



ÚŘAD PRO VYNÁLEZY
A OBJEVY

POPIS VYNÁLEZU K PATENTU

236787
(11) (B2)

(51) Int. Cl.⁵
A 01 N 37/22

(22) Přihlášeno 18 02 83
(21) [PV 1120-83]
(32) (31) (33) Právo přednosti od 20 02 82
(P 32 06 235.4)
Německá spolková republika
(40) Zveřejněno 17 09 84
(45) Vydáno 15 02 87

(72) Autor vynálezu
BRANDES WILHELM dr., LEICHLINGEN, DAUM WERNER dr., KREFELD (NSR)
(73) Majitel patentu
BAYER AKTIENGESELLSCHAFT, LEVERKUSEN (NSR)

(54) Fungicidní prostředek a způsob výroby účinných látek

1

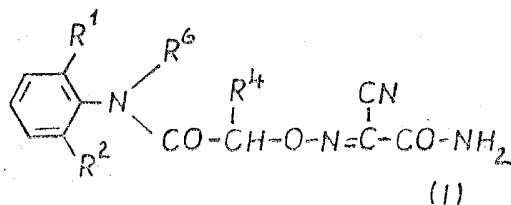
Vynález popisuje nové substituované oximinoacetanilidy, způsob jejich výroby, jakož i jejich použití jako prostředků k potírání škůdců, zejména jako fungicidů.

Jak je již dlouhou dobu známo, používají se při ochraně rostlin v zemědělství a zahradnictví jako fungicidy, zejména ethylen-1,2-bis-dithiokarbamat zinečnatý a N-trichlormethylthiotetrahydroftalimid. Tyto sloučeniny mají mezi obchodními preparáty velký význam [viz R. Wegler, „Chemie der Pflanzenschutz- und Schädlingsbekämpfungsmittel“, sv. 2, str. 65 a 108, Berlín(Heidelberg)New York (1970)]. Účinek těchto látek však při jejich aplikaci v nižších množstvích není vždy zcela uspokojivý.

Dále je známo, že některé isonitroso-kyanacetamidové deriváty [viz DE-OS 2 312 956 a americké patentní spisy číslo 3 919 284, 3 957 847 a 4 188 401] a alkoxykarbonylethyl-N-halogenacetaniliny [viz DE-OS číslo 2 350 944] mají fungicidní vlastnosti. I v těchto případech není účinnost zmíněných látek při jejich aplikaci v nižších množstvích vždy uspokojivá a ve vyšších koncentracích mohou tyto sloučeniny poškozovat rostliny.

Nyní byly nalezeny nové oximinoacetanilidy obecného vzorce I

2



ve kterém

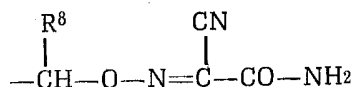
R¹ znamená alkylovou skupinu s 1 až 4 atomy uhlíku,

R² představuje alkylovou skupinu s 1 až 4 atomy uhlíku,

R⁴ představuje atom vodíku nebo methylovou skupinu a

R⁶ znamená alkoxyalkylovou skupinu s 1 až 4 atomy uhlíku v alkoxylové a 1 až 3 atomy uhlíku v alkylové části, alkoxykarbonylalkylovou skupinu s 1 až 4 atomy uhlíku v alkoxylové a 1 až 3 atomy uhlíku v alkylové části, pěti- nebo šestičlenný, přes atom uhlíku nebo dusíku napojený heterocyklylalkylový zbytek s 1 až 4 atomy uhlíku v alkylové části, který může obsahovat do 3 atomů dusíku, do 2 atomů kyslíku nebo do 2

atomů dusíku a 1 atom kyslíku, bicykloheterocyklylalkylovou skupinu s 1 až 4 atomy uhlíku v alkylové části, obsahující do 3 atomů dusíku a celkem nejvýše 10 členů kruhu, přičemž heterocyklické zbytky mohou být dále substituovány alkylovou skupinou s 1 až 2 atomy uhlíku nebo ketoskupinou, hydrogenovaný furanonový zbytek nebo zbytek vzorce

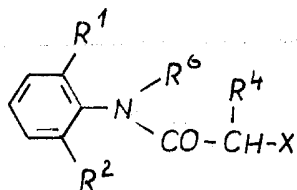


kde

R^8 představuje atom vodíku, methylovou nebo ethylovou skupinu.

Substituované oximinoacetanilidy obecného vzorce I podle vynálezu se mohou vyskytovat v různých stereochemických formách. Obecný vzorec I zahrnuje všechny tyto možné formy a jejich směsi.

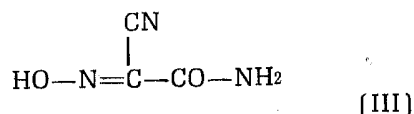
Dále bylo zjištěno, že substituované oximinoacetanilidy shora uvedeného obecného vzorce I se získají tak, že se substituovaný acetanilid obecného vzorce II



ve kterém

R^1 , R^2 , R^4 a R^6 mají shora uvedený význam a

X představuje chlor, brom, jod nebo sulfonyloxyskupinu, nechá, popřípadě v ředidle, reagovat s amidem 2-kyan-2-oximinoctové kyseliny vzorce III



ve formě soli s alkalickým kovem nebo kovem alkalické zeminy, nebo v přítomnosti akceptoru protonů.

Předmětem vynálezu je fungicidní prostředek, vyznačující se tím, že jako účinnou látku obsahuje alespoň jeden shora definovaný substituovaný oximinoacetanilid obecného vzorce I, jakož i výše uvedený způsob výroby těchto účinných látek.

Nové substituované oximinoacetanilidy obecného vzorce I mají silné fungicidní vlastnosti. Tyto je možno používat protektivně, kurativně a eradikativně. Mimoto vykazují tyto sloučeniny systemické nebo/a lokosystemické vlastnosti. Sloučeniny podle vynálezu se překvapivě vyznačují lepší snášitelností pro rostliny než známé deriváty isonitroso-kyanacetamidu. Oproti dithiokarbamátům a N-trichlormethylthiotetrahydroftalimidu mají látky podle vynálezu výhodu, vzhledem ke svému kurativnímu a eradikativnímu účinku.

Sloučeniny podle vynálezu, vzhledem k četným možnostem svých výhodných biologických aplikací představují tudíž cenné obohacení dosavadního stavu techniky.

Dalším zásadním aspektem vynálezu je, že poskytuje nové účinné látky s cennými vlastnostmi pro praxi v době, kdy starší účinné látky pozbývají pro trh význam, protože u škůdců se na ně vyvíjí rezistence.

V současné době i pro blízkou budoucnost tedy existuje výrazná potřeba nových fungicidů.

Ze substituovaných oximinoacetanilidů obecného vzorce I podle vynálezu jsou zvláště výhodné ty látky, v nichž

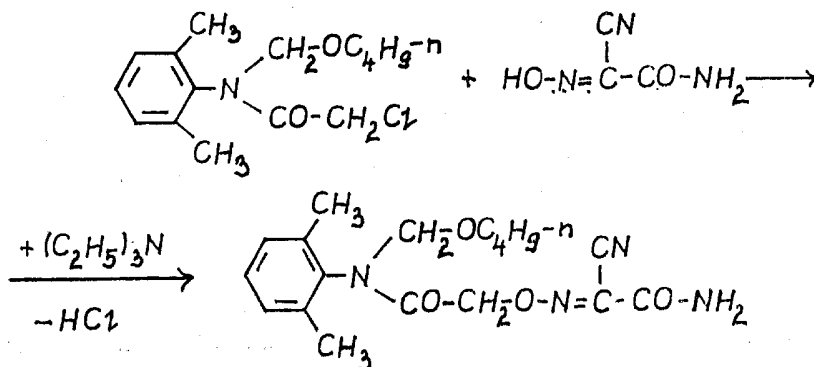
R^1 znamená methylovou nebo ethylovou skupinu,

R^2 představuje methylovou nebo ethylovou skupinu,

R^4 znamená atom vodíku a

R^6 má shora uvedený význam.

Použijí-li se při práci způsobem podle vynálezu jako výchozí látky například N-n-butoxymethyl-N-(2,6-dimethylfenyl)-2-chloracetamid a amid 2-kyan-2-oximinoctové kyseliny, a triethylamin jako akceptor protonů, je možno průběh reakce popsat následujícím reakčním schématem:



Substituované acetanilidy obecného vzorce II jsou známy nebo je lze získat principiálně známými postupy, například reakcí N-substituovaných anilinů s halogenidy kyseliny, nebo také reakcí sekundárních acetanilidů se sloučeninami obecného vzorce



V závislosti na reakčních podmínkách rezultují účinné látky podle vynálezu buď v krystalické formě, nebo zůstávají rozpouštěny v organickém rozpouštědle, z něhož je lze izolovat po promytí roztoky vodou opatrným odpařením roztoku nebo přidáním méně polárního organického rozpouštědla,

jako cyklohexanu, dibutyletheru, butylacetátu nebo tetrachlormethanu. V některých případech je nutno rozpouštědlo mísitelné s vodou po provedené reakci odstranit odpařením ve vakuu.

Jsou-li sloučeniny podle vynálezu rozpustitelné v rozpouštědle mísitelném s vodou, lze je například vysrážet rovněž přidáním vody. Pokud to zvláštní podmínky zpracování dovolují, roztoky účinných látek podle vynálezu, popřípadě suspenze těchto účinných látek obsahující ještě rozpouštědlo, se slabě okyslí.

Sloučeniny podle vynálezu se v některých případech při vyšší teplotě rozkládají, takže nelze vždy přesně zjistit jejich teploty tání.

Účinné látky podle vynálezu vykazují silný mikrobicidní účinek a lze je v praxi používat k potírání nežádoucích mikroorganismů. Popisované účinné látky jsou vhodné k upotřebení jako činnidla k ochraně rostlin.

Fungicidní prostředky se při ochraně rostlin používají k potírání hub z třídy *Plasmodiophoromycetes*, *Oomycetes*, *Chytridiomycetes*, *Zygomycetes*, *Ascomycetes*, *Basidiomycetes* a *Deuteromycetes*.

Vzhledem k tomu, že rostliny účinné látky podle vynálezu v koncentracích potřebných k potírání houbových chorob rostlin dobře snášejí, lze tyto sloučeniny používat k ošetřování nadzemních částí rostlin, sazenic a semen, jakož i k ošetřování půdy.

Jako činnidla k ochraně rostlin je možno účinné látky podle vynálezu se zvláště dobrými výsledky používat k potírání hub z třídy *Oomycetes*, například k potírání původce plísně bramborové na bramborách a rajčatech (*Phytophthora infestans*).

Popisované sloučeniny vykazují vysokou kurativní a protektivní účinnost. Dále u nich byly zjištěny dobré účinky proti bakteriím.

Účinné látky podle vynálezu nejen že mají dobré vlastnosti vynikajících současných obchodních preparátů, ale oproti nim mají ještě výrazné výhody. Tyto přednosti spočívají v první řadě ve schopnosti sloučenin podle vynálezu pronikat do rostlin. Tyto látky mohou být přijímány povrchem semen, kořeny, jakož i nadzemními částmi rostlin po povrchových aplikacích. Popisované sloučeniny mají rovněž výhodnou schopnost působit lokosystemicky, tj. působit hlobkově v rostlinné tkáni a tak ničit původce houbových chorob, kteří již do tkáně uživatelské rostliny pronikly.

Účinné látky se mohou převádět na obvyklé prostředky, jako jsou roztoky, emulze, suspenze, prášky, pěny, pasty, granuláty, aerosoly, přírodní a syntetické látky impregnované účinnými látkami, malé částice obalené polymerními látkami a obalovací hmoty pro osivo, dále na prostředky se zápalnými přísadami, jako jsou kouřové patrony, kouřové dózy, kouřové spirály apod., jakož i na prostředky ve formě koncentrátů

účinné látky pro rozptýl mlhou za studena nebo za tepla.

Tyto prostředky se připravují známým způsobem, například smísením účinné látky s plnidly, tedy kapalnými rozpouštědly, zkapalněnými plyny nacházejícími se pod tlakem nebo/a pevnými nosnými látkami, popřípadě za použití povrchově aktivních činnidel, tedy emulgátorů nebo/a dispergátorů nebo/a zpěňovacích činnidel. V případě použití vody jako plnidla je možno jako pomocná rozpouštědla používat například také organická rozpouštědla. Jako kapalná rozpouštědla přicházejí v podstatě v úvahu: aromáty, jako xylen, toluen nebo alkyl-naftaleny, chlorované aromáty nebo chlorované alifatické uhlovodíky, jako chlorbenzeny, chlorethyleny nebo methylenchlorid, alifatické uhlovodíky, jako cyklohexan nebo parafiny, například ropné frakce, alkoholy, jako butanol nebo glykol, jakož i jejich ethery a estery, dále ketony, jako acetony, methylethylketon, methyisobutylketon nebo cyklohexanon, silně polární rozpouštědla, jako dimethylformamid a dimethylsulfoxid, jakož i voda. Zkapalněnými plynnými plnidly nebo nosnými látkami se míní takové kapaliny, které jsou za normální teploty a normálního tlaku plynné, například aerosolové propelanty, jako halogenované uhlovodíky, jakož i butan, propan, dusík a kysličník uhličitý. Jako pevné nosné látky přicházejí v úvahu: přírodní kamenné moučky, jako kaoliny, aluminy, mastek, křída, křemen, attapulgit, montmorillonit nebo křemelina, a syntetické kamenné moučky, jako vysoce disperzní kyselina křemičitá, kysličník hlinitý a křemičitany. Jako pevné nosné látky pro přípravu granulátů přicházejí v úvahu drcené a frakcionované přírodní kamenné materiály, jako vápenec, mramor, pemza, sepiolit a dolomit, jakož i syntetické granuláty z anorganických a organických mouček a granuláty z organického materiálu, jako z pilin, skořápek kokosových ořechů, kukuřičných palic a tabákových stonků. Jako emulgátory nebo/a zpěňovací činnidla přicházejí v úvahu neionogenní a anionické emulgátory, jako polyoxyethylenestery mastných kyselin, polyoxyethylenestery mastných alkoholů, například alkylarylpolyglykoether, alkylsulfonáty, alkylsulfáty, arylsulfonáty a hydrolyzáty bílkovin a jako dispergátory například sulfitové odpadní louhy s obsahem ligninu a methylcelulóza.

Je třeba podotknout, že kromě zpracování na shora uvedené prostředky je možno sloučeniny podle vynálezu zpracovávat na vhodné prostředky rovněž v kombinaci se sacharózou, dextrózou, dextriny, bezvodým síranem vápenatým nebo hemihydrátem síranu vápenatého, jakož i v kombinaci s karboxylovými kyselinami, například s kyselinou fumarovou nebo 4-hydroxybenzoovou, nebo také v kombinaci se slabě kyselými iontoměniči.

Prostředky mohou obsahovat adhezíva, ja-

ko karboxymethylcelulózu, přírodní a syntetické práškové, zrnité nebo latexovité polymery, jako arabskou gumu, polyvinylalkohol a polyvinylacetát.

Dále mohou tyto prostředky obsahovat barviva, jako anorganické pigmenty, například kysličník železitý, kysličník titaničitý a ferrokyanidovou modř, a organická barviva, jako alizarinová barviva, azobarviva a kovová ftalocyaninová barviva, jakož i stopové prvky, například soli železa, manganu, boru, mědi, kobaltu, molybdenu a zinku.

Koncentráty obsahují obecně mezi 0,1 a 95 % hmotnostními, s výhodou mezi 0,5 a 96 % hmotnostními, účinné látky.

Účinné látky podle vynálezu mohou být v koncentrátech nebo v různých aplikačních formách obsaženy ve směsi s jinými známými účinnými látkami jako fungicidy, baktericidy, insekticidy, akaricidy, nematocidy, herbicidy, ochrannými látkami proti ozobu ptáky, růstovými látkami, živinami pro rostliny a činidly zlepšujícími strukturu půdy.

Účinné látky podle vynálezu je možno aplikovat jako takové, ve formě koncentrátů nebo z nich dalším ředěním připravených aplikačních forem, jako přímo použitelných roztoků, emulzí, suspenzí, prášků, past a granulátů. Aplikace se provádí obvyklým způsobem, například zálivkou, namáčením, postřikem, zamlžováním, odpařováním, injikací, natíráním, poprášením, pohazováním, mořením za sucha, za vlhka, za mokra nebo v suspenzi, nebo inkrustací.

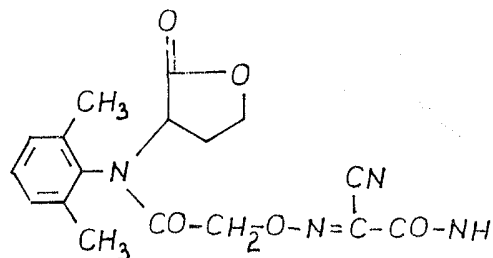
Při použití účinných látek k ošetřování nadzemních částí rostlin se mohou jejich koncentrace v aplikovatelných prostředcích pohybovat v širokém rozmezí. Tyto koncentrace obecně leží mezi 1 a 0,001 % hmotnostního, s výhodou mezi 0,5 a 0,001 % hmotnostního.

Při ošetřování osiva je obecně zapotřebí na každý kilogram osiva použít 0,001 až 50 gramů, s výhodou 0,01 až 10 g účinné látky.

Při ošetřování půdy je zapotřebí používat účinné látky v místě, kde se má docílit daného účinku, v koncentracích od 0,00001 % hmotnostního do 0,1 % hmotnostního, s výhodou od 0,0001 až 0,02 % hmotnostního.

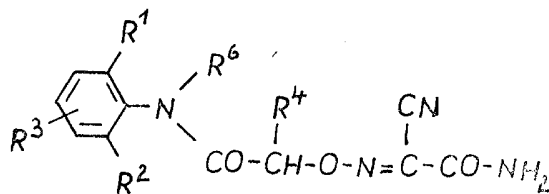
Způsob výroby účinných látek ilustrují následující příklady provedení, jimiž se však rozsah vynálezu v žádném směru neomezuje.

Příklad 1

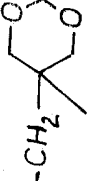
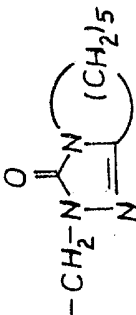
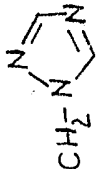
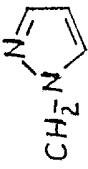


K 7,91 g 2-kyan-2-oximinoacetamidu a 200 gramů dimethylsulfoxidu se přidá 7,1 g triethylaminu. Po 30 minutách se přidá 20,6 g N-(tetrahydrofuran-2-on-3-yl)-N-(2,6-dimethylfenyl)-2-chloracetamidu a směs se 7 hodin zahřívá na 115 °C. Průběh reakce se sleduje chromatografií na tenké vrstvě silikagelu za použití směsi kyseliny octové, ethylacetátu a toluenu jako rozpouštědlového systému. Většina dimethylsulfoxidu se oddestiluje za tlaku 20 Pa a k destilačnímu zbytku se přidá ethylacetát a voda. Ethylacetátový roztok se třikrát promyje vodou a po vysušení síranem sodným se odpaří ve vakuu. Krystalizací odparku z diisopropyletheru se získá 20,8 g 2-kyan-2-[(N-(2,6-dimethylfenyl)-N-tetrahydrofuran-2-on-3-yl)-aminokarbonylmethoximino]acetamidu o teplotě tání 201 až 203 °C. Po překrystalování ze směsi toluenu a diethylketonu (7 : 1) taje produkt při 203 až 204 °C.

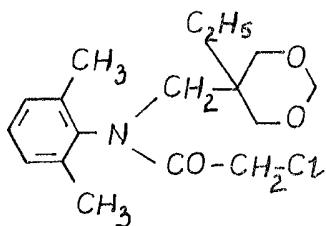
Analogickým způsobem se připraví následující sloučeniny obecného vzorce I



(I)

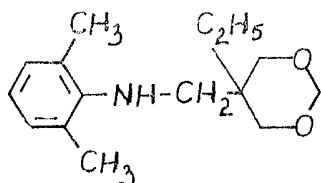
příklad číslo	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁶	teplota tání [°C]	reakční podmínky
2	CH ₃	CH ₃	H	H	—CH ₂ —OCH ₃	151,5	6 h, 80 °C, acetonitril
3	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	H	H	—CH ₂ —OCH ₃	109	7 h, 80 °C, acetonitril
4	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	H	H	—CH ₂ —O—N=C(CN)CO—NH ₂	161	7 h, 80 °C, acetonitril
5	CH ₃	CH ₃	H	H	—CH ₂ —O—N=C(CN)CO—NH ₂	228	7 h, 80 °C, acetonitril
6	CH ₃	CH ₃	H	H	 C ₂ H ₅	167	7 h, 80 °C, acetonitril
7	CH ₃	CH ₃	H	H		95	7 h, 80 °C, acetonitril
8	CH ₃	CH ₃	H	CH ₃	—CH ₂ —OCH ₃	137	5 h, 117 °C, dimethylsulfoxid
9	CH ₃	CH ₃	H	H	—CH(CH ₃)—CO—OCH ₃	171,5	5 h, 116 °C, dimethylsulfoxid
10	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	H	H	—CH(CH ₃)—CO—OCH ₃	102	5 h, 110 °C, dimethylsulfoxid
11	CH ₃	CH ₃	H	H		201,5	6 h, 80 °C, acetonitril
12	CH ₃	CH ₃	H	H		176	6 h, 80 °C, acetonitril
13	CH ₃	CH ₃	H	H	—CH(CH ₃)—CO—OCH(CH ₃) ₂	92	4 h, 115 °C, dimethylformamid

a) Příprava meziprojektu pro práci postupem podle příkladu 6



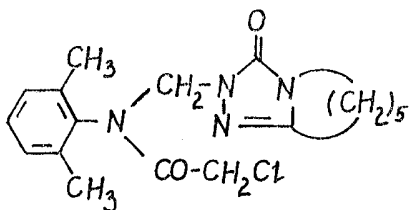
K roztoku 19,9 g N-[(5-ethyl-1,3-dioxan-5-yl)methyl]-2,6-dimethylanilinu v 50 ml chlorbenzenu se při teplotě 5 °C přidá 6,4 g chloracetylchloridu. Směs se 2 hodiny zahřívá na 80 °C, přičemž se k ní vždy po 1 hodině znovu přidá dalších 3,2 g chloracetylchloridu. Výsledná směs se ještě 5 hodin zahřívá na 100 °C, pak se odpaří ve vakuu, zbytek se rozpustí v xylenu a roztok se dvakrát promyje vodou s přídavkem malého množství kyseliny octové. Xylenový roztok se vysuší síranem sodným, dvakrát se rozmíchá s preparátem Tonsil optimum a odpaří se ve vakuu. Odparek o hmotnosti 22,6 g pomalu zkrystaluje a trituruje se s petroletherem. Výsledné krystaly se vysuší ve vakuu při teplotě 60 °C, čímž se získá krystalický produkt o teplotě tání 99 °C, jehož IČ spektrum (chloroform) obsahuje při 1680 cm⁻¹ pás pro seskupení N—CO.

a1) Příprava výchozí látky



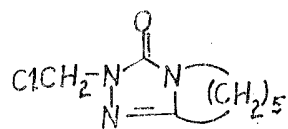
Směs 82,3 g 5-ethyl-1,3-dioxan-5-ylmethyl-toluensulfonátu, 106 g dimethylformamidu, 121 g 2,6-dimethylanilinu a 40 g uhličitane draselného se 16 hodin zahřívá na 163 až 169 °C. Reakční směs se zředí toluenem, promyje se vodou, odpaří se ve vakuu a zbytek se podrobí destilaci. Frakce vroucí při 126 °C/4 Pa obsahuje 11,6 g N-[(5-ethyl-1,3-dioxan-5-yl)methyl]-2,6-dimethylanilinu.

b) Příprava meziprojektu pro práci postupem podle příkladu 7



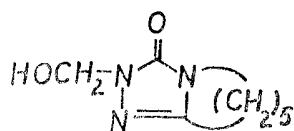
Směs 19,8 g N-chloracetyl-2,6-dimethylanilinu, 200 ml methylenchloridu, 100 ml 45% chloridu a 22,5 g 2-chlormethyl-3-oxo-4,5-pentamethylen-1,2,4-triazol-5-inu se 0,5 hodiny intenzivně míchá při teplotě 40 °C, pak se k ní přidá 600 ml toluenu, výsledná směs se několikrát promyje vodou, vysuší se síranem sodným, rozmíchá se s preparátem Tonsil optimum a odpaří se ve vakuu. Odparek se rozpustí v 600 ml horkého xylenu a k roztoku se přidá směs 100 ml dibutyletheru a 200 ml petroletheru, přičemž vykrystaluje N-(2,6-dimethylfenyl)-N-(3-oxo-4,5-pentamethylen-1,2,4-triazol-5-in-2-ylmethyl)-chloracetamid. Tento materiál se oddělí a po promytí petroletherem se vysuší. Produkt taje při 128 °C.

b1) Příprava výchozí látky



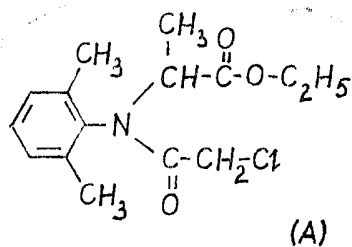
K roztoku 21,7 g 2-hydroxymethyl-3-oxo-4,5-pentamethylen-1,2,4-triazol-5-inu v 50 ml chloroformu obsahujícího 1 kapku dimethylformamidu se při teplotě 3 °C přidá 29 g thionylchloridu. Reakční směs se nechá bez chlazení 4 hodiny stát, načež se odpaří ve vakuu. Vysušením pevného zbytku při 30 °C/10 Pa se získá 23,3 g 2-chlormethyl-3-oxo-4,5-pentamethylentriazol-5-inu.

b2) Příprava výchozího materiálu



Do 290 g 24,2% roztoku formalinu se při teplotě 24 °C v 5 dávkách přidá 199 g 4,5-pentamethylen-1,2,4-triazol-5-in-3-onu. Směs se 3,5 hodiny míchá, pak se zfiltruje, filtrát se zředí 120 ml vody a extrahuje se třikrát vždy 300 ml chloroformu. Chloroformový roztok se vysuší síranem sodným, odpaří se ve vakuu a odparek se vysuší při 60 °C/10 Pa. Získá se 204,8 g 2-hydroxymethyl-3-oxo-4,5-pentamethylen-1,2,4-triazol-5-inu o teplotě tání 104 °C.

Následující příklad ilustruje fungicidní účinnost sloučenin obecného vzorce I podle vynálezu. Jako standardní srovnávací látka se používá sloučenina níže uvedeného vzorce A.



Příklad A

Test protektivní účinnosti na plíseň bramborovou (*Phytophthora infestans*)/rajče

Rozpouštědlo:

4,7 dílu hmotnostního acetonu

emulgátor:

0,3 dílu hmotnostního alkylarylpolýglykol-etheru

K přípravě vhodného účinného prostředku se 1 díl hmotnostní účinné látky smísí s uvedeným množstvím rozpouštědla a emulgátoru, a koncentrát se zředí vodou na žádanou koncentraci.

K stanovení protektivní účinnosti se mladé pokusné rostliny až do orosení postřikají připraveným účinným prostředkem. Po oschnutí povlaku naneseného postřikem se rostliny inokulují vodnou suspenzí spor plísně bramborové (*Phytophthora infestans*).

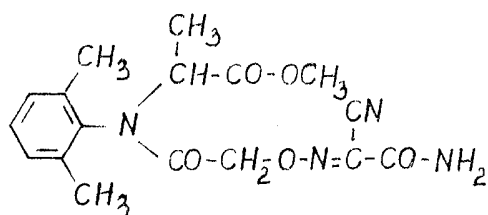
Rostliny se pak uchovávají v inkubační komoře při 100% relativní vlhkosti vzduchu a teplotě zhruba 20 °C.

Za 3 dny po inokulaci se pokus vyhodnotí.

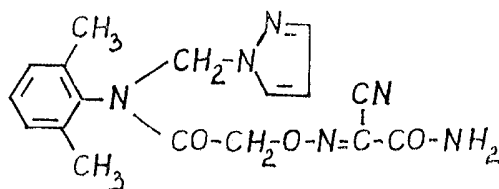
Účinné látky, koncentrace účinných látek a dosažené výsledky jsou uvedeny v následující tabulce.

Tabulka A

účinná látka	napadení v % při koncentraci účinné látky 0,0005 %
(A; známá)	51
	12
	24
	31
	25



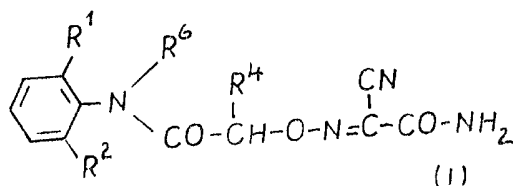
21



26

PŘEDMĚT VYNÁLEZU

1. Fungicidní prostředek, vyznačující se tím, že jako účinnou látku obsahuje alespoň jeden substituovaný oximinoacetanilid obecného vzorce I



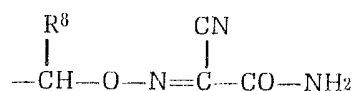
ve kterém

R¹ znamená alkylovou skupinu s 1 až 4 atomy uhlíku,

R² představuje alkylovou skupinu s 1 až 4 atomy uhlíku,

R⁴ představuje atom vodíku nebo methylovou skupinu a

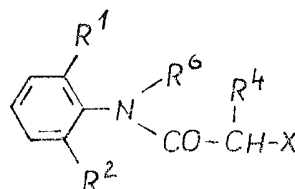
R⁶ znamená alkoxyalkylovou skupinu s 1 až 4 atomy uhlíku v alkoxylové a 1 až 3 atomy uhlíku v alkylové části, alkoxykarbonylalkylovou skupinu s 1 až 4 atomy uhlíku v alkoxylové a 1 až 3 atomy uhlíku v alkylové části, pěti- nebo šestičlenný, přes atom uhlíku nebo dusíku napojený heterocyklylalkylový zbytek s 1 až 4 atomy uhlíku v alkylové části, který může obsahovat do 3 atomů dusíku, do 2 atomů kyslíku nebo do 2 atomů dusíku a 1 atom kyslíku, bicykloheterocyklylalkylovou skupinu s 1 až 4 atomy uhlíku v alkylové části, obsahující do 3 atomů dusíku a celkem nejvýše 10 členů kruhu, přičemž heterocyklické zbytky mohou být dále substituovány alkylovou skupinou s 1 až 2 atomy uhlíku nebo ketoskupinou, hydrogenovaný furanonový zbytek nebo zbytek vzorce



kde

R⁸ představuje atom vodíku, methylovou nebo ethylovou skupinu.

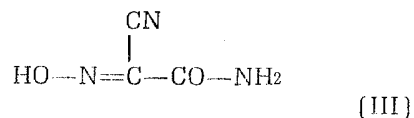
2. Způsob výroby účinných látek obecného vzorce I podle bodu 1, vyznačující se tím, že se substituovaný acetanilid obecného vzorce II



ve kterém

R¹, R², R⁴ a R⁶ mají shora uvedený význam a

X představuje chlor, brom, jod nebo sulfonyloxyskupinu, nechá, popřípadě v ředidle, reagovat s amidem 2-kyan-2-oximinooctové kyseliny vzorce III



ve formě soli s alkalickým kovem nebo kovem alkalické zeminy, nebo v přítomnosti akceptoru protonů.