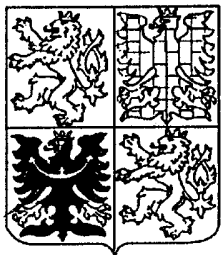


ČESKÁ
REPUBLIKA

(19)



ÚŘAD
PRŮMYSLOVÉHO
VLASTNICTVÍ

ZVEŘEJNĚNÁ PŘIHLÁŠKA VYNÁLEZU

(12)

(21) 2413-92

(13) A3

(51) C 07 D 261/08
A 01 N 43/80

(22) 03.08.92

(32) 05.08.91, 12.03.92

(31) 91/16833, 92/850424

(33) GB, US

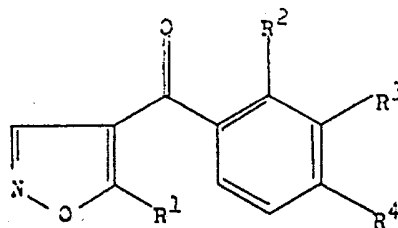
(40) 17.02.93

(71) RHONE-POULENC AGRICULTURE LTD, Essex, GB;

(72) Cain Paul Alfred, Ongar, GB;
Cramp Susan Mary, Ongar, GB;
Little Gillian Mary, Ongar, GB;
Luscombe Brian Malcom, Ongar, GB;

(54) Herbicidy

(57) Deriváty 4-benzoylisoxazolu obecného vzorce I, kde R^1 je methylová, ethylová, isopropylová, cyklopropylová nebo 1-methylcyklopropylová skupina, R^2 je přímá či rozvětvená alkylová nebo alkoxylová skupina obsahující až 4 atomy uhlíku, R^3 je atom vodíku, chloru, bromu či fluoru, nebo skupina vybraná z R^5 , $-CO_2R^5$ a $-OR^5$, nebo přímá či rozvětvená alkylová skupina obsahující až 4 atomy uhlíku substituovaná $-OR^5$, nebo přímá či rozvětvená alkoxylová skupina obsahující až 4 atomy uhlíku substituovaná $-OR^5$, R^4 je $-S(O)_n$, R^5 je přímá či rozvětvená alkylová skupina obsahující až 4 atomy uhlíku popřípadě substituovaná jedním nebo několika atomy halogenů, R je methylová nebo ethylová skupina, a n je nula, jednička nebo dvojka, způsob jejich výroby a jejich použití jako herbicidů.



(I)

- 1 -

Herbicidey

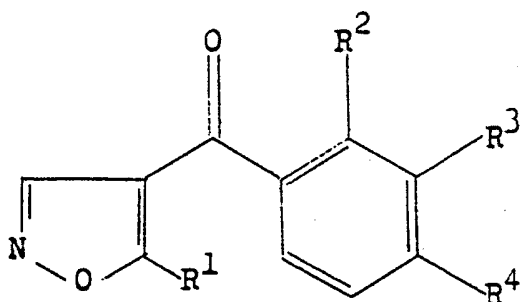
Oblast techniky

PŘÍL. PRO VYNÁLEZY A OBJEVY	ÚŘAD	03. VIII 92	045042	č.j.
	PRO VYNÁLEZY A OBJEVY			

Vynález se týká nových derivátů 4-benzoylisoxazolu, prostředků které je obsahují a jejich použití jako herbicidů.

Podstata vynálezu

Vynález popisuje deriváty 4-benzoylisoxazolu obecného vzorce I



(I)

ve kterém

- R^1 představuje methylovou, ethylovou, isopropylovou, cyklopropylovou nebo 1-methylcyklopropylovou skupinu,
- R^2 znamená alkylovou nebo alkoxylovou skupinu s přímým či rozvětveným řetězcem obsahující až 4 atomy uhlíku,
- R^3 představuje atom vodíku, chloru, bromu nebo fluoru; nebo některou ze skupin R^5 , $-CO_2R^5$ a $-OR^5$; nebo alkylovou skupinu s přímým či rozvětveným řetězcem obsahující až 4 atomy uhlíku substituovanou $-OR^5$; nebo alkoxylovou skupinu s přímým či rozvětveným řetězcem obsahující až 4 atomy uhlíku substituova-

- nou $-OR^5$,
- R^4 znamená $-S(O)_nR$,
- R^5 představuje alkylovou skupinu s přímým nebo rozvětveným řetězcem obsahující až 4 atomy uhlíku, která je popřípadě substituována jedním nebo několika atomy halogenů,
- R znamená methylovou nebo ethylovou skupinu, a
- n představuje nulu, jedničku či dvojku,
- s tím, že v případě že R^1 představuje methylovou nebo cyklopropylovou skupinu, R^2 znamená methylovou skupinu a R^4 představuje $-SO_2CH_3$, R^3 znamená jinou skupinu než $-CO_2CH_3$ či $-CO_2-CH \begin{matrix} \swarrow CH_3 \\ \searrow CH_3 \end{matrix}$, které mají cenné herbicidní vlastnosti.

Sloučeniny podle vynálezu vykazují v některých aspektech svého herbicidního působení výhody proti známým sloučeninám.

Z hlediska svých herbicidních vlastností tvoří výhodnou skupinu sloučeniny obecného vzorce I ve kterém

- a) R^1 představuje isopropylovou, cyklopropylovou nebo 1-methylcyklopropylovou skupinu, nebo/a
- b) R^2 znamená methylovou, ethylovou, methoxylovou nebo ethoxylovou skupinu, nebo/a
- c) R^3 představuje atom vodíku, chloru, bromu nebo fluoru; nebo zbytek vybraný ze skupiny zahrnující methylovou skupinu, methoxylovou skupinu, ethoxylovou skupinu, $-CH_2OR^5$, $-O-(CH_2)_2OR^5$ a $-CO_2R^5$, kde R^5 znamená alkylovou skupinu s přímým nebo rozvětveným řetězcem obsahující až 3 atomy uhlíku.

Další výhodnou skupinu tvoří sloučeniny obecného vzorce I ve kterém:

- R^1 představuje isopropylovou, cyklopropylovou nebo

- 1-methylcyklopropylovou skupinu,
- R^2 znamená methylovou, ethylovou, methoxylovou nebo ethoxylovou skupinu, a
- R^3 představuje atom vodíku, atom fluoru, atom chloru, atom bromu, methylovou skupinu, methoxymethylovou skupinu nebo 1-methoxyethoxylovou skupinu.

Další výhodnou skupinu tvoří sloučeniny obecného vzorce I ve kterém:

- R^1 představuje isopropylovou, 1-methylcyklopropylovou nebo cyklopropylovou skupinu,
- R^2 znamená methylovou, ethylovou, methoxylovou nebo ethoxylovou skupinu,
- R^3 představuje atom vodíku, atom fluoru, atom chloru, atom bromu, methylovou skupinu nebo methoxylovou skupinu, a
- R znamená methylovou skupinu.

Další výhodnou skupinu tvoří sloučeniny obecného vzorce I ve kterém:

- R^1 představuje cyklopropylovou skupinu,
- R^2 znamená methylovou skupinu nebo methoxylovou skupinu a
- R^3 představuje atom vodíku nebo methoxylovou skupinu, s tím, že R^2 a R^3 neznamenaají současně vždy methoxylovou skupinu, a
- R představuje methylovou skupinu.

Zvláště výhodné z hlediska svých herbicidních vlastností jsou sloučeniny vybrané ze skupiny zahrnující:

A) 5-cyklopropyl-4-(2-methoxy-4-methylsulfenylbenzoyl)isoxazol,

B) 5-cyklopropyl-4-(2-methoxy-4-methylsulfonyl-

benzoyl)isoxazol,

C) 5-cyklopropyl-4-(2-methoxy-4-methylsulfinylbenzoyl)isoxazol,

D) 5-cyklopropyl-4-(2-methyl-4-methylsulfinylbenzoyl)isoxazol,

E) 5-cyklopropyl-4-(2-methyl-4-methylsulfonylbenzoyl)isoxazol,

F) 5-cyklopropyl-4-(2-methyl-4-methylsulfenylbenzoyl)isoxazol,

G) 5-(1-methylcyklopropyl)-4-(2-methyl-4-methylsulfonylbenzoyl)isoxazol,

H) 4-(2-ethyl-4-methylsulfenylbenzoyl)-5-cyklopropylisoxazol,

I) 4-(2-ethyl-4-methylsulfinylbenzoyl)-5-cyklopropylisoxazol,

J) 4-(2-ethyl-4-methylsulfonylbenzoyl)-5-cyklopropylisoxazol,

K) 4-(2-ethoxy-4-methylsulfenylbenzoyl)-5-cyklopropylisoxazol,

L) 4-(2-ethoxy-4-methylsulfonylbenzoyl)-5-cyklopropylisoxazol,

M) 4-(3-chlor-2-methyl-4-methylsulfenylbenzoyl)-5-cyklopropylisoxazol,

N) 4-(3-chlor-2-methyl-4-methylsulfinylbenzoyl)-5-cyklopropylisoxazol,

O) 4-(3-chlor-2-methyl-4-methylsulfonylbenzoyl)-5-cyklopropylisoxazol,

P) 4-(2-methyl-3-methoxy-4-methylsulfenylbenzoyl)-5-cyklopropylisoxazol,

Q) 4-(2-methyl-3-methoxy-4-methylsulfonylbenzoyl)-

-5-cyklopropylisoxazol,

R) 4-(2,3-dimethyl-4-methylsulfenylbenzoyl)-5-cyklopropylisoxazol,

S) 4-(2,3-dimethyl-4-methylsulfinylbenzoyl)-5-cyklopropylisoxazol, a

T) 4-(2,3-dimethyl-4-methylsulfonylbenzoyl)-5-cyklopropylisoxazol.

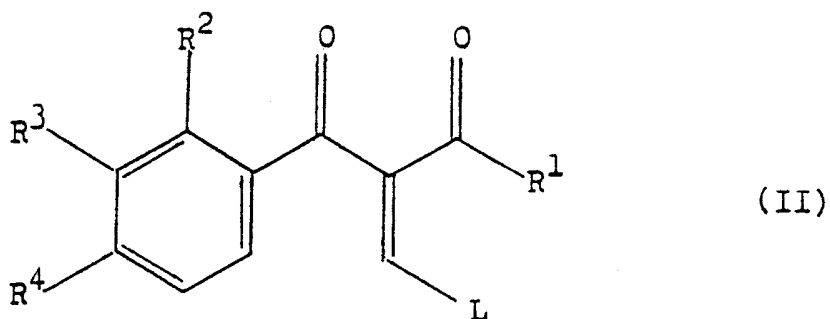
Tyto sloučeniny jsou označeny písmeny A až T kvůli odkazům dále v textu.

Sloučeniny obecného vzorce I lze připravit použitím nebo adaptací známých postupů (t.j. postupů dříve používaných nebo popsaných v literatuře), například níže popsaných.

V následujícím textu, pokud nejsou symboly v obecných vzorcích blíže definovány, mají "shora definovaný význam" v souladu s první definicí každého symbolu v popisu.

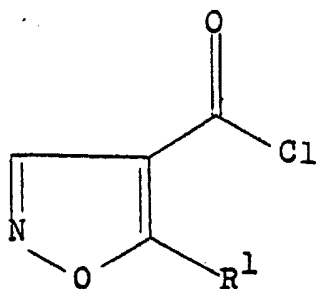
Je třeba brát v úvahu, že v popisu následujících postupů je možno jednotlivé kroky provádět v rozdílném pořadí, a že k získání žádané sloučeniny mohou být použity vhodné chránicí skupiny.

V souladu s provedením vynálezu lze sloučeniny obecného vzorce I připravit reakcí sloučeniny obecného vzorce II



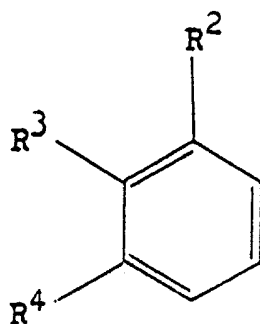
ve kterém L představuje odštěpitelnou skupinu, se solí hydroxylaminu. Obecně je výhodný hydroxylaminhydrochlorid. L obecně znamená O-alkylovou skupinu, například ethoxylovou skupinu, nebo N,N-dialkylaminoskupinu, například dimethylaminoskupinu. Reakce se obecně provádí v rozpouštědle jako je ethanol nebo acetonitril, popřípadě v přítomnosti bázičkého nebo kyselého akceptoru jako je triethylamin nebo octan sodný.

V souladu s dalším provedením vynálezu lze sloučeniny obecného vzorce I kde R^4 představuje skupinu -SR připravit reakcí sloučeniny obecného vzorce III



(III)

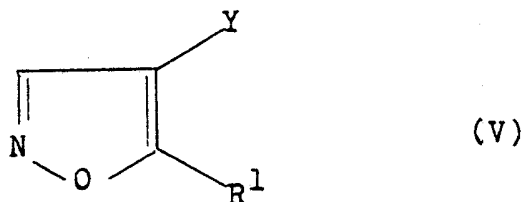
se sloučeninou obecného vzorce IV



(IV)

kde R^4 znamená skupinu -SR. Reakce se obecně provádí v přítomnosti katalyzátoru Lewisovy kyseliny jako je chlorid hlinitý při teplotě mezi teplotou místnosti a 100 °C.

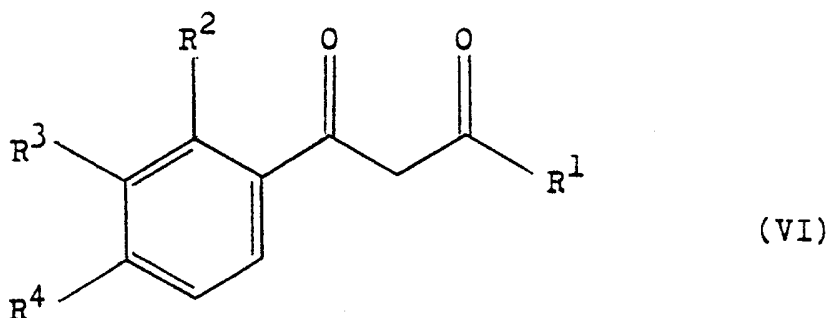
V souladu s dalším provedením vynálezu lze sloučeniny obecného vzorce I připravit reakcí sloučeniny obecného vzorce V



kde Y představuje karboxylovou skupinu nebo její reaktivní derivát (jako je chlorid karboxylové kyseliny nebo ester karboxylové kyseliny), nebo kyanoskupinu, s vhodným organokovovým činidlem jako je Grignardovo činidlo nebo organolithné činidlo. Reakce se obecně provádí v inertním rozpouštědle jako je ether nebo tetrahydrofuran, při teplotě od 0 °C do teploty varu směsi pod zpětným chladičem.

Meziprodukty v přípravě sloučenin obecného vzorce I byly připraveny použitím nebo adaptací známých metod.

Sloučeniny obecného vzorce II lze připravit reakcí sloučenin obecného vzorce VI



s trialkyl-orthoformiátem či dimethylformamid-dialkylacetalem. Obecně se používají triethyl-orthoformiát či di-

methyformamid²dimethylacetal. Reakce s trialkyl-orthoformi-
átem se obecně provádí v přítomnosti anhydridu kyseliny
při teplotě varu směsi pod zpětným chladičem a reakce
s dimethylformamid²dialkylacetalem se provádí popřípadě
v přítomnosti inertního rozpouštědla při teplotě od teplo-
ty místnosti do teploty varu směsi pod zpětným chladičem.

Příprava sloučenin obecných vzorců III, IV, V a VI
je rozsáhle popsána v literatuře.

Pro odborníky v oboru je zřejmé, že některé slouče-
niny obecného vzorce I lze připravit vzájemnou přeměnou
jiných sloučenin obecného vzorce I a takové vzájemné pře-
měny tvoří další provedení vynálezu. Příklady těchto vzá-
jemných přeměn jsou popsány níže.

V souladu s dalším provedením vynálezu lze slouče-
niny ve kterých n znamená 1 nebo 2 připravit oxidací ato-
mu síry sloučenin ve kterých n představuje nulu. Oxidace
atomu síry se obecně provádí za použití například 3-chlor-
peroxybenzoové kyseliny v inertním rozpouštědle jako je
dichlormethan při teplotě od -40°C do teploty místnosti,
například od -40°C do 0°C .

Následující příklady provedení ilustrují přípravu
sloučenin obecného vzorce I a referenční příklady ilustru-
jí přípravu meziproductů podle vynálezu. Za označením NMR
následují vždy hodnoty protonového nukleárního magnetic-
kého resonančního spektra.

Příklady provedení vynálezu

Příklad 1

Sloučeniny A, E, F, G, H, K, M, P, a R

K míchané směsi 30,6 g 3-cyklopropyl-2-ethoxyme-
thylen-1-(2-methoxy-4-methylsulfenylfenyl)propan-1,3-
-dionu a 8,0 g hydroxylamin-hydrochloridu v ethanolu se

přidá 7,87 g octanu sodného. Směs se míchá přes noc při teplotě místnosti, poté se odpaří do sucha a odparek se rozpustí v ethylacetátu, promyje se vodou, vysuší (bezvodým síranem hořečnatým) a zfiltruje. Filtrát se odpaří do sucha, odparek se trituruje etherem a po zfiltrování se získá 5-cyklopropyl-4-(2-methoxy-4-methylsulfenylbenzoyl)isoxazol jako bílá pevná látka, o teplotě tání 107,5 - 108,5 °C.

Podobným postupem se z vhodně substituovaných výchozích materiálů připraví následující sloučeniny obecného vzorce I:

Slou- čenina	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	teplota tání/ NMR
E	Cp	CH ₃	H	SO ₂ CH ₃	86 - 87 °C
F	Cp	CH ₃	H	SCH ₃	65 - 66 °C
G	1-CH ₃ -Cp	CH ₃	H	SO ₂ CH ₃	87,5 - 88,5 °C
H	Cp	CH ₂ CH ₃	H	SCH ₃	NMR (a)
K	Cp	OCH ₂ CH ₃	H	SCH ₃	108,8 - 110,6 °C
M	Cp	CH ₃	Cl	SCH ₃	157,4 - 158,2 °C
P	Cp	CH ₃ OCH ₃	OCH ₃	SCH ₃	106 - 107 °C
R	Cp	CH ₃	CH ₃	SCH ₃	101,7 - 103,9 °C

legenda: Cp znamená cyklopropylovou skupinu.

(a) NMR (CDCl₃): 1,0 (m, 2H), 1,1 (t, 3H), 1,4 (m, 1H), 2,5 (s, 3H), 2,6 (m, 1H), 2,8 (q, 2H), 7,0 (dd, 1H), 7,1 (d, 1H), 7,3 (d, 1H), 8,3 (s, 1H).

Příklad 2

Sloučeniny B, C, D, I, J, L, N, O, Q, S a T

K roztoku 3,5 g 5-cyklopropyl-4-(2-methoxy-4-methylsulfenylbenzoyl)isoxazolu v dichlormethanu se při teplotě -15°C přidá 3,4 g 3-chlorperoxybenzoové kyseliny. Směs se míchá 1 hodinu při teplotě -15°C a přes noc při teplotě místnosti. Směs se znovu ochladí na -15°C a přidá se 3,4 g 3-chlorperoxybenzoové kyseliny. Směs se zfiltruje a filtrát se promyje vodným roztokem natriummetabisulfátu, vodou, vysuší se (bezvodým síranem hořečnatým) a zfiltruje. Filtrát se odpaří do sucha a odpařek se vyčistí sloupcovou chromatografií na silikagelu při použití směsi ethylacetátu a hexanu jako elučního činidla, čímž se získá 1,4 g 5-cyklopropyl-4-(2-methoxy-4-methylsulfenylbenzoyl)isoxazolu ve formě bílé pevné látky o teplotě tání $133 - 133,5^{\circ}\text{C}$ a 0,85 g 5-cyklopropyl-4-(2-methoxy-4-methylsulfenylbenzoyl)isoxazolu jako špinavě bílé pevné látky o teplotě tání $100 - 102^{\circ}\text{C}$.

Podobným postupem lze z vhodně substituovaných výchozích materiálů připravit následující sloučeniny obecného vzorce I:

Sloučenina	R^1	R^2	R^3	R^4	teplota tání
D	Cp	CH_3	H	S(O)CH_3	$135 - 136,5^{\circ}\text{C}$
I	Cp	CH_2CH_3	H	S(O)CH_3	$139,9 - 140,6^{\circ}\text{C}$
J	Cp	CH_2CH_3	H	SO_2CH_3	$85,8 - 86,8^{\circ}\text{C}$
L	Cp	OCH_2CH_3	H	SO_2CH_3	$101 - 103^{\circ}\text{C}$
N	Cp	CH_3	Cl	S(O)CH_3	$78 - 79^{\circ}\text{C}$

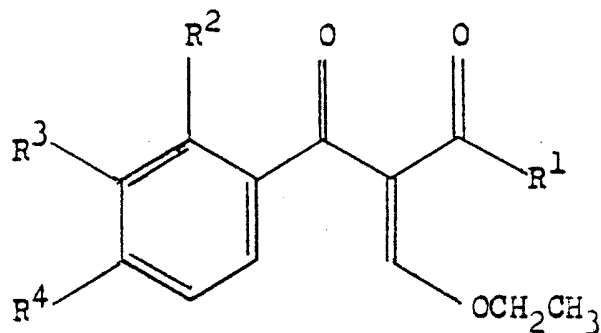
Slou- čenina	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	teplota tání
O	Cp	CH ₃	Cl	SO ₂ CH ₃	137,6 - 138,2 °C
Q	Cp	CH ₃	OCH ₃	SO ₂ CH ₃	147 - 148,7 °C
S	Cp	CH ₃	CH ₃	S(O)CH ₃	114,3 - 117,9 °C
T	Cp	CH ₃	CH ₃	SO ₂ CH ₃	139,9 - 140,2 °C

legenda: Cp znamená cyklopropylovou skupinu

Referenční příklad 1

Směs 25,4 g 3-cyklopropyl-1-(2-methoxy-4-methylsulfenylfenyl)-propan-1,3-dionu a 39 g triethyl-orthoformiátu v anhydridu kyseliny octové se za míchání zahřívá k varu pod zpětným chladičem po dobu 3 hodin. Po ochlazení se směs odpaří do sucha, odparek se rozpustí v toluenu a znovu se odpaří do sucha, čímž se získá 30,6 g 3-cyklopropyl-2-ethoxymethylen-1-(2-methoxy-4-methylsulfenylfenyl)-propan-1,3-dionu jako červené pryskyřice, která se dále nečistí.

Podobným postupem se z vhodně substituovaných výchozích materiálů připraví následující sloučeniny:



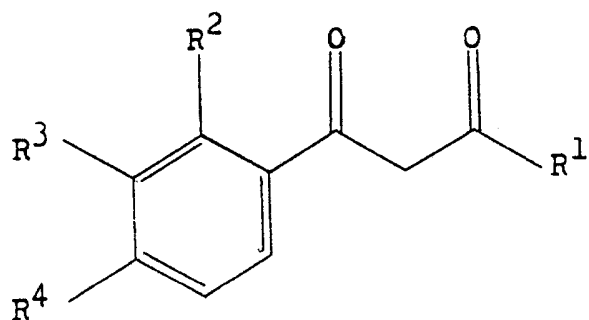
R ¹	R ²	R ³	R ⁴
cyklopropyl	CH ₃	H	SO ₂ CH ₃
cyklopropyl	CH ₃	H	SCH ₃
1-methylcyklopropyl	CH ₃	H	SO ₂ CH ₃
cyklopropyl	CH ₂ CH ₃	H	SCH ₃
cyklopropyl	OCH ₂ CH ₃	H	SCH ₃
cyklopropyl	CH ₃	Cl	SCH ₃
cyklopropyl	CH ₃	OCH ₃	SCH ₃
cyklopropyl	CH ₃	CH ₃	SCH ₃

Referenční příklad 2

Roztok 35,1 g terc.butyl-3-cyklopropyl-2-(2-methoxy-4-methylsulfenyl-benzoyl)-3-oxopropionátu a 1,2 g 4-toluensulfonové kyseliny v toluenu se za míchání zahřívá k varu pod zpětným chladičem po dobu 8 hodin. Po ochlazení se směs promyje vodou, vysuší (bezvodým síranem hořečnatým) a zfiltruje. Filtrát se odpaří do sucha, čímž se získá 25,8 g 3-cyklopropyl-1-(2-methoxy-4-methyl-sulfenylfenyl)-propan-1,3-dionu jako červené pevné látky.

NMR (CDCl₃): 0,7 - 1,2 (m, 4H), 1,4 - 2,0 (m, 1H),
 2,4 (s, 3H), 3,75 (s, 3H), 6,4 (s, 1H),
 6,6 (s, 1H), 6,65 (d, 1H), 7,65 (d, 1H).

Podobným postupem lze z vhodně substituovaných výchozích materiálů připravit následující sloučeniny:



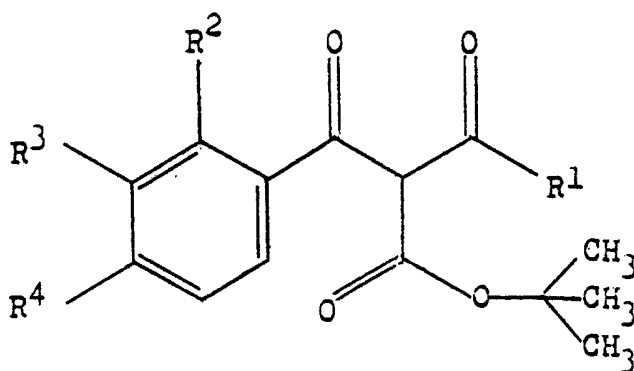
R^1	R^2	R^3	R^4	NMR / teplota tání
Cp	CH_3	H	SO_2CH_3	($CDCl_3$); 0,8-1,3(m,4H), 1,5-1,9(m,1H), 1,5(s,3H), 3,0(s,3H), 5,8(s,1H), 7,5-8,1(m,3H)
Cp	CH_3	H	SCH_3	($CDCl_3$); 0,8-1,2(m,4H), 1,4-1,8(m,1H), 2,45(s,6H), 5,8(s,1H), 6,7-7,5(m,3H)
1- CH_3 -Cp	CH_3	H	SO_2CH_3	($CDCl_3$); 0,7-1,1(m,2H), 1,2-1,5(m,5H), 2,4(s,3H), 3,0(s,3H), 5,75(s,1H), 7,4-7,8(m,3H)
Cp	CH_2CH_3	H	SCH_3	nebylo stanoveno
Cp	OCH_2CH_3	H	SCH_3	($CDCl_3$); 0,9(m,2H), 1,1(m,2H), 1,4(t,3H), 1,7(m,1H), 2,5 (s,3H), 4,0(q,2H), 6,6(s,1H), 6,8(m,2H), 7,9(m,1H)
Cp	CH_3	CH_3	SCH_3	79,1 - 80,2 °C

legenda: Cp znamená cyklopropylovou skupinu

Referenční příklad 3

K suspenzi 2,67 g hořčíku v methanolu se přidají 2 ml tetrachlormethanu a směs se za míchání zahřívá k varu pod zpětným chladičem po dobu 0,5 hodiny. Po ochlazení se přidá 18,4 g terc.butyl-3-cyklopropyl-3-oxopropionátu, načež se směs za míchání zahřívá k varu pod zpětným chladičem po dobu 0,5 hodiny. Směs se odpaří do sucha a k odparku se přidá toluen. Ten se opět odpaří a z odparku se vytvoří suspenze v acetonitrilu. Přidá se roztok 21,8 g 2-methoxy-4-methylsulfenylbenzoylchloridu v acetonitrilu a směs se míchá po dobu 4 hodin. Poté se směs odpaří do sucha, odparek se rozpustí v ethylacetátu, promyje se 2M vodnou kyselinou chlorovodíkovou, voľou, vysuší se (bezvodým síranem hořečnatým) a zfiltruje. Filtrát se odpaří do sucha, čímž se získá 36 g terc.butyl-3-cyklopropyl-2-(2-methoxy-4-methylsulfenylbenzoyl)-3-oxopropionátu jako hnědé olejovité látky, která se dále nečistí.

Podobným postupem lze z vhodně substituovaných výchozích materiálů připravit následující sloučeniny:



R¹

R²

R³

R⁴

cyklopropyl

CH₃

H

SO₂CH₃

R ¹	R ²	R ³	R ⁴
cyklopropyl	CH ₃	H	SCH ₃
1-methylcyklopropyl	CH ₃	H	SO ₂ CH ₃
cyklopropyl	CH ₂ CH ₃	H	SCH ₃
cyklopropyl	OCH ₂ CH ₃	H	SCH ₃
cyklopropyl	CH ₃	CH ₃	SCH ₃

Referenční příklad 4

K míchané suspenzi 2,88 g natriumhydridu v tetrahydrofuranu v inertní atmosféře se přidá roztok 6,5 g cyklopropylmethylketonu v tetrahydrofuranu a směs se míchá po dobu 3,5 hodiny. Poté se přidá roztok 8,5 g 3-chlor-2-methyl-4-(methylsulfenyl)benzoátu v tetrahydrofuranu. Výsledná směs se míchá přes noc při teplotě místnosti. Poté se reakční směs naředí etherem a 2M chlorovodíkovou kyselinou. Vrstvy se oddělí a organická vrstva se promyje vodou, vysuší síranem hořečnatým a zfiltruje. Filtrát se odpaří do sucha, čímž se získá surová žlutá pevná látka, která se vyčistí sloupcovou chromatografií na silikagelu při použití směsi ethylacetátu a benzínu (teplota varu 60 - 80 °C) jako elučního činidla. Výtěžek je 5,25 g 3-cyklopropyl-1-(3-chlor-2-methyl-4-methylsulfenylfenyl)-propan-1,3-dionu jako žluté pevné látky o teplotě tání 113 - 116 °C.

Podobným postupem lze z vhodně substituovaného výchozího materiálu připravit následující sloučeninu:

3-cyklopropyl-1-(2-methyl-3-methoxy-4-methylsulfenylfenyl)propan-1,3-dion;

NMR (CDCl_3): 0,8 - 1,2 (m, 4H), 1,6 (m, 1H), 2,3 (s, 3H),
2,4 (s, 3H), 3,7 (s, 3H), 5,8 (s, 1H),
6,8 (d, 1H), 7,2 (d, 1H), 16,0 (bs, 1H).

Benzoylchloridy lze připravit zahříváním vhodně substituovaných benzoových kyselin k varu pod zpětným chladičem po dobu 3 hodin s thionylchloridem. Nadbytek thionylchloridu se odstraní odpařením a benzoylchloridy se použijí přímo bez dalšího čištění.

Předmětem vynálezu je dále způsob potlačování růstu plevelů (tj. nežádoucí vegetace) na určitém místě, který spočívá v tom, že se na toto místo aplikuje herbicidně účinné množství alespoň jednoho isoxazolového derivátu obecného vzorce I. K těmto účelům se isoxazolové deriváty normálně používají ve formě herbicidních prostředků (tj. v kombinaci s kompatibilními ředidly nebo nosiči nebo/a povrchově aktivními činidly vhodnými pro použití v herbicidních prostředcích), například jak jsou popsány níže.

Sloučeniny obecného vzorce I vykazují herbicidní účinnost proti dvojděložným (tj. širokolistým) a jednoděložným (tj. trávovitým) plevelům, a to při preemergentní nebo/a postemergentní aplikaci.

Výrazem "preemergentní aplikace" se míní aplikace do půdy, v níž jsou přítomna semena nebo klíčící rostliny plevelů, před vzejitím plevelů nad povrch půdy. Výrazem "postemergentní aplikace" se míní aplikace na nadzemní části plevelů nebo na části plevelů vystavené kontaktu s herbicidem, vzešlé nad povrch půdy.

Tak například je možno používat sloučeniny obecného vzorce I k potlačování růstu širokolistých plevelů, jako jsou například:

Abutilon theophrasti (abutilon),
Amaranthus retroflexus (laskavec ohnutý),
Bidens pilosa (dvojjzubec),
Chenopodium album (merlík bílý),

Galium aparine (svízel přítula),
Ipomoea spec., např. *Ipomoea purpurea* (povíjnice),
Sesbania exaltata,
Sinapis arvensis (hořčice rolní),
Solanum nigrum (lilek černý) a
Xanthium strumarium (řepeň durkoman),

trávovitých plevelů, jako jsou například:

Alopecurus myosuroides (psárka polní),
Avena fatua (oves hluchý),
Digitaria sanguinalis (rosička krvavá),
Echinochloa crus-galli (ježatka kuří noha),
Sorghum bicolor (čirok),
Eleusine indica (eleusin) a
Setaria spec., např. *Setaria faberii* a *Setaria viridis*
(bér zelený)

a šáchorů, jako je například

Cyperus esculentus (šáchor jedlý).

Aplikovaná množství sloučenin obecného vzorce I se mění v závislosti na charakteru plevelů, na použitých prostředcích, na době, kdy se aplikace provádí, na klimatických a půdních podmínkách a na povaze užitkové rostliny v případě, že se potlačuje růst plevelů v kulturách užitkových rostlin. Aplikují-li se sloučeniny podle vynálezu na plochy, kde se pěstují nebo budou pěstovat užitkové rostliny, mají se aplikovat v dávce postačující k potlačení růstu plevelů a nezpůsobující přitom významnější trvalé škody na užitkových rostlinách. S přihlédnutím k těmto faktorům se obecně dosahuje dobrých výsledků při aplikaci dávek mezi 0,01 kg a 5 kg účinné látky na hektar. Je ovšem třeba mít na zřeteli, že je možno sloučeniny podle vynálezu aplikovat i ve vyšších nebo nižších dávkách, a to v závislosti na příslušných okolnostech spojených s problematikou hubení plevelů.

Sloučeniny obecného vzorce I je možno používat k selektivnímu potlačování růstu plevelů, například k potlačování růstu výše zmíněných druhů plevelů a to jejich preemergentní nebo postemergentní, směrovanou nebo nesměrovanou aplikací, například směrovanou nebo nesměrovanou postřikovou aplikací na místo zamořené plevellem, kterým je plocha jež se používá nebo bude používat k pěstování užitkových rostlin, například obilovin, jako pšenice, ječmene, ovsa, kukuřice a rýže, soji, fazolu obecného a polního, hrachu, vojtěšky, bavlníku, podzemnice olejné, lnu, cibule, mrkve, zelí, řepky olejné, slunečnice, cukrové řepy a trvalých či setých luk, a to před nebo po zasetí užitkové rostliny nebo před či po vzejití užitkové rostliny. K selektivnímu hubení plevelů na místech zamořených plevelů, jimiž jsou plochy, které se používají nebo budou používat k pěstování užitkových rostlin, například výše zmíněných užitkových rostlin, jsou zvláště vhodné aplikační dávky pohybující se mezi 0,01 kg a 4 kg, s výhodou mezi 0,01 kg a 2 kg účinné látky na hektar.

Sloučeniny obecného vzorce I je možno rovněž používat k potlačování růstu plevelů, zejména plevelů uveděných výše, preemergentní nebo postemergentní aplikací v ovocných sadech a na jiných plochách, kde se pěstují stromy, například v lesích, hájích a parcích a na plantážích, například na plantážích cukrové třtiny, palmy olejné a kaučukovníku. K tomuto účelu je možno zmíněné látky aplikovat směrovaným nebo nesměrovaným způsobem (například směrovaným nebo nesměrovaným postřikem) na plevele nebo na půdu, na níž se očekává jejich výskyt, a to před nebo po vysazení stromů nebo plantážních rostlin, v dávkách mezi 0,25 kg a 5 kg, s výhodou mezi 0,05 kg a 4 kg účinné látky na hektar.

Sloučeniny obecného vzorce I lze rovněž používat k potlačování růstu plevelů, zejména plevelů uvedených výše na místech, kde se užitkové rostliny nepěstují, kde je

však nicméně žádoucí plevely hubit.

Jako příklady takovýchto ploch, kde se užitkové rostliny nepěstují, lze uvést letiště, nezastavěné plochy průmyslových podniků, železnice, krajnice silnic, břehy řek, závlahových kanálů a jiných vodních cest, křovinaté porosty, úhory nebo nekultivovanou půdu. V daném případě jde zejména o plochy, na nichž je žádoucí potlačovat růst plevelů za účelem snížení nebezpečí požáru. Při použití k těmto účelům, kdy se často žádá totální herbicidní účinek, se účinné látky aplikují obvykle ve vyšších dávkách, než jaké se používají k ošetřování ploch, na nichž se pěstují užitkové rostliny, jak je popsáno výše. Přesné dávkování závisí na povaze ošetřované vegetace a na požadovaném efektu.

K danému účelu je zvláště vhodná preemergentní nebo postemergentní, zejména však preemergentní aplikace, směrovaným nebo nesměrovaným způsobem (například směrovaným nebo nesměrovaným postřikem) za použití aplikačních dávek pohybujících se mezi 1,0 kg a 20,0 kg, s výhodou mezi 5,0 kg a 10,0 kg účinné látky na hektar.

Při použití k potlačování růstu plevelů preemergentní aplikací je možno sloučeniny obecného vzorce I zpracovávat do půdy, na níž se očekává vzejití plevelů. Je pochopitelné, že používají-li se sloučeniny obecného vzorce I k potlačování růstu plevelů postemergentní aplikací, tj. aplikací na nadzemní nebo nechráněné části vzešlých plevelů, přicházejí sloučeniny obecného vzorce I normálně rovněž do styku s půdou, kde mohou mít preemergentní účinek na později klíčící plevely nacházející se v půdě.

V případech, kdy se požaduje zvláště dlouho trvající zničení plevelů, je možno v případě potřeby aplikaci sloučenin obecného vzorce I opakovat.

V souladu s dalším provedením vynález popisuje

prostředky vhodné k herbicidnímu používání, které obsahují jeden nebo několik isoxazolových derivátů obecného vzorce I v kombinaci (s výhodou homogenně dispergované) s jedním nebo několika kompatibilními ředidly nebo nosiči nebo/a povrchově aktivními činidly, použitelnými pro přípravu herbicidních prostředků (tj. ředidly nebo nosiči nebo/a povrchově aktivními činidly, které se v daném oboru obvykle používají, které jsou vhodné pro použití v herbicidních prostředcích a jsou kompatibilní se sloučeninami obecného vzorce I). Výraz "homogenně dispergovaný" se používá k popisu prostředků, v nichž jsou sloučeniny obecného vzorce I rozpuštěny v dalších komponentách. Výrazem "herbicidní prostředky" se v širokém slova smyslu míní nejen preparáty vhodné k okamžitému použití jako herbicidy, ale i koncentráty, které je nutno před použitím ředit. Prostředky podle vynálezu s výhodou obsahují 0,05 až 90 % hmotnostních jedné nebo několika sloučenin obecného vzorce I.

Herbicidní prostředky mohou obsahovat jak ředidlo nebo nosič, tak povrchově aktivní činidlo (například směšedlo, dispergátor nebo emulgátor). Povrchově aktivními činidly, která mohou být přítomna v herbicidních prostředcích podle vynálezu, mohou být povrchově aktivní činidla ionogenního nebo neionogenního typu, například sulforicinoleáty, kvarterní amoniové deriváty, produkty na bázi kondenzátů ethylenoxidu s alkyl- a polyarylfenoly, například s nonylfenoly nebo oktylfenoly, nebo estery karboxylových kyselin s anhydrosorbitoly, jejichž rozpustnost byla zajištěna etherifikací volných hydroxylových skupin kondenzací s ethylenoxidem, soli esterů kyseliny sírové a sulfonových kyselin s alkalickými kovy a kovy alkalických zemin, jako jsou dinonyl- a dioktylnatriumsulfonosukcináty, a soli derivátů sulfonové kyseliny o vysoké molekulové hmotnosti s alkalickými kovy a kovy alkalických zemin, jako lignosulfonát sodný a vápenatý a alkylbenzensulfoná-

ty sodné a draselné.

Herbicidní prostředky podle vynálezu mohou účelně obsahovat až do 10 % hmotnostních, například 0,05 až 10 % hmotnostních povrchově aktivního činidla. Je-li to však žádoucí, mohou herbicidní prostředky podle vynálezu obsahovat i vyšší podíl povrchově aktivního činidla, například až do 15 % hmotnostních v kapalných emulgovatelných suspenzních koncentrátech a až do 25 % hmotnostních v kapalných koncentrátech rozpustných ve vodě.

Jako příklady vhodných pevných ředidel nebo nosičů lze uvést křemičitan hlinitý, mastek, oxid hořečnatý, křemelinu, terciární fosforečnan vápenatý, práškový korek, adsorbující saze a hlínky, jako kaolín a bentonit. Pevné prostředky, které mohou mít formu popraší, granulátů nebo smáčitelných prášků, se s výhodou připravují rozemletím sloučenin obecného vzorce I s pevnými ředidly nebo impregnací pevných ředidel či nosičů roztoky sloučenin obecného vzorce I v těkavých rozpouštědlech, odpařením rozpouštědel a v případě potřeby rozemletím získaných produktů na prášky. Granulované prostředky je možno připravit tak, že se sloučeniny obecného vzorce I, rozpuštěné ve vhodných, například v těkavých rozpouštědlech, adsorbují na pevná ředidla nebo nosiče v granulované formě a rozpouštědla se pak popřípadě odpaří nebo že se granulují shora popsaným postupem získané prostředky v práškové formě. Pevné herbicidní prostředky, zejména smáčitelné prášky a granuláty mohou obsahovat smáčedla nebo dispergátory, například smáčedla nebo dispergátory shora popsaných typů, které mohou rovněž, jsou-li pevné, sloužit jako ředidla nebo nosiče.

Kapalné prostředky podle vynálezu mohou být ve formě vodných, organických nebo vodně organických roztoků, suspenzí a emulzí, jež mohou obsahovat povrchově aktivní činidlo. Mezi vhodná kapalná ředidla pro přípravu kapalných

prostředků náležejí voda, glykoly, tetrahydrofurfuryl-alkohol, acetofenon, cyklohexanon, isoforon, toluen, xylen, minerální, živočišné a rostlinné oleje a lehké aromatické a naftenické frakce ropy, jakož i směsi těchto ředidel. Jako povrchově aktivní činidla, která mohou být přítomna v kapalných prostředcích, lze uvést ionogenní nebo neionogenní povrchově aktivní činidla, například povrchově aktivní činidla shora popsaných typů, která mohou, jsou-li kapalná, rovněž sloužit jako ředidla nebo nosiče.

Prášky, dispergovatelné granuláty a kapalně prostředky ve formě koncentrátů je možno ředit vodou nebo jinými vhodnými ředidly, například minerálními nebo rostlinnými oleji, zejména pak v případě kapalných koncentrátů, v nichž ředidlem nebo nosičem je olej, za vzniku preparátů vhodných k okamžitému použití.

Je-li to žádoucí, lze kapalně prostředky obsahující sloučeninu obecného vzorce I používat ve formě samoemulgovatelných koncentrátů obsahujících účinnou látku rozpuštěnou v emulgátorech nebo v rozpouštědlech obsahujících emulgátory kompatibilní s účinnými látkami. Pouhým přidáním vody k takovýmto koncentrátům se pak získají preparáty vhodné k okamžitému použití.

Kapalné koncentráty, v nichž ředidlem nebo nosičem je olej, lze použít bez dalšího ředění, provádí-li se aplikace za pomoci elektrostatické postřikové techniky.

Herbicidní prostředky podle vynálezu mohou popřípadě rovněž obsahovat běžné pomocné látky, jako adheziva, ochranné koloidy, zahušťovadla, penetrační činidla, stabilizátory, komplexotvorná činidla, činidla proti spékání, barviva a inhibitory koroze. Tyto pomocné látky mohou rovněž sloužit jako nosiče nebo ředidla.

Výhodnými herbicidními prostředky podle vynálezu jsou následující prostředky, přičemž, pokud není uvedeno jinak, se uváděnými procenty rozumí procenta hmotnostní:

vodné suspenzní koncentráty obsahující 10 až 70 % jedné nebo několika sloučenin obecného vzorce I, 2 až 10 % povrchově aktivního činidla, 0,1 až 5 % zahušťovadla a 15 až 87,9 % vody,

smáčitelné prášky obsahující 10 až 90 % jedné nebo několika sloučenin obecného vzorce I, 2 až 10 % povrchově aktivního činidla a 8 až 88 % pevného ředidla nebo nosiče,

ve vodě rozpustné nebo ve vodě dispergovatelné prášky obsahující 10 až 90 % jedné nebo několika sloučenin obecného vzorce I, 2 až 40 % uhličitanu sodného a 0 až 88 % pevného ředidla,

kapalně rozpustné koncentráty rozpustné ve vodě obsahující 5 až 50 %, například 10 až 30 % jedné nebo několika sloučenin obecného vzorce I, 5 až 25 % povrchově aktivního činidla a 25 až 90 %, například 45 až 85 % rozpouštědla mísitelného s vodou, například dimethylformamidu, nebo směsi s vodou mísitelného rozpouštědla a vody,

kapalně emulgovatelné suspenzní koncentráty obsahující 10 až 70 % jedné nebo několika sloučenin obecného vzorce I, 5 až 15 % povrchově aktivního činidla, 0,1 až 5 % zahušťovadla a 10 až 84,9 % organického rozpouštědla,

granuláty obsahující 1 až 90 %, například 2 až 10 % jedné nebo několika sloučenin obecného vzorce I, 0,5 až 7 %, například 0,5 až 2 % povrchově aktivního činidla a 3 až 98,5 %, například 88 až 97,5 % granulovaného nosiče a

emulgovatelné koncentráty obsahující 0,05 až 90 %, s výhodou 1 až 60 % jedné nebo několika sloučenin obecného vzorce I, 0,01 až 10 %, s výhodou 1 až 10 % povrchově aktivního činidla a 9,99 až 99,94 %, s výhodou 39 až 98,99 % organického rozpouštědla.

Herbicidní prostředky podle vynálezu mohou rovněž obsahovat sloučeniny obecného vzorce I v kombinaci (s výhodou homogenně dispergované) s jednou nebo několika dalšími pesticidně účinnými sloučeninami a popřípadě s jedním nebo několika kompatibilními ředidly nebo nosiči použitelnými pro výrobu pesticidních prostředků, povrchově aktivními činidly a běžnými pomocnými látkami, jak je popsáno výše. Jako příklady dalších pesticidně účinných sloučenin, které mohou být obsaženy v herbicidních prostředcích podle vynálezu nebo které je možno používat v kombinaci s herbicidními prostředky podle vynálezu, lze uvést herbicidy sloužící například k rozšíření spektra účinnosti při hubení plevelů, jako jsou

alachlor [2-chlor-2,6'-diethyl-N-(methoxy-methyl)acetanilid],

atrazin [2-chlor-4-ethylamino-6-isopropylamino-1,3,5-triazin],

bromoxynil [3,5-dibrom-4-hydroxybenzonnitril],

chlortoluron [N'-(3-chlor-4-methylfenyl)-N,N-dimethylmočovina],

cyanazin [2-chlor-4-(1-kyano-1-methylethylamino)-6-ethylamino-1,3,5-triazin],

2,4-D [2,4-dichlorfenoxyoctová kyselina],

dicamba [3,6-dichlor-2-methoxybenzoová kyselina],

difenzoquat [1,2-dimethyl-3,5-difenylpyrazoliové soli],

flampropmethyl [methyl-N-2-(N-benzoyl-3-chlor-4-fluoranilino)-propionát],

fluometuron [N'-(3-trifluor-methylfenyl)-N,N-dimethylmočovina],

isoproturon [N'-(4-isopropylfenyl)-N,N-dimethylmočovina],

insekticidy, jako jsou

syntetické pyrethroidy, například permethrin a cypermethrin a

fungicidy, jako jsou

karbamáty, například methyl-N-(1-butyl-karbamoyl-benzimidazol-2-yl)karbamát a triazoly, například 1-(4-chlor-fenoxy)-3,3-dimethyl-1-(1,2,4-triazol-1-yl)-butan-2-on.

Pesticidně účinné látky a další biologicky aktivní materiály, které je možno přidávat do herbicidních prostředků podle vynálezu nebo používat v kombinaci s herbicidními prostředky podle vynálezu, jako například shora zmíněné látky, se v případě, že mají kyselý charakter, mohou popřípadě používat ve formě obvyklých derivátů, například solí s alkalickými kovy, solí s aminy a esterů.

Vynález rovněž zahrnuje výrobky obsahující alespoň jeden isoxazolový derivát obecného vzorce I nebo s výhodou shora popsaný herbicidní prostředek, zejména herbicidní koncentrát, který je nutno před použitím ředit, obsahující alespoň jeden isoxazolový derivát obecného vzorce I, v obalu opatřeném instrukcemi popisujícími způsob, jakým se má shora zmíněný derivát nebo deriváty obecného vzorce I, popřípadě herbicidní prostředek tyto látky obsahující, použít k potlačení růstu plevelů. Shora zmíněnými obaly mohou být obaly běžně používané ke skladování chemických látek pevných při okolní teplotě a herbicidních prostředků, zejména ve formě koncentrátů, například plechovky a kovové sudy, které mohou být popřípadě opatřeny vnitřním nátěrem, a nádoby z plastických hmot, skleněné láhve a láhve z plastických hmot, a dále v případě, že obsah je pevný, jako je tomu například v případě granulovaných herbicidních prostředků, krabice, například lepenkové krabice, krabice z plastických hmot a kovové krabice, nebo pytle. Tyto obaly mají být normálně dostatečně velké k tomu, aby se do nich bešlo množství isoxazolového derivátu nebo herbicidních prostředků, postačující k ošetření alespoň zhruba 40 arů pozemku, pokud jde o potlačení růstu plevelů, jejich velikost však nemá přesáhnout rozměry vhodné pro běžnou manipulaci. Instrukce,

kterými jsou tyto obaly opatřeny, mohou být na obalech například přímo natištěny, nebo mohou být obaly opatřeny nálepkou či visačkou s těmito instrukcemi. Zmíněné návody obvykle uvádějí, že obsah obalu, v případě potřeby po zředění, se aplikuje k potlačení růstu plevelů v aplikačních dávkách mezi 0,01 kg a 20 kg účinné látky na hektar, a to způsobem a k účelům popsaným výše.

Následující příklady ilustrují herbicidní prostředky podle vynálezu.

Příklad C1

Rozpustný koncentrát byl připraven z těchto složek:

účinná látka (sloučenina A)	20 % (hmotnost/objem)
33% (hmotnost/objem) roztok hydroxidu draselného	10 % (objem/objem)
tetrahydrofurfurylalkohol	10 % (objem/objem)
voda	do 100 % objemu

Shora uvedený prostředek byl připraven tak, že se k míchané směsi tetrahydrofurfurylalkoholu, účinné látky (sloučeniny A) a 90 % objemu vody pomalu přidával roztok hydroxidu draselného, až se získalo stálé pH 7 - 8, a poté se objem doplnil vodou.

Obdobné rozpustné koncentráty je možno připravit shora popsaným způsobem za použití jiných sloučenin obecného vzorce I místo sloučeniny A.

Příklad C2

Smáčitelný prášek byl připraven z těchto složek:

účinná látka (sloučenina A)	50 % (hmotnost/hmotnost)
-----------------------------	--------------------------

natrium-dodecylbenzensulfonát	3 % (hmotnost/hmotnost)
natrium-lignosulfát	5 % (hmotnost/hmotnost)
natrium-formaldehyd-alkyl- naftalensulfonát	2 % (hmotnost/hmotnost)
velmi jemný oxid křemičitý	3 % (hmotnost/hmotnost) a
kaolín	37 % (hmotnost/hmotnost).

Shora uvedený prostředek byl připraven tak, že se jednotlivé složky smíchaly a směs se rozemlela ve vzduchovém mlýnu.

Obdobné smáčitelné prášky je možno připravit shora popsaným způsobem za použití jiných sloučenin obecného vzorce I místo sloučeniny A.

Příklad C3

Prášek rozpustný ve vodě byl připraven z těchto složek:

účinná látka (sloučenina A)	50 % (hmotnost/hmotnost)
natrium-dodecylbenzensulfonát	1 % (hmotnost/hmotnost)
velmi jemný oxid křemičitý	2 % (hmotnost/hmotnost)
hydrogenuhlíčitan sodný	47 % (hmotnost/hmotnost)

Shora uvedený prostředek byl připraven tak, že se jednotlivé složky smíchaly a směs se rozemlela v kládiovém mlýnu.

Obdobné prášky rozpustné ve vodě je možno připravit shora popsaným způsobem za použití jiných sloučenin obecného vzorce I místo sloučeniny A.

V následující části jsou popsány postupy, v nichž byly použity sloučeniny podle vynálezu při herbicidních

aplikacích.

Způsob použití herbicidních sloučenin

(a) Obecně:

Příslušná množství sloučenin používaných k ošetření rostlin se rozpustila v acetonu na roztoky odpovídající aplikačním dávkám až 4000 g testované sloučeniny na hektar. Tyto roztoky byly aplikovány standardním laboratorním herbicidním postřikovačem v dávce odpovídající 290 litrům postřikové kapaliny na hektar.

(b) Hubení plevelů - preemergentní aplikace:

Semena byla vyseta do nesterilní půdy v 75 mm hlubokých miskách z umělé hmoty, tvaru čtverce o hraně 70 mm. Množství semen na misku byla následující:

Druh plevelu	Přibližné množství semen na misku
1) širokolisté plevely:	
<i>Abutilon theophrasti</i>	10
<i>Amaranthus retroflexus</i>	20
<i>Galium aparine</i>	10
<i>Ipomoea purpurea</i>	10
<i>Sinapis arvensis</i>	15
<i>Xanthium strumarium</i>	2
2) trávovité plevely:	
<i>Alopecurus myosuroides</i>	15
<i>Avena fatua</i>	10
<i>Echinochloa crus-galli</i>	15
<i>Setaria viridis</i>	20
3) šáchory:	
<i>Cyperus esculentus</i>	3

Plodina	Přibližné množství semen na misku
1) širokolisté:	
bavlník	3
soja	3
2) trávovité:	
kukuřice	2
rýže	6
pšenice	6.

Sloučeniny podle vynálezu byly aplikovány na povrch půdy obsahující semena způsobem popsaným v části (a). Pro každé ošetření a každý druh plevelu nebo plodiny byla použita jedna miska, přičemž byly provedeny rovněž kontrolní pokusy s neošetřenými miskami a kontrolní pokusy s miskami ošetřenými pouze samotným acetonem.

Po ošetření byly misky umístěny na vzlínavou podložku do skleníku a zavlažovány svrchu. Vyhodnocení poškození rostlin bylo provedeno vizuálně 20 - 24 dnů po postřiku. Výsledky byly vyjádřeny v procentech potlačení růstu nebo poškození plodiny či plevelu ve srovnání s rostlinami v kontrolních miskách.

(c) Hubení plevelů - postemergentní aplikace:

Plevely a plodiny byly vysety přímo do kompostovky John Innes do 75 mm hlubokých misek čtvercového tvaru o hraně 70 mm, s výjimkou plevelů rodu *Amaranthus*, které byly přepíchány do misek ve stadiu semenáčků týden před postřikem. Rostliny byly poté pěstovány ve skleníku, dokud nebyly připraveny k postřiku sloučeninami použitými k ošetření rostlin. Počty rostlin v misce byly následující:

1) Širokolisté plevely:

druh plevele	počet rostlin na misku	růstové stadium
<i>Abutilon theophrasti</i>	3	1 až 2 listy
<i>Amaranthus retroflexus</i>	4	1 až 2 listy
<i>Galium aparine</i>	3	první přeslen
<i>Ipomoea purpurea</i>	3	1 až 2 listy
<i>Sinapis arvensis</i>	4	2 listy
<i>Xanthium strumarium</i>	1	2 až 3 listy

2) Trávovité plevely:

druh plevele	počet rostlin na misku	růstové stadium
<i>Alopecurus myosuroides</i>	8 - 12	1 až 2 listy
<i>Avena fatua</i>	12 - 18	1 až 2 listy
<i>Echinochloa crus-galli</i>	4	2 až 3 listy
<i>Setaria viridis</i>	15 - 25	1 až 2 listy

3) Šáchorý:

druh plevele	počet rostlin na misku	růstové stadium
<i>Cyperus esculentus</i>	3	3 listy

1) Širokolisté plodiny:

plodina	počet rostlin na misku	růstové stadium
bavlník	2	1 list
soja	2	2 listy

2) Trávovité plodiny:

plodina	počet rostlin na misku	růstové stadium
kukuřice	2	2 až 3 listy
rýže	4	2 až 3 listy
pšenice	5	2 až 3 listy.

Sloučeniny použité pro ošetření rostlin byly aplikovány na rostliny způsobem popsáným v části (a). Pro každé ošetření a každý druh plevelu nebo plodiny byla použita jedna miska, přičemž byly provedeny rovněž kontrolní pokusy s neošetřenými miskami a kontrolní pokusy s miskami ošetřenými pouze samotným acetonem.

Po ošetření byly misky umístěny ve skleníku na vzlínavou podložku, zavlaženy svrchu jednou za 24 hodin a poté řízenou spodní závlahou. Vyhodnocení poškození rostlin bylo provedeno vizuálně 20 - 24 dnů po postřiku. Výsledky byly vyjádřeny v procentech potlačení růstu nebo poškození plodiny či plevelu ve srovnání s rostlinami v kontrolních miskách.

Sloučeniny podle vynálezu vykazaly při použití 4 kg na hektar nebo méně vynikající úroveň herbicidní účinnosti současně s tolerancí užitkových rostlin při použití plevelů uvedených shora.

Při preemergentní nebo postemergentní aplikaci v dávce 1000 g na hektar potlačují sloučeniny A až T růst jednoho nebo několika druhů plevelů nejméně z 90 %.

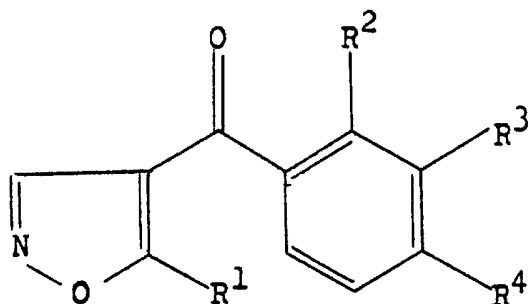
J. Traplová
UDr. Jarmila Traplová

č.j.	045042
POSTO	03. VIII 52
ÚŘAD PRO VYNÁLEZY A OBJEVY	
PŘÍL.	

PATENTOVÉ NÁROKY

2413-92

1. Deriváty 4-benzoylisoxazolu obecného vzorce I



ve kterém

- R^1 představuje methylovou, ethylovou, isopropylovou, cyklopropylovou nebo 1-methylcyklopropylovou skupinu,
- R^2 znamená alkylovou nebo alkoxylovou skupinu s přímým či rozvětveným řetězcem obsahující až 4 atomy uhlíku,
- R^3 představuje atom vodíku, chloru, bromu nebo fluoru; nebo skupinu vybranou ze souboru zahrnujícího R^5 , $-CO_2R^5$ a $-OR^5$; nebo alkylovou skupinu s přímým či rozvětveným řetězcem obsahující až 4 atomy uhlíku substituovanou $-OR^5$; nebo alkoxylovou skupinu s přímým či rozvětveným řetězcem obsahující až 4 atomy uhlíku substituovanou $-OR^5$,
- R^4 znamená $-S(O)_nR$,
- R^5 představuje alkylovou skupinu s přímým či rozvětveným řetězcem obsahující až 4 atomy uhlíku, která je popřípadě substituována jedním nebo několika atomy halogenů,
- R znamená methylovou nebo ethylovou skupinu, a

n představuje nulu, jedničku nebo dvojku,
s tím, že v případě, že R^1 představuje methylovou nebo
cyklopropylovou skupinu, R^2 znamená methylovou skupinu
a R^4 představuje $-\text{SO}_2\text{CH}_3$, R^3 znamená jinou skupinu než
 $-\text{CO}_2\text{CH}_3$ či $-\text{CO}_2-\text{CH}-\begin{matrix} \text{CH}_3 \\ \diagdown \\ \text{CH}_3 \end{matrix}$.

2. Sloučenina podle nároku 1, kde:

- a) R^1 představuje isopropylovou, cyklopropylovou nebo
1-methylcyklopropylovou skupinu, nebo/a
- b) R^2 znamená methylovou, ethylovou, methoxylovou nebo
ethoxylovou skupinu, nebo/a
- c) R^3 představuje atom vodíku, chloru, bromu či fluoru;
nebo skupinu vybranou ze souboru zahrnujícího
methylovou skupinu, methoxylovou skupinu, ethoxy-
lovou skupinu, $-\text{CH}_2\text{OR}^5$, $-\text{O}-(\text{CH}_2)_2\text{OR}^5$ a $-\text{CO}_2\text{R}^5$,
kde R^5 znamená alkylovou skupinu s přímým či roz-
větveným řetězcem obsahující až 3 atomy uhlíku,

a zbývající obecné symboly mají shora uvedený význam.

3. Sloučenina podle nároku 1 nebo 2, kde

- R^1 představuje isopropylovou, cyklopropylovou nebo
1-methylcyklopropylovou skupinu,
- R^2 znamená methylovou, ethylovou, methoxylovou nebo
ethoxylovou skupinu,
- R^3 představuje atom vodíku, atom fluoru, atom chloru,
atom bromu, methylovou skupinu, methoxymethylovou
skupinu nebo 1-methoxyethoxyskupinu,

a zbývající obecné symboly mají shora uvedený význam.

4. Sloučenina podle nároku 1, 2 nebo 3, kde

- R^1 představuje isopropylovou, 1-methylcyklopropylovou
nebo cyklopropylovou skupinu,

- R^2 znamená methylcovou, ethylovou, methoxylovou nebo ethoxylovou skupinu,
- R^3 představuje atom vodíku, atom fluoru, atom chloru, atom bromu, methylcovou skupinu nebo methoxylovou skupinu,
- R znamená methylcovou skupinu,
- a zbývající obecné symboly mají shora uvedený význam.

5. Sloučenina podle libovolného z nároků 1 až 4, kde

- R^1 představuje cyklopropylovou skupinu,
- R^2 znamená methylcovou nebo methoxylovou skupinu a
- R^3 představuje methoxylovou skupinu nebo atom vodíku, s tím, že R^2 a R^3 neznamenaají současně methoxylovou skupinu,
- R představuje methylcovou skupinu,
- a zbývající obecné symboly mají shora uvedený význam.

6. Sloučenina podle nároku 1 vybraná ze skupiny zahrnující:

- 5-cyklopropyl-4-(2-methoxy-4-methylsulfenylbenzoyl)isoxazol,
- 5-cyklopropyl-4-(2-methoxy-4-methylsulfonylbenzoyl)-isoxazol,
- 5-cyklopropyl-4-(2-methoxy-4-methylsulfinylbenzoyl)-isoxazol,
- 5-cyklopropyl-4-(2-methyl-4-methylsulfinylbenzoyl)isoxazol,
- 5-cyklopropyl-4-(2-methyl-4-methylsulfonylbenzoyl)isoxazol,
- 5-cyklopropyl-4-(2-methyl-4-methylsulfenylbenzoyl)isoxazol,
- 5-(1-methylcyklopropyl)-4-(2-methyl-4-methylsulfonyl-

benzoyl)isoxazol,

4-(2-ethyl-4-methylsulfenylbenzoyl)-5-cyklopropylisoxazol,

4-(2-ethyl-4-methylsulfinylbenzoyl)-5-cyklopropylisoxazol,

4-(2-ethyl-4-methylsulfonylbenzoyl)-5-cyklopropylisoxazol,

4-(2-ethoxy-4-methylsulfenylbenzoyl)-5-cyklopropylisoxazol,

4-(2-ethoxy-4-methylsulfonylbenzoyl)-5-cyklopropylisoxazol,

4-(3-chlor-2-methyl-4-methylsulfenylbenzoyl)-5-cyklopropylisoxazol,

4-(3-chlor-2-methyl-4-methylsulfinylbenzoyl)-5-cyklopropylisoxazol,

4-(3-chlor-2-methyl-4-methylsulfonylbenzoyl)-5-cyklopropylisoxazol,

4-(2-methyl-3-methoxy-4-methylsulfenylbenzoyl)-5-cyklopropylisoxazol,

4-(2-methyl-3-methoxy-4-methylsulfonylbenzoyl)-5-cyklopropylisoxazol,

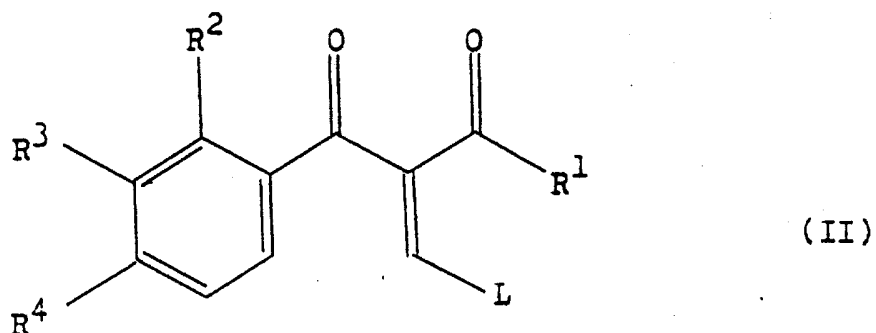
4-(2,3-dimethyl-4-methylsulfenylbenzoyl)-5-cyklopropylisoxazol,

4-(2,3-dimethyl-4-methylsulfinylbenzoyl)-5-cyklopropylisoxazol a

4-(2,3-dimethyl-4-methylsulfonylbenzoyl)-5-cyklopropylisoxazol.

7. Způsob výroby sloučenin obecného vzorce I podle nároku 1, v y z n a ě u j í c í s e t í m , že se

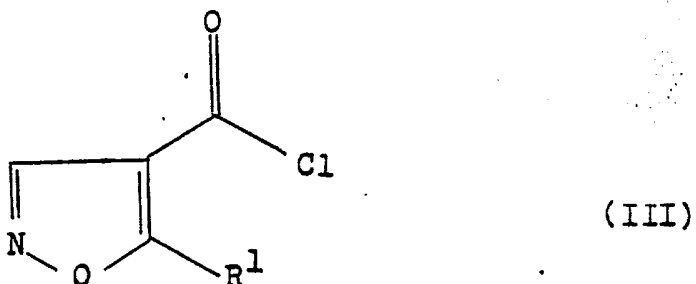
a) nechá reagovat sloučenina obecného vzorce II



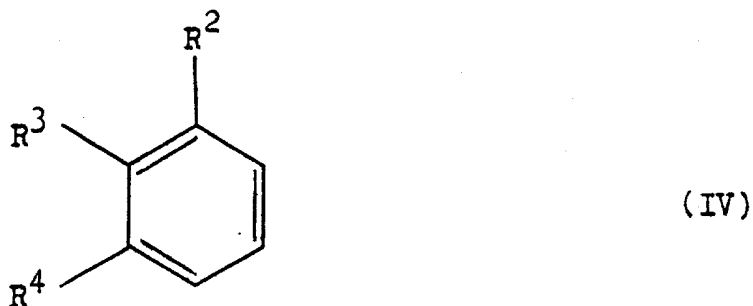
ve kterém L znamená odštěpitelnou skupinu a zbývající obecné symboly mají význam definovaný v nároku 1, se solí hydroxylaminu;

nebo že se

b) k výrobě sloučenin, v nichž R^4 představuje skupinu -SR, nechá reagovat sloučenina obecného vzorce III



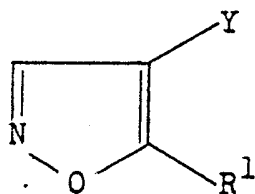
ve kterém má R^1 význam definovaný v nároku 1, se sloučeninou obecného vzorce IV



ve kterém R^4 znamená skupinu $-SR$, a R , R^2 a R^3 mají význam definovaný v nároku 1;

nebo že se

c) nechá reagovat sloučenina obecného vzorce V



(V)

ve kterém Y představuje karboxylovou skupinu nebo její reaktivní derivát, či kyanoskupinu, a R^1 má význam definovaný v nároku 1,

s vhodným organokovovým činidlem;

nebo že se

d) k výrobě sloučenin, v nichž n znamená 1 nebo 2, oxiduje atom síry v odpovídající sloučenině obecného vzorce I, kde n představuje nulu, a zbývající obecné symboly mají význam definovaný v nároku 1.

8. Herbicidní prostředek, v y z n a č u j í c í s e t í m , že jako účinnou složku obsahuje herbicidně účinné množství isoxazolového derivátu obecného vzorce I, definovaného v nároku 1, v kombinaci s ředidlem nebo nosičem nebo/a povrchově aktivním činidlem, vhodným pro použití v zemědělství.

9. Herbicidní prostředek podle nároku 8, v y z n a č u j í c í s e t í m , že obsahuje 0,05 až 90 % hmotnostních účinné složky.

10. Herbicidní prostředek podle nároku 8 nebo 9, v y z n a č u j í c í s e t í m , že je v kapalné formě a obsahuje 0,05 až 25 % povrchově aktivního činidla.

11. Herbicidní prostředek podle nároku 8, 9 nebo 10, v y z n a č u j í c í s e t í m , že je ve formě vodného suspenzního koncentrátu, smáčitelného prášku, ve vodě rozpustného nebo ve vodě dispergovatelného prášku, kapalného koncentrátu rozpustného ve vodě, kapalného emulgovatelného suspenzního koncentrátu, granulátu nebo emulgovatelného koncentrátu.

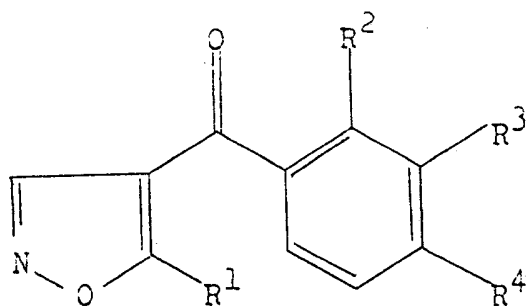
12. Způsob potlačování růstu plevelů na určitém místě, v y z n a č u j í c í s e t í m , že se na toto místo aplikuje herbicidně účinné množství isoxazolového derivátu obecného vzorce I definovaného v nároku 1.

13. Způsob podle nároku 12, v y z n a č u j í c í s e t í m , že ošetřovaným místem je plocha, která se používá nebo bude používat k pěstování užitkových rostlin a sloučenina se aplikuje v aplikační dávce od 0,01 kg do 4,0 kg na hektar.

14. Způsob podle nároku 12, v y z n a č u j í c í s e t í m , že ošetřovaným místem je plocha, na které se užitkové rostliny nepěstují a sloučenina se aplikuje v aplikační dávce od 1,0 kg do 20,0 kg na hektar.

J. S. KUBIŠ
UDr. Jarmila Traplová

Vzorec pro anotaci (I)



(I)

