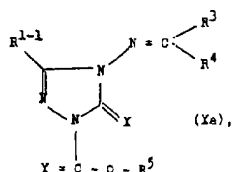
Aldehydy alebo ketóny všeobecného vzorca (VII) sú všeobecne známe zlúčeniny organickej chémie.

1-nesubstituované triazolinón-hydrazóny všeobecného vzorca (VIII) sú z veľkej časti známe zlúčeniny (porovnaj napríklad J. Heterocycl. Chem. 20, 77 - 80 (1983), J. Heterocycl. Chem. 16, 403 - 407 (1979), Chim. Acta Turc. 7, 269 - 290 (1979), J. Chem. Soc., Parkin Trans. II, 1973, 9 - 11, J. Org. Chem. 36, 2190 - 2192 (1971)).

Estery (tio)chlórmravčej kyseliny všeobecného vzorca (IX) sú všeobecne známe zlúčeniny organickej chémie.

Triazolinóny všeobecného vzorca (X), uvádzané ako medziprodukty, sú čiastočne známe zlúčeniny (porovnaj napríklad Acta Pol. Pharm. 38, 153 - 162 (1981), prípadne C. A. 95, 203841j).

Triazolinóny všeobecného vzorca (X), ktoré sú nové, sú definované všeobecným vzorcom (Xa)



v ktorom

R^{1-1} znamená alkylovú skupinu a

R^3 , R^4 , R^5 , X a Y majú uvedený význam.

Výhodné sú zlúčeniny všeobecného vzorca (Xa), v ktorom

R^{1-1} znamená výhodne priamu alebo rozvetvenú alkylovú skupinu s 1 až 4 atómami uhlíka, najmä s 1 až 3 atómami uhlíka, celkom obzvlášť potom R^{1-1} znamená metylovú skupinu,

R^3 a R^4 znamenajú výhodne vždy nezávisle od seba atóm vodíka, priamu alebo rozvetvenú alkylovú skupinu s 1 až 4 atómami uhlíka alebo fenylovú skupinu, alebo benzylovú skupinu,

R^5 znamená výhodne priamu alebo rozvetvenú alkylovú skupinu s 1 až 4 atómami uhlíka, alebo prípadne raz až trikrát, rovnako alebo rôzne substituovanú fenylovú skupinu alebo benzylovú skupinu, pričom ako substituenty prichádzajú do úvahy vždy atóm halogénu, kyanoskupina, nitroskupina, vždy priama alebo rozvetvená alkylová skupina, alkoxykupina alebo alkyltioskupina, vždy s 1 až 4 atómami uhlíka alebo vždy priama alebo rozvetvená halogénalkylová skupina, halogénalkoxykupina alebo halogénalkyltioskupina vždy s 1 až 4 atómami uhlíka a s 1 až 9 rovnakými alebo rozdielnymi atómami halogénu,

R^5 znamená najmä metylovú skupinu, etylovú skupinu, n-propylovú skupinu, izopropylovú skupinu, n-butylovú skupinu, izobutylovú skupinu, sek-butylovú skupinu alebo terc-butylovú skupinu, alebo prípadne raz až dvakrát, rovnako alebo rôzne substituovanú fenylovú alebo benzylovú skupinu, pričom ako substituenty prichádzajú do úvahy vždy atóm fluóru, atóm chlóru, atóm brómu, kyanoskupina, nitroskupina, metylová skupina, etylová skupina, n-propylová skupina, izopropylová skupina, n-butylová skupina, izobutylová skupina, sek-butylová skupina, terc-butylová skupina, metoxyskupina, etoxyskupina, n-propoxyskupina, izopropoxyskupina, metyltioskupina, trifluórmetylová skupina, trifluórmetoxykupina alebo trifluórmetyltioskupina,

X a Y znamenajú nezávisle od seba atóm kyslíka alebo síry, výhodne atóm kyslíka.

1H-triazolinóny, ktoré sú potrebné ako východiskové látky pri vykonávaní postupu podľa variantu b), sú všeobecne definované vzorcom (III). V tomto vzorci (III) znamenajú symboly R^1 a X výhodne tie zvyšky, ktoré boli v súvislosti s opisom zlúčenín všeobecného vzorca (I) podľa vynálezu uvedené ako výhodné pre tieto symboly.

1H-triazolinóny všeobecného vzorca (III) sú známe alebo sa získajú analogicky podľa známych postupov (porovnaj napríklad J. Heterocycl. Chem. 16, 403 (1979), J. Heterocycl. Chem. 17, 1691 (1980), Europ. J. med. Chem. 18, 215 (1983), Chem. Ber. 98, 3025 (1965), Liebig's Ann. Chem. 637, 135 (1960)).

Izo(tio)kyanáty, ktoré sú ďalej potrebné ako východiskové látky pri vykonávaní postupu podľa variantu b), sú všeobecne definované vzorcom (IV). V tomto vzorci (IV) znamenajú substituenty R^2 a Y výhodne tie zvyšky, ktoré už boli uvedené ako výhodné v súvislosti s opisom zlúčenín všeobecného vzorca (I) podľa vynálezu pre tieto substituenty.

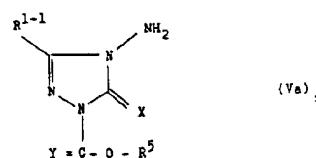
Izo(tio)kyanáty všeobecného vzorca (IV) sú väčšinou známe zlúčeniny organickej chémie. 2,2,2-Trifluórizopropylkyanát a 2,2,2-trifluór-1,1-dimetyletylkyanát neboli však doteraz známe. Tieto zlúčeniny sa však dajú pripraviť podľa známych metód. Tak sa izo(tio)kyanáty získajú napríklad tým, že sa nechajú reagovať zodpovedajúce amíny s fosgénom, prípadne v prítomnosti bázy, ako napríklad trietylaminu (porovnaj napríklad DE-OS 28 04 082, DE-OS 25 12 514, americký patentový spis 35 84 028, americký patentový spis 27 06 753, americký patentový spis 33 11 654, JP 50/29599, Synthesis 1985, str. 682 alebo J. Am. Chem. Soc. 77, 1901 - 1902 (1955)).

Triazolinóny, potrebné ako východiskové látky pri vykonávaní postupu podľa variantu c) sú všeobecne definované vzorcom (V). V tomto vzorci (V) majú substituenty R^1 , X a Y výhodne významy, ktoré už boli ako výhodné uvádzané v súvislosti s opisom zlúčenín všeobecného vzorca (I), zatiaľ čo

R^5 znamená výhodne priamu alebo rozvetvenú alkylovú skupinu s 1 až 4 atómami uhlíka alebo prípadne raz až trikrát, rovnako alebo rôzne substituovanú fenylovú skupinu alebo benzylovú skupinu, pričom ako substituenty prichádzajú do úvahy vždy atóm halogénu, kyanoskupina, nitroskupina, vždy priama alebo rozvetvená alkylová skupina, alkoxykupina alebo alkyltioskupina, vždy s 1 až 4 atómami uhlíka alebo vždy priama alebo rozvetvená halogénalkylová skupina, halogénalkoxykupina alebo halogénalkyltioskupina vždy s 1 až 4 atómami uhlíka a s 1 až 9 rovnakými alebo rozdielnymi atómami halogénu, R^5 znamená najmä metylovú skupinu, etylovú skupinu, n-propylovú skupinu, izopropylovú skupinu, n-butylovú skupinu, izobutylovú skupinu, sek-butylovú skupinu alebo terc-butylovú skupinu alebo prípadne raz až dvakrát, rovnako alebo rôzne substituovanú fenylovú skupinu alebo benzylovú skupinu, pričom ako substituenty prichádzajú do úvahy vždy atóm fluóru, chlór, bróm, kyanoskupina, nitroskupina, metylová skupina, etylová skupina, n-propylová skupina, izopropylová skupina, n-butylová skupina, izobutylová skupina, sek-butylová skupina, terc-butylová skupina, metoxyskupina, etoxyskupina, n-propoxyskupina, izopropoxyskupina, metyltioskupina, trifluórmetylová skupina, trifluórmetoxykupina alebo trifluórmetyltioskupina.

Triazolinóny všeobecného vzorca (V) sú čiastočne známe zlúčeniny (porovnaj napríklad J. Heterocycl. Chem. 17, 1691 - 1696 (1980)).

Doteraz neznáme sú triazolinóny všeobecného vzorca (Va)

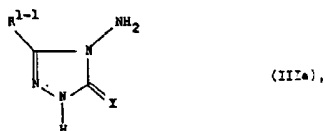


v ktorom

R^{1-1} znamená alkylovú skupinu, výhodne priamu alebo rozvetvenú alkylovú skupinu s 1 až 4 atómami uhlíka, najmä s 1 až 3 atómami uhlíka, celkom obzvlášť výhodne metylovú skupinu,

R^5 , X a Y majú uvedené významy.

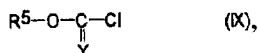
Tieto zlúčeniny sa získajú analogickým spôsobom ako sa pripravujú známe zlúčeniny všeobecného vzorca (V) tým, že sa nechajú reagovať 1H-triazolinóny všeobecného vzorca (IIIa)



v ktorom

R^{1-1} a X majú uvedené významy,

s esterami (tio)chlórnavčej kyseliny všeobecného vzorca (IX)



v ktorom

R^5 a Y majú uvedené významy,

pripadne v prítomnosti riedidla, ako napríklad tetrahydrofurán a pripadne v prítomnosti pomocného reakčného činidla, ako napríklad terc-butoxidu draselného alebo hydridu sodného, pri teplotách medzi $-20\text{ }^{\circ}\text{C}$ a $+40\text{ }^{\circ}\text{C}$ (porovnaj tiež príklady vyhotovenia).

1H-triazolinóny všeobecného vzorca (IIIa) sú známe alebo sa získajú analogicky podľa známych postupov (porovnaj napríklad J. Heterocycl. Chem. 16, 403 (1979), J. Heterocycl. Chem. 17, 1691 (1980), Europ. J. med. Chem. 18, 215 (1983), Chem. Ber. 98, 3025 (1965), Liebig's Ann. Chem. 637, 135 (1960)).

Ako kyseliny na vykonávanie postupu podľa vynálezu (variant a) prichádzajú do úvahy všetky anorganické a organické kyseliny použiteľné zvyčajne pre štiepenie hydrazónu. Výhodne sa používajú anorganické minerálne kyseliny ako kyselina chlorovodíková, kyselina sírová alebo kyselina fosforečná.

Ako riedidlá na vykonávanie postupu podľa vynálezu (variant a) prichádzajú do úvahy všetky bežné organické alebo anorganické rozpúšťadlá. Výhodne sa používajú polárne s vodou miešateľné organické rozpúšťadlá, najmä alkoholy, ako metanol, etanol, propanol alebo butanol, ich zmesi s vodou alebo čistá voda.

Reakčné teploty sa môžu pri vykonávaní postupu podľa vynálezu (variant a) meniť v širokom rozmedzí. Všeobecne sa pracuje pri teplotách medzi $20\text{ }^{\circ}\text{C}$ a $150\text{ }^{\circ}\text{C}$, výhodne pri teplotách medzi $50\text{ }^{\circ}\text{C}$ a $120\text{ }^{\circ}\text{C}$.

Postup podľa variantu a) sa zvyčajne vykonáva pri atmosférickom tlaku alebo pri zníženom tlaku. Ak sa pracuje pri zníženom tlaku, potom prichádzajú do úvahy tlaky v rozsahu medzi 2 000 a 40 000 Pa, výhodne medzi 1 000 a 20 000 Pa.

Pri vykonávaní postupu podľa variantu a) sa používa na 1 mól hydrazónu vzorca (II) všeobecne 1 až 50 mól, výhodne 1 až 20 mól kyseliny. Pritom sa hydrazón vzorca (II) rozpustí vo vhodnom množstve riedidla, k získanému roztoku sa potom pridá potrebné množstvo kyseliny a zmes sa zvoľna niekoľko hodín zahusťuje za zníženého tlaku.

Pri zvláštnom spôsobe vyhotovenia je tiež možné vykonávať postup podľa variantu a) na výrobu medzipro-

duktov potrebných pre tento účel vzorca (II) v jednom reakčnom stupni, t. j. v jednej reakčnej nádobe.

Pritom existuje možnosť voliť ako východiskové látky triazolinóny vzorca (X) a tie postupne nechať reagovať v jednej reakčnej nádobe s amínmi vzorca (VI) a potom s kyselinou postupom podľa vynálezu (variant a) (porovnaj rovnako príklady vyhotovenia) alebo alternatívne zvoliť ako východiskové látky triazolín-hydrazóny vzorca (VIII) a tie nechať postupne v jednej reakčnej nádobe reagovať s esterami (tio)chlórnavčej kyseliny vzorca (IX), potom s amínmi vzorca (VI) a nakoniec s kyselinou postupom podľa variantu a).

Ako riedidlá na vykonávanie postupu podľa variantu b) prichádzajú do úvahy všetky inertné organické rozpúšťadlá. K tým patria najmä alifatické, alicyklické alebo aromatické, pripadne halogénované uhľovodíky, ako napríklad benzín, benzén, toluén, xylén, chlórbenzén, petroléter, hexán, cyklohexán, dichlórmetán, chloroform, tetrachlórmetán, étery, ako dietyléter, dioxán, tetrahydrofurán alebo etylénglykoldimetyléter, alebo etylénglykoldietyléter, nitrily, ako acetonitril alebo propionitril, amidy, ako dimetylformamid, dimetylacetamid, N-metylformanilid, N-metylpyrolidín alebo hexametyltriamid fosforečnej kyseliny, alebo estery, ako etylacetát.

Postup podľa variantu b) sa pripadne vykonáva za prítomnosti vhodného pomocného reakčného činidla. Samy osebe prichádzajú do úvahy všetky bežné anorganické alebo organické bázy. K tým patria napríklad terciárne amíny, ako trietylamin, N,N-dimetylanilín, N,N-dietylbenzylamin, N,N-dimetylcyklohexylamin alebo dibutylcindilaurát, pyridín, N,N-dimetylaminopyridín, diazabicyklooktán, diazabicyklononén alebo diazabicykloundecén.

Reakčné teploty sa môžu pri vykonávaní postupu podľa variantu b) meniť v širokom rozsahu. Všeobecne sa pracuje pri teplotách medzi $0\text{ }^{\circ}\text{C}$ a $150\text{ }^{\circ}\text{C}$, výhodne pri teplotách medzi $20\text{ }^{\circ}\text{C}$ a $100\text{ }^{\circ}\text{C}$.

S cieľom vykonávať postup podľa vynálezu sa na 1 mól 1H-triazolinónu vzorca (III) používa všeobecne 1,0 až 2,0 mól, výhodne 1,0 až 1,5 mól izo(tio)kyanátu vzorca (IV) a pripadne 0,001 až 2,0 mól, výhodne 0,001 až 1,0 mól pomocného reakčného činidla.

Vykonávanie reakcie, spracovávanie reakčnej zmesi a izolácia reakčných produktov sa vykonáva podľa všeobecných zvyčajných metód.

Ako riedidlá na vykonávanie postupu podľa variantu c) prichádzajú do úvahy inertné organické rozpúšťadlá. K týmto patria hlavne alifatické, alicyklické alebo aromatické, pripadne halogénované uhľovodíky, ako napríklad benzín, benzén, toluén, xylén, chlórbenzén, petroléter, hexán, cyklohexán, dichlórmetán, chloroform, tetrachlórmetán, étery ako dietyléter, dioxán, tetrahydrofurán alebo etylénglykoldimetyléter, alebo etylénglykoldietyléter, nitrily ako acetonitril alebo propionitril, amidy ako dimetylformamid, dimetylacetamid, N-metylformanilid, N-metylpyrolidón alebo hexametyltriamid fosforečnej kyseliny, alebo estery, ako etylacetát alebo sulfoxidy, ako dimetylsulfoxid.

Postup podľa variantu c) sa môže vykonávať v prítomnosti vhodného pomocného reakčného činidla. Ako takéto činidlá prichádzajú do úvahy všetky bežné anorganické alebo organické bázy. K týmto patria napríklad hydroxidy alkalickej kovov, ako hydroxid sodný alebo hydroxid draselný, uhličitany alkalickej kovov, ako uhličitán sodný, uhličitán draselný alebo hydrogenuhličitán sodný, ako i terciárne amíny, ako trietylamin, N,N-dimetylanilín, pyridín, N,N-dimetylaminopyridín, diazabi-

cyklooktán, diazabicyklononén alebo diazabicykloundecén.

Reakčné teploty sa môžu pri vykonávaní postupu podľa variantu c) meniť v širokom rozmedzí. Všeobecne sa pracuje pri teplotách medzi 0 °C a 120 °C, výhodne pri teplotách medzi 20 °C a 50 °C.

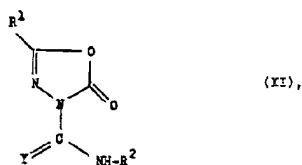
S cieľom vykonávať postup podľa variantu c) sa používa na 1 mól triazolinónu vzorca (V) všeobecne 1,0 až 5,0 mól, výhodne 1,0 až 2,5 mól amínu vzorca (VI) a prípadne 1,0 až 2,0 mól, výhodne 1,0 až 1,2 mól pomocného reakčného činidla.

Vykonávanie reakcie, spracovávanie reakčnej zmesi a izolácia reakčných produktov sa uskutočňujú podľa všeobecne bežných metód.

Pri zvláštnom vyhotovení postupu podľa variantu c) možno výrobu medziproduktov vzorca (V), ktoré sú potrebné pre tento postup, vykonávať v jedinom reakčnom stupni, t. j. v jedinej reakčnej nádobe.

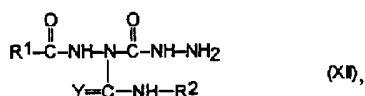
Pritom sa vychádza z 1H-triazolinónov vzorca (III) a tieto zlúčeniny sa nechajú postupne reagovať v jedinej reakčnej nádobe najprv s estermi (tio)chlórnavčej kyseliny vzorca (IX) a potom s amínmi vzorca (VI) podľa variantu c).

Ďalšia metóda na získanie zlúčenín všeobecného vzorca (I) spočíva v tom, že sa nechajú reagovať oxadiazolinóny všeobecného vzorca (XI)



v ktorom

R^1 , R^2 a Y majú uvedené významy, s hydrazinhydrátom v prítomnosti vhodného riedidla, ako napríklad metanolu a etanolu, pri teplotách medzi 20 °C a 100 °C a takto získané deriváty karbamidovej kyseliny všeobecného vzorca (XII)



v ktorom

R^1 , R^2 a Y majú uvedené významy, v prítomnosti vhodného riedidla, ako napríklad toluénu, chlórbenzénu alebo dichlórbenzénu pri teplotách medzi 80 °C a 200 °C, sa pôsobením tepla cyklizujú.

Oxadiazolinóny všeobecného vzorca (XI) sú známe zlúčeniny (porovnaj napríklad FR 14 15 605, prípadne C. A. 64, P5105g, ako i NL 6 510 645, prípadne C. A. 65, P2274d-f) alebo sa získavajú podľa všeobecne známych postupov, napríklad reakciou zodpovedajúcich 4H-oxadiazolinónov s izo(tio)kyanátmi vzorca (IV) analogicky podľa syntézy používanej na výrobu východiskových látok vzorca (II).

Čistenie reakčných produktov vzorca (I) sa vykonáva pomocou bežných postupov, napríklad stĺpcovou chromatografiou alebo prekryštalizovaním. Charakteristika zlúčenín sa vykonáva pomocou teploty topenia a pri nekryštalizujúcich zlúčeninách pomocou protónového magnetického rezonančného spektra.

Účinné látky podľa vynálezu sa môžu používať ako defoliačné prostriedky, dezikačné prostriedky, prostriedky na hubenie burín a hlavne ako prostriedky na ničenie burín. Burinou sa v najširšom zmysle chápu všetky rastliny, ktoré rastú v miestach, kde sú nežiaduce. Skutočnosť, či účinné látky podľa vynálezu pôsobia ako totálne alebo ako selektívne herbicidy, závisí v podstate od použitého množstva.

Účinné látky podľa vynálezu sa môžu napríklad používať pri nasledujúcich rastlinách:

dvojkliče buriny rodov:

horčica (*Sinapis*), žerucha (*Lepidium*), lipkavec (*Galium*), hviezdica (*Stellaria*), rumanček (*Matricaria*), ruman (*Anthemis*), galinsoga (*Galinsoga*), mrlík (*Chenopodium*), prhlava (*Urtica*), starček (*Senecio*), láskavec (*Amaranthus*), portulaka (*Portulaca*), voškovník (*Xanthium*), pupenec (*Convolvulus*), povojník (*Ipomoea*), stávik (*Polygonum*), sesbania (*Sesbania*), ambrosia (*Ambrosia*), pichliač (*Cirsium*), bodliak (*Carduus*), mlieč (*Sonchus*), ľufok (*Solanum*), roripa (*Rorippa*), Rotala, Lindernia, hluchavka (*Lamium*), veronika (*Veronica*), abutilon (*Abutilon*), Emex, durman (*Datura*), violka (*Viola*), konopnica (*Galeopsis*), mak (*Papaver*), nevädza (*Centaurea*) a *Mercurialis*,

dvojkliče kultúrne rastliny rodov:

bavlník (*Gossypium*), sója (*Glycine*), repa (*Beta*), mrkva (*Daucus*), fazuľa (*Phaseolus*), hrach (*Pisum*), zemiaky (*Solanum*), ľan (*Linum*), povojník (*Ipomoea*), vika (*Vicia*), tabak (*Nicotiana*), paradajky (*Lycopersicon*), podzemnica olejná (*Arachis*), kel (*Brassica*), šalát (*Lactuca*), uhorka (*Cucumis*), tekvica (*Cucurbita*).

jednokliče buriny rodov:

ježatka (*Echinochloa*), bar (*Setaria*), proso (*Panicum*), prstovka (*Digitaria*), timotejka (*Phleum*), lipnica (*Poa*), kostrava (*Festuca*), eleusine (*Eleusine*), Brachiaria, mätnoh (*Lolium*), stoklas (*Bromus*), ovos (*Avena*), šachor (*Cyperus*), cirok (*Sorghum*), pýr (*Agropyron*), troskul (*Cynodon*), Monochoria, Fimbristylis, šípovka (*Segittaria*), Eleocharis, Scirpus, Paspalum, Ischaemum, Sphegnoclea, Dactyloctenium, psinček (*Agrostis*), psiarka (*Alopecurus*), metlička (*Apera*).

jednokliče kultúrne rastliny rodov:

ryža (*Oryza*), kukurica (*Zea*), pšenica (*Triticum*), jačmeň (*Hordeum*), ovos (*Avena*), raž (*Secale*), cirok (*Sorghum*), proso (*Panicum*), cukrová trstina (*Saccharum*), ananas (*Ananas*), asparágus (*Asparagus*), cesnak (*Allium*).

Použitie účinných látok podľa vynálezu nie je však v žiadnom prípade obmedzené len na tieto rody, ale sa vzťahuje rovnakým spôsobom i na ďalšie rastliny.

Zlúčeniny podľa vynálezu sú vhodné, v závislosti od koncentrácie, na totálne hubenie burín napríklad na priemyselných plochách a železničných plochách, ako i na cestách a námestiach, prípadne s porastom stromov. Zlúčeniny podľa vynálezu sa môžu rovnako používať na hubenie burín v dlhoročných kultúrach, napríklad lesných kultúrach, v kultúrach okrasných drevín, ovocných stromov, vo viniciach, v kultúrach citrusovníkov, orešánov, banánovníkov, kávovníkov, čajovníkov, kaučukovníkov, kokosových paliem, kakaovníkov, ďalej v kultúrach rastlín s bobuľovitými plodmi a na chmeľniciach a ďalej na selektívne hubenie burín v jednoročných kultúrach.

Účinné látky podľa vynálezu sa pritom dajú s obzvlášť dobrým úspechom používať na ničenie jednokličných a dvojkličných burín, hlavne v kultúrach dvojkličných rastlín, ako napríklad v cukrovej repe.

Za zmienku ďalej stojí tiež výborná účinnosť proti bažanke (*Mercurialis*), ktorá predstavuje problematickú burinu, ktorá sa dá len ťažko vyhubiť.

Účinné látky sa môžu prevádzať na bežné prostriedky ako sú roztoky, emulzie, zmačateľné prášky, suspenzie, prášky, poprášky, pasty, rozpustné prášky, granuláty, koncentráty na báze suspenzií a emulzií, prírodné a syntetické látky impregnované účinnými látkami, ako i na enkapsulované prostriedky v polymérnych látkach.

Tieto prostriedky sa vyrábajú známym spôsobom, napríklad zmiešaním účinných látok s plnidlami, t. j. s kvapalnými rozpúšťadlami a/alebo pevnými nosnými látkami, prípadne za použitia povrchovo aktívnych činidiel, t. j. emulgátorov a/alebo dispergátorov, a/alebo speňovacích prostriedkov.

V prípade použitia vody ako nosnej látky sa môžu ako pomocné rozpúšťadlá používať napríklad tiež organické rozpúšťadlá. Ako kvapalné rozpúšťadlá prichádzajú v podstate do úvahy: aromatické uhľovodíky, ako xylén, toluén alebo alkylnaftalény, chlórované aromatické uhľovodíky alebo chlórované alifatické uhľovodíky, ako chlórbenzény, chlóretylén alebo metylénchlorid, alifatické uhľovodíky, ako cyklohexán alebo parafrinické uhľovodíky, napríklad ropné frakcie, minerálne a rastlinné oleje, alkoholy ako butanol alebo glykol, ako i ich étery a estery, ketóny, ako acetón, metyletylketón, metylizobutylketón alebo cyklohexanón, silne polárne rozpúšťadlá, ako dimetylformamid a dimetylsulfoxid, ako i voda.

Ako pevné nosné látky prichádzajú do úvahy: napríklad prírodné kamenné múčky, ako kaolíny, alumíny, mastenec, krieda, kremič, atapulgít, montmorillonit alebo kremelina a syntetické kamenné múčky, ako vysoko disperzná kyselina kremičitá, oxid hlinitý a kremičitany. Ako pevné nosné látky pre prípravu granulátov prichádzajú do úvahy napríklad drvené a frakcionované kamenné materiály, ako vápenec, mramor, pemza, sepiolit a dolomit, ako i syntetické granuláty z organického materiálu, ako z pilín, škrupín kokosových orechov, kukuričných palíc a tabakových stoniek. Ako emulgátory a/alebo speňovacie činidlá prichádzajú do úvahy napríklad neiónogénne a aniónové emulgátory, ako polyoxetylénestery masťných kyselín, polyoxetylénestery masťných alkoholov, napríklad alkylarylpolyglykoléteryalkylsulfonáty, alkylsulfáty, arylsulfonáty a hydrolyzáty bielkovín a ako dispergátory napríklad lignín, sulfitové odpadové láhly a metylcelulóza.

Prostriedky podľa vynálezu môžu obsahovať adhezíva ako karboxymetylcelulózu, prírodné a syntetické, práškové, zrnité alebo latexovité polyméry, ako arabskú gumu, polyvinylalkohol a polyvinylacetát, ako i prírodné fosfolipidy ako kefalíny a lecitíny a syntetické fosfolipidy. Ďalšími prísadami môžu byť minerálne a rastlinné oleje.

Ďalej môžu tieto prostriedky obsahovať farbivá ako anorganické pigmenty, napríklad oxid železitý, oxid titaničitý a ferokyanidová modrá a organické farbivá, ako alizarínové farbivá, azofarbivá a kovové ftalocyanínové farbivá, ako i stopové prvky, napríklad soli železa, mangánu, bóru, medi, kobaltu, molybdénu a zinku.

Prostriedky obsahujú všeobecne medzi 0,1 a 95 % hmotnostnými účinnou látkou, výhodne medzi 0,5 a 90 % hmotnostnými účinnou látkou.

Účinné látky podľa vynálezu sa môžu používať samé osebe alebo vo forme svojich prostriedkov tiež v zmesi so známymi herbicidmi používanými na ničenie burín, pričom toto pridávanie je možné tiež už k hotovým prostriedkom alebo bezprostredne pred aplikáciou pridaním do zásobného tanku.

Pre toto miešanie prichádzajú do úvahy známe herbicidy, ako napríklad 1-amino-6-etyltio-3-(2,2-dimetylpropyl)-1,3,5-triazín-2,4(1H,3H)dión alebo N-(2-benziazolyl)-N,N'-dimetylmočovina na hubenie burín v kultúrach obilovín; 4-amino-3-metyl-6-fenyl-1,2,4-triazín-5(4H)-ón na hubenie burín v cukrovej repe a 4-amino-6-(1,1-dimetyl-etyl)-3-metyltio-1,2,4-triazín-5(4H)-ón na ničenie burín v sóji. Možné sú rovnako zmesi s 5-(2-chlór-4-trifluórmetylfenoxy)-2-nitrobenzoovou kyselinou, N-(metoxy-metyl)-2,6-dietylanilidom chlórctovej kyseliny, metyl-6,6-dimetyl-2,4-dioxo-3-[1-(2-propenyl-oxamino)butylidén]-cyklohexankarboxylovej kyseliny, metyl-5-(2,4-dichlórfenoxy)-2-nitrobenzoátom, 5-amino-4-chlór-2-fenyl-2,3-dihydro-3-oxo-pyridazinom, etyl-2-/[4-(4-chlór-6-metoxo-2-pyrimidinyl)-amino-karbonyl]-aminosulfonil/benzoátom, exo-1-metyl-4-(1-metyl-etyl)-2-(2-metylfenylmetoxy)-7-oxabicyklo[2,2,1]-heptánom, etyl-2-/[4-(4-chlór-6-metoxo-2-pyridinyl)-amino-karbonyl]-aminosulfonil/benzoátom, 3,6-dichlór-2-pyridin-karboxylovou kyselinou, N,S-dietyl-N-cyklohexyltiolkarbamátom, 3-(metoxykarbonylamino-fenyl)-N-metylkarbamátom, 2-[4-(2,4-dichlórfenoxy)fenoxy]propiónovou kyselinou, jej metylestermi alebo etylestermi, 4-amino-6-terc-butyl-3-etyltio-1,2,4-triazín-5-(4H)-ónom, 2-/4-[(6-chlór-2-benzoxazolyl)oxy]fenoxy/propánovou kyselinou, jej metylesterom alebo jej etylesterom, trimetylsilylmetylesterom 2-[4-(3,5-dichlóropyrid-2-yloxy)fenoxy]-propiónovej kyseliny, 5-(2-chlór-4-trifluórmetylfenoxy)-N-metyl-sulfonil-2-nitrobenzamídom, 2-/4-[(3-chlór-5-trifluórmetyl)-2-pyridinyl]oxyfenoxy/propánovou kyselinou, prípadne jej etylesterom, metylesterom 2-[4-(2,4-dichlórfenoxy)fenoxy]propiónovej kyseliny, 2-[5-metyl-5-(1-metyletyl)-4-oxo-2-imidazolin-2-yl]-3-chinolíňkarboxylovou kyselinou, 1-izobutyl-aminokarbonyl-2-imidazolidinónom, 3-cyklohexyl-5,6-trimetylényracilom, N-metyl-2-(1,3-benziazol-2-yloxy)-acetanilidom, 2-chlór-N-(2,6-dimetylfenyl)-N-[(1H)pyrazol-1-yl-metyl]acetamidom, 2-etyl-6-metyl-N-(1-metyl-2-metoxo-etyl)chlóracetanilidom, 3-(etoxycarbonylamino-fenyl)-N-(3'-metylfenyl)-karbamátom, 2-[1-(etoxamino)butylidén]-5-(2-etyltiopropyl)-1,3-cyklohexadiónom, N,N-diizopropyl-S-(2,3,3-trichlórallyl)tiolkarbamátom alebo 2,6-dinitro-4-trifluór-metyl-N,N-dipropylanilínom. Niektoré zmesi majú prekvapujúco tiež synergický účinok.

Možné je rovnako miešanie s inými známymi účinnými látkami ako sú fungicidy, insekticidy, akaricidy, nematocidy, ochranné látky proti ozobaniu vtákmi, látky potrebné na výživu rastlín a prostriedky na zlepšenie štruktúry pôdy.

Účinné látky sa môžu používať samé osebe, vo forme koncentrátov alebo ako aplikačné formy pripravené z týchto koncentrátov ďalším riedením ako sú roztoky na priame použitie, suspenzie, emulzie, prášky, pasty a granuláty. Aplikácia sa vykonáva zvyčajným spôsobom, napríklad zalieváním, postrekom, posypom a pod.

Účinné látky podľa vynálezu sa môžu aplikovať tak pred, ako i po vzklíčení rastlín.

Účinné látky sa môžu zapracovávať tiež pred osevom rastlín.

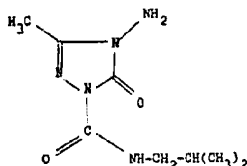
Aplikované množstvo účinnej látky sa pohybuje vo veľkom rozsahu. Toto množstvo závisí v podstate od druhu požadovaného efektu. Všeobecne sa aplikované množstvá pohybujú medzi 0,01 a 10 kg účinnej látky na 1 ha pôdnej plochy, výhodne medzi 0,05 a 5 kg účinnej látky na 1 ha pôdnej plochy.

Nasledujúce príklady bližšie objasňujú výrobu účinných látok podľa vynálezu a ich použitie. Tieto príklady však vynález v žiadnom smere neobmedzujú.

Príklady uskutočnenia vynálezu

Príklady ilustrujúce spôsob výroby účinných látok

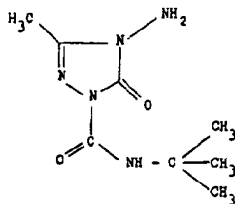
Príklad 1



Postup a)

K 11,1 g (0,04 mól) 1-(N-izobutylkarbamoyl)-4-izopropylidén-imino-3-metyl-1,2,4-triazolín-5-ónu v 100 ml etanolu sa pridá 20 ml koncentrovanej kyseliny chlorovodíkovej a reakčný roztok sa zahusť pri 60 °C a za tlaku asi 20 000 Pa v priebehu 5 hodín na rotačnej odparke. Odparok sa rozťieraním so zmesou etanolu a dietyléteru v pomere 1 : 1 privedie ku kryštalizácii a vysuší sa na vzduchu. Takto sa získa 4,3 g (50 % teória) 4-amino-1-(N-izobutylkarbamoyl)-3-metyltriazolín-5-ón s teplotou topenia 183 °C.

Príklad 2

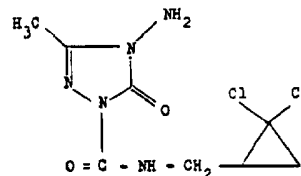


Postup b)

K 3,42 g (0,03 mól) 4-amino-3-metyl-1,2,4-(1H)-triazolín-5-ónu v 80 ml absolútneho acetonitrilu sa pridá 3,6 g (0,036 mól) terc.butylizokyanátu a 0,05 g až 0,1 g diazabicykloundecénu, zmes sa mieša 2 hodiny pri teplote 20 °C, potom sa zahusť za zníženého tlaku, zvyšok sa vyberie dichlórmetánom, premyje sa vodou, vysuší sa síranom sodným, zahusť sa za zníženého tlaku a zvyšok vykryštalizuje pri rozťieraní s dietyléterom.

Získa sa 5,0 g (78,3 % teória) 4-amino-1-(N-terc-butylkarbamoyl)-3-metyl-1,2,4-triazolín-5-ónu s teplotou topenia 132 °C.

Príklad 3

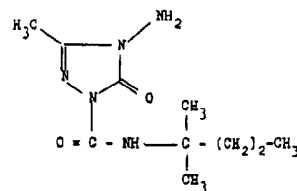


Postup a) - variant v jedinom reakčnom stupni

K 8,2 g (0,03 mól) 4-izopropylidénimino-3-metyl-1-fenoxy-karbonyl-1,2,4-triazolín-5-ónu v 50 ml absolútneho tetrahydrofuránu sa pridá 4,2 g (0,03 mól) (2,2-dichlórcyklo-propyl)metylamínu, zmes sa potom mieša 12 hodín pri teplote 20 °C, zahusť sa za zníženého tlaku, zvyšok sa vyberie 100 ml etanolu, pridajú sa 3 ml koncentrovanej chlorovodíkovej kyseliny a zmes sa mieša 3 až 4 hodiny pri teplote 60 °C za tlaku 20 000 Pa. S cieľom spracovať sa reakčná zmes zahusť za zníženého tlaku, zvyšok sa vyberie dichlórmetánom, dichlórmetánový roztok sa trikrát premyje nasýteným vodným roztokom hydrogénuhlčitanu sodného, vysuší sa síranom sodným a zahusť sa za zníženého tlaku. Zvyšok sa rozťieraním s dietyléterom privedie ku kryštalizácii.

Získa sa 4,4 g (52 % teória) 4-amino-1-[N-(2,2-dichlór-cyklopropyl-metyl)karbamoyl]-3-metyl-1,2,4-triazolín-5-ónu s teplotou topenia 149 °C.

Príklad 4

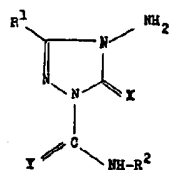


Postup c)

K 3,2 g (0,0137 mól) 4-amino-3-metyl-1-fenoxy-karbonyl-1,2,4-triazolín-5-ónu v zmesi pozostávajúcej z 25 ml tetrahydrofuránu a 10 ml dioxánu sa pridá 8,9 g (0,088 mól) 1,1-dimetylbutylamínu, reakčná zmes sa zahrieva 24 hodín k varu pod spätným chladičom, potom sa zahusť za zníženého tlaku, zvyšok sa vyberie dichlórmetánom, dichlórmetánový roztok sa premyje 2 % roztokom hydroxidu sodného a vodou, vysuší sa síranom sodným, rozpúšťadlo sa odstráni za zníženého tlaku a zvyšok pri rozťieraní s dietyléterom vykryštalizuje.

Získa sa 1,9 g (61 % teória) 4-amino-1-[N-(1,1-dimetylbutyl)karbamoyl]-3-metyl-1,2,4-triazolín-5-ónu s teplotou topenia 110 °C.

Analogickým spôsobom a podľa všeobecných údajov, týkajúcich sa spôsobu výroby, sa získajú nasledujúce substituované triazolinóny všeobecného vzorca (I):

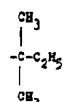
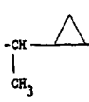
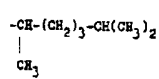
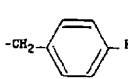
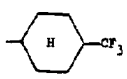
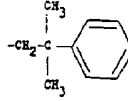
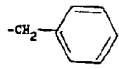
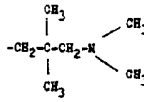
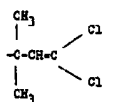
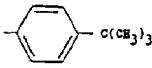
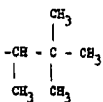
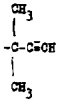
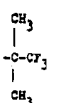
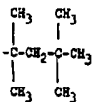
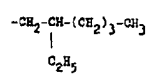
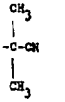
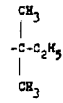
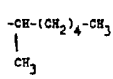
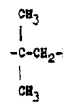
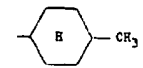
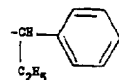
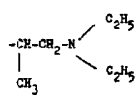


(I),

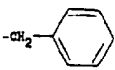
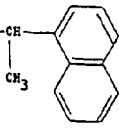
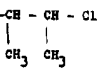
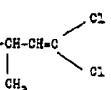
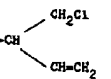
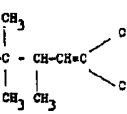
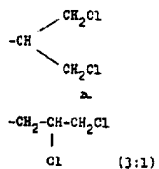
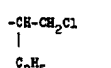
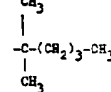
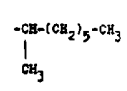
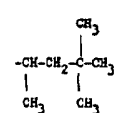
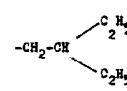
Příklad číslo	R ¹	R ²	X	Y	fyzikální vlastnosti
5	CH ₃		O	O	¹ H-NMR*) 1,5 (d)
6	CH ₃		O	O	¹ H-NMR*) 1,5 (d)
7	C ₂ H ₅		O	O	t.t. 139 °C
8	H		O	O	t.t. 161 °C
9	CH ₃	-CH(CH ₃) ₂	O	O	t.t. 63 °C
10	CH ₃	-(CH ₂) ₅ -CH ₂ Cl	O	O	¹ H-NMR*) 1,45 (m, 4H)
11	CH ₃	-CH-C ₂ H ₅ CH ₃	O	C	¹ H-NMR*) 0,95 (t, 3H)
12	CH ₃	-CH ₂ -	O	O	t.t. 133 °C
13	CH ₃	-CH(C ₂ H ₅) ₂	O	O	t.t. 103 °C
14	CH ₃	-CH-CH(CH ₃) ₂ CH ₃	O	O	t.t. 103 °C
15	CH ₃		O	O	t.t. 105 °C
16	CH ₃	-CH ₂ -CH ₂ -	O	O	t.t. 135 °C
17	CH ₃		O	O	t.t. 106 °C (rozklad)

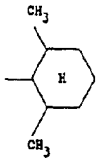
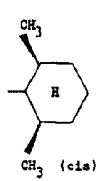
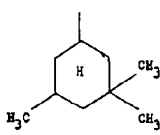
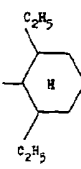
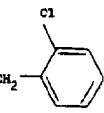
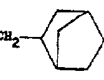
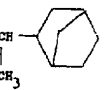
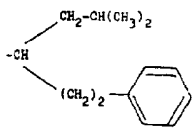
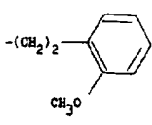
Příklad číslo	R ¹	R ²	X	Y	fyzikální vlastnosti
18	CH ₃	-CH-(CH ₂) ₂ -	O	O	n _D ²⁰ 1,5496
19	CH ₃		S	O	t.t. 128 °C
20	CH ₃		S	O	t.t. 100 °C
21	H	-(CH ₂) ₅ -CH ₂ Cl	O	O	t.t. 131 °C
22	CH ₃		O	O	t.t. 153 °C
23	CH ₃		O	O	t.t. 118 °C
24	CH ₃	-CH ₂ -CH=CH ₂	O	O	t.t. 92 °C
25	CH ₃	-CH ₂ -C(=O)-OC ₂ H ₅	O	O	t.t. 127 °C
26	CH ₃		O	O	n _D ²² 1,5055
27	CH ₃		O	O	t.t. 176 °C
28	C ₂ H ₅	-CH ₂ -C(=O)-CH ₃ CH ₃	O	O	¹ H-NMR*) 4,4; 7,95
29	CH ₃		O	O	t.t. 133 °C
30	C ₂ H ₅		O	O	t.t. 30-40 °C
31	CH ₃		O	O	¹ H-NMR*) 4,36; 8,23

SK 279720 B6

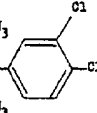
Příklad číslo	R ¹	R ²	X	Y	fyzikální vlastnosti	Příklad číslo	R ¹	R ²	X	Y	fyzikální vlastnosti
32	CH ₃		0	0	t.t. 99 °C	49	CH ₃		0	0	¹ H-NMR) 0,35-0,6; 0,93
33	CH ₃		0	0	¹ H-NMR) 4,40; 7,61	50	CH ₃		0	0	t.t. 175 °C
34	CH ₃		0	0	t.t. 162 °C	52	CH ₃		0	0	t.t. 152 °C
35	CH ₃		0	0	t.t. 198 °C	53	CH ₃	-C ₂ H ₅	0	0	t.t. 185 °C
36	CH ₃	-(CH ₂) ₃ -CH ₃	0	0	t.t. 108-109 °C	54	CH ₃		0	0	t.t. 198 °C (hydrochlorid)
37	CH ₃	CH ₃	0	0	t.t. 168-170 °C	55	CH ₃		0	0	t.t. 135 °C
38	CH ₃	-(CH ₂) ₂ -CH ₃	0	0	t.t. 134-136 °C	56	CH ₃		0	0	t.t. 200-203 °C
39	CH ₃		0	0	t.t. 149 °C	57	CH ₃		0	0	t.t. 119 °C
40	CH ₃		0	0	t.t. 149-151 °C	58	CH ₃		0	0	t.t. 136 °C
41	CH ₃		0	0	t.t. 93-94 °C	59	CH ₃		0	0	t.t. 122 °C
42	CH ₃	-CH ₂ -CH ₂ -CH ₃	0	0	t.t. 175-178 °C	60	CH ₃		0	0	t.t. 141 °C
43	CH ₃		0	0	t.t. 51-92 °C	61	CH ₃		0	0	t.t. 176 °C
44	C ₂ H ₅		0	0	t.t. 102-103 °C	62	CH ₃		0	0	t.t. 67 °C
45	CH ₃		0	0	t.t. 178 °C	63	CH ₃		0	0	t.t. 120 °C
46	CH ₃		0	0	t.t. 113 °C	64	CH ₃	-(CH ₂) ₂ -OCH ₃	0	0	t.t. 114 °C
47	CH ₃		0	0	t.t. 109 °C	65	CH ₃		0	0	t.t. 84 °C (hydrochlorid)
48	CH ₃		0	0	t.t. 148 °C	66	CH ₃	-(CH ₂) ₃ -CH ₃	0	S	t.t. 147 °C

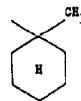
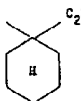
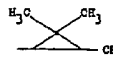
SK 279720 B6

Příklad číslo	R ¹	R ²	X	Y	fyzikální vlastnosti
67	CH ₃		0	S	t.t. 155 °C
68	CH ₃	-C ₂ H ₅	0	S	t.t. 205 °C
69	CH ₃	-CH ₃	0	S	t.t. 212 °C
70	CH ₃		0	0	t.t. 139 °C
71	CH ₃		0	0	t.t. 114 °C
72	CH ₃		0	0	n _D ²⁰ 1,5328
73	CH ₃		0	0	t.t. 120 °C
74	CH ₃		0	0	n _D ²⁰ 1,3840
75	CH ₃		0	0	t.t. 158 °C
76	CH ₃		0	0	t.t. 147 °C
78	CH ₃		0	0	n _D ²² 1,4891
79	CH ₃		0	0	n _D ²⁰ 1,4920
80	CH ₃		0	0	t.t. 140 °C
81	CH ₃		0	0	t.t. 115 °C

Příklad číslo	R ¹	R ²	X	Y	fyzikální vlastnosti
82	CH ₃		0	0	t.t. 134 °C
83	CH ₃		0	0	t.t. 164 °C
84	CH ₃		0	0	t.t. 144 °C
85	CH ₃		0	0	t.t. 121 °C
86	CH ₃		0	0	¹ H-NMR ²⁾ 2,33
87	CH ₃	-CH ₂ -CF ₃	0	0	t.t. 152 °C
88	CH ₃		0	S	t.t. 178 °C
89	CH ₃		0	0	t.t. 156 °C
90	CH ₃		0	0	t.t. 167 °C
91	CH ₃		0	0	t.t. 113 °C
92	CH ₃		0	0	t.t. 133 °C
93	CH ₃		0	0	t.t. 98 °C
94	CH ₃		0	0	t.t. 156 °C

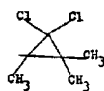
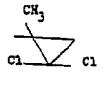
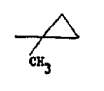
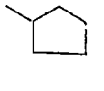
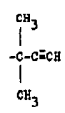
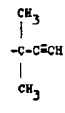
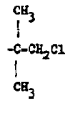
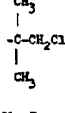
SK 279720 B6

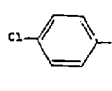
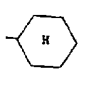
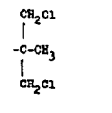
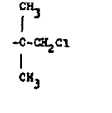
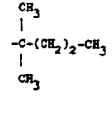
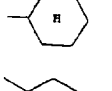
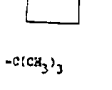
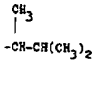
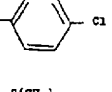
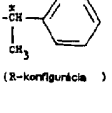
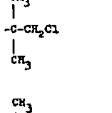
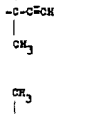
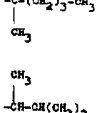
Příklad číslo	R ¹	R ²	X	Y	fyzikální vlastnosti
95	CH ₃	-(CH ₂) ₂ -  -OCH ₃	0	0	t.t. 210 °C
97	CH ₃	-CH ₂ -CH-C ₂ H ₅ CH ₃	0	0	t.t. 106 °C
98	CH ₃	-(CH ₂) ₂ -CH(CH ₃) ₂	0	0	t.t. 104 °C
99	CH ₃	-CH-  CF ₃	0	0	t.t. 120 °C (rozklad)
100	CH ₃	-CH ₂ -  -CH ₃	0	0	t.t. 108 °C
101	CH ₃	-CH ₂ -C(CH ₃) ₂ - 	0	0	t.t. 151 °C
102	CH ₃	-(CH ₂) ₂ - 	0	0	t.t. 151 °C
103	CH ₃	-C(CH ₃) ₂ -CH-CH ₃ CH ₃	0	0	t.t. 134 °C
104	CH ₃	-CH-(CH ₂) ₂ -CH ₃ CH ₃	0	0	n _D ²⁰ 1,4972
105	CH ₃	-C(C ₂ H ₅) ₂ -C ₂ H ₅ C ₂ H ₅	0	0	t.t. 128 °C
106	CH ₃	- 	0	0	t.t. 101 °C
107	CH ₃	-CH-(CH ₂) ₂ -CH-CH ₃ CH ₃	0	0	t.t. 73 °C
108	CH ₃	-(CH ₂) ₃ -N(CH ₃) ₂ -C ₂ H ₅	0	0	n _D ²⁰ 1,5815 (hydrochlorid)
109	CH ₃	-(CH ₂) ₃ -N(CH ₃) ₂ -CH ₃	0	0	t.t. 210 °C (hydrochlorid)

Příklad číslo	R ¹	R ²	X	Y	fyzikální vlastnosti
110	CH ₃	-CH-CH ₂ -CH- C ₂ H ₅	0	0	t.t. 145 °C
111	CH ₃	-CH-CH ₂ -CH-C ₂ H ₅ C ₂ H ₅ CH ₃	0	0	n _D ²⁰ 1,4890
112	CH ₃	-CH-CH ₂ -CH-CH ₃ CH ₃ CH ₃	0	0	n _D ²⁰ 1,4858
113	CH ₃	-CH-CH ₂ -N-  CH ₃	0	0	t.t. 108 °C (hydrochlorid)
114	CH ₃	-(CH ₂) ₄ -CH ₃	0	0	t.t. 81 °C
115	CH ₃	-CH-(CH ₂) ₃ -N(CH ₃) ₂ -C ₂ H ₅	0	0	n _D ²⁰ 1,5100 (hydrochlorid)
116	CH ₃	-CH-CH ₂ -N(CH ₃) ₂ -CH ₃	0	0	n _D ²⁰ 1,5150 (hydrochlorid)
117	CH ₃	- 	0	0	t.t. 157 °C
118	CH ₃	- 	0	0	t.t. 116 °C
119	CH ₃	- 	0	0	t.t. 145 °C
120	CH ₃	- 	0	0	t.t. 118 °C
121	CH ₃	-CH ₂ -CH ₂ -OC ₂ H ₅	0	0	t.t. 123 °C
122	CH ₃	- 	0	0	t.t. 213 °C
123	CH ₃	-  -CH=C(CH ₃) ₂	0	0	t.t. 93 °C
124	CH ₃	-  -CH ₃	0	0	t.t. 93 °C
125	CH ₃	-  -CH=C(Cl) ₂	0	0	1,58 (dd); 1,77 (t); 2,76 (t)

Příklad číslo	R ¹	R ²	X	Y	fyzikální vlastnosti
126	CH ₃		0	0	t.t. 142 °C
127	CH ₃		0	0	t.t. 123 °C (endo-forma)
128	CH ₃		0	0	t.t. 131 °C (exo-forma)
129	CH ₃		0	0	t.t. 133 °C
131	CH ₃		0	0	t.t. 117 °C
132	CH ₃		0	0	1H-NMR ^{a)} 1,45 (s), 7,04-7,43 (m)
133	CH ₃		0	0	t.t. 168 °C
134	CH ₃		0	0	t.t. 118 °C
135	CH ₃		0	0	t.t. 157 °C
136	CH ₃		0	0	t.t. 180 °C
137	CH ₃		0	0	t.t. 188 °C
138	CH ₃		0	0	t.t. 95 °C
139	C ₂ H ₅		0	0	t.t. 158 °C
140	C ₂ H ₅		0	0	t.t. 119 °C

Příklad číslo	R ¹	R ²	X	Y	fyzikální vlastnosti
141	C ₂ H ₅		0	0	t.t. 106 °C
142	C ₂ H ₅		0	0	t.t. 89 °C
143	C ₂ H ₅		0	0	n _D ²⁰ 1,4929
144	C ₂ H ₅		0	0	n _D ²⁰ 1,4955
145	CH ₃		0	0	t.t. 146 °C
146	C ₂ H ₅		0	0	t.t. 105 °C
147	CH ₃		0	0	t.t. 110 °C
148	CH ₃		0	0	t.t. 98 °C
149	CH ₃		0	0	t.t. 104 °C
150	CH ₃		0	0	t.t. 118 °C
151	CH ₃		0	0	t.t. 129 °C
152	CH ₃		0	0	t.t. 112 °C
153	CH ₃		0	0	t.t. 193 °C
154	CH ₃		0	0	t.t. 125 °C
155	C ₂ H ₅		0	0	n _D ²⁰ 1,4896
156	CH ₃		0	0	t.t. 185 °C
157	CH ₃		0	0	t.t. 158 °C
158	CH ₃		0	0	t.t. 132 °C
159	CH ₃		0	0	t.t. 98 °C

Príklad číslo	R ¹	R ²	X	Y	fyzikálne vlastnosti
160	CH ₃		0	0	t.t. 137 °C
161	CH ₃		0	0	t.t. 162 °C
162	CH ₃		0	0	t.t. 172 °C
163	C ₂ H ₅		0	0	t.t. 104 °C
164	(CH ₃) ₃ C-	-(CH ₂) ₅ -CH ₃	0	0	n _D ²⁰ =1,4980
165	CH ₃ -(CH ₂) ₂ -		0	0	t.t. 106 °C
166	(CH ₃) ₂ CH-		0	0	t.t. 90 °C
167	CH ₃	-(CH ₂) ₅ -CH ₃	0	0	t.t. 90 °C
168	(CH ₃) ₂ CH-		0	0	t.t. 133 °C
169	CH ₃ -(CH ₂) ₂ -		0	0	t.t. 98 °C
170	(CH ₃) ₃ C-		0	0	t.t. 158 °C
171	CH ₃ -(CH ₂) ₂ -		0	0	t.t. 100 °C
172	(CH ₃) ₂ CH-		0	0	n _D ²⁰ =1,5168
173	C ₂ H ₅		0	0	t.t. 137 °C
174	CH ₃ -(CH ₂) ₂ -		0	0	n _D ²⁰ =1,5890
175	(CH ₃) ₂ CH-		0	0	n _D ²⁰ =1,5650
176	CH ₃		0	0	t.t. 105 °C

Príklad číslo	R ¹	R ²	X	Y	fyzikálne vlastnosti
177			0	0	t.t. 185 °C
178	C ₂ H ₅		0	0	n _D ²⁰ =1,5149
179	C ₂ H ₅		0	0	t.t. 128 °C
180	C ₂ H ₅		0	0	n _D ²⁰ =1,4928
181	(CH ₃) ₃ C-		0	0	¹ H-NMR): 1,44 (9H), 4,48 (2H)
182	(CH ₃) ₃ C-		0	0	¹ H-NMR): 1,44 (9H), 4,53 (2H)
183	(CH ₃) ₃ C-	-C(CH ₃) ₃	0	0	t.t. 142 °C
184	C ₂ H ₅		0	0	t.t. 93 °C
185	(CH ₃) ₃ C-		0	0	t.t. 203 °C
186	CH ₃ -(CH ₂) ₂ -	-C(CH ₃) ₃	0	0	t.t. 112 °C
187	(CH ₃) ₂ CH-	-C(CH ₃) ₃	0	0	t.t. 108 °C
188		-C(CH ₃) ₃	0	0	t.t. 151 °C
189	(CH ₃) ₃ C-		0	0	n _D ²⁰ =1,5171
190	(CH ₃) ₃ C-		0	0	n _D ²⁰ =1,5411
191	(CH ₃) ₃ C-		0	0	t.t. 133 °C
192	(CH ₃) ₃ C-		0	0	t.t. 148 °C
193	(CH ₃) ₃ C-		0	0	n _D ²⁰ =1,4844
194	(CH ₃) ₃ C-		0	0	t.t. 135 °C

Príklad číslo	R ¹	R ²	X	Y	fyzikálne vlastnosti
195	(CH ₃) ₃ C-		0	0	t.t. 141 °C
196	(CH ₃) ₃ C-		0	0	t.t. 208 °C
197	(CH ₃) ₃ C-		0	0	n_D^{20} 1,5520
198	(CH ₃) ₃ C-		0	0	t.t. 172 °C
199	(CH ₃) ₂ CH-		0	0	t.t. 109 °C
200	(CH ₃) ₂ CH-		0	0	t.t. 83 °C
201	(CH ₃) ₂ CH-		0	0	n_D^{20} 1,4801
202			0	0	t.t. 177 °C
203			0	0	t.t. 107 °C
204	(CH ₃) ₂ CH-		0	0	t.t. 124 °C
205	(CH ₃) ₂ CH-		0	0	$^1H-NMR^*$: 1,34 (6H), 4,40 (2H), 3,12 (1H)
206	(CH ₃) ₂ CH-		0	0	t.t. 121 °C
207	(CH ₃) ₂ CH-		0	0	t.t. 124 °C
208	(CH ₃) ₂ CH-		0	0	n_D^{20} 1,4874
209	(CH ₃) ₂ CH-		0	0	n_D^{20} 1,4847
210	(CH ₃) ₂ CH-		0	0	n_D^{20} 1,4860
211	C ₂ H ₅		0	0	t.t. 136 °C

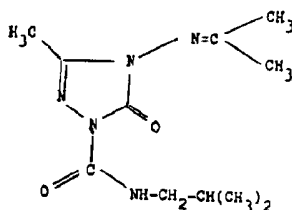
Príklad číslo	R ¹	R ²	X	Y	fyzikálne vlastnosti
212	C ₂ H ₅		0	0	$^1H-NMR^*$: 1,29 (t, 3H), 1,59 (d, 3H)
213	C ₂ H ₅		0	0	(amorfný produkt)
214	C ₂ H ₅		0	0	(amorfný produkt)
215	C ₂ H ₅		0	0	(amorfný produkt)
217	C ₂ H ₅		0	0	t.t. 118 °C
218	C ₂ H ₅		0	0	t.t. 105 °C
219	C ₂ H ₅		0	0	t.t. 114 °C
220	C ₂ H ₅		0	0	(amorfný produkt)
221	CH ₃		0	0	t.t. 128 °C
222	CH ₃		0	0	t.t. 118 °C
223	CH ₃		0	0	t.t. 112 °C
224	C ₂ H ₅		0	0	t.t. 90 °C
225	C ₂ H ₅		0	0	t.t. 108 °C

Poznámka k tabuľke:

*) ^1H-NMR spektrá boli vykonávané v deuteriochloroforme (CDCl₃) s použitím tetrametylsilánu ako vnútorného štandardu. Uvádza sa chemický posun ako hodnota δ v ppm.

Výroba východiskových látok

Príklad II-1

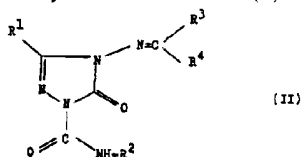


K 6 g (0,04 mól) 4-izopropylidénimino-3-metyl-1H-triazolín-5-ónu a 4 g (0,04 mól) trietylamínu v 20 ml dioxánu sa pri teplote 20 °C za miešania prikvapká 12 g (0,12 mól) izobutylizokyanátu a zmes sa po dokončení prídavku mieša 3 hodiny pri teplote 100 °C. S cieľom spracovať sa reakčná zmes zahusť za zníženého tlaku, zvyšok sa vyberie 100 ml dichlórmetánu, niekoľkokrát sa premyje vždy 100 ml vody, vysuší sa síranom sodným a za zníženého tlaku sa zbaví rozpúšťadla.

Získa sa 11,2 g (100 % teórie) 1-(N-izobutylkarbamoyl)-4-izopropylidénimino-3-metyl-1,2,4-triazolín-5-ónu vo forme oleja.

¹H-NMR spektrum (deuteriochloroform): d = 0,85 (d, 6H) ppm.

Zodpovedajúcim spôsobom a podľa všeobecných údajov týkajúcich sa spôsobu výroby sa získajú nasledujúce medziprodukty všeobecného vzorca (II)

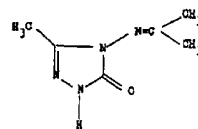


Tabuľka 2

Príklad číslo	R1	R2	$\begin{array}{c} R^3 \\ \diagup \\ C \\ \diagdown \\ R^4 \end{array}$	fyzikálne vlastnosti
II-2	CH ₃		=C(CH ₃) ₂	t.t. 125 °C
II-3	CH ₃		=CH-CH(CH ₃) ₂	¹ H-NMR (x) 3,9
II-4	CH ₃		=C(CH ₃) ₂	t.t. 87 °C
II-5	CH ₃	-CH(CH ₃) ₂	=C(CH ₃) ₂	t.t. 107 °C
II-6	CH ₃	-CH(C ₂ H ₅) ₂	=C(CH ₃) ₂	t.t. 68 °C
II-7	CH ₃	-CH-CH(CH ₃) ₂	=C(CH ₃) ₂	¹ H-NMR (x) 0,54 (d, CH ₃)
II-8	CH ₃		=C(CH ₃) ₂	t.t. 115 °C

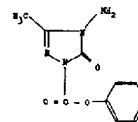
Príklad číslo	R1	R2	$\begin{array}{c} R^3 \\ \diagup \\ C \\ \diagdown \\ R^4 \end{array}$	fyzikálne vlastnosti
II-9	CH ₃		=C(CH ₃) ₂	t.t. 88 °C
II-10	CH ₃		=C(CH ₃) ₂	t.t. 139 °C
II-11	CH ₃		=C(CH ₃) ₂	olej
II-12	CH ₃	-CH ₂ -COOC ₂ H ₅	=C(CH ₃) ₂	t.t. 108 °C
II-13	CH ₃	-CH ₂ -CH=CH ₂	=C(CH ₃) ₂	t.t. 86 °C
II-17	CH ₃		=C(CH ₃) ₂	t.t. 121-122 °C

Príklad III-1



11,4 g (0,1 mól) 4-amino-3-metyl-1,2,4-(1H)-triazolín-5-ónu (porovnaj Europ. J. Med. Chem., Chim. Ther. 18, 215 - 220 (1983) a 0,1 g toluénsulfónovej kyseliny v 100 ml (79,06 g, 1,36 mól) acetónu sa mieša 40 hodín pri teplote 70 °C a potom sa zmes zahusť vo vákuu. Získa sa 15,4 g (100 % teória) 4-izopropylidénimino-3-metyl-1,2,4-(1H)-triazolín-5-ónu s teplotou topenia 140 až 144 °C.

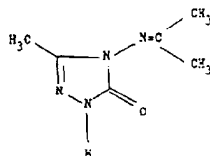
Príklad V-1



K 2,3 g (0,02 mól) 4-amino-3-metyl-1,2,4-(1H)triazolín-5-ónu v 25 ml absolútneho tetrahydrofuránu sa pridá 2,7 g (0,024 mól) terc-butoxidu draselného, reakčná zmes sa mieša 1 hodinu pri teplote 20 °C, potom sa k nej za miešania prikvapká 3,1 g (0,02 mól) fenylesteru chlômravčej kyseliny, reakčná zmes sa mieša 12 hodín pri teplote miestnosti, potom sa pomocou ľadovej kyseliny octovej upraví na pH 5, zahusť sa za zníženého tlaku, zvyšok sa vyberie chloroformom, premyje sa vodou, vysuší sa síranom sodným, zahusť sa za zníženého tlaku a zvyšok vykryštalizuje pri rozťieraní s éterom.

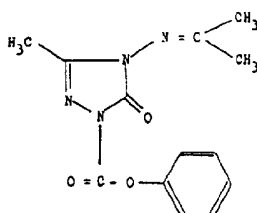
Získa sa 1,1 g (23,5 % teórie) 4-amino-3-metyl-1-fenoxy-karbonyl-1,2,4-triazolín-5-ónu s teplotou topenia 175 °C.

Príklad VIII-1



11,4 g (0,1 mól) 4-amino-3-metyl-1,2,4-(1H)-triazolín-5-ónu (porovnaj Europ. J. Med. Chem., Chim. Ther. 18, 215 - 220 (1983)) a 0,1 g p-toluénsulfónovej kyseliny v 100 ml (79,06 g, 1,36 mól) acetónu sa mieša 40 hodín pri teplote 70 °C a potom sa reakčná zmes zahusť za zníženého tlaku. Získa sa 15,4 g (100 % teórie) 4-izo-propylidénimino-3-metyl-1,2,4-(1H)-triazolín-5-ónu s teplotou topenia 140 až 144 °C.

Príklad X-1

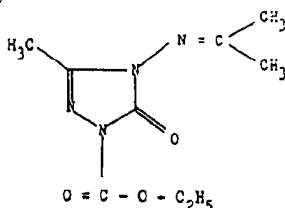


K 15,4 g (0,1 mól) 4-izopropylidénimino-3-metyl-1,2,4-(1H)-triazolín-5-ónu v 100 ml absolútneho tetrahydrofuránu sa pridá pri teplote miestnosti najprv 13,4 g (0,12 mól) terc-butoxidu draselného, reakčná zmes sa mieša jednu hodinu pri teplote miestnosti, potom sa pridá 15,5 g (0,1 mól) fenylesteru chlórmyravej kyseliny a zmes sa mieša ďalších 12 hodín pri teplote 20 °C.

S cieľom spracovať sa reakčná zmes okyslí ľadovou kyselinou octovou, zahusť sa za zníženého tlaku, zvyšok sa vyberie chloroformom, premyje sa vodou, vysuší sa síranom sodným, znova sa zahusť za zníženého tlaku a prekryštalizuje sa z acetónu.

Získa sa 10 g (36 % teórie) 4-izopropylidénimino-3-metyl-1-fenoxykarbonyl-1,2,4-triazolín-5-ónu s teplotou topenia 162 °C.

Príklad X-2



7,7 g (0,05 mól) 4-izopropylidénimino-3-metyl-1,2,4-(1H)-triazolín-5-ónu v 50 ml absolútneho tetrahydrofuránu sa pri teplote 20 °C pridá 1,5 g (0,05 mól) hydridu sodného, reakčná zmes sa mieša 1 hodinu pri teplote miestnosti, potom sa k nej prikvapká za miešania 5,4 g (0,05 mól) etylesteru chlórmyravej kyseliny a po skončení prídavku sa reakčná zmes mieša ďalších 12 hodín pri teplote 20 °C.

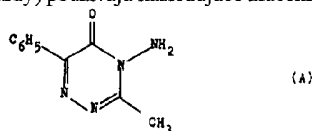
S cieľom spracovať sa reakčná zmes okyslí ľadovou kyselinou octovou, potom sa zahusť za zníženého tlaku, zvyšok sa vyberie dichlórmetánom, dichlórmetánový roztok sa premyje vodou, vysuší sa síranom sodným,

znova sa zahusť za zníženého tlaku a prekryštalizuje sa z izopropylalkoholu.

Získa sa 5,0 g (44 % teórie) 1-etoxykarbonyl-4-izo-propylidénimino-3-metyl-1,2,4-triazolín-5-ónu s teplotou topenia 91 °C.

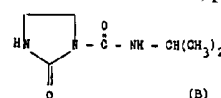
Príklady ilustrujúce biologickú účinnosť

V nasledujúcich príkladoch sa ako porovnávacie látky (standarty) používajú nasledujúce zlúčeniny:



Zlúčenina A:

4-amino-3-metyl-6-fenyl-1,2,4-triazín-5-ón
(zlúčenina známa z DE-OS 23 64 474, príklad 1-22),



Zlúčenina B:

N-izobutyl-2-oximidazolidín-1-karboxamid
(zlúčenina známa z publikácie R. Weglera "Chemie der Pflanzenschutz- und Schädlingsbekämpfungsmittel", zv. 5, str. 219 (1977)).

Príklad A

Preemergentný test

Rozpúšťadlo: 5 dielov hmotnostných acetónu

Emulgátor: 1 diel hmotnostný alkylarylpolglykoléteri

Na prípravu vhodného účinného prípravku sa zmieša 1 diel hmotnostnej účinnej látky s uvedeným množstvom rozpúšťadla, pridá sa uvedené množstvo emulgátora a koncentrát sa zriedi vodou na požadovanú koncentráciu.

Semená testovaných rastlín sa zasejú do normálnej pôdy a po 24 hodinách sa zalejú prípravkom účinnej látky. Pritom sa udržiava množstvo vody na jednotku plochy účelne na konštantnej hodnote. Koncentrácia účinnej látky v prípravku nehrá žiadnu úlohu, rozhodujúce je iba použité množstvo účinnej látky na jednotku plochy. Po troch týždňoch sa hodnotí stupeň poškodenia rastlín v % poškodenia v porovnaní s vývojom neošetrených kontrolných rastlín. Pritom znamená:

0 % žiaden účinok (ako v prípade neošetrených kontrolných rastlín)

100 % úplné zničenie (odumretie) rastlín.

Pri tomto teste majú napríklad zlúčeniny z príkladov vyhotovenia 2, 14, 23, 32, 41, 45, 48 a 57 výrazne lepší herbicídny účinok proti burinám a výrazne lepšiu selektivitu v úžitkových rastlinách, napríklad v cukrovej repe ako porovnávacia látka B. Podobným spôsobom majú napríklad zlúčeniny z príkladov vyhotovenia 7 a 175 výrazne lepší herbicídny účinok a dobrú selektivitu v jačmeni.

Výsledky týchto testov sú zhrnuté v nasledujúcich tabuľkách A a A-1.

Tabuľka A - 1: posmergerentný test (pokusy v skleníku)

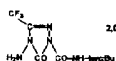
účinná látka	počet množstvo (g/ha)	účinná látka	účinná látka	účinná látka	účinná látka	účinná látka	účinná látka
(a)	2000	30	70	0	40	80	60
(2)	2000	0	90	100	100	100	100
(14)	2000	0	80	100	100	100	100
(23)	2000	0	90	100	100	100	100
(32)	2000	0	95	100	100	100	100
(41)	2000	0	80	100	100	100	100
(45)	2000	0	80	100	100	100	100
(48)	2000	0	80	100	100	100	100
(57)	2000	0	80	100	100	100	100

Tabuľka A - 2: posmergerentný test (pokusy v skleníku)

účinná látka	počet množstvo (g/ha)	účinná látka	účinná látka	účinná látka	účinná látka	účinná látka	účinná látka
(7)	1000	0	100	100	100	90	100
(175)	500	10	100	95	100	100	100

Tabuľka A - 3: posmergerentný test (pokusy v skleníku)

účinná látka	počet množstvo (g/ha)	účinná látka	účinná látka	účinná látka	účinná látka	účinná látka	účinná látka
(7)	1000	0	100	100	100	100	100
(175)	500	10	100	95	100	100	100



Príklad B

Postmergerentný test

Rozpúšťadlo: 5 dielov hmotnostných acetónu

Emulgátor: 1 diel hmotnostný alkylarylpolyglykoléteru
Na prípravu vhodného účinného prípravku sa zmieša 1 diel účinnej látky s uvedeným množstvom rozpúšťadla, pridá sa uvedené množstvo emulgátora a koncentrát sa zriedi vodou na požadovanú koncentráciu.

Účinným prípravkom sa postriekajú pokusné rastliny, ktoré majú výšku 5 až 15 cm tak, aby sa na jednotku plochy aplikovalo vždy požadované množstvo účinnej látky. Koncentrácia postrekovej suspenzie sa volí tak, aby sa vždy potrebné množstvo účinnej látky aplikovalo v 2 000 litroch vody na 1 ha. Po troch týždňoch sa hodnotí stupeň poškodenia rastlín v % poškodenia v porovnaní s vývojom neošetrených kontrolných rastlín.

Pritom znamená:

0 % = žiaden účinok (účinnok rovnaký ako v prípade neošetrených kontrolných rastlín)

100 % = úplné zničenie (odumretie) rastlín.

Pri tomto teste majú napríklad zlúčeniny podľa príkladov vyhotovenia 1 a 48, ďalej zlúčeniny podľa príkladov vyhotovenia 2, 14, 23, 32, 41, 45, 48, 57, 78, ako i zlúčeniny z príkladov vyhotovenia 7, 15, 34, 3, 63, 138 a 175 pri hubení jednoklíčnych a dvojklíčnych burín podstatne lepší herbicídny účinok ako porovnávacia látka A, prípadne B.

Výsledky týchto testov sú zhrnuté v nasledujúcich tabuľkách B-1, B-2 a B-3:

Tabuľka B - 1: posmergerentný test (pokusy v skleníku)

účinná látka	počet množstvo (g/ha)	účinná látka	účinná látka	účinná látka	účinná látka	účinná látka	účinná látka
(a)	2,0	0	0	70	0	80	0
(2)	2,0	0	100	95	100	100	90
(48)	2,0	0	100	95	100	100	80
(175)	1,0	0	100	95	100	100	80

Tabuľka B - 2: posmergerentný test (pokusy v skleníku)

účinná látka	počet množstvo (g/ha)	účinná látka	účinná látka	účinná látka	účinná látka	účinná látka	účinná látka
(9)	2000	50	20	70	30	0	60
(2)	2000	0	100	100	100	95	100
(14)	2000	0	90	100	100	100	100
(23)	2000	0	100	100	100	100	100
(32)	2000	10	100	100	100	100	100
(41)	2000	0	100	100	100	100	100
(45)	2000	10	100	100	100	100	100
(48)	2000	0	90	95	100	100	100
(57)	2000	10	100	100	100	100	100
(78)	2000	10	100	100	100	100	100

Tabuľka B - 3: posmergerentný test (pokusy v skleníku)

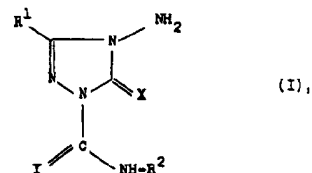
účinná látka	počet množstvo (g/ha)	účinná látka	účinná látka	účinná látka	účinná látka	účinná látka	účinná látka
(7)	500	0	100	100	100	100	100
(15)	1000	0	80	100	100	95	80
(34)	1000	0	90	100	100	90	100
(3)	1000	0	100	70	100	30	100
(63)	1000	0	100	90	100	30	95
(138)	500	0	100	95	100	100	100
(175)	500	10	100	100	100	100	100

Tabuľka B - 4: posmergerentný test (pokusy v skleníku)

účinná látka	počet množstvo (g/ha)	účinná látka	účinná látka	účinná látka	účinná látka	účinná látka	účinná látka
(7)	1000	10	100	100	95	95	95

PATENTOVÉ NÁROKY

1. Substituované triazolinóny všeobecného vzorca (I)



v ktorom

R¹ znamená atóm vodíka, priamu alebo rozvetvenú alkylovú skupinu s 1 až 8 atómami uhlíka, cykloalkylovú skupinu s 3 až 7 atómami uhlíka v cykloalkylovej časti, prípadne aspoň raz, rovnako alebo rôzne atómom halogénu substituovanú arylovú skupinu so 6 až 10 atómami uhlíka alebo halogénalkylovú skupinu s 1 až 4 atómami uhlíka a s až 9 rovnakými alebo rozdielnymi atómami halogénu,

R² znamená priamu alebo rozvetvenú alkylovú skupinu s 1 až 18 atómami uhlíka, alkenylovú skupinu s 2 až 8 atómami uhlíka, alkinyllovú skupinu s 2 až 8 atómami uhlíka, halogénalkylovú skupinu s 1 až 8 atómami uhlíka a s 1 až 17 rovnakými alebo rozdielnymi atómami halogénu, halogénalkenylovú skupinu s 2 až 8 atómami uhlíka a s 1 až 15 rovnakými alebo rozdielnymi atómami halogénu, kyanoalkylovú skupinu s 1 až 8 atómami uhlíka, alkoxyalkylovú skupinu s 1 až 6 atómami uhlíka v alkoxylovej i alkylovej časti, alkoxykarbonylalkylovú skupinu so vždy s 1 až 6 atómami uhlíka v alkoxylovej i alkylovej časti, alkoxykarbonylalkenylovú skupinu s 1 až 6 atómami uhlíka v alkoxylovej časti a s 2 až 6 atómami uhlíka v alkenylovej časti, alkylaminoalkylovú skupinu s 1 až 6 ató-

mami uhlíka v alkylových častiach, dialkylaminoalkylovú skupinu s 1 až 6 atómami uhlíka v alkylových častiach alebo vždy prípadne aspoň raz rovnako alebo rôzne substituovanú cykloalkylovú, alebo cykloalkylalkylovú skupinu vždy s 3 až 12 atómami uhlíka v cykloalkylovej časti a s 1 až 6 atómami uhlíka v alkylovej časti s priamym alebo rozvetveným reťazcom, pričom ako substituenty prichádzajú do úvahy atóm halogénu, priama alebo rozvetvená alkylová skupina s 1 až 4 atómami uhlíka, halogénalkylová skupina s 1 až 4 atómami uhlíka, halogénalkylová skupina s 1 až 4 atómami uhlíka a s 1 až 9 rovnakými alebo rôznymi atómami halogénu alebo halogénalkenyllová skupina s 1 až 4 atómami uhlíka v priamom alebo rozvetvenom reťazci a s 1 až 5 rovnakými alebo rozdielnymi atómami halogénu, ďalej R^2 znamená prípadne aspoň jednu, rovnako alebo rôzne substituovanú aralkylovú skupinu, alebo aryllovú skupinu so 6 až 10 atómami uhlíka v aryllovej časti a prípadne s 1 až 8 atómami uhlíka v priamej alebo v rozvetvenej alkylovej časti, pričom ako substituenty alkylovej skupiny prichádzajú prípadne do úvahy atómy halogénu a ako substituenty aryllovej skupiny prichádzajú do úvahy atóm halogénu, priama alebo rozvetvená alkylová skupina s 1 až 6 atómami uhlíka alebo alkoxy skupina s 1 až 6 atómami uhlíka,

X znamená atóm kyslíka alebo atóm síry a

Y znamená atóm kyslíka alebo atóm síry.

2. Substituované triazolinóny všeobecného vzorca (I) podľa nároku 1, v ktorom

R^1 znamená atóm vodíka, priamu alebo rozvetvenú alkylovú skupinu s 1 až 8 atómami uhlíka, cykloalkylovú skupinu s 3 až 7 atómami uhlíka alebo prípadne aspoň raz, rovnako alebo rôzne atómom halogénu substituovanú aryllovú skupinu so 6 až 10 atómami uhlíka,

R^2 znamená priamu alebo rozvetvenú alkylovú skupinu s 1 až 18 atómami uhlíka, alkenylovú skupinu s 2 až 8 atómami uhlíka, alkinylovú skupinu s 2 až 8 atómami uhlíka, halogénalkylovú skupinu s 1 až 8 atómami uhlíka a s 1 až 17 rovnakými alebo rozdielnymi atómami halogénu, halogénalkenyllovú skupinu s 2 až 8 atómami uhlíka a s 1 až 15 rovnakými alebo rozdielnymi atómami halogénu, kyanoalkylovú skupinu s 1 až 8 atómami uhlíka, alkoxyalkylovú skupinu s 1 až 6 atómami uhlíka v alkoxylovej i alkylovej časti alebo alkoxykarbonylalkylovú skupinu so vždy s 1 až 6 atómami uhlíka v alkoxylovej i alkylovej časti, dialkylaminoalkylovú skupinu s 1 až 6 atómami uhlíka v alkylových častiach alebo vždy prípadne aspoň raz rovnako alebo rôzne substituovanú cykloalkylovú, alebo cykloalkylalkylovú skupinu vždy s 3 až 8 atómami uhlíka v cykloalkylovej časti a s 1 až 6 atómami uhlíka v alkylovej časti s priamym alebo rozvetveným reťazcom, pričom ako substituenty prichádzajú do úvahy atóm halogénu, priama alebo rozvetvená alkylová skupina s 1 až 4 atómami uhlíka, halogénalkylová skupina s 1 až 4 atómami uhlíka a s 1 až 9 rovnakými alebo rôznymi atómami halogénu, alebo halogénalkenyllová skupina s 1 až 4 atómami uhlíka v priamom alebo rozvetvenom reťazci a s 1 až 5 rovnakými alebo rozdielnymi atómami halogénu, ďalej R^2 znamená prípadne aspoň jednu, rovnako alebo rôzne substituovanú aralkylovú alebo aryllovú skupinu so 6 až 10 atómami uhlíka v aryllovej časti a prípadne s 1 až 8 atómami uhlíka v priamej alebo v rozvetvenej alkylovej časti, pričom ako substituenty alkylovej skupiny prichádzajú prípadne do úvahy atómy halogénu a ako substituenty aryllovej skupiny prichádzajú do úvahy atóm halogénu, priama alebo rozvetvená alkylová skupina s 1 až 6 a-

tómami uhlíka alebo alkoxy skupina s 1 až 6 atómami uhlíka,

X znamená atóm kyslíka alebo atóm síry a

Y znamená atóm kyslíka alebo atóm síry.

3. Substituované triazolinóny všeobecného vzorca (I) podľa nároku 1, v ktorom

R^1 znamená alkylovú skupinu s 1 až 4 atómami uhlíka alebo halogénalkylovú skupinu s 1 až 4 atómami uhlíka a s až 9 rovnakými alebo rozdielnymi atómami halogénu, R^2 znamená alkylovú skupinu s 1 až 10 atómami uhlíka, halogénalkylovú skupinu s 1 až 6 atómami uhlíka a s 1 až 13 atómami halogénu, cykloalkylovú skupinu s 3 až 12 atómami uhlíka, ktorá je prípadne substituovaná alkylovou skupinou s 1 až 4 atómami uhlíka alebo halogénalkylovou skupinou s 1 až 4 atómami uhlíka; ďalej znamená alkinylovú skupinu s 2 až 8 atómami uhlíka, cykloalkylalkylovú skupinu s 3 až 8 atómami uhlíka v cyklickej časti a s 1 až 4 atómami uhlíka v alkylovej časti, pričom cykloalkylalkylová skupina je prípadne substituovaná v cyklickej časti alkylovou skupinou s 1 až 4 atómami uhlíka alebo atómom halogénu, alebo znamená alkoxyalkylovú skupinu s 1 až 4 atómami uhlíka v alkoxylovej i alkylovej časti,

X znamená atóm kyslíka a

Y znamená atóm kyslíka.

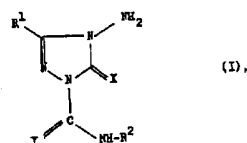
4. Substituované triazolinóny všeobecného vzorca (I) podľa nároku 1, v ktorom

R^1 znamená alkylovú skupinu s 1 až 4 atómami uhlíka, R^2 znamená alkylovú skupinu s 1 až 10 atómami uhlíka, halogénalkylovú skupinu s 1 až 6 atómami uhlíka a s 1 až 13 atómami halogénu, cykloalkylovú skupinu s 3 až 8 atómami uhlíka, ktorá je prípadne substituovaná alkylovou skupinou s 1 až 4 atómami uhlíka alebo halogénalkylovou skupinou s 1 až 4 atómami uhlíka; ďalej znamená alkinylovú skupinu s 2 až 8 atómami uhlíka, cykloalkylalkylovú skupinu s 3 až 8 atómami uhlíka v cykloalkylovej časti a s 1 až 4 atómami uhlíka v alkylovej časti, pričom táto skupina je v cyklickej časti prípadne substituovaná alkylovou skupinou s 1 až 4 atómami uhlíka alebo atómom halogénu; alebo znamená alkoxyalkylovú skupinu s 1 až 4 atómami uhlíka v alkoxylovej i alkylovej časti, a

X znamená atóm kyslíka a

Y znamená atóm kyslíka.

5. Spôsob výroby substituovaných triazolinónov všeobecného vzorca (I) podľa nároku 1



v ktorom

R^1 znamená atóm vodíka, priamu alebo rozvetvenú alkylovú skupinu s 1 až 8 atómami uhlíka, cykloalkylovú skupinu s 3 až 7 atómami uhlíka v cykloalkylovej časti, prípadne aspoň raz, rovnako alebo rôzne atómom halogénu substituovanú aryllovú skupinu so 6 až 10 atómami uhlíka alebo halogénalkylovú skupinu s 1 až 4 atómami uhlíka a s až 9 rovnakými alebo rozdielnymi atómami halogénu,

R^2 znamená priamu alebo rozvetvenú alkylovú skupinu s 1 až 18 atómami uhlíka, alkenylovú skupinu s 2 až 8 atómami uhlíka, alkinylovú skupinu s 2 až 8 atómami uhlíka, halogénalkylovú skupinu s 1 až 8 atómami uhlíka a s 1 až 17 rovnakými alebo rozdielnymi atómami halogénu,

halogénalkenyllovú skupinu s 2 až 8 atómami uhlíka a s 1 až 15 rovnakými alebo rozdielnymi atómami halogénu, kyanoalkyllovú skupinu s 1 až 8 atómami uhlíka, alkoxyalkyllovú skupinu s 1 až 6 atómami uhlíka v alkoxylovej i alkylovej časti, alkoxykarbonylalkyllovú skupinu vždy s 1 až 6 atómami uhlíka v alkoxylovej i alkylovej časti, alkoxykarbonylalkenyllovú skupinu s 1 až 6 atómami uhlíka v alkoxylovej časti a s 2 až 6 atómami uhlíka v alkenylovej časti, alkylaminoalkyllovú skupinu s 1 až 6 atómami uhlíka v alkylových častiach, dialkylaminoalkyllovú skupinu s 1 až 6 atómami uhlíka v alkylových častiach alebo vždy prípadne aspoň raz rovnako, alebo rôzne substituovanú cykloalkyllovú, alebo cykloalkylalkyllovú skupinu vždy s 3 až 12 atómami uhlíka v cykloalkyllovej časti a s 1 až 6 atómami uhlíka v alkylovej časti s priamym alebo rozvetveným reťazcom, pričom ako substituenty prichádzajú do úvahy atóm halogénu, priama alebo rozvetvená alkylová skupina s 1 až 4 atómami uhlíka, halogénalkyllová skupina s 1 až 4 atómami uhlíka, halogénalkyllová skupina s 1 až 4 atómami uhlíka a s 1 až 9 rovnakými alebo rôznymi atómami halogénu alebo halogénalkenyllová skupina s až 4 atómami uhlíka v priamom alebo rozvetvenom reťazci a s 1 až 5 rovnakými alebo rozdielnymi atómami halogénu,

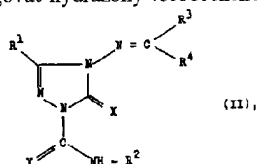
ďalej R^2 znamená prípadne aspoň raz, rovnako alebo rôzne substituovanú aralkyllovú skupinu alebo aryllovú skupinu so 6 až 10 atómami uhlíka v aryllovej časti a prípadne s 1 až 8 atómami uhlíka v priamej alebo v rozvetvanej alkylovej časti, pričom ako substituenty alkylovej skupiny prichádzajú prípadne do úvahy atómy halogénu a ako substituenty aryllovej skupiny prichádzajú do úvahy atóm halogénu, priama alebo rozvetvená alkylová skupina s 1 až 6 atómami uhlíka alebo alkoxy skupina s 1 až 6 atómami uhlíka,

X znamená atóm kyslíka alebo atóm síry a

Y znamená atóm kyslíka alebo atóm síry,

v y z n a č u j ú c i s a t ý m , že sa

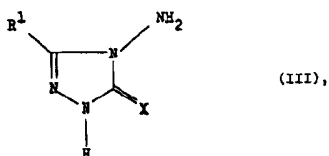
a) nechajú reagovať hydrazóny všeobecného vzorca (II)



v ktorom

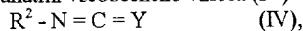
R^1 , R^2 , X a Y majú významy uvedené v nároku 1 a R^3 a R^4 znamenajú nezávisle od seba atóm vodíka, alkylovú skupinu, aralkyllovú skupinu alebo aryllovú skupinu, s kyselinou, prípadne v prítomnosti riedidla, alebo sa

b) nechajú reagovať 1H-triazolinóny všeobecného vzorca (III)



v ktorom

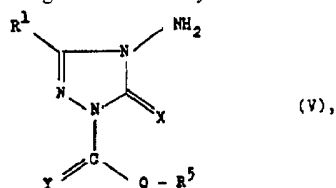
R^1 a X majú významy uvedené v nároku 1, s izo(tio)kyanátmi všeobecného vzorca (IV)



v ktorom

R^2 a Y majú významy uvedené v nároku 1, prípadne v prítomnosti riedidla a prípadne v prítomnosti pomocného reakčného činidla, alebo sa

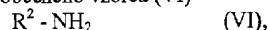
c) nechajú reagovať triazolinóny všeobecného vzorca (V)



v ktorom

R^1 , X a Y majú významy uvedené v nároku 1 a R^5 znamená alkylovú skupinu, aryllovú skupinu alebo aralkyllovú skupinu,

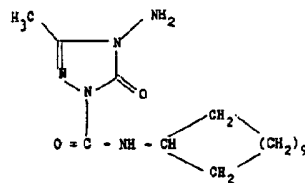
s amínmi všeobecného vzorca (VI)



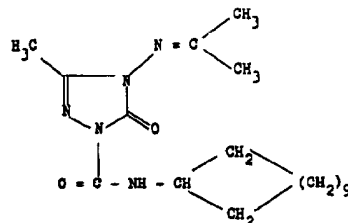
v ktorom

R^2 má význam uvedený v nároku 1, prípadne v prítomnosti riedidla a prípadne v prítomnosti pomocného reakčného činidla.

6. Spôsob podľa nároku 5 na výrobu zlúčeniny vzorca

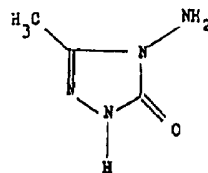


v y z n a č u j ú c i s a t ý m , že sa na zlúčeninu vzorca

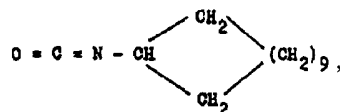


pôsobí kyselinou, prípadne v prítomnosti riedidla, alebo

sa nechá reagovať zlúčenina vzorca

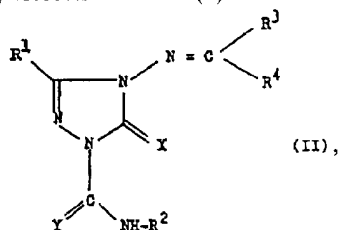


so zlúčeninou vzorca



prípadne v prítomnosti riedidla a prípadne v prítomnosti pomocného reakčného činidla.

7. Medziprodukt na prípravu zlúčenín všeobecného vzorca (I), podľa niektorého z nárokov 1 až 4, ktorým sú hydrazóny všeobecného vzorca (II)



v ktorom

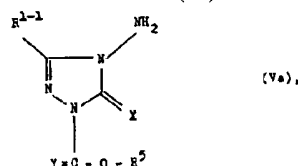
R^1 znamená atóm vodíka, priamu alebo rozvetvenú alkylovú skupinu s 1 až 8 atómami uhlíka, cykloalkylovú skupinu s 3 až 7 atómami uhlíka v cykloalkylovej časti, prípadne aspoň raz, rovnako alebo rôzne atómom halogénu substituovanú arylovú skupinu so 6 až 10 atómami uhlíka alebo halogénalkylovú skupinu s 1 až 4 atómami uhlíka a s až 9 rovnakými alebo rozdielnymi atómami halogénu, R^2 znamená priamu alebo rozvetvenú alkylovú skupinu s 1 až 18 atómami uhlíka, alkenylovú skupinu s 2 až 8 atómami uhlíka, alkinylovú skupinu s 2 až 8 atómami uhlíka, halogénalkylovú skupinu s 1 až 8 atómami uhlíka a s 1 až 17 rovnakými alebo rozdielnymi atómami halogénu, halogénalkenylovú skupinu s 2 až 8 atómami uhlíka a s 1 až 15 rovnakými alebo rozdielnymi atómami halogénu, kvanoalkylovú skupinu s 1 až 8 atómami uhlíka, alkoxyalkylovú skupinu s 1 až 6 atómami uhlíka v alkoxylovej i alkylovej časti, alkoxykarbonylalkylovú skupinu vždy s 1 až 6 atómami uhlíka v alkoxylovej i alkylovej časti, alkoxykarbonylalkenylovú skupinu s 1 až 6 atómami uhlíka v alkoxylovej časti a s 2 až 6 atómami uhlíka v alkenylovej časti, alkylaminoalkylovú skupinu s 1 až 6 atómami uhlíka v alkylových častiach, dialkylaminoalkylovú skupinu s 1 až 6 atómami uhlíka v alkylových častiach alebo vždy prípadne aspoň raz rovnako, alebo rôzne substituovanú cykloalkylovú, alebo cykloalkylalkylovú skupinu vždy s 3 až 12 atómami uhlíka v cykloalkylovej časti a s 1 až 6 atómami uhlíka v alkylovej časti s priamym alebo rozvetveným reťazcom, pričom ako substituenty prichádzajú do úvahy atóm halogénu, priama alebo rozvetvená alkylová skupina s 1 až 4 atómami uhlíka, halogénalkylová skupina s 1 až 4 atómami uhlíka a s 1 až 9 rovnakými alebo rôznymi atómami halogénu alebo halogénalkenylová skupina s až 4 atómami uhlíka v priamom alebo rozvetvenom reťazci a s 1 až 5 rovnakými alebo rozdielnymi atómami halogénu, ďalej R^2 znamená prípadne aspoň jednu, rovnako alebo rôzne substituovanú aralkylovú skupinu alebo arylovú skupinu so 6 až 10 atómami uhlíka v arylovej časti a prípadne s 1 až 8 atómami uhlíka v priamej alebo v rozvetvenej alkylovej časti, pričom ako substituenty alkylovej skupiny prichádzajú prípadne do úvahy atómy halogénu a ako substituenty arylovej skupiny prichádzajú do úvahy atóm halogénu, priama alebo rozvetvená alkylová skupina s 1 až 6 atómami uhlíka alebo alkoxy skupina s 1 až 6 atómami uhlíka,

R^3 a R^4 znamenajú nezávisle od seba atóm vodíka, alkylovú skupinu s 1 až 4 atómami uhlíka, fenylovú skupinu alebo benzylovú skupinu,

X znamená atóm kyslíka alebo atóm síry a

Y znamená atóm kyslíka alebo atóm síry.

8. Medziprodukt na prípravu zlúčenín všeobecného vzorca (I) podľa niektorého z nárokov 1 až 4, ktorým sú triazolinóny všeobecného vzorca (Va)



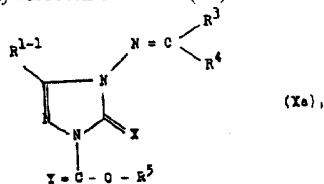
v ktorom

R^{1-1} znamená alkylovú skupinu s 1 až 4 atómami uhlíka,

R^5 znamená alkylovú skupinu s 1 až 4 atómami uhlíka, prípadne raz až trikrát substituovanú fenylovú skupinu alebo benzylovú skupinu, pričom ako substituenty prichádzajú do úvahy vždy atóm halogénu, kyanoskupina, nitroskupina, alkylová skupina, alkoxy skupina či alkyltioskupina, vždy s 1 až 4 atómami uhlíka, halogénalkylová skupina, halogénalkoxy skupina alebo halogénalkyltioskupina vždy s 1 až 4 atómami uhlíka, a

X a Y znamenajú nezávisle od seba atóm kyslíka alebo atóm síry.

9. Medziprodukt na prípravu zlúčenín všeobecného vzorca (I) podľa niektorého z nárokov 1 až 4, ktorým sú triazolinóny všeobecného vzorca (Xa)



v ktorom

R^{1-1} znamená alkylovú skupinu s 1 až 4 atómami uhlíka,

R^3 a R^4 znamenajú nezávisle od seba atóm vodíka, alkylovú skupinu s 1 až 4 atómami uhlíka, fenylovú skupinu alebo benzylovú skupinu,

R^5 znamená alkylovú skupinu s 1 až 4 atómami uhlíka, prípadne raz až trikrát substituovanú fenylovú alebo benzylovú skupinu, pričom ako substituenty prichádzajú do úvahy atóm halogénu, kyanoskupina, nitroskupina, alkylová skupina, alkoxy skupina či alkyltioskupina, vždy s 1 až 4 atómami uhlíka, halogénalkylová skupina, halogénalkoxy skupina či halogénalkyltioskupina vždy s 1 až 4 atómami uhlíka, a

X a Y znamenajú nezávisle od seba atóm kyslíka alebo atóm síry.

10. Herbicídny prostriedok, v y z n a č u j ú c i s a t ý m, že ako účinnú zložku obsahuje aspoň jeden substituovaný triazolinón všeobecného vzorca (I) podľa nároku 3 alebo 4.

11. Herbicídny prostriedok podľa nároku 10, v y z n a č u j ú c i s a t ý m, že obsahuje nosné látky a/alebo povrchovo aktívne látky.

12. Použitie substituovaných triazolinónov všeobecného vzorca (I) podľa nárokov 3 alebo 4 na ničenie burín.

Koniec dokumentu