

PŘIHLÁŠKA VYNÁLEZU

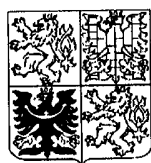
zveřejněná podle § 31 zákona č. 527/1990 Sb.

(21) Číslo dokumentu:

2481-97

(19)

ČESKÁ
REPUBLIKA



ÚŘAD
PRŮMYSLVÉHO
VLASTNICTVÍ

(22) Přihlášeno: **05. 08. 97**

(32) Datum podání prioritní přihlášky: **07.08.96**

(31) Číslo prioritní přihlášky: **96/693422**

(33) Země priority: **US**

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

(13) Druh dokumentu: **A3**

(51) Int. Cl.⁶:

C 07 D 213/62
C 07 D 239/32
A 01 N 43/40
A 01 N 43/54

(71) Přihlášovatel:

AMERICAN CYANAMID COMPANY, Wayne,
NJ, US;

(72) Původce:

Kleemann Axel, Hanau, DE;
Baltruschat Helmut Siegfried,
Schweppenhausen, DE;
Maier Thomas, Mainz, DE;
Scheiblich Stefan, Mainz, DE;

(74) Zástupce:

Čermák Karel Dr., Národní 32, Praha 1,
11000;

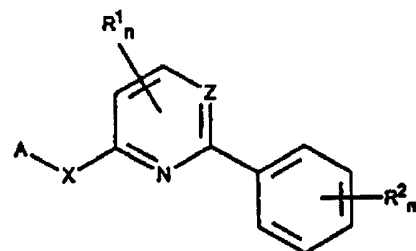
(54) Název přihlášky vynálezu:

**2,6-Disubstituované pyridiny a 2,4-di-
substituované pyrimidiny a jejich použi-
tí, herbicidní prostředky a způsoby potla-
čování rostlin**

(57) Anotace:

2,6-Disubstituované pyridiny a 2,4-disubsti-
tuované pyrimidiny obecného vzorce I, kde A
představuje popřípadě substituovanou
arylskupinu nebo popřípadě substituovanou
pěti nebo šestičlennou heteroaromatickou
skupinu obsahující atom dusíku nebo diflu-
orbenzodioxolyl skupinu; m představuje celé
číslo od 0 do 5; n představuje celé číslo od 0 do
2; R¹ při každém svém výskytu nezávisle
představuje atom vodíku, atom halogenu, po-
případě substituovanou alkylskupinu, alke-
nylskupinu, alkinylskupinu, alkoxy skupinu,
alkoxyalkoxy skupinu, alkoxyalkylskupinu,
dialkoxyalkylskupinu, alkylthioskupinu,
amino skupinu, alkylaminoskupinu, dialkyla-
minoskupinu, alkoxyaminoskupinu nebo
formamidinoskupinu; R² při každém svém
výskytu nezávisle představuje atom vodíku,
atom halogenu, popřípadě substituovanou

alkylskupinu, alkenylskupinu, alkinylsku-
pinu, alkoxy skupinu, alkoxyalkylskupinu,
alkoxyalkoxy skupinu, alkylthioskupinu,
alkylsulfinyl, alkylsulfonyl, nitroskupinu,
kyanoskupinu, halogenalkylskupinu, ha-
logenalkoxy skupinu, halogenalkylthiosku-
pinu nebo SF₅; X představuje atom kyslí-
ku nebo síry; a Z představuje atom dusíku
nebo skupinu CH; přičemž /a/ A předsta-
vuje pyridylskupinu substituovanou ales-
poň jednou halogenalkylskupinou, haloge-
nalkoxy skupinou nebo halogenalkylthi-
oskupinou, když Z představuje atom dusí-
ku; nebo /b/ m a n představují číslo 1, R¹
představuje alkylskupinu, alkoxy skupinu
nebo alkylaminoskupinu vázanou v poloze
4 a R² představuje trifluormethylskupinu,
když Z představuje skupinu CH. Použití
těchto sloučenin, herbicidní prostředky na
jejich bázi a způsoby potlačování rostlin.



CZ 2481-97 A3

01-1832-97-Če

2,6-Disubstituované pyridiny a 2,4-disubstituované pyrimidiny a jejich použití, herbicidní prostředky a způsoby potlačování rostlin

Oblast techniky

Vynález se týká určitých 2,6-disubstituovaných pyridinů a 2,4-disubstituovaných pyrimidinů, způsobů jejich výroby a jejich použití jako herbicidů.

Dosavadní stav techniky

Pyridinů, pyrimidinů a jejich derivátů je hojně užíváno ve farmacii, jakož i v zemědělství (jako herbicidů, fungicidů, akaricidů, anthelmintik a ptačích repelentů) a dále jako reakčních činidel, meziproduktů a chemikálií v průmyslu polymerů a textilním průmyslu.

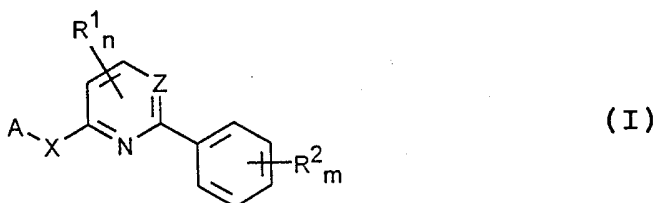
Tak jsou například 2-arylpyrimidiny (DE 40 29 654) a 2-pyrimidinyl-6-arylpyridiny (JO 2131-480) popsány jako fungicidy. Předmětem EP 263 958 jsou herbicidně účinné 2,6-difenylpyridiny; jim strukturně příbuzné 2,4-difenylpyrimidiny jsou popsány v EP 354 766 a EP 425 247 a jsou rovněž herbicidní. Jako jiný příklad je možno uvést 2,6-difenoxy-pyridiny, které byly publikovány v EP 572 093, jako herbicidy. 4-Fenoxy-2-pyrazol-1-ylpyrimidiny jsou popsány v DE 29 35 578 a vykazují fungicidní účinnost. Huelsen (Diplomová práce, Konstanz, 1993) popisuje čtyři různé 2-(1-methyl-3-trifluormethylpyrazol-5-yloxy)-6-fenylpyridiny, ale nezmiňuje se o žádné biologické účinnosti.

Nyní bylo překvapivě zjištěno, že nové pyridinové a pyrimidinové deriváty podle tohoto vynálezu, které současně

obsahují arylskupinu a aryloxy- nebo heteroaryloxyskupinu, vykazují dobrou herbicidní účinnost. Tyto sloučeniny mají neočekávaně vysokou účinnost a dobrou selektivitu vůči ploidinám při preemergentní i postemergentní aplikaci na širokolisté i travní druhy plevelů.

Podstata vynálezu

Předmětem vynálezu jsou 2,6-disubstituované pyridiny a 2,4-disubstituované pyrimidiny obecného vzorce I



kde

A představuje popřípadě substituovanou arylskupinu nebo popřípadě substituovanou pěti- nebo šestičlennou heteroaromatickou skupinu obsahující atom dusíku nebo difluorbenzodioxolylskupinu;

m představuje celé číslo od 0 do 5;

n představuje celé číslo od 0 do 2;

R¹ při každém svém výskytu nezávisle představuje atom vodíku, atom halogenu, popřípadě substituovanou alkylskupinu, alkenylskupinu, alkynylskupinu, alkoxyskupinu, alkoxyalkylskupinu, dialkoxyalkylskupinu, alkoxyalkoxyskupinu, alkylthioskupinu, aminoskupinu, alkylaminoskupinu, dialkylaminoskupinu, alkoxyaminoskupinu nebo formamidinoskupinu;

R^2 při každém svém výskytu nezávisle představuje atom vodíku, atom halogenu, popřípadě substituovanou alkylskupinu, alkenylskupinu, alkynylskupinu, halogenalkylskupinu, halogenalkoxyskupinu, alkoxy- skupinu, alkoxyalkylskupinu, alkoxyalkoxyskupinu, alkylthioskupinu, halogenalkylthioskupinu nebo nitroskupinu, kyanoskupinu, skupinu SF_5 , alkyl- sulfonyskupinu nebo alkylsulfinylskupinu;

X představuje atom kyslíku nebo síry; a

Z představuje atom dusíku nebo skupinu CH;

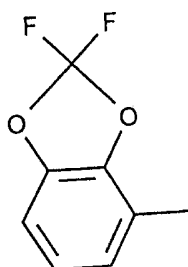
příčemž

(a) A představuje pyridylskupinu substituovanou alespoň jednou halogenalkylskupinou, halogenalkoxyskupinou nebo halogenalkylthioskupinou, když Z představuje atom dusíku; nebo

(b) m a n představují číslo 1, R^1 představuje alkylskupinu, alkoxy skupinu nebo alkylaminoskupinu vázanou v poloze 4 a R^2 představuje trifluormethylskupinu, když Z představuje skupinu CH.

Arylskupina, která je substituentem nebo částí jiných substituentů nebo arylskupina ve významu symbolu A představuje výhodně popřípadě substituovanou fenylskupinu nebo naftylskupinu. Pěti- nebo šestičlenná heteroarylskupina uvedená v definici symbolu A představuje popřípadě substituovanou pěti- nebo šestičlennou heterocyklickou skupinu, která obsahuje jeden nebo více atomů dusíku a/nebo kyslíku a/nebo síry. Přednost se dává 1 až 3 atomům dusíku. Jako příklady takových skupin je možno uvést pyrazolyl, imidazolyl, triazolyl, tetrazolyl, pyridyl, pyrazinyl, pyrimi-

dinyl, pyridazinyl, isoxazolyl, isothiazolyl a triazinylskupinu. Definice arylskupiny ve významu symbolu A zahrnuje také bicyklické systémy, které se skládají z benzenového kruhu přikondenzovaného k pětičlennému nebo šestičlennému heterocyklickému kruhu definovanému výše a samotné pětičlenné nebo šestičlenné heterocykly mohou být kondenzovány s benzenovým jádrem. Podle jiného přednostního provedení A představuje difluorbenzodioxolylskupinu vzorce



Obecně platí, že když některý z výše uvedených zbytků obsahuje alkylskupinu, alkenylskupinu nebo alkinylskupinu, jsou tyto skupiny přímé nebo rozvětvené a obsahují 1 až 12, přednostně 1 až 4 atomy uhlíku, pokud není uvedeno jinak. Jako příklady takových skupin je možno uvést methylskupinu, ethylskupinu, propylskupinu, vinylskupinu, allylskupinu, isopropylskupinu, butylskupinu, isobutylskupinu a terc.butylskupinu. Alkylové části halogenalkylskupiny, halogenalkoxyskupiny, alkylthioskupiny, halogenalkylthioskupiny nebo alkokyskupiny s výhodou obsahují 1 až 4, přednostně 1 nebo 2, atomy uhlíku. Alkoxyalkylskupina, alkoxyalkoxyskupina nebo dialkoxyalkylskupina obsahuje až 6, přednostně až 4 atomy uhlíku. Jako příklady takových skupin je možno uvést methoxymethylskupinu, methoxymethoxyskupinu, methoxyethylskupinu, ethoxymethylskupinu, ethoxyethoxyskupinu a dimethoxymethylskupinu.

Pod označením "halogen" se rozumí fluor, chlor, brom nebo jod, přednostně fluor, chlor nebo brom. Halogenalkylskupina, halogenalkylthioskupina a halogenalkoxysku-

pina přednostně představuje mono-, di- nebo trifluoralkylskupinu, -alkylthioskupinu a -alkoxyskupinu, zejména trifluormethylskupinu, difluormethoxyskupinu, trifluormethylthioskupinu nebo trifluormethoxyskupinu.

Pokud se u některé z výše uvedených skupin uvádí, že je popřípadě substituována, přicházejí jako tyto případné substituenty v úvahu skupiny, kterých se obvykle používá při vývoji pesticidních sloučenin a/nebo při jejich modifikaci a zejména se jedná o substituenty, kterých se používá za účelem udržení nebo zvýšení herbicidní účinnosti nebo ovlivnění persistence, penetrace do půdy nebo rostliny nebo jakékoliv jiné požadované vlastnosti takové herbicidní sloučeniny. V každé části molekuly může být přítomen jeden substituent nebo více stejných nebo rozdílných substituentů. V případě výše definovaných zbytků, které obsahují popřípadě substituované alkylové skupiny, včetně alkylových částí halogenalkylových, alkoxylových skupin, alkylthioskupin, halogenalkoxylových, alkylaminových a dialkylaminových skupin, je možno jako specifické příklady substituentů uvést fenylskupinu, atomy halogenu, nitroskupinu, kyanoskupinu, hydroxyskupinu, alkoxyskupinu s 1 až 4 atomy uhlíku, halogenalkoxyskupinu s 1 až 4 atomy uhlíku a alkoxykarbonylskupinu s 1 až 4 atomy uhlíku v alkoxylové části.

Pokud některá z výše uvedených skupin zahrnuje popřípadě substituovanou arylovou nebo heteroarylovou skupinu, jsou případné substituenty zvoleny ze souboru zahrnujícího halogen, zejména fluor, chlor a brom, nitroskupinu, kyanoskupinu, aminoskupinu, hydroxyskupinu, alkylskupinu s 1 až 4 atomy uhlíku, alkoxyskupinu s 1 až 4 atomy uhlíku, halogenalkylskupinu s 1 až 4 atomy uhlíku, halogenalkoxyskupinu s 1 až 4 atomy uhlíku, halogenalkylthioskupinu s 1 až 4 atomy uhlíku a halogensulfanylskupinu, jako je SF₅. Takových substituentů může být přítomno účelně 1 až 5; přednost se

09.03.98

dává 1 až 2 substituentům. Jako příklady halogenalkylskupin, halogenalkoxyskupin a halogenalkylthioskupin je možno uvést trifluormethylskupinu, trifluormethoxyskupinu, difluormethoxyskupinu a trifluormethylthioskupinu.

Parametr m má přednostně hodnotu do 1 do 3 a n má přednostně hodnotu 1 (potom R^1 nepředstavuje atom vodíku).

Sloučeniny obecného vzorce I mají povahu olejů, pryskyřic nebo, nejčastěji, krystalických pevných látek. Může se jich například používat v zemědělství nebo souvisejících oborech pro potlačování nežádoucích rostlin, jako je *Alopecurus myosuroides*, *Echinochloa crus-galli*, *Setaria viridis*, *Galium aparine*, *Stellaria media*, *Veronica persica*, *Lamium purpureum*, *Viola arvensis*, *Abutilon theophrasti*, *Ipomoea purpurea* a *Amaranthus retroflexus* a je možno je aplikovat preemergentně i postemergentně. Sloučeniny obecného vzorce I vykazují vysokou herbicidní účinnost v širokém koncentračním rozmezí a je možno jich používat v zemědělství.

Přednost se dává sloučeninám podle vynálezu, kde A představuje fenylskupinu, pyridylskupinu nebo pyrazolylskupinu, z nichž každá je substituována jedním nebo více substituenty, které mohou být stejné nebo různé a jsou zvoleny ze souboru zahrnujícího atomy halogenu, alkylskupinu, alkoxyskupinu, halogenalkylskupinu, halogenalkoxyskupinu a pentahalogensulfanylskupinu.

Zvláštní přednost se dává sloučeninám podle vynálezu, které nesou substituent skupiny A v meta poloze vzhledem k místu připojení této skupiny.

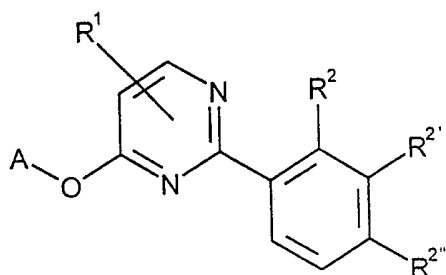
Z hlediska potlačování růstu nežádoucích rostlin byly dobré výsledky získány u sloučenin podle vynálezu,

09.03.98

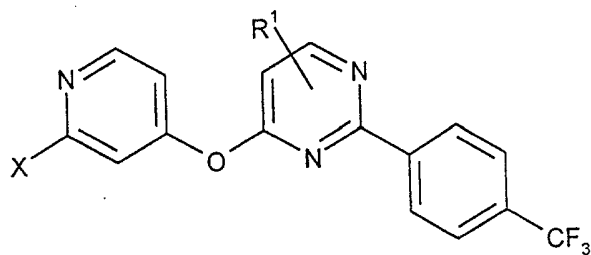
kde zbytek A je metasubstituován atomem chloru nebo tri-
fluormethylskupinou, zejména kde A představuje 2-chlor-
pyrid-4-yl-, 1-methyl-3-trifluormethylpyrazol-5-yl- nebo
3-trifluormethylfenylskupinu.

Zvláště dobrých výsledků při potlačování plevelných
rostlin bylo dosaženo u sloučenin podle vynálezu, kde
X představuje atom kyslíku a mimořádné výsledky byly
získány u sloučenin podle vynálezu, kde Z představuje atom
dusíku.

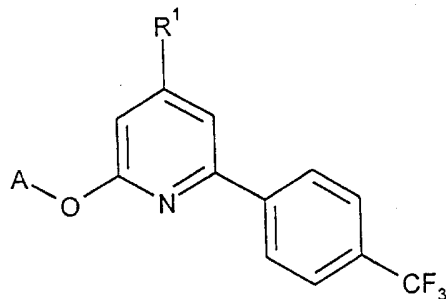
Přednostní provedení vynálezu představují slouče-
niny obecných vzorců IA, IB a IC



(I A)



(IB)



(IC)

09.03.98

Ve sloučeninách obecného vzorce 1A A představuje 2-trifluormethylpyrid-4-ylskupinu nebo 2-difluormethoxy-pyrid-4-ylskupinu; R^1 má výše uvedený význam; R^2 , $R^{2'}$ a $R^{2''}$ představuje každý nezávisle atom vodíku, fluoru, chloru nebo bromu nebo jeden nebo dva z R^2 , $R^{2'}$ a $R^{2''}$ představují také trifluormethylskupinu, trifluormethoxyskupinu nebo kyano-skupinu, $R^{2''}$ může dále představovat alkylskupinu s 1 až 4 atomy uhlíku, zvláště terc.butylskupinu.

Ve sloučeninách obecného vzorce IB X představuje halogenalkylskupinu, halogenalkoxyskupinu nebo halogen-alkylthioskupinu, přednostně difluormethoxyskupinu a R^1 představuje atom halogenu nebo alkylskupinu nebo alkoxy-skupinu.

Ve sloučeninách obecného vzorce IC R^1 představuje alkylskupinu, alkoxy skupinu nebo alkylaminoskupinu a A má výše uvedený význam.

Jako příklady sloučenin podle vynálezu je možno uvést sloučeniny zvolené ze souboru zahrnujícího:

6-ethyl-2-(4'-trifluormethylfenyl)-4-(2''-trifluormethyl-pyrid-4''-yloxy)pyrimidin;

6-ethyl-2-(4'-trifluormethylfenyl)-4-[2''-(2,2,2-trifluor-ethyl)pyrid-4''-yloxy]pyrimidin;

6-methyl-2-(4'-trifluormethylfenyl)-4-(2''-difluormethoxy-pyrid-4''-yloxy)pyrimidin;

6-ethyl-2-(4'-trifluormethylfenyl)-4-(2''-difluormethoxy-pyrid-4''-yloxy)pyrimidin;

09.03.98

6-methoxymethyl-2-(4'-trifluormethylfenyl)-4-(2"-difluor-methoxypyrid-4"-yloxy)pyrimidin;

6-methoxymethyl-2-(4'-trifluormethylfenyl)-4-[2"-(2,2,2-tri-fluorethyl)pyrid-4"-yloxy]pyrimidin;

6-methyl-2-(4'-trifluormethylfenyl)-4-[2"-(1,1,2,2-tetra-fluorethyl)pyrid-4"-yloxy]pyrimidin;

5-methyl-2-(4'-trifluormethylfenyl)-4-[2"-(1,1,2,2-tetra-fluorethyl)pyrid-4"-yloxy]pyrimidin;

6-methyl-2-(4'-trifluormethylfenyl)-4-(2"-difluormethyl-thiopyrid-4"-yloxy)pyrimidin;

5-methyl-2-(4'-trifluormethylfenyl)-4-(2"-difluormethyl-thiopyrid-4"-yloxy)pyrimidin;

6-methoxy-2-(4'-trifluormethylfenyl)-4-(2"-difluormethyl-thiopyrid-4"-yloxy)pyrimidin;

4-ethyl-2-(4'-trifluormethylfenyl)-6-(1"-methyl-3-tri-fluormethylpyrazol-5-yloxy)pyridin;

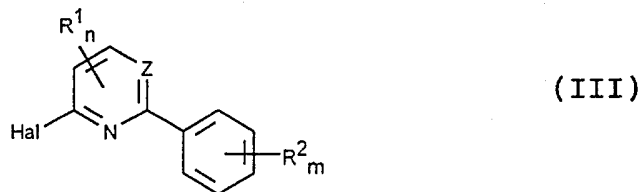
4-methyl-2-(4'-trifluormethylfenyl)-6-(2"-difluormethoxy-pyrid-4"-yloxy)pyridin;

4-methyl-2-(4'-trifluormethylfenyl)-6-(2"-trifluormethyl-pyrid-4"-yloxy)pyridin a

4-methyl-2-(4'-trifluormethylfenyl)-6-(3"-trifluormethyl-fenyloxy)pyridin.

Sloučeniny podle vynálezu je možno vyrábět obvyklými postupy.

Vhodným postupem výroby sloučenin obecného vzorce I je způsob, při němž se sloučenina obecného vzorce III



kde Z, R¹, R², m a n mají výše uvedený význam a Hal představuje atom halogenu;

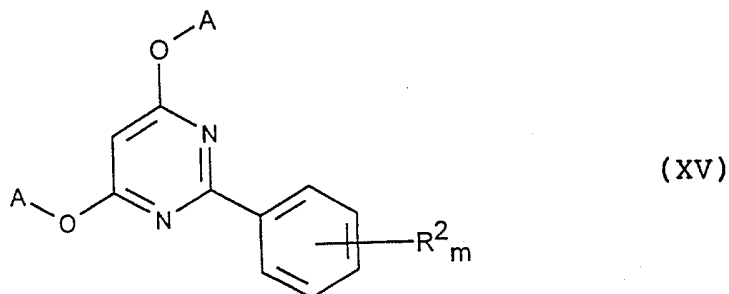
nechá reagovat se sloučeninou obecného vzorce IV



kde A a X mají výše uvedený význam a M představuje atom kovu.

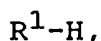
Atomem halogenu ve významu Hal může být kterýkoliv atom halogenu; s výhodou se použije atomu fluoru, chloru nebo bromu. Atomem kovu ve významu M může být kterýkoliv atom kovu, s výhodou se použije atomů alkalických kovů, přednostně sodíku a draslíku.

Alternativně je sloučeninu obecného vzorce XV



kde A, R² a m mají výše uvedený význam; možno nechat reagovat se sloučeninou obecného vzorce

09.03.98



přednostně za přítomnosti báze, pokud R^1 představuje popřípadě substituovanou alkoxy skupinu, alkoxyalkoxy skupinu, alkylthio skupinu, aminoskupinu, alkylaminoskupinu, dialkylaminoskupinu nebo alkoxyaminoskupinu, za vzniku sloučeniny obecného vzorce I.

Sloučeniny obecného vzorce I, kde R^1 představuje alkynylskupinu nebo alkenylskupinu, například allylového nebo propargylového typu, je možno vyrábět ze sloučenin obecného vzorce I, kde R^1 představuje atom halogenu, přednostně chloru nebo bromu, reakcí sloučeniny obecného vzorce



nebo jejího organokovového derivátu, přednostně za přítomnosti katalyzátoru na bázi přechodového kovu nebo báze.

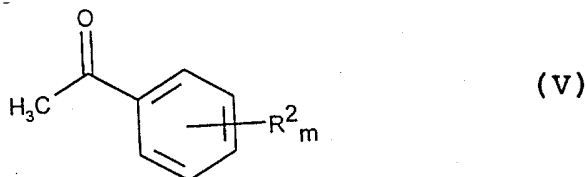
Sloučeniny obecného vzorce XV je možno vyrábět ze sloučenin obecného vzorce III, kde R^1 představuje Hal, Z představuje atom dusíku a Hal, R^2 a m mají výše uvedený význam, reakcí se sloučeninou obecného vzorce IV uvedeného výše, kde X představuje atom kyslíku, přičemž se použije asi 2 ekvivalentů sloučeniny obecného vzorce IV.

V praxi se tato reakce může provádět bez nebo za přítomnosti rozpouštědla, které povzbuzuje reakci nebo alespoň s reakcí neinterferuje. Přednost se dává polárním, aprotickým nebo protickým rozpouštědlům. Takovými vhodnými rozpouštědly jsou N,N-dimethylformamid, dimethylsulfoxid, sulfolan nebo ether, jako tetrahydrofuran nebo dioxan, alkoholy nebo voda a vzájemné směsi výše uvedených rozpouštědel. Reakce se provádí při teplotě okolí až teplotě

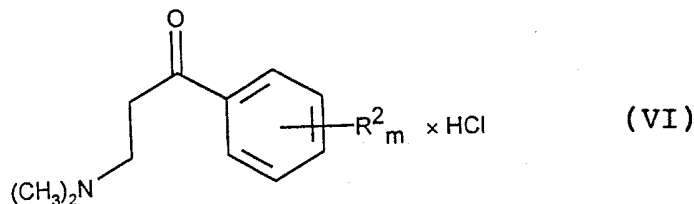
09.03.98

zpětného toku reakční směsi, přednostně při zvýšené teplotě, zejména při teplotě zpětného toku.

Sloučeniny obecného vzorce III, kde Z představuje skupinu C-H a n představuje číslo 0, je možno získat tak, že se sloučenina obecného vzorce V



kde R^2 a m mají výše uvedený význam, nechá reagovat s aldehydem, s výhodou formaldehydem, a dialkylaminem, s výhodou dimethylaminem, způsobem popsáným v Org. Synthesis Col. sv. III, 305f, v rozpouštědle, účelně alkoholu, přednostně ethanolu, za vzniku sloučeniny obecného vzorce VI

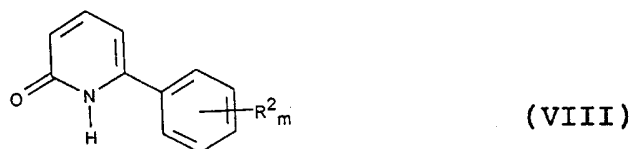


která se následně nechá reagovat za podmínek popsáných v DBP 21 47 288 (1971) s amonnou solí, s výhodou octanem amonným, a sloučeninou obecného vzorce VII



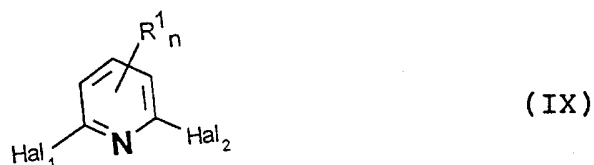
09.03.98

kde Y představuje alkoxykupinu nebo aminoskupinu, přednostně ethoxykupinu, v rozpouštědle, s výhodou v alkoholu, přednostně ethanolu, za vzniku sloučeniny obecného vzorce VIII



která se dále reakcí s fosforylhalogenidem (Müller, E., Chem. Ber. 32, 423 (1909); Katritzky et al., J. Chem. Soc., Perkin Trans. část 1, 1980, 2743 až 2754), přednostně fosforylbromidem nebo fosforylchloridem, při zvýšené teplotě, ideálně při teplotě zpětného toku, převede na sloučeninu obecného vzorce III.

Alternativní postup výroby sloučenin obecného vzorce III, kde Z představuje skupinu C-H, jemuž se dává přednost, zahrnuje reakci 2,6-dihalogenpyridinu obecného vzorce IX



kde R¹ a n mají výše uvedený význam a Hal₁ a Hal₂ představuje nezávisle vždy atom halogenu, s organokovovým derivátem benzeny obecného vzorce X



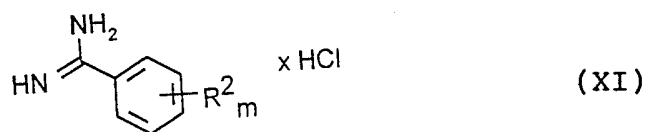
kde R² a m mají výše uvedený význam a M představuje atom alkalického kovu, boru, cínu, hořčíku, zinku nebo mědi, v

přibližně ekvimolárním poměru, za přítomnosti katalyzátoru na bázi přechodového kovu.

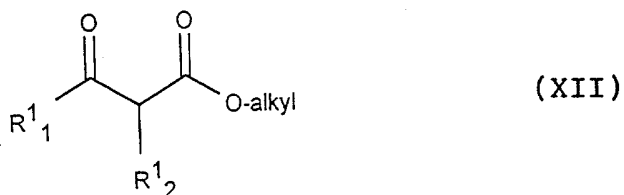
Alkalickým kovem může být jakýkoliv alkalický kov, přednostně lithium a reakci lze provádět v aprotickém polárním rozpouštědle, přednostně etherech, za vzniku sloučeniny obecného vzorce III, jak to popsali Cook a Wakefield, J. Chem. Soc., 1969, 2376, nebo v nepolárních rozpouštědlech nebo vodě, jak je to například popsáno v Ali, N. M. et al., Tetrahedron, 1992, 8117.

Sloučeniny obecného vzorce III, kde Z představuje skupinu CH, Hal představuje fluor, R^1 představuje vodík a R^2 a m mají výše uvedený význam, je možno dále převádět na sloučeniny obecného vzorce III, kde n představuje číslo 1, Z představuje skupinu CH, Hal představuje fluor, R^2 a m mají výše uvedený význam a R^1 je v poloze 3 a představuje methylthioskupinu (nebo jinou skupinu ze souboru uvedeného výše, která je schopna zavedení ve formě elektrofilního činidla), podobným postupem, jaký popsali Gungor, T., Marsais, F. a Queguiner, G., J. Organometallic Chem., 1981, 139 až 150.

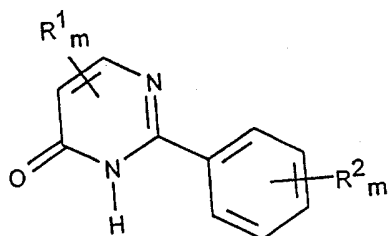
Způsob výroby sloučeniny obecného vzorce III, kde Z představuje atom dusíku, zahrnuje reakci hydrochloridu benzamidinu obecného vzorce XI



kde R^2 a m mají výše uvedený význam, se sloučeninou obecného vzorce XII



nebo její solí, kde R^1_1 a R^1_2 má každý nezávisle výše uvedený význam a O-alkylskupinou je s výhodou methoxyskupina nebo ethoxyskupina, za vzniku pyrimidinonu obecného vzorce XIII



(XIII)

kde R^1 může také představovat hydroxyskupinu.

Sloučeniny obecného vzorce XI jsou známe nebo je lze připravit způsoby známými z dosavadního stavu techniky, které jsou například popsány v Tetrahedron, 33, 1675f (1979) a J. Org. Chem., 26, 412f (1960).

Reakci sloučeniny obecného vzorce XI a XII je možno provádět podle Liebigs Ann. 1980, 1392f v organickém rozpouštědle, s výhodou alkoholu, přednostně ethanolu, a za přítomnosti báze, s výhodou alkoxidu kovu, přednostně ethoxidu sodného.

Sloučeniny obecného vzorce XIII je možno následně převádět na sloučeniny obecného vzorce III v podstatě způsobem popsaným v Davies a Pigott, J. Chem. Soc., 1945, 347, reakcí s fosforylhalogenidem, thionylhalogenidem nebo fosgenem, přednostně fosforylchloridem nebo fosforylbromidem, nejvýhodněji za nepřítomnosti rozpouštědla, při zvýšené teplotě, za vzniku sloučenin obecného vzorce III.

Sloučeniny obecného vzorce III, jak jsou definovány výše, kde R^1 představuje fluor, je možno získat ze sloučenin obecného vzorce III, kde R^1 představuje chlor nebo aminoskupinu, způsobem známým v tomto oboru, jak ho popsali

Tullock C. W. et al., J. Am. Chem. Soc. 1960, 5197 nebo
Kiburis J. a Klister J., J. Chem. Soc. Chem. Com. 1969, 381.

Sloučeniny obecného vzorce IV jsou známe nebo je
možno je vyrábět známými postupy. Tyto sloučeniny lze při-
pravovat a izolovat odděleně nebo in situ. Obecně je možno
způsob výroby těchto sloučenin popsat takto: sloučenina
obecného vzorce XIV

A-XH

(XIV)

kde A a X mají výše uvedený význam, se nechá reagovat s
vhodnou kovovou bází, například uhličitanem nebo hydridem
kovu. Přednostní soli kovu je sůl sodíku nebo draslíku.

Sloučeniny obecného vzorce I je možno - je-li to
žádoucí - izolovat a čistit konvenčními postupy.

Předmětem vynálezu je také použití sloučenin
obecného vzorce I jako herbicidů. Dále je předmětem vynálezu
způsob potlačování růstu nežádoucích rostlin, jehož podstata
spočívá v tom, že se na místo, na němž má být růstu
zamezeno, aplikuje sloučenina obecného vzorce I nebo
prostředek na její bázi. Tyto prostředky a sloučeniny podle
vynálezu se s výhodou aplikují ve formě postřiku na list,
nejvýhodněji na nežádoucí rostliny v oblasti růstu plodin.
Jako příklady plodin je možno uvést obiloviny, kukuřici,
soju, slunečnici a bavlnu. Kromě toho je sloučeniny, které
mají preemergentní herbicidní účinnost, možno aplikovat také
na půdu. Při způsobu potlačování růstu nežádoucích rostlin
podle vynálezu se účinná přísada, může například dávkovat
v množství v rozmezí od 0,01 do 10 kg/ha, přednostně od
0,05 do 1 kg/ha.

09.03.98

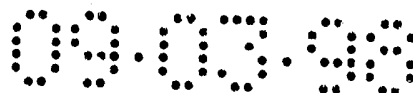
Dále je předmětem vynálezu také způsob výroby herbicidních prostředků, jehož podstata spočívá v tom, že se sloučenina obecného vzorce I smísí s alespoň jedním nosičem.

Přednostně obsahuje prostředek alespoň dva nosiče, z nichž alespoň jedním je povrchově aktivní látka.

Jako nosiče se v prostředcích podle vynálezu může používat jakékoliv látky, s níž je možno účinnou přísadu mísit za účelem usnadnění aplikace na ošetřované místo (kterým může být například rostlina, osivo nebo půda) nebo usnadnění skladování, dopravy nebo manipulace. Nosič může být pevný nebo kapalný, a může se také použít látek, které jsou za normálních podmínek plynné, ale které ve stlačeném stavu tvoří kapalinu. Obecně se může používat všech nosičů, kterých se používá při sestavování obvyklých herbicidních prostředků. Přednostní prostředky podle vynálezu obsahují 0,5 až 95 % hmotnostních účinné přísady.

Jako vhodné pevné nosiče je možno uvést přírodní a syntetické hlinky a silikáty, například oxid křemičitý přírodního původu, jako je například infusoriová hlinka; křemičitany hořečnaté, jako je například mastek; křemičitany hořečnatohlinité, jako je například attapulgit a vermikulit; křemičitany hlinité, jako je například kaolinit, montmorillonit a slída; uhličitan vápenatý; síran vápenatý; síran amonný; syntetické hydratované oxidy křemíku a syntetické křemičitany vápenaté nebo hlinité; prvky, jako je například uhlík a síra; přírodní a syntetické pryskyřice, například kumaronové pryskyřice, polyvinylchlorid a polymery a kopolymery styrenu; pevné polychlorfenoly; bitumen; vosky; a pevná hnojiva, například superfosfát.

Jako vhodné kapalné nosiče je možno uvést vodu; alkoholy, například isopropylalkohol a glykoly; ketony,



například aceton, methylethylketon, methylisobutylketon a cyklohexanon; ethery; aromatické nebo aralifatické uhlovodíky, například benzen, toluen a xylen; ropné frakce, například petrolej a lehké minerální oleje; chlorované uhlovodíky, například tetrachlormethan, perchlorethylen a trichlorethan. Často jsou vhodné také směsi různých kapalných nosičů.

Zemědělské prostředky se často vyrábějí a dopravují v koncentrované formě, z níž se finální prostředek vyrábí ředěním, což provádí uživatel před aplikací. Proces ředění usnadňuje přítomnost malých množství povrchově aktivních látek, které se rovněž rozumějí pod pojmem nosič. Alespoň jedním nosičem v prostředku podle vynálezu je tedy přednostně povrchově aktivní činidlo. Prostředek podle vynálezu může například obsahovat alespoň dva nosiče, přičemž alespoň jedním z nich je povrchově aktivní činidlo.

Jako povrchově aktivní činidla přicházejí v úvahu emulgátory, dispergátory nebo smáčedla a může se jednat o neiontové nebo iontové látky. Jako příklady vhodných povrchově aktivních činidel je možno uvést sodné nebo vápenaté soli polyakrylové kyseliny a ligninsulfonové kyseliny; kondenzační produkty mastných kyselin nebo alifatických aminů nebo amidů obsahujících alespoň 12 atomů uhlíku v molekule s ethylenoxidem a/nebo propylenoxidem; estery mastných kyselin s glycerolem, sorbitolem, sacharosou nebo pentaerythritolem; kondenzáty těchto látek s ethylenoxidem a/nebo propylenoxidem; kondenzační produkty mastných alkoholů nebo alkylfenolů, například p-oktylfenolu nebo p-oktylkresolu, s ethylenoxidem a/nebo propylenoxidem; sulfáty nebo sulfonáty těchto kondenzačních produktů; soli alkalických kovů nebo kovů alkalických zemin, přednostně sodné soli esterů kyseliny sírové nebo sulfonových kyselin obsahujících přinejmenším 10 atomů uhlíku v molekule, jako je například



laurylsulfát sodný, sekundární alkylsulfáty sodné, sodná sůl sulfonovaného ricinového oleje a sodné soli alkylarylsulfonových kyselin, jako je dodecylbenzensulfonát sodný; a polymery ethylenoxidu nebo kopolymery ethylenoxidu s propylenoxidem.

Herbicidní prostředky podle vynálezu mohou také obsahovat jiné přísady, například jiné sloučeniny s insekticidními nebo fungicidními vlastnostmi nebo jiné herbicidy.

Prostředek, který obsahuje sloučeninu podle vynálezu může sestávat ze 100 g účinné přísady (sloučeniny obecného vzorce I), 30 g dispergačního činidla, 3 g protipěnového činidla, 2 g činidla pro ovlivnění struktury, 50 g nemzrnoucí přísady, 0,5 g biocidního činidla a vody do 1000 ml. Takový prostředek se před použitím ředí vodou, aby se dosáhlo požadované koncentrace účinné přísady.

Vynález je blíže objasněn v následujících příkladech provedení. Tyto příklady mají výhradně ilustrativní charakter a rozsah vynálezu v žádném ohledu neomezují. Struktura sloučenin vyrobených podle následujících příkladů byla potvrzena NMR a hmotnostní spektrometrií.

Příklady provedení vynálezu

P ř í k l a d 1

Hydrochlorid β -dimethylaminopropiofenonu

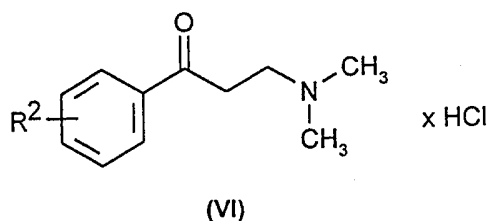
Acetofenon (29,1 ml, 0,25 mol), paraformaldehyd (12,0 g, 0,40 mol) a hydrochlorid dimethylaminu (28,5 g, 0,35 mol) se suspendují v ethanolu (50 ml). Ke vzniklé suspenzi se přidá koncentrovaná kyselina chlorovodíková

(0,5 ml). Reakční směs se 4 hodiny zahřívá ke zpětnému toku a poté se k ní přidá aceton (200 ml). Výsledný čirý roztok se nechá zchladnout na teplotu okolí. Vyloučená sraženina se shromáždí filtrací a překrystaluje z ethanolu. Získá se sloučenina uvedená v nadpisu (40,7 g, 76,0 % teoretického výtěžku) ve formě bezbarvých krystalů o teplotě tání 158°C.

P ř í k l a d y 2 a ž 4

Způsobem popsaným v příkladu 1 se vyrobí další sloučeniny obecného vzorce VI. Bližší údaje jsou uvedeny v následující tabulce I.

T a b u l k a I



Př. č.	R ²	Teplota tání (°C)	Výtěžek (%)
2	3-trifluormethyl	157	63
3	2,4-dichlor	136	51
4	2,4-dimethyl	134	72

P ř í k l a d 5

6-Fenyl-2-pyridon

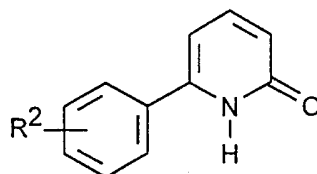
Ethyl-2-chloracetát (10,6 ml, 0,1 mol) se pomalu přidá k horkému (105°C) pyridinu (8,9 ml, 0,11 mol), přičemž se teplota udržuje v rozmezí od 100 do 110°C. Výsledný hnědý

olej se rozpustí v ethanolu (60 ml) a k ethanolickému roztoku se přidá hydrochlorid β -dimethylaminopropiofenonu (17,7 g, 0,1 mol, připravený způsobem popsáným v příkladu 1) a octan amonný (60 g). Reakční směs se 4 hodiny zahřívá ke zpětnému toku, ochladí a prefiltruje. Z filtrátu se za sníženého tlaku odpaří rozpouštědlo. Zbytek se nechá vykristalovat z vody, shromáždí filtrací a přečistí překrystalováním z toluenu. Získá se sloučenina uvedená v nadpisu ve formě bezbarvých krystalů (4,7 g, 28 % teorie) o teplotě tání 200°C.

P ř í k l a d y 6 a ž 8

Způsobem popsáným v příkladu 5 se připraví další sloučeniny. Bližší údaje jsou uvedeny v tabulce II.

T a b u l k a I I



(VIII)

Př. č.	R ²	Teplota tání (°C)	Výtěžek (%)
6	3-trifluormethyl	174	36
7	2,4-dichlor	255	56
8	2,4-dimethyl	209	23

P ř í k l a d 9

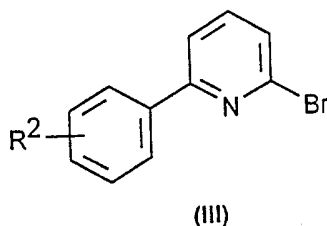
2-Brom-6-fenylpyridin

Směs 6-fenylpyridonu (3 g, 17,5 mmol, připraveného způsobem popsaným v příkladu 6) a fosforylbromidu (7,2 g, 25,0 mmol) se 5 hodin zahřívá na 100°C, ochladí a nalije do vody (40 ml). pH vodné směsi se přidavkem nasyceného vodného uhličitanu sodného nastaví na 9. Vrstvy se oddělí a vodná vrstva se extrahuje ethylacetátem (50 ml). Spojené organické vrstvy se vysuší bezvodým síranem hořečnatým a za sníženého tlaku se odpaří rozpouštědlo. Surový produkt se překrystaluje z vodného ethanolu a následně přečistí mžikovou chromatografií na silikagelu za použití směsi hexanu a ethylacetátu v poměru 9 : 1 (objemově), jako elučního činidla. Získá se 2-brom-6-fenylpyridin (3,1 g, 76 % teorie) ve formě světle hnědých krystalů o teplotě tání 50°C.

P ř í k l a d y 1 0 a ž 1 2

Způsobem popsaným v příkladu 9 se vyrobí další sloučeniny, které odpovídají obecnému vzorci III. Bližší údaje jsou uvedeny v tabulce III.

T a b u l k a I I I



Př. č.	R ²	Teplota tání (°C)	Výtěžek (%)
10	3-trifluormethyl	olej	82
11	2,4-dichlor	123	88
12	2,4-dimethyl	olej	68

P ř í k l a d 1 3

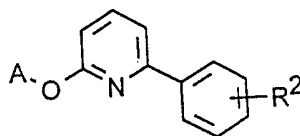
2-(1'-Methyl-3'-trifluormethylpyrazol-5'-yloxy)-6-fenyl-
pyridin

Směs 2-brom-6-fenylpyridinu (0,5 g, 2,1 mmol, vyrobeného způsobem popsáným v příkladu 9), 1-methyl-3-fluor-methyl-5-hydroxypyrazolu (0,65 g, 3,9 mmol), uhličitanu draselného (0,6 g, 4,3 mmol) a N,N-dimethylformamidu (2 ml) se 12 hodin zahřívá ke zpětnému toku. Poté se reakční směs přímo nanese na sloupec pro mžikovou chromatografii (silika-gel). Eluce se provádí směsí hexanu a ethylacetátu v poměru 9 : 1 (objemově). Získá se sloučenina uvedená v nadpisu (0,35 g, 52,0 % teorie) ve formě světle žlutého oleje.

P ř í k l a d y 1 4 a ž 1 6

Podobným postupem, jaký je popsán v příkladu 13, se vyrobí sloučeniny uvedené v tabulce IV.

T a b u l k a I V



Př. č.	A	R ²	teplota tání (°C)	výtěžek (%)
14	1'-CH ₃ -3'-CF ₃ - pyrazol-5'-yl	3''-CF ₃	113	93
15	1'-CH ₃ -3'-CF ₃ - pyrazol-5'-yl	2'',4''-dichlor	91	78
16	1'-CH ₃ -3'-CF ₃ - pyrazol-5'-yl	2'',4''-dimethyl	olej	95

P ř í k l a d 1 7

2-Fluor-6-(4'-fluorfenyl)pyridin

Butyllithium (105,0 ml, 0,26 mol, 2,5M roztok v hexanu) se při -20°C přidá k roztoku 1-brom-4-fluorbenzenu (34,3 ml, 0,31 mol) v bezvodém diethyletheru (200 ml). Vzniklá směs se 60 minut míchá, poté ochladí na -40°C a přidá se k ní 2,6-difluorpyridin (22,7 ml, 0,25 mol). Reakční směs se nechá zahřát na teplotu okolí a poté promyje nasyceným vodným chloridem amonným (300 ml). Vrstvy se oddělí a vodná vrstva se promyje třikrát diethyletherem (vždy 100 ml). Spojené organické vrstvy se vysuší bezvodým síranem hořečnatým a z filtrátu se za sníženého tlaku odstraní rozpouštědlo. Surový produkt se přečistí mžikovou chromatografií na sloupci silikagelu za použití směsi hexanu a ethylacetátu v poměru 8 : 2, jako elučního činidla. Získá se 2-fluor-6-(4'-fluorfenyl)pyridin (19,8 g, 41,0 % teorie) ve formě bezbarvých krystalů o teplotě tání 34°C.

P ř í k l a d 1 8

2-Fluor-6-(4'-fluorfenyl)-4-methylpyridin

Směs 2-brom-6-fluor-4-methylpyridinu (9,5 g, 50 mmol), 4-fluorbenzenboronové kyseliny (7,8 g, 56 mmol), hydrogenuhličitanu sodného (12,6 g, 150 mmol), vody (200 ml) a katalytického množství tetrakis(trifenylfosfin)palladia(0) v DME se pod atmosférou dusíku přes noc zahřívá ke zpětnému toku. Reakční směs se prefiltruje a z filtrátu se za sníženého tlaku odstraní rozpouštědla. Zbytek se rozdělí mezi vodu a ethylacetát. Vrstvy se oddělí a vodná vrstva se promyje ethylacetátem. Spojené organické vrstvy se vysuší bezvodým síranem hořečnatým a za sníženého tlaku se z nich odpaří rozpouštědlo. Surový produkt se přečistí mžikovou

09.03.98

chromatografií na sloupci silikagelu za použití směsi pentanu a ethylacetátu v poměru 9 : 1, jako elučního činidla. Získá se 2-fluor-6-(4'-fluorfenyl)-4-methylpyridin (3,7 g, 36,1 % teorie) ve formě bezbarvých krystalů o teplotě tání 49°C.

P ř í k l a d 1 9

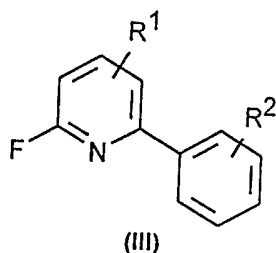
2-Fluor-6-(4'-trifluorfenyl)-3-methylthiopyridin

K roztoku 2-fluor-6-(4'-trifluorfenyl)pyridinu (2,4 g, 10 mmol, připraveného způsobem popsáným v příkladu 17) v suchém tetrahydrofuranu (35 ml) se při -70°C přikape roztok 2M lithiundiisopropylamidu v tetrahydrofuranu (7,5 ml, 15 mmol). Po 2 hodinách při -70°C se ke vzniklé směsi přidá dimethyldisulfid (1,41 g, 15 mmol). Reakční směs se nechá zahřát na -20°C, hydrolyzuje a extrahuje diethyletherem. Organická vrstva se oddělí, vysuší bezvodým síranem hořečnatým a odstraní se z ní rozpouštědla. Surový produkt se přečistí mžikovou chromatografií na silikagelu za použití směsi hexanu a ethylacetátu v poměru 20 : 1 (objemově), jako elučního činidla. Získá se sloučenina uvedená v nadpisu (1,2 g, 42 %) o teplotě tání 70 až 73°C.

P ř í k l a d y 2 0 a ž 2 3

Podobným způsobem, jaký je popsán v příkladu 17, se vyrobí sloučeniny, které odpovídají obecnému vzorci III, uvedené v tabulce V.

T a b u l k a V



Př. č.	R ¹	R ²	teplota tání (°C)	výtěžek (%)
20	-	-	olej	47
21	-	4'-trifluormethyl	58	75
22	-	3'-trifluormethyl	olej	72
23	-	3,4-difluor	olej	24

P ř í k l a d 2 4

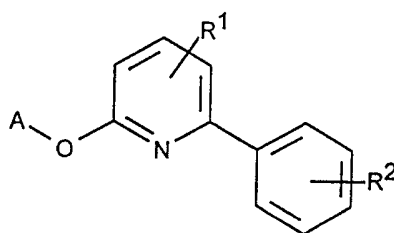
2-(3'-Chlorpyrid-5'-yloxy)-6-(4"-fluorfenyloxy)pyridin

Směs 2-fluor-6-(4'-fluorfenyl)pyridinu (1,9 g, 10,0 mmol, připraveného způsobem popsáním v příkladu 17), 3-chlor-5-hydroxypyridinu (1,4 g, 11,0 mmol) a uhličitanu draselného (1,5 g, 11,0 mmol) v sulfolanu (10 ml) se 8 hodin zahřívá ke zpětnému toku, nechá zchladnout na teplotu okolí a prefiltruje přes vrstvu silikagelu, která se následně promyje ethylacetátem. Organické roztoky se spojí a za sníženého tlaku se z nich odpaří rozpouštědlo. Zbytek se umístí do horní části kolony pro mžikovou chromatografii s náplní silikagelu a eluuje směsí hexanu a ethylacetátu v poměru 8 : 2 (objemově). Získá se 2-(3'-chlorpyrid-5'-yloxy)-6-(4"- fluorfenyloxy)pyridin (1,4 g, 46 % teorie) ve formě světle hnědých krystalů o teplotě tání 139°C.

P ř í k l a d y 2 5 a ž 4 3

Podobným způsobem, jaký je popsán v příkladu 24, se vyrobí další sloučeniny. Bližší údaje jsou uvedeny v tabulce VI.

T a b u l k a V I



Př. č.	R ¹	A	R ²	teplota tání (°C)	výtěžek (%)
25	-	3'-CF ₃ -fenyl	4"-fluor	olej	48
26	-	2'-chlorpyrid-4'-yl	4"-fluor	137	37
27	-	2'-chlorpyrid-4'-yl	-	109	35
28	-	2'-chlorpyrid-4'-yl	4"-trifluormethyl	105	51
29	-	1'-CH ₃ -3'-CF ₃ -pyra-zol-5'-yl	4"-fluor	87	44
30	-	1'-CH ₃ -3'-CF ₃ -pyra-zol-5'-yl	4"-trifluormethyl	94	59
31	-	1'-CH ₃ -3'-CF ₃ -pyra-zol-5'-yl	3"-trifluormethyl	112	44
32	-	2'-chlorpyrid-4'-yl	3"-trifluormethyl	92	54
33	-	2',4'-difluorfenyl	3"-trifluormethyl	olej	72
34	-	3'-CF ₃ -fenyl	4"-trifluormethyl	olej	44
35	4-CH ₃	1'-CH ₃ -3'-CF ₃ -pyra-zol-5'-yl	4"-fluor	85	43
36	4-CH ₃	2'-chlorpyrid-4'-yl	4"-fluor	115	35
37	3-CH ₃ S	3'-CF ₃ -fenyl	4"-trifluormethyl	133-136	67

38	3-CH ₃ S	1'-CH ₃ -3'-CF ₃ -pyra- zol-5'-yl	4"-trifluormethyl	154-156	41
39		1'-CH ₃ -3'-CF ₃ -pyra- zol-5'-yl	3",4"-difluor	olej	29

P ř í k l a d 4 0

Hydrochlorid 4-fluorbenzamidinu

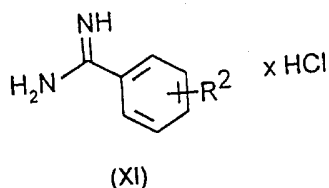
4-Fluorbenzonitril (10 g, 83 mmol) se rozpustí ve směsi bezvodého ethanolu (5 ml) a diethyletheru (70 ml). Reakční směs se za chlazení v ledové lázni během 90 minut nasytí plynným chlorovodíkem, nechá zahřát na teplotu okolí a přes noc míchá.

Bezbarvá sraženina se odfiltruje, promyje diethyletherem a rozpustí v bezvodém ethanolu (20 ml). K ethanolicnému roztoku se přidá nasycený roztok plynného amoniaku v diethyletheru (100 ml). Reakční roztok se 3 hodiny míchá. Výsledná suspenze se přefiltruje a z filtrátu se za sníženého tlaku odstraní rozpouštědlo. Zbytek se promyje diisopropyletherem a vysuší. Získají se bezbarvé krystaly (5,15 g, 35,5 %) o teplotě tání 210°C.

P ř í k l a d y 4 1 a ž 5 0

Podobným postupem, jaký je popsán v příkladu 40, se připraví další sloučeniny, které odpovídají obecnému vzorci XI. Bližší údaje jsou uvedeny v tabulce VII.

T a b u l k a V I I



Př. č.	R ²	Teplota tání (°C)	Výtěžek (%)
41	4-trifluormethyl	167	21,4
42	3-methyl	243	29,7
43	3-chlor	148	17,5
44	3,4-difluor	185	17,4
45	3-trifluormethyl	181	17,6
46	3-fluor	143	20,0
47	4-brom	245	39
48	4-chlor	>250	85
49	4-terc.butyl	153	92
50	4-trifluormethoxy	210	57

P ř í k l a d 5 1

2-(4'-Fluorfenyl)-5-methyl-4-pyrimidinon

Natriumhydrid (0,52 g, 13 mmol) se přidá k 20 ml bezvodého ethanolu. Vzniklá směs se 30 minut míchá při teplotě okolí a přidá se k ní hydrochlorid 4-fluorbenzamidinu (1,47 g, 8,5 mmol, z příkladu 40). Výsledná směs se míchá dalších 30 minut a poté se k ní přikape methyl-2-formylpropionát (1 g, 10,6 mmol). Reakční směs se 4 dny míchá při teplotě okolí, ochladí a za sníženého tlaku se z ní odstraní rozpouštědlo. Zbytek se rozpustí ve vodném hydroxidu sodném (10 ml, 1M). Poté se pH směsi 2M kyselinou chlorovodíkovou upraví na 5. Vyloučená sraženina se

odfiltruje, promyje diisopropyletherem a vysuší. Získají se bezbarvé krystaly (0,44 g, 10,3 %) o teplotě tání nad 250°C.

P ř í k l a d 5 2

6-Hydroxy-2-(4'-trifluormethylfenyl)-4-pyrimidinon

Hydrochlorid 4-trifluormethylbenzamidinu (22,4 g, 0,1 mol, z příkladu 41) se přidá k roztoku methoxidu draselného (0,22 mol) v bezvodém methanolu (65 ml). Vzniklá směs se 15 minut míchá při teplotě okolí a přidá se k ní dimethylmalonát (12,6 ml, 0,11 mol). Reakční směs se 4 hodiny zahřívá ke zpětnému toku, ochladí a výsledná suspenze se zředí methanolem (50 ml). Rozpouštědlo se odstraní za sníženého tlaku a zbytek se rozpustí ve vodě (50 ml). pH vodné směsi se koncentrovanou kyselinou chlorovodíkovou upraví na 1. Vyloučená sraženina se odfiltruje, promyje vodou a vysuší. Získají se bledě žluté krystaly (15,1 g, 59 %) o teplotě tání nad 200°C.

P ř í k l a d 5 3

5-Methoxy-2-(4'-trifluormethylfenyl)-4-pyrimidinon

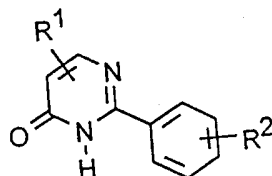
K suspenzi natriumhydridu (60%, 6 g, 0,15 mol) v suchém tetrahydrofuranu (225 ml) se během 30 minut přidá roztok methylmethoxyacetátu (14,9 ml, 0,15 mol) v methylformiátu (11,1 ml, 0,18 mol). Reakční směs se 2 hodiny míchá při teplotě okolí a přidá se k ní diethylether (300 ml). Odsátím je možno izolovat sodnou sůl monoaldehydu methylmetoxymalonátu. Tato sodná sůl (0,075 mol) se přidá k hydrochloridu 4-trifluormethylbenzamidinu (16,8 g, 0,075 mol, z příkladu 41) v suchém ethanolu (150 ml). Vzniklá směs se 48 hodin míchá při teplotě okolí, 1 hodinu zahřívá ke zpětnému toku a poté se k ní přidá voda (100 ml). Vodný

roztok se přefiltruje, pH filtrátu se kyselinou octovou upraví na 5 a za sníženého tlaku se z něj odstraní ethanol. Sraženina se odfiltruje, promyje ethanolem a vysuší. Získají se krystaly (13,7 g, 68 %) o teplotě tání nad 200°C.

P ř í k l a d y 5 4 a ž 7 8

Způsobem popsaným v příkladu 53 se vyrobí další sloučeniny, které odpovídají obecnému vzorci III. Podrobnější informace jsou uvedeny v tabulce VIII.

T a b u l k a V I I I



Př. č.	R ¹	R ²	teplota tání (°C)	výtěžek (%)
54	6-methyl	4'-fluor	267	56,8
55	5-methyl	4'-trifluormethyl	>250	58,7
56	6-methyl	4'-trifluormethyl	209	82,2
57	5-methyl	3'-methyl	169	34,3
58	6-methyl	3'-methyl	185	41,6
59	5-methyl	3'-chlor	260	61,4
60	6-methyl	3'-chlor	218	51
61	5-methyl	3',4'-difluor	>250	59,4
62	6-methyl	3',4'-difluor	225	51,3
63	5-methyl	3'-trifluormethyl	204	39,8
64	6-methyl	3'-trifluormethyl	109	26,6
65	5,6-dimethyl	3'-trifluormethyl	215	70,4
66	5,6-dimethyl	4'-trifluormethyl	242	63,5
67	5-methyl	4'-chlor	>250	27,2

68	6-methyl	4'-chlor	227	6,8
69	5-methyl	3'-fluor	238	56
70	6-methyl	3'-fluor	194	48,4
71	6-ethyl	4'-trifluormethyl	181	87
72	5-methyl	4'-brom	>250	20
73	6-methyl	4'-brom	245	39
74	5-methyl	4'-terc.butyl	218	81
75	6-methyl	4'-terc.butyl	213	75
76	5,6-dimethyl	4'-chlor	276	44
77	5,6-dimethyl	4'-trifluormethoxy	228	70
78	6-methyl	4'-trifluormethoxy	196	95

P ř í k l a d 79

2-(4'-Fluorfenyl)-4-chlor-5-methylpyrimidin

Směs 2-(4'-fluorfenyl)-5-methyl-4-pirimidinonu (0,79 g, 3,9 mmol, z příkladu 55) a oxychloridu fosforečného (3 ml) se 1 hodinu zahřívá ke zpětnému toku. Převážná část nadbytečného oxychloridu fosforečného se odstraní za sníženého tlaku a zbytek se rozloží vodou (10 ml), čímž se hydrolyzuje zbývající reakční činidlo. Výsledná směs se neutralizuje a extrahuje ethylacetátem (50 ml). Organická vrstva se vysuší bezvodým síranem hořečnatým a za sníženého tlaku se z ní odstraní rozpouštědlo. Získá se sloučenina uvedená v nadpisu (0,63 g, 72,6 %) ve formě bezbarvých krystalů o teplotě tání 133°C.

P ř í k l a d 80

2-(4'-Chlorfenyl)-4,5-dichlor-6-methoxypyrimidin

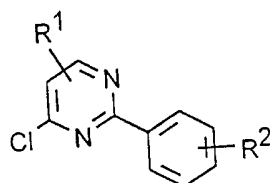
K roztoku 2-(4'-chlorfenyl)-4,5,6-trichlorpyrimidinu (1,85 g, 6,3 mmol) v methanolu (30 ml) a tetrahydro-

furanu (60 ml) se přidá roztok sodíku (0,145 g, 6,3 mmol) v methanolu (10 ml). Reakční směs se přes noc míchá při teplotě okolí a za sníženého tlaku se z ní odstraní rozpouštědla. Ke zbytku se přidá dichlormethan a vzniklá směs se promyje vodou. Organická vrstva se vysuší bezvodým síranem hořečnatým a odstraní se z ní rozpouštědlo. Zbytek se zpracuje pentanem. Získá se sloučenina uvedená v nadpisu (1,75 g, 96 %) ve formě bezbarvých krystalů o teplotě tání 157 až 159°C.

P ř í k l a d y 81 a ž 108

Sloučeniny, které odpovídají obecnému vzorci III, uvedené v tabulce IX se vyrobí způsobem popsaným v příkladu 83.

T a b u l k a I X



Př. č.	R ¹	R ²	teplota tání (°C)	výtěžek (%)
81	6-methyl	4'-fluor	143	97
82	6-methyl	4'-trifluormethyl	62	71,8
83	5-methyl	4'-trifluormethyl	109	87,3
84	5-methyl	3'-methyl	154	98,8
85	6-methyl	3'-methyl	134	73,7
86	5-methyl	3'-chlor	87	94,1
87	6-methyl	3'-chlor	101	26,1
88	5-methyl	3',4'-difluor	114	92
89	6-methyl	3',4'-difluor	94	90,7

09.03.98

90	5,6-dimethyl	3'-trifluormethyl	83	81,6
91	5,6-dimethyl	4'-trifluormethyl	57	54,5
92	5-methyl	3'-trifluormethyl	101	81,4
93	6-methyl	3'-trifluormethyl	62	87,3
94	5-methyl	4'-chlor	162	85,2
95	6-methyl	4'-chlor	101	83,6
96	5-methyl	3'-fluor	95	83,7
97	6-methyl	3'-fluor	86	71,5
98	6-ethyl	4'-trifluormethyl	35	86
99	5-methyl	4'-brom	156-158	94
100	6-methyl	4'-brom	110-112	94
101	5-methyl	4'-terc.butyl	103-105	98
102	6-methyl	4'-terc.butyl	70-72	99
103	5,6-dimethyl	4'-chlor	87	71
104	5,6-dimethyl	4'-trifluormethoxy	76	81
105	5-methyl	4'-trifluormethoxy	129	91
106	6-methyl	4'-trifluormethoxy	64	94
107	6-chlor	4'-trifluormethyl	80	33
108	5-methoxy	4'-trifluormethyl	108	31

P ř í k l a d 1 0 9

2-(4'-Fluorfenyl)-4-(3"-trifluormethylfenoxy)-6-methyl-
pyrimidin

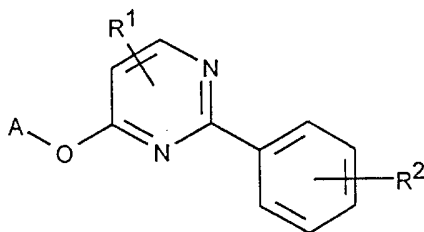
Směs 2-(4'-fluorfenyl)-4-chlor-6-methylpyridinu (0,6 g, 2,7 mmol) (z příkladu 85), α,α,α -3-hydroxybenzo-trifluoridu (0,49 g, 3 mmol) a uhličitanu draselného (0,41 g, 3 mmol) v N,N-dimethylformamidu (3 ml) se 2 hodiny zahřívá ke zpětnému toku, ochladí a přidá se k ní ethylacetát (10 ml). Výsledná suspenze se přefiltruje přes vrstvu silikagelu za použití ethylacetátu. Z filtrátu se za sníženého tlaku odstraní rozpouštědlo a zbytek se přečistí mžikovou chromatografií na sloupci silikagelu za použití

směsi hexanu a ethylacetátu v poměru 7 : 2, jako elučního činidla. Po odstranění rozpouštědla se získají bezbarvé krystaly (0,53 g, 56,4 %) o teplotě tání 58°C.

P ř í k l a d y 110 až 183

Způsobem popsaným v příkladu 109 se vyrobí další sloučeniny, které odpovídají obecnému vzorci I. Bližší údaje jsou uvedeny v tabulce X.

T a b u l k a X



(I)

Př. č.	R ¹	R ²	A	teplota tání (°C)	výtěžek (%)
110	5-methyl	4'-fluor	1"-CH ₃ -3"-CF ₃ -pyrazol-5"-yl	133	54,7
111	6-methyl	4'-fluor	1"-CH ₃ -3"-CF ₃ -pyrazol-5"-yl	123	21
112	6-methyl	4'-CF ₃	1"-CH ₃ -3"-CF ₃ -pyrazol-5"-yl	98	39,5
113	6-methyl	4'-CF ₃	3"-CF ₃ -fenyl	89	79,9
114	5-methyl	4'-CF ₃	1"-CH ₃ -3"-CF ₃ -pyrazol-5"-yl	147	27,6
115	5-methyl	4'-CF ₃	3"-CF ₃ -fenyl	95	97,6
116	5-methyl	3'-CH ₃	1"-CH ₃ -3"-CF ₃ -pyrazol-5"-yl	121	74,9
117	5-methyl	3'-CH ₃	3"-CF ₃ -fenyl	71	74,5

09.03.98

118	6-methyl	3'-CH ₃	1"-CH ₃ -3"-CF ₃ - pyrazol-5"-yl	113	74,9
119	6-methyl	3'-CH ₃	3"-CF ₃ -fenyl	60	73,2
120	5-methyl	3'-chlor	1"-CH ₃ -3"-CF ₃ - pyrazol-5"-yl	116	35,4
121	5-methyl	3'-chlor	3"-CF ₃ -fenyl	105	52,4
122	6-methyl	3'-chlor	1"-CH ₃ -3"-CF ₃ - pyrazol-5"-yl	96	27,1
123	5-methyl	2',4'-difluor	3"-CF ₃ -fenyl	68	40,4
124	5-methyl	2',4'-difluor	2"-chlorpyrid- 4"-yl	146	58,8
125	6-methyl	2',4'-difluor	1"-CH ₃ -3"-CF ₃ - pyrazol-5"-yl	78	56,4
126	6-methyl	2',4'-difluor	3"-CF ₃ -fenyl	64	65,3
127	6-methyl	2',4'-difluor	2"-chlorpyrid- 4"-yl	162	31,7
128	5-methyl	4'-CF ₃	2"-chlorpyrid- 4"-yl	99	44,1
129	5,6-dimethyl	4'-CF ₃	1"-CH ₃ -3"-CF ₃ - pyrazol-5"-yl	136	13,2
130	5,6-dimethyl	4'-CF ₃	3"-CF ₃ -fenyl	73	65,6
131	5,6-dimethyl	3'-CF ₃	1"-CH ₃ -3"-CF ₃ - pyrazol-5"-yl	132	30,3
132	5,6-dimethyl	3'-CF ₃	3"-CF ₃ -fenyl	105	67,5
133	6-methyl	4'-CF ₃	1"-CH ₃ -3"-CF ₃ - pyrazol-5"-yl	128	41
134	6-methyl	4'-CF ₃	2",2"-difluor- 1",3"-benzodioxol- 4"-yl	86	85
135	6-ethyl	4'-CF ₃	1"-CH ₃ -3"-CF ₃ - pyrazol-5"-yl	75	46
136	6-ethyl	4'-CF ₃	2"-chlorpyrid- 4"-yl	97	41
137	6-methyl	3'-CF ₃	4"-fluorfenyl	78	92
138	6-ethyl	4'-CF ₃	3"-CF ₃ -fenyl	65	38



139	5-methyl	3'-CF ₃	4"-fluorfenyl	109-111	86
140	5-methyl	4'-Br	3"-CF ₃ -fenyl	110	100
141	6-methyl	4'-Br	3"-CF ₃ -fenyl	86-88	89
142	5-methyl	4'-terc.butyl	1"-CH ₃ -3"-CF ₃ - pyrazol-5"-yl	149-151	92
143	6-methyl	4'-terc.butyl	1"-CH ₃ -3"-CF ₃ - pyrazol-5"-yl	119-121	78
144	5-methyl	4'-terc.butyl	3"-CF ₃ -fenyl	123-124	91
145	6-methyl	4'-terc.butyl	3"-CF ₃ -fenyl	olej	99
146	6-methyl	4'-Cl	3"-CF ₃ -fenyl	68	29
147	5,6-dimethyl	4'-Cl	1"-CH ₃ -3"-CF ₃ - pyrazol-5"-yl	142	49
148	5,6-dimethyl	4'-Cl	2"-chlorpyrid- 4"-yl	150	36
149	5,6-dimethyl	4'-Cl	3"-CF ₃ -fenyl	102	66
150	5-methyl		1"-CH ₃ -3"-CF ₃ - pyrazol-5"-yl	140-150	75
151	5,6-dimethyl	3'-F	1"-CH ₃ -3"-CF ₃ - pyrazol-5"-yl	117	70
152	5-methyl	4'-Cl	1"-CH ₃ -3"-CF ₃ - pyrazol-5"-yl	141	58
153	5-methyl	4'-Cl	2"-chlorpyrid- 4"-yl	125	31
154	5-methyl	4'-Cl	3"-CF ₃ -fenyl	101	52
155	6-methyl	4'-Cl	1"-CH ₃ -3"-CF ₃ - pyrazol-5"-yl	99	37
156	6-methyl	4'-Cl	2"-chlorpyrid- 4"-yl	151	8
157	5-methyl	3',4'-difluor	2"-chlorpyrid- 4"-yl	146	59
158	6-methyl	3',4'-difluor	1"-CH ₃ -3"-CF ₃ - pyrazol-5"-yl	78	56
159	6-methyl	3',4'-difluor	3"-CF ₃ -fenyl	64	65
160	6-methyl	3',4'-difluor	2"-chlorpyrid- 4"-yl	162	32



161	5-methyl	4'-CF ₃ O	1"-CH ₃ -3"-CF ₃ - pyrazol-5"-yl	117-121	58
162	6-methyl	4'-CF ₃ O	1"-CH ₃ -3"-CF ₃ - pyrazol-5"-yl	102-104	46
163	5-methyl	4'-CF ₃ O	1"-CH ₃ -3"-t-bu- pyrazol-5"-yl	96-98	58
164	6-methyl	4'-CF ₃ O	1"-CH ₃ -3"-t-bu- pyrazol-5"-yl	88-89	78
165	6-methyl	4'-CF ₃	1"-CH ₃ -3"-t-bu- pyrazol-5"-yl	87-90	83
166	6-methyl	4'-CF ₃ O	3"-CF ₃ -fenyl	52	73
167	6-methyl	4'-CF ₃ O	2"-chlorpyrid- 4"-yl	72	32
168	5-methyl	4'-CF ₃ O	3"-CF ₃ -fenyl	83	80
169	5-methyl	4'-CF ₃ O	2"-chlorpyrid- 4"-yl	82	43
170	5,6-dimethyl	4'-CF ₃ O	3"-CF ₃ -fenyl	75	66
171	5,6-dimethyl	4'-CF ₃ O	2"-chlorpyrid- 4"-yl	107	54
172	5-methyl	3',4'-difluor	3"-CF ₃ -fenyl	68	40
173	6-methyl	4'-CF ₃ O	1"-CH ₃ -3"-t-bu- pyrazol-5"-yl	116	43
174	5-methyl	4'-CF ₃ O	1"-CH ₃ -3"-t-bu- pyrazol-5"-yl	98	67
175	5,6-dimethyl	4'-CF ₃ O	1"-CH ₃ -3"-t-bu- pyrazol-5"-yl	128	45
176	6-methoxy- methyl	4'-Cl	2"-chlorpyrid- 4"-yl	89-91	100
177	6-methoxy- methyl	4'-Cl	1"-CH ₃ -3"-t-bu- pyrazol-5"-yl	113-115	94
178	6-methoxy- methyl	4'-Cl	3"-CF ₃ -fenyl	140-142	92
179	5-methoxy	4'-CF ₃	2"-chlorpyrid- 4"-yl	96	92
180	5-methoxy	4'-CF ₃	3"-CF ₃ -fenyl	80	95



181	5-chlor-6-methoxy	4'-Cl	1"-CH ₃ -3"-t-bu-pyrazol-5"-yl	173-176	95
182	5-chlor-6-methoxy	4'-Cl	3"-CF ₃ -fenyl	95-98	100
183	5-methoxy	4'-CF ₃	1"-CH ₃ -3"-t-bu-pyrazol-5"-yl	80	180

P ř í k l a d 1 8 4

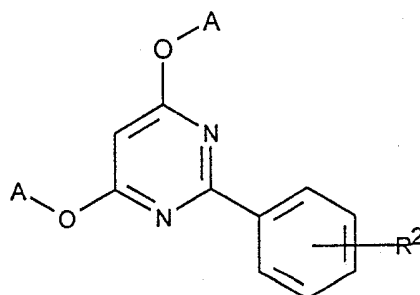
4,6-Bis(2"-chlorpyrid-4"-yloxy)-2-(4'-trifluormethylfenyl)-pyrimidin

Směs 4,6-dichlor-2-(4'-trifluormethylfenyl)pyrimidinu (2,93 g, 10 mmol, z příkladu 111), 2-chlor-4-hydroxypyridinu (2,85 g, 22 mmol) a uhličitanu draselného (3,04 g, 22 mmol) v bezvodém N,N-dimethylformamidu (20 ml) se 1 hodinu zahřívá na 80°C, ochladí a za sníženého tlaku se z ní odstraní rozpouštědlo. Ke zbytku se přidá směs ethylacetátu a hexanu v poměru 1 : 1 (10 ml). Vzniklá suspenze se přefiltruje přes vrstvu silikagelu. Filtrační roztok se promyje 3 x vodou. Organická vrstva se vysuší bezvodým síranem horečnatým a odstraní se z ní rozpouštědlo. Zbytek se přečistí mžikovou chromatografií na sloupci silikagelu za použití směsi hexanu a ethylacetátu v poměru 8 : 2, jako elučního činidla. Po odstranění rozpouštědla se získají bezbarvé krystaly (4,1 g, 86 %) o teplotě tání 141°C.

P ř í k l a d y 1 8 5 a ž 1 8 7

Sloučeniny, které odpovídají obecnému vzorci XVa, uvedené v tabulce XI se vyrobí podobným postupem, jaký je popsán v příkladu 184.

T a b u l k a X I



Př. č.	R ²	A	(XV a)	teplota tání (°C)	výtěžek (%)
185	4'-trifluor- methyl	1"-CH ₃ -3"-CF ₃ - pyrazol-5"-yl		168	86
186	4'-trifluor- methyl	3"-CF ₃ -fenyl		92	88
187	4'-chlor	1"-CH ₃ -3"-CF ₃ - pyrazol-5"-yl		156	93

P ř í k l a d 1 8 8

6-Methoxy-4-(2"-chlorpyrid-4"-yloxy)-2-(4'-trifluormethyl-
fenyl)pyrimidin

4,6-Bis(2"-chlorpyrid-4"-yloxy)-2-(4'-trifluor-
methylyfenyl)pyrimidin (2,0 g, 4,2 mmol, z příkladu 184) se
rozpustí v bezvodém methanolu (5 ml). Ke vzniklému roztoku
se přikape roztok methoxidu draselného (4,2 mmol) v metha-
nolu (1,2 ml). Reakční směs se 30 minut zahřívá ke zpětnému
toku a poté se z ní za sníženého tlaku odstraní rozpouštěd-
lo. Zbytek se přečistí mžikovou chromatografií na silikagelu
za použití směsi hexanu a ethylacetátu v poměru 9 : 1, jako
elučního činidla. Získají se bezbarvé krystaly (1,0 g, 62
%) o teplotě tání 128°C.

P ř í k l a d 1 8 9

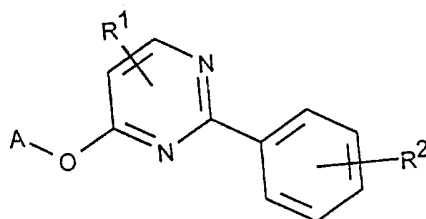
4,6-Dibrom-2-(4'-trifluormethylfenyl)pyrimidin

Směs 4,6-dihydroxy-2-(4'-trifluormethylfenyl)pyrimidinu (5,12 g, 20 mmol) a oxybromidu fosforečného (10 ml) se 3 hodiny zahřívá na 100°C. Výsledná horká suspenze se přidá k ledu a odsátím se izoluje produkt, který se vysuší. Získají se téměř bezbarvé krystaly (6,5 g, 86 %) o teplotě tání 87°C.

P ř í k l a d y 1 9 0 a ž 2 0 3

Způsobem popsaným v příkladu 188 nebo 109 se vyrobí další sloučeniny, které odpovídají obecnému vzorci I. Bližší údaje o těchto sloučeninách jsou uvedeny v tabulce XII.

T a b u l k a X I I



(I)

Př. č.	R ¹	R ²	A	teplota tání (°C)	výtěžek (%)
190	6-methoxy	4'-CF ₃	1"-CH ₃ -3"-CF ₃ -pyrazol-5"-yl	130	64
191	6-methoxy	4'-CF ₃	3"-CF ₃ -fenyl	94	94
192	6-methylthio	4'-CF ₃	1"-CH ₃ -3"-CF ₃ -pyrazol-5"-yl	127	55
193	6-methylthio	4'-CF ₃	2"-chlorpyrid-4"-yl	106	41



194	6-dimethyl- amino	4'-CF ₃	1"-CH ₃ -3"-CF ₃ - pyrazol-5"-yl	148	90
195	6-ethylamino	4'-CF ₃	1"-CH ₃ -3"-CF ₃ - pyrazol-5"-yl	102	23
196	6-methoxy	4'-Cl	1"-CH ₃ -3"-CF ₃ - pyrazol-5"-yl	144	80
197	6-methoxy- amino	4'-Cl	1"-CH ₃ -3"-CF ₃ - pyrazol-5"-yl	178	16
198	6-dimethyl- amino	4'-Cl	1"-CH ₃ -3"-CF ₃ - pyrazol-5"-yl	143	13
199	6-amino	4'-Cl	1"-CH ₃ -3"-CF ₃ - pyrazol-5"-yl	149	80
200	6-methyl- amino	4'-Cl	1"-CH ₃ -3"-CF ₃ - pyrazol-5"-yl	114	97
201	6-brom	4'-Cl	1"-CH ₃ -3"-CF ₃ - pyrazol-5"-yl	110	57
202	6-chlor	4'-Cl	1"-CH ₃ -3"-CF ₃ - pyrazol-5"-yl	122	26
203	6-chlor	4'-Cl	1"-CH ₃ -3"-CF ₃ - pyrazol-5"-yl	113	69

P ř í k l a d 2 0 4

6-Vinyl-4-(1"-methyl-3"-trifluormethylpyrazol-5"-yl)-2-(4'-trifluormethylfenyl)pyrimidin

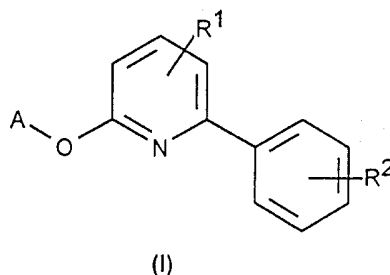
Směs 6-brom-4-(1"-methyl-3"-trifluormethylpyrazol-5"-yl)-2-(4'-trifluormethylfenyl)pyrimidinu (2 g, 4,3 mmol, z příkladu 201), vinyltributylstanátu (1,4 ml, 4,7 mmol), tetrakis(trifenylfosfin)palladia(0) (0,1 g, 0,09 mmol), toluenu (20 ml) a 3 krystalů 2,6-diterc.butyl-4-methylfenolu se 90 minut zahřívá ke zpětnému toku, ochladí a přidá se k ní 1,2M roztok pyridiniumfluoridu ve směsi tetrahydrofuranu a pyridinu (4 ml) a pyridin (2 ml). Vzniklý roztok se

míchá 17 hodin při teplotě okolí. K výsledné směsi se přidá ethylacetát (100 ml) a ethylacetátový roztok se promyje dvakrát vodou a nasyceným roztokem hydrogenuhličitanu sodného. Organická vrstva se vysuší bezvodým síranem hořečnatým, odstraní se z ní rozpouštědlo a zbytek se přečistí mžikovou chromatografií na silikagelu za použití směsi hexanu a ethylacetátu v poměru 7 : 3, jako elučního činidla. Po odstranění rozpouštědla se získají téměř bezbarvé krystaly (1,45 g, 82 %) o teplotě tání 112°C.

P ř í k l a d y 2 0 5 a ž 2 1 4

Podobným způsobem, jaký je popsán v příkladu 24, se vyrobí další sloučeniny. Bližší údaje o těchto sloučeninách jsou uvedeny v tabulce XIII A.

T a b u l k a X I I I A



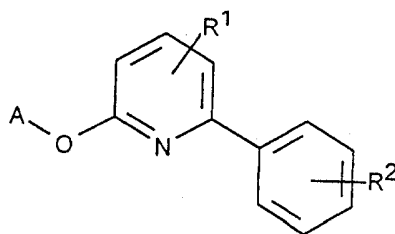
Př. č.	R ¹	A	R ²	teplota tání (°C)
205	3-ethyl	3'-CF ₃ -fenyl	4"-trifluormethyl	72-75
206	5-ethyl	3'-CF ₃ -fenyl	4"-trifluormethyl	44-46
207	4-methyl	1"-CH ₃ -3"-CF ₃ - pyrazol-5"-yl	4"-trifluormethyl	98
208	4-methyl	3'-CF ₃ -fenyl	4"-trifluormethyl	olej
209	4-methyl	1"-CH ₃ -3"-CF ₃ - pyrazol-5"-yl	3",5"-dichlor	117

210	4-methyl	1"-CH ₃ -3"-CF ₃ -pyrazol-5"-yl	3",5"-di(trifluoromethyl)	126
211	4-methyl	1"-CH ₃ -3"-CF ₃ -pyrazol-5"-yl	3"-chlor-4"-fluor	101
212	4-methyl	1"-CH ₃ -3"-CF ₃ -pyrazol-5"-yl	3",4"-dichlor	97
213	3-methyl	3'-CF ₃ -fenyl	4"-trifluormethyl	71-73
214	3-methyl	1"-CH ₃ -3"-CF ₃ -pyrazol-5"-yl	4"-trifluormethyl	130-133

P ř í k l a d y 2 1 5 a ž 2 2 1

Podobným způsobem, jaký je popsán v příkladu 188, se za použití 2,4-bisaryloxy-6-arylpyridinů, jako výchozích látek, vyrobí další sloučeniny. Bližší údaje o těchto sloučeninách jsou uvedeny v tabulce XIIIIB.

T a b u l k a X I I I B



(I)

Př. č.	R ¹	A	R ²	teplota tání (°C)
215	4-methoxy	1"-CH ₃ -3"-CF ₃ -pyrazol-5"-yl	4"-trifluormethyl	102
216	4-methoxy-amino	1"-CH ₃ -3"-CF ₃ -pyrazol-5"-yl	4"-trifluormethyl	168
217	4-methoxy	3'-CF ₃ -fenyl	4"-trifluormethyl	olej
218	4-C ₂ H ₅	1"-CH ₃ -3"-CF ₃ -	4"-trifluormethyl	61

09.03.98

		pyrazol-5"-yl	
219	4-CH ₃	2'-difluormethoxy- 4"-trifluormethyl	76-79
		pyrid-4'-yl	
220	4-CH ₃	2'-trifluormethyl- 4"-trifluormethyl	112-115
		pyrid-4'-yl	
221	4-C ₂ H ₅	2'-trifluormethyl- 4"-trifluormethyl	olej
		fenyl	

Požadované 2,4-bisaryloxy-6-arylpýridiny se získají podobným způsobem, jaký je explicitně popsán dále pro:

2,4-Bis-(1"-methyl-3"-trifluormethylpyrazol-5"-yloxy)-6-(4'-trifluormethylfenyl)pyridin

Směs 4-nitro-2,6-dichlorpyridinu (3,9 g, 20 mmol), 1-methyl-3-trifluormethyl-5-hydroxypyrazolu (7,3 g, 44 mmol) a uhličitanu draselného (6,7 g, 48 mmol) v bezvodém sulfolanu se přes noc zahřívá na 110°C, ochladí na teplotu okolí, zředí směsí pentanu a ethylacetátu (v poměru 1 : 1, objemově) a přefiltruje přes vrstvu silikagelu. Filtrát se promyje desetkrát vodou, vysuší bezvodým síranem hořečnatým a za sníženého tlaku se z něj odpaří rozpouštědla. Zbytek se přečistí mžikovou chromatografií na silikagelu za použití směsi pentanu a ethylacetátu, jako elučního činidla. Získá se 2,4-bis-(1'-methyl-3'-trifluormethylpyrazol-5'-yloxy)-6-chlorpyridin (4,3 g) o teplotě tání 105°C.

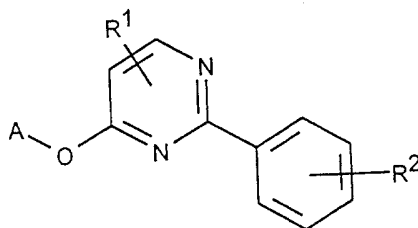
Směs chloridu bis(benzonitril)palladnatého(II) (0,19 g, 0,5 mmol) a 1,4-bis(difenylfosfino)butanu (0,2 g, 0,5 mmol) v bezvodém toluenu (10 ml) se pod atmosférou dusíku zahřívá ke zpětnému toku. Po 2 hodinách se ke vzniklé směsi přidá 4-trifluormethylbenzenboronová kyselina (1,2 g, 6,5 mmol), 2,4-bis-(1"-methyl-3"-trifluormethylpyrazol-5"-yloxy)-6-chlorpyridin (2,2 g, 5 mmol), ethanol (2,5 ml) a 1M vodný

roztok uhličitanu sodného (5 ml). Reakční směs se pod atmosférou dusíku další 2 hodiny zahřívá ke zpětnému toku, zředí ethylacetátem a přefiltruje přes vrstvu silikagelu. Filtrát se promyje vodou, vysuší bezvodým síranem hořečnatým a za sníženého tlaku se z něj odstraní rozpouštědlo. Zbytek se přečistí mžikovou chromatografií na silikagelu za použití směsi pentanu a ethylacetátu v poměru 8 : 2 (objemově), jako elučního činidla. Získá se sloučenina uvedená v nadpisu ve formě bezbarvých krystalů (2 g, výtěžek 73 %) o teplotě tání 133°C.

P ř í k l a d y 2 2 2 a ž 3 0 0

Způsobem popsaným v příkladu 113 se vyrobí další sloučeniny, které odpovídají obecnému vzorci I. Bližší údaje o těchto sloučeninách jsou uvedeny v tabulce XIV.

T a b u l k a X I V

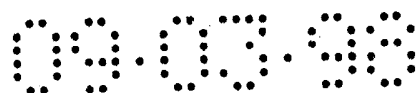


(I)

Př. č.	R ¹	R ²	A	teplota tání (°C)
222	5-methyl	4'-CF ₃	4"-chlorpyrimidin-6"-yl	107
223	6-methylthio	4'-chlor	1"-CH ₃ -3"-CF ₃ -pyrazol-5"-yl	131
224	6-brom	4'-CF ₃	2"-chlorpyridin-4"-yl	108
225	6-brom	4'-CF ₃	3"-CF ₃ -fenyl	96

09.03.98

226	6-(dimethyl- amino)methy- lenamino	4'-chlor	1"-CH ₃ -3"-CF ₃ - pyrazol-5"-yl	126
227	6-ethinyl	4'-CF ₃	1"-CH ₃ -3"-CF ₃ - pyrazol-5"-yl	117
228	6-methoxy- methyl	4'-CF ₃	1"-CH ₃ -3"-CF ₃ - pyrazol-5"-yl	114-116
229	6-methoxy- methyl	4'-CF ₃	3"-CF ₃ -4"-fluorfenyl	71-73
230	6-methoxy- methyl	4'-CF ₃	2"-chlorpyridin-4"-yl	100-102
231	4,5-dichlor	4'-chlor	1"-CH ₃ -3"-CF ₃ - pyrazol-5"-yl	156-160
232	6-methyl	4'-SO ₂ CH ₃	1"-CH ₃ -3"-CF ₃ - pyrazol-5"-yl	132
233	6-methyl	4'-SO ₂ CH ₃	3"-CF ₃ -fenyl	162
234	6-methyl	4'-SO ₂ CH ₃	2"-chlorpyrid-4"-yl	168
235	4-fluor	4'-CF ₃	1"-CH ₃ -3"-CF ₃ - pyrazol-5"-yl	124
236	6-ethyl	4'-CF ₃	1"-CH ₃ -3"-CF ₃ - pyrazol-5"-yl	90
237	6-ethyl	4'-CF ₃	3"-CF ₃ -fenyl	77
238	6-ethyl	4'-CF ₃	2"-chlorpyrid-4"-yl	97
239	6-ethyl	4'-CF ₃	4"-chlorpyrimidin- 6"-yl	86
240	6-ethyl	4'-CF ₃	6"-(2,2,2-trifluor- ethoxy)pyrimidin-4"-yl	105
241	6-ethyl	4'-CF ₃	2",6"-dichlorpyrid- 4"-yl	158
242	6-ethyl	4'-CF ₃	6"-kyanopyrid-4"-yl	130
243	6-ethyl	4'-CF ₃	3"-CF ₃ -4"-fluorfenyl	62
244	4-chlor	4'-CF ₃	3"-CF ₃ -fenyl	89
245	4-chlor	4'-CF ₃	2"-chlorpyrid-4"-yl	104
246	4-chlor	4'-CF ₃	1"-CH ₃ -3"-C ₂ F ₅ - pyrazol-5"-yl	108



247	6-methyl	4'-CF ₃	2"-difluormethoxy- pyrid-4"-yl	89-92
248	4-methylamino	4'-CF ₃	1"-CH ₃ -3"-CF ₃ - pyrazol-5"-yl	167
249	6-ethoxy	4'-CF ₃	1"-CH ₃ -3"-CF ₃ - pyrazol-5"-yl	162
250	6-(2-fluor- ethoxy)	4'-CF ₃	1"-CH ₃ -3"-CF ₃ - pyrazol-5"-yl	148
251	6-(2,2,2-tri- fluorethoxy)	4'-CF ₃	1"-CH ₃ -3"-CF ₃ - pyrazol-5"-yl	133
252	6-allyloxy	4'-CF ₃	1"-CH ₃ -3"-CF ₃ - pyrazol-5"-yl	127
253	5,6-diethoxy	4'-CF ₃	1"-CH ₃ -3"-CF ₃ - pyrazol-5"-yl	93
254	6-methoxy- methyl	4'-CF ₃	3"-CF ₃ -fenyl	56-59
255	6-kyanomethyl	4'-CF ₃	1"-CH ₃ -3"-CF ₃ - pyrazol-5"-yl	127-130
256	6-hydrazino	4'-CF ₃	1"-CH ₃ -3"-CF ₃ - pyrazol-5"-yl	187
257	4-fluor	4'-CF ₃	3"-CF ₃ -fenyl	olej
258	4-fluor	4'-CF ₃	2"-chlorpyrid-4"-yl	136
259	4-jod	4'-CF ₃	1"-CH ₃ -3"-CF ₃ - pyrazol-5"-yl	108
260	6-methyl	4'-CHCl ₂	1"-CH ₃ -3"-CF ₃ - pyrazol-5"-yl	116
261	6-difluor- methoxy	4'-CF ₃	3"-CF ₃ -fenyl	92-95
262	4-chlor-5- methyl	4'-CF ₃	1"-CH ₃ -3"-CF ₃ - pyrazol-5"-yl	146
263	4-fluor-5- methyl	4'-CF ₃	1"-CH ₃ -3"-CF ₃ - pyrazol-5"-yl	150
264	4-fluor-5- methyl	4'-CF ₃	3"-CF ₃ -fenyl	69
265	4-fluor-5- methyl	4'-CF ₃	2"-chlorpyrid-4"-yl	129



266	6-methyl	4'-CF ₃	2"-trifluormethyl- pyrid-4"-yl	105
267	6-methyl	4'-CN	1"-CH ₃ -3"-CF ₃ - pyrazol-5"-yl	177
268	5-chlor	4'-CF ₃	1"-CH ₃ -3"-CF ₃ - pyrazol-5"-yl	135-140
269	6-methyl	4'-CF ₃	2"-(2,2,2-trifluor- ethoxy)pyrid-4"-yl	104-106
270	4-chlor	4'-CF ₃	2"-difluormethoxy- pyrid-4"-yl	101-104
271	6-methyl	4'-CF ₃	3"-CN-fenyl	138
272	5-isopropyl	4'-CF ₃	3"-CF ₃ -fenyl	66
273	6-methoxy	4'-CF ₃	2"-trifluormethyl- pyrid-4"-yl	84
274	5-methyl	4'-CF ₃	2"-trifluormethyl- pyrid-4"-yl	109
275	4-chlor	4'-CF ₃	2"-trifluormethyl- pyrid-4"-yl	97
276	6-methyl	4',5'-di(CF ₃)	1"-CH ₃ -3"-CF ₃ - pyrazol-5"-yl	132
277	6-methyl	4',5'-di(CF ₃)	3"-CF ₃ -fenyl	93
278	6-methyl	4',5'-di(CF ₃)	2"-chlorpyrid-4"-yl	128
279	4-difluor- methoxy	4'-CF ₃	1"-CH ₃ -3"-CF ₃ - pyrazol-5"-yl	108-110
280	6-methoxy	4'-CF ₃	2"-difluormethoxy- pyrid-4"-yl	88-91
281	5-methyl	4'-CF ₃	2"-difluormethoxy- pyrid-4"-yl	101-103
282	4-chlor	4'-CF ₃	2"-(2,2,2-trifluor- ethoxy)pyrid-4"-yl	98-101
283	6-methoxy	4'-CF ₃	2"-(2,2,2-trifluor- ethoxy)pyrid-4"-yl	91-94
284	5-methyl	4'-CF ₃	2"-(2,2,2-trifluor- ethoxy)pyrid-4"-yl	74-76
285	5-methyl	4'-CF ₃	3"-CF ₃ O-fenyl	73

286	6-methyl	4'-CF ₃	3"-CF ₃ O-fenyl	63
287	5-methyl	4'-CF ₃	2"-kyanopyrid-4"-yl	133
288	5-methyl	4'-CF ₃	2"-pentafluorethyl- pyrid-4"-yl	134
289	6-methyl	4'-CF ₃	2"-pentafluorethyl- pyrid-4"-yl	91
290	6-methoxy- methyl	4'-CF ₃	2"-trifluormethyl- pyrid-4"-yl	70
291	6-methoxy	4'-CF ₃	2"-pentafluorethyl- pyrid-4"-yl	100
292	6-ethyl	4'-CF ₃	2"-trifluormethyl- pyrid-4"-yl	59
293	6-ethyl	4'-CF ₃	2"-(2,2,2-trifluor- ethoxy)pyrid-4"-yl	86
294	6-ethyl	4'-CF ₃	2"-difluormethoxy- pyrid-4"-yl	92
295	6-methoxy- methyl	4'-CF ₃	2"-difluormethoxy- pyrid-4"-yl	118
296	6-methoxy- methyl	4'-CF ₃	2"-(2,2,2-trifluor- ethoxy)pyrid-4"-yl	103
297	6-methyl	4'-CF ₃	2"-(1,1,2,2-tetrafluor- ethyl)pyrid-4"-yl	
298	6-methyl	4'-CF ₃	2"-difluormethyl- thiopyrid-4"-yl	70-73
299	5-methyl	4'-CF ₃	2"-difluormethyl- thiopyrid-4"-yl	80-95
300	6-methoxy	4'-CF ₃	2"-difluormethyl- thiopyrid-4"-yl	67-70

P ř í k l a d 3 0 1

Herbicidní účinnost

Pro vyhodnocení herbicidní účinnosti se sloučeniny podle vynálezu podrobí zkoušení za použití následujícího



reprezentativního souboru rostlin.

TRZAS	Triticum aestivum	pšenice obecná
HORVW	Hordeum vulgare	ječmen obecný
GOSHI	Gossypium hirsutum	bavlník srstnatý
HELAN	Helianthus annuus	slunečnice roční
ORYSA	Oryza sativa	rýže setá
GLXMA	Glycine max	soja
BEAVA	Beta vulgaris	řepa cvikla
ZEAMX	Zea mays	kukuřice setá
ALOMY	Alopecurus myosuroides	psárka polní
AVEFA	Avena fatua	oves hluchý
ECHCG	Echinochloa crus-galli	ježatka kuří noha
SETVI	Setaria viridis	bér zelený
GALAP	Galium aparine	svízel přítula
STEME	Stellaria media	ptačinec žabinec
CHEAL	Chenopodium album	merlík bílý
VERPE	Veronica persica	rozrazil perský
LAMPU	Lamium purpureum	hluchavka nachová
VIOAR	Viola arvensis	violka rolní
SIDSP	Sida spinosa	
AMBAR	Ambrosia artemisifolia	ambrózie
ABUTH	Abutilon theophrasti	abutilon
IPOPU	Ipomoea purpurea	povíjnice
SINAL	Sinapsis alba	hořčice bílá
AMARE	Amaranthus retroflexus	laskavec ohnutý

Zkoušky spadají do dvou kategorií, tj. preemergentní a postemergentní. Při preemergentních zkouškách se kapalný prostředek obsahující zkoušenou sloučeninu nastříká na půdu, do níž byla nedávno zaseta semena. Při postemergentních zkouškách se kapalný prostředek obsahující zkoušenou sloučeninu nastříká na semenáčky použitých rostlin.

Jako půdy se při těchto zkouškách použije upravené zahradnické hlinitopísčité půdy. Prostředky pro zkoušení se vyrobí z roztoků zkoušených sloučenin v acetonu s obsahem 0,4 % hmotnostního kondenzátu alkylfenolu s ethylenoxidem (TRITON X-155). Acetonové roztoky se zředí vodou a vzniklé prostředky se aplikují v dávce odpovídající intenzitě ošetření 1000 g nebo 300 g účinné přísady na hektar, při objemu, který odpovídá objemu postřiku 400 litrů/hektar. Při preemergentních zkouškách se jako kontrolní plochy použije neošetřené oseté půdy a při postemergentních zkouškách se jako kontrolní plochy použije neošetřené půdy s neošetřenými semenáčky.

Herbicidní účinky zkoušených sloučenin se zjišťují vizuálně 20 dnů po postřiku listů a půdy (v případě sloučenin z příkladů 13 až 16 se zjišťují 13 dnů po ošetření) a jsou vyjádřeny pomocí klasifikační stupnice, která zahrnuje stupně 0 až 9. Stupněm 0 se označuje růst neošetřených kontrolních rostlin a stupněm 9 se označuje usmrcení rostlin. Nárůst o jednu jednotku v lineární stupnici představuje přibližně 10% zvýšení hladiny účinku.

Výsledky těchto zkoušek jsou souhrnně uvedeny v následujících tabulkách. Hvězdička znamená, že takto označený druh rostliny nebyl při zkoušce použit.

T a b u l k a X V

Účinnost sloučenin podle vynálezu při preemergentní a post-emergentní aplikaci



Př. č.	Dáv- ka g/ha	Doba apli- kace	T R Z A W	H O R V W	G O S H I	H E L Y N	O R X M A	G L E A V M X	B E A O F A G	Z E L E H C V I P	A O E H T L E M A P E	A E H C V I P	S E T L E M A P E	S G T E M P E	C H E R M P E	V E A M P E	L A I O D S A R H	V I M B U O N A	A B U O N A	I P O N A	S I M A	A M A	
13	100 0	pre post	* *	* *	* *	* *	0 2	0 5	4 8	2 4	* *	2 2	4 5	* *	* *	* *	* *	* *	* *	* *	* *	5 8	* *
14	100 0	pre post	* *	* *	* *	* *	3 4	4 6	9 9	9 6	* *	6 6	8 7	* *	* *	* *	* *	* *	* *	* *	* *	8 8	* *
15	100 0	pre post	* *	* *	* *	* *	0 2	2 6	8 9	2 5	* *	2 2	5 7	* *	* *	* *	* *	* *	* *	* *	* *	6 6	* *
16	100 0	pre post	* *	* *	* *	* *	0 0	0 2	2 7	0 4	* *	0 2	2 2	* *	* *	* *	* *	* *	* *	* *	* *	2 5	* *
24	300	pre post	1 0	0 0	0 1	0 1	* *	* *	* *	0 1	0 0	* *	* *	0 0	0 0	* *	0 0	* *	0 0	* *	* *	0 0	* *
25	300	pre post	0 0	0 0	0 1	0 2	* *	* *	* *	0 2	0 0	* *	* *	1 0	0 0	* *	0 1	* *	0 1	* *	* *	0 1	* *
26	300	pre post	1 1	0 2	* *	1 3	* *	* *	* *	1 2	* *	* *	* *	0 0	2 2	0 4	0 4	* *	* *	* *	* *	0 4	0 1
27	300	pre post	0 2	0 2	* *	0 3	* *	* *	* *	0 3	* *	* *	* *	0 1	0 1	0 2	0 3	* *	* *	* *	* *	0 3	0 2
28	300	pre post	0 3	3 3	0 4	0 5	* *	* *	* *	3 4	5 5	* *	6 4	9 6	2 5	7 4	* *	9 6	8 6	8 6	4 5	4 4	2 *
29	300	pre post	0 4	1 3	* *	0 4	* *	* *	* *	0 3	* *	* *	* *	8 3	0 3	7 5	8 6	8 *	* *	* *	* *	0 5	0 4
30	300	pre post	4 4	6 5	3 6	3 6	* *	* *	* *	4 4	9 6	* *	8 6	9 7	6 5	9 6	* *	9 6	9 7	8 8	8 5	6 6	* *
31	300	pre post	1 3	4 5	2 8	0 5	* *	3 5	* *	1 8	8 7	* *	5 4	9 7	7 6	9 7	* *	9 7	9 8	* *	* *	8 8	5 6
32	300	pre post	1 2	0 2	0 5	0 4	* *	0 3	* *	0 3	3 3	* *	2 2	8 4	1 4	6 5	* *	8 9	3 5	8 7	* *	3 4	1 5



Př. č.	Dávka g/ha	Doba apli- kace	T R Z A W	H R V W	G O S H I N	H O L Y A A	O R L X M A	G B E A V M X	Z E A O M Y	A L O F A	E C H T V A G	S E A L P E	S C T H E R M O D B U O N A	V E A P P A S A T H U L	L E U R P R H U L	V I M B U O N A	S A I P I M A	A A I P I M A	I B U O N A	S A I P I M A			
33	300	pre post	2 0 0	0 0 0	0 0 0	* * *	2 0 *	* * *	0 0 0	* * *	0 0 2	0 0 0	* * *	0 0 0	0 0 0	* * *	* * *	0 0 0	5 1 0	* * *	0 0 0		
34	300	pre post	1 2	3 2	3 5	* * *	3 2	* * *	2 7 2	* * *	8 4 5	8 5 6	2 6 6	* * *	9 9 6	8 6 6	9 6 6	* * *	8 5 6	3 6 6	5 6 6	* * *	8 7 7
39	300	pre post	1 1	3 2	0 4	* * *	* * 3	0 * *	5 3 3	* * *	4 2 7	9 5 5	2 5 5	* * *	9 9 5	8 5 7	9 7 7	* * *	3 3 3	3 3 5	3 5 5	* * *	9 5 5
109	300	pre post	0 0 0	0 0 2	0 0 0	* * *	* * *	0 * *	0 0 0	* * *	0 0 1	0 0 0	0 0 0	6 0 0	0 7 0	0 0 0	0 0 1	* * *	0 0 0	0 2 2	* * *	6 1 1	
110	300	pre post	3 4	4 5	2 6	1 6	* * *	* * *	2 4 7	8 7 *	6 7 *	9 6 8	2 8 7	* * *	9 9 7	9 8 8	9 6 6	* * *	5 6 4	3 4 *	* * *	9 6 6	
111	300	pre post	1 3	3 3	0 5	0 5	* * *	* * *	0 4 4	8 4 *	* * *	9 6 6	5 6 8	9 8 9	8 9 8	* * *	6 6 6	* * *	5 6 6	3 4 4	* * *	9 6 6	
112	300	pre post	3 4	5 5	6 8	3 8	* * *	5 8 *	* 5 7	4 * *	9 * 6	8 9 8	8 7 8	* * *	9 9 8	9 8 9	8 9 *	* * *	8 8 8	9 7 7	* * *	9 8 8	
113	300	pre post	3 4	6 5	6 8	2 8	* * *	3 8 *	3 5 6	9 * *	8 7 *	9 9 7	8 8 8	* * *	9 9 8	8 8 8	* * *	* * *	9 8 8	9 8 8	* * *	9 7 7	
114	300	pre post	4 4	5 5	8 8	3 6	* * *	4 6 *	3 6 8	8 * *	8 5 *	9 8 7	8 8 8	* * *	9 9 8	8 8 8	* * *	* * *	9 8 8	9 8 8	* * *	9 7 7	
115	300	pre post	4 4	7 6	8 9	3 8	* * *	5 8 *	* 6 7	4 * *	8 6 *	9 8 7	8 7 8	* * *	9 8 8	9 8 8	8 8 *	* * *	9 8 8	9 8 8	* * *	9 8 8	
116	300	pre post	0 2	3 3	0 4	0 4	* * *	0 5 *	* 3 3	0 * *	6 2	9 8	0 3	6 4	* * *	9 9 7	8 5 5	* * *	* * *	2 4 4	* * *	8 5 5	
117	300	pre post	0 3	2 3	0 4	0 4	* * *	0 4 *	* 4 4	2 * *	7 * 3	9 4	1 4	5 4	* * *	9 9 5	6 7 7	8 * *	* * *	4 4 4	* * *	9 7 7	
118	300	pre post	0 0	0 2	0 4	0 4	* * *	0 3 *	* 2 3	0 * *	3 * 3	7 4	1 3	2 3	* * *	8 9 4	3 4 5	7 * *	* * *	1 2 2	* * *	9 5 5	

09.03.98

Pr. č.	Dáv- ka	Doba apli- kace	T R A W	H R V W	G O S H I	H E L N	O Y A	G X M A	B E V A	Z E M X	A A O Y	A V E F A	E H C G	S E T V	G A L P	S T E M	C H E R	V E R P	L A M P	V I O D	S I M S	A M B U	A P O N	I P O N	S I M A	
119	300	pre post	0 0	0 2	0 0	0 2	* *	0 1	* *	0 1	0 1	* *	1 0	0 1	0 2	0 2	* *	0 3	0 1	0 5	2 *	* *	0 1	0 3	* *	0 4
120	300	pre post	1 2	3 4	2 5	0 4	* *	0 5	* *	2 3	8 5	* *	6 4	9 5	6 6	9 4	* *	8 9	8 7	8 *	* *	5 5	5 4	* *	9 5	
121	300	pre post	2 3	3 4	2 8	0 4	* *	1 5	* *	3 5	8 5	* *	7 6	9 7	3 6	8 5	* *	9 9	7 7	8 8	* *	* *	5 4	4 5	* *	9 6
122	300	pre post	* *	* *	* *	* *	* *	* *	* *	* *	* *	* *	* *	* *	* *	* *	* *	* *	* *	* *	* *	* *	* *	* *	* *	* *
123	300	pre post	0 1	0 1	0 2	0 3	* *	0 2	* *	0 1	0 1	* *	0 2	0 2	0 3	0 4	* *	2 5	2 3	4 5	* *	* *	0 2	0 6	* *	4 4
124	300	pre post	1 4	3 4	2 6	1 5	* *	5 5	* *	5 5	5 5	* *	6 6	8 7	3 4	9 5	* *	9 9	8 6	9 8	* *	* *	7 6	9 7	* *	9 6
125	300	pre post	3 4	4 5	3 5	2 5	* *	3 6	* *	5 5	8 5	* *	7 6	9 7	4 5	9 6	* *	9 9	9 6	9 8	* *	* *	9 5	7 7	* *	9 6
126	300	pre post	0 2	0 2	0 5	0 4	* *	0 3	* *	0 3	3 3	* *	0 3	9 3	1 4	7 4	* *	8 9	4 5	8 8	* *	* *	2 4	3 6	* *	9 5
127	300	pre post	0 0	0 1	1 4	0 3	* *	0 2	* *	2 2	2 3	* *	0 2	8 4	0 3	7 5	* *	7 6	3 4	8 8	* *	* *	2 4	4 6	* *	8 6
128	300	pre post	4 5	5 5	7 6	2 5	* *	3 5	* *	5 6	8 6	* *	7 7	9 7	5 6	9 6	* *	9 9	9 6	9 8	* *	* *	9 6	9 8	* *	9 7
129	300	pre post	3 2	3 4	5 7	4 5	* *	3 5	* *	3 3	8 5	* *	6 5	9 6	5 5	9 5	* *	9 9	9 6	9 8	* *	* *	9 6	9 9	* *	9 6
130	300	pre post	2 2	5 4	3 6	2 5	* *	3 5	* *	3 4	7 5	* *	6 5	9 7	4 5	9 6	* *	9 8	6 6	9 8	* *	* *	7 5	6 9	* *	8 6
131	300	pre post	0 1	0 1	2 3	2 4	* *	0 2	* *	2 1	1 2	* *	0 2	8 2	0 4	4 4	* *	7 7	0 4	8 7	* *	* *	0 4	5 5	* *	8 4

09.03.98

Pr. č.	Dávka g/ha	Doba apli- kace	T R Z A W	H R V W	G O S H I	H O L Y N	O R X A A	G L E V M A	B E A M X	Z E O M Y	A V E F A	E C H C V A G	S E T V I P	G A L E M E	S T E R P	C H E R M P A L	V E R M P A L	L A I M O D B U O N A	V I M D B U O N A	S A B U O N A	A I P O N A	I B U O N A	S I P O N A	A M P A R	
132	300	pre post	0 0	0 1	0 3	0 2	* 2	3 2	* 2	0 1	0 0	* 1	0 2	3 3	0 3	0 3	* 4	0 3	3 5	* 5	* 2	0 5	3 5	* 5	5 5
133	400	pre post	5 3	5 4	* *	* *	5 5	7 6	* *	4 4	8 8	* *	* 8	9 9	7 *	* *	9 8	9 8	* *	* *	* 9	9 9	* 9	* 9	
134	400	pre post	3 2	4 3	* *	* *	3 2	4 6	* *	4 3	8 4	* *	* 8	9 7	3 *	* *	9 9	7 8	* *	* *	* 9	6 9	4 9	* *	
135	300	pre post	6 4	7 6	* *	* *	5 4	4 6	* *	3 3	8 7	* *	8 6	9 7	3 6	8 7	* 8	9 9	8 9	* *	* *	8 7	9 9	* *	
136	300	pre post	6 5	8 6	* *	* *	5 5	4 6	* *	4 4	8 6	* *	8 7	8 7	1 6	9 8	* 6	9 9	8 7	* *	* *	6 8	9 8	* *	
137	300	pre post	0 0	0 1	* *	* *	0 1	0 1	* *	0 0	0 1	* *	0 0	0 1	0 1	5 *	0 2	0 2	* *	* *	* *	0 1	0 2	* *	
138	300	pre post	6 4	7 7	* *	* *	4 4	4 7	* *	3 3	8 6	* *	8 6	9 5	4 7	9 7	* 9	9 8	* *	* *	* 7	9 8	* *		
139	300	pre post	0 1	0 2	* *	* *	0 1	0 2	* *	0 0	0 1	* *	0 1	0 1	0 1	* 4	0 3	0 2	* *	* *	* 2	0 4	0 *	* *	
140	300	pre post	4 3	5 4	5 5	* *	3 5	2 5	* *	2 3	8 7	* *	8 4	8 7	4 6	9 *	9 9	9 8	9 6	* *	8 6	4 8	6 9	* *	
141	300	pre post	1 2	4 3	2 9	* *	2 2	1 4	* *	2 3	7 4	* *	8 3	9 5	1 5	9 5	* 8	9 7	8 6	* *	5 6	2 5	4 9	* *	
142	300	pre post	0 0	0 1	1 5	* *	0 0	1 4	* *	0 2	0 0	* *	1 1	5 2	1 3	4 *	5 5	1 4	7 6	* *	0 5	0 3	1 5	* *	
143	300	pre post	0 1	1 2	4 8	* *	2 0	2 3	* *	2 3	6 1	* *	5 2	8 3	3 6	9 5	* 8	9 5	9 6	* *	8 7	4 6	5 7	* *	
144	300	pre post	0 1	0 1	0 6	* *	0 0	2 3	* *	0 2	0 0	* *	0 1	3 1	0 4	* *	4 6	4 3	4 5	* *	0 5	0 3	4 4	* *	

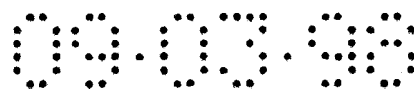
Př. č.	Dávka g/ha	Doba apli- kace	T	H	G	H	O	G	B	Z	A	A	E	S	G	S	C	V	L	V	S	A	A	I	S	A
			R Z A W	O R V W	O S H I	E L A N	R Y S A	L X M A	E A V A	E A M X	A O M Y	V E F A	C H C V	E T L A M P E L	A P P A S R H U L E											
145	300	pre post	0 1	0 2	2 8	* *	0 0	1 4	* *	1 3	2 1	* *	2 2	5 5	0 5	3 5	* *	6 7	3 5	6 6	* *	2 6	0 5	2 5	* *	5 8
146	300	pre post	0 0	0 0	0 4	0 5	* *	1 1	* *	0 4	7 5	* *	3 4	8 9	0 4	8 6	* *	9 7	4 4	8 7	* *	4 4	3 3	1 4	* *	9 4
147	300	pre post	0 0	1 0	0 4	0 5	* *	1 4	* *	0 1	5 4	* *	3 3	7 5	0 4	6 5	* *	9 6	3 4	7 5	* *	3 4	3 4	3 5	* *	9 4
148	300	pre post	0 0	0 0	0 3	0 4	* *	0 2	* *	0 2	1 1	* *	0 1	2 3	0 4	0 3	* *	8 4	0 3	8 6	* *	0 3	1 2	0 4	* *	9 4
149	300	pre post	0 0	0 0	3 0	0 4	* *	0 2	* *	0 2	0 0	* *	0 0	0 2	0 4	0 3	* *	2 5	1 4	5 4	* *	0 4	0 1	0 4	* *	8 4
150	300	pre post	2 2	4 4	4 6	2 5	* *	3 4	* *	4 4	8 6	* *	7 6	9 8	2 5	9 5	* *	9 7	9 7	9 7	* *	7 6	4 6	6 6	* *	9 7
151	300	pre post	0 0	0 1	0 4	2 5	* *	0 3	* *	0 3	4 2	* *	0 2	0 4	0 4	6 5	* *	8 6	2 4	9 7	* *	4 4	1 2	1 4	* *	9 6
152	300	pre post	3 2	4 4	5 6	4 6	* *	3 5	* *	4 5	8 8	* *	7 6	7 9	4 7	9 7	* *	9 7	8 7	9 7	* *	8 7	7 6	9 5	* *	8 7
153	300	pre post	1 4	3 4	3 5	0 6	* *	1 4	* *	3 4	8 6	* *	7 5	7 8	1 5	9 6	* *	9 8	8 5	9 6	* *	4 4	5 5	5 5	* *	9 5
154	300	pre post	4 5	5 6	4 *	2 *	* *	2 5	* *	4 7	8 *	* *	8 *	9 *	3 *	9 *	* *	9 *	9 *	9 *	* *	8 *	7 *	7 *	* *	9 *
155	300	pre post	3 1	4 5	4 6	1 6	* *	1 5	* *	3 6	8 6	* *	8 7	9 8	4 6	9 7	* *	9 7	8 5	9 7	* *	8 5	8 6	6 5	* *	9 5
156	300	pre post	2 0	2 1	0 4	0 5	* *	* 4	* *	0 4	6 5	* *	4 4	9 9	0 5	8 7	* *	9 7	4 4	9 6	* *	4 4	4 4	3 4	* *	9 5
157	300	pre post	1 4	3 4	2 6	1 5	* *	5 5	* *	5 5	5 5	* *	6 6	8 7	3 4	9 5	* *	9 9	8 6	9 8	* *	7 5	7 6	9 7	* *	9 6



Pr. č.	Dáv- ka g/ha	Doba apli- kace	T R Z A W	H R V W	G O S H I	H E L Y N	O R X M A	G B E A V A	Z E A M X	A A O M Y	A V E H C F A	S E T L E A M P E	S C H E R M O D B U O N A	V E A I I M B P I M	L A I O D B U O N A	V I I M B P I M	S A I M B P I M	A A I M B P I M	I P O N A	S I M B P I M	A M B P I M					
158	300	pre post	3 4	4 5	3 5	2 5	* *	3 6	* *	5 5	8 5	* *	7 6	9 7	4 5	9 6	* *	9 9	9 8	* *	7 5	9 5	7 7	* *	9 6	
159	300	pre post	0 2	0 2	0 5	0 4	* *	0 3	* *	0 3	3 3	* *	0 3	9 3	1 4	7 4	* *	8 9	4 5	8 8	* *	4 4	2 6	3 6	* *	9 5
160	300	pre post	0 0	0 1	1 4	0 3	* *	0 2	* *	2 2	2 3	* *	0 2	8 4	0 3	7 5	* *	7 6	3 4	8 2	* *	2 5	2 4	4 6	* *	2 6
161	300	pre post	0 0	0 1	0 3	* *	0 0	1 2	* *	0 0	0 0	* *	0 0	0 1	0 0	0 1	* *	1 1	0 1	0 5	* *	0 1	0 1	0 3	* *	0 2
162	300	pre post	0 0	0 0	0 3	* *	0 0	0 2	* *	0 0	0 0	* *	0 0	0 1	0 1	0 1	* *	0 1	0 5	0 5	* *	0 0	0 2	0 2	* *	0 0
163	300	pre post	0 1	0 1	0 5	* *	0 0	0 4	* *	0 2	0 0	* *	0 0	3 2	1 2	0 3	* *	3 6	0 4	2 5	* *	0 3	0 2	2 4	* *	0 5
164	300	pre post	0 0	0 1	0 6	* *	2 0	0 4	* *	0 3	0 1	* *	0 1	5 1	0 2	6 4	* *	4 6	1 5	7 6	* *	1 3	0 3	1 5	* *	3 8
165	300	pre post	0 2	3 3	5 9	* *	2 0	2 6	* *	2 3	8 3	* *	8 2	9 5	4 8	9 6	* *	9 9	9 7	9 6	* *	8 6	4 7	6 9	* *	8 8
166	300	pre post	0 1	1 2	4 5	* *	2 2	1 7	* *	1 2	5 3	* *	7 3	5 4	2 6	5 5	* *	8 8	7 5	8 7	* *	6 4	2 6	4 5	* *	8 8
167	300	pre post	2 2	3 3	5 6	* *	4 5	2 6	* *	3 3	8 6	* *	8 6	9 8	2 5	8 7	* *	9 8	8 6	8 6	* *	8 4	4 6	9 5	* *	8 8
168	300	pre post	2 2	3 3	4 8	* *	0 2	3 7	* *	1 2	7 4	* *	5 4	8 5	1 5	5 5	* *	9 9	6 8	9 8	* *	5 6	4 5	3 8	* *	9 7
169	300	pre post	3 3	3 3	5 9	* *	5 5	2 6	* *	3 3	8 5	* *	6 5	9 6	1 5	9 4	* *	9 8	8 7	9 7	* *	5 5	4 6	6 6	* *	9 7
170	300	pre post	0 0	0 1	0 4	* *	0 0	0 5	* *	0 1	0 0	* *	0 0	2 0	0 2	0 1	* *	0 3	1 3	5 5	* *	0 3	0 2	2 4	* *	6 5



Př. č.	Dávka g/ha	Doba aplikace	T R Z	H O S	G L Y	H E X	O A M	G B V	Z A M	A E F	A C H	E T V	S A M	G S C	V E R	L A M	V I O	S D B	A U P	A I O	S N A	A R E				
171	300	pre post	0 1	0 2	1 4	* *	0 0	* *	0 4	3 1	* *	2 2	6 3	0 4	0 2	* *	3 5	2 5	8 7	* *	0 4	0 4	1 4	* *	7 5	
172	300	pre post	0 1	0 1	0 2	* *	* *	0 2	* *	0 1	0 1	* *	0 2	0 2	0 3	* *	2 5	2 3	4 5	* *	1 2	0 2	0 6	* *	4 4	
173	300	pre post	1 2	3 3	6 6	* *	* *	2 7	* *	2 3	8 6	* *	8 6	9 7	6 6	8 7	* *	9 9	9 6	9 7	* *	8 6	5 6	8 8	* *	8 8
174	300	pre post	3 2	3 3	5 6	* *	0 4	3 7	* *	2 3	8 5	* *	5 5	8 5	4 5	8 4	* *	9 9	8 7	9 8	* *	6 6	4 5	6 8	* *	9 7
175	300	pre post	0 1	0 1	2 6	* *	0 1	1 7	* *	0 1	4 5	* *	1 5	7 5	0 5	2 4	* *	7 9	4 7	8 8	* *	1 6	0 5	0 8	* *	8 7
176	400	pre post	3 3	2 4	* *	* *	2 2	3 2	* *	2 2	7 4	* *	* *	8 6	3 8	* *	* *	9 8	8 7	* *	* *	2 8	8 9	* *	* *	
177	400	pre post	7 3	5 5	* *	* *	5 4	4 6	* *	4 4	8 6	* *	* *	9 7	5 7	* *	* *	9 9	* *	* *	* *	6 7	9 6	* *	* *	
178	400	pre post	2 1	2 3	* *	* *	2 4	1 4	* *	1 3	6 3	* *	* *	8 4	4 5	* *	* *	8 9	* *	* *	* *	2 5	3 4	* *	* *	
188	400	pre post	4 3	5 4	* *	* *	6 3	4 5	* *	5 3	9 7	* *	* *	9 8	8 9	* *	* *	9 9	9 8	* *	* *	9 8	9 9	* *	* *	
190	400	pre post	5 4	6 5	* *	* *	5 4	5 7	* *	5 3	9 8	* *	* *	9 9	9 9	* *	* *	9 9	9 8	* *	* *	9 9	9 9	* *	* *	
191	400	pre post	4 4	4 4	* *	* *	5 4	5 7	* *	4 3	9 8	* *	* *	9 8	8 9	* *	* *	9 9	9 8	* *	* *	9 9	9 9	* *	* *	
192	400	pre post	4 3	4 4	* *	* *	3 3	5 6	* *	4 2	8 7	* *	* *	9 8	7 9	* *	* *	9 9	8 8	* *	* *	9 9	9 9	* *	* *	
193	400	pre post	4 4	5 4	* *	* *	3 4	4 5	* *	4 3	8 8	* *	* *	9 9	7 8	* *	* *	9 8	8 7	* *	* *	8 8	9 9	* *	* *	



T a b u l k a X V I

Účinnost sloučenin podle vynálezu při preemergentní aplikaci

Příklad	Dávka [kg/ha]	G L X M A	H O R Y V A	O R Y S A W	T R Z A M W	Z A M X	A B U T H	A M B E L	C A S O B	G A L O P	I P O H E	L A M P U	M A T I N	S T E M E	V E R P E	A L O M Y	D I G S A	E C H C G	S E T V I
218	0,4	4	5	3	5	4	9	9	7	8	9	8	9	8	9	9	9	8	9
	0,1	4	4	2	4	3	8	9	7	7	5	8	9	8	9	7	9	6	8
	0,025	3	3	1	2	2	8	9	6	2	5	8	9	7	8	5	8	2	8
	0,0125	2	2	1	1	1	6	8	6	1	3	8	8	X	X	2	7	1	6
219	0,4	6	5	4	5	4	9	9	9	8	9	8	9	X	9	9	9	9	9
	0,1	4	4	2	4	3	9	9	9	7	9	8	9	X	9	8	9	7	9
	0,025	3	3	2	2	2	8	7	8	3	7	8	9	X	9	5	9	5	9
	0,0125	3	2	1	1	1	5	7	8	X	6	7	9	X	9	3	7	3	6
220	0,4	6	6	4	6	5	9	9	9	8	9	8	9	X	9	9	9	9	9
	0,1	4	5	3	4	3	8	8	9	8	9	X	9	X	9	8	9	7	9
	0,025	2	4	1	2	2	7	8	7	2	4	8	9	X	9	7	9	4	9
	0,0125	2	3	1	1	1	4	7	3	X	3	7	9	X	8	6	8	3	7
292	0,4	5	7	4	6	5	9	9	9	8	9	8	9	9	9	9	9	9	9
	0,1	4	5	3	4	4	8	9	8	7	7	8	9	9	9	9	9	8	9
	0,025	2	4	1	2	2	6	8	7	5	5	8	9	9	9	7	9	5	9
	0,0125	2	3	0	1	1	4	6	5	1	3	7	9	8	8	5	8	3	9
293	0,4	3	5	3	4	4	9	9	8	8	9	9	9	9	9	9	9	8	9
	0,1	3	4	2	2	3	6	8	8	6	6	7	8	9	8	8	9	5	9
	0,025	2	3	1	1	2	6	7	2	3	3	X	8	9	6	5	6	2	8
	0,0125	1	2	0	0	0	2	4	1	1	3	5	6	5	6	2	4	0	5
294	0,4	4	6	4	5	3	9	8	9	8	9	8	9	9	9	9	9	8	9
	0,1	3	5	3	4	2	7	8	5	5	9	8	9	9	8	8	9	7	9
	0,025	3	4	1	2	1	5	7	5	4	4	8	8	6	8	6	7	5	9
	0,0125	1	3	0	2	0	4	7	X	2	3	7	8	X	7	5	6	5	8
295	0,4	3	5	2	3	3	6	9	8	6	6	8	9	8	8	6	9	7	9
	0,1	2	3	1	1	2	4	8	2	4	5	7	9	8	8	5	9	4	9
	0,025	X	2	0	0	1	X	6	2	1	5	7	8	7	7	2	6	4	8
	0,0125	0	1	0	0	0	2	6	1	0	3	6	8	7	7	1	2	1	3
296	0,4	4	3	1	2	2	7	9	9	8	9	8	9	X	8	7	9	4	9
	0,1	2	2	0	1	1	5	7	7	7	5	5	9	X	8	4	8	2	8
	0,025	1	1	0	0	0	4	3	1	X	4	5	6	X	3	2	4	1	4
	0,0125	1	0	0	0	0	4	3	1	1	3	4	6	X	X	1	1	0	3
298	0,4	5			5	4	8	9	9		9		9			9		8	9
	0,1	5			3	3	8	9	9		7		9			7		8	9
	0,025	2			1	1	X	X	5		X		X			X		3	X
	0,0125	2			1	1	5	7	5		5		8			3		2	6
299	0,4	3			3	3	8	9	9		9		9			8		8	9
	0,1	3			2	2	6	9	9		5		9			7		5	9
	0,025	2			1	1	5	9	7		5		9			5		3	7
	0,0125	2			1	1	3	7	3		3		8			2		1	5

300	0,4	3	4	4	8	9	8	9	9	8	8	9
	0,1	2	2	2	5	9	7	5	9	6	5	9
	0,025	2	1	1	3	8	6	4	8	4	2	6
	0,0125	1	0	1	1	3	1	1	8	2	1	5

X - určení nelze provést

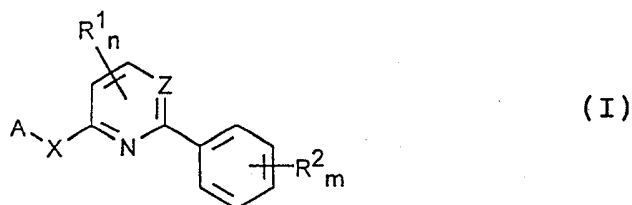
T a b u l k a X V I I

Účinnost sloučenin podle vynálezu při postemergentní aplikaci

Příklad	Dávka [kg/ha]	G L X M A	H O R Y V W	O R Y S A W	T R Z A M W X	Z E A M X	A B U T H	A M B L	C A S O B	G A L O P E	I P O H E	L A M P I N	M A T E M P E	S V E R E E	A L O M Y	D I O S A	E C H S G I	S E T V I	
218	0,4	8	5	6	5	4	8	8	6	8	9	8	9		9	8	8	8	8
	0,1	6	4	6	4	4	8	7	X	7	9	8	7		9	8	8	8	8
	0,025	6	4	5	3	3	6	6	6	6	9	8	6		9	5	7	6	6
219	0,4	7	5	6	5	5	7	6	7	8	9	8	8	8	9	8	7	8	8
	0,1	6	4	5	4	4	7	6	7	8	9	8	8	8	9	7	6	7	8
	0,025	5	4	4	3	3	6	5	6	8	9	7	7	7	9	6	4	6	7
220	0,4	7	5	6	5	5	7	7	7	8	9	8	9	8	9	9	7	8	8
	0,1	6	4	5	4	5	7	6	6	8	9	8	8	8	9	7	5	8	8
	0,025	5	4	3	3	4	6	6	6	7	9	7	7	7	9	5	3	6	7
292	0,4	7	5	6	5	5	8	7	7	8	9	8	8	9	9	8	8	8	8
	0,1	6	5	5	4	5	7	7	7	8	9	8	8	9	9	8	8	8	8
	0,025	5	4	3	3	4	6	6	7	8	9	8	7	7	9	6	6	5	6
293	0,4	5	4	5	4	5	8	8	7	8	9	8	7	9	9	8	8	8	8
	0,1	5	4	4	3	4	7	7	7	8	9	8	7	8	9	7	8	7	8
	0,025	4	3	3	3	3	5	5	7	8	5	8	7	8	9	5	5	4	6
294	0,4	7	5	6	4	5	8	8	7	8	9	9	8	9	9	8	7	8	8
	0,1	5	4	4	4	4	7	7	7	8	9	8	8	9	9	8	7	8	8
	0,025	5	4	3	3	3	5	5	6	6	5	8	7	5	9	6	6	5	7
295	0,4	5	4	2	3	3	7	6	7	6	9	8	8	6	9	5	6	5	8
	0,1	5	3	2	2	3	5	5	7	5	8	8	8	0	9	4	6	5	6
	0,025	4	2	2	2	2	4	4	6	4	6	8	5	X	9	2	4	2	4
296	0,4	6	3	4	3	3	7	7	6	8	9	8	7	9	9	5	3	4	8
	0,1	5	2	3	2	2	7	6	6	8	9	7	6	7	9	4	3	3	7
	0,025	4	2	2	2	2	4	5	5	7	5	6	4	4	8	3	3	3	5
298	0,4	5			4	5	8	8	7		9		8			9			9
	0,1	4			3	3	X	7	7		9		8			8			9
	0,025	3			2	2	6	6	5		9		7			7			9
299	0,4	6			4	3	9	8	7		9		8			9			9
	0,1	4			3	2	8	7	7		9		7			7			9
	0,025	3			2	2	5	4	7		9		7			5			9
300	0,4	4			4	3	9	8	7		9		8			9			9
	0,1	4			3	2	8	7	7		9		8			8			9
	0,025	2			2	2	5	4	6		9		7			6			8

P A T E N T O V É N Á R O K Y

1. 2,6-Disubstituované pyridiny a 2,4-disubstituované pyrimidiny obecného vzorce I



kde

A představuje popřípadě substituovanou arylskupinu nebo popřípadě substituovanou pěti- nebo šestičlennou heteroaromatickou skupinu obsahující atom dusíku nebo difluorbenzodioxolylskupinu;

m představuje celé číslo od 0 do 5;

n představuje celé číslo od 0 do 2;

R¹ při každém svém výskytu nezávisle představuje atom vodíku, atom halogenu, popřípadě substituovanou alkylskupinu, alkenylskupinu, alkynylskupinu, alkoxy skupinu, alkoxyalkoxy skupinu, alkoxyalkylskupinu, dialkoxyalkylskupinu, alkylthioskupinu, aminoskupinu, alkylaminoskupinu, dialkylaminoskupinu, alkoxyaminoskupinu nebo formamidinoskupinu;

R² při každém svém výskytu nezávisle představuje atom vodíku, atom halogenu, popřípadě substituovanou alkylskupinu, alkenylskupinu, alkynylskupinu, alkoxy skupinu, alkoxyalkylskupinu, alkoxyalkoxy skupinu, alkylthioskupinu, alkylsulfinyl, alkylsulfonyl, nitroskupinu, kyanoskupinu, halogen-

09.03.98

alkylskupinu, halogenalkoxyskupinu, halogenalkylthioskupinu nebo SF_5 ;

X představuje atom kyslíku nebo síry; a

Z představuje atom dusíku nebo skupinu CH;

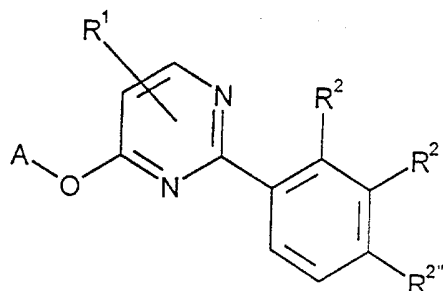
příčemž

(a) A představuje pyridylskupinu substituovanou alespoň jednou halogenalkylskupinou, halogenalkoxyskupinou nebo halogenalkylthioskupinou, když Z představuje atom dusíku; nebo

(b) m a n představují číslo 1, R^1 představuje alkylskupinu, alkoxyskupinu nebo alkylaminoskupinu vázanou v poloze 4 a R^2 představuje trifluormethylskupinu, když Z představuje skupinu CH.

2. 2,6-Disubstituované pyridiny a 2,4-disubstituované pyrimidiny podle nároku 1 obecného vzorce I, kde A představuje fenylyskupinu, pyridylskupinu nebo pyrazolylskupinu, z nichž každá je substituována jedním nebo více substituenty, které mohou být stejné nebo různé a jsou zvoleny ze souboru zahrnujícího atomy halogenu, alkylskupinu, alkoxyskupinu, halogenalkylskupinu, halogenalkoxyskupinu, halogenalkylthioskupinu a pentafluorsulfanylskupinu.

3. 2,4-Disubstituované pyrimidiny obecného vzorce IA, kde

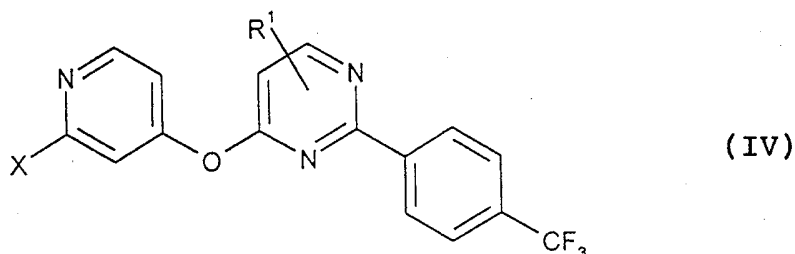


(IA)

kde A představuje 2-trifluormethylpyrid-4-ylskupinu nebo 2-difluormethoxypyrid-4-ylskupinu; R^1 má výše uvedený význam; R^2 , $R^{2'}$ a $R^{2''}$ představuje každý nezávisle atom vodíku, fluoru, chloru nebo bromu nebo jeden nebo dva z R^2 , $R^{2'}$ a $R^{2''}$ představují také trifluormethylskupinu, trifluormethoxyskupinu nebo kyanoskupinu, $R^{2''}$ může dále představovat alkylskupinu s 1 až 4 atomy uhlíku, zvláště terc.butylskupinu.

4. 2,4-Disubstituované pyrimidiny obecného vzorce

IB



kde X představuje halogenalkylskupinu, halogenalkoxyskupinu nebo halogenalkylthioskupinu a R^1 představuje atom halogenu, alkylskupinu nebo alkoxyskupinu.

5. 2,4-Disubstituované pyrimidiny obecného vzorce

IB, zvolené ze souboru zahrnujícího

6-methyl-2-(4'-trifluormethylfenyl)-4-(2''-difluormethoxy-pyrid-4''-yloxy)pyrimidin;

6-ethyl-2-(4'-trifluormethylfenyl)-4-(2''-trifluormethyl-pyrid-4''-yloxy)pyrimidin;

6-ethyl-2-(4'-trifluormethylfenyl)-4-[2''-(2,2,2-trifluor-ethyl)pyrid-4''-yloxy]pyrimidin;

6-ethyl-2-(4'-trifluormethylfenyl)-4-(2''-difluormethoxy-pyrid-4''-yloxy)pyrimidin;

6-methoxymethyl-2-(4'-trifluormethylfenyl)-4-(2"-difluor-methoxypyrid-4"-yloxy)pyrimidin;

6-methoxymethyl-2-(4'-trifluormethylfenyl)-4-[2"-(2,2,2-tri-fluorethyl)pyrid-4"-yloxy]pyrimidin;

6-methyl-2-(4'-trifluormethylfenyl)-4-[2"-(1,1,2,2-tetra-fluorethyl)pyrid-4"-yloxy]pyrimidin;

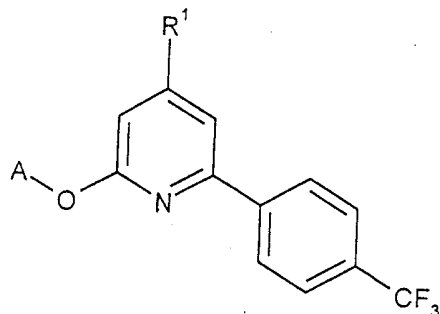
5-methyl-2-(4'-trifluormethylfenyl)-4-[2"-(1,1,2,2-tetra-fluorethyl)pyrid-4"-yloxy]pyrimidin;

6-methyl-2-(4'-trifluormethylfenyl)-4-(2"-difluormethyl-thiopyrid-4"-yloxy)pyrimidin;

5-methyl-2-(4'-trifluormethylfenyl)-4-(2"-difluormethyl-thiopyrid-4"-yloxy)pyrimidin a

6-methoxy-2-(4'-trifluormethylfenyl)-4-(2"-difluormethyl-thiopyrid-4"-yloxy)pyrimidin.

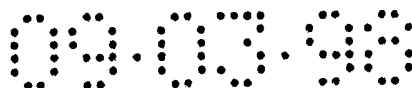
6. 2,6-Disubstituované pyridiny obecného vzorce IC



(IC)

kde R¹ představuje alkylskupinu, alkoxy skupinu nebo alkyl-aminoskupinu a A má význam uvedený v některém z předchozích nároků.

7. 2,6-Disubstituované pyridiny obecného vzorce IC, zvolené ze souboru zahrnujícího



4-ethyl-2-(4'-trifluormethylfenyl)-6-(1"-methyl-3-tri-
fluormethylpyrazol-5-yloxy)pyridin;

4-methyl-2-(4'-trifluormethylfenyl)-6-(2"-difluormethoxy-
pyrid-4"-yloxy)pyridin;

4-methyl-2-(4'-trifluormethylfenyl)-6-(2"-trifluormethyl-
pyrid-4"-yloxy)pyridin a

4-methyl-2-(4'-trifluormethylfenyl)-6-(3"-trifluormethyl-
fenyloxy)pyridin.

8. Herbicidní prostředek, v y z n a č u j í c í
s e t í m , že obsahuje alespoň jeden 2,6-disubstituovaný
pyridin nebo 2,4-disubstituovaný pyrimidin podle některého
z nároků 1 až 14 a nosič a/nebo povrchově aktivní činidlo.

9. Způsob potlačování růstu nežádoucích rostlin,
v y z n a č u j í c í s e t í m , že se na místo, kde
se má růstu zamezit, aplikuje účinné množství alespoň
jednoho 2,6-disubstituovaného pyridinu nebo 2,4-disubsti-
tuovaného pyrimidinu podle některého z nároků 1 až 14.

10. Použití účinného množství 2,6-disubstituova-
ného pyridinu nebo 2,4-disubstituovaného pyrimidinu podle
některého z nároků 1 až 14 pro potlačování růstu nežádoucích
rostlin.

01-1832-97-Če