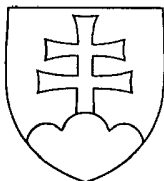


SLOVENSKÁ REPUBLIKA

(19)

SK



ÚRAD
PRIEMYSELNÉHO
VLASTNÍCTVA
SLOVENSKEJ REPUBLIKY

ZVEREJNENÁ PRIHLÁŠKA VYNÁLEZU

(21) Číslo dokumentu:

693-96

(13) Druh dokumentu: **A3**

(51) Int. Cl.⁶:

**C 07D 251/16,
C 07D 251/20,
A 01N 43/647**

(22) Dátum podania: 29.05.96

(31) Číslo prioritnej prihlášky: 08/459 868, 08/458 211,
08/459 919, 08/459 950,
08/458 639, 08/458 324,
08/458 920, 08/459 567

(32) Dátum priority: 02.06.95, 02.06.95, 02.06.95,
02.06.95, 02.06.95, 02.06.95,
02.06.95, 02.06.95

(33) Krajina priority: US, US, US, US, US, US, US, US

(40) Dátum zverejnenia: 06.08.97

(86) Číslo PCT:

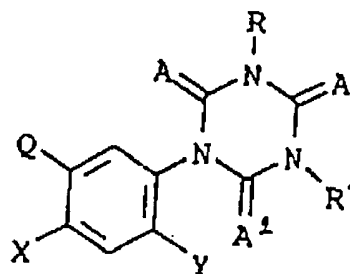
(71) Prihlasovateľ: American Cyanamid Company, Wayne, NJ, US;

(72) Pôvodca vynálezu: Crews Alvin D. jr., Voorhees, NJ, US;
Harrington Philip Mark, Cranbury, NJ, US;
Karp Gary M., Orinceton Junction, NJ, US;
Manfredi Mark Ch., Hamilton, NJ, US;
Guaciario Michael A., Hightstown, NJ, US;

(54) Názov prihlášky vynálezu: **1-(3-Heterocyklylfenyl)-s-triazín-2,4,6-oxo- alebo tiotrióny a herbicídne prostriedky na ich báze**

(57) Anotácia:

1-(3-Heterocyklylfenyl)-s-triazín-2,4,6-oxo- alebo tiotrióny všeobecného vzorca (I), kde jednotlivé všeobecné symboly majú význam uvedený v nárokoch, sú herbicídnyimi činidlami. Sú opísané tiež herbicídne prostriedky na ich báze a spôsob potlačovania nežiaducich druhov rastlín.



(I)

1-(3-Heterocyklylfenyl)-s-triazín-2,4,6-oxo- alebo tiotrióny
a herbicídne prostriedky na ich báze

Oblasť techniky

Vynález sa týka určitých 1-(3-heterocyklylfenyl)-s-triazín-2,4,6-oxo- alebo tiotriónov. Tieto zlúčeniny sú herbicídne účinné. Ďalej sa vynález týka herbicídnych prostriedkov na báze týchto zlúčenín a spôsobu potlačovania nežiadúcich druhov rastlín pomocou týchto zlúčenín a prostriedkov.

Doterajší stav techniky

Burina spôsobuje v svetovom meradle obrovské hospodárske straty tým, že znižuje úrodu a kvalitu plodín. V samotných Spojených štátoch amerických musia agronomické plodiny súťažiť so stovkami burinových rastlín.

Napriek existencii a dostupnosti veľa herbicídov naďalej dochádza k škodám na plodinách spôsobených burinovitými rastlinami. Z tohto dôvodu pokračuje výskum zameraný na vytvorenie nových a účinnejších herbicídov.

Určité heterocyklylfenylové herbicídne činidlá sú známe (pozri napríklad WO 85/01939, EP 77938-A2 a US 5 356 863). Žiadna z týchto publikácií však neopisuje heterocyklylfenylové zlúčeniny, ktoré sú substituované 1,3,5-triazín-2,4,6-triónovou skupinou.

V US patentoch č. 4 876 253 a US 4 927 824 sú opísané fungicídne 1,3,5-triazín-2,4,6-trióny. Tieto patenty však neopisujú žiadne heterocyklylfenylsubstituované 1,3,5-triazín-2,4,6-trióny a rovnako neuvádzajú herbicídne použitie týchto zlúčenín.

V EP 640600-A1 a US patente č. 4 512 797 sú opísané herbicídne 1,3,5-triazín-2,4,6-trióny. Tieto publikácie sa však netýkajú heterocyklylfenylsubstituovaných 1,3,5-triazín-2,4,6-triónových zlúčenín.

Úlohou tohto vynálezu je vyvinúť zlúčeniny, ktoré by boli vysoko účinné pri potlačovaní nežiadúcich druhov rastlín.

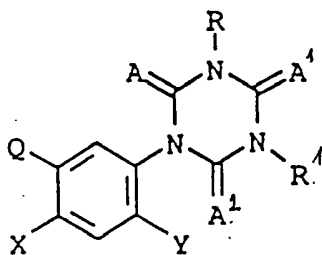
Ďalšou úlohou tohto vynálezu je vyvinúť spôsob potlačovania nežiadúcich druhov rastlín.

Tieto a ďalšie úlohy, ktoré vynález rieši, sú zrejmé z nasledujúceho podrobného opisu.

Podstata vynálezu

Predmetom vynálezu sú 1-(3-heterocyklylfenyl)-s-triazín-2,4,6-oxo- alebo tiotriónové zlúčeniny, ktoré sú užitočné ako herbicídne činidlá.

1-(3-heterocyklylfenyl)-s-triazín-2,4,6-oxo- alebo tiotriónové zlúčeniny podľa vynálezu majú štruktúru, ktorá zodpovedá všeobecnému vzorcu I



(I)

kde

X a Y predstavuje každý nezávisle atóm vodíka, atóm halogénu, nitroskupinu, kyanoskupinu, alkyl-

skupinu s 1 až 4 atómami uhlíka, halogénalkylskupinu s 1 až 4 atómami uhlíka, alkoxy skupinu s 1 až 4 atómami uhlíka, halogénalkoxy skupinu s 1 až 4 atómami uhlíka alebo skupinu vzorca $S(O)_m R^2$;

m predstavuje celé číslo 0, 1 alebo 2;

R^2 predstavuje alkylskupinu s 1 až 4 atómami uhlíka alebo halogénalkylskupinu s 1 až 4 atómami uhlíka;

R predstavuje atóm vodíka, alkylskupinu s 1 až 6 atómami uhlíka, alkoxyalkylskupinu s 2 až 12 atómami uhlíka, alkylkarbonylalkylskupinu s 3 až 12 atómami uhlíka, halogénalkylkarbonylalkylskupinu s 3 až 12 atómami uhlíka, alkoxykarbonylalkylskupinu s 3 až 12 atómami uhlíka, halogénalkoxykarbonylalkylskupinu s 3 až 12 atómami uhlíka, alkenylskupinu s 3 až 6 atómami uhlíka, alkynylskupinu s 3 až 6 atómami uhlíka, atóm alkalického kovu, fenylskupinu, ktorá je prípadne substituovaná jedným až tromi substituentmi zvolenými zo súboru zahŕňajúceho atóm halogénu, alkylskupinu s 1 až 4 atómami uhlíka, alkoxy skupinu s 1 až 4 atómami uhlíka a halogénalkoxy skupinu s 1 až 4 atómami uhlíka, alebo

benzylskupinu, ktorá je prípadne substituovaná jedným až tromi substituentmi zvolenými zo súboru zahŕňajúceho atóm halogénu, alkylskupinu s 1 až 4 atómami uhlíka, alkoxy skupinu s 1 až 4 atómami uhlíka a halogénalkoxy skupinu s 1 až 4 atómami uhlíka;

- R^1 predstavuje atóm vodíka, alkenylskupinu s 3 až 6 atómami uhlíka, alkinylskupinu s 3 až 6 atómami uhlíka, kyanoskupinu,
- alkylskupinu s 1 až 12 atómami uhlíka, ktorá je prípadne substituovaná jedným alebo viacerými atómami halogénu alebo jedným substituentom zvoleným zo súboru zahŕňajúceho kyanoskupinu, skupinu vzorca $C(O)R^3$, $C(W)R^4$, $OC(O)R^5$, $CH_2OC(O)R^5$, OR^4 , CH_2OR^4 a $CR^6(OR^7)_2$ alebo jednou fenylskupinou, ktorá je prípadne substituovaná jedným až tromi substituentmi zvolenými zo súboru zahŕňajúceho atóm halogénu, alkylskupinu s 1 až 4 atómami uhlíka, alkoxyskupinu s 1 až 4 atómami uhlíka a halogénalkoxyskupinu s 1 až 4 atómami uhlíka, alebo
- fenylskupinu, ktorá je prípadne substituovaná jedným až tromi substituentmi zvolenými zo súboru zahŕňajúceho atóm halogénu, alkylskupinu s 1 až 4 atómami uhlíka, alkoxyskupinu s 1 až 4 atómami uhlíka a halogénalkoxyskupinu s 1 až 4 atómami uhlíka;
- R^3 predstavuje hydroxyskupinu alebo skupinu vzorca OR^8 , SR^8 alebo NR^9R^{10} ;
- W predstavuje atóm kyslíka alebo skupinu vzorca NOR^9 , $NCOR^9$ alebo $NNHCONH_2$;
- R^4 , R^5 a R^6 predstavuje každý nezávisle atóm vodíka, alkylskupinu s 1 až 4 atómami uhlíka alebo halogénalkylskupinu s 1 až 4 atómami uhlíka;
- R^7 predstavuje alkylskupinu s 1 až 4 atómami uhlíka;

R⁸

predstavuje alkylskupinu s 1 až 6 atómami uhlíka, ktorá je prípadne substituovaná substituentom zvoleným zo súboru zahrňajúceho alkoxyskupinu s 1 až 4 atómami uhlíka, alkyltioskupinu s 1 až 4 atómami uhlíka, atóm halogénu, hydroxyskupinu, cykloalkylskupinu s 3 až 6 atómami uhlíka, furylskupinu a fenylskupinu, ktorá je prípadne substituovaná jedným alebo viacerými substituentmi zvolenými zo súboru zahrňajúceho atóm halogénu, kyanoskupinu, nitroskupinu, alkylskupinu s 1 až 4 atómami uhlíka, halogénalkylskupinu s 1 až 4 atómami uhlíka, alkoxyskupinu s 1 až 4 atómami uhlíka a halogénalkoxyskupinu s 1 až 4 atómami uhlíka,

alkenylskupinu s 3 až 6 atómami uhlíka, ktorá je prípadne substituovaná substituentom zvoleným zo súboru zahrňajúceho alkoxyskupinu s 1 až 4 atómami uhlíka, atóm halogénu, cykloalkylskupinu s 3 až 6 atómami uhlíka a fenylskupinu, ktorá je prípadne substituovaná jedným alebo viacerými substituentmi zvolenými zo súboru zahrňajúceho atóm halogénu, kyanoskupinu, nitroskupinu, alkylskupinu s 1 až 4 atómami uhlíka, halogénalkylskupinu s 1 až 4 atómami uhlíka, alkoxyskupinu s 1 až 4 atómami uhlíka a halogénalkoxyskupinu s 1 až 4 atómami uhlíka,

alkinylskupinu s 3 až 6 atómami uhlíka, ktorá je prípadne substituovaná alkoxyskupinou s 1 až 4 atómami uhlíka alebo atómom halogénu;

cykloalkylskupinu s 3 až 6 atómami uhlíka,

skupinu vzorca $N=C(R^4R^5)$ alebo

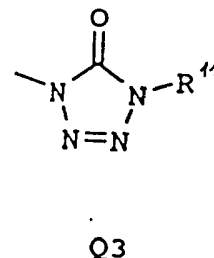
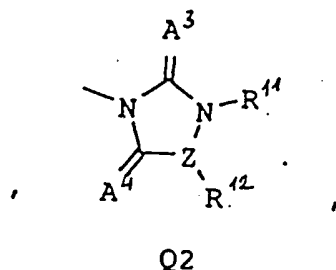
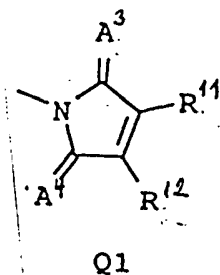
atóm alkalického kovu, kovu alkalických zemín,
mangánu, medi, zinku, kobaltu, striebra, niklu,
amónny alebo organoamóniový kation;

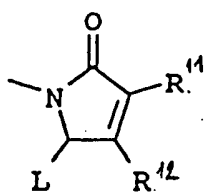
R^9 a R^{10} predstavuje každý nezávisle vždy atóm vodíka,
alkylskupinu s 1 až 6 atómami uhlíka,

benzylskupinu, ktorá je prípadne substituovaná jed-
ným alebo viacerými substituentmi zvolenými zo
súboru zahŕňajúceho atóm halogénu, kyanoskupinu,
nitroskupinu, alkylskupinu s 1 až 4 atómami
uhlíka, halogénalkylskupinu s 1 až 4 atómami
uhlíka, alkoxykupinu s 1 až 4 atómami uhlíka
a halogénalkoxykupinu s 1 až 4 atómami uhlíka,
alebo

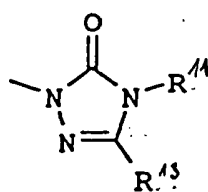
fenylskupinu, ktorá je prípadne substituovaná jed-
ným alebo viacerými substituentmi zvolenými zo
súboru zahŕňajúceho atóm halogénu, kyanoskupinu,
nitroskupinu, alkylskupinu s 1 až 4 atómami
uhlíka, halogénalkylskupinu s 1 až 4 atómami
uhlíka, alkoxykupinu s 1 až 4 atómami uhlíka
a halogénalkoxykupinu s 1 až 4 atómami uhlíka;

Q predstavuje skupinu vzorca Q1 až Q32

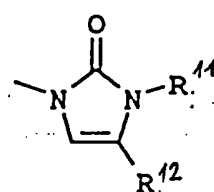




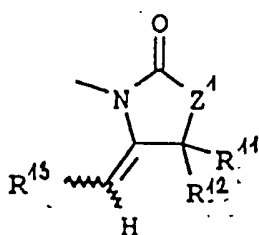
Q4



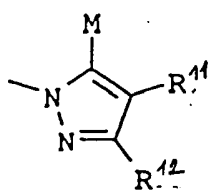
Q5



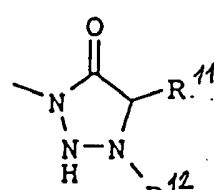
Q6



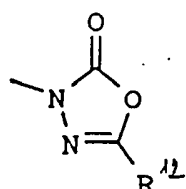
Q7



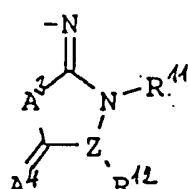
Q8



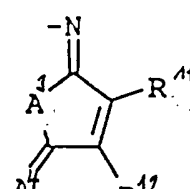
Q9



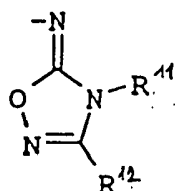
Q10



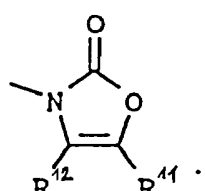
Q11



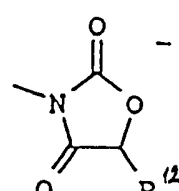
Q12



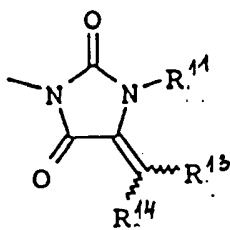
Q13



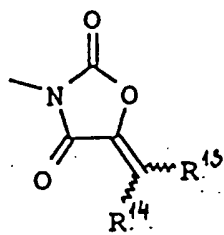
Q14



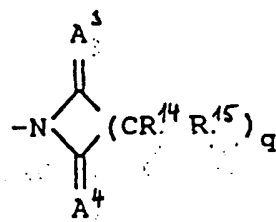
Q15



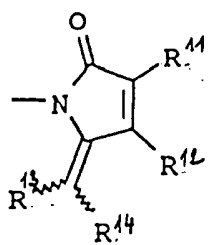
Q16



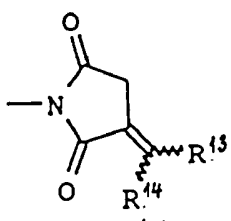
Q17



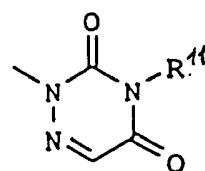
Q18



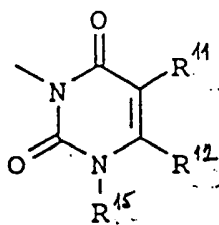
Q19



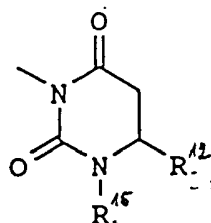
Q20



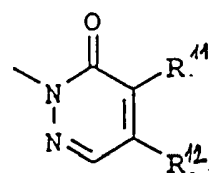
Q21



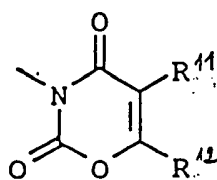
Q22



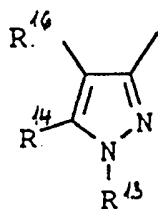
Q23



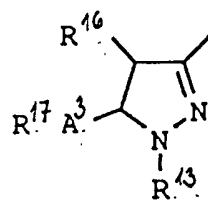
Q24



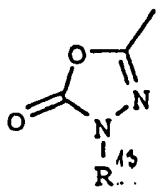
Q25



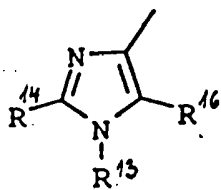
Q26



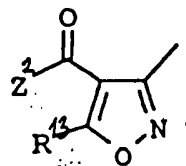
Q27



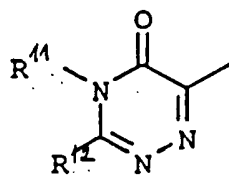
Q28



Q29

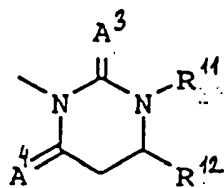


Q30



Q31

alebo



Q32

R^{11} a R^{12} predstavuje nezávisle vždy

atóm vodíka,

alkylskupinu s 1 až 6 atómami uhlíka, ktorá je prípadne substituovaná jedným alebo viacerými atómami halogénu, alebo

cykloalkylskupinu s 3 až 6 atómami uhlíka, ktorá je prípadne substituovaná jedným alebo viacerými atómami halogénu, a ďalej tiež

R^{11} a R^{12} dohromady s atómami, ku ktorým sú pripojené, predstavujú štvor- až sedemčlenný nasýtený alebo nenasýtený kruh, ktorý je prípadne prerušený atómom kyslíka, $S(O)_r$ alebo atómom dusíka a ktorý je prípadne substituovaný jednou až tromi metylskupinami alebo jedným alebo viacerými atómami halogénu;

- R^{13} , R^{14} a R^{15} predstavuje nezávisle vždy atóm vodíka, alkylskupinu s 1 až 3 atómami uhlíka alebo halogénalkylskupinu s 1 až 3 atómami uhlíka;
- R^{16} predstavuje atóm vodíka alebo halogénu;
- R^{17} predstavuje alkylskupinu s 1 až 4 atómami uhlíka alebo halogénalkylskupinu s 1 až 4 atómami uhlíka;
- A , A^1 , A^2 , A^3 a A^4 predstavuje nezávisle vždy atóm kyslíka alebo síry;
- L predstavuje hydroxyskupinu, atóm halogénu, alkoxy-skupinu s 1 až 3 atómami uhlíka alebo alkyltioskupinu s 1 až 3 atómami uhlíka;
- M predstavuje atóm halogénu alebo alkylskupinu s 1 až 3 atómami uhlíka;
- Z predstavuje atóm dusíka alebo skupinu CH ;
- Z^1 predstavuje skupinu NR^9 alebo atóm kyslíka;
- Z^2 predstavuje skupinu OR^7 alebo NR^9R^{10} ;
- r predstavuje celé číslo 0, 1 alebo 2; a
- q predstavuje celé číslo 2, 3 alebo 4.

Predmetom vynálezu sú ďalej tiež herbicídne prostriedky na báze hore uvedených zlúčenín a spôsoby použitia týchto zlúčenín a prostriedkov. Zistilo sa, že zlúčeniny podľa tohto vynálezu a prostriedky na ich báze sa hodia na potlačovanie nežiadúcich druhov rastlín. Zlúčeniny podľa

vynálezu sú osobitne užitočné pre selektívne potlačovanie nežiadúcich druhov rastlín v prítomnosti plodín.

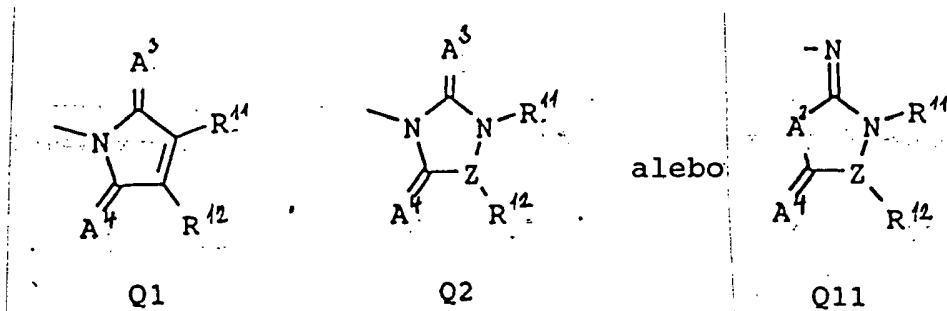
Ďalším predmetom vynálezu je spôsob potlačovania nežiadúcich druhov rastlín, ktorého podstata spočíva v tom, že sa na listy týchto rastlín alebo na pôdu alebo do vody obsahujúcej semená alebo iné rozmnožovacie orgány týchto rastlín aplikuje herbicídne účinné množstvo 1-(3-heterocyklylfenyl)-s-triazín-2,4,6-oxo- alebo tiotriónovej zlúčeniny všeobecného vzorca I.

Prednosť sa venuje zlúčeninám podľa vynálezu všeobecného vzorca I, kde

- X predstavuje atóm vodíka alebo halogénu;
- Y predstavuje atóm vodíka, atóm halogénu, nitroskupinu alebo kyanoskupinu;
- R predstavuje atóm vodíka, alkylskupinu s 1 až 4 atómami uhlíka, alkoxy-metyl-skupinu s 1 až 4 atómami uhlíka v alkoxylovej časti, alkoxykarbonyl-metyl-skupinu s 1 až 4 atómami uhlíka v alkoxylovej časti, alkenylskupinu s 3 až 6 atómami uhlíka alebo alkynylskupinu s 3 až 6 atómami uhlíka;
- R¹ predstavuje atóm vodíka, alkenylskupinu s 3 až 6 atómami uhlíka, alkynylskupinu s 3 až 6 atómami uhlíka alebo alkylskupinu s 1 až 6 atómami uhlíka, ktorá je prípadne substituovaná jednou skupinou C(O)R³;
- R³ predstavuje hydroxyskupinu alebo skupinu OR⁸;

R^8 predstavuje alkylskupinu s 1 až 6 atómami uhlíka alebo atóm alkalického kovu alebo amónny alebo organoamóniový katión;

Q predstavuje skupinu všeobecného vzorca Q1, Q2 alebo Q11



R^{11} a R^{12} dohromady s atómami, ku ktorým sú pripojené, tvoria kruh, v ktorom zoskupenie $R^{11}R^{12}$ predstavuje alkylenskupinu s 2 až 5 atómami uhlíka, ktorá je prípadne prerušená zvyškom $S(O)_r$ a ktorá je prípadne substituovaná jednou až tromi metylskupinami alebo jedným alebo viacerými atómami halogénu, alebo $R^{11}R^{12}$ predstavuje skupinu $-CR^{18}=CR^{19}-CR^{20}=CR^{21}-$, kde R^{18} , R^{19} , R^{20} a R^{21} predstavuje každý nezávisle atóm vodíka, atóm halogénu alebo metylskupinu;

A, A^1 a A^2 predstavuje každý atóm kyslíka;

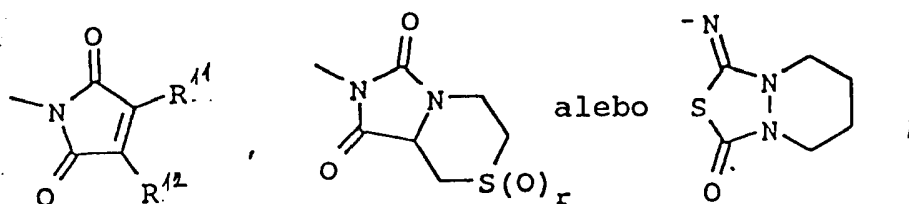
A^3 a A^4 predstavuje každý nezávisle atóm kyslíka alebo síry;

Z predstavuje atóm dusíka alebo skupinu CH;

r predstavuje celé číslo 0, 1 alebo 2.

Väčšia prednosť sa ako herbicídny činidlám venuje zlúčeninám podľa vynálezu všeobecného vzorca I, kde

- X a Y predstavuje každý nezávisle atóm vodíka, fluóru alebo chlóru;
- R predstavuje atóm vodíka, alkylskupinu s 1 až 4 atómami uhlíka, alkoxymetyl skupinu s 1 až 4 atómami uhlíka v alkoxyllovej časti, alkoxykarbonylmetyl skupinu s 1 až 4 atómami uhlíka v alkoxyllovej časti, alylskupinu alebo propargylskupinu;
- R¹ predstavuje alylskupinu, propargylskupinu alebo alkylskupinu s 1 až 4 atómami uhlíka, ktorá je prípadne substituovaná jednou skupinou C(O)R³;
- R³ predstavuje hydroxyskupinu alebo skupinu OR⁸;
- R⁸ predstavuje alkylskupinu s 1 až 6 atómami uhlíka;
- Q predstavuje skupinu vzorca



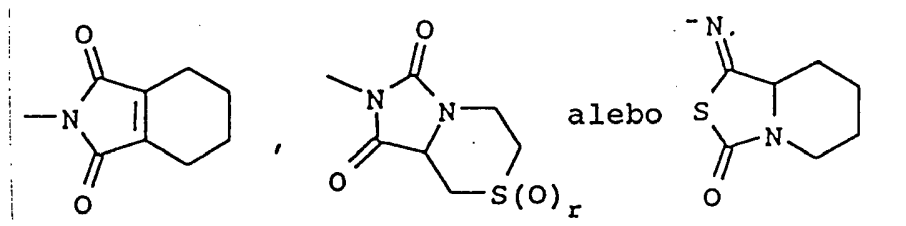
R¹¹ a R¹² dohromady s atómami, ku ktorým sú pripojené, tvoria kruh, v ktorom zoskupenie R¹¹R¹² predstavuje butylénskupinu, ktorá je prípadne substituovaná jednou až tromi metylskupinami;

A, A¹ a A² predstavuje každý atóm kyslíka; a

r predstavuje celé číslo 0 alebo 1.

Najväčšia prednosť sa ako zlúčeninám osobitne vhodným na potlačovanie nežiadúcich druhov rastlín venuje zlúčeninám podľa vynálezu všeobecného vzorca I, kde

- X predstavuje atóm fluóru alebo chlóru;
- Y predstavuje atóm chlóru;
- R predstavuje alkylskupinu s 1 až 4 atómami uhlíka, alylskupinu alebo propargylskupinu;
- R¹ predstavuje skupinu vzorca CH₂CO₂R⁸;
- R⁸ predstavuje alkylskupinu s 1 až 4 atómami uhlíka;
- Q predstavuje skupinu vzorca



A, A¹ a A² predstavuje každý atóm kyslíka; a

r predstavuje celé číslo 0 alebo 1.

Ako 1-(3-Heterocyklylfenyl)-s-triazín-2,4,6-oxotriónové zlúčeniny podľa vynálezu, ktoré sú osobitne účinnými herbicídnymi činidlami, je možné tiež uviesť:

izopropyl 3-{2-chlór-4-fluór-5-[5,6,8,8a-tetrahydro-1,3-dioxo-1H-imidazo[5,1-c][1,4]tiazín-2(3H)-yl]fenyl}tetrahydro-5-metyl-2,4,6-trioxo-s-triazín-1(2H)-acetát;

izopropyl-3-{2-chlór-4-fluór-5-[(tetrahydro-3-oxo-1H,3H-[1,3,4]tiadiazolo[3,4-a]pyridazín-1-ylidén)amino]fenyl}-tetrahydro-5-metyl-2,4,6-trioxo-s-triazín-1(2H)-acetát;

izopropyl-3-[2-chlór-4-fluór-5-(tetrahydro-1,3,7-trioxo-1H-imidazo[5,1-c][1,4]tiazín-2(3H)-yl)fenyl]tetrahydro-5-metyl-2,4,6-trioxo-s-triazín-1(2H)-acetát;

izopropyl-3-[2-chlór-4-fluór-5-(3-fluórftalimido)fenyl]-tetrahydro-5-metyl-2,4,6-trioxo-s-triazín-1(2H)-acetát;

terc.butyl-3-[2-chlór-5-(1-cyklohexén-1,2-dikarboximido)-4-fluórfenyl]tetrahydro-5-metyl-2,4,6-trioxo-s-triazín-1(2H)-acetát;

izopropyl-3-[2-chlór-5-(1-cyklohexén-1,2-dikarboximido)-4-fluórfenyl]tetrahydro-5-metyl-2,4,6-trioxo-s-triazín-1(2H)-acetát a

metyl-3-[2-chlór-5-(1-cyklohexén-1,2-dikarboximido)-4-fluórfenyl]tetrahydro-5-metyl-2,4,6-trioxo-s-triazín-1(2H)-acetát.

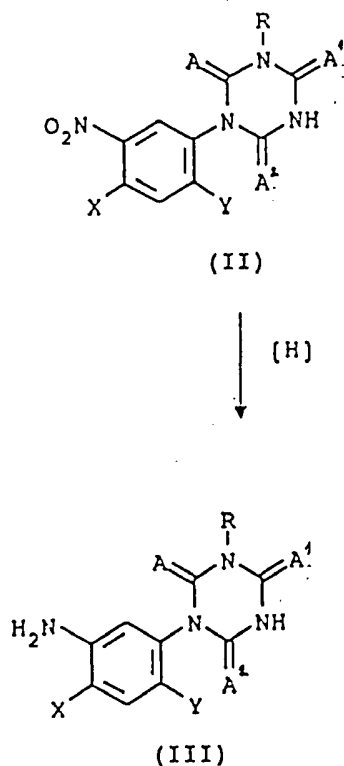
Ako halogén je napríklad možné uviesť fluór, chlór, bróm alebo jód. Do rozsahu pojmu "halogénalkylskupina s 1 až 4 atómami uhlíka", ako sa používa v opise aj nárokoch, spadajú alkylskupiny s 1 až 4 atómami uhlíka, ktoré sú substituované jedným alebo viacerými atómami halogénu. Uvedená definícia analogicky platí tiež pre pojem "halogénalkylskupina s 1 až 3 atómami uhlíka" a "halogénalkoxyskupina s 1 až 4 atómami uhlíka". Vo všeobecnom vzorci I uvedenom hore sa pod pojmom "alkalický kov" rozumie sodík, draslík a lítium, pod pojmom "kovy alkalických zemín" sa rozumie horčík a vápnik. Ďalej sa pod pojmom "organoamónium" rozumie kladne nabitý atóm dusíka, ku ktorému sú pripojené 1 až 4

alifatické skupiny, z ktorých každá obsahuje 1 až 16 atómov uhlíka.

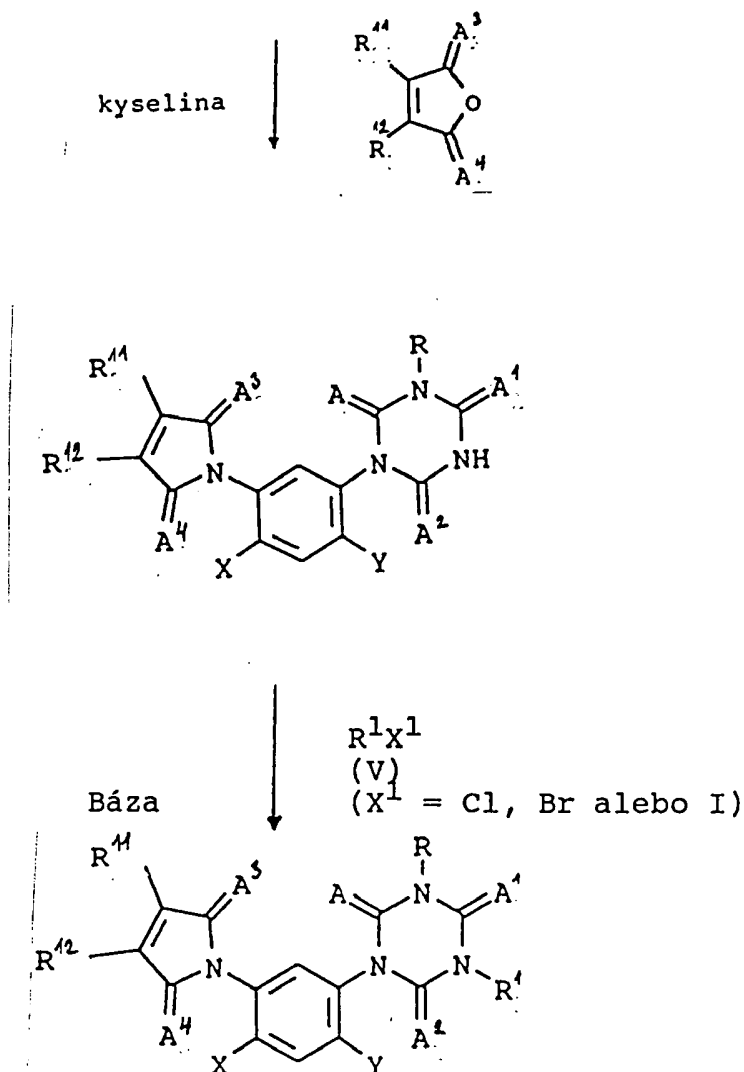
Teraz sa zistilo, že niektoré zlúčeniny podľa vynálezu sú osobitne užitočné pre selektívne potlačovanie nežiadúcich druhov rastlín v prítomnosti dôležitých poľnohospodárskych plodín.

Zlúčeniny všeobecného vzorca I, kde Q predstavuje skupinu vzorca Q1 je možné vyrobiť redukciou 3-(3-nitrofenyl)-s-triazín-2,4,6-oxo- alebo tiotriónovej zlúčeniny vzorca II za štandardných podmienok, ako je katalytická hydrogenácia alebo chemická redukcia za vzniku amínu vzorca III. Amín vzorca III sa nechá reagovať s anhydridom vzorca IV, prednostne za zvýšenej teploty v prítomnosti kyseliny, ako kyseliny octovej, čím sa získa zlúčenina všeobecného vzorca I, kde R^1 predstavuje atóm vodíka, ktorú je možné alkylovať alkylačným činidlom vzorca V v prítomnosti bázy na zlúčeninu všeobecného vzorca I, kde R^1 je rôzny od vodíka. Táto reakčná sekvencia je ilustrovaná v schéme I.

S c h é m a I

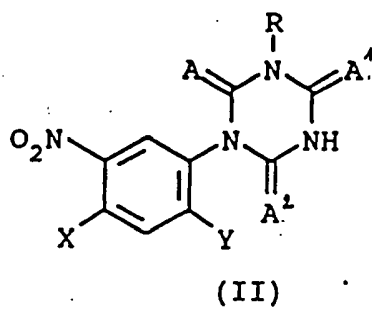


S c h é m a I - pokračovanie



Alternatívne je zlúčeniny všeobecného vzorca I, kde Q predstavuje skupinu Q1 a R^1 nepredstavuje atóm vodíka, možné vyrobiť alkyláciou 3-(3-nitrofenyl)-s-triazín-2,4,6-oxo- alebo tiotriónovej zlúčeniny vzorca II alkylačným či-nidlom vzorca V v prítomnosti bázy. Vzniknutá 3-(3-nitrofenyl)-s-triazín-2,4,6-oxo- alebo tiotriónová zlúčenina vzorca VI sa redukuje za štandardných podmienok na amín vzorca VII, ktorý sa nechá reagovať s anhydridom vzorca IV, prednostne za zvýšenej teploty a v prítomnosti kyseliny, ako je kyselina octová. Táto reakčná sekvencia je ilustrovaná v schéme II.

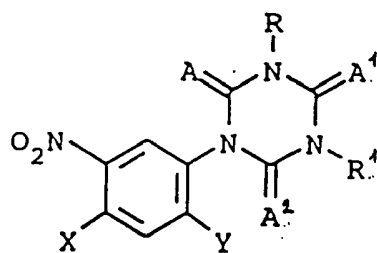
Schéma I I



Báza

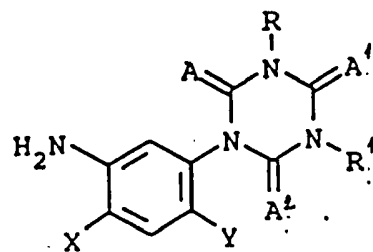
R^1X^1
(V)

($X^1 = Cl, Br \text{ alebo } I$)

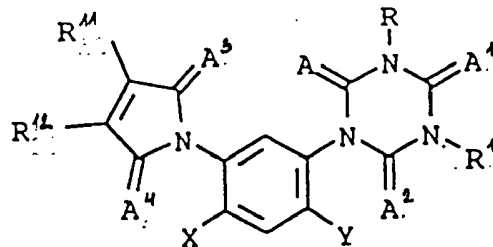
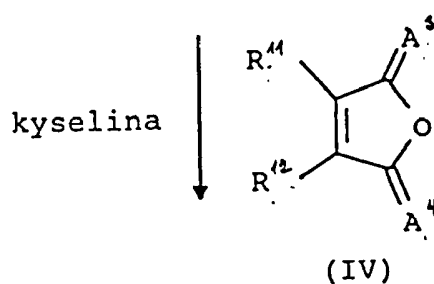


[H]

S c h é m a I I - pokračovanie



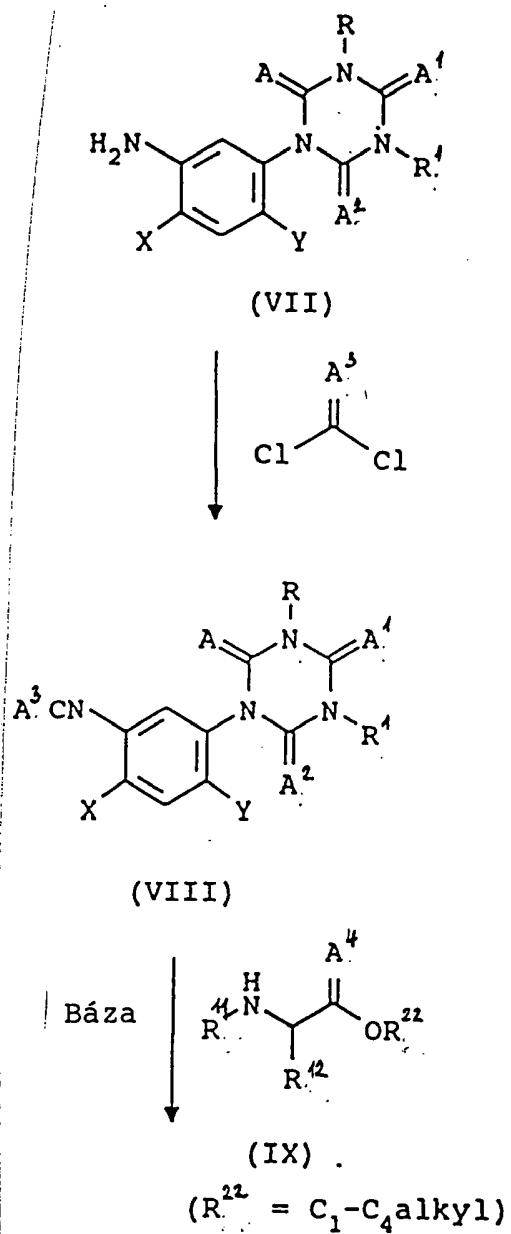
(VII)



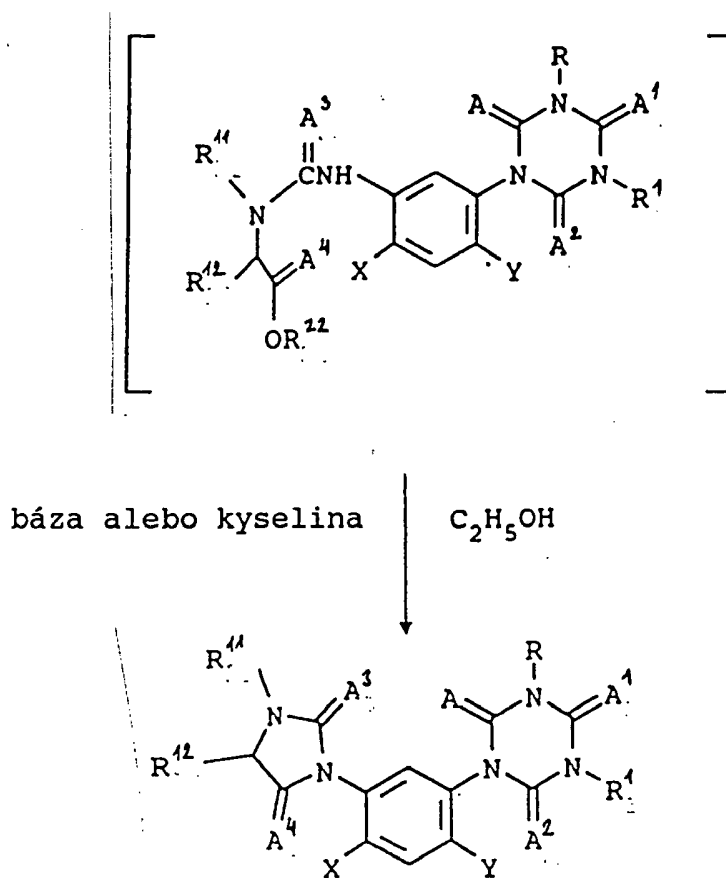
Zlúčeniny všeobecného vzorca I, kde Q predstavuje skupinu vzorca Q2 a Z predstavuje CH, je možné vyrobiť reakciou amínu vzorca VII s fosgénom alebo tiofosgénom v prítomnosti inertného rozpúšťadla. Vzniknutý izokyanát alebo tioizokyanát vzorca VIII sa nechá reagovať s aminoesterom vzorca IX v prítomnosti bázy, ako trietylaminu. Výsledná intermediárna zlúčenina sa cyklizuje pôsobením kyseliny alebo bázy v prítomnosti inertného organického rozpúšťadla,

ako etanolu. Táto reakčná sekvencia je ilustrovaná v schéme III.

S c h é m a I I I

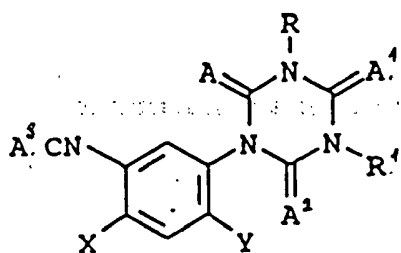


S c h é m a I I I - pokračovanie

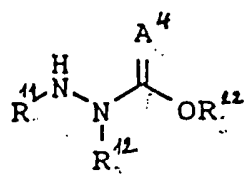


Zlúčeniny všeobecného vzorca I, kde Q predstavuje skupinu Q2 a Z predstavuje atóm dusíka, je možné vyrobiť reakciou izokyanátu alebo tioizokyanátu vzorca VIII so substituovaným hydrazínom vzorca X za vzniku intermediárnej zlúčeniny. Táto intermediárna zlúčenina sa cyklizuje pôsobením bázy. Táto reakčná sekvencia je ilustrovaná v schéme IV.

Schéma IV

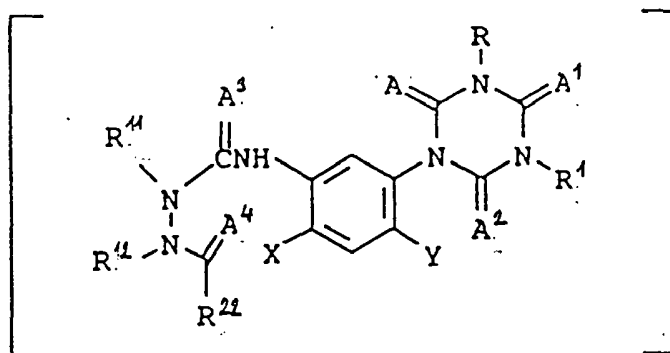


(VIII)

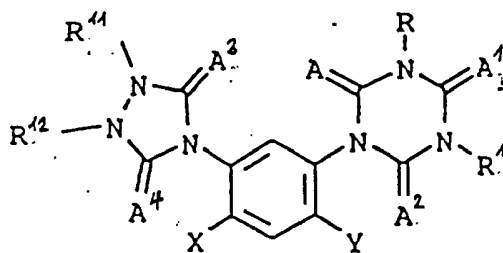


(X)

(R²² = C₁-C₄ alkyl)

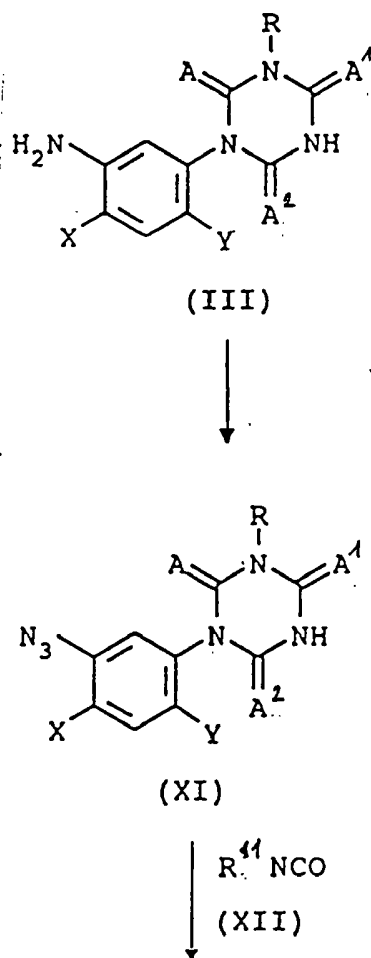


Báza

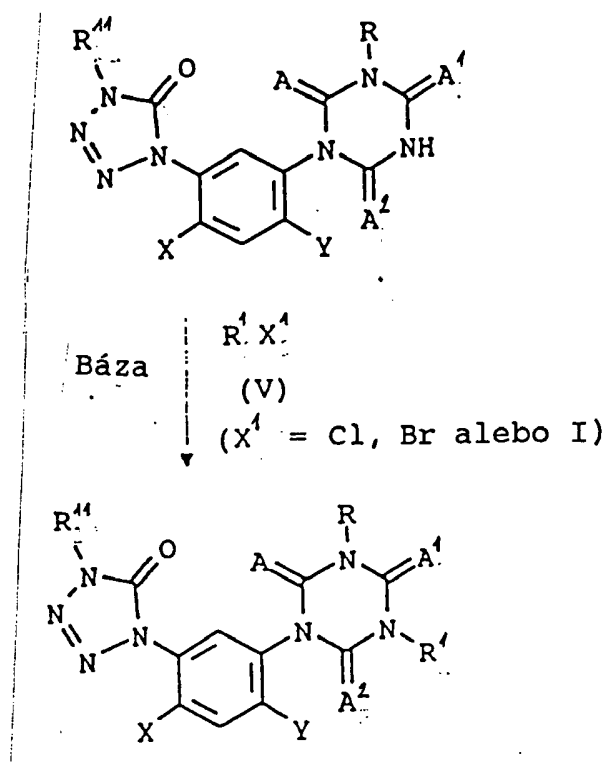


Zlúčeniny všeobecného vzorca I, kde Q predstavuje skupinu Q3, je možné vyrobiť reakciou amínu vzorca III s dusitanom sodným, azidom sodným, kyselinou octovou, kyselinou chlorovodíkovou a octanom sodným alebo dusitanom sodným, hydrátom hydrazínu a kyselinou octovou, za vzniku azidu vzorca XI. Azid vzorca XI sa nechá reagovať s izokyanátom vzorca XII na požadovanú zlúčeninu všeobecného vzorca I, kde R^1 predstavuje atóm vodíka. Zlúčeninu všeobecného vzorca I, kde R^1 predstavuje atóm vodíka, je prípadne možné alkylovať alkylačným činidlom vzorca V v prítomnosti báza. Táto reakčná sekvencia je ilustrovaná v schéme V.

S c h é m a V



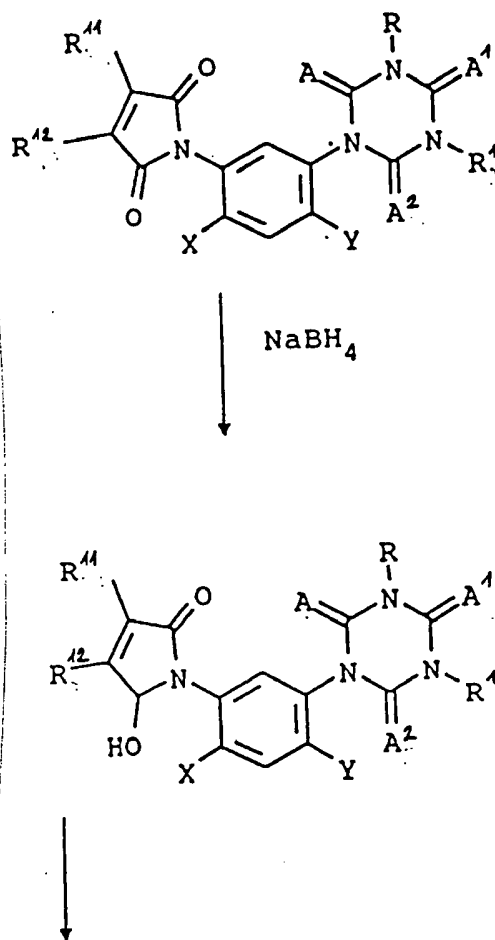
S c h é m a V - pokračovanie



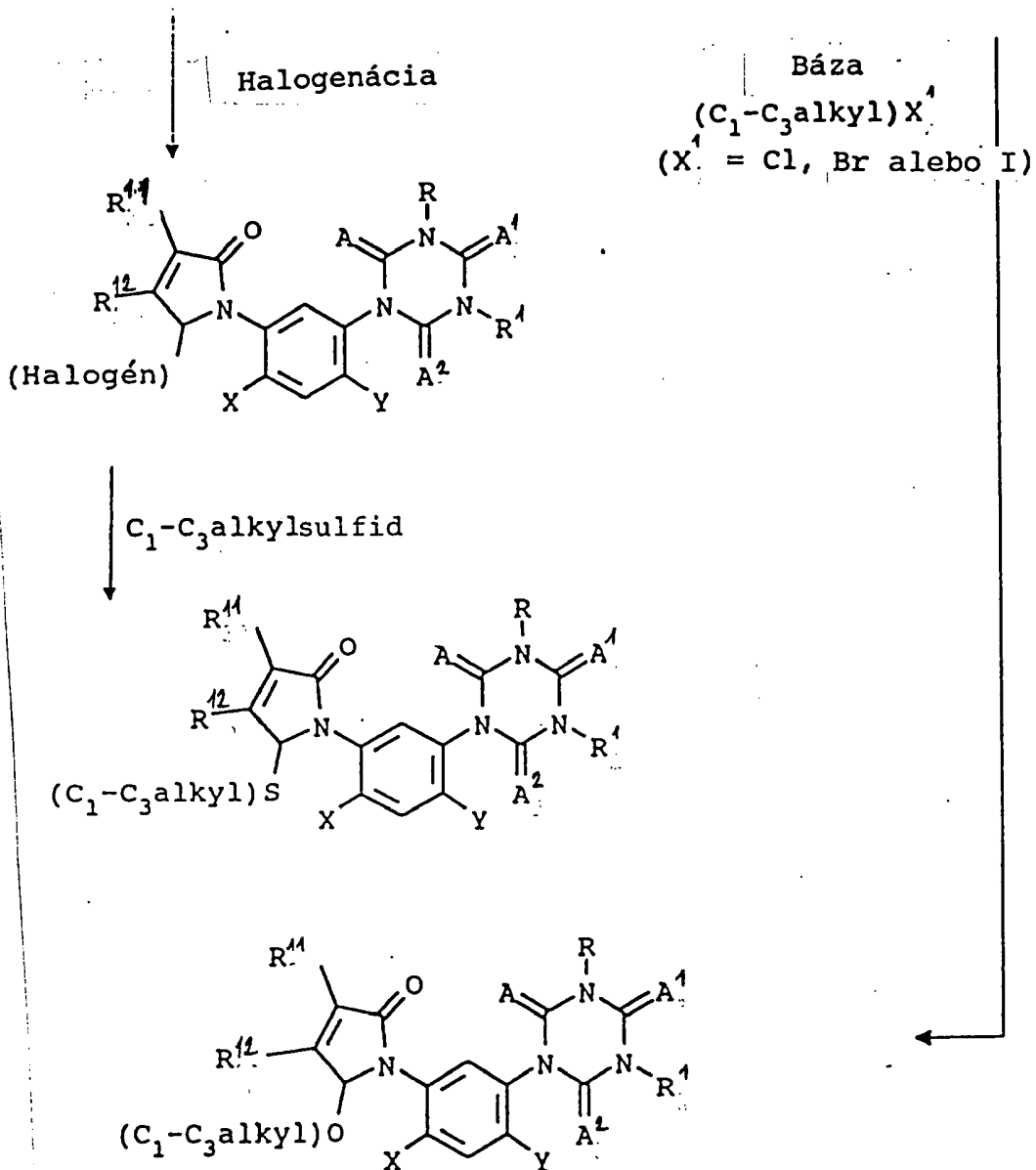
Zlúčeniny všeobecného vzorca I, kde Q predstavuje skupinu Q4, je možné vyrobiť reakciou zlúčeniny vzorca I, kde Q predstavuje skupinu Q1 a A³ a A⁴ predstavujú atómy kyslíka, reakciou tetrahydroboritanu sodného za vzniku zlúčeniny, kde L predstavuje hydroxyskupinu. Táto zlúčenina sa nechá reagovať s bázou a vhodným alkylačným činidlom, čím sa získa zlúčenina, kde L predstavuje alkoxyskupinu s 1 až 3 atómami uhlíka, alebo sa zlúčenina, kde L predstavuje hydroxyskupinu, nechá reagovať s halogenačným činidlom, ako chloridom fosforitým, tionylchloridom, bromidom fosforitým, zmesou trifenyľfosfínu a brómu, jodidom fosforitým alebo zmesou trifenyľfosfínu a jódu, v inertnom rozpúšťadle, ako chloroformu. Získa sa zlúčenina, kde L predstavuje atóm halogénu, ktorá sa ďalej nechá reagovať s alkylsulfidom s 1 až 3 atómami uhlíka na zlúčeninu, kde L predstavuje

alkyltioskupinu s 1 až 3 atómy uhlíka. Tieto reakčné sekvencie sú ilustrované v schéme VI.

S c h é m a V I



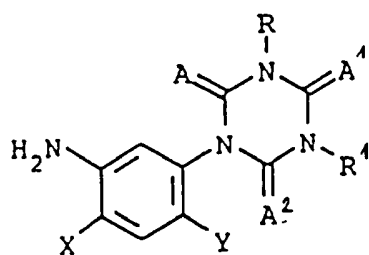
S c h é m a V I - pokračovanie



Zlúčeniny všeobecného vzorca I, kde Q predstavuje skupinu Q5, je možné vyrobiť diazotáciou amínu vzorca VII pri použití štandardných postupov. Vznikne intermediárna zlúčenina, ktorá sa redukuje siričitanom sodným na hydrazín vzorca XIV. Hydrazín sa potom nechá reagovať s imino-

éterom vzorca XV na amidrazón vzorca XVI. Amidrazón vzorca XVI sa nechá reagovať s fosgénom alebo vhodným ekvivalentom fosgénu, prípadne v prítomnosti trietylamínu, za vzniku požadovanej zlúčeniny. Táto reakčná sekvencia je ilustrovaná v schéme VII.

S c h é m a V I I

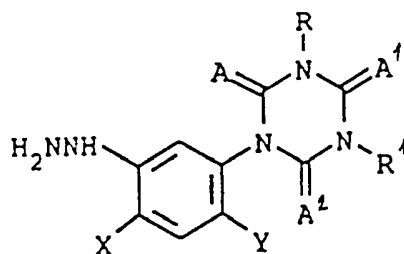


(VII)

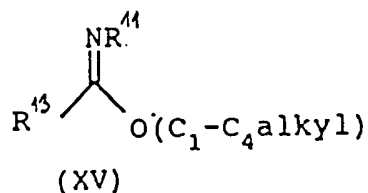


1) Diazotácia

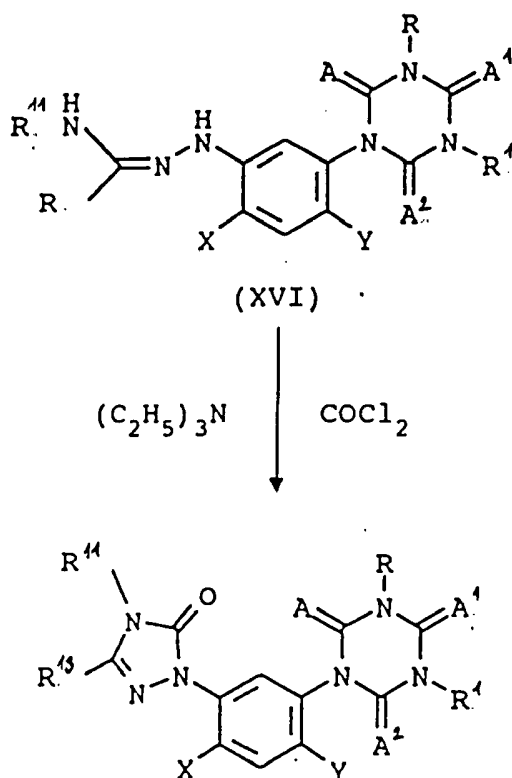
2) Na_2SO_3



(XIV)

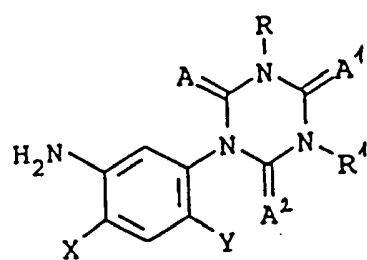


S c h é m a V I I - pokračovanie



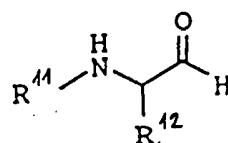
Zlúčeniny všeobecného vzorca I, kde Q predstavuje skupinu Q6, je možné pripraviť kondenzáciou amínu vzorca VII s β -aminoaldehydom vzorca XVII v prítomnosti bázy. Vzniknutá intermediárna zlúčenina sa nechá reagovať s fosgénom alebo ekvivalentom fosgénu. Táto reakčná sekvencia je ilustrovaná v schéme VIII.

Schéma VIII

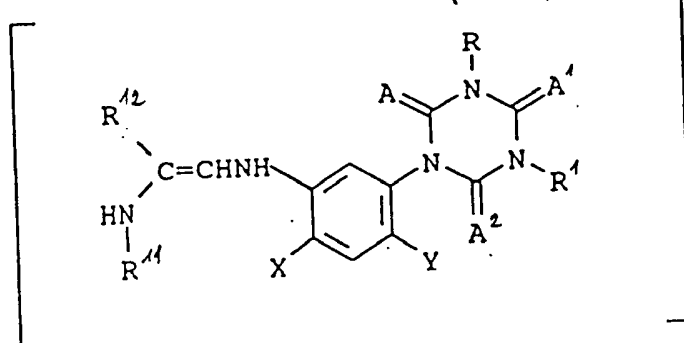


(VII)

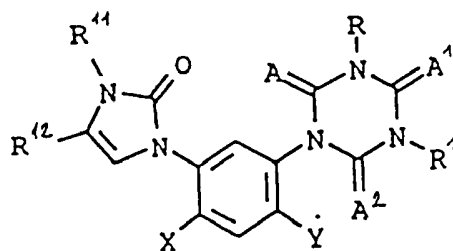
Báza



(XVII)

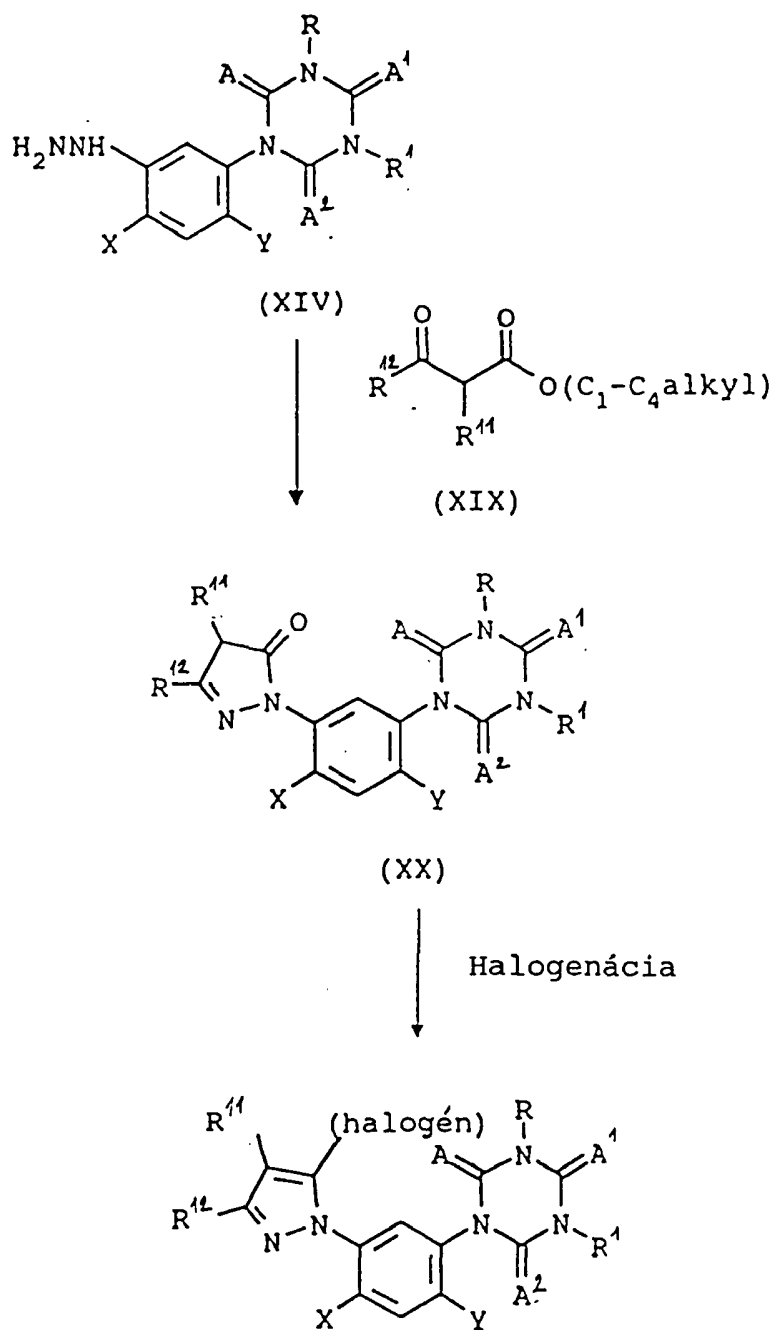


COCl_2



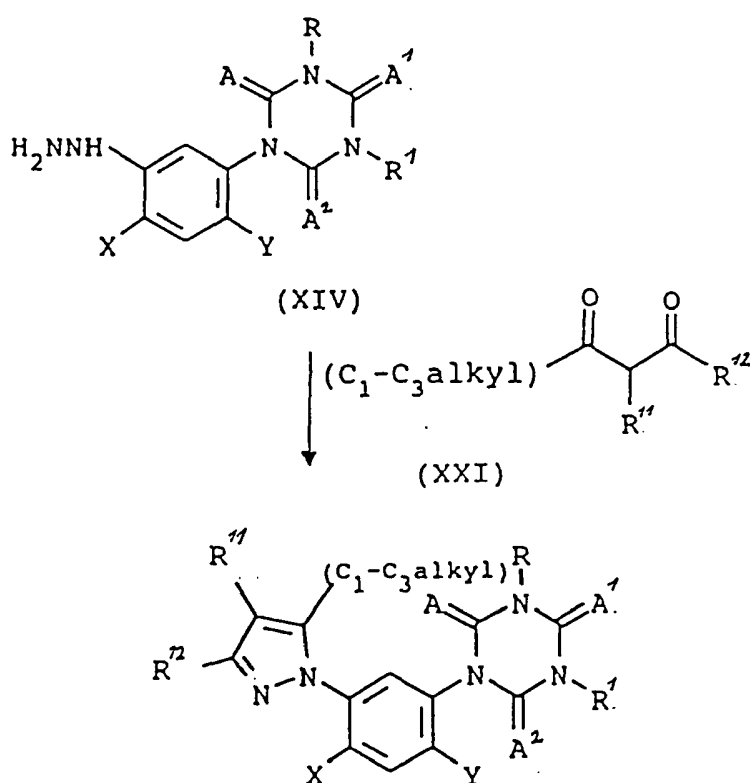
ným činidlom, ako je oxychlorid fosforečný alebo oxybromid fosforečný. Táto reakčná sekvencia je ilustrovaná v schéme X.

S c h é m a X



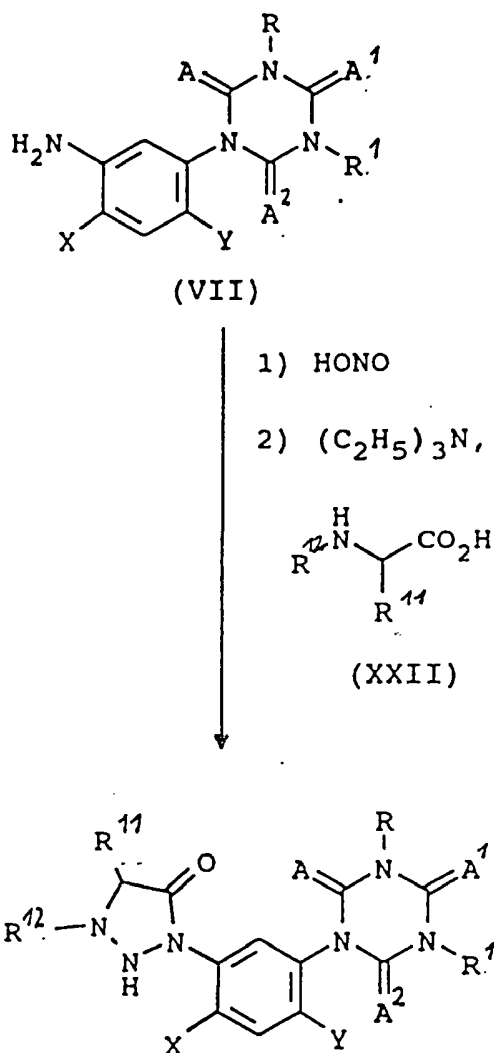
Zlúčeniny všeobecného vzorca I, kde Q predstavuje skupinu Q8 a M predstavuje alkylskupinu s 1 až 3 atómami uhlíka, je možné vyrobiť reakciou hydrazínu vzorca XIV s 1,3-diketónom vzorca XXI prípadne v prítomnosti bázy v inertnom rozpúšťadle. Táto reakcia je ilustrovaná v schéme XI.

S c h é m a X I



Zlúčeniny vzorca I, kde Q predstavuje skupinu Q9, je možné vyrobiť diazotáciou amínu vzorca VII na intermediárnu diazóniovú soľ. Táto intermediárna diazóniová soľ sa in situ nechá reagovať s β -aminokyselinou vzorca XXII v prítomnosti trietylaminu. Táto reakčná sekvencia je ilustrovaná v schéme XII.

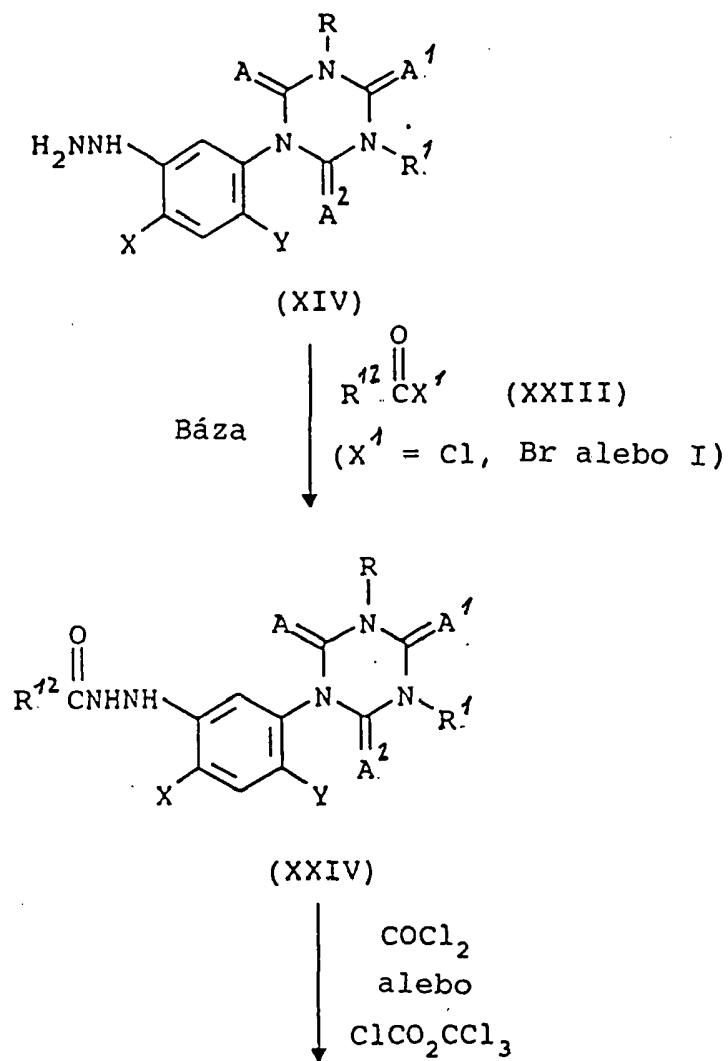
S c h é m a X I I



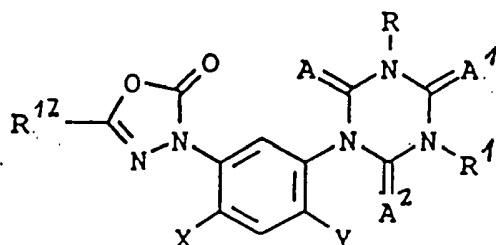
Zlúčeniny všeobecného vzorca I, kde Q predstavuje skupinu Q10, je možné vyrobiť reakciou hydrazínu vzorca XIV s acylhalogenidom vzorca XXIII v prítomnosti bázy, ako trietylamínu alebo pyridínu. Vzniknutý arylhydrazid vzorca XXIV sa nechá reagovať s trichlórmetylchlórformiátom a fosgénom alebo vhodným ekvivalentom fosgénu prípadne v prítomnosti

triethylamínu. Táto reakčná sekvencia je ilustrovaná v schéme XIII.

S c h é m a X I I I

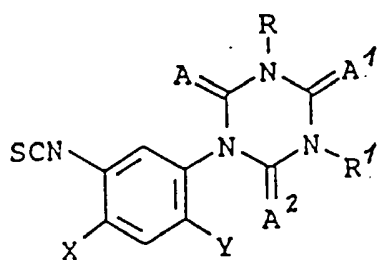


S c h é m a X I I I - pokračovanie

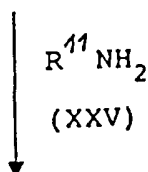


Zlúčeniny všeobecného vzorca I, kde Q predstavuje skupinu Q11, A³ predstavuje atóm síry, A⁴ predstavuje atóm kyslíka a Z predstavuje skupinu CH, je možné vyrobiť reakciou izotiokyanátu vzorca VIII s amínom vzorca XXV za vzniku tio-
močoviny vzorca XXVI. Táto tiomočovina sa nechá reagovať s α-halogénkarbonylhalogenidom vzorca XXVII v prítomnosti bázy. Táto reakčná sekvencia je ilustrovaná v schéme XIV.

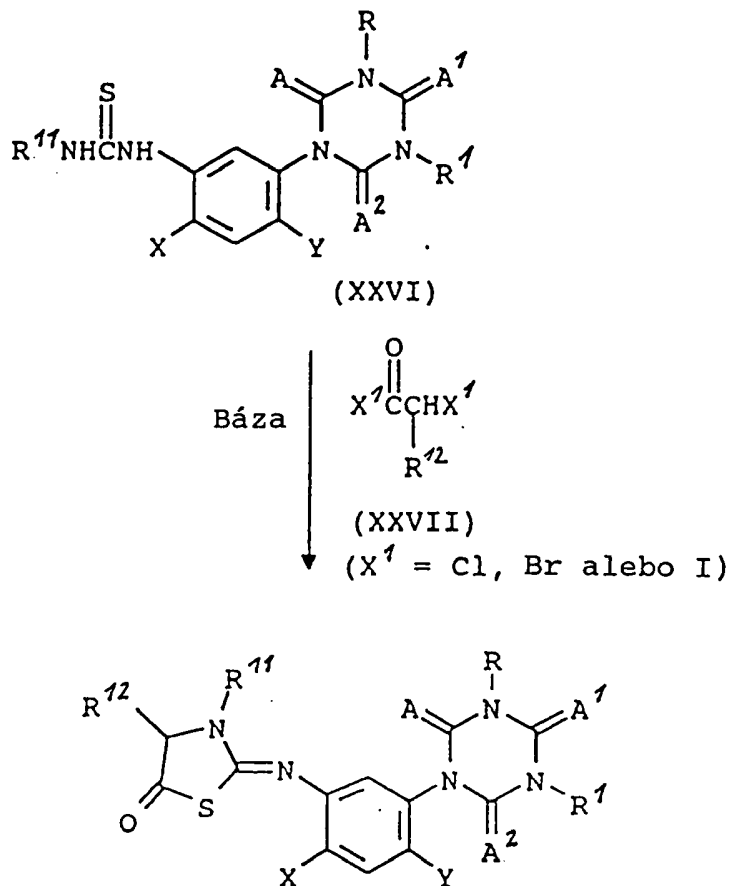
S c h é m a X I V



(VIII)

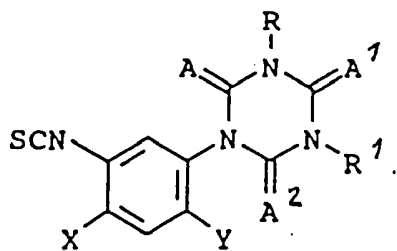


S c h é m a X I V - pokračovanie

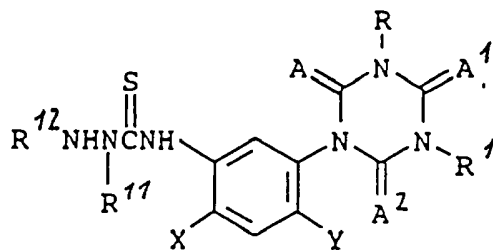
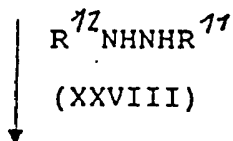


Zlúčeniny všeobecného vzorca I, kde Q predstavuje skupinu Q11, A³ predstavuje atóm síry, A⁴ predstavuje atóm kyslíka a Z predstavuje atóm dusíka, je možné vyrobiť reakciou izotiokyanátu vzorca VIII sa substituovaným hydrazínom vzorca XXVIII za vzniku intermediárnej zlúčeniny vzorca XXIX. Táto intermediárna zlúčenina sa nechá reagovať s fosgénom alebo vhodným ekvivalentom fosgénu v prítomnosti bázy, ako trietylaminu. Táto reakčná sekvencia je ilustrovaná v schéme XV.

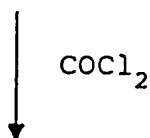
S c h é m a X V



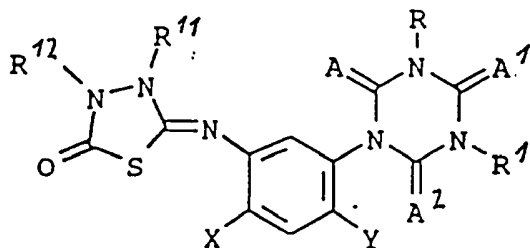
(VIII)



(XXIX)



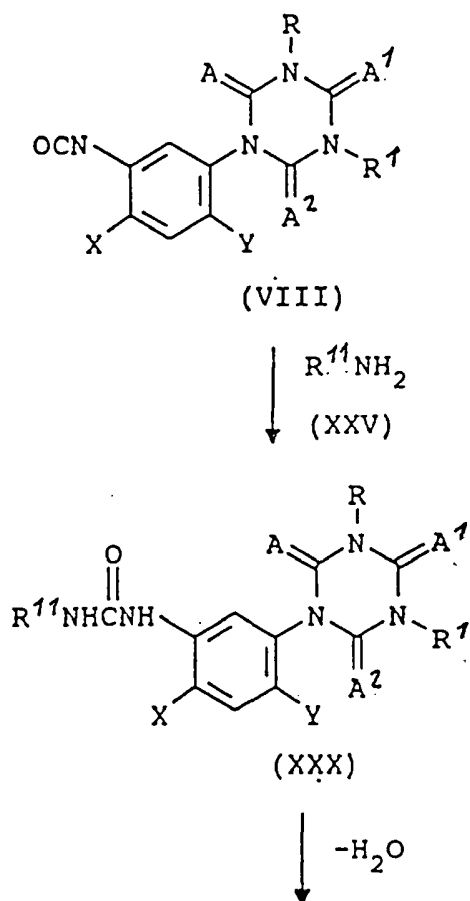
Báza



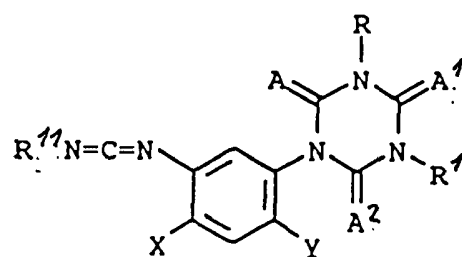
Zlúčeniny všeobecného vzorca I, kde Q predstavuje skupinu Q11, A³ a A⁴ predstavujú atómy kyslíka a Z predstavuje skupinu CH, je možné vyrobiť reakciou izokyanátu vzorca VIII s amínom vzorca XXV za vzniku močoviny vzorca XXX. Močovina vzorca XXX sa dehydratuje na karbodiimid

vzorca XXXI, ktorý sa nechá reagovať s α -halogénkarbonyl-halogenidom vzorca XXVII za vzniku halogénamidínu vzorca XXXII. Halogénamidín vzorca XXXIII sa hydrolyzuje pôsobením vodnej kyseliny na acylmočovinu, ktorá sa zahrievaním in situ premení na O-acylmočovinu vzorca XXXIII. O-Acylmočovina vzorca XXXIII sa nechá reagovať s bázou, ako trietyl-aminom. Táto reakčná sekvencia je ilustrovaná v schéme XVI.

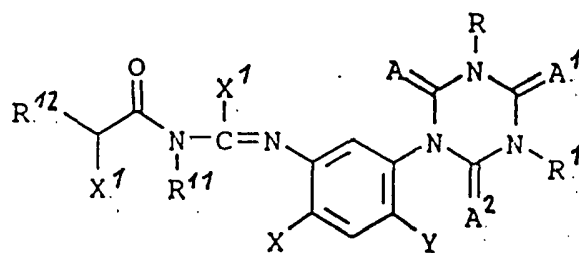
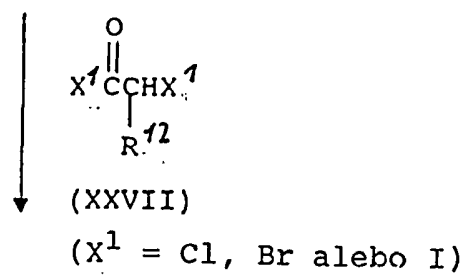
S c h é m a X V I



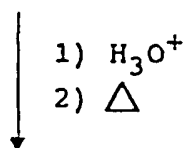
S c h é m a X V I - pokračovanie



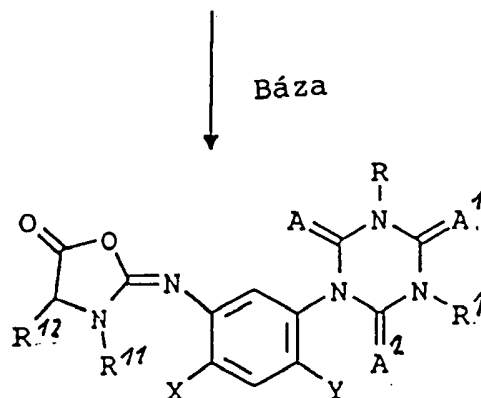
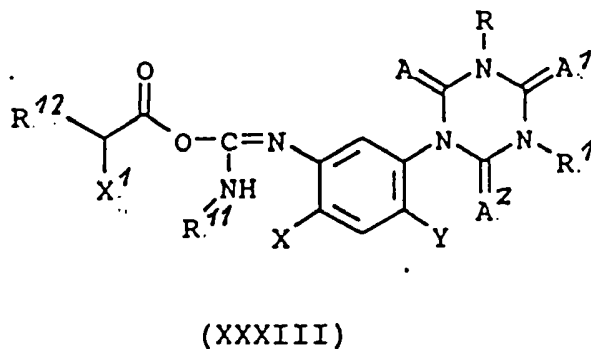
(XXXI)



(XXXII)

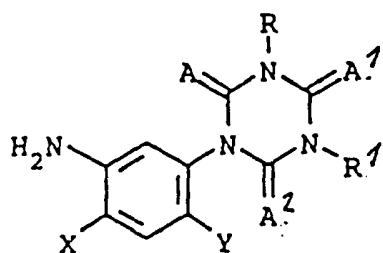


S c h é m a X V I - pokračovanie

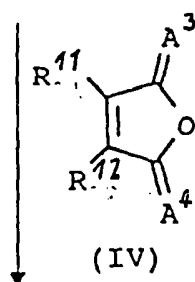


Zlúčeniny všeobecného vzorca I, kde Q predstavuje skupinu vzorca Q12, je možné pripraviť reakciou amínu vzorca VII s anhydridom vzorca IV za vzniku amidu kyseliny vzorca XXXIV. Amid kyseliny vzorca XXXIV sa dehydratuje pôsobením dehydratačného činidla, ako je 1,3-dicyklohexylkarbodiimid. Táto reakčná sekvencia je ilustrovaná v schéme XVII.

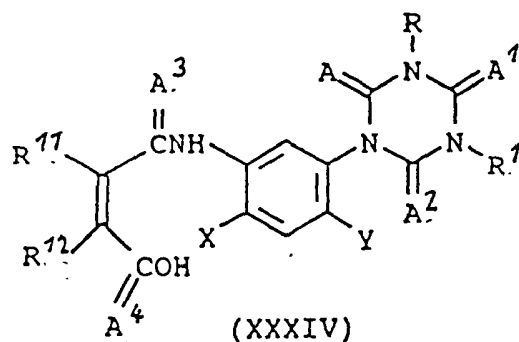
S c h é m a X V I I



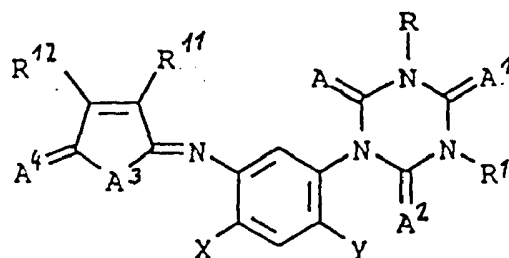
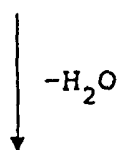
(VII)



(IV)

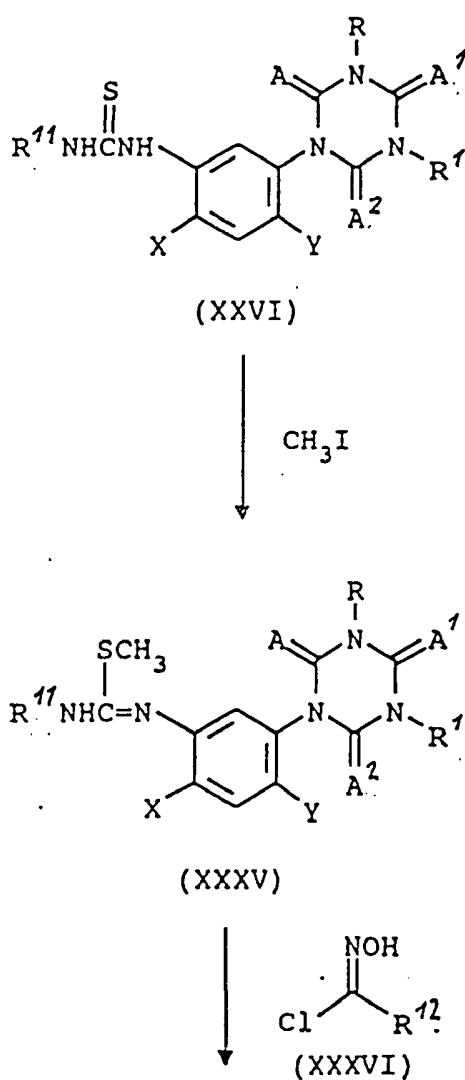


(XXXIV)

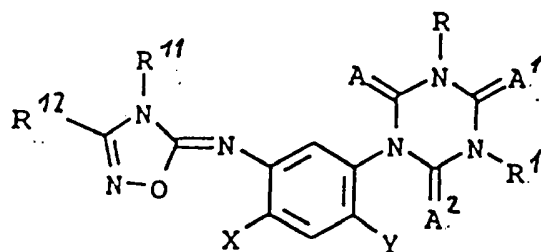


Zlúčeniny všeobecného vzorca I, kde Q predstavuje skupinu vzorca Q13, je možné pripraviť reakciou tiomočoviny vzorca XXVI s jódmetánom za vzniku izotiomochoviny vzorca XXXV, ktorá sa nechá reagovať s chlór oxímom vzorca XXXVI. Táto reakčná sekvencia je ilustrovaná v schéme XVIII.

S c h é m a X V I I I

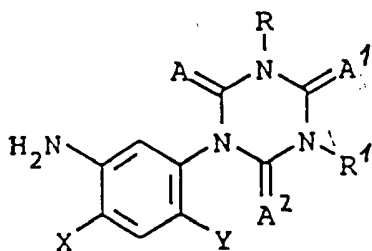


S c h é m a X V I I I - pokračovanie

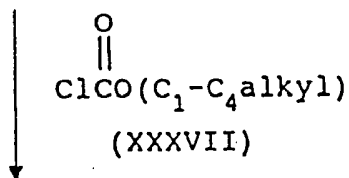


Zlúčeniny všeobecného vzorca I, kde Q predstavuje skupinu vzorca Q14, je možné vyrobiť reakciou amínu vzorca VII s chlórformiátom vzorca XXXVII za vzniku karbamátu vzorca XXXVIII. Karbamát vzorca XXXVIII sa nechá reagovať s halogénketónom vzorca XXXIX v prítomnosti bázy. Táto reakčná sekvencia je ilustrovaná v schéme XIX.

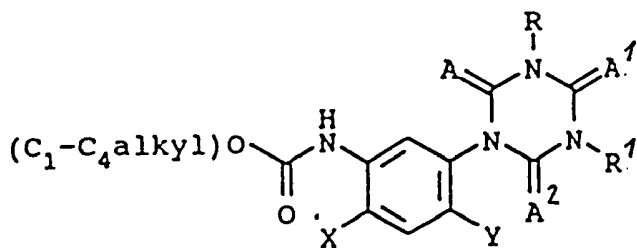
S c h é m a X I X



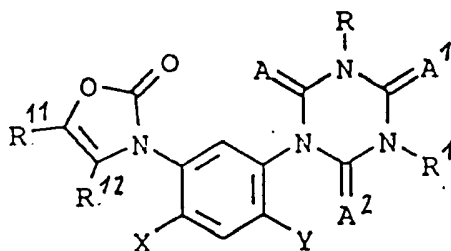
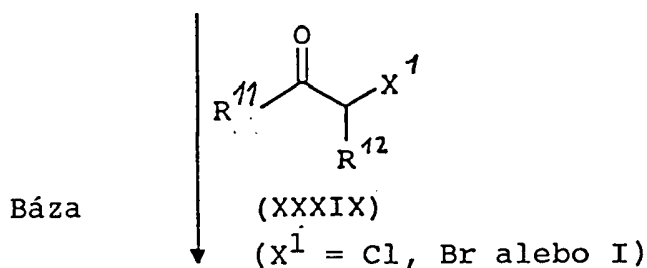
(VII)



S c h é m a X I X - pokračovanie

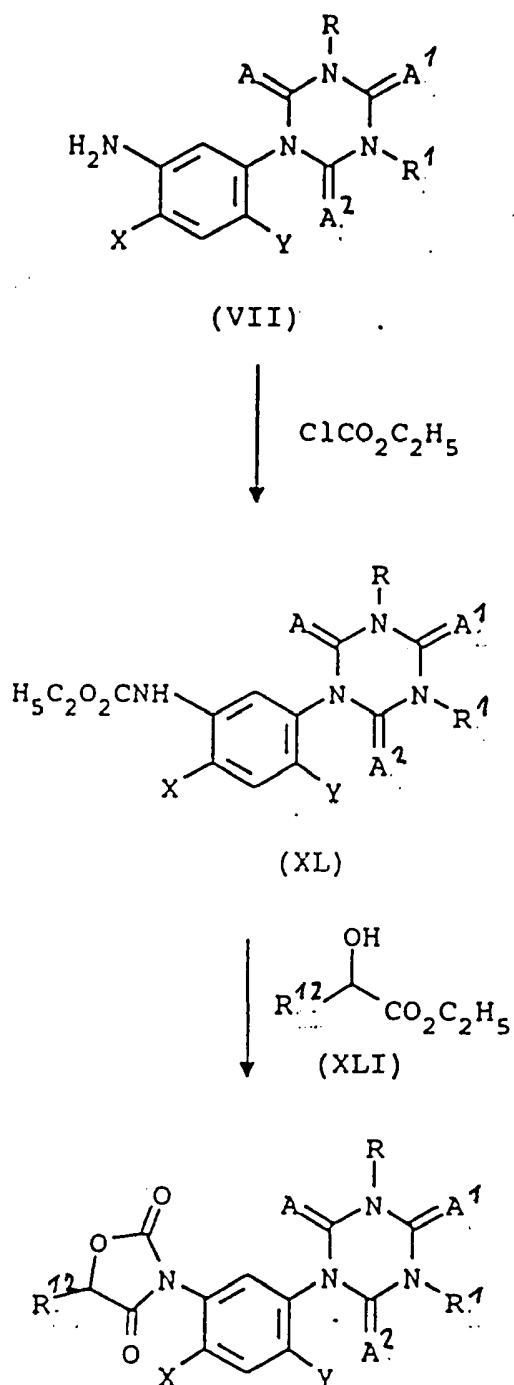


(XXXVIII)



Zlúčeniny všeobecného vzorca I, kde Q predstavuje skupinu vzorca Q15, je možné vyrobiť reakciou amínu vzorca VII s etylchlórformiátom za vzniku karbamátu vzorca XL. Karbamát vzorca XL sa nechá reagovať s hydroxyesterom vzorca XLI pri zvýšenej teplote za odstraňovania etanolu. Táto reakčná sekvencia je ilustrovaná v schéme XX.

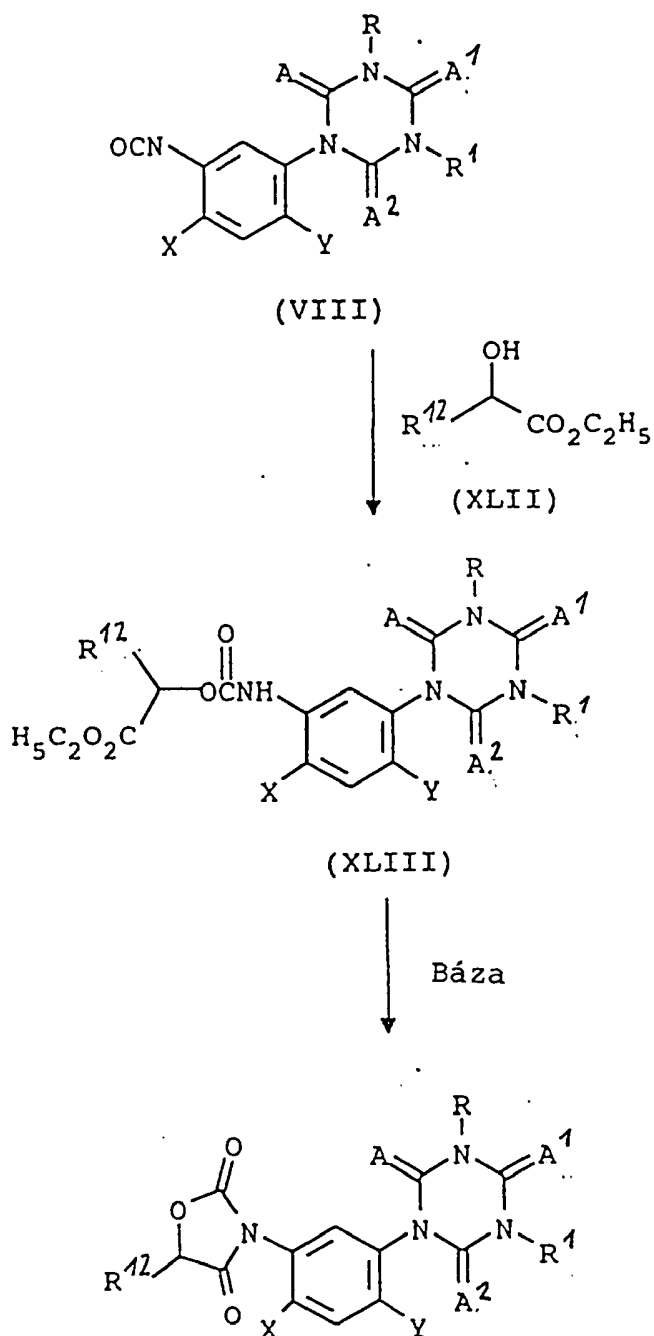
S c h é m a X X



Alternatívne je zlúčeniny všeobecného vzorca I, kde Q predstavuje skupinu vzorca Q15, možné vyrobiť reakciou izokyanátu vzorca VIII s hydroxyesterom vzorca XLII za vzniku

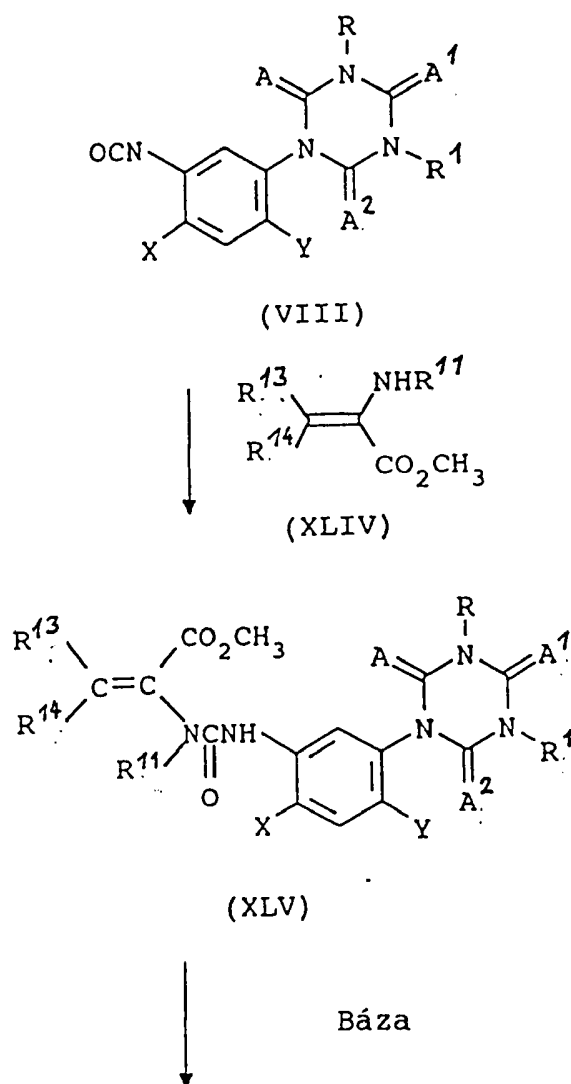
intermediárnej zlúčeniny vzorca XLIII. Táto intermediárna zlúčenina vzorca XLIII sa nechá reagovať s bázou, ako octanom sodným, v inertnom rozpúšťadle, ako toluéne. Táto reakčná sekvencia je ilustrovaná v schéme XXI.

S c h é m a X X I

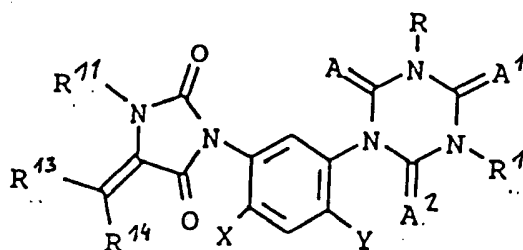


Zlúčeniny všeobecného vzorca I, kde Q predstavuje skupinu vzorca Q16, je možné vyrobiť reakciou izokyanátu vzorca VIII s α -amino- α,β -nenasýteným esterom vzorca XLIV za vzniku močoviny vzorca XLV. Močovina vzorca XLV sa nechá reagovať s bázou, ako octanom sodným, v inertnom rozpúšťadle, ako toluéne, pri zvýšenej teplote. Táto reakčná sekvencia je ilustrovaná v schéme XXII.

S c h é m a X X I I

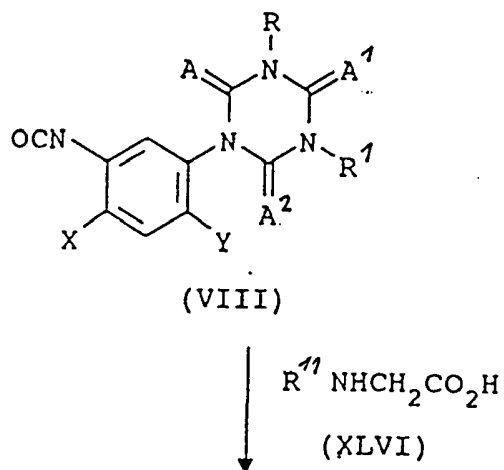


S c h é m a X X I I - pokračovanie

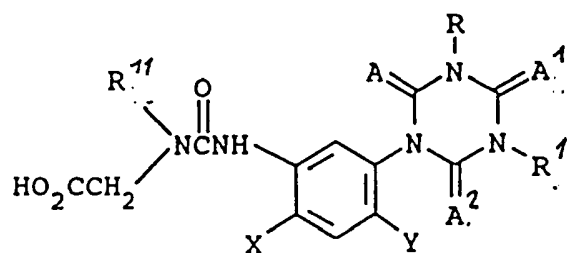


Alternatívne je zlúčeniny všeobecného vzorca I, kde Q predstavuje skupinu vzorca Q16, možné vyrobiť reakciou izokyanátu vzorca VIII s aminokyselinou vzorca XLVI za vzniku močoviny vzorca XLVII. Táto močovina sa nechá reagovať s vodnou kyselinou na hydantoín vzorca XLVIII, ktorý sa podrobí pôsobeniu acetalu vzorca XLIX. Táto reakčná sekvencia je ilustrovaná v schéme XXIII.

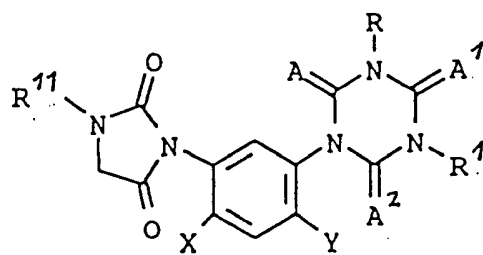
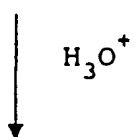
S c h é m a X X I I I



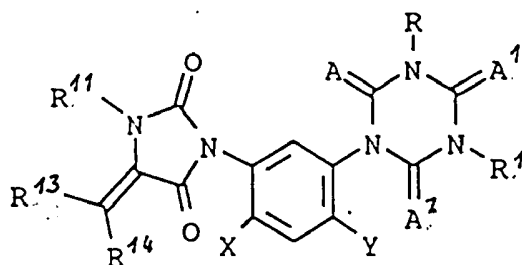
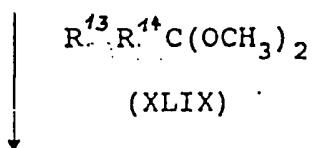
S c h é m a X X I I I - pokračovanie



(XLVII)



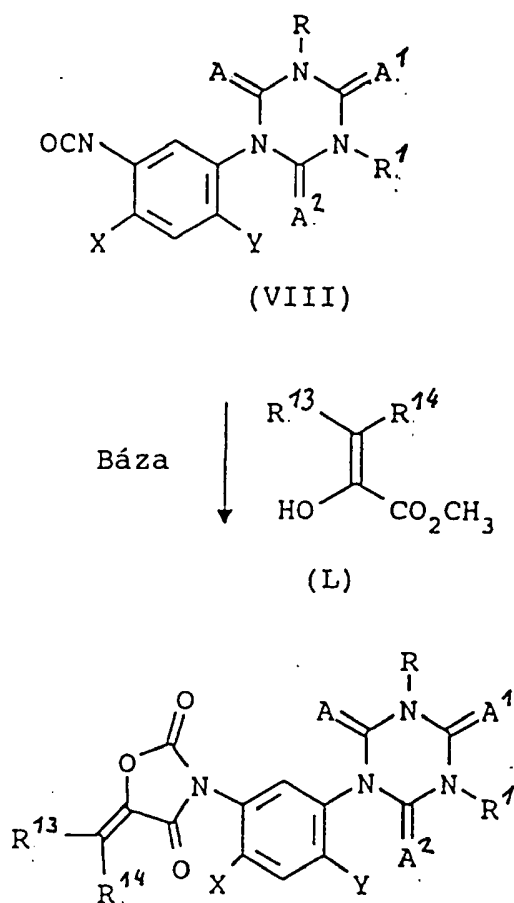
(XLVIII)



Zlúčeniny všeobecného vzorca I, kde Q predstavuje skupinu vzorca Q17, je možné vyrobiť reakciou izokyanátu

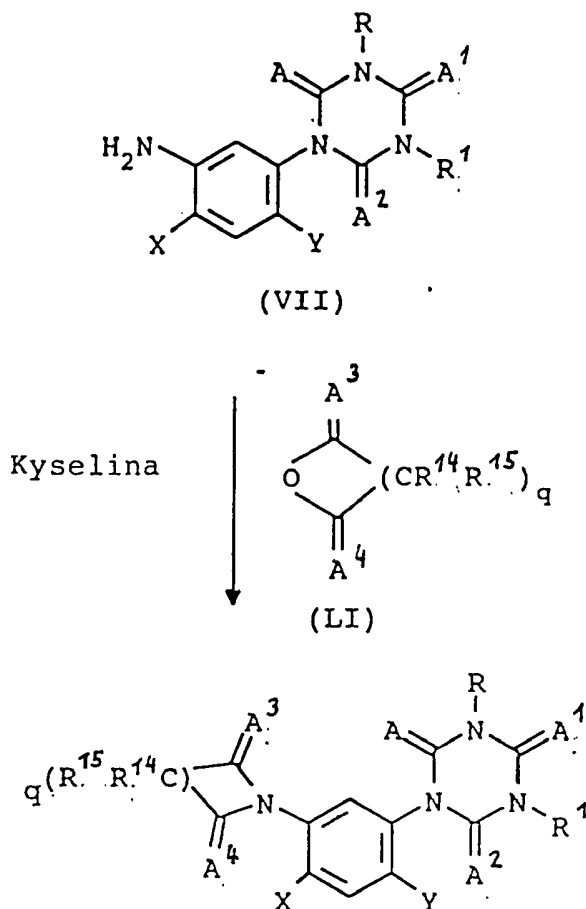
vzorca VIII s hydroxyalkenoátom vzorca L v prítomnosti bázy, ako trietylamínu. Táto reakcia je znázornená v schéme XXIV.

S c h é m a X X I V



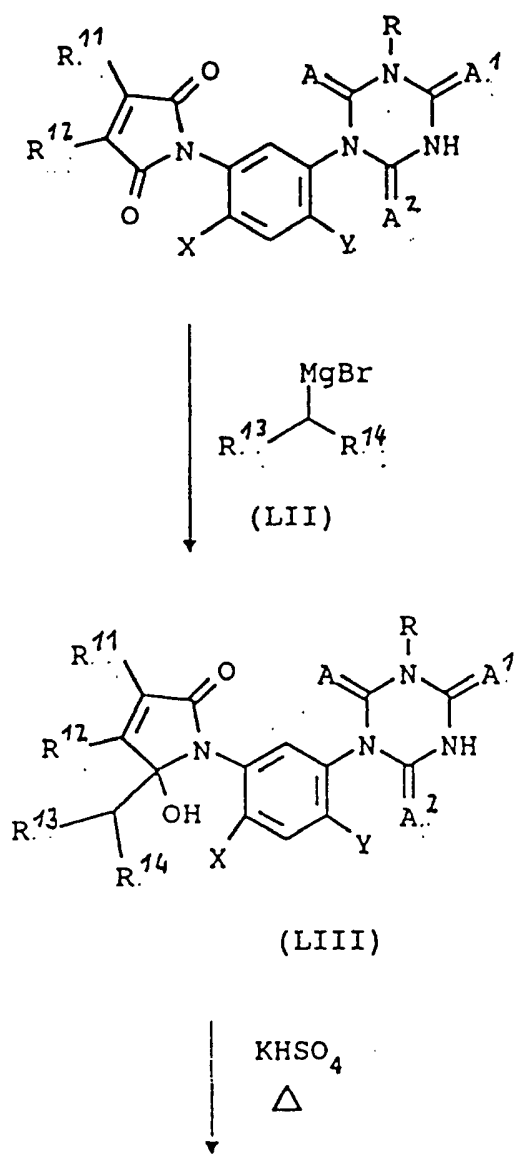
Zlúčeniny všeobecného vzorca I, kde Q predstavuje skupinu vzorca Q18, je možné vyrobiť reakciou amínu vzorca VII s anhydridom vzorca LI v prítomnosti kyseliny, ako je kyselina octová, prednostne pri zvýšenej teplote. Táto reakcia je ilustrovaná v schéme XXV.

S c h é m a X X V

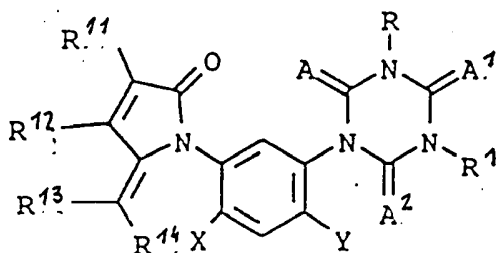
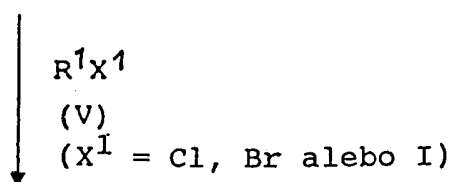
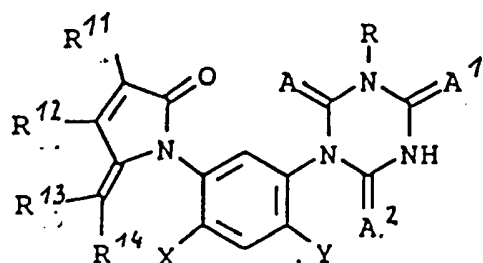


Zlúčeniny všeobecného vzorca I, kde Q predstavuje skupinu vzorca Q19, je možné vyrobiť reakciou zlúčeniny všeobecného vzorca I, kde Q predstavuje skupinu vzorca Q1, A^3 a A^4 predstavujú atómy kyslíka a R^1 predstavuje atóm vodíka, s Grignardovým činidlom vzorca LII v rozpúšťadle, ako je dietyléter alebo tetrahydrofurán, pri zvýšenej teplote, pričom vznikne intermediárna zlúčenina vzorca LIII. Zlúčenina vzorca LIII sa nechá reagovať s hydrogensíranom draselným pri zvýšenej teplote za vzniku požadovanej zlúčeniny všeobecného vzorca I, kde R^1 predstavuje atóm vodíka, ktorú je možné pôsobením alkylačného činidla vzorca V v prítomnosti bázy alkylovať. Táto reakčná sekvencia je ilustrovaná v schéme XXVI.

S c h é m a X X V I

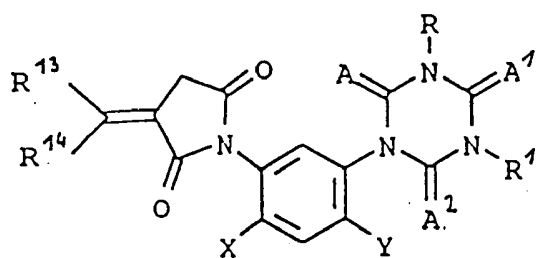
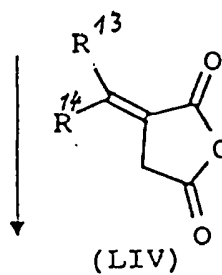
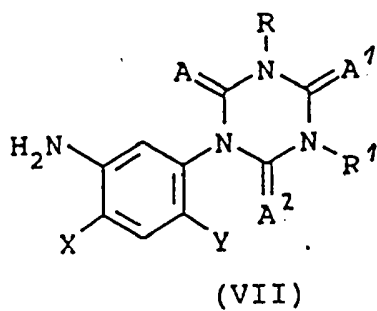


S c h é m a X X V I - pokračovanie



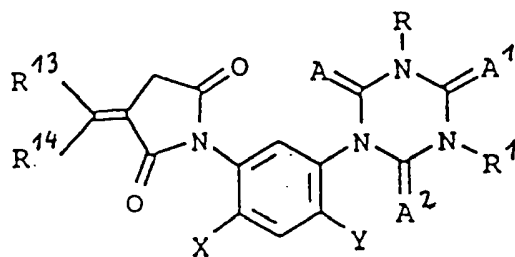
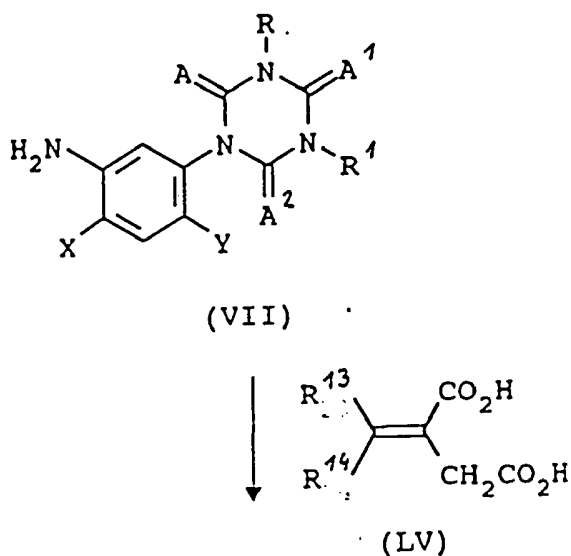
Zlúčeniny všeobecného vzorca I, kde Q predstavuje skupinu vzorca Q20, je možné vyrobiť reakciou amínu vzorca VII s anhydridom vzorca LIV v acetanhydride v prítomnosti katalytického množstva octanu sodného pri zvýšenej teplote, v kyseline octovej pri zvýšenej teplote alebo v xyléne v prítomnosti katalytického množstva p-toluénsulfónovej kyseliny pri zvýšenej teplote. Táto reakčná sekvencia je ilustrovaná v schéme XXVII.

S c h é m a X X V I I



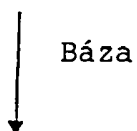
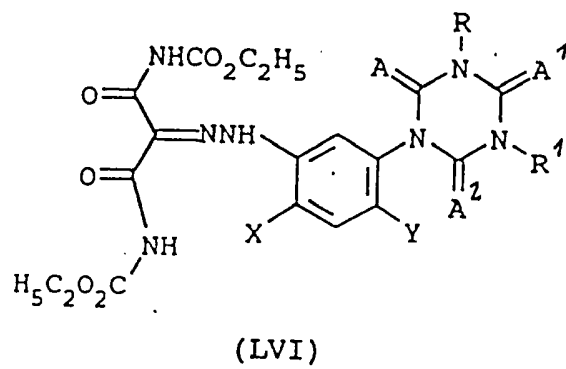
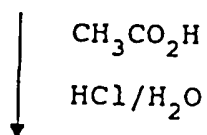
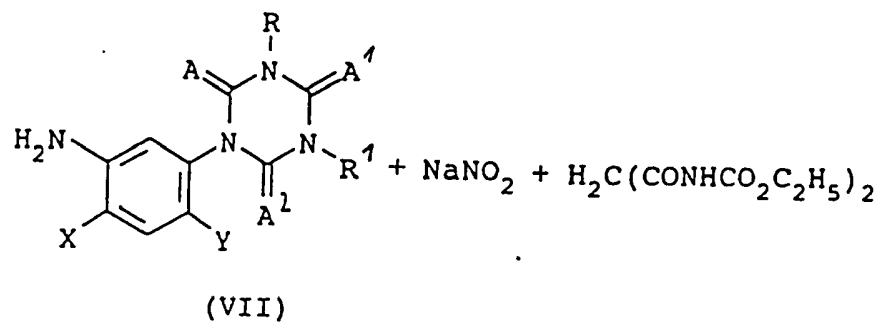
Alternatívne je zlúčeniny všeobecného vzorca I, kde Q predstavuje skupinu vzorca Q20, možné vyrobiť reakciou amínu vzorca VII s dvojsýtnou kyselinou vzorca LV v xyléne pri teplote spätného toku. Táto reakcia je ilustrovaná v schéme XXVIII.

S c h é m a X X V I I I

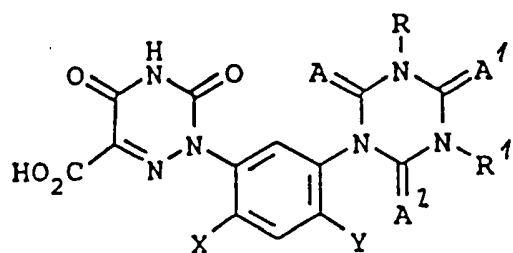


Zlúčeniny všeobecného vzorca I, kde Q predstavuje skupinu vzorca Q21, je možné vyrobiť reakciou amínu všeobecného vzorca VII s etylmalonyldiuretánom a dusitanom sodným v kyseline octovej s obsahom katalytického množstva koncentrovanej kyseliny chlorovodíkovej za vzniku hydrazónu vzorca LVI. Hydrazón vzorca LVI sa cyklizuje na triazíndiión vzorca LVII, ktorý sa dekarboxyluje reakciou s merkptooctovou kyselinou pri zvýšenej teplote. Zlúčenina všeobecného vzorca I, kde Q predstavuje skupinu vzorca Q21 a R¹¹ predstavuje atóm vodíka sa prípadne alkyluje alkylhalogenidom v prítomnosti bázy, ako natriumhydridu. Táto reakčná sekvencia je ilustrovaná v schéme XXIX.

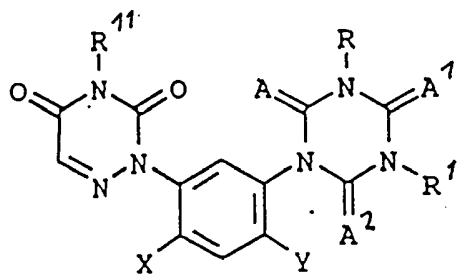
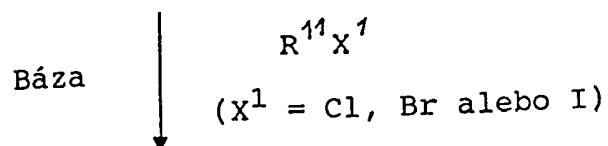
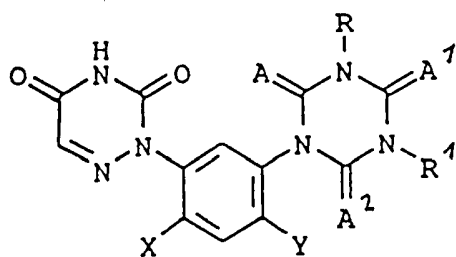
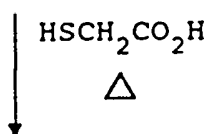
S c h é m a X X I X



S c h é m a X X I X - pokračovanie



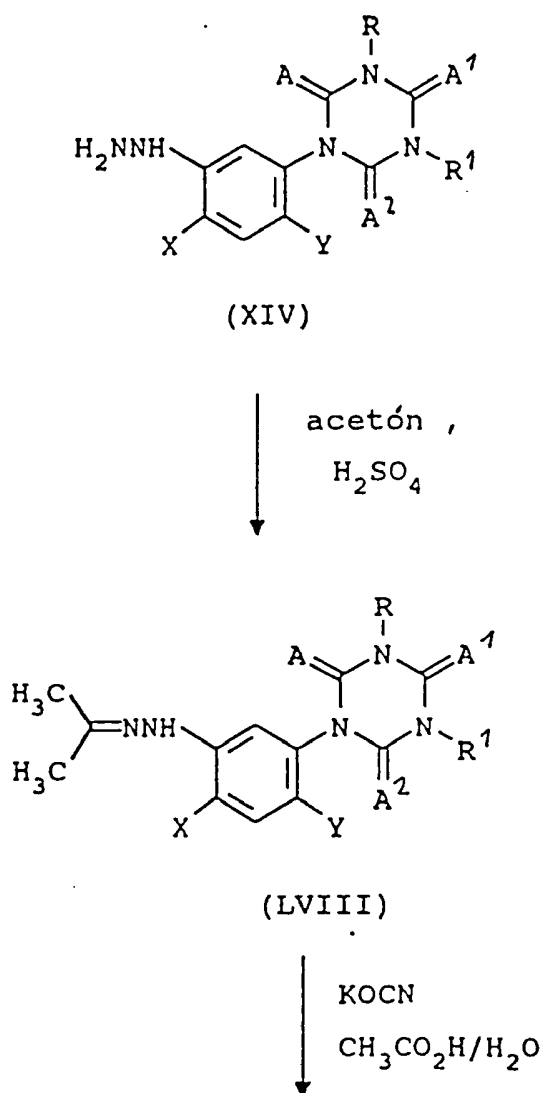
(LVII)



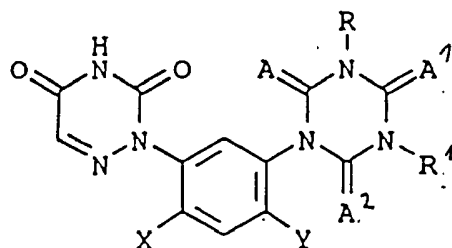
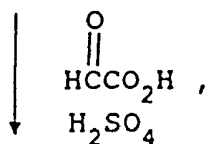
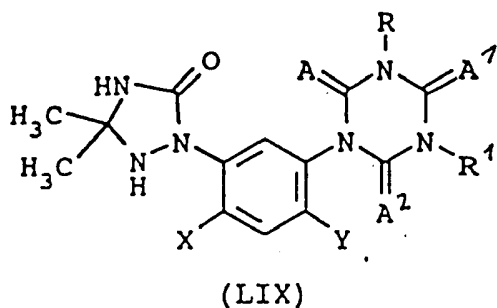
Alternatívne je zlúčeniny všeobecného vzorca I, kde Q predstavuje skupinu vzorca Q21 a R^{11} predstavuje atóm vodíka, možné vyrobiť reakciou hydrazínu vzorca XIV s acetónom

v roztoku kyseliny sírovej za vzniku hydrazónu vzorca LVIII. Hydrazón vzorca LVIII sa nechá reagovať s kyanátanom draselným v roztoku kyseliny octovej. Vzniknutý triazolidín vzorca LIX sa nechá reagovať s kyselinou glyoxylovou a kyselinou sírovou. Táto reakčná sekvencia je ilustrovaná v schéme XXX.

S c h é m a X X X

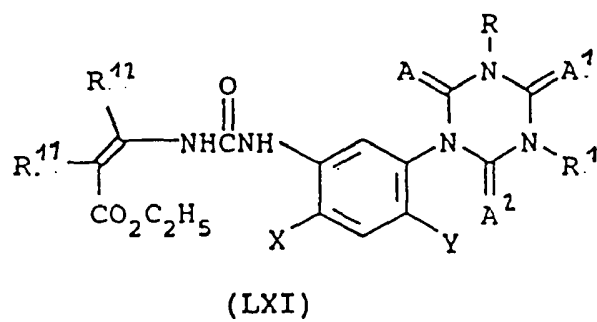
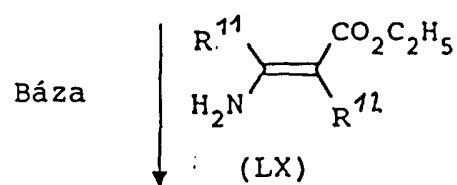
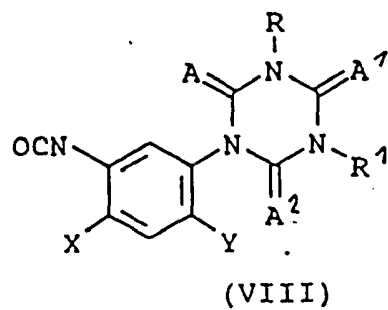


S c h é m a X X X - pokračovanie

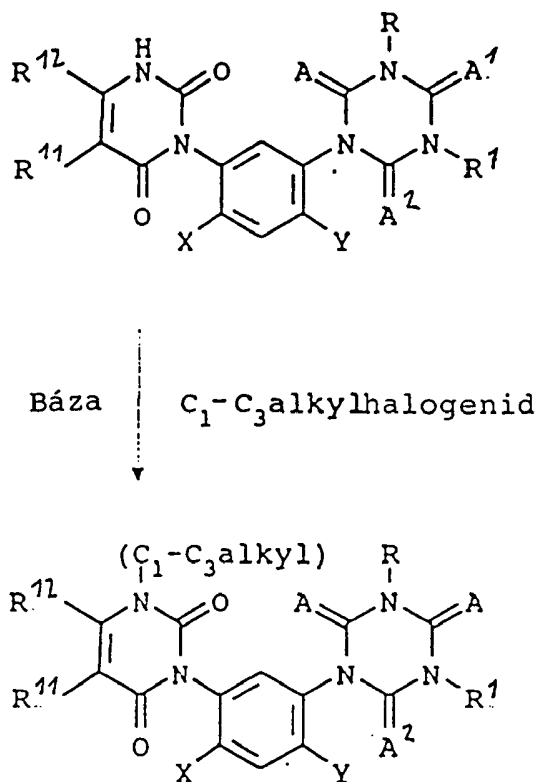


Zlúčeniny všeobecného vzorca I, kde Q predstavuje skupinu vzorca Q22 a R^1 sa odlišuje od vodíka, je možné vyrobiť reakciou zlúčeniny vzorca VIII s aminoesterom vzorca LX v prítomnosti bázy, ako natriumhydridu, za vzniku intermediárnej zlúčeniny vzorca LXI. Intermediárna zlúčenina vzorca LXI sa cyklizuje prípadne v prítomnosti kyseliny alebo bázy. Zlúčenina všeobecného vzorca I, kde Q predstavuje skupinu vzorca Q22 a R^{16} predstavuje atóm vodíka, sa prípadne alkyluje alkylhalogenidom s 1 až 3 atómami uhlíka v prítomnosti bázy, ako je natriumhydrid. Táto reakčná sekvencia je ilustrovaná v schéme XXXI.

S c h é m a X X X I

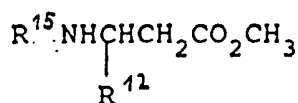
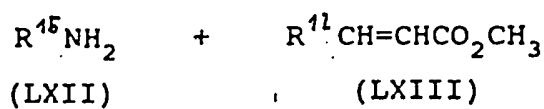


S c h é m a X X X I - pokračovanie

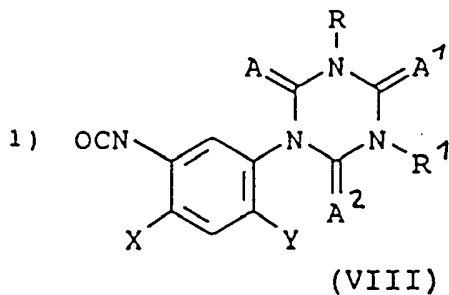


Zlúčeniny všeobecného vzorca I, kde Q predstavuje skupinu vzorca Q23, je možné vyrobiť reakciou amínu vzorca LXII s α,β -nenasýteným esterom vzorca LXIII za vzniku aminoesteru vzorca LXIV. Aminoester vzorca LXIV sa podrobí reakcii s izokyanátom vzorca VIII nasledovanej zahrievaním za kyslých podmienok. Táto reakčná sekvencia je ilustrovaná v schéme X XXXII.

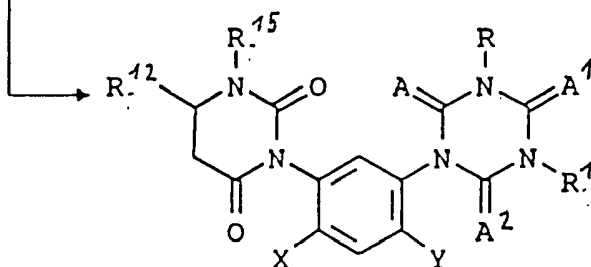
S c h é m a X X X I I



(LXIV)



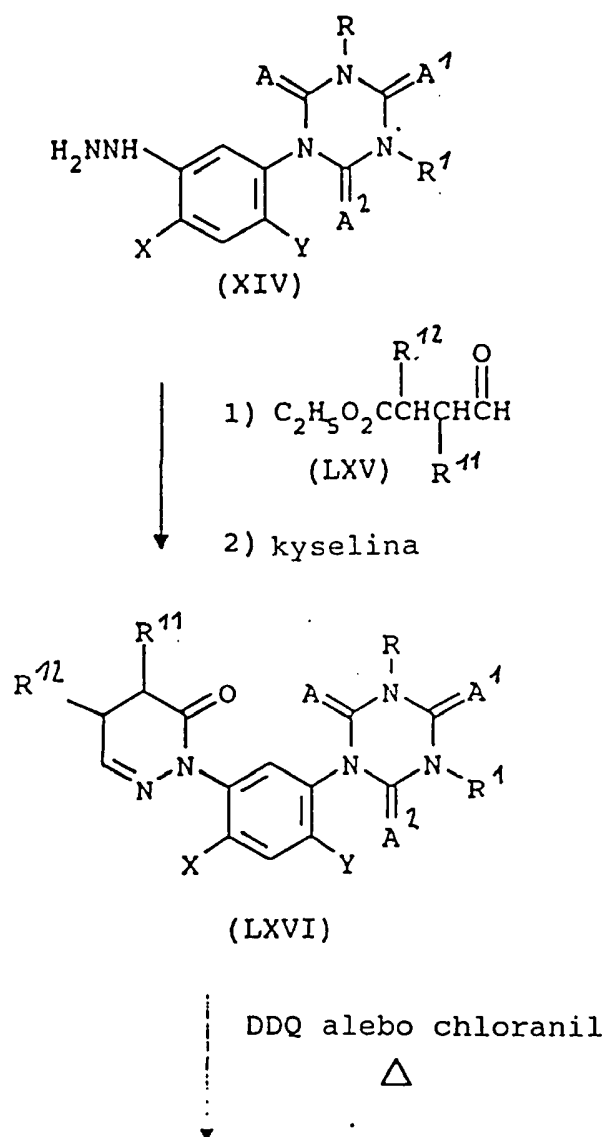
2) kyselina



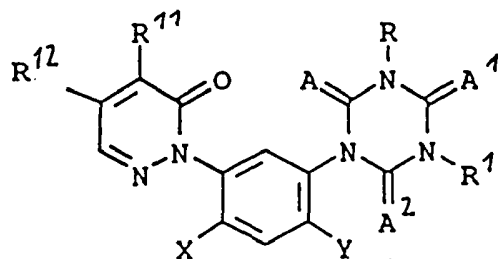
Zlúčeniny všeobecného vzorca I, kde Q predstavuje skupinu vzorca Q24, je možné vyrobiť reakciou hydrazínu vzorca XIV s formylpropionátom vzorca LXV a následnou cyklizáciou za kyslých podmienok. Vzniknutý dihydropyridazínón vzorca LXVI sa dehydrogenuje pôsobením chloranilu alebo 2,3-dichlór-5,6-dikyanobenzochinónu (DDQ) v inertnom roz-

púšťadle, ako dioxáne alebo toluéne, pri zvýšenej teplote.
Táto reakčná sekvencia je ilustrovaná v schéme XXXIII.

S c h é m a X X X I I I

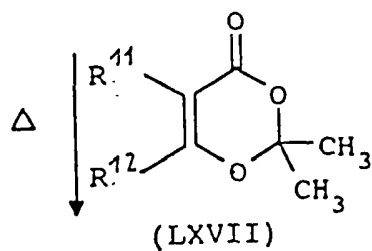
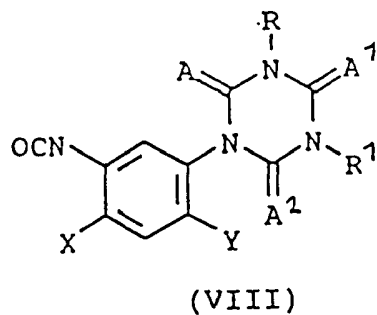


S c h é m a X X X I I I - pokračovanie

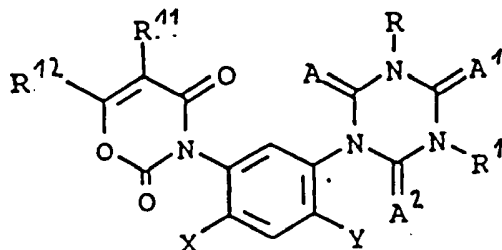


Zlúčeniny všeobecného vzorca I, kde Q predstavuje skupinu vzorca Q25, je možné vyrobiť reakciou izokyanátu vzorca VIII s acetonidom vzorca LXVII pri zvýšenej teplote. Táto reakcia je ilustrovaná v schéme XXXIV.

S c h é m a X X X I V

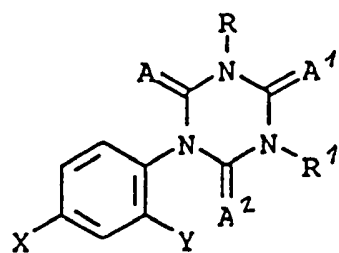


S c h é m a X X X I V - pokračovanie

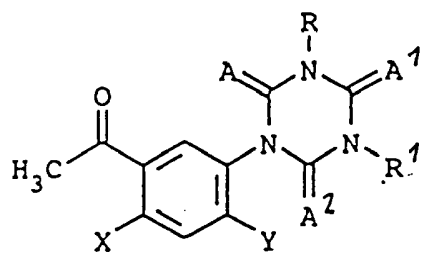
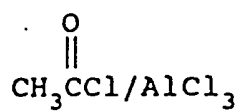


Zlúčeniny všeobecného vzorca I, kde Q predstavuje skupinu vzorca Q26, je možné vyrobiť reakciou 3-(substituovaný fenyl)-s-triazín-2,4,6-oxo- alebo tiotriónu vzorca LXVIII s acetylchloridom v prítomnosti chloridu hlinitého. Vzniknutý ketón vzorca LXIX sa nechá reagovať s esterom vzorca LXX na diketónovú zlúčeninu vzorca LXXI, ktorá sa reakciou s hydrazínom vzorca LXXII premení na zlúčeninu všeobecného vzorca I, kde Q predstavuje skupinu vzorca Q26 a R^{16} predstavuje atóm vodíka, ktorá sa potom prípadne halogenuje. Táto reakčná sekvencia je ilustrovaná v schéme XXXV.

S c h é m a X X X V

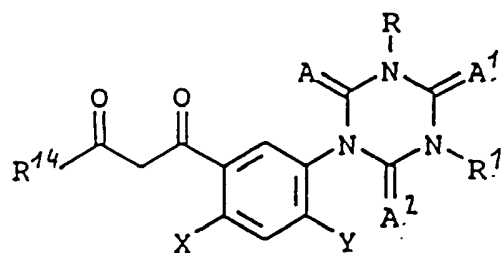
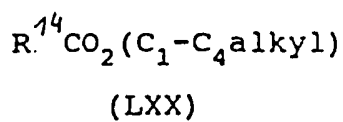


(LXVIII)

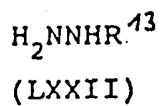


(LXIX)

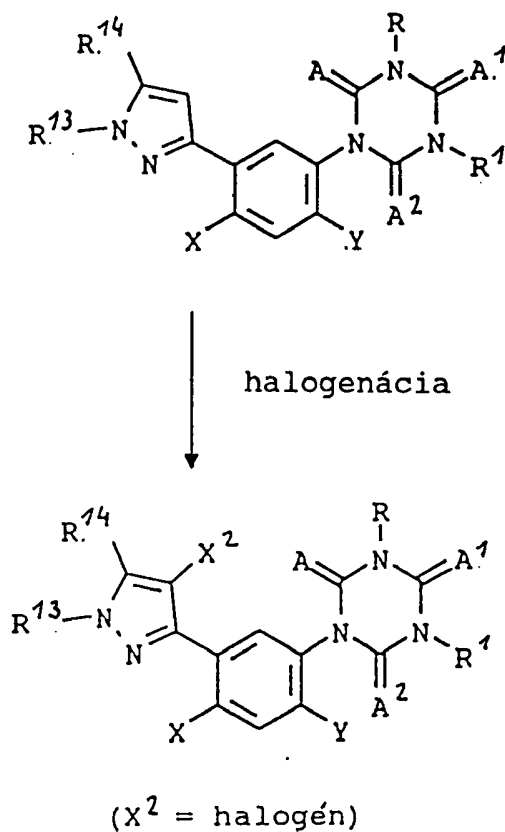
Báza



(LXXI)

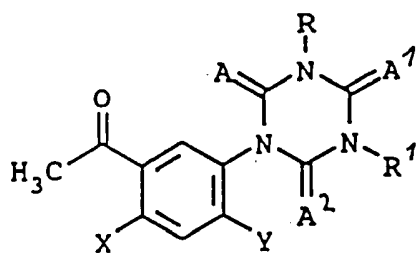


S c h é m a X X X V - pokračovanie

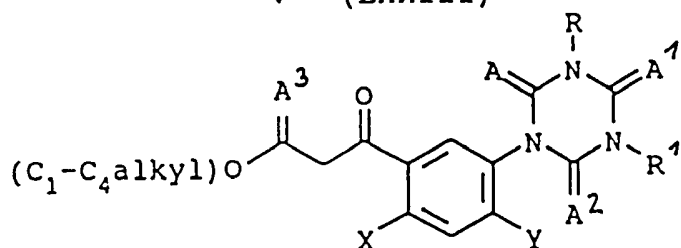
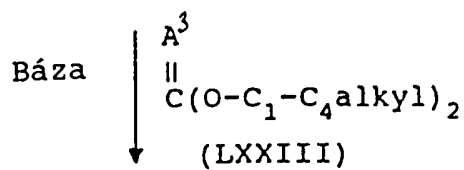


Zlúčeniny všeobecného vzorca I, kde Q predstavuje skupinu vzorca Q27, je možné vyrobiť reakciou ketónu vzorca LXIX s karbonátom alebo tiokarbonátom vzorca LXXIII v prítomnosti bázy za vzniku esteru alebo tioxoesteru vzorca LXXIV. Zlúčenina vzorca LXXIV sa nechá reagovať s hydrazínom vzorca LXXII na intermediárnu zlúčeninu vzorca LXXV, ktorá sa alkyluje alkylačným činidlom vzorca LXXVI v prítomnosti bázy. Vzniknutá zlúčenina všeobecného vzorca I, kde Q predstavuje skupinu vzorca Q27 a R^{16} predstavuje atóm vodíka, sa potom prípadne halogenuje. Táto reakčná sekvencia je ilustrovaná v schéme XXXVI.

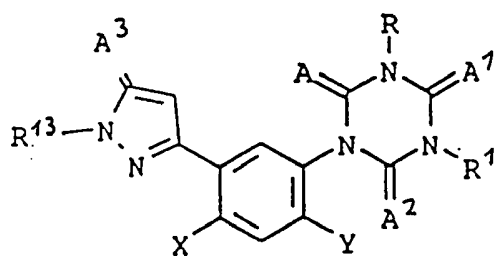
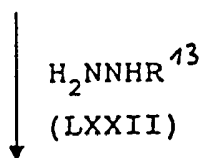
S c h é m a X X X V I



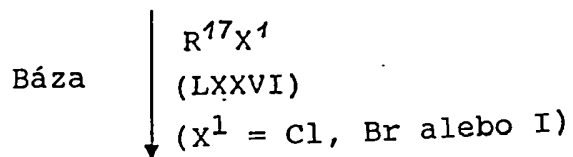
(LXIX) .



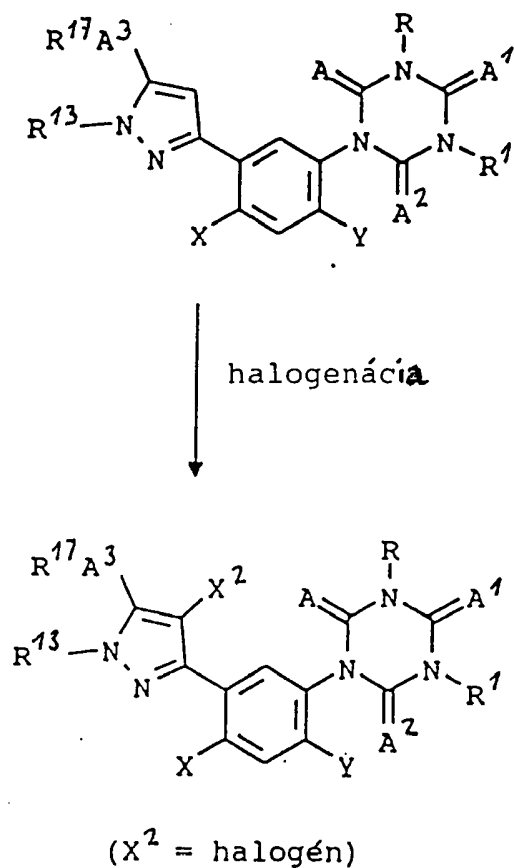
(LXXIV)



(LXXV) .



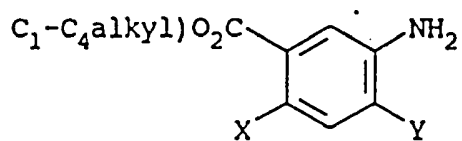
S c h é m a X X X V I - pokračovanie



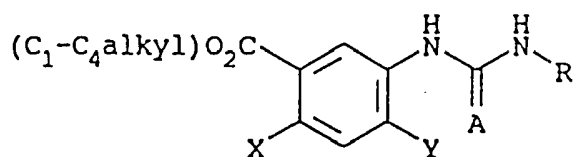
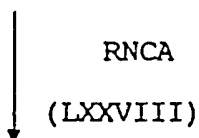
Zlúčeniny všeobecného vzorca I, kde Q predstavuje skupinu vzorca Q28, je možné vyrobiť reakciou anilínu vzorca LXXVII s izokyanátom alebo izotiokyanátom vzorca LXXVIII za vzniku močoviny alebo tiomočoviny vzorca LXXIX. Zlúčenina vzorca LXXIX sa cyklizuje reakciou s izokyanátom alebo tioizokyanátom vzorca LXXX na 3-(substituovaný fenyl)-s-triazín-2,4,6-oxo- alebo tiotrión vzorca LXXXI, ktorý sa postupne podrobí pôsobeniu bázy, tionylchloridu a hydrazínu vzorca LXXII. Vzniknutá intermediárna zlúčenina vzorca LXXXII sa nechá reagovať s fosgénom alebo ekvivalentom fosgénu za vzniku zlúčeniny všeobecného vzorca I, kde Q pred-

stavuje skupinu vzorca Q28 a R^1 predstavuje atóm vodíka, ktorú je možné alkylovať pôsobením alkylačného činidla vzorca V v prítomnosti bázy. Táto reakčná sekvencia je ilustrovaná v schéme XXXVII.

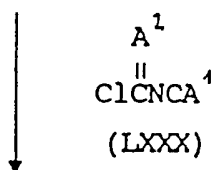
S c h é m a X X X V I I



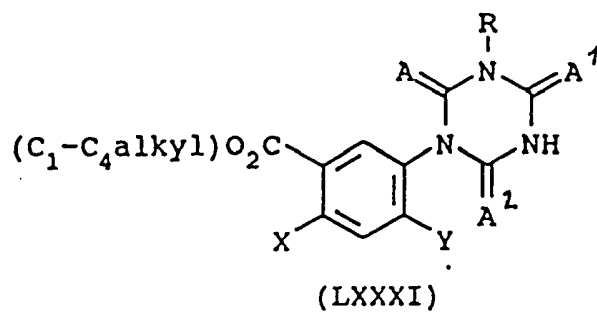
(LXXVII)



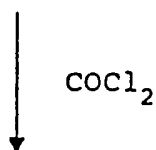
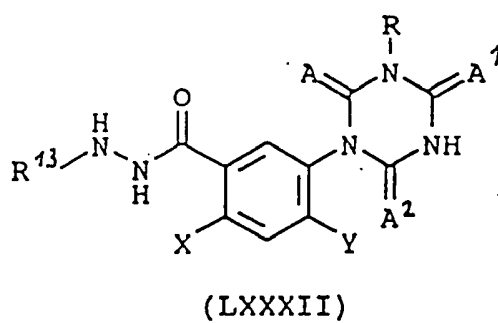
(LXXIX)



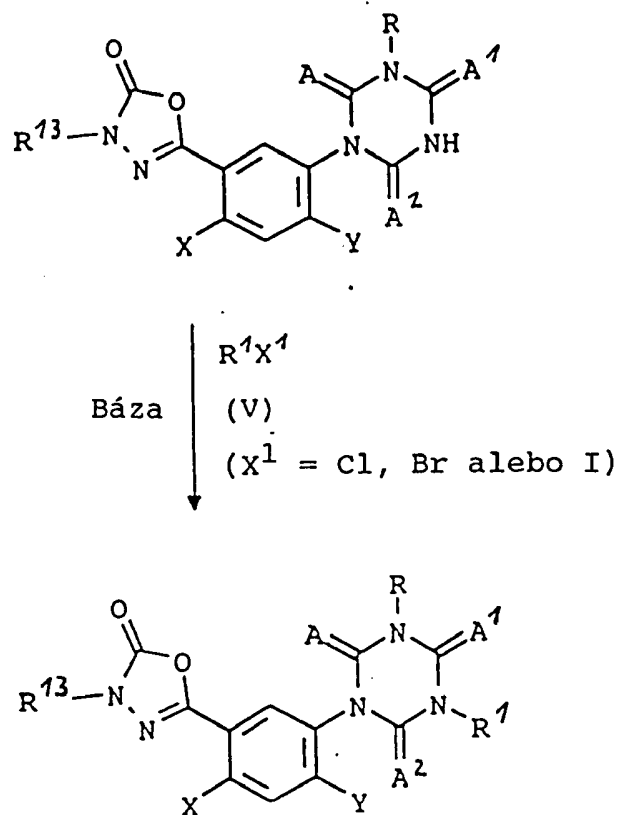
S c h é m a X X X V I I - pokračovanie



- 1) báza
2) SOCl₂
3) H₂NNHR¹³
(LXXXII)

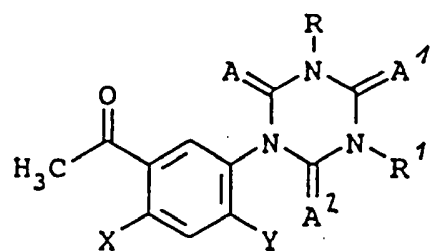


S c h é m a X X X V I I - pokračovanie

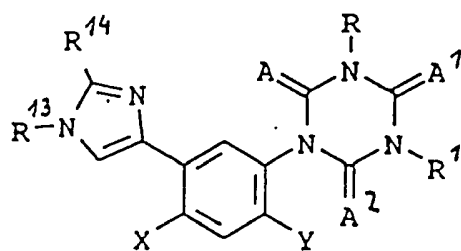
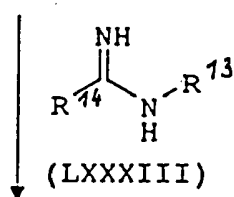


Zlúčeniny všeobecného vzorca I, kde Q predstavuje skupinu vzorca Q29, je možné vyrobiť reakciou ketónu vzorca LXIX s amidínom vzorca LXXXIII za vzniku zlúčeniny všeobecného vzorca I, kde Q predstavuje skupinu vzorca Q29 a R¹⁶ predstavuje atóm vodíka, ktorá sa prípadne halogenuje. Táto reakcia je ilustrovaná v schéme XXXVIII.

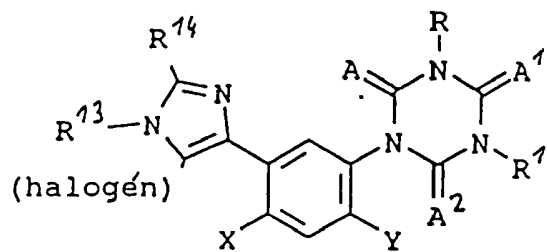
S c h é m a X X X V I I I



(LXIX)

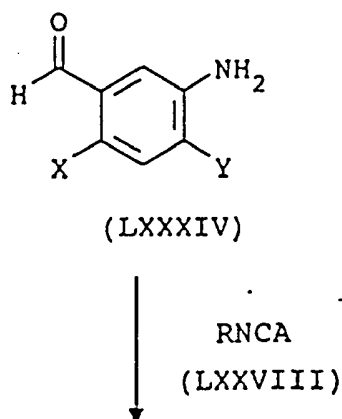


Halogenácia

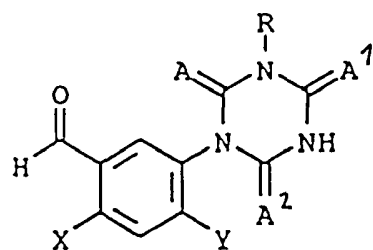
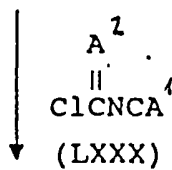
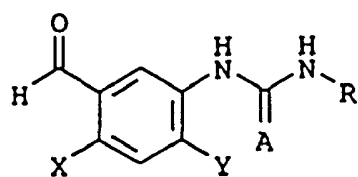


Zlúčeniny všeobecného vzorca I, kde Q predstavuje skupinu vzorca Q30 a R^1 predstavuje atóm vodíka, je možné vyrobiť tak, že sa amín vzorca LXXXIV nechá reagovať s izokyanátom alebo tioizokyanátom vzorca LXXVIII za vzniku močoviny alebo tiomočoviny vzorca LXXXV. Zlúčenina vzorca LXXXV sa cyklizuje pôsobením izokyanátu alebo izotiokyanátu vzorca LXXX na 3-(substituovaný fenyl)-s-triazín-2,4,6-oxo- alebo tiotrión vzorca LXXXVI. Zlúčenina vzorca LXXXVI sa postupne podrobí pôsobeniu hydroxidu amónneho a chloračného činidla. Vzniknutý chlór oxím vzorca LXXXVII sa nechá reagovať s alkínom vzorca LXXXVIII, čím sa získa zlúčenina všeobecného vzorca I, kde Q predstavuje Q30, R^1 predstavuje atóm vodíka a Z^2 predstavuje alkoxy skupinu s 1 až 4 atómami uhlíka. Na túto zlúčeninu sa prípadne pôsobí postupne kyselinou alebo bázou, tionylchloridom a amínom vzorca LXXXIX, čím sa získa zlúčenina všeobecného vzorca I, kde Q predstavuje skupinu vzorca Q30, R^1 predstavuje atóm vodíka a Z^2 predstavuje skupinu vzorca NR^9R^{10} . Táto reakčná sekvencia je ilustrovaná v schéme XXXIX.

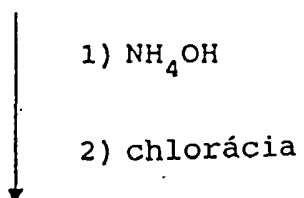
S c h é m a X X X I X



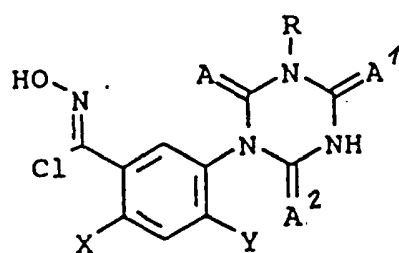
S c h é m a X X X I X - pokračovanie



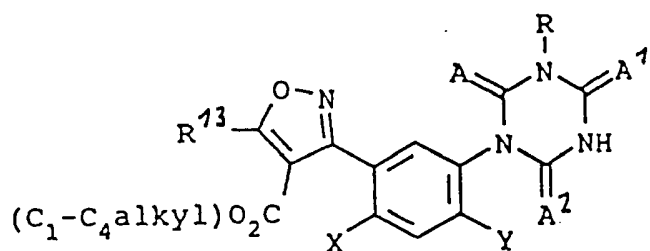
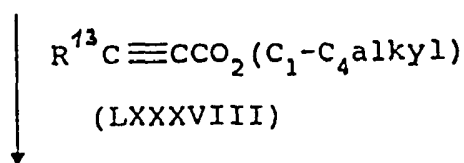
(LXXXVI)



S c h é m a X X X I X - pokračovanie

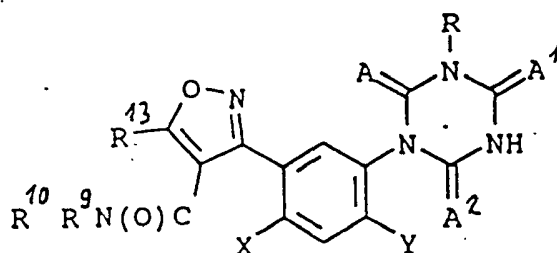


(LXXXVII)



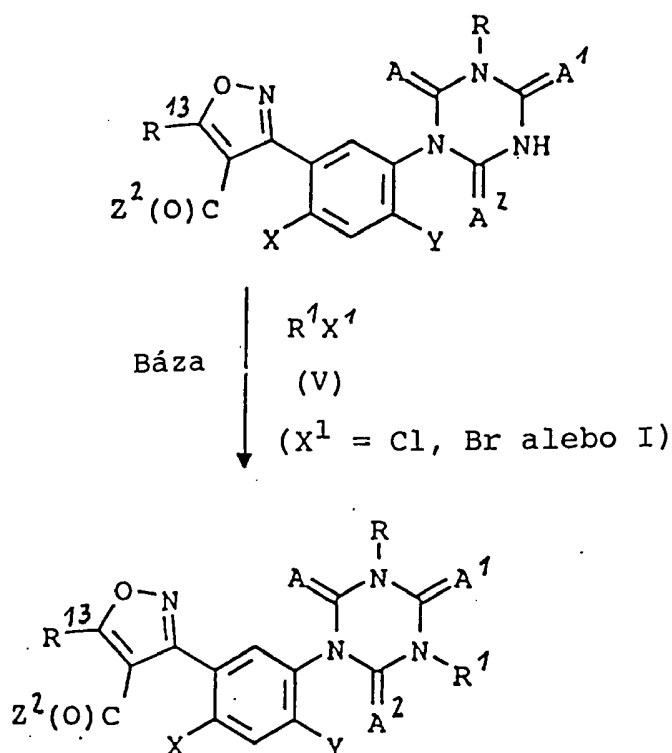
- Reaction conditions for the conversion of (LXXXVIII) to (LXXXIX):
- 1) kyselina alebo báza
 - 2) SOCl₂
 - 3) NHR⁹R¹⁰

(LXXXIX)



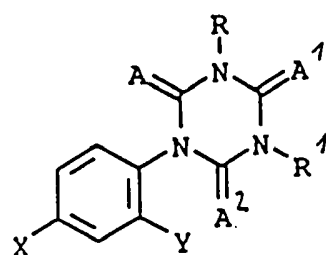
Zlúčeniny všeobecného vzorca I, kde Q predstavuje skupinu vzorca Q30 a R^1 sa líši od vodíka, je možné vyrobiť alkyláciou zlúčeniny všeobecného vzorca I, kde Q predstavuje skupinu vzorca Q30 a R^1 predstavuje atóm vodíka, pôsobením alkylačného činidla vzorca V v prítomnosti bázy. Táto reakcia je ilustrovaná v schéme XL.

S c h é m a X L

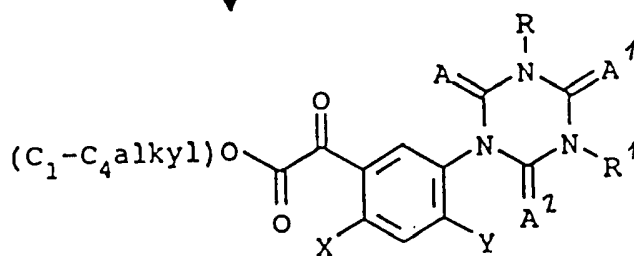
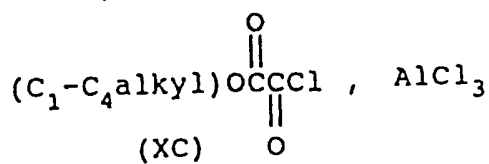


Zlúčeniny všeobecného vzorca I, kde Q predstavuje skupinu vzorca Q31, je možné vyrobiť reakciou 3-(substituovaný fenyl)-s-triazín-2,4,6-oxo- alebo tiotriónu vzorca LXVIII s esterom vzorca XC v prítomnosti chloridu hlinitého. Vzniknutá intermediárna zlúčenina vzorca XCI sa nechá reagovať so substituovaným amínom vzorca XCII. Táto reakčná sekvencia je ilustrovaná v schéme XLI.

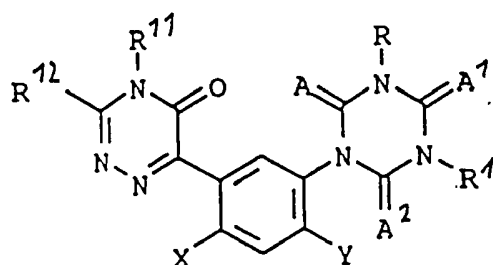
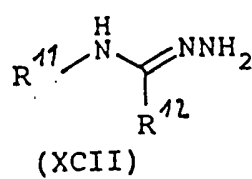
S c h é m a X L I



(LXVIII)

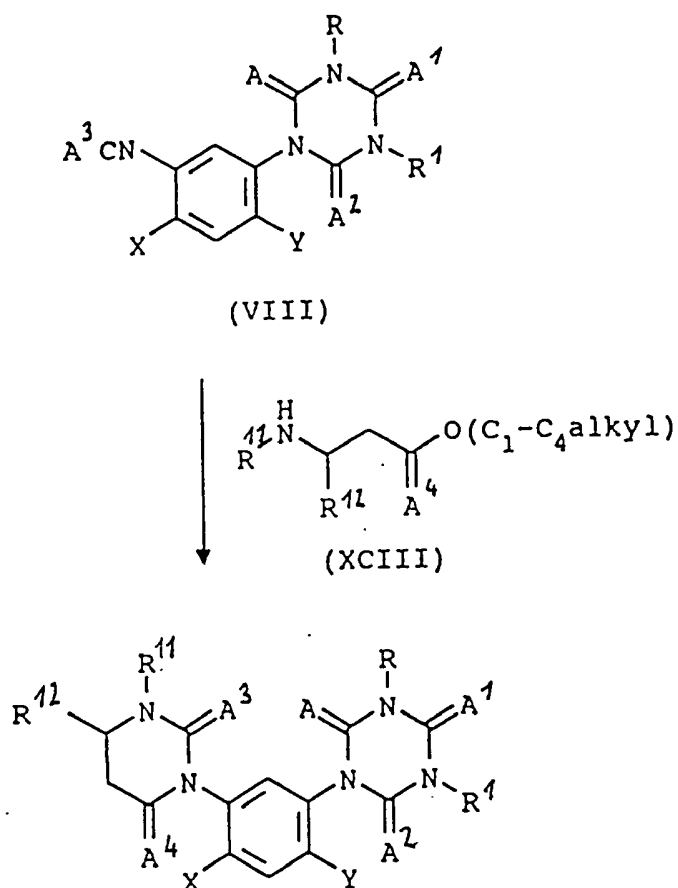


(XCI)



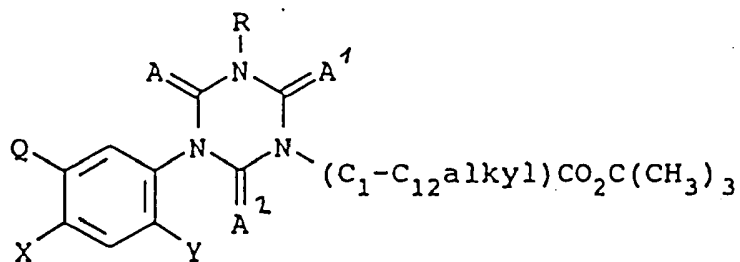
Zlúčeniny všeobecného vzorca I, kde Q predstavuje skupinu vzorca Q32, je možné vyrobiť reakciou izokyanátu alebo tioizokyanátu vzorca VIII s aminoesterom alebo amino-tioesterom vzorca XCIII v inertnom rozpúšťadle, prednostne pri zvýšenej teplote. Táto reakcia je ilustrovaná v schéme XLII.

S c h é m a X L I I

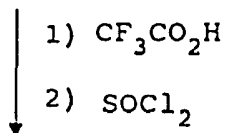


Zlúčeniny všeobecného vzorca I, kde R^3 predstavuje skupinu vzorca NR^9R^{10} , je možné vyrobiť pri použití štandardných postupov, napríklad tak, že sa hydrolyzuje vhodný ester vzorca XCIV v prítomnosti trifluóroctovej kyseliny, výsledná kyselina sa nechá reagovať s tionylchloridom, čím sa získa chlorid kyseliny vzorca XCV. Chlorid vzorca XCV sa nechá reagovať s amínom vzorca LXXXIX prípadne v prítomnosti bázy, čím sa získa požadovaný produkt. Táto reakčná sekvencia je ilustrovaná v schéme XLIII.

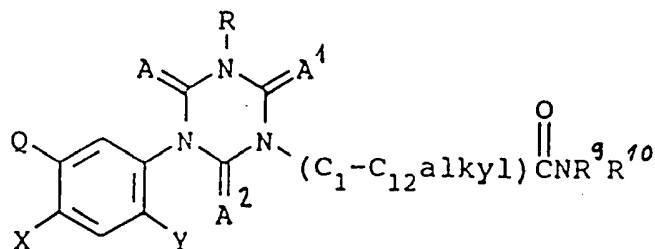
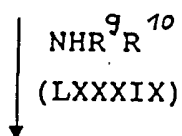
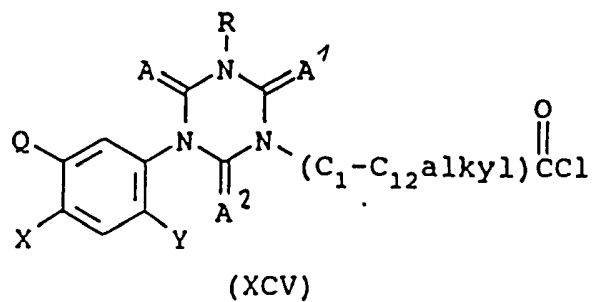
S c h é m a X L I I I



(XCIV)

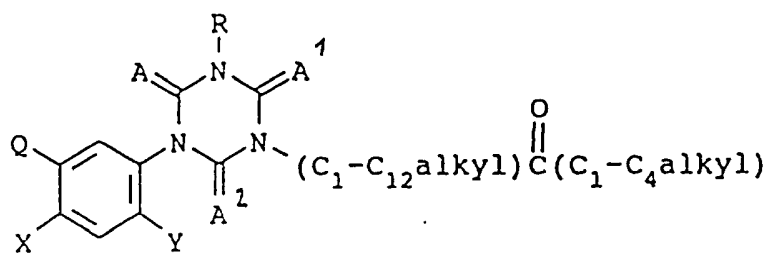
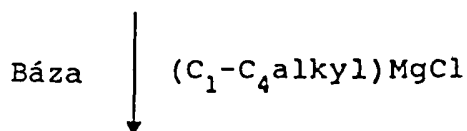
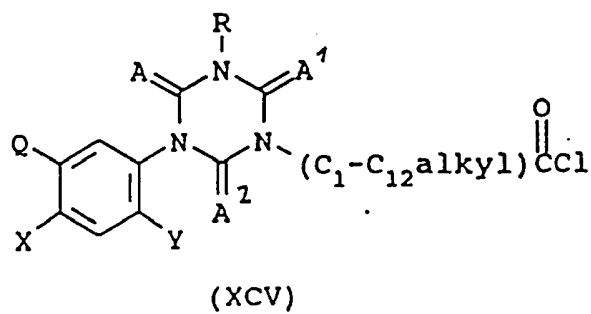


S c h é m a X L I I I - pokračovanie



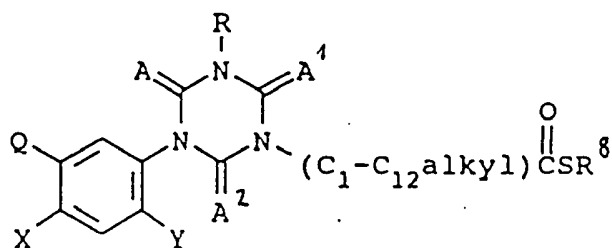
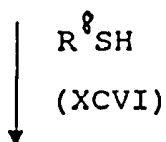
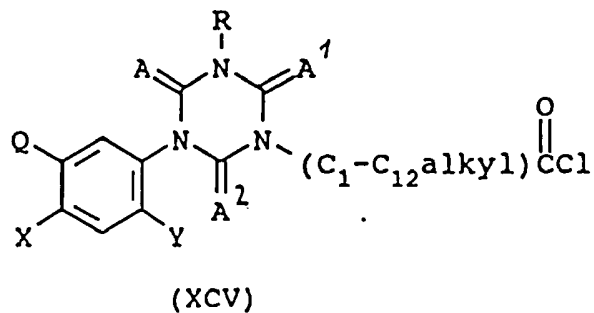
Zlúčeniny všeobecného vzorca I, kde R^1 predstavuje alkylskupinu s 1 až 12 atómami uhlíka substituovanú skupinou $\text{C}(\text{O})\text{alkyl}$ s 1 až 4 atómami uhlíka v alkylovej časti, je možné vyrobiť pri použití chloridu kyseliny vzorca XCV postupom ilustrovaným v schéme XLIV.

S c h é m a X L I V



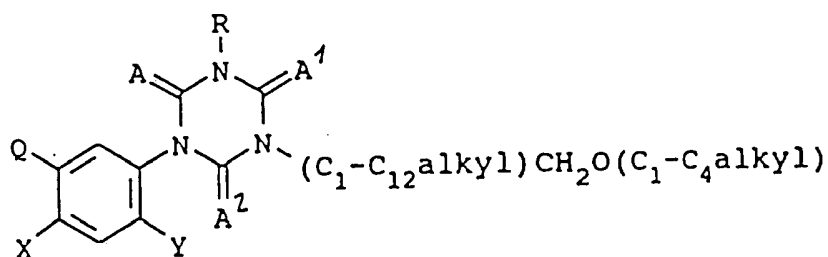
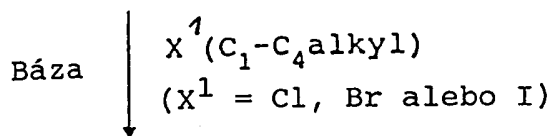
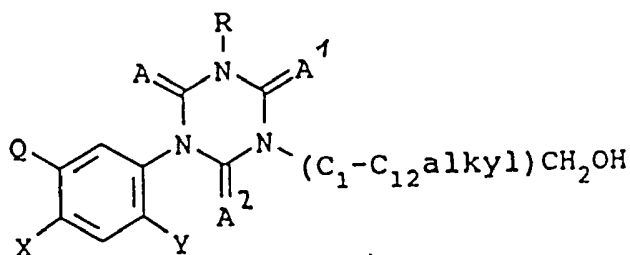
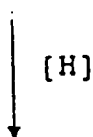
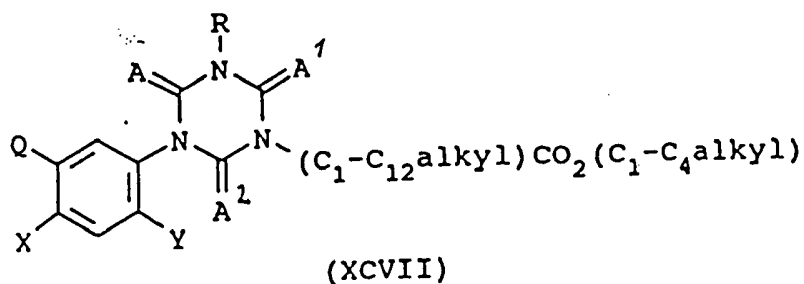
Zlúčeniny všeobecného vzorca I, kde R^3 predstavuje skupinu vzorca SR^8 , je možné vyrobiť reakciou chloridu kyseliny vzorca XCV s tiolom vzorca XCVI. Táto reakcia je ilustrovaná v schéme XLV.

S c h é m a X L V



Zlúčeniny všeobecného vzorca I, kde R^1 predstavuje alkylskupinu s 1 až 12 atómami uhlíka substituovanú jednou skupinou CH_2OR^4 , je možné vyrobiť redukciovou zlúčeniny vzorca XCVII na zlúčeninu všeobecného vzorca I, kde R^4 predstavuje atóm vodíka, ktorá sa prípadne nechá reagovať s alkylhalogenidom s 1 až 4 atómami uhlíka v prítomnosti bázy. Táto reakčná sekvencia je ilustrovaná v schéme XLVI.

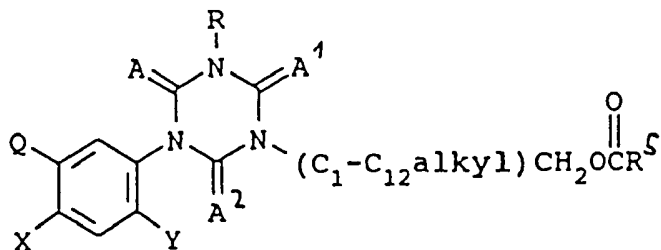
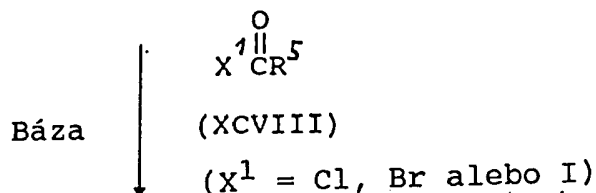
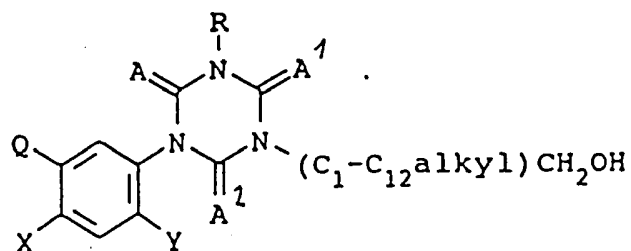
S c h é m a X L V I



Podobne je možné zlúčeniny všeobecného vzorca I, kde R^1 predstavuje alkylskupinu s 1 až 12 atómami uhlíka substituovanú jednou skupinou $\text{CH}_2\text{OC(O)R}^5$, vyrobiť reakciou zlúčeniny všeobecného vzorca I, kde R^1 predstavuje alkylskupinu s 1 až 12 atómami uhlíka substituovanú hydroxymetyl-

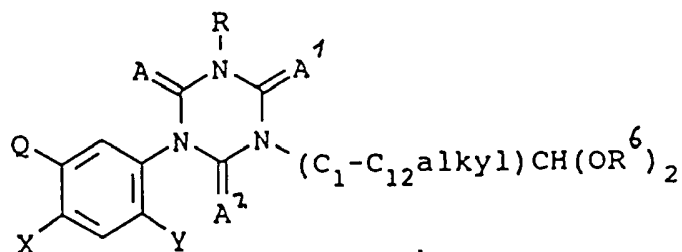
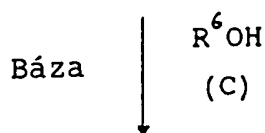
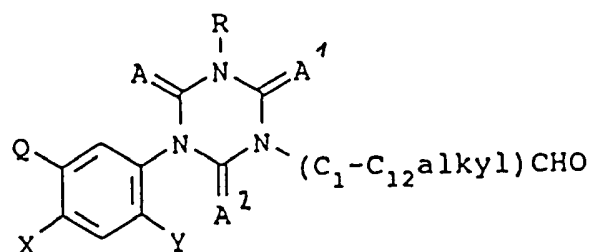
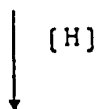
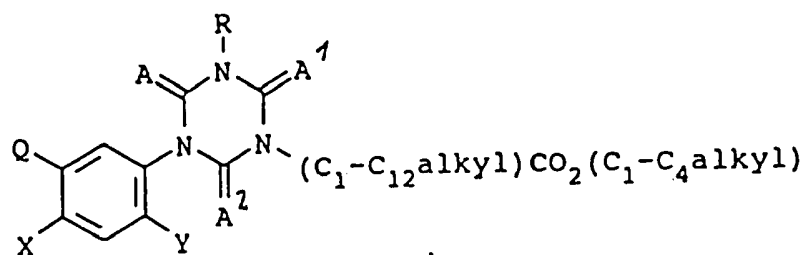
skupinou s acylhalogenidom vzorca XCVII v prítomnosti bázy. Táto reakčná sekvencia je ilustrovaná v schéme XLVII.

S c h é m a X L V I I



Zlúčeniny všeobecného vzorca I, kde R^1 predstavuje alkylskupinu s 1 až 12 atómami uhlíka substituovanú jednou skupinou CHO alebo skupinou $\text{CH}(\text{OR}^6)_2$, je možné vyrobiť redukciou zlúčeniny vzorca XCVII na aldehyd vzorca XCIX, ktorý sa nechá reagovať s alkoholom vzorca C v prítomnosti kyseliny. Táto reakčná sekvencia je ilustrovaná v schéme XLVIII.

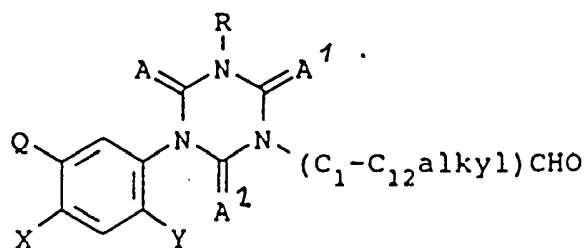
S c h é m a X L V I I I



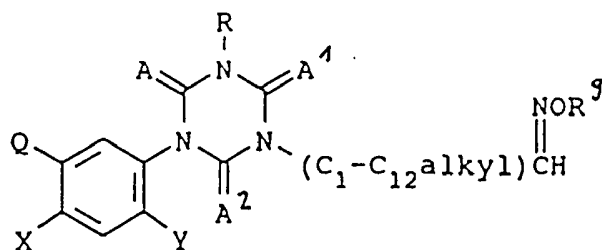
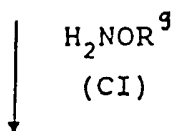
Zlúčeniny všeobecného vzorca I, kde R¹ predstavuje alkylskupinu s 1 až 12 atómami uhlíka substituovanú jednou skupinou HC=NOR⁹, je možné vyrobiť reakciou aldehydu vzorca

XCIX s amínom vzorca CI. Táto reakčná sekvencia je ilustrovaná v schéme XLIX.

S c h é m a X L I X

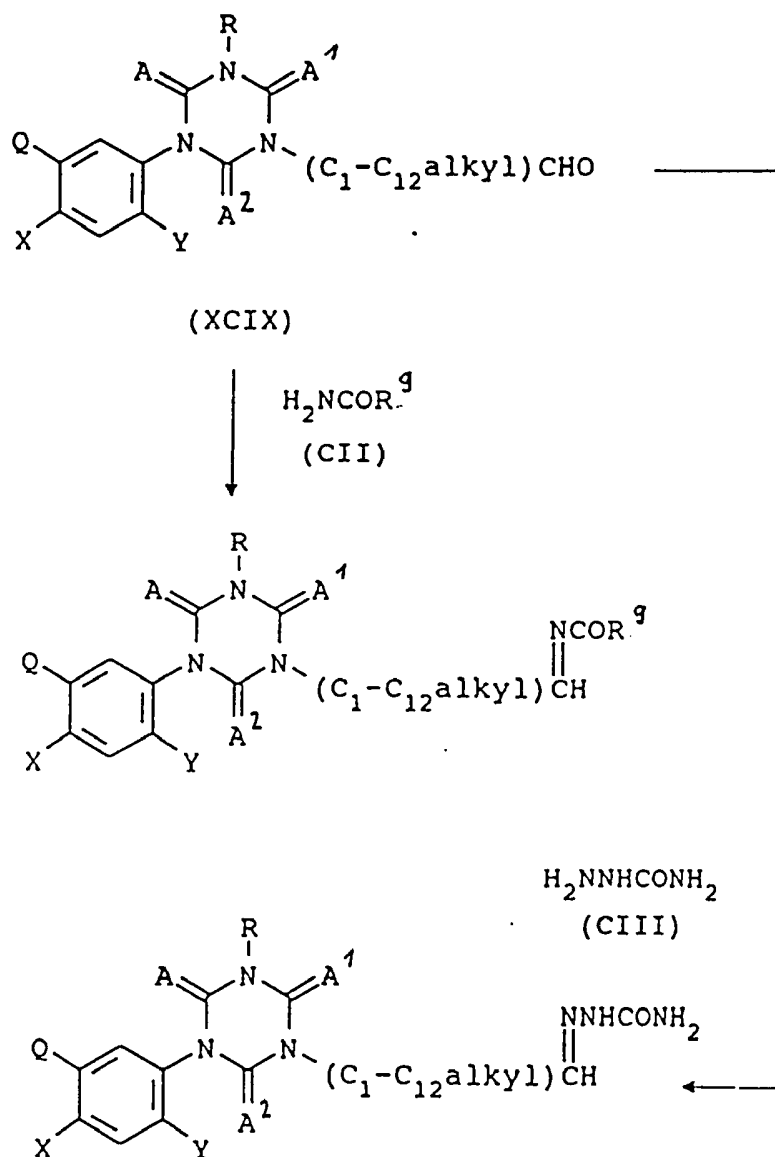


(XCIX)



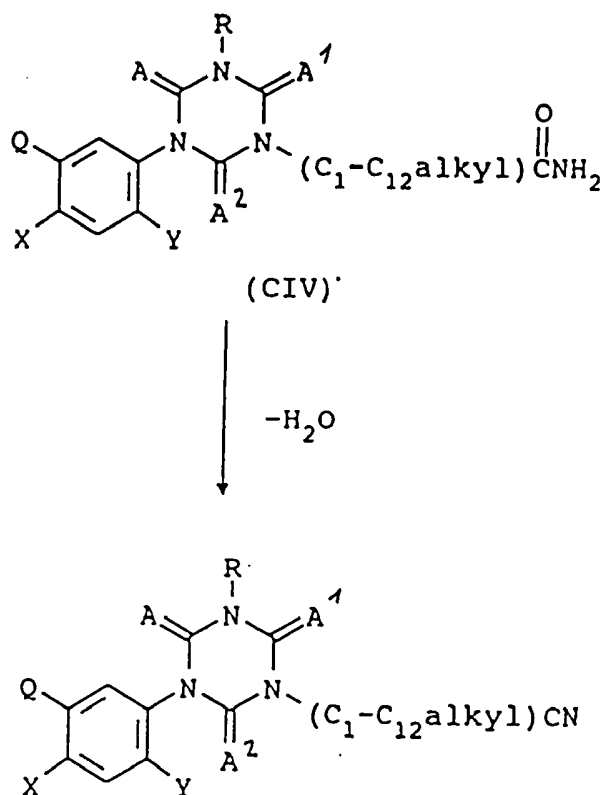
Podobne je zlúčeniny všeobecného vzorca I, kde R^1 predstavuje alkylskupinu s 1 až 12 atómami uhlíka substituo-
vanú jednou skupinou $HC=NCOR^9$ alebo skupinou $HC=NNHCONH_2$,
možné vyrobiť reakciou aldehydu vzorca XCIX s amínom vzorca
CII alebo hydrazínom vzorca CIII. Táto reakčná sekvencia je
ilustrovaná v schéme L.

S c h é m a L



Zlúčeniny všeobecného vzorca I, kde R^1 predstavuje alkylskupinu s 1 až 12 atómami uhlíka substituovanú kyano-skupinou, je možné vyrobiť dehydratáciou amidu vzorca CIV za štandardných podmienok. Táto reakcia je ilustrovaná v schéme LI.

S c h é m a L I

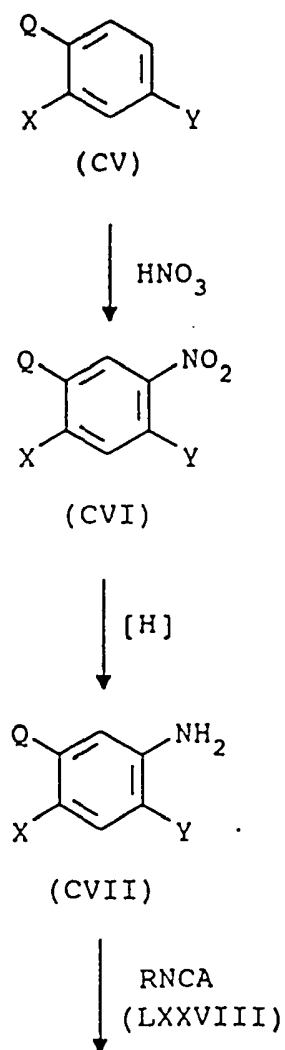


Zlúčeniny všeobecného vzorca I, kde R⁸ predstavuje atóm alkalického kovu, kovu alkalických zemín, mangánu, medi, zinku, kobaltu, striebra, niklu, amónny alebo organoamóniový katión a/alebo R predstavuje atóm alkalického kovu, je možné vyrobiť zo zlúčenín všeobecného vzorca I, kde R³ predstavuje hydroxyskupinu a/alebo R predstavuje atóm vodíka, obvyklými postupmi známymi odborníkom v tomto odbore.

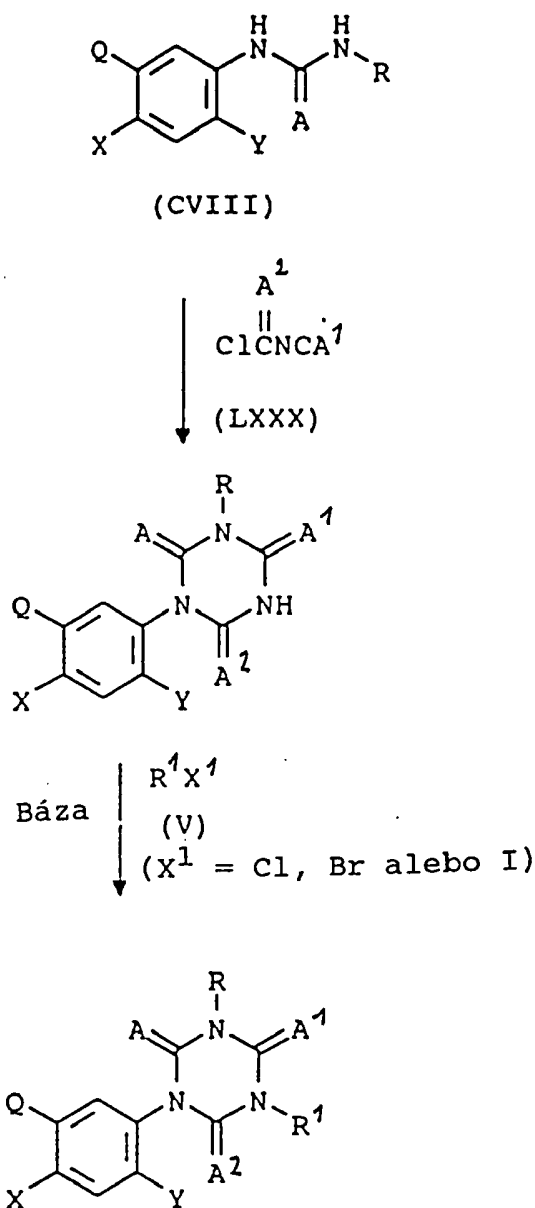
Zlúčeniny všeobecného vzorca I, je rovnako možné vyrobiť nitráciou heterocyklylfenylovej zlúčeniny vzorca CV pôsobením kyseliny dusičnej. Vzniknutá 3-nitro-1-heterocyklylfenylová zlúčenina vzorca CVI sa za štandardných podmienok redukuje na 3-amino-1-heterocyklylfenylovú zlúčeninu vzorca CVII, ktorá sa nechá reagovať s izokyanátom alebo izotiokyanátom vzorca LXXVIII. Získaná močovina alebo

tiomočovina vzorca CVIII sa cyklizuje reakciou s izokyanátom alebo izotiokyanátom vzorca LXXX, čím sa získa zlúčenina všeobecného vzorca I, kde R^1 predstavuje atóm vodíka. Túto zlúčeninu je možné alkylovať alkylačným činidlom vzorca V v prítomnosti bázy. Táto reakčná sekvencia je ilustrovaná v schéme LII.

S c h é m a L I I



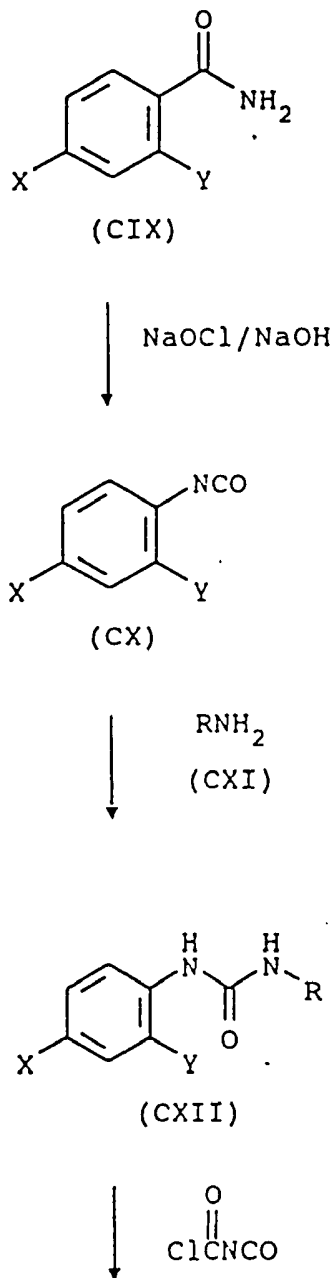
S c h é m a L I I - pokračovanie



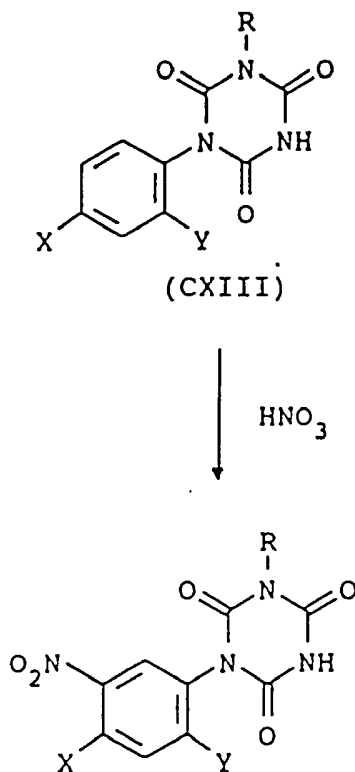
Východisková zlúčeniny vzorca II, kde A, A¹ a A² predstavujú atómy kyslíka, je možné vyrobiť reakciou amidu vzorca CIX s chlórnanom sodným a hydroxidom sodným za vzniku izokyanátu vzorca CX. Izokyanát vzorca CX sa nechá reagovať s amínom vzorca CXI na močovinu vzorca CXII, ktorá sa cykli-
zuje pôsobením N-(chlórkarbonyl)izokyanátu na trión vzorca CXIII. Trión vzorca CXIII sa nitruje reakciou s kyselinou

dusičnou. Táto reakčná sekvencia je ilustrovaná v schéme LIII.

S c h é m a L I I I

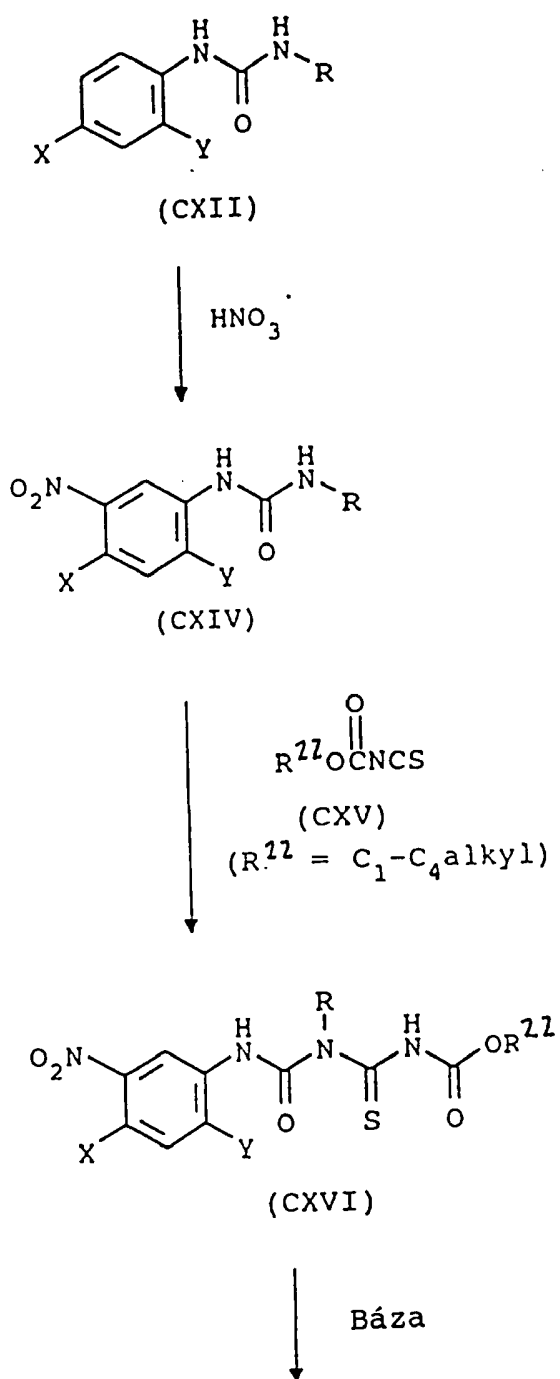


S c h é m a L I I I - pokračovanie

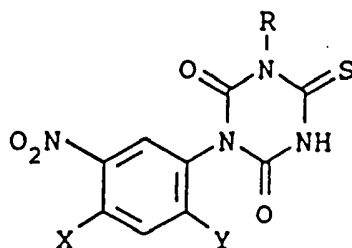


Zlúčeniny vzorca II, kde A a A² predstavujú atómy kyslíka a A¹ predstavuje atóm síry, je možné vyrobiť nitráciou močoviny vzorca CXII za vzniku intermediárnej zlúčeniny vzorca CXIV, ktorá sa nechá reagovať s izotiokyanátom vzorca CXV. Vzniknutá intermediárna zlúčenina vzorca CXVI sa cyklizuje pôsobením bázy. Táto reakčná sekvencia je ilustrovaná v schéme LIV.

S c h é m a L I V

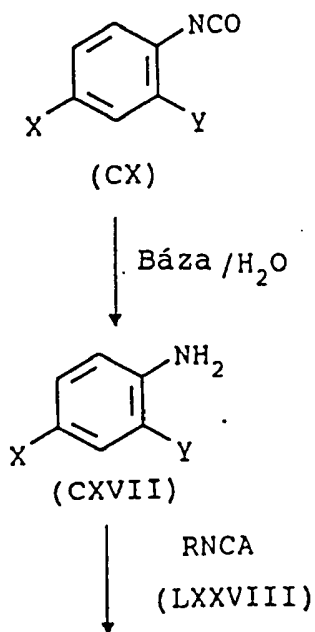


S c h é m a L I V - pokračovanie

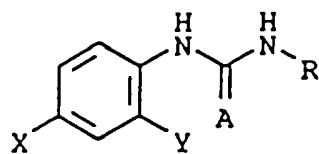


Zlúčeniny všeobecného vzorca II, kde A predstavuje atóm kyslíka alebo síry, A¹ predstavuje atóm síry a A² predstavuje atóm kyslíka, je možné vyrobiť reakciou izokyanátu vzorca CX s vodnou bázou za vzniku amínu vzorca CXVII. Amín vzorca CXVII sa nechá reagovať s izokyanátom alebo izotio- kyanátom vzorca LXXVIII na močovinu vzorca CXVIII, ktorá sa nitruje za vzniku intermediárnej zlúčeniny vzorca CXIX. Táto intermediárna zlúčenina sa nechá reagovať s izotio- kyanátom vzorca CXV na intermediárnu zlúčeninu vzorca CXX, ktorá sa pôsobením bázy cyklizuje. Táto reakčná sekvencia je ilustro- vaná v schéme LV.

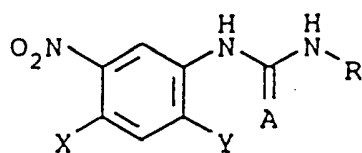
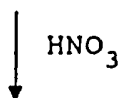
S c h é m a L V



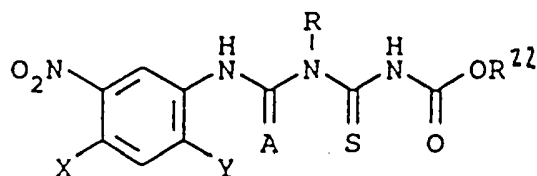
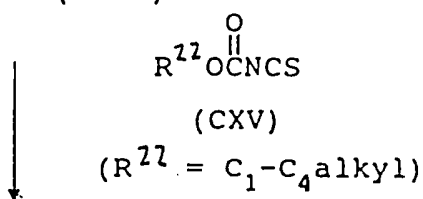
S c h é m a L V - pokračovanie



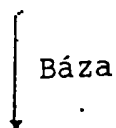
(CXVIII)



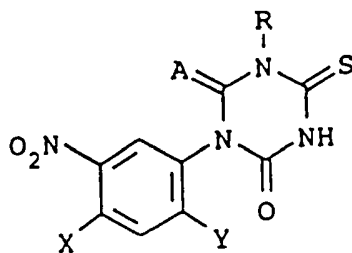
(CXIX)



(CXX)

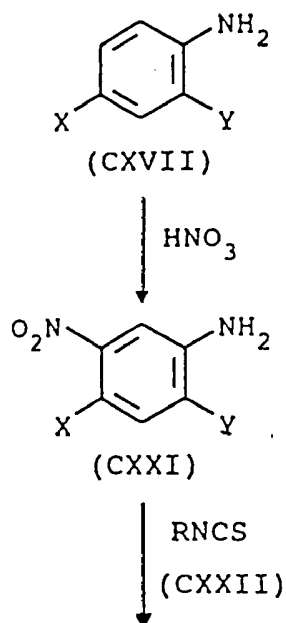


S c h é m a L V - pokračovanie

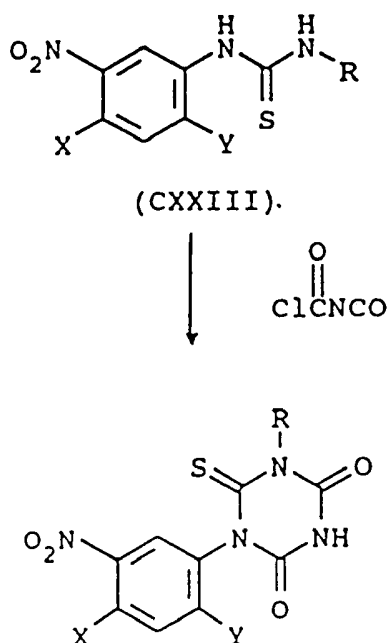


Zlúčeniny vzorca II, kde A predstavuje atóm síry a A^1 a A^2 predstavujú atómy kyslíka, je možné vyrobiť nitráciou amínu vzorca CXVII za vzniku 3-nitroanilínu vzorca CXXI. 3-nitroanilín vzorca CXXI sa nechá reagovať s izotio- kyanátom vzorca CXXII na tiomočovinu vzorca CXXIII, ktorá sa cyklizuje reakciou s N-(chlórkarbonyl)izokyanátom. Táto reakčná sekvencia je ilustrovaná v schéme LVI.

S c h é m a L V I

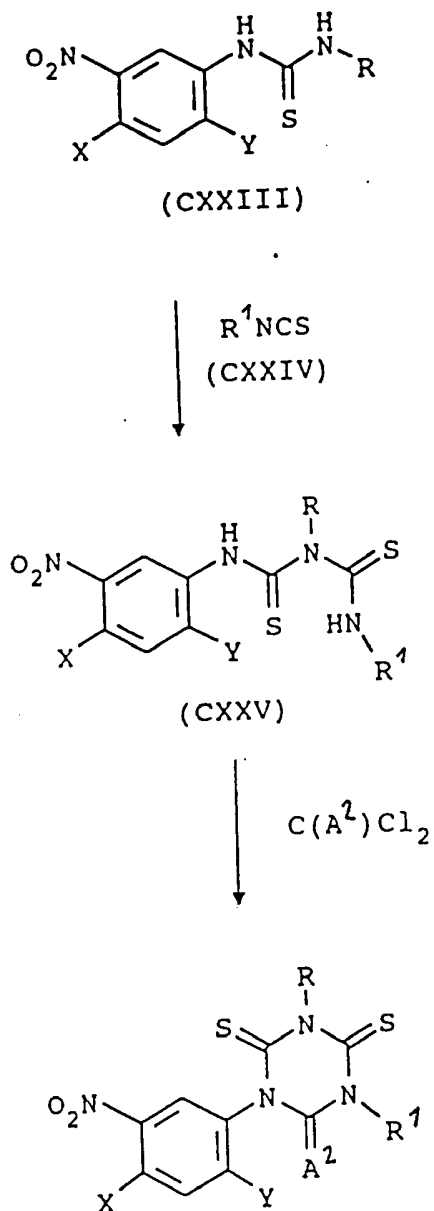


S c h é m a L V I - pokračovanie



Zlúčeniny vzorca VI, kde A a A¹ predstavujú atómy síry a A² predstavuje atóm kyslíka alebo síry, je možné vyrobiť reakciou tiomočoviny vzorca CXXIII s izotiokyanátom vzorca CXXIV za vzniku intermediárnej zlúčeniny vzorca CXXV, ktorá sa cyklizuje reakciou s fosgénom alebo tiofosgénom. Táto reakčná sekvencia je ilustrovaná v schéme LVII.

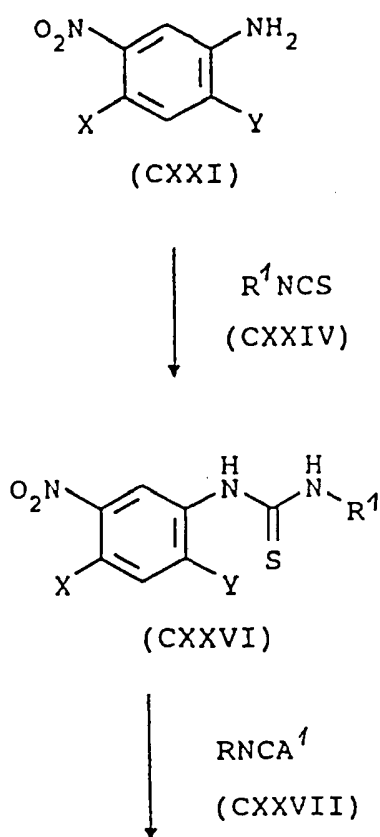
S c h é m a L V I I



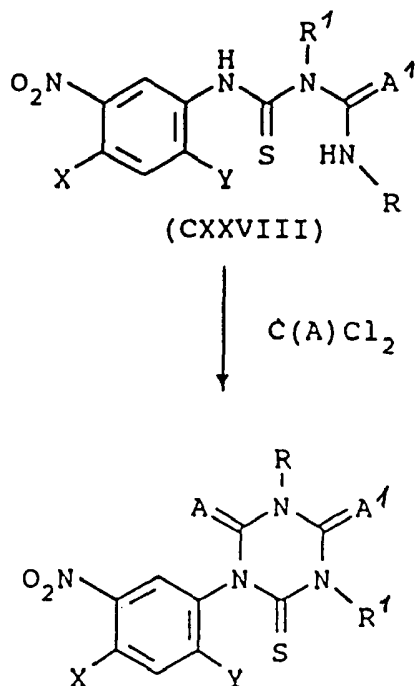
Zlúčeniny vzorca VI, kde A a A¹ predstavuje každý nezávisle atóm kyslíka alebo síry a A² predstavuje atóm síry, je možné vyrobiť reakciou amínu vzorca CXXI s izotiokyanátom

vzorca CXXIV za vzniku tiomočoviny vzorca CXXVI. Tiomočovina vzorca CXXVI sa nechá reagovať s izokyanátom alebo izotio-
kyanátom vzorca CXXVII na intermediárnu zlúčeninu vzorca
CXXVIII, ktorá sa cyklizuje reakciou s fosgénom alebo tio-
fosgénom. Táto reakčná sekvencia je ilustrovaná v schéme
LVIII.

S c h é m a L V I I I

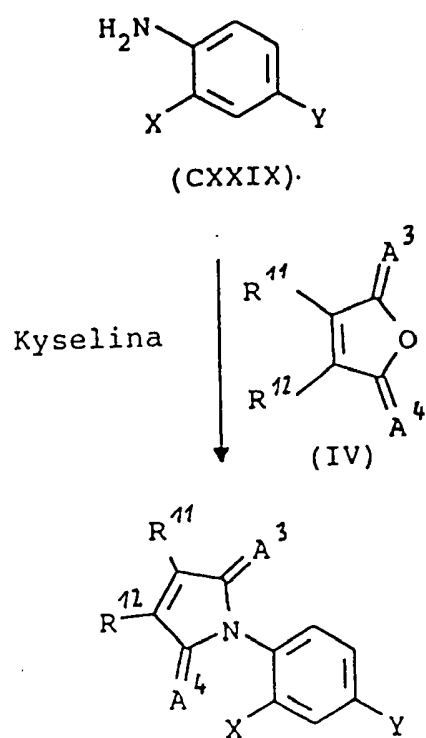


S c h é m a L V I I I - pokračovanie



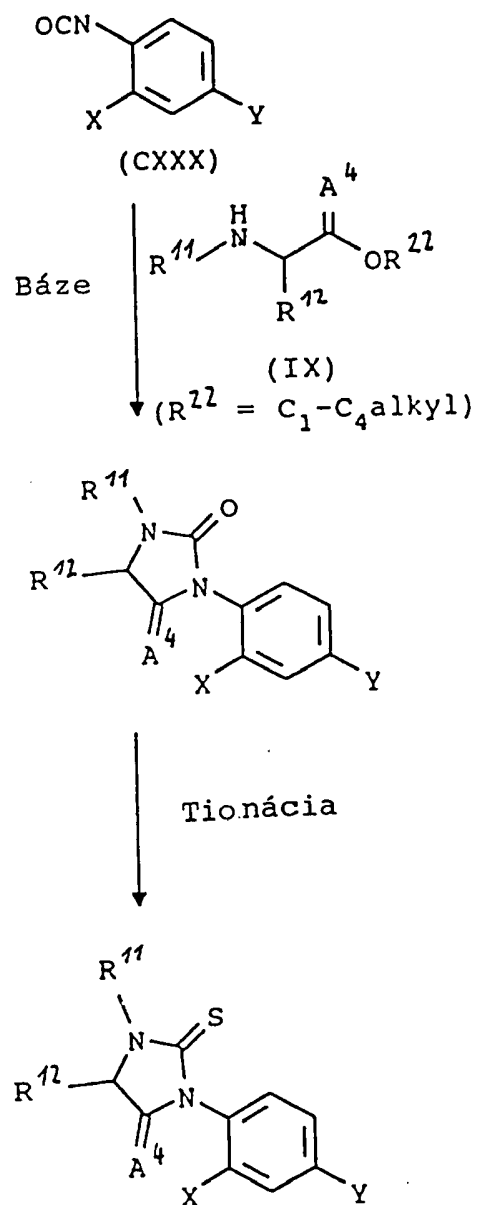
Východiskovú zlúčeninu vzorca CV, kde Q predstavuje skupinu vzorca Q1, je možné vyrobiť reakciou anilínu vzorca CXXIX s anhydridom vzorca IV v prítomnosti kyseliny, ako kyseliny octovej. Táto reakcia je ilustrovaná v schéme LIX.

S c h é m a L I X



Zlúčeniny vzorca CV, kde Q predstavuje skupinu vzorca Q2 a Z predstavuje skupinu CH, je možné vyrobiť reakciou izokyanátu vzorca CXXX s aminoesterom vzorca IX v prítomnosti bázy a prípadnou tionáciou vzniknutej zlúčeniny tionačným činidlom, ako je Lawessonove reakčné činidlo alebo sulfidom fosforečným P_4S_{10} . Táto reakcia je ilustrovaná v schéme LX.

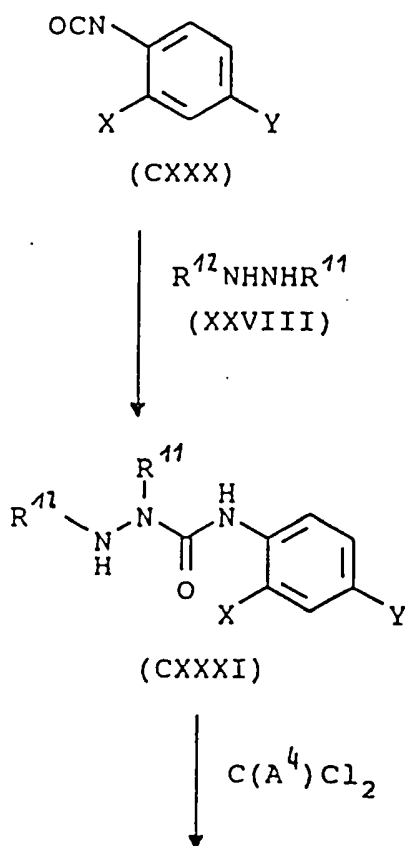
S c h é m a L X



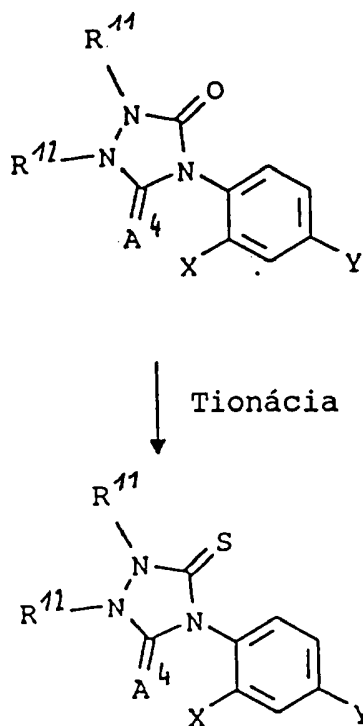
Východiskové zlúčeniny vzorca CV, kde Q predstavuje skupinu vzorca Q2 a Z predstavuje atóm dusíka, je možné vyrobiť reakciou izokyanátu vzorca CXXX so substituovaným

hydrazínom vzorca XXVIII za vzniku intermediárnej zlúčeniny vzorca CXXXI. Intermediárna zlúčenina vzorca CXXXI sa nechá reagovať s fosgénom alebo tiofosgénom a vzniknutá zlúčenina vzorca CV, kde Q predstavuje skupinu vzorca Q2, Z predstavuje atóm dusíka a A³ predstavuje atóm kyslíka, sa prípadne podrobí tionácii. Táto reakčná sekvencia je ilustrovaná v schéme LXI.

S c h é m a L X I

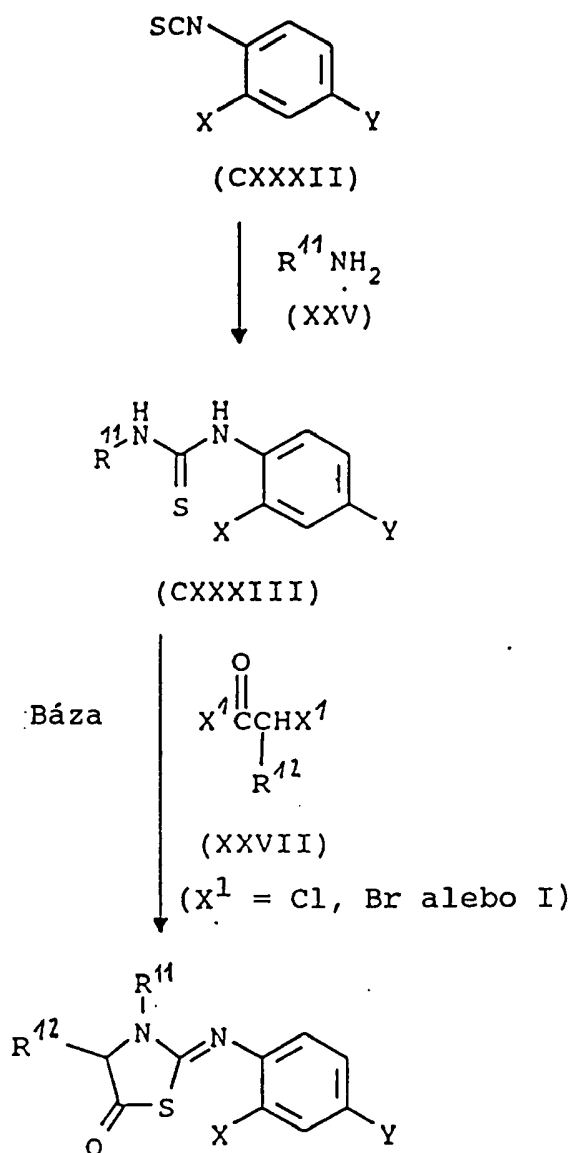


S c h é m a L X I - pokračovanie



Zlúčeniny všeobecného vzorca CV, kde Q predstavuje skupinu vzorca Q11, A³ predstavuje atóm síry, A⁴ predstavuje atóm kyslíka a Z predstavuje skupinu CH, je možné vyrobiť reakciou izotiokyanátu vzorca CXXXII s amínom vzorca XXV za vzniku tiomočoviny vzorca CXXXIII, ktorá sa v prítomnosti bázy nechá reagovať s α-halogénkarbonylhalogenidom vzorca XXVII. Táto reakčná sekvencia je ilustrovaná v schéme LXII.

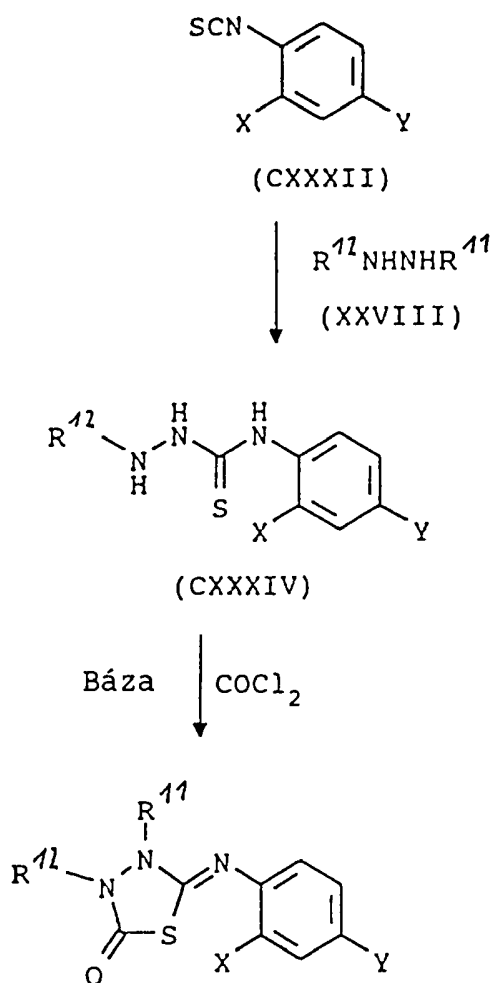
S c h é m a L X I I



Východiskové zlúčeniny vzorca CV, kde Q predstavuje skupinu vzorca Q11, A³ predstavuje atóm síry, A⁴ predstavuje atóm kyslíka a Z predstavuje atóm dusíka, je možné vyrobiť reakciou izotiokyanátu vzorca CXXXII so substituovaným hydrazínom vzorca XXVIII za vzniku intermediárnej zlúčeniny vzorca CXXXIV. Intermediárna zlúčenina vzorca CXXXIV sa nechá reagovať s fosgénom alebo vhodným ekvivalentom fosgénu

v prítomnosti bázy, ako je trietylamin. Táto reakčná sekven-
cia je ilustrovaná v schéme LXIII.

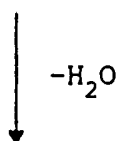
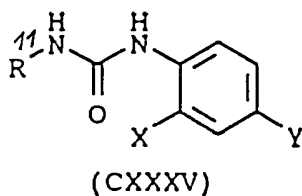
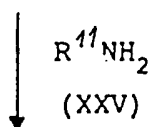
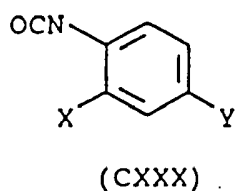
S c h é m a L X I I I



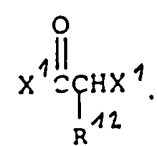
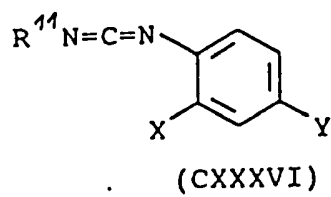
Zlúčeniny vzorca CV, kde Q predstavuje skupinu
vzorca Q11, A³ a A⁴ predstavujú atómy kyslíka a Z predsta-
vuje skupinu CH, je možné vyrobiť reakciou izokyanátu vzorca
CXXX s amínom vzorca XXV za vzniku močoviny vzorca CXXXV,

ktorá sa dehydratuje na karbodiimid vzorca CXXXVI. Karbodiimid vzorca CXXXVI sa nechá reagovať s α -halogénkarbonylhalogenidom vzorca XXVII na halogénamidín vzorca CXXXVII, ktorý sa hydrolyzuje pôsobením vodnej kyseliny za vzniku acylmočoviny. Acylmočovina sa in situ zahrieva, čím vznikne O-acylmočovina vzorca CXXXVIII, ktorá sa nechá reagovať s bázou, ako trietylaminom. Táto reakčná sekvencia je ilustrovaná v schéme LXIV.

S c h é m a L X I V

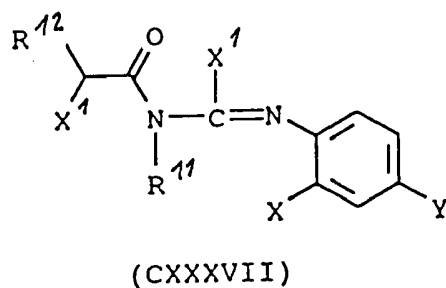


S c h é m a L X I V - pokračovanie



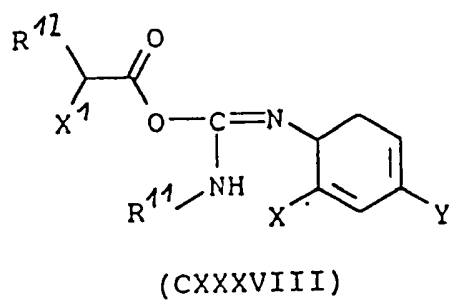
(XXVII)

(X¹ = Cl, Br alebo I)



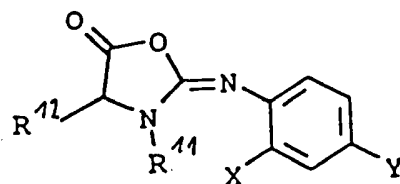
1) H₃O⁺

2) Δ

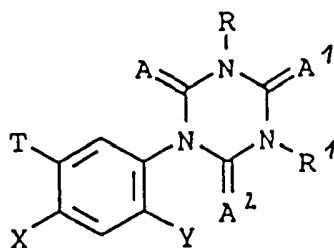


Báza

S c h é m a L X I V - pokračovanie



Predmetom vynálezu sú rovnako intermediárne zlúčeniny, ktoré sú užitočné pre prípravu zlúčenín všeobecného vzorca I. Štruktúra týchto intermediárnych zlúčenín zodpovedá všeobecnému vzorci CXXXIX

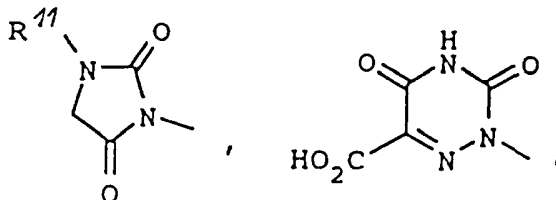


(CXXXIX)

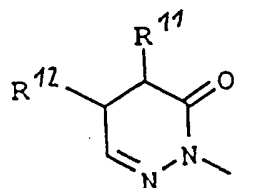
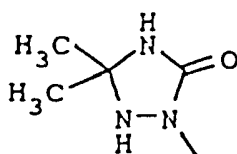
kde

T

predstavuje skupinu vzorca $-NH_2$, $-NCO$, $-NCS$, $-N_3$, $-NHNH_2$, $-NHC(S)NHR^{11}$, $-C(O)NHNHR^{13}$, $-C(O)H$, $-C(O)CH_3$, $-C(O)CO_2$ (alkyl s 1 až 4 atómami uhlíka), $-C(O)CH_2C(O)R^{11}$, $-C(O)CH_2C(A^3)O$ (alkyl s 1 až 4 atómami uhlíka), $-CO_2$ (alkyl s 1 až 4 atómami uhlíka), $-N=C=NR^{11}$, $-NHC(O)NHR^{11}$, $-NHC(S)NR^{11}HNR^{12}$, $-N=C(SCH_3)NHR^{11}$, $-NHCO_2$ (alkyl s 1 až 4 atómami uhlíka), $-C(Cl)=NOH$,



alebo



- X a Y predstavuje každý nezávisle atóm vodíka, atóm halogénu, nitroskupinu, kyanoskupinu, alkylskupinu s 1 až 4 atómami uhlíka, halogénalkylskupinu s 1 až 4 atómami uhlíka, alkoxy skupinu s 1 až 4 atómami uhlíka, halogénalkoxy skupinu s 1 až 4 atómami uhlíka alebo skupinu vzorca $S(O)_m R^2$;
- m predstavuje celé číslo 0, 1 alebo 2;
- R^2 predstavuje alkylskupinu s 1 až 4 atómami uhlíka alebo halogénalkylskupinu s 1 až 4 atómami uhlíka;
- R predstavuje atóm vodíka, alkylskupinu s 1 až 6 atómami uhlíka, alkoxyalkylskupinu s 2 až 12 atómami uhlíka, alkylkarbonylalkylskupinu s 3 až 12 atómami uhlíka, halogénalkylkarbonylalkylskupinu s 3 až 12 atómami uhlíka, alkoxykarbonylalkylskupinu s 3 až 12 atómami uhlíka, halogénalkoxykarbonylalkylskupinu s 3 až 12 atómami uhlíka, alkenylskupinu s 3 až 6 atómami uhlíka, alkynylskupinu s 3 až 6 atómami uhlíka,
- fenylskupinu, ktorá je prípadne substituovaná jedným až tromi substituentmi zvolenými zo súboru zahrňajúceho atóm halogénu, alkylskupinu s 1 až 4 atómami uhlíka, alkoxy skupinu s 1 až 4 atómami uhlíka a halogénalkoxy skupinu s 1 až 4 atómami uhlíka, alebo
- benzylskupinu, ktorá je prípadne substituovaná jedným až tromi substituentmi zvolenými zo súboru zahrňajúceho atóm halogénu, alkylskupinu s 1 až 4 atómami uhlíka, alkoxy skupinu s 1 až 4 atómami uhlíka a halogénalkoxy skupinu s 1 až 4 atómami uhlíka;

R^1 predstavuje atóm vodíka, alkenylskupinu s 3 až 6 atómami uhlíka, alkynylskupinu s 3 až 6 atómami uhlíka, kyanoskupinu,

alkylskupinu s 1 až 12 atómami uhlíka, ktorá je prípadne substituovaná jedným alebo viacerými atómami halogénu alebo jedným substituentom zvoleným zo súboru zahŕňajúceho kyanoskupinu, skupinu vzorca $C(O)R^3$, $OC(O)R^5$, $CH_2OC(O)R^5$, OR^4 , CH_2OR^4 a $CR^6(OR^7)_2$ alebo jednou fenylskupinou, ktorá je prípadne substituovaná jedným až tromi substituentmi zvolenými zo súboru zahŕňajúceho atóm halogénu, alkylskupinu s 1 až 4 atómami uhlíka, alkoxy skupinu s 1 až 4 atómami uhlíka a halogénalkoxy skupinu s 1 až 4 atómami uhlíka, alebo

fenylskupinu, ktorá je prípadne substituovaná jedným až tromi substituentmi zvolenými zo súboru zahŕňajúceho atóm halogénu, alkylskupinu s 1 až 4 atómami uhlíka, alkoxy skupinu s 1 až 4 atómami uhlíka a halogénalkoxy skupinu s 1 až 4 atómami uhlíka;

R^3 predstavuje skupinu vzorca OR^8 , SR^8 alebo NR^9R^{10} ;

R^4 , R^5 a R^6 predstavuje každý nezávisle atóm vodíka, alkylskupinu s 1 až 4 atómami uhlíka alebo halogénalkylskupinu s 1 až 4 atómami uhlíka;

R^7 predstavuje alkylskupinu s 1 až 4 atómami uhlíka;

R^8 predstavuje

alkylskupinu s 1 až 6 atómami uhlíka, ktorá je prípadne substituovaná substituentom zvoleným zo súboru zahrňajúceho alkoxy skupinu s 1 až 4 atómami uhlíka, alkyltioskupinu s 1 až 4 atómami uhlíka, atóm halogénu, hydroxyskupinu, cykloalkylskupinu s 3 až 6 atómami uhlíka, furylskupinu a fenylskupinu, ktorá je prípadne substituovaná jedným alebo viacerými substituentmi zvolenými zo súboru zahrňajúceho atóm halogénu, kyanoskupinu, nitroskupinu, alkylskupinu s 1 až 4 atómami uhlíka, halogénalkylskupinu s 1 až 4 atómami uhlíka, alkoxy skupinu s 1 až 4 atómami uhlíka a halogénalkoxy skupinu s 1 až 4 atómami uhlíka,

alkenylskupinu s 3 až 6 atómami uhlíka, ktorá je prípadne substituovaná substituentom zvoleným zo súboru zahrňajúceho alkoxy skupinu s 1 až 4 atómami uhlíka, atóm halogénu, cykloalkylskupinu s 3 až 6 atómami uhlíka a fenylskupinu, ktorá je prípadne substituovaná jedným alebo viacerými substituentmi zvolenými zo súboru zahrňajúceho atóm halogénu, kyanoskupinu, nitroskupinu, alkylskupinu s 1 až 4 atómami uhlíka, halogénalkylskupinu s 1 až 4 atómami uhlíka, alkoxy skupinu s 1 až 4 atómami uhlíka a halogénalkoxy skupinu s 1 až 4 atómami uhlíka,

alkinylskupinu s 3 až 6 atómami uhlíka, ktorá je prípadne substituovaná alkoxy skupinou s 1 až 4 atómami uhlíka alebo atómom halogénu; alebo

cykloalkylskupinu s 3 až 6 atómami uhlíka;

R^9 a R^{10} predstavuje každý nezávisle vždy atóm vodíka, alkylskupinu s 1 až 6 atómami uhlíka,

benzylskupinu, ktorá je prípadne substituovaná jedným alebo viacerými substituentmi zvolenými zo súboru zahrňajúceho atóm halogénu, kyanoskupinu, nitroskupinu, alkylskupinu s 1 až 4 atómami uhlíka, halogénalkylskupinu s 1 až 4 atómami uhlíka, alkoxy skupinu s 1 až 4 atómami uhlíka a halogénalkoxy skupinu s 1 až 4 atómami uhlíka, alebo

fenylskupinu, ktorá je prípadne substituovaná jedným alebo viacerými substituentmi zvolenými zo súboru zahrňajúceho atóm halogénu, kyanoskupinu, nitroskupinu, alkylskupinu s 1 až 4 atómami uhlíka, halogénalkylskupinu s 1 až 4 atómami uhlíka, alkoxy skupinu s 1 až 4 atómami uhlíka a halogénalkoxy skupinu s 1 až 4 atómami uhlíka;

R^{11} a R^{12} predstavuje nezávisle vždy

atóm vodíka,

alkylskupinu s 1 až 6 atómami uhlíka, ktorá je prípadne substituovaná jedným alebo viacerými atómami halogénu, alebo

cykloalkylskupinu s 3 až 6 atómami uhlíka, ktorá je prípadne substituovaná jedným alebo viacerými atómami halogénu, a ďalej

R^{11} a R^{12} dohromady s atómami, ku ktorým sú pripojené, predstavujú štvor- až sedemčlenný nasýtený alebo nenasýtený kruh, ktorý je prípadne prerušený atómom kyslíka, $S(O)_r$ alebo atómom dusíka a ktorý je prípadne substituovaný jednou až tromi metylskupinami alebo jedným alebo viacerými atómami halogénu;

R^{13} predstavuje atóm vodíka, alkylskupinu s 1 až 3 atómami uhlíka alebo halogénalkylskupinu s 1 až 3 atómami uhlíka;

A , A^1 , A^2 a A^3 predstavuje nezávisle vždy atóm kyslíka alebo síry; a

r predstavuje celé číslo 0, 1 alebo 2.

Prednosť sa venuje intermediárnym zlúčeninám vzorca CXXXIX, kde

T predstavuje skupinu $-NH_2$, $-NCO$, $-NCS$, $-N_3$, $-NHNH_2$, $-NHC(S)NHR^{11}$, $-NHC(O)NHR^{11}$, $-NHC(S)NR^{11}NHR^{12}$ alebo $-N=C=NR^{11}$;

X predstavuje atóm vodíka alebo halogénu;

Y predstavuje atóm vodíka, atóm halogénu, nitro-skupinu alebo kyanoskupinu;

R predstavuje atóm vodíka, alkylskupinu s 1 až 4 atómami uhlíka, alkoxymetylskupinu s 1 až 4 atómami uhlíka v alkoxylovej časti, alkoxykarbonylmetylskupinu s 1 až 4 atómami uhlíka v alkoxylovej časti, alkenylskupinu s 3 až 6 atómami uhlíka alebo alkynylskupinu s 3 až 6 atómami uhlíka;

R^1 predstavuje atóm vodíka, alkenylskupinu s 3 až 6 atómami uhlíka, alkynylskupinu s 3 až 6 atómami uhlíka alebo alkylskupinu s 1 až 6 atómami uhlíka, ktorá je prípadne substituovaná jednou skupinou CO_2R^8 ;

R^8 predstavuje alkylskupinu s 1 až 6 atómami uhlíka;

R^{11} a R^{12} predstavuje nezávisle vždy atóm vodíka alebo alkylskupinu s 1 až 4 atómami uhlíka, alebo R^{11} a R^{12} dohromady s atómami, ku ktorým sú pripojené, tvoria kruh, v ktorom zoskupenie $R^{11}R^{12}$ predstavuje alkylénskupinu s 2 až 5 atómami uhlíka, ktorá je prípadne prerušená zvyškom $S(O)_r$ a ktorá je prípadne substituovaná jednou až tromi metylskupinami alebo jedným alebo viacerými atómami halogénu;

A , A^1 a A^2 predstavuje každý atóm kyslíka; a

r predstavuje celé číslo 0, 1 alebo 2.

Väčšia prednosť sa venuje intermediárnym zlúčeninám podľa vynálezu všeobecného vzorca CXXXIX,

kde

T predstavuje skupinu $-NH_2$, $-NCO$, $-NCS$, $-NHC(S)NHR^{11}$ alebo $-NHC(O)NHR^{11}$;

X a Y predstavuje každý nezávisle atóm vodíka, fluóru alebo chlóru;

R predstavuje atóm vodíka, alkylskupinu s 1 až 4 atómami uhlíka, alkoxymetylskupinu s 1 až 4 atómami uhlíka v alkoxylovej časti, alkoxykarbonylmetylskupinu s 1 až 4 atómami uhlíka v alkoxylovej časti, alylskupinu alebo propargylskupinu;

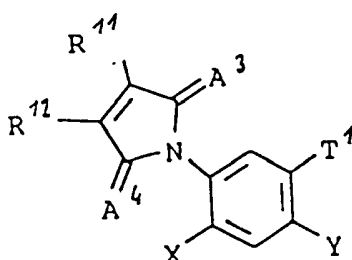
R^1 predstavuje atóm vodíka, alylskupinu, propargylskupinu alebo alkylskupinu s 1 až 4 atómami uhlíka, ktorá je prípadne substituovaná jednou skupinou CO_2R^8 ;

R^8 predstavuje alkylskupinu s 1 až 4 atómami uhlíka;

R^{11} predstavuje atóm vodíka alebo alkylskupinu s 1 až 4 atómami uhlíka; a

A, A^1 a A^2 predstavuje každý atóm kyslíka.

Predmetom vynálezu sú tiež intermediárne zlúčeniny všeobecného vzorca CXL



(CXL)

kde

T^1 predstavuje skupinu NO_2 , NH_2 alebo $-NHC(A)NHR$;

A, A^3 a A^4 predstavuje každý nezávisle atóm kyslíka alebo síry;

X a Y predstavuje každý nezávisle atóm vodíka, atóm halogénu, nitroskupinu, kyanoskupinu, alkylskupinu s 1 až 4 atómami uhlíka, halogénalkylskupinu s 1 až 4 atómami uhlíka, alkoxy skupinu s 1 až 4 atómami uhlíka, halogénalkoxy skupinu s 1 až 4 atómami uhlíka alebo skupinu vzorca $S(O)_m R^2$;

m predstavuje celé číslo 0, 1 alebo 2;

R^2 predstavuje alkylskupinu s 1 až 4 atómami uhlíka alebo halogénalkylskupinu s 1 až 4 atómami uhlíka;

R predstavuje atóm vodíka, alkylskupinu s 1 až 6 atómami uhlíka, alkoxyalkylskupinu s 2 až 12 atómami uhlíka, alkylkarbonylalkylskupinu s 3 až 12 atómami uhlíka, halogénalkylkarbonylalkylskupinu s 3 až 12 atómami uhlíka, alkoxykarbonylalkylskupinu s 3 až 12 atómami uhlíka, halogénalkoxykarbonylalkylskupinu s 3 až 12 atómami uhlíka, alkenylskupinu s 3 až 6 atómami uhlíka, alkynylskupinu s 3 až 6 atómami uhlíka,

fenylskupinu, ktorá je prípadne substituovaná jedným až tromi substituentmi zvolenými zo súboru zahŕňajúceho atóm halogénu, alkylskupinu s 1 až 4 atómami uhlíka, alkoxy skupinu s 1 až 4 atómami uhlíka a halogénalkoxy skupinu s 1 až 4 atómami uhlíka, alebo

benzylskupinu, ktorá je prípadne substituovaná jedným až tromi substituentmi zvolenými zo súboru zahŕňajúceho atóm halogénu, alkylskupinu s 1 až 4 atómami uhlíka, alkoxy skupinu s 1 až 4 atómami uhlíka a halogénalkoxy skupinu s 1 až 4 atómami uhlíka;

R^{11} a R^{12} predstavuje nezávisle vždy

atóm vodíka,

alkylskupinu s 1 až 6 atómami uhlíka, ktorá je prípadne substituovaná jedným alebo viacerými atómami halogénu, alebo

cykloalkylskupinu s 3 až 6 atómami uhlíka, ktorá je prípadne substituovaná jedným alebo viacerými atómami halogénu, a ďalej tiež

R^{11} a R^{12} dohromady s atómami, ku ktorým sú pripojené, predstavujú štvor- až sedemčlenný nasýtený alebo nenasýtený kruh, ktorý je prípadne prerušený atómom kyslíka, $S(O)_r$ alebo atómom dusíka a ktorý je prípadne substituovaný jednou až tromi metylskupinami alebo jedným alebo viacerými atómami halogénu; a

r predstavuje celé číslo 0, 1 alebo 2.

Prednosť sa venuje intermediárnym zlúčeninám všeobecného vzorca CXL, kde

T^1 predstavuje skupinu NO_2 , NH_2 alebo $-NHC(O)NHR$;

A^3 a A^4 predstavuje každý atóm kyslíka;

X a Y predstavuje každý nezávisle atóm vodíka alebo atóm halogénu;

R predstavuje alkylskupinu s 1 až 6 atómami uhlíka, alkenylskupinu s 3 až 6 atómami uhlíka alebo alkinylskupinu s 3 až 6 atómami uhlíka;

R^{11} a R^{12} dohromady s atómami, ku ktorým sú pripojené, tvoria kruh, v ktorom zoskupenie $R^{11}R^{12}$ predstavuje alkylénskupinu s 2 až 5 atómami uhlíka, ktorá je prípadne prerušená zvyškom $S(O)_r$ a ktorá je prípadne substituovaná jednou až tromi metylskupinami alebo jedným alebo viacerými atómami halogénu, alebo $R^{11}R^{12}$ predstavuje skupinu $-CR^{18}=CR^{19}-CR^{20}=CR^{21}-$, kde R^{18} , R^{19} , R^{20} a R^{21} predstavuje každý nezávisle atóm vodíka, atóm halogénu alebo metylskupinu; a

r predstavuje celé číslo 0, 1 alebo 2.

Väčšia prednosť sa venuje intermediárnym zlúčeninám všeobecného vzorca CXL, kde

T^1 predstavuje skupinu NO_2 , NH_2 alebo $-NHC(O)NHR$;

A^3 a A^4 predstavuje každý atóm kyslíka;

X predstavuje atóm fluóru alebo chlóru;

Y predstavuje atóm chlóru;

R predstavuje alkylskupinu s 1 až 4 atómami uhlíka, alylskupinu alebo propargylskupinu; a

R^{11} a R^{12} dohromady s atómami, ku ktorým sú pripojené, tvoria kruh, v ktorom zoskupenie $R^{11}R^{12}$ predstavuje butylénskupinu, ktorá je prípadne substituovaná jednou až tromi metylskupinami.

Zlúčeniny všeobecného vzorca I podľa tohto vynálezu sú účinnými herbicídnyimi činidlami, ktorá sú užitočné pre potlačovanie celého radu nežiadúcich druhov rastlín. Tieto zlúčeniny sú účinné pre potlačovanie burinových rastlín ako v suchej, tak zamokrenej pôde. Sú tiež užitočné ako vodné herbicídy. Zlúčeniny podľa vynálezu sa môžu aplikovať na listy, pôdu alebo do vody obsahujúcej semená alebo iné rozmnožovacie orgány nežiadúcich druhov rastlín, ako sú odnože, hlúzy alebo rhizómy, v dávke v rozmedzí asi od 0,016 do asi 4,0 kg/ha a prednostne od asi 0,032 do asi 2,0 kg/ha.

Zlúčeniny podľa vynálezu všeobecného vzorca I sa najlepšie hodia pre použitie ako širokospektrálne herbicídy, najmä pri postemergentnej aplikácii na miesto, na ktorom sa má potlačenie buriny dosiahnuť. Určité zlúčeniny podľa

vynálezu sú však selektívne. Niektoré z nich sú napríklad selektívne pri aplikácii v kultúrach takých plodín, ako je sója, ryža a kukurica.

Zlúčeniny podľa vynálezu síce účinne potlačujú nežiadúce druhy rastlín, i keď sa používajú samotné, ale môžu sa tiež pri použití kombinovať s inými biologickými chemikáliami, vrátane iných herbicídov.

Zlúčeniny všeobecného vzorca I podľa tohto vynálezu je možné aplikovať na plodiny v podobe pevného alebo kvapalného herbicídneho prostriedku obsahujúceho herbicídne účinné množstvo zlúčeniny všeobecného vzorca I, ktoré je dispergované alebo rozpustené v inertnom pevnom alebo kvapalnom agronomicky vhodnom nosiči. Prostriedky podľa vynálezu je možné aplikovať preemergentne alebo postemergentne.

S výhodou je možné zlúčeniny všeobecného vzorca I spracovávať na emulgovateľné koncentráty, namáčateľné prášky, granulárne prostriedky, tekuté koncentráty apod.

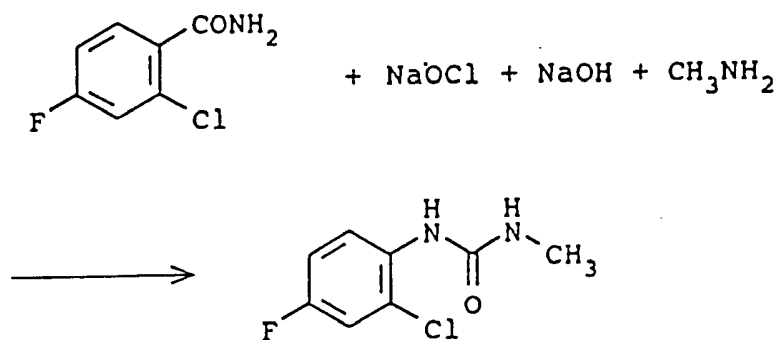
Vynález je bližšie objasnený v nasledujúcich príkladoch rozpracovania. Tieto príklady majú výhradne ilustratívny význam a v žiadnom ohľade rozsah vynálezu neobmedzujú. Pre rozsah ochrany sú rozhodujúce pripojené patentové nároky.

Skratkou NMR sa označuje nukleárna magnetická rezonančná spektroskopia.

Príklady rozpracovania vynálezu

P r í k l a d 1

Príprava 1-(2-chlór-4-fluórfenyl)-3-metylmočoviny

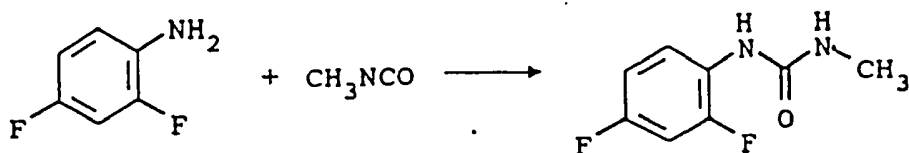


Zmes 50% roztoku hydroxidu sodného (28 g, 0,35 mol) a 5% roztoku chlórnanu sodného (226 ml) sa pri 0°C pridá k zmesi 2'-chlór-4'-fluórbenzamidu (50 g, 0,288 mol) v metanole. Po dokončení prídavku sa k zmesi pri 0°C pridá 55 ml 40% roztoku metylamínu. Výsledná reakčná zmes sa 6 hodín za miešania zahrieva na 55°C, ochladí na teplotu miestnosti a prefiltruje. Získaná pevná látka sa premyje postupne vodou a hexánmi a vysuší na vzduchu. Získa sa zlúčenina uvedená v nadpise vo forme bielej pevnej látky (30 g) s teplotou topenia 174 až 178°C.

V podstate rovnakým postupom, ale pri použití 2',4'-dichlórbenzamidu namiesto 2'-chlór-4'-fluórbenzamidu, sa získa 1-(2,4-dichlórphenyl)-3-metylmočovina vo forme béžovej pevnej látky.

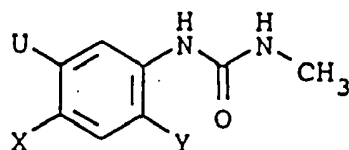
Pr í k l a d 2

Pr í p r a v a 1-(2,4-difluórfenyl)-3-metylmočoviny



Metylizokyanát (9,6 g, 10 ml, 0,174 mol) sa pridá k roztoku 2,4-difluóranilínu (15 g, 0,116 mol) v toluéne. Reakčná zmes sa mieša 1 hodinu a potom sa z nej filtráciou oddelí pevná látka. Táto pevná látka sa premyje hexánmi a vysuší na vzduchu. Získa sa zlúčenina uvedená v nadpise vo forme špinavo bielej pevnej látky s teplotou topenia 182 až 183°C.

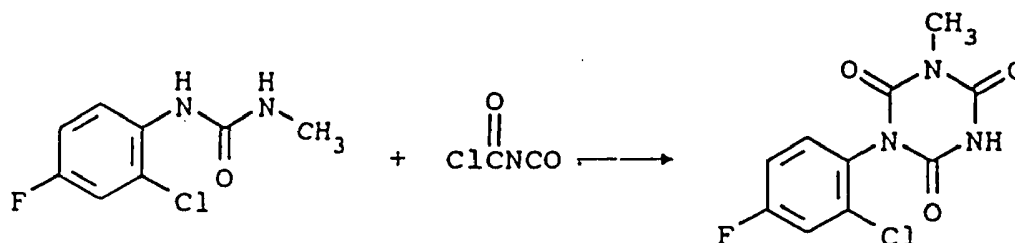
V podstate rovnakým spôsobom, ale pri použití vhodne substituovaného anilínu, sa vyrobia nasledujúce zlúčeniny:



<u>U</u>	<u>X</u>	<u>Y</u>	<u>t.t. (°C)</u>
NO ₂	H	F	229-232
H	F	Cl	-

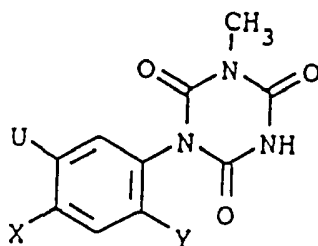
P r í k l a d 3

Príprava 1-(2-chlór-4-fluórfenyl)-3-metyl-s-triazín-2,4,6-(1H,3H,5H)-triónu



N-(Chlórkarbonyl)izokyanát (18,97 g, 0,180 mol) sa pridá k zmesi 1-(2-chlór-4-fluórfenyl)-3-metylmočoviny (29,2 g, 0,144 mol) v toluéne. Reakčná zmes sa mieša 90 minút a prefiltruje. Získa sa 32,1 g zlúčeniny uvedenej v nadpise vo forme bielej pevnej látky s teplotou topenia 225 až 228°C.

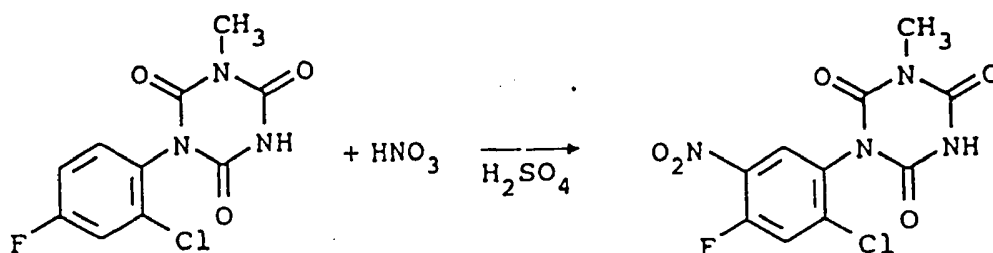
V podstate rovnakým spôsobom, ale pri použití vhodne substituovanej močoviny sa vyrobia nasledujúce zlúčeniny:



<u>U</u>	<u>X</u>	<u>Y</u>	<u>t.t. (°C)</u>
H	F	F	242-245
H	Cl	Cl	200-204
NO ₂	H	F	180-183

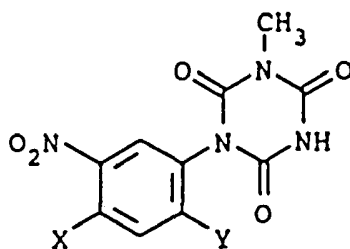
P r í k l a d 4

Príprava 1-(2-chlór-4-fluór-5-nitrofenyl)-3-metyl-s-triazín-2,4,6(1H,3H,5H)-triónu



Kyselina dusičná (70%, 8,3 ml, 0,131 mol) sa pridá k roztoku 1-(2-chlór-4-fluórfenyl)-3-metyl-s-triazín-2,4,6-(1H,3H,5H)-triónu (32,4 g, 0,119 mol) v koncentrovanej kyseline sírovej, pričom sa teplota reakčnej zmesi udržiava pod 10°C . Po dokončení prídavku sa reakčná zmes mieša 30 minút pri teplote miestnosti, ochladí na 10°C a zriedi ľadovou vodou. Vzniknutá vodná zmes sa prefiltruje a oddelená pevná látka sa premyje vodou a vysuší na vzduchu. Získa sa 28,5 g zlúčeniny uvedenej v nadpise vo forme bielej pevnej látky s teplotou topenia 135 až 139°C .

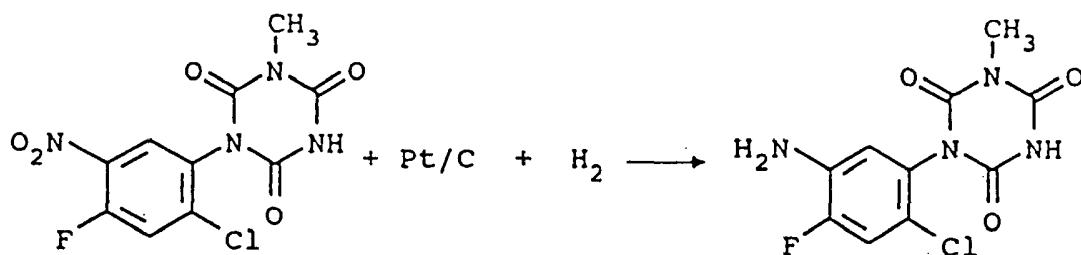
V postate rovnakým spôsobom, ale pri použití vhodne substituovaného 1-fenyl-3-metyl-s-triazín-2,4,6(1H,3H,5H)-triónu sa získajú nasledujúce zlúčeniny:



<u>X</u>	<u>Y</u>	<u>t.t. (°C)</u>
F	F	100-120
Cl	Cl	220-222

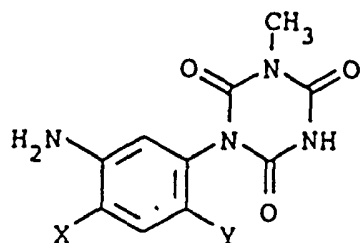
P r í k l a d 5

Príprava 1-(5-amino-2-chlór-4-fluórfenyl)-3-metyl-s-triazín-2,4,6(1H,3H,5H)-triónu



Zmes 1-(2-chlór-4-fluór-5-nitrofenyl)-3-metyl-s-triazín-2,4,6(1H,3H,5H)-triónu (28,5 g, 0,09 mol) a 5% platiny na aktívnom uhlí (1 g) v etylacetáte sa hydrogenuje za tlaku 378 kPa až do skončenia absorpcie vodíka. Reakčná zmes sa potom prefiltruje a filtrát sa skoncentruje pri zníženom tlaku. Získa sa zlúčenina uvedená v nadpise vo forme bielej pevnej látky s teplotou topenia 244 až 245°C.

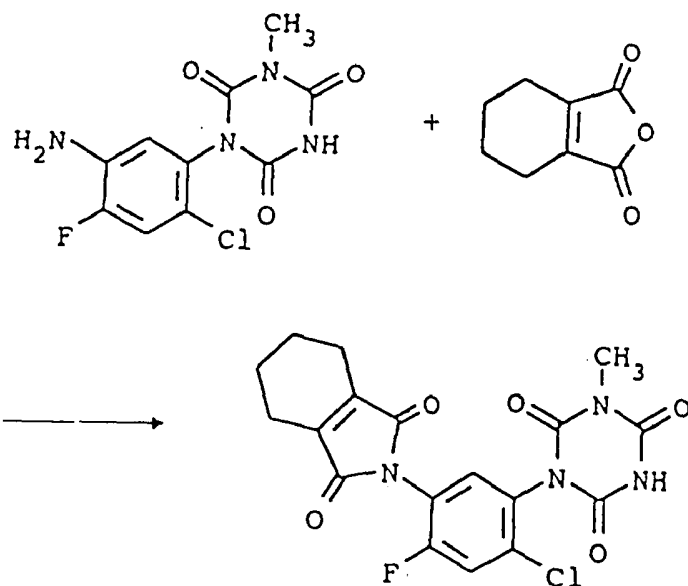
V podstate rovnakým spôsobom, ale pri použití vhodne substituovaného 1-nitrofenyl-3-metyl-s-triazín-2,4,6-(1H,3H,5H)-triónu sa vyrobia nasledujúce zlúčeniny:



<u>X</u>	<u>Y</u>	<u>t.t.(°C)</u>
F	F	194-196
Cl	Cl	145-151
H	F	

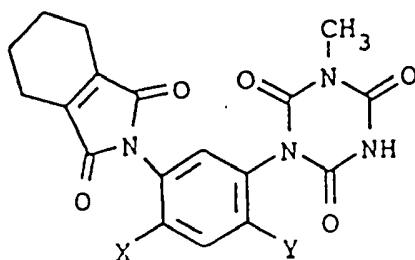
P r í k l a d 6

Príprava 1-[4-chlór-2-fluór-5-(hexahydro-3-metyl)-2,4,6-trioxo-s-triazín-1-yl]fenyl]-1-cyklohexén-1,2-dikarboximidu



Zmes 1-(5-amino-2-chlór-4-fluórfenyl)-3-metyl-s-triazín-2,4,6(1H,3H,5H)-triónu (23,4g, 0,0816 mol) a anhydridu 3,4,5,6-tetrahydroftalovej kyseliny (13,04 g, 0,0857 mol) v ľadovej kyseline octovej sa mieša 8 hodín pri 100°C, ochladí na 25°C a naleje do vody. Výsledná vodná zmes sa prefiltruje a oddelená pevná látka sa premyje vodou a vysuší za vákua. Získa sa zlúčenina uvedená v nadpise (22,5 g) vo forme béžovej pevnej látky s teplotou topenia 154 až 165°C.

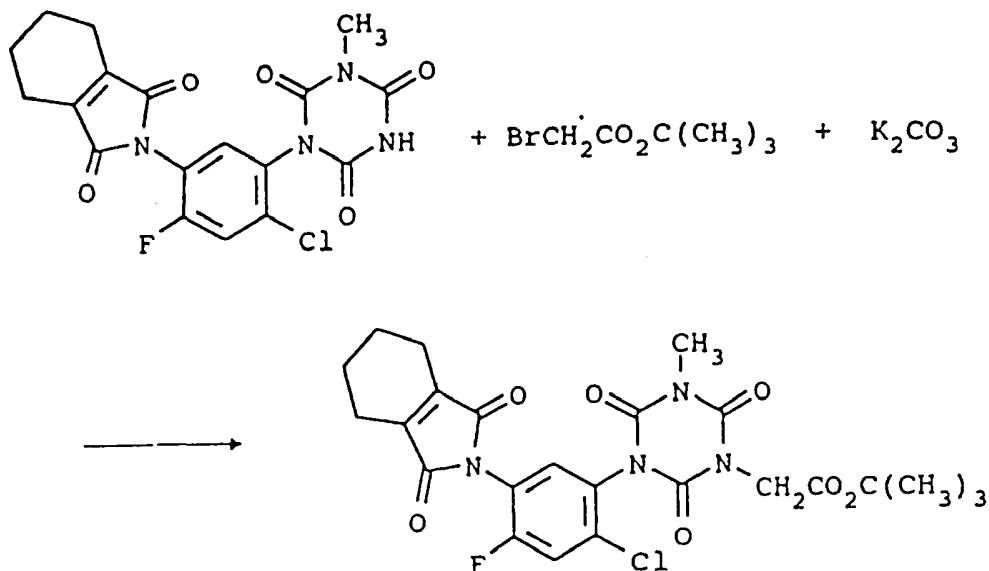
V podstate rovnakým spôsobom, ale pri použití vhodne substituovaného 1-(aminofenyl)-3-metyl-s-triazín-2,4,6-(1H,3H,5H)-triónu sa vyrobia nasledujúce zlúčeniny:



<u>X</u>	<u>Y</u>	<u>t.t. (°C)</u>
F	F	135-150
Cl	Cl	125-135
H	F	

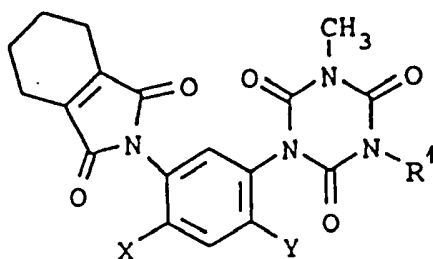
P r í k l a d 7

Príprava terc.butyl-3-[2-chlór-5-(1-cyklohexén-1,2-dikarboximido)-4-fluórfenyl]tetrahydro-5-metyl-2,4,6-trioxo-s-triazín-1(2H)-acetátu



Zmes 1-[4-chlór-2-fluór-5-(hexahydro-3-metyl)-2,4,6-trioxo-s-triazín-1-yl)fenyl]-1-cyklohexén-1,2-dikarboximidu (8 g, 0,0199 mol) a uhličitanu draselného (4,13 g, 0,0299 mol) v N,N-dimetylformamide sa zmieša s terc.butylbrómacetátom (5,82 g, 0,0299 mol). Vzniknutá zmes sa mieša 18 hodín pri teplote miestnosti a naleje do vody. Vodná zmes sa prefiltruje a oddelená pevná látka sa premyje vodou a vysuší na vzduchu. Získa sa 6,13 g zlúčeniny uvedenej v nadpise vo forme bielej pevnej látky s teplotou topenia 105 až 115°C.

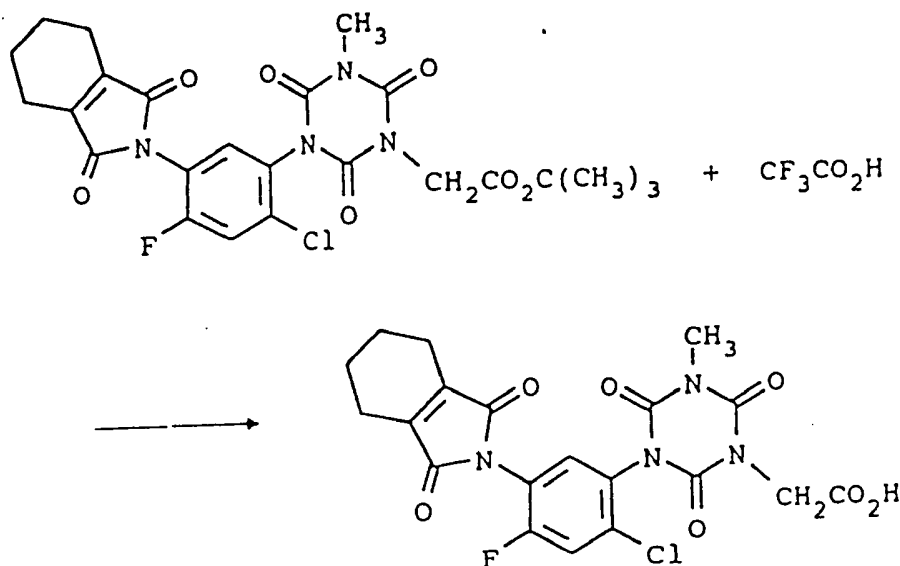
V podstate rovnakým spôsobom, ale pri použití vhodne substituovaného 1-[5-(hexahydro-3-metyl-2,4,6-trioxo-s-triazín-1-yl)fenyl]-1-cyklohexén-1,2-dikarboximidu a vhodného alkylačného činidla sa získajú nasledujúce zlúčeniny:



<u>X</u>	<u>Y</u>	<u>R¹</u>	<u>t.t. (°C)</u>
F	F	CH ₂ CO ₂ CH ₃	100-115
F	Cl	CH ₂ CO ₂ CH ₃	95-110
Cl	Cl	CH ₂ CO ₂ C(CH ₃) ₃	95-100
Cl	Cl	CH ₂ CO ₂ CH ₃	120-125
H	F	CH ₂ CO ₂ CH ₃	110-120
F	Cl	CH ₂ CH=CH ₂	91-106
F	Cl	CH ₂ C≡CH	105-122

P r í k l a d 8

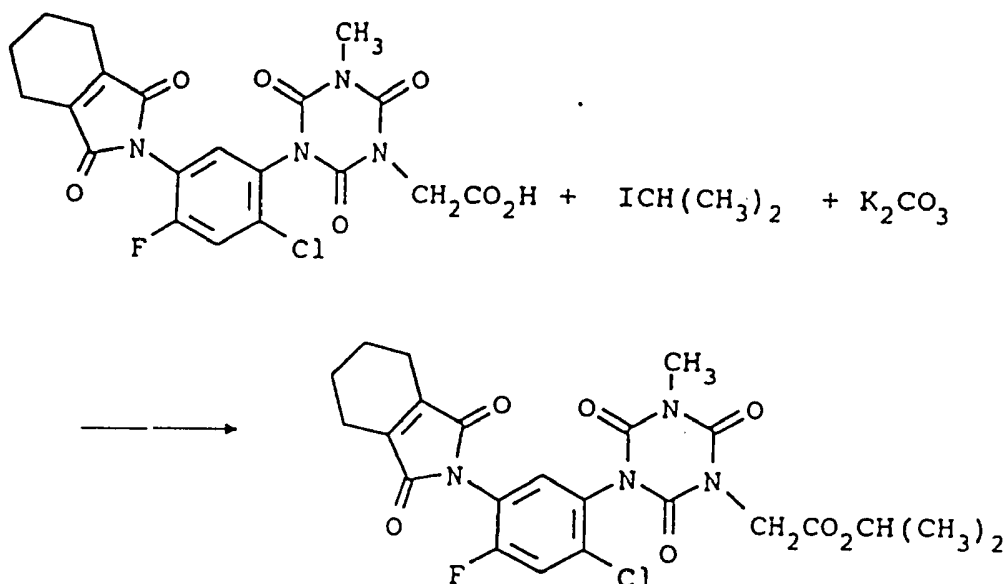
Príprava 3-[2-chlór-5-(1-cyklohexén-1,2-dikarboximido)-4-fluórfenyl]tetrahydro-5-metyl-2,4,6-trioxo-s-triazín-1(2H)-octovej kyseliny



Roztok terc.butyl-3-[2-chlór-5-(1-cyklohexén-1,2-dikarboximido)-4-fluórfenyl]tetrahydro-5-metyl-2,4,6-trioxo-s-triazín-1(2H)-acetátu (5,92 g, 0,011 mol) v trifluóroctovej kyseline sa 2 hodiny zahrieva k spätnému toku, ochladí na teplotu miestnosti a skoncentruje pri zníženom tlaku. Jantárovo zafarbený živcový zvyšok sa rozpustí v étere a výsledný roztok sa skoncentruje pri zníženom tlaku. Získa sa zlúčenina uvedená v nadpise (3,62 g) vo forme žltej pevné látky s teplotou topenia 75 až 80°C.

P r í k l a d 9

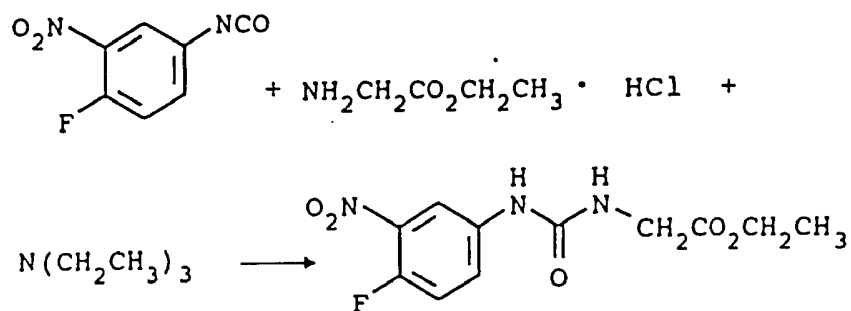
Príprava izopropyl-3-[2-chlór-5-(1-cyklohexén-1,2-dikarboximido)-4-fluórfenyl]tetrahydro-5-metyl-2,4,6-trioxo-s-triazín-1(2H)-acetátu



Roztok 3-[2-chlór-5-(1-cyklohexén-1,2-dikarboximido)-4-fluórfenyl]tetrahydro-5-metyl-2,4,6-trioxo-s-triazín-1(2H)-octovej kyseliny (1,5 g, 3,13 mmol) v N,N-dimetylformamidu sa zmieša s 2-jódpropánom (0,849 g, 5 mmol) a uhličitanom draselným (0,69 g, 5 mmol). Vzniknutá zmes sa mieša cez noc pri teplote miestnosti a naleje do vody. Vodná zmes sa prefiltruje a oddelená pevná látka sa vysuší na vzduchu. Získa sa zlúčenina uvedená v nadpise (0,6 g) vo forme béžovej pevnej látky s teplotou topenia 100 až 130°C.

P r í k l a d 1 0

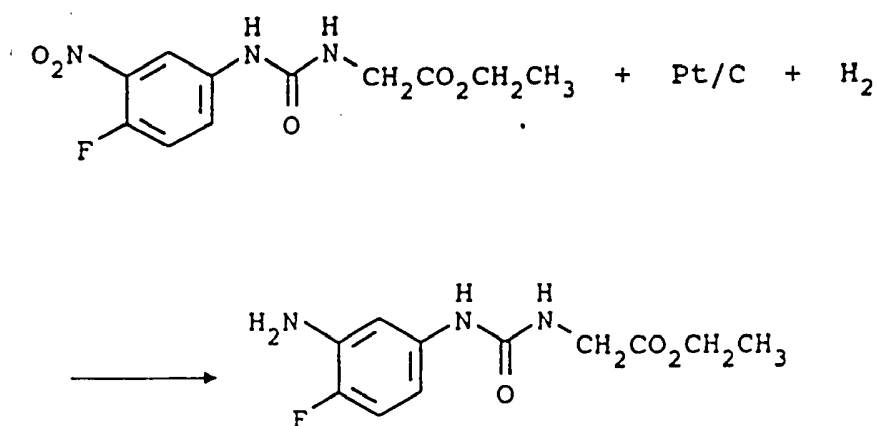
Príprava etylesteru N-[(4-fluór-3-nitrofenyl)karbamoyl]-
glycínu



Roztok 4-fluór-3-nitrofenylizokyanátu (10 g, 0,055 mol) v bezvodom tetrahydrofuráne sa ochladí na 0°C a zmieša s hydrochloridom etylesteru glycínu (7,7 g, 0,055 mol). Výsledná zmes sa zmieša s trietylamiénom (5,56 g, 0,055 mol), pričom sa teplota reakčnej zmesi udržiava pod 10°C. Reakčná zmes sa mieša 1 hodinu pri teplote miestnosti a naleje do vody. Vodná zmes sa extrahuje éterom. Spojené organické extrakty sa premyjú postupne 1N kyselinou chlorovodíkovou a roztokom chloridu sodného, vysušia bezvodým síranom horečnatým a skoncentrujú pri zníženom tlaku. Pevný zvyšok sa vysuší na vzduchu. Získa sa zlúčenina uvedená v nadpise (8,8 g) vo forme žltej pevnej látky s teplotou topenia 115 až 120°C.

P r í k l a d 11

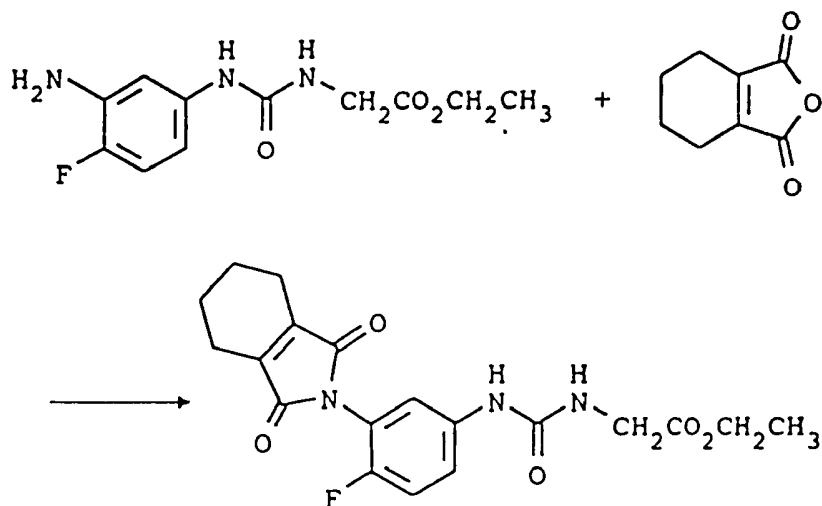
Príprava etylesteru N-[(3-amino-4-fluórfenyl)karbamoyl]-
glycínu



Zmes etylesteru N-[(4-fluór-3-nitrofenyl)karbamoyl]glycínu (8 g, 0,029 mol) a 5% platiny na aktívnom uhlí (0,5 g) v etylacetáte sa hydrogenuje za tlaku 343,5 kPa až do skončenia absorpcie vodíka. Reakčná zmes sa potom prefiltruje a chladí v ľadovom kúpeli, kým nevznikne pevná látka. Pevná látka sa zhromaždí filtráciou a vysuší na vzduchu. Získa sa zlúčenina uvedená v nadpise (4,5 g) vo forme bielej pevnej látky s teplotou topenia 152 až 153°C.

P r í k l a d 1 2

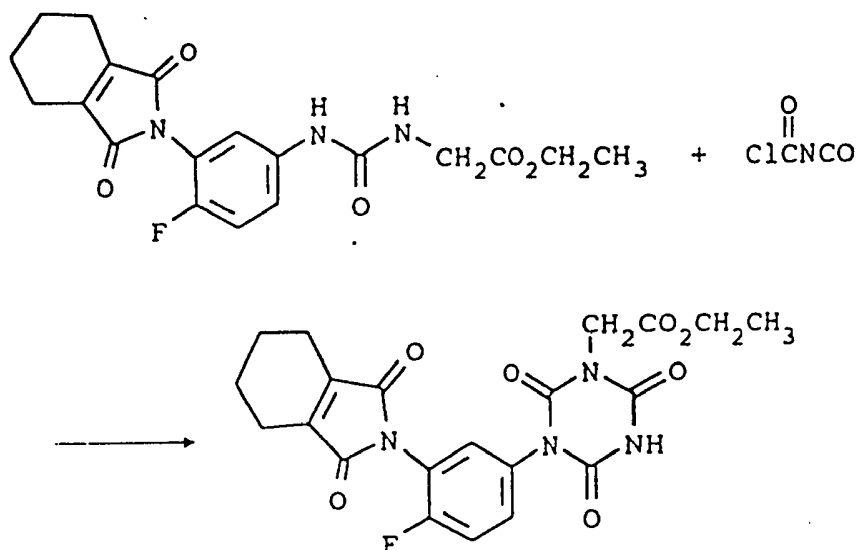
Príprava etylesteru {N-[3-(1-cyklohexén-1,2-dikarboximido)-4-fluórfenyl]karbamoyl}glycínu



Roztok etylesteru N-[(3-amino-4-fluórfenyl)karbamoyl]glycínu (4 g, 0,0157 mol) v kyseline octovej sa zmieša s anhydridom 3,4,5,6-tetrahydroftalovej kyseliny (2,43 g, 0,016 mol). Vzniknutá zmes sa 8 hodín zahrieva na 100°C, ochladí na teplotu miestnosti a naleje do vody. Vodná zmes sa prefiltruje a oddelená pevná látka sa prekryštalizuje zo zmesi etylacetátu a hexánov. Získa sa zlúčenina uvedená v nadpise vo forme žltej pevnej látky s teplotou topenia 72 až 82°C.

P r í k l a d 1 3

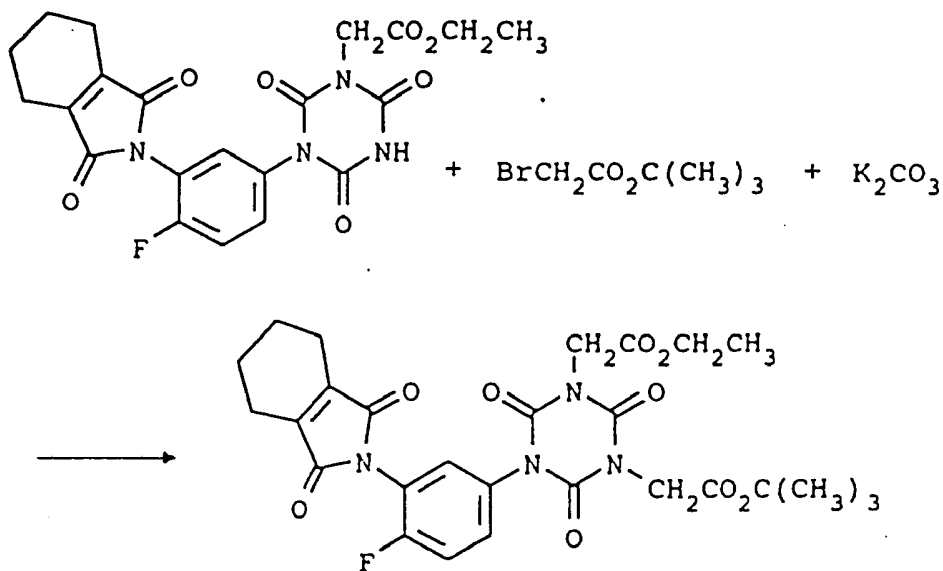
Príprava etyl-3-[3-(1-cyklohexén-1,2-dikarboximido)-4-fluórfenyl]tetrahydro-2,4,6-trioxo-s-triazín-1(2H)-acetátu



Roztok etylesteru {N-[3-(1-cyklohexén-1,2-dikarboximido)-4-fluórfenyl]karbamoyl}glycínu (2,45 g, 6,3 mmol) v toluéne sa zmieša s N-(chlórkarbonyl)izokyanátom (0,77 g, 7,3 mmol). Výsledná zmes sa mieša 12 hodín pri 60°C a skoncentruje pri zníženom tlaku. Pevný zvyšok sa 24 hodín suší za vákua pri 85°C. Získa sa 2,13 g zlúčeniny uvedenej v nadpise vo forme žltej pevnej látky s teplotou topenia 135 až 150°C.

P r í k l a d 1 4

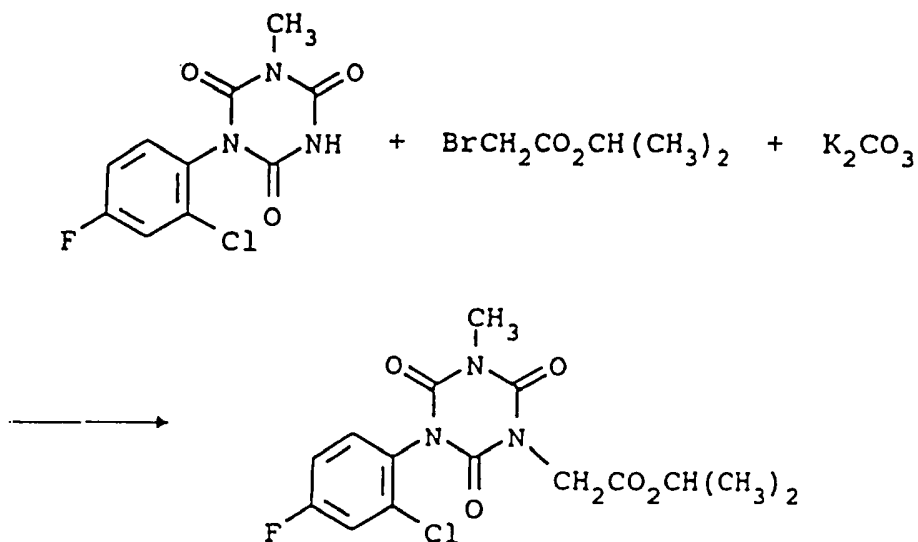
Príprava 1-terc.butylesteru 5-[3-(1-cyklohexén-1,2-dikarboximido)-4-fluórfenyl]dihydro-2,4,6-trioxo-s-triazín-1,3(2H,4H)-dioctovej kyseliny



Terc.butylbrómacetát (0,689 g, 3,5 mmol) a uhličitan draselný (0,484 g, 3,5 mmol) sa oddelene pridajú k roztoku etyl-3-[3-(1-cyklohexén-1,2-dikarboximido)-4-fluórfenyl]tetrahydro-2,4,6-trioxo-s-triazín-1(2H)-acetátu (1,35 g, 2,9 mmol) v N,N-dimetylformamide. Reakčná zmes sa mieša 18 hodín pri teplote miestnosti, naleje do vody a vodná zmes sa extrahuje éterom. Organické extrakty sa spoja, premyjú roztokom chloridu sodného, vysušia bezvodým síranom horečnatým a skoncentrujú pri zníženom tlaku. Získa sa 0,8 g zlúčeniny uvedenej v nadpise vo forme jantárovo zafarbenej pevnej látky s teplotou topenia 95 až 105°C.

P r í k l a d 1 5

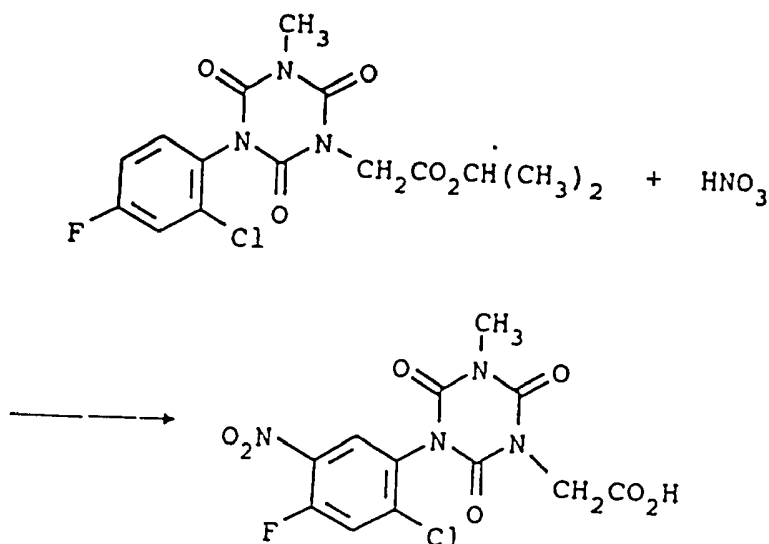
Príprava izopropyl-3-(2-chlór-4-fluórfenyl)tetrahydro-5-metyl-
2,4,6-trioxo-s-triazín-1(2H)-acetátu



Zmes 1-(2-chlór-4-fluórfenyl)-3-metyl-s-triazín-
2,4,6(1H,3H,5H)-triónu (40,9 g, 0,150 mol), uhličitanu dra-
selného (31,1 g, 0,225 mol) a izopropylbrómacetátu (29,1 ml,
0,225 mol) v N,N-dimetylformamide sa mieša 2 hodiny pri
teplote miestnosti a naleje do vody. Vodná zmes sa extrahuje
etylacetátom. Organické extrakty sa premyjú postupne vodou
a roztokom chloridu sodného, vysušia bezvodým síranom horeč-
antým a skoncentrujú pri zníženom tlaku. Olejovitý zvyšok sa
podrobí flash chromatografii na stĺpci silikagélu pri použití
0 až 10% éteru v metylénchloride, ako elučného činidla. Získa
sa zlúčenina uvedená v nadpise (51,5 g) vo forme bielej pev-
nej látky s teplotou topenia 127 až 128°C.

P r í k l a d 1 6

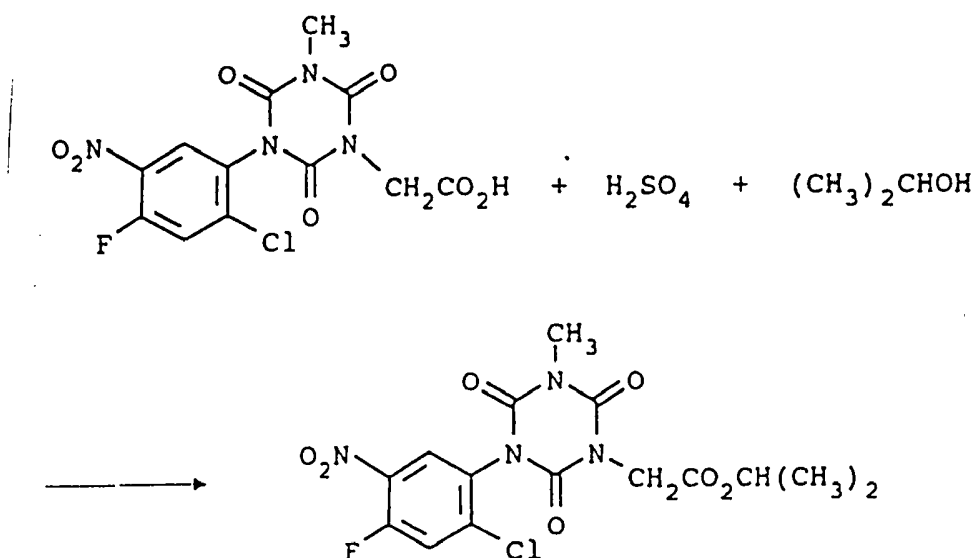
Príprava 3-(2-chlór-4-fluór-5-nitrofenyl)tetrahydro-5-metyl-2,4,6-trioxo-s-triazín-1(2H)-octovej kyseliny



Roztok izopropyl-3-(2-chlór-4-fluórfenyl)tetrahydro-5-metyl-2,4,6-trioxo-s-triazín-1(2H)-acetátu (48,7 g, 0,0508 mol) v koncentrovanej kyseline sírovej sa ochladí na 0°C a zmieša s 90% kyselinou dusičnou (2,6 ml). Vzniknutá zmes sa mieša cez noc pri teplote miestnosti, zmieša s 90% kyselinou dusičnou (1,0 ml), mieša 4 hodiny, zmieša s ďalším množstvom 90% kyseliny dusičnej (2,0 ml), mieša cez noc pri teplote miestnosti, zmieša s 90% kyselinou dusičnou (1,0 ml), mieša 1 hodinu a naleje na ľad. Vodný roztok sa prefiltruje, oddelená pevná látka sa rozpustí v étere, vysuší síranom horečnatým a skoncentruje pri zníženom tlaku. Získa sa zlúčenina uvedená v nadpise vo forme žltej peny, ktorá sa identifikuje NMR spektrálnou analýzou.

P r í k l a d 1 7

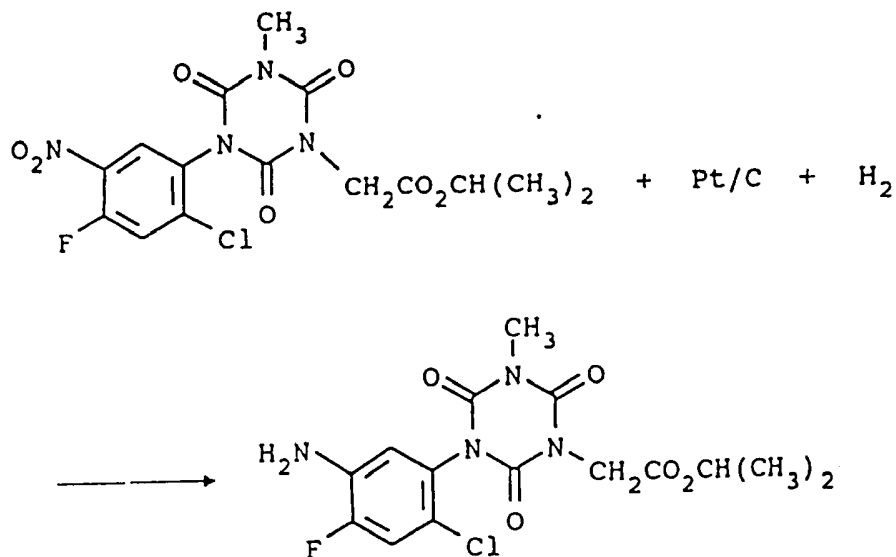
Príprava izopropyl-3-(2-chlór-4-fluór-5-nitrofenyl)tetrahydro-5-metyl-2,4,6-trioxo-s-triazín-1(2H)-acetátu



Roztok 3-(2-chlór-4-fluór-5-nitrofenyl)tetrahydro-5-metyl-2,4,6-trioxo-s-triazín-1(2H)-octovej kyseliny (43,6 g, 0,105 mol) a koncentrovanej kyseliny sírovej (25 ml) v 2-propanolu (300 ml) sa 12 hodín zahrieva k spätnému toku, ochladí na teplotu miestnosti a prefiltruje. Oddelená pevná látka sa vysuší. Získa sa zlúčenina uvedená v nadpise vo forme špinavo bielej pevnej látky, ktorá sa identifikuje NMR spektrálnou analýzou. Filtrát sa sčasti skoncentruje pri zníženom tlaku a naleje na ľad. Vzniknutá vodná zmes sa extrahuje etylacetátom. Organické extrakty sa vysušia bezvodým síranom horečnatým a skoncentrujú pri zníženom tlaku. Oranžový olejovitý zvyšok sa podrobí flash chromatografii na stípci silikagélú pri použití 2,5 až 5% éteru v metylénchloride, ako elučného činidla. Získa sa ďalšia frakcia zlúčeniny uvedenej v nadpise vo forme žltej peny.

P r í k l a d 1 8

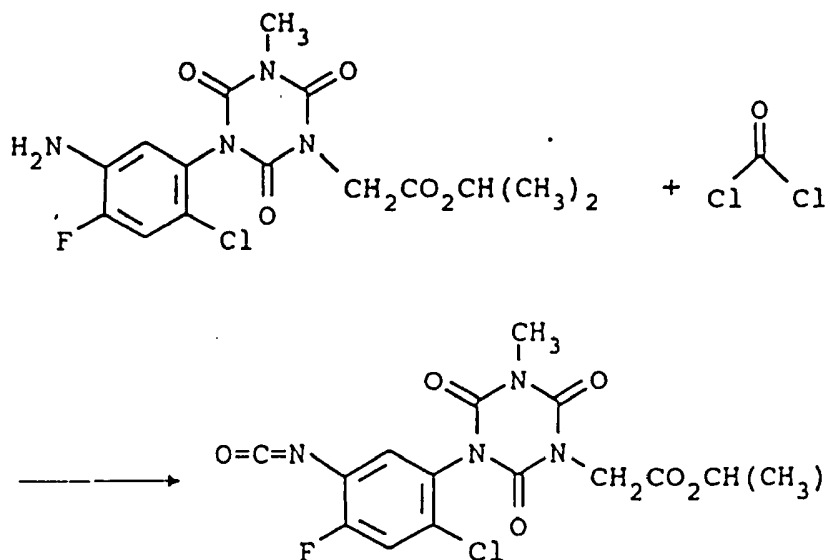
Príprava izopropyl-3-(5-amino-2-chlór-4-fluórfenyl)tetrahydro-5-metyl-2,4,6-trioxo-s-triazín-1(2H)-acetátu



Zmes izopropyl-3-(2-chlór-4-fluór-5-nitrofenyl)-tetrahydro-5-metyl-2,4,6-trioxo-s-triazín-1(2H)-acetátu (34,8 g, 0,0835 mol) a 5% platiny na aktívnom uhlí (3,48 g) v etylacetáte sa hydrogenuje až do absorpcie asi 618 kPa vodíka. Reakčná zmes sa prefiltruje a filtrát sa skoncentruje pri zníženom tlaku. Zvyšok vo forme peny sa chromatografuje na stĺpci silikagélu pri použití 10 až 20% éteru v metylénchloride, ako elučného činidla. Získa sa žltá pena, ktorá obsahuje dve zlúčeniny. Zmes peny a 5% platiny na uhlíku (3,5 g) v etylacetáte sa hydrogenuje až do absorpcie 34,35 kPa vodíka. Reakčná zmes sa potom prefiltruje a filtrát sa skoncentruje pri zníženom tlaku. Získa sa zlúčenina uvedená v nadpise vo forme žltej peny, ktorá sa identifikuje NMR spektrálnou analýzou.

P r í k l a d 19

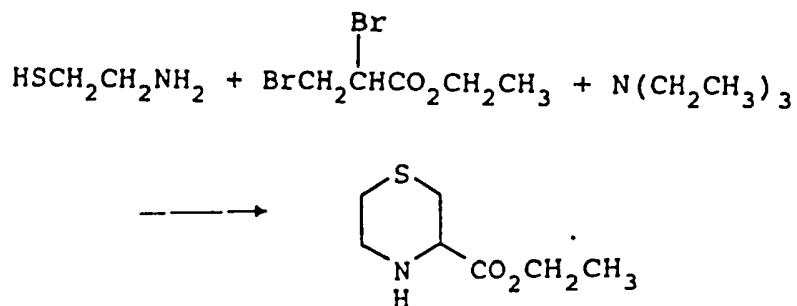
Príprava izopropyl-3-(2-chlór-4-fluór-5-izokyanatofenyl)-
tetrahydro-5-metyl-2,4,6-trioxo-s-triazín-1(2H)-acetátu



Zmes izopropyl-3-(5-amino-2-chlór-4-fluórphenyl)-
tetrahydro-5-metyl-2,4,6-trioxo-s-triazín-1(2H)-acetátu
(4,0 g, 0,0103 mol) v toluéne sa zmieša s 1,93M roztokom
fosgénu v toluéne (19 ml). Vzniknutá zmes sa 3 hodiny varí
pod spätným chladičom, ochladí, sčasti skoncentruje pri
zníženom tlaku, zriedi toluénom, sčasti skoncentruje pri
zníženom tlaku, zriedi toluénom a skoncentruje pri zníženom
tlaku. Získa sa zlúčenina uvedená v nadpise vo forme žltej
peny, ktorá sa identifikuje ^1H NMR spektrálnou analýzou.

P r í k l a d 2 0

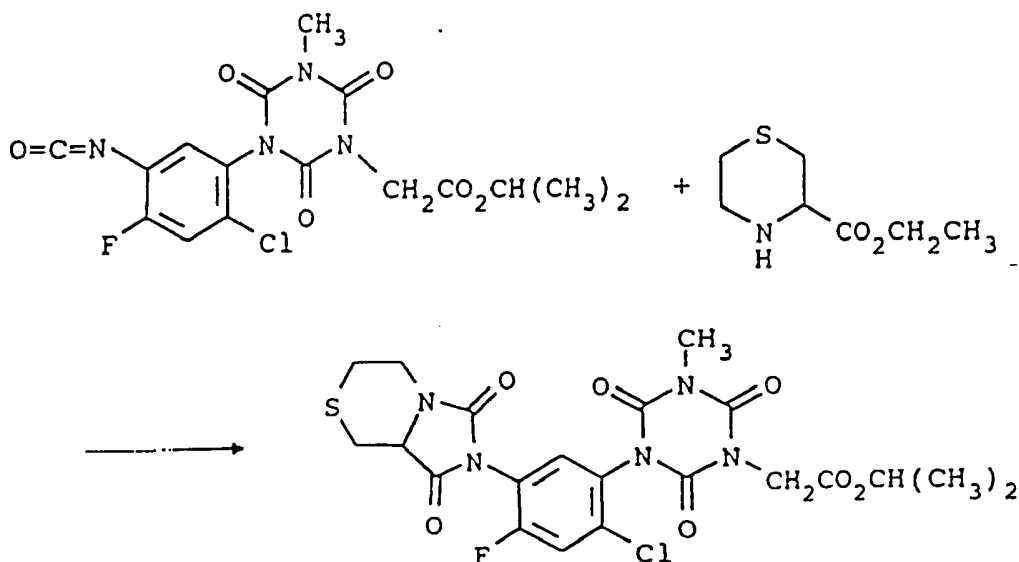
Príprava etyl-3-tiomorfolínkarboxylátu



Teplý roztok 2-aminoetántiolu (10,0 g, 0,130 mol) a trietylaminu (36 ml, 0,260 mol) v chloroformu sa pridá behom 5 minút k roztoku etyl-2,3-dibrómpropionátu (33,9 g, 0,130 mol) v zmesi chloroformu a toluénu v pomere 1 : 1,6. Reakčná zmes sa mieša 2,5 hodiny pri teplote miestnosti, prefiltruje a filtrát sa skoncentruje pri zníženom tlaku. Kvapalný oranžový zvyšok sa podrobí vákuovej destilácii, čím sa získa zlúčenina uvedená v nadpise vo forme bezfarebnej kvapaliny s teplotou varu 121 až 124°C za tlaku 340 Pa.

P r í k l a d 2 1

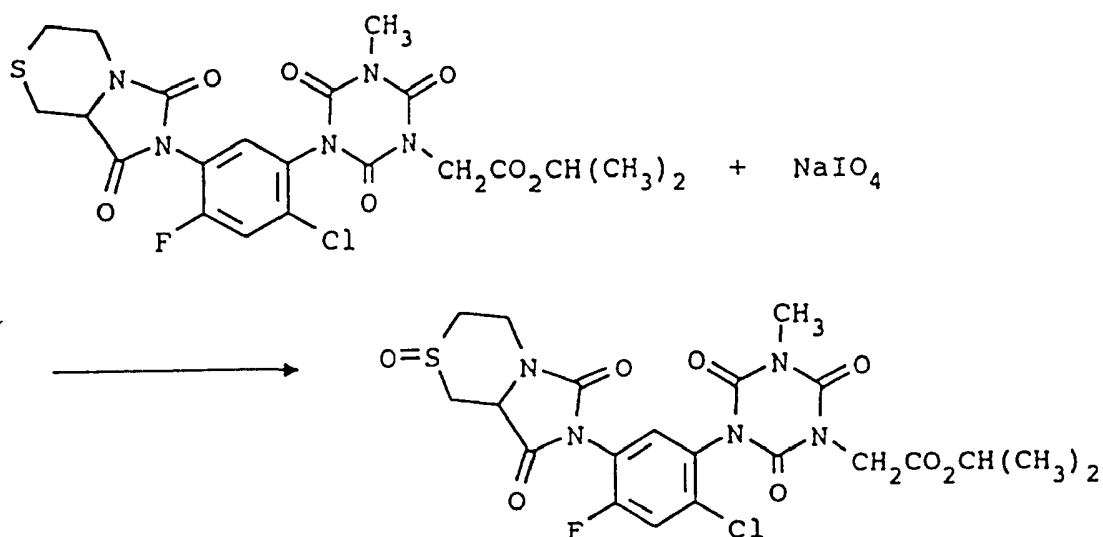
Príprava izopropyl-3-{2-chlór-4-fluór-5-[5,6,8,8a-tetrahydro-1,3-dioxo-1H-imidazo[5,1c][1,4]-tiazín-2(3H)-yl]-fenyl}tetrahydro-5-metyl-2,4,6-trioxo-s-triazín-1(2H)-acetátu



Roztok izopropyl-3-(2-chlór-4-fluór-5-izokyanato-fenyl)tetrahydro-5-metyl-2,4,6-trioxo-s-triazín-1(2H)-acetátu (3,11 g, 7,5 mmol) a etyl-3-tiomorfolínkarboxylátu (1,44 g, 8,2 mmol) v toluéne sa mieša 1 hodinu pri teplote miestnosti a zmieša s niekoľkými kvapkami etyl-3-tiomorfolínkarboxylátu. Vzniknutá zmes sa mieša cez noc pri teplote miestnosti a filtráciou sa oddelí žltá pevná látka. Filtrát sa vysuší a skoncentruje pri zníženom tlaku. Zvyšok vo forme oranžovej peny a pevná látka sa spoja a chromatografujú na silikagéli pri použití 10% éteru v metylénchloride, ako elučného činidla. Získaná oranžová pena, ktorá obsahuje dve zlúčeniny, sa podrobí flash chromatografii na silikagéli pri použití 15% etylacetátu v metylénchloride, ako elučného činidla. Získa sa zlúčenina uvedená v nadpise vo forme špi-
navo bielej peny s teplotou topenia 147 až 155°C.

P r í k l a d 2 2

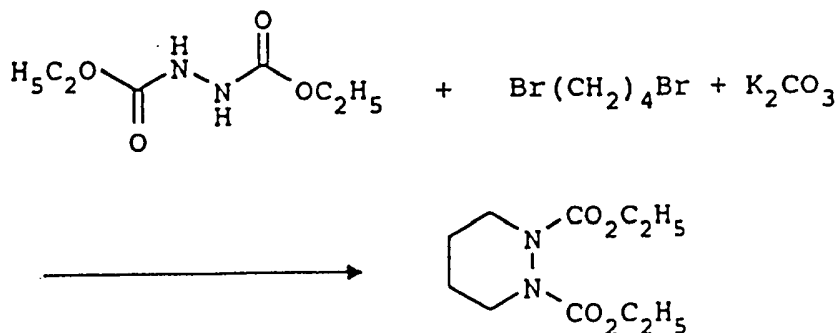
Príprava izopropyl-3-[2-chlór-4-fluór-5-(tetrahydro-1,3,7-trioxo-1H-imidazo[5,1-c][1,4]tiazín-2(3H)-yl)fenyl]-tetrahydro-5-metyl-2,4,6-trioxo-s-triazín-1(2H)-acetátu



Zmes izopropyl-3-{2-chlór-4-fluór-5-[5,6,8,8a-tetrahydro-1,3-dioxo-1H-imidazo[5,1c][1,4]-tiazín-2(3H)-yl]-fenyl}tetrahydro-5-metyl-2,4,6-trioxo-s-triazín-1(2H)-acetátu (0,95 g, 1,75 mmol) v metanole (10 ml) sa behom 15 minút pridá k roztoku jodistanu sodného (0,38 g, 1,78 mmol) vo vode (10 ml), ktorý bol vopred ochladený na 0 až 5°C. Po dokončení prídavku sa reakčná zmes mieša cez noc pri teplote miestnosti a zriedi metylénchloridom. Zriedená zmes sa premyje postupne 1M roztokom dihydrogenfosforečnanu draselného a roztokom chloridu sodného, vysuší bezvodým síranom horečnatým a skoncentruje pri zníženom tlaku. Zvyšok vo forme žltej peny sa podrobí flash chromatografii na silikagéli pri použití 10% éteru v metylénchloride a 2,5% metanolu v metylénchloride, ako elučného činidla. Získa sa zlúčenina uvedená v nadpise vo forme bielej peny (0,59 g) s teplotou topenia 175 až 180°C.

P r í k l a d 23

Príprava dietylésteru
tetrahydro-1,2-pyridazíndikarboxylovej kyseliny

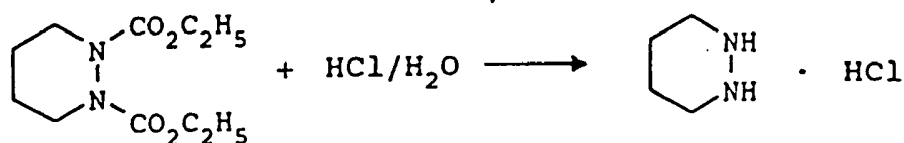


1,4-Dibrómbután (81,4 ml, 0,682 mol) sa behom 1 hodiny pridá k zmesi 1,2-dietoxykarbonylhydrazínu (100 g, 0,568 mol) a uhličitanu draselného (158 g, 1,14 mol) v acetonitrile (600 ml). Výsledná reakčná zmes sa 6 hodín zahrieva k spätnému toku, ochladí na teplotu miestnosti a prefiltruje. Filtrát sa skoncentruje pri zníženom tlaku a

získaná žltá kvapalina sa predestiluje pri zníženom tlaku. Získa sa zlúčenina uvedená v nadpise (90,8 g) vo forme bezfarebnej kvapaliny s teplotou varu 115 až 120°C za tlaku 120 Pa.

P r í k l a d 2 4

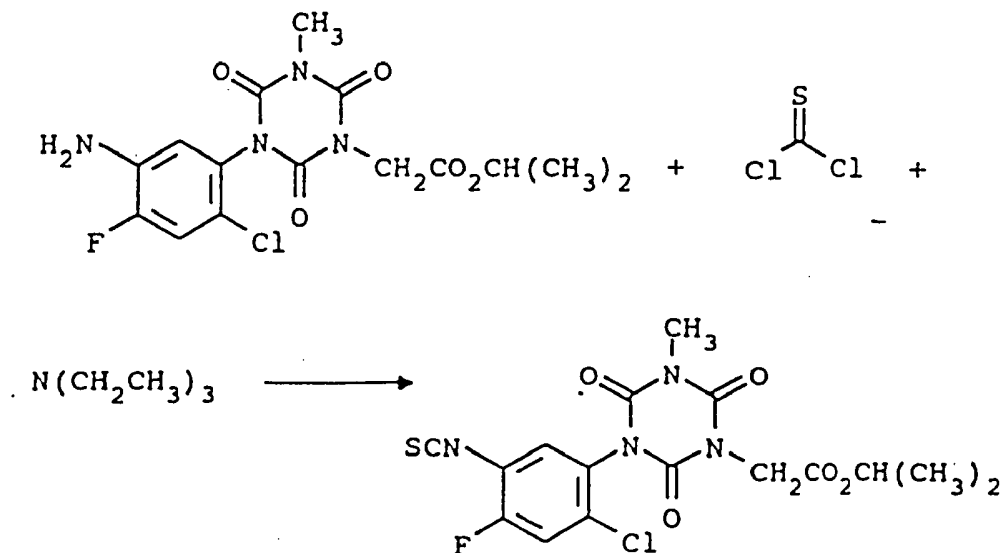
Príprava hydrochloridu hexahydropyridazínu



Roztok dietylésteru tetrahydro-1,2-pyridazíndi-karboxylovej kyseliny (45,0 g, 0,195 mol) v koncentrovanej kyseline chlorovodíkovej (190 ml) sa cez noc zahrieva k spätnému toku a skoncentruje pri zníženom tlaku. Biely pevný zvyšok sa 1 hodinu mieša v acetonitrile, potom sa vzniknutá zmes prefiltruje a oddelená pevná látka sa vysuší. Získa sa zlúčenina uvedená v nadpise (19,5 g) vo forme bielej pevnej látky s teplotou topenia 163°C.

P r í k l a d 2 5

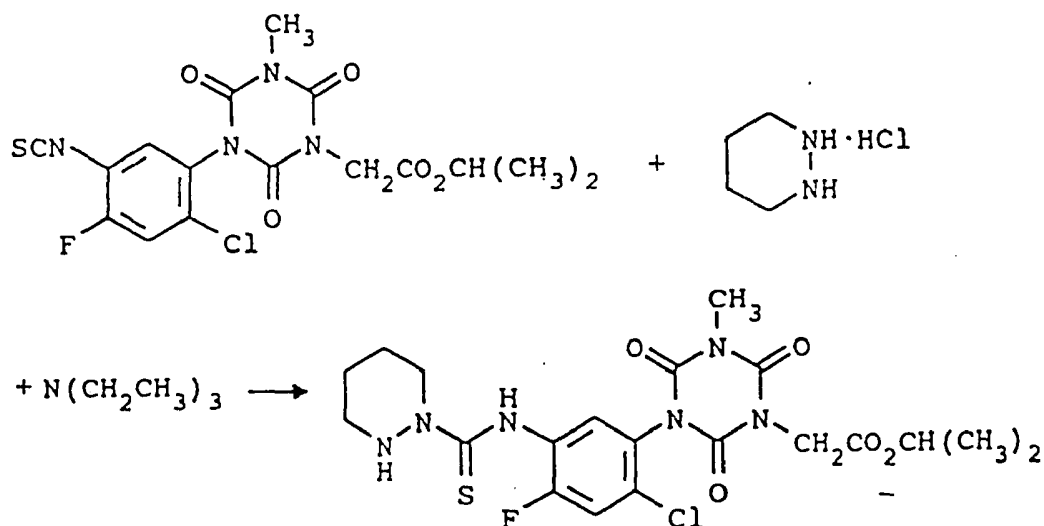
Príprava izopropyl-3-(2-chlór-4-fluór-5-izotiokyanato)-fenyl)tetrahydro-5-metyl-2,4,6-trioxo-s-triazín-1(2H)-acetátu



Tiofosgén (0,50 ml, 6,5 mmol) sa behom 45 minút pridá k roztoku izopropyl-3-(5-amino-2-chlór-4-fluórfenyl)-tetrahydro-5-metyl-2,4,6-trioxo-s-triazín-1(2H)-acetátu (2,5 g, 6,5 mmol) a trietylamínu (1,8 ml, 13,0 mmol) v tetrahydrofuráne. Reakčná zmes sa mieša 4 hodiny pri teplote miestnosti a zriedi tetrahydrofuránom. Zriedená zmes sa prefiltruje a filtrát sa skoncentruje pri zníženom tlaku. Získa sa zlúčenina uvedená v nadpise vo forme oranžového oleja, ktorá sa identifikuje NMR spektrálnou analýzou.

P r í k l a d 26

Príprava izopropyl-3-{2-chlór-4-fluór-5-[(tetrahydropyridazín-1(2H)-yl)tiokarboxamido]fenyl}tetrahydro-5-metyl-2,4,6-trioxo-s-triazín-1(2H)-acetátu

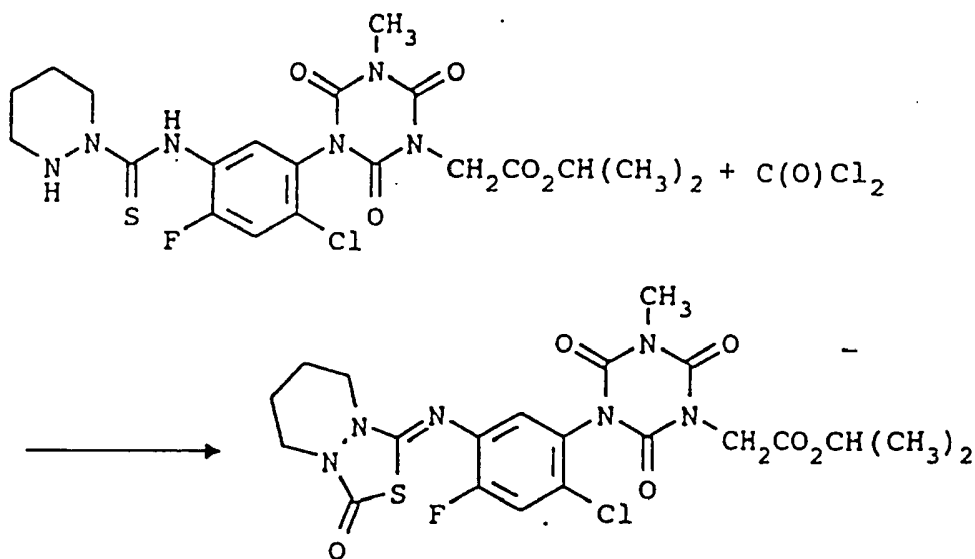


Trietylamín (2,5 ml, 18,2 mmol) sa prikvapká k zmesi izopropyl-3-(2-chlór-4-fluór-5-izotiokyanatofenyl)-tetrahydro-5-metyl-2,4,6-trioxo-s-triazín-1(2H)-acetátu (2,79 g, 6,5 mmol) a hydrochloridu hexahydropyridazínu (1,45 g, 9,1 mmol) v metanole, pričom sa teplota reakčnej zmesi udržiava na 20 až 25°C. Po dokončení prídavku sa reakčná zmes mieša cez noc pri teplote miestnosti, sčasti

skoncentruje pri zníženom tlaku a zriedi etylacetátom. Organická fáza sa oddelí, premyje postupne vodou a roztokom chloridu sodného, vysuší bezvodým síranom horečnatým a skoncentruje pri zníženom tlaku. Zvyšok vo forme oranžovej peny sa podrobí flash chromatografii na silikagéli pri použití 2,5 až 10% éteru v metylénchloride, ako elučného činidla. Získa sa zlúčenina uvedená v nadpise (2,15 g) vo forme žltej peny s teplotou topenia 105 až 110°C

P r í k l a d 2 7

Príprava izopropyl-3-{2-chlór-4-fluór-5-[(tetrahydro-3-oxo-1H,3H-[1,3,4]tiadiazolo[3,4-a]pyridazín-1-ylidén)amino]-fenyl}tetrahydro-5-metyl-2,4,6-trioxo-s-triazín-1(2H)-acetátu

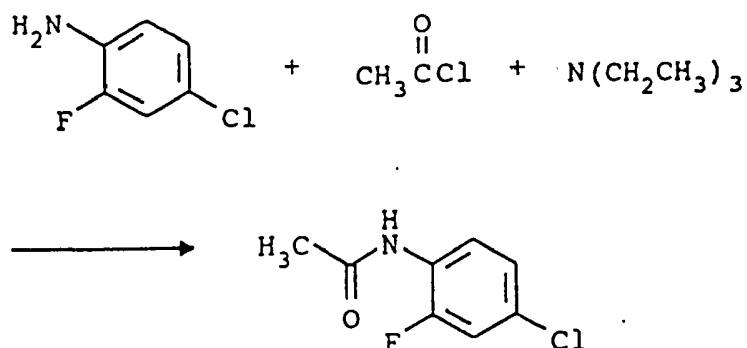


Roztok izopropyl-3-{2-chlór-4-fluór-5-[(tetrahydropyridazín-1(2H)-yl)tiokarboxamido]fenyl}tetrahydro-5-metyl-2,4,6-trioxo-s-triazín-1(2H)-acetátu (1,50 g, 2,9 mmol) v 1,2-dichlóretáne sa behom 30 minút pridá k 20% roztoku fosgénu v toluéne (2,91 ml, 5,6 mmol), ktorý bol vopred ochladený na 0 až 5°C. Po dokončení prídavku sa reakčná zmes mieša 2 hodiny pri teplote miestnosti, premyje postupne vodou a roztokom chloridu sodného, vysuší bezvo-

dým síranom horečnatým a skoncentruje pri zníženom tlaku. Zvyšok vo forme žltej peny sa podrobí flash chromatografii na silikagéli pri použití 2,5 až 10% éteru v metylénchloride, ako elučného činidla. Získa sa zlúčenina uvedená v nadpise (1,18 g) vo forme bielej peny s teplotou topenia 97 až 107°C.

P r í k l a d 28

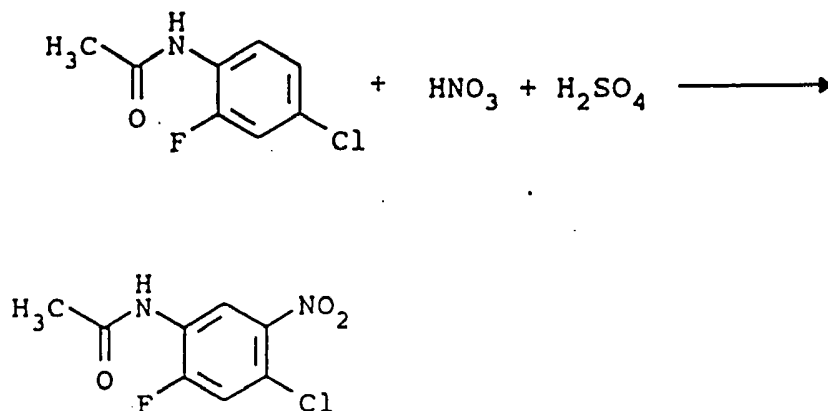
Príprava 4'-chlór-2'-fluóracetanilidu



Acetylchlorid (24,2 ml, 0,34 mol) sa pomaly pridá k roztoku 4-chlór-2-fluóranilínu (49,4 g, 0,34 mol) a trietylamínu (47 ml, 0,34 mol) v tetrahydrofuráne, pričom sa teplota reakčnej zmesi udržiava pod 20°C. Po dokončení prídavku sa reakčná zmes mieša cez noc pri teplote miestnosti a naleje do etylacetátu. Organický roztok sa premyje postupne vodou a roztokom chloridu sodného, vysuší bezvodým síranom horečnatým a skoncentruje pri zníženom tlaku. Špinavo biely pevný zvyšok sa mieša niekoľko minút v etanole a filtráciou sa oddelí zlúčenina uvedená v nadpise vo forme bielej pevnej látky.

P r í k l a d 2 9

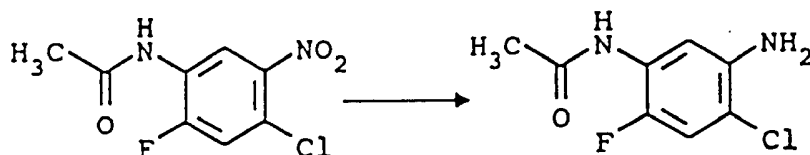
Príprava 4'-chlór-2'-fluór-5'-nitroacetanilidu



Zmes 4'-chlór-2'-fluóracetanilidu (51 g, 0,272 mol) v koncentrovanej kyseline sírovej (100 ml) sa ochladí na 0°C a behom 45 minút zmieša s kyselinou dusičnou (90%, 14 ml, 0,300 mol). Výsledná zmes sa mieša 10 minút a naleje na ľad. Vodná zmes sa prefiltruje a oddelená zlatohnedá pevná látka sa premyje vodou, cez noc vysuší a prekryštalizuje zo zmesi chloroformu a hexánov v pomere 17 : 1. Získa sa zlúčenina uvedená v nadpise vo forme žltej pevnej látky.

P r í k l a d 3 0

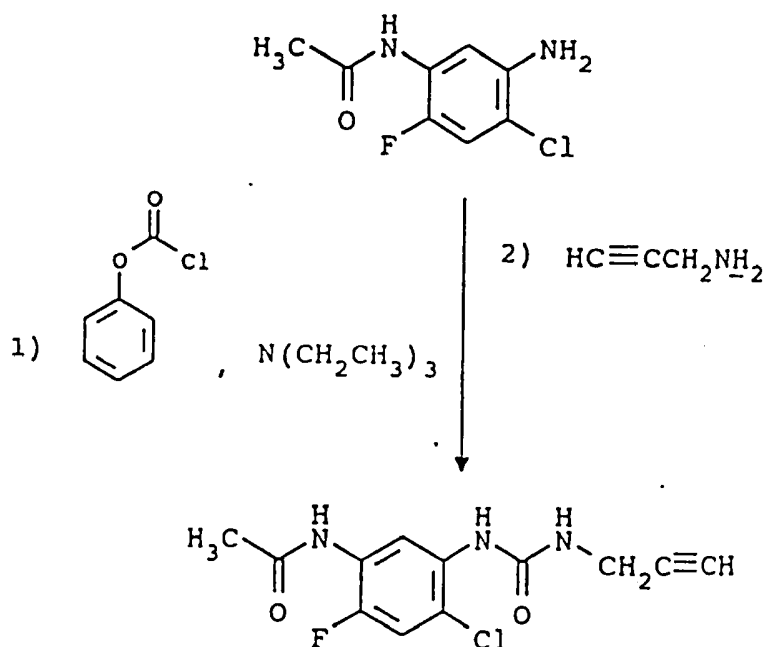
Príprava 5'-amino-4'-chlór-2'-fluóracetanilidu



Zmes 4'-chlór-2'-fluór-5'-nitroacetanilidu (35,2 g, 151 mmol) a 5% platiny na uhlíku (7,0 g, 20 % hmot.) v zmesi etanolu a tetrahydrofuránu v pomere 2 : 1 sa hydrogenuje až do absorpcie 192 kPa vodíka. Potom sa reakčná zmes prefiltruje a skoncentruje pri zníženom tlaku. Získa sa zlúčenina uvedená v nadpise vo forme zlatohnedej pevnej látky, ktorá sa identifikuje ^1H NMR spektrálnou analýzou.

P r í k l a d 3 1

Príprava 1-(5-acetamido-2-chlór-4-fluórfenyl)-3-(2-propinyl)-močoviny

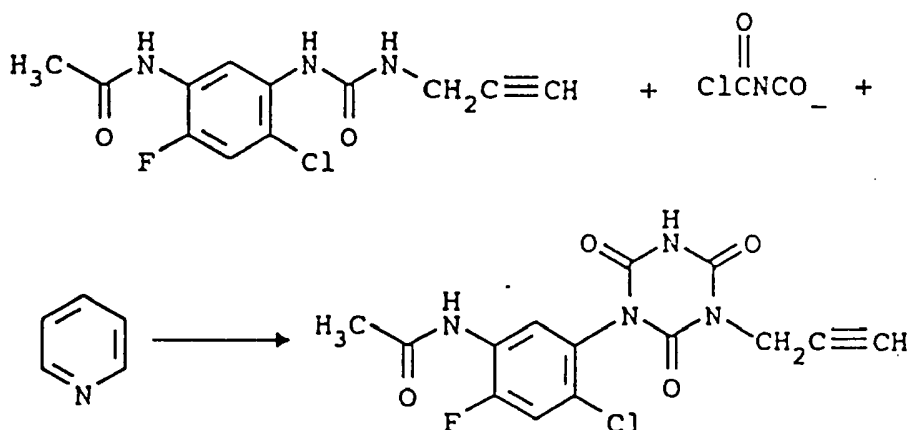


Roztok 5'-amino-4'-chlór-2'-fluóracetanilidu (11,25 g, 55,6 mmol) a triethylamínu (7,70 ml, 55,6 mmol) v tetrahydrofuráne sa prikvapká k miešanému roztoku fenylchlórformiátu (8,70 ml, 69,4 mmol) v tetrahydrofuráne, pričom sa teplota reakčnej zmesi udržiava na 25 až 30°C. Po dokončení prídavku sa reakčná zmes mieša 75 minút pri teplote miestnosti a naleje do etylacetátu. Organická zmes sa premyje postupne vodou, nasýteným roztokom hydrogenuhličitanu sodného a roz-

tokom chloridu sodného, vysuší bezvodým síranom horečnatým a skoncentruje pri zníženom tlaku. Zlatohnedý pevný zvyšok sa rozpustí v tetrahydrofuráne a vzniknutý roztok sa zmieša s propargylamínom (9,52 ml, 139 mmol). Výsledná zmes sa 1 hodinu zahrieva k spätnému toku a naleje do vody. Vodná zmes sa prefiltruje a oddelená pevná látka sa premyje postupne vodou, 0,5N kyselinou chlorovodíkovou a vodou a cez noc vysuší. Získa sa zlúčenina uvedená v nadpise vo forme béžovej pevnej látky.

P r í k l a d 3 2

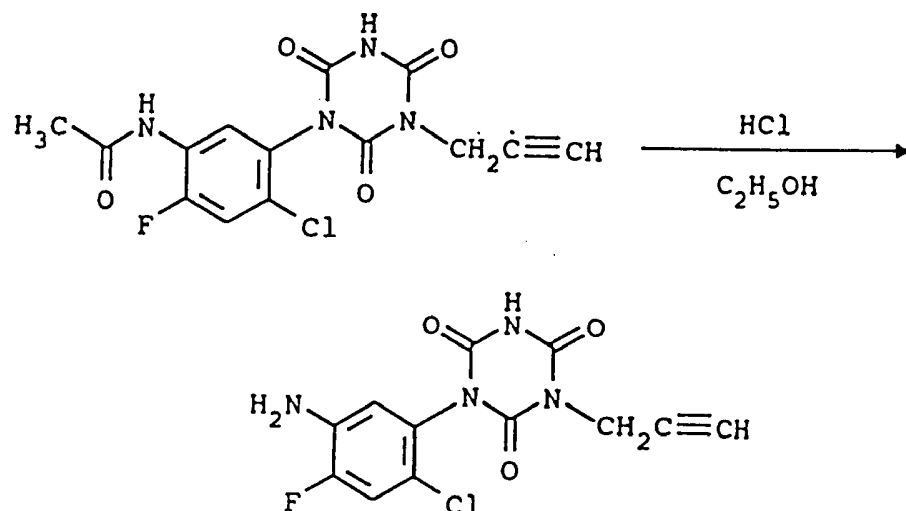
Príprava 4'-chlór-2'-fluór-5'-[hexahydro-2,4,6-trioxo-3-(2-propinyl)-s-triazín-1-yl]acetanilidu



Zmes 1-(5-acetamido-2-chlór-4-fluórfenyl)-3-(2-propinyl)močoviny (4,50 g, 15,9 mmol) a pyridínu (2,56 ml, 31,8 mmol) v metylénchloride sa zmieša s N-(chlórkarbonyl)-izokyanátom (1,92 ml, 23,9 mmol). Reakčná zmes sa mieša cez noc pri teplote miestnosti a 90 minút zahrieva k spätnému toku, ochladí na teplotu miestnosti a zmieša s ďalším množstvom pyridínu (1,30 ml) a N-(chlórkarbonylizokyanátu (1,92 ml). Vzniknutá zmes sa mieša 10 minút, ochladí na teplotu miestnosti a filtráciou sa oddelí pevná látka, ktorá sa premyje vodou a hexánmi a vysuší. Získa sa zlúčenina uvedená v nadpise vo forme zlatohnedej pevnej látky.

P r í k l a d 3 3

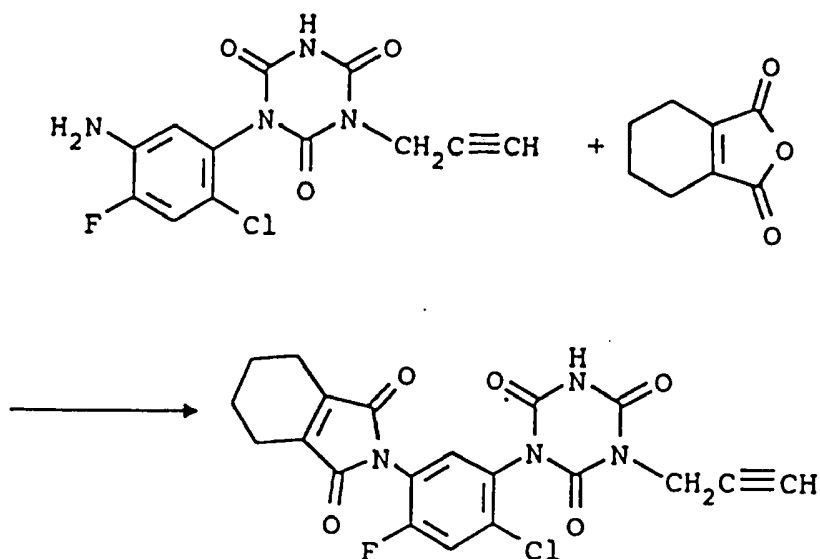
Príprava 1-(5-amino-2-chlór-4-fluórfenyl)-3-(2-propinyl)-
s-triazín-2,4,6-(1H,3H,5H)-triónu



Zmes 4'-chlór-2'-fluór-5'-[hexahydro-2,4,6-tri-
oxo-3-(2-propinyl)-s-triazín-1-yl]acetanilidu (3,00 g, 8,5
mmol) a 3N kyseliny chlorovodíkovej (25 ml) v etanole (50
ml) sa 3 hodiny zahrieva k spätnému toku, ochladí na teplotu
miestnosti a naleje do etylacetátu. K vzniknutému organickému
roztoku sa pridá 3N roztok hydroxidu sodného (25 ml) a odde-
lia sa fázy. Organická fáza sa premyje postupne nasýteným
roztokom hydrogenuhličitanu sodného a roztokom chloridu sod-
ného a skoncentruje pri zníženom tlaku. Získa sa zlúčenina
uvedená v nadpise (2,17 g) vo forme béžovej pevnej látky
s teplotou topenia 118 až 121°C.

P r í k l a d 3 4

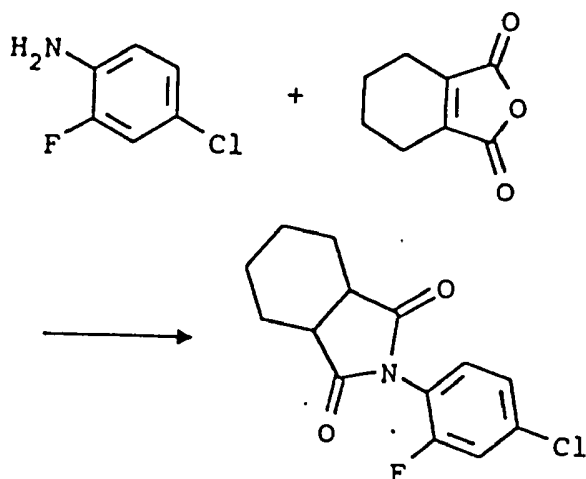
Príprava N-{4-chlór-2-fluór-5-[hexahydro-2,4,6-trioxo-3-
(2-propinyl)-s-triazín-1-yl]fenyl}-1-cyklohexén-1,2-di-
karboximidu



Roztok 1-(5-amino-2-chlór-4-fluórfenyl)-3-(2-propinyl)-s-triazín-2,4,6-(1H,3H,5H)-triónu (1,50 g, 4,83 mmol) a anhydridu 3,4,5,6-tetrahydroftalovej kyseliny (0,73 g, 4,83 mmol) v kyseline octovej (3 ml) sa 5 hodín zahrieva na 100°C, ochladí a naleje do etylacetátu. Organická zmes sa premyje postupne vodou, nasýteným roztokom hydrogenuhličitanu sodného a roztokom chloridu sodného, vysuší bezvodým síranom horečnatým a skoncentruje pri zníženom tlaku. Polopevný žltý zvyšok sa podrobí flash chromatografii na silikagéli pri použití zmesi etylacetátu a hexánov v pomere 1 : 2, ako elučného činidla. Získa sa zlúčenina uvedená v nadpise (1,20 g) vo forme bielej pevnej látky s teplotou topenia 127 až 135°C.

P r í k l a d 3 5

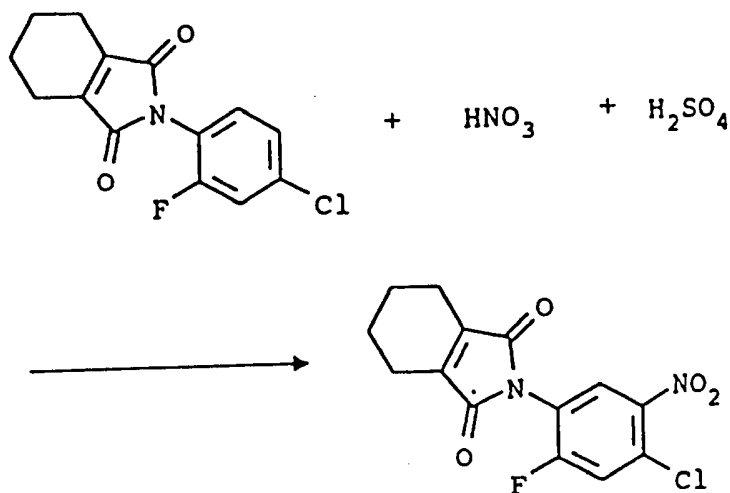
Príprava N-(4-chlór-2-fluórfenyl)-1-cyklohexén-1,2-dikarboximidu



Zmes 4-chlór-2-fluóranilínu (19,0 g, 130,6 mmol) a anhydridu 3,4,5,6-tetrahydroftalovej kyseliny (19,85 g, 130,6 mmol) v kyseline octovej (150 ml) sa 2 hodiny zahrieva k spätnému toku, zmieša s ďalším 4-chlór-2-fluóranilínom (3,0 g). Vzniknutá zmes sa 90 minút zahrieva k spätnému toku, mieša cez noc pri teplote miestnosti a naleje do zmesi vody a etylacetátu. Organická fáza sa premyje postupne vodou, nasýteným roztokom hydrogenuhličitanu sodného a roztokom chloridu sodného, vysuší bezvodým síranom horečnatým a skoncentruje pri zníženom tlaku. Purpurový olejovitý zvyšok sa podrobí flash chromatografii na silikagéli pri použití 15% až 20% etylacetátu v hexánoch, ako elučného činidla. Získa sa zlúčenina uvedená v nadpise (25,3 g) vo forme špinavo bielej pevnej látky s teplotou topenia 81 až 82°C.

P r í k l a d 3 6

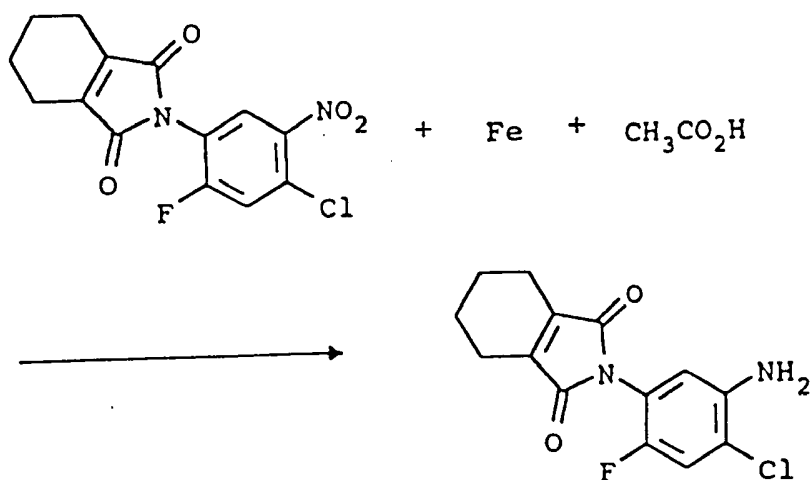
Príprava N-(4-chlór-2-fluór-5-nitrofenyl)-1-cyklohexén-1,2-dikarboximidu



Zmes N-(4-chlór-2-fluórfenyl)-1-cyklohexén-1,2-dikarboximidu (24,4 g, 86,7 mmol) v kyseline sírovej (150 ml) sa ochladí na -3°C a po kvapkách zmieša s kyselinou dusičnou (70%, 6,70 ml, 104 mmol), pričom sa teplota reakčnej zmesi udržiava na 0 až 2°C . Reakčná zmes sa mieša 90 minút pri teplote miestnosti a naleje na ľad. Vodná zmes sa mieša niekoľko minút a potom prefiltruje. Oddelená pevná látka sa premyje vodou a vysuší. Získa sa zlúčenina uvedená v nadpise (28,6 g) vo forme bieleho prášku s teplotou topenia 152 až 155°C .

P r í k l a d 3 7

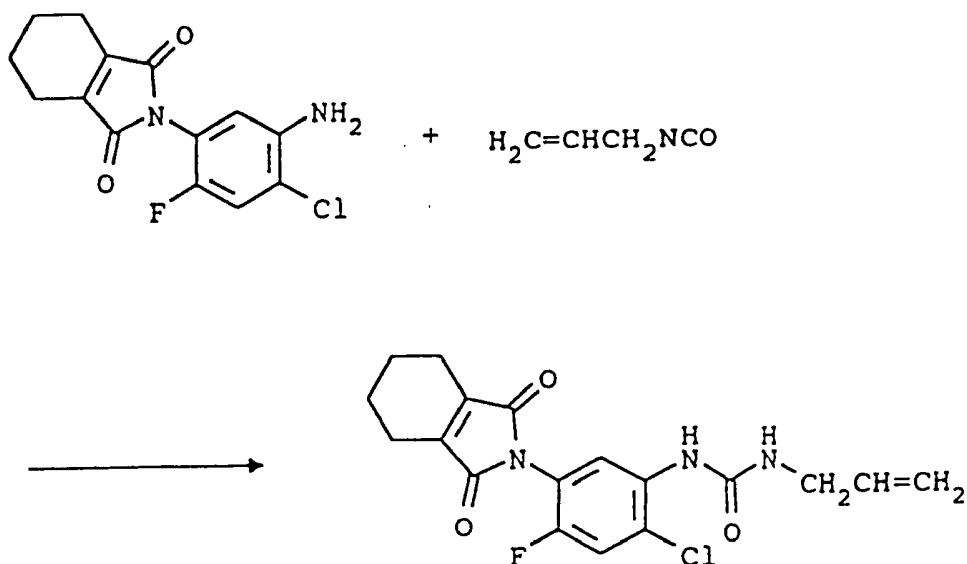
Príprava N-(5-amino-4-chlór-2-fluórfenyl)-1-cyklohexén-1,2-dikarboximidu



Železný prach (7,30 g, 130,7 mmol) sa po častiach pri 65°C pridá k zmesi N-(4-chlór-2-fluór-5-nitrofenyl)-1-cyklohexén-1,2-dikarboximidu (10,6 g, 32,7 mmol) v kyseline octovej (100 ml). Po dokončení prídavku sa reakčná zmes mieša 10 minút a prefiltruje cez infuzóriovú hlinku. Filtrát sa skoncentruje pri zníženom tlaku. Tmavý pevný zvyšok sa zmieša s roztokom etylacetátu a nasýteného roztoku hydrogenuhlčitanu sodného, výsledná zmes sa prefiltruje cez infuzóriovú hlinku a oddelia sa fázy. Organická fáza sa premyje postupne nasýteným roztokom hydrogenuhlčitanu sodného a roztokom chloridu sodného, vysuší bezvodým síranom horečnatým a skoncentruje pri zníženom tlaku. Získa sa zlúčenina uvedená v nadpise vo forme žltej pevnej látky.

P r í k l a d 3 8

Príprava 1-allyl-3-[2-chlór-5-(1-cyklohexén-1,2-dikarboximido)-4-fluórfenyl]močoviny

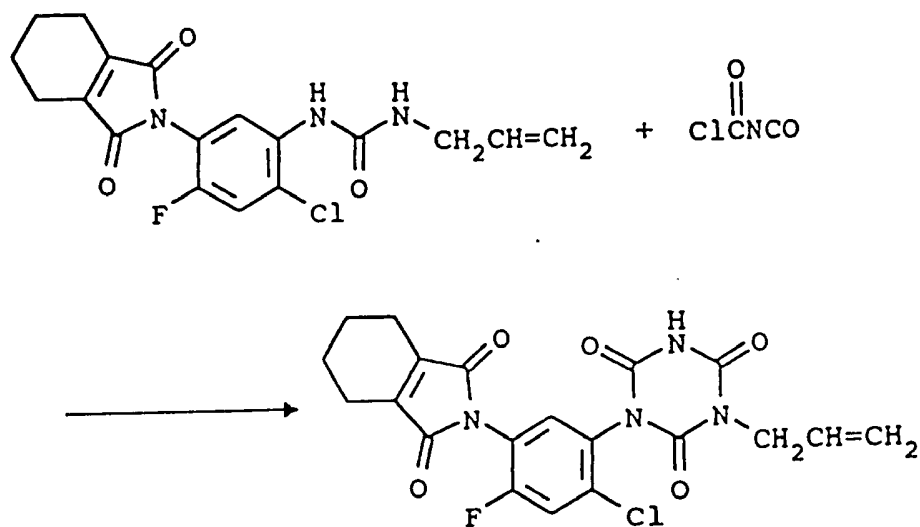


Zmes N-(5-amino-4-chlór-2-fluórfenyl)-1-cyklohexén-1,2-dikarboximidu (3,50 g, 11,9 mmol) v toluéne (25 ml) sa zmieša s alylizokyanátom (2,10 ml, 23,8 mmol). Reakčná zmes sa 21 hodín zahrieva na 60°C a zmieša s ďalším množstvom alyl-

izokyanátu (0,53 ml). Výsledná zmes sa zahrieva 3 hodiny na 60°C, ochladí na 20 až 30°C a prefiltruje. Oddelená pevná látka sa premyje hexánmi. Získa sa zlúčenina uvedená v nadpise (3,15 g) vo forme zlatohnedej pevnej látky s teplotou topenia 236 až 238°C.

P r í k l a d 3 9

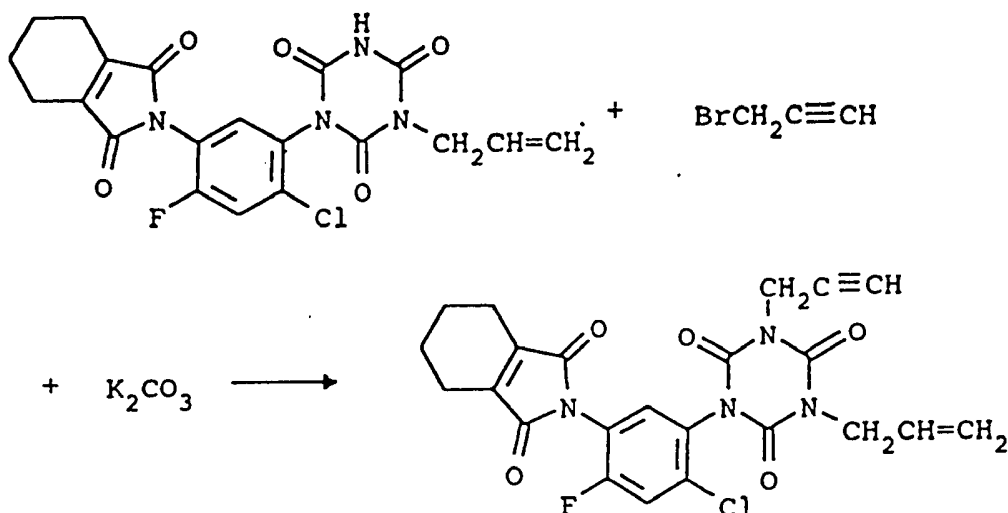
Príprava N-[5-(3-allylhexahydro-2,4,6-trioxo-s-triazín-1-yl)-4-chlór-2-fluórfenyl]-1-cyklohexén-1,2-dikarboximidu



Zmes 1-allyl-3-[2-chlór-5-(1-cyklohexén-1,2-dikarboximido)-4-fluórfenyl]močoviny (2,34 g, 6,21 mmol) v toluéne (25 ml) sa zmieša s N-(chlórkarbonyl)izokyanátom (0,75 ml, 9,31 mmol). Výsledná zmes sa mieša 3 hodiny pri 60°C, ochladí na teplotu miestnosti a skoncentruje pri zníženom tlaku. Olejovitý zvyšok sa podrobí flash chromatografii na silikagéli pri použití zmesi etylacetátu a hexánov v pomere 2 : 3, ako elučného činidla. Získa sa zlúčenina uvedená v nadpise (2,6 g) vo forme bielej pevnej látky s teplotou topenia 130 až 145°C.

P r í k l a d 4 0

Príprava N-{5-[3-allylhexahydro-2,4,6-trioxo-5-(2-propinyl)-s-triazín-1-yl]-4-chlór-2-fluórfenyl}-1-cyklohexén-1,2-dikarboximidu



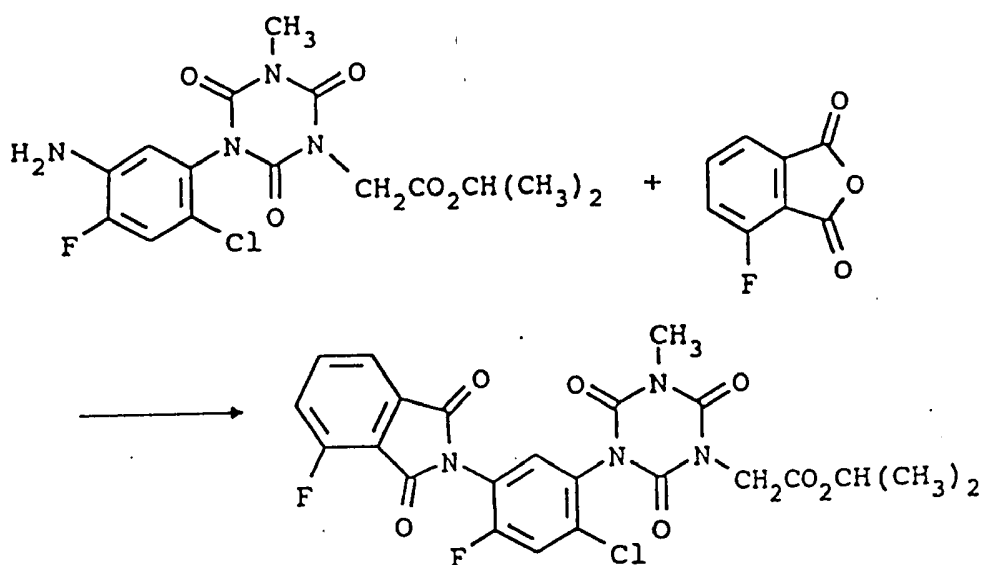
Propargylbromid (0,37 ml, 3,36 mmol) sa pridá k zmesi N-[5-(3-allylhexahydro-2,4,6-trioxo-s-triazín-1-yl)-4-chlór-2-fluórfenyl]-1-cyklohexén-1,2-dikarboximidu (1,00 g, 2,24 mmol) a uhličitanu draselného (0,62 g, 4,48 mmol) v N,N-dimetylformamide. Reakčná zmes sa mieša 7 hodín a naleje do etylacetátu. Organický roztok sa premyje postupne vodou a roztokom chloridu sodného, vysuší bezvodým síranom horečnatým a skoncentruje pri zníženom tlaku. Žltý olejovitý zvyšok sa podrobí flash chromatografii na silikagéli pri použití zmesi etylacetátu a hexánov v pomere 1 : 4, ako elučného činidla. Získa sa zlúčenina uvedená v nadpise (0,60 g) vo forme bielej pevnej látky s teplotou topenia 107 až 114°C.

V podstate rovnakým spôsobom, ale pri použití allylbromidu namiesto propargylbromidu sa získa N-[4-chlór-

5-(3,5-dialylhexahydro-2,4,6-trioxo-s-triazín-1-yl)-2-fluórfenyl]-1-cyklohexén-1,2-dikarboximid vo forme bielej pevnej látky s teplotou topenia 80 až 85°C.

P r í k l a d 4 1

Príprava izopropyl-3-[2-chlór-4-fluór-5-(3-fluórfthalimido)-fenyl]tetrahydro-5-metyl-2,4,6-trioxo-s-triazín-1(2H)-acetátu



Roztok izopropyl-3-(5-amino-2-chlór-4-fluórfenyl)-tetrahydro-5-metyl-2,4,6-trioxo-s-triazín-1(2H)-acetátu (1,0 g, 2,6 mmol) a anhydridu 3-fluórfthalovej kyseliny (0,51 g, 3,1 mmol) v kyseline octovej sa 6 hodín zahrieva k spätnému toku, mieša niekoľko dní pri teplote miestnosti a naleje na ľad. Vodná zmes sa prefiltruje a oddelená pevná látka sa vysuší a chromatografuje na silikagéli pri použití 2,5% éteru v metylénchloride, ako elučného činidla. Získa sa zlúčenina uvedená v nadpise vo forme žltej peny s teplotou topenia 119 až 125°C.

P r í k l a d 4 2

Hodnotenie postemergentnej herbicídnej účinnosti skúšaných zlúčenín

Postemergentná herbicídna účinnosť zlúčenín podľa vynálezu sa demonštruje nasledujúcimi skúškami, pri ktorých sa rôzne dvojklíčne a jednoduché rastliny ošetrí skúšanými zlúčeninami dispergovanými v zmesi vody a acetónu. Pri týchto skúškach sa semenáčky rastlín nechajú rásť počas približne 2 týždňov na malých skúšobných plochách. Skúšané zlúčeniny sa dispergujú v zmesi vody a acetónu 50 : 50 s obsahom 0,5 % Tween 20 (polyoxyetylén-sorbitanmonolaurátový surfaktant od firmy Atlas Chemical Industries) v množstve dostačujúcom pre zaistenie ošetrenia ekvivalentného 0,125 až 0,500 kg/ha, vztiahnuté na účinnú zlúčeninu pri aplikácii na rastliny pomocou rozprašovacej hubice, ktorá pracuje za tlaku 275 kPa predpísaný čas. Po postreku sa rastliny umiestnia na skleníkové police a ošetrujú obvyklým spôsobom porovnateľným s bežnými skleníkovými praktikami. 4 až 5 týždňov po ošetrení sa semenáčky prezerajú a klasifikujú podľa ďalej uvedeného systému. Zistené údaje sú uvedené v tabuľke I. Pokiaľ sa s určitou zlúčeninou vykoná viac ako jedna skúška, predstavujú uvedené údaje priemerné hodnoty.

Druhy rastlín použité pri týchto skúškach sú identifikované skratkami, ktoré sa používajú v hlavičke tabuliek, slovenským názvom a latinským názvom.

Zlúčeniny, ktoré sa používajú pri skúškach postemergentnej a preemergentnej herbicídnej účinnosti, sú identifikované číslom a chemickým názvom. V tabuľke I sú použité zlúčeniny identifikované príslušným číslom.

Klasifikačná stupnica pre hodnotenie herbicídnej účinnosti

Výsledky hodnotenia herbicídnej účinnosti sa klasifikujú niektorým zo stupňov 0 až 9 z ďalej uvedenej klasifikačnej stupnice. Táto klasifikačná stupnica je založená na vizuálnom hodnotení rastu, robustnosti, malformácie, veľkosti, chlorózy a celkového výzoru rastliny v porovnaní s kontrolnými rastlinami.

Stupeň	Význam	Potlačenie (%) v porovnaní s kontrolou
9	Úplné usmrtenie	100
8	Takmer úplné usmrtenie	91 až 99
7	Dobrá herbicídna účinnosť	80 až 90
6	Herbicídna účinnosť	65 až 79
5	Nepopierateľné poškodenie	45 až 64
4	Poškodenie	30 až 44
3	Malá účinnosť	16 až 29
2	Nepatrná účinnosť	6 až 15
1	Stopová účinnosť	1 až 5
0	Žiadna účinnosť	0
-	Nehodnotené	

Druhy rastlín použité pri skúškach herbicídnej účinnosti

Skratka	Slovenský názov	Latinský názov
ABUTH	abutilón	Abutilon theophrasti, medic
AMBEL	ambrózia	Ambrosia artemisiifolia, L.

Skratka	Slovenský názov	Latinský názov
CASOB	kasia	Cassia obtusifolia, L.
CHEAL	mrlík biely	Chenopodium album, L.
IPOSS	povojník	Ipomoea spp.
GALAP	lipkavec obyčajný	Galium aparine
ECHCG	ježatka kuria noha	Echinochloa crus- galli, (L) Beau
SETVI	bar zelený	Setaria viridis, (L) Beauv.
GLXMAW	sója, odr. Williams	Glycine max (L) Merr., odr. Williams
ORYSAT	ryža, odr. Tebonnet	Oryza sativa, L., odr. Tebonnet
TRZAWO	ozimná pšenica, odr. Apollo	Triticum aestivum, odr. Apollo
ZEAMX	kukurica	Zea mays, L.

Zlúčeniny hodnotené ako herbicídne činidlá

Zlúčenina
číslo

- | | |
|---|--|
| 1 | Metyl-3-[2-chlór-5-(1-cyklohexén-1,2-di-
karboximido)-4-fluórfenyl]tetrahydro-5-
metyl-2,4,6-trioxo-s-triazín-1(2H)-acetát |
| 2 | terc.butyl-3-[2-chlór-5-(1-cyklohexén-1,2-
dikarboximido)-4-fluórfenyl]tetrahydro-5-
metyl-2,4,6-trioxo-s-triazín-1(2H)-acetát |

- 3 3-[2-chlór-5-(1-cyklohexén-1,2-dikarboximido)-4-fluórfenyl]tetrahydro-5-metyl-2,4,6-trioxo-s-triazín-1(2H)-octová kyselina
- 4 izopropyl-3-[2-chlór-5-(1-cyklohexén-1,2-dikarboximido)-4-fluórfenyl]tetrahydro-5-metyl-2,4,6-trioxo-s-triazín-1(2H)-acetát
- 5 metyl-3-[5-(1-cyklohexén-1,2-dikarboximido)-2-fluórfenyl]tetrahydro-5-metyl-2,4,6-trioxo-s-triazín-1(2H)-acetát
- 6 metyl-3-[2,4-dichlór-5-(1-cyklohexén-1,2-dikarboximido)fenyl]tetrahydro-5-metyl-2,4,6-trioxo-s-triazín-1(2H)-acetát
- 7 terc.butyl-3-[2,4-dichlór-5-(1-cyklohexén-1,2-dikarboximido)fenyl]tetrahydro-5-metyl-2,4,6-trioxo-s-triazín-1(2H)-acetát
- 8 1-terc.butyl, etyldiester 5-[3-(1-cyklohexén-1,2-dikarboximido)-4-fluórfenyl]dihydro-2,4,6-trioxo-s-triazín-1,3(2H,4H)-dioctovej kyseliny
- 9 etyl-3-[3-(1-cyklohexén-1,2-dikarboximido)-4-fluórfenyl]tetrahydro-2,4,6-trioxo-s-triazín-1(2H)-acetát
- 10 metyl-3-[5-(1-cyklohexén-1,2-dikarboximido)-2,4-difluórfenyl]-5-metyl-2,4,6-trioxo-s-triazín-1(2H)-acetát

- 11 izopropyl-3-[2-chlór-4-fluór-5-(3-fluór-ftalimido)fenyl]tetrahydro-5-metyl-2,4,6-trioxo-s-triazín-1(2H)-acetát

- 12 izopropyl-3-{2-chlór-4-fluór-5-[5,6,8,8a-tetrahydro-1,3-dioxo-1H-imidazo[5,1c][1,4]-tiazín-2(3H)-yl]fenyl}tetrahydro-5-metyl-2,4,6-trioxo-s-triazín-1(2H)-acetát

- 13 izopropyl-3-{2-chlór-4-fluór-5-[(tetrahydro-3-oxo-1H,3H-[1,3,4]tiadiazolo[3,4-a]pyridazín-1-ylidén)amino]fenyl}tetrahydro-5-metyl-2,4,6-trioxo-s-triazín-1(2H)-acetát

- 14 izopropyl-3-[2-chlór-4-fluór-5-(tetrahydro-1,3,7-trioxo-1H-imidazo[5,1-c][1,4]tiazín-2(3H)-yl)fenyl]tetrahydro-5-metyl-2,4,6-trioxo-s-triazín-1(2H)-acetát

- 15 N-{4-chlór-2-fluór-5-[hexahydro-2,4,6-trioxo-3-(2-propinyl)-s-triazín-1-yl]fenyl}-1-cyklohexén-1,2-dikarboximid

- 16 N-{4-chlór-2-fluór-5-[hexahydro-3-metyl-2,4,6-trioxo-5-(2-propinyl)-s-triazín-1-yl]fenyl}-1-cyklohexén-1,2-dikarboximid

- 17 N-[5-(3-alylhexahydro-5-metyl-2,4,6-trioxo-s-triazín-1-yl)-4-chlór-2-fluórfenyl]-1-cyklohexén-1,2-dikarboximid

- 18 N-[5-(3-alylhexahydro-2,4,6-trioxo-s-triazín-1-yl)-4-chlór-2-fluórfenyl]-1-cyklohexén-1,2-dikarboximid

- 19 N-[4-chlór-5-(3,5-dialylhexahydro-2,4,6-trioxo-s-triazín-1-yl)-2-fluórfenyl]-1-cyklohexén-1,2-dikarboximid
- 20 N-{5-[3-alyhexahydro-2,4,6-trioxo-5-(2-propinyl)-s-triazín-1-yl]-4-chlór-2-fluórfenyl}-1-cyklohexén-1,2-dikarboximid

T a b u l k a I

Hodnotenie postemergentnej herbicídnej účinnosti skúšaných zlúčenín

Zl. č.	dávka (kg/ha)	ABUTH	AMBEL	CASOB	CHEAL	IPOSS	GALAP	ECHCG	SETVI	GLXMAW	ORYSAT	TRZAWO	ZEAMX
1	0,500	9,0	9,0	7,0	4,0	8,0	4,0	1,0	2,0	7,0	4,5	5,5	5,0
	0,250	9,0	9,0	7,0	3,0	9,0	3,0	0,0	0,0	6,5	4,5	5,5	4,5
	0,125	9,0	7,0	5,0	2,0	8,0	3,0	0,0	0,0	5,0	3,5	4,0	4,5
2	0,500	9,0	8,5	7,0	8,0	7,0	8,5	0,5	0,5	5,5	4,5	4,5	4,3
	0,250	9,0	7,5	5,5	7,5	8,0	9,0	0,0	0,0	5,5	3,8	4,3	4,0
	0,125	9,0	6,0	5,0	5,5	7,5	7,0	0,0	0,0	4,3	3,0	3,5	3,3
3	0,500	2,0	3,0	3,0	2,0	5,0	2,0	0,0	0,0	4,0	4,0	5,0	4,5
	0,250	0,0	3,0	2,0	2,0	4,0	2,0	0,0	0,0	4,5	4,0	4,5	4,5
	0,125	1,0	1,0	2,0	0,0	2,0	0,0	0,0	0,0	3,5	3,0	4,0	4,0
4	0,500	9,0	9,0	9,0	8,0	8,0	8,0	2,0	3,0	7,0	4,0	5,0	4,5
	0,250	9,0	7,0	8,0	8,0	8,0	7,0	0,0	1,0	6,0	4,0	4,5	4,5
	0,125	9,0	5,0	7,0	6,0	7,0	6,0	0,0	0,0	5,0	4,0	4,5	4,5

<u>čl.</u>	<u>dávka</u> <u>(kg/ha)</u>	<u>ABUTH</u>	<u>AMBEL</u>	<u>CASOB</u>	<u>CHEAL</u>	<u>IPOSS</u>	<u>GALAP</u>	<u>ECHCG</u>	<u>SETM</u>	<u>GLXMAW</u>	<u>ORYSAT</u>	<u>TRZAWO</u>	<u>ZEAMX</u>
5	0,500	2,0	2,0	0,0	0,0	5,0	3,0	0,0	2,0	4,5	2,0	2,0	3,5
	0,250	0,0	2,0	0,0	0,0	2,0	2,0	0,0	0,0	4,5	2,0	1,0	2,5
	0,125	2,0	2,0	0,0	0,0	3,0	0,0	0,0	0,0	4,0	1,5	1,0	2,5
6	0,500	8,0	5,0	4,5	7,5	7,0	4,5	1,0	2,0	5,0	2,8	3,5	3,8
	0,250	6,5	4,5	4,5	8,0	6,0	4,0	1,0	1,0	4,3	2,8	3,3	3,8
	0,125	6,0	3,5	3,0	5,5	5,5	3,0	0,0	0,0	4,0	2,0	2,5	3,0
7	0,500	7,5	7,5	6,0	8,0	7,0	6,0	1,0	1,0	5,0	3,0	3,3	4,8
	0,250	9,0	7,5	6,0	8,0	6,0	4,5	1,0	1,0	5,0	3,0	2,5	4,8
	0,125	7,0	6,0	5,0	7,0	5,5	2,5	0,0	0,0	4,5	2,3	2,5	3,8
8	0,500	3,0	3,0	0,0	2,0	3,0	4,0	0,0	0,0	2,0	1,5	0,5	0,5
	0,250	3,0	2,0	0,0	2,0	2,0	4,0	0,0	0,0	2,5	1,5	0,5	0,5
	0,125	2,0	0,0	0,0	0,0	3,0	2,0	0,0	0,0	1,5	1,5	0,5	0,0

Zl. č.	dávka (kg/ha)	ABUTH	AMBEL	CASOB	CHEAL	IPOSS	GALAP	ECHCG	SETVI	GLXMAW	ORYSAT	TRZAWO	ZEAMX
9	0,500	5,4	2,0	0,0	2,0	4,0	3,0	0,0	0,0	3,5	2,0	2,0	1,5
	0,250	4,0	2,0	0,0	0,0	2,0	2,0	0,0	0,0	2,5	2,0	2,0	1,5
	0,125	3,0	0,0	0,0	0,0	2,0	2,0	0,0	0,0	2,0	1,5	1,0	1,0
10	0,500	9,0	6,0	0,0	0,0	5,0	0,0	0,0	0,0	4,5	4,0	4,0	4,0
	0,250	6,0	4,0	2,0	2,0	4,0	2,0	0,0	0,0	4,0	3,5	3,5	4,0
	0,125	6,0	4,0	1,0	0,0	8,0	0,0	0,0	0,0	3,5	3,0	3,5	4,0
11	0,500	7,0	9,0	6,0	9,0	6,0	3,0	3,0	3,0	5,5	2,0	1,0	3,0
	0,250	6,0	6,0	4,0	9,0	4,0	2,0	3,0	3,0	4,5	2,0	0,5	2,5
	0,125	9,0	9,0	4,0	9,0	3,0	1,0	3,0	2,0	4,0	1,5	0,5	2,5
12	0,500	9,0	9,0	9,0	9,0	9,0	8,0	3,0	4,0	6,5	3,0	2,5	5,0
	0,250	9,0	9,0	9,0	9,0	9,0	8,0	3,0	3,0	5,5	3,5	2,5	-4,5
	0,125	9,0	9,0	9,0	9,0	7,0	7,0	2,0	2,0	6,5	3,0	2,5	4,0

zl. č.	dávka (kg/ha)	ABUTH	AMBEL	CASOB	CHEAL	IPOSS	GALAP	ECHCG	SETVI	GLXMAW	ORYSAT	IRZAWO	ZEAMX
13	0,500	9,0	9,0	9,0	9,0	9,0	8,0	0,0	1,0	6,5	4,0	3,5	4,0
	0,250	9,0	7,0	9,0	9,0	8,0	9,0	0,0	1,0	5,5	4,5	3,5	3,5
	0,125	9,0	6,0	7,0	8,0	7,0	7,0	0,0	1,0	5,5	4,0	3,5	3,5
14	0,500	6,0	6,0	5,0	7,0	4,0	4,0	0,0	1,0	4,5	4,5	2,0	1,5
	0,250	5,0	5,0	5,0	8,0	3,0	4,0	0,0	1,0	4,0	2,5	2,0	1,0
	0,125	3,0	4,0	5,0	6,0	3,0	3,0	0,0	1,0	3,5	2,5	2,0	1,5
15	0,500	2,0	5,0	1,0	9,0	2,0	9,0	4,0	5,0	6,0	2,0	5,0	6,0
	0,250	0,0	5,0	0,0	8,0	0,0	5,0	3,0	4,0	4,0	0,0	3,0	5,0
	0,125	0,0	3,0	0,0	8,0	0,0	5,0	3,0	4,0	2,0	0,0	2,0	3,0
16	0,500	4,0	4,0	3,0	5,0	6,0	4,0	0,0	0,0	4,0	4,5	4,0	4,0
	0,250	3,0	4,0	2,0	5,0	6,0	4,0	0,0	0,0	3,5	4,5	3,5	3,5
	0,125	2,0	2,0	1,0	4,0	4,0	3,0	0,0	0,0	3,0	3,0	2,5	2,5

zl. č.	dávka (kg/ha)	ABUTH	AMBEL	CASOB	CHEAL	IPOSS	GALAP	ECHCG	SETVI	GLXMAW	ORYSAT	TRZAWO	ZEAMX
17	0,500	8,0	7,0	2,0	8,0	5,0	4,0	0,0	2,0	5,5	3,5	3,0	4,0
	0,250	6,0	5,0	3,0	6,0	3,0	3,0	0,0	1,0	4,0	2,5	2,5	3,0
	0,125	6,0	4,0	2,0	5,0	3,0	2,0	0,0	1,0	3,0	2,5	2,0	2,5
18	0,500	6,0	5,0	4,0	7,0	4,0	6,0	4,0	4,0	5,5	4,0	4,5	5,0
	0,250	1,0	3,0	3,0	7,0	2,0	2,0	0,0	2,0	3,5	3,0	3,5	3,5
	0,125	0,0	1,0	2,0	6,0	2,0	0,0	0,0	1,0	4,0	2,0	2,5	2,0
19	0,500	3,0	6,0	2,0	7,0	3,0	4,0	0,0	0,0	1,0	2,0	2,0	3,0
	0,250	3,0	5,0	0,0	6,0	3,0	4,0	0,0	0,0	1,0	2,0	2,0	2,0
	0,125	1,0	4,0	0,0	4,0	1,0	3,0	0,0	0,0	1,0	2,0	2,0	1,0
20	0,500	6,0	6,0	2,0	8,0	6,0	8,0	0,0	0,0	2,0	2,0	2,0	3,0
	0,250	6,0	5,0	0,0	7,0	4,0	2,0	0,0	0,0	1,0	2,0	2,0	2,0
	0,125	3,0	4,0	0,0	7,0	2,0	2,0	0,0	0,0	1,0	2,0	1,0	2,0

P r í k l a d 4 3

Hodnotenie preemergentnej herbicídnej účinnosti skúšaných zlúčenín

Preemergentná herbicídna účinnosť zlúčenín podľa vynálezu sa demonštruje nasledujúcimi skúškami, pri ktorých sa semená rôznych dvojklíčnych a jednoklíčnych rastlín oddelene zmiešajú so zeminou pre presadzovanie rastlín v korenáčoch, pričom vzniknutá zmes sa umiestni ako vrchná vrstva s hrúbkou približne 2,5 cm v oddelených pohárkoch s objemom 0,47 litra. Po výsevu, ktorý sa týmto spôsobom vykoná, sa pohárky ošetrí skúšanými zlúčeninami rozpustnými v zmesi vody a acetónu v množstve dostačujúcom pre zaistenie ošetrenia ekvivalentného 0,125 až 0,500 kg/ha, vzťahnuté na účinnú zlúčeninu. Po postreku sa pohárky umiestnia na skleníkové police, zavlažia a ďalej sa ošetrujú obvyklým spôsobom porovnateľným s bežnými skleníkovými praktikami. 4 až 5 týždňov po ošetrení sa skúška ukončí a pohárky sa prezerajú a klasifikujú podľa systému uvedeného v príklade 42.

Zistené údaje sú uvedené v tabuľke II. V tabuľke II sú skúšané zlúčeniny identifikované číslom, ktoré dostali pridelené v príklade 42.

T a b u l k a II

Hodnotenie preemergentnej herbicídnej účinnosti skúšaných zlúčenín

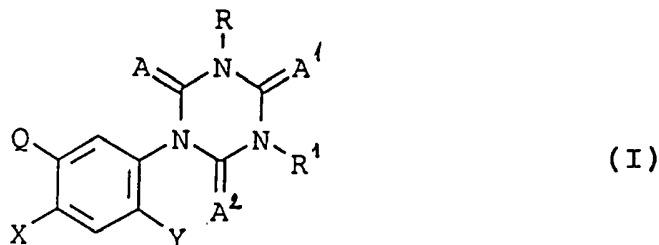
čl. č.	dávka (kg/ha)	<u>ABUTH</u>	<u>CASOB</u>	<u>CHEAL</u>	<u>IPOSS</u>	<u>GALAP</u>	<u>ECHCG</u>	<u>SETVI</u>	<u>GLXMAW</u>	<u>ORYSAT</u>	<u>IRZAWO</u>	<u>ZEAMX</u>
1	0,500	8,0	4,0	6,0	9,0	0,0	0,0	4,0	0,0	0,0	0,0	0,0
	0,250	9,0	0,0	5,0	9,0	2,0	0,0	2,0	0,0	0,0	0,0	0,0
	0,125	0,0	0,0	5,0	9,0	0,0	0,0	2,0	0,0	0,0	0,0	0,0
2	0,500	9,0	7,0	8,0	9,0	6,0	0,0	0,0	0,0	1,0	1,0	2,0
	0,250	9,0	5,0	3,0	9,0	6,0	0,0	0,0	0,0	1,0	1,0	0,0
	0,125	7,0	5,0	4,0	9,0	6,0	0,0	0,0	0,0	0,0	1,0	0,0
3	0,500	0,0	0,0	6,0	7,0	0,0	2,0	4,0	0,0	0,0	0,0	0,0
	0,250	0,0	0,0	4,0	0,0	0,0	0,0	0,0	0,0	0,0	0,0	0,0
	0,125	0,0	0,0	3,0	0,0	0,0	0,0	0,0	0,0	0,0	0,0	0,0
4	0,500	9,0	6,0	9,0	9,0	6,0	0,0	4,0	0,0	2,0	4,0	3,0
	0,250	9,0	3,0	0,0	9,0	3,0	0,0	2,0	0,0	1,0	2,0	3,0
	0,125	6,0	2,0	0,0	9,0	2,0	0,0	0,0	0,0	1,0	2,0	0,0

čl. č.	dávka (kg/ha)	ABUTH	AMBEL	CASOB	CHEAL	IPOSS	GALAP	ECHCG	SETVI	GLXMAW	ORYSAT	TRZAWO	ZEAMX
9	0,500	0,0	0,0	0,0	0,0	0,0	0,0	0,0	0,0	0,0	0,0	0,0	0,0
	0,250	0,0	0,0	0,0	0,0	0,0	0,0	0,0	0,0	0,0	0,0	0,0	0,0
	0,125	0,0	0,0	0,0	0,0	0,0	0,0	0,0	0,0	0,0	0,0	0,0	0,0
10	0,500	0,0	0,0	6,0	8,0	0,0	4,0	3,0	3,0	0,0	0,0	0,0	0,0
	0,250	0,0	0,0	6,0	9,0	0,0	3,0	0,0	4,0	0,0	2,0	0,0	0,0
	0,125	-	0,0	4,0	3,0	0,0	-	0,0	1,0	0,0	2,0	0,0	0,0
11	0,500	3,0	0,0	0,0	9,0	0,0	-	0,0	0,0	0,0	0,0	0,0	0,0
	0,250	3,0	0,0	0,0	9,0	0,0	-	0,0	0,0	0,0	0,0	0,0	0,0
	0,125	0,0	0,0	0,0	9,0	0,0	-	0,0	0,0	0,0	0,0	0,0	0,0
12	0,500	9,0	3,0	9,0	9,0	4,0	-	0,0	3,0	1,0	0,0	0,0	3,0
	0,250	9,0	0,0	9,0	9,0	6,0	-	0,0	0,0	1,0	0,0	0,0	1,0
	0,125	5,0	0,0	9,0	9,0	2,0	-	0,0	0,0	0,0	0,0	0,0	0,0

Zl. č.	dávk (kg/ha)	<u>ABUTH</u>	<u>AMBEL</u>	<u>CASOB</u>	<u>CHEAL</u>	<u>IPOSS</u>	<u>GALAP</u>	<u>ECHCG</u>	<u>SETVI</u>	<u>GLXMAW</u>	<u>ORYSAT</u>	<u>TRZAWO</u>	<u>ZEAMX</u>
18	0,500	0,0	0,0	0,0	7,0	4,0	4,0	0,0	0,0	0,0	0,0	0,0	0,0
	0,250	0,0	0,0	0,0	5,0	0,0	0,0	0,0	0,0	0,0	0,0	0,0	0,0
	0,125	0,0	0,0	0,0	0,0	0,0	0,0	0,0	0,0	0,0	0,0	0,0	0,0

P A T E N T O V É N Á R O K Y

1. Zlúčeniny všeobecného vzorca I



kde

X a Y predstavuje každý nezávisle atóm vodíka, atóm halogénu, nitroskupinu, kyanoskupinu, alkylskupinu s 1 až 4 atómami uhlíka, halogénalkylskupinu s 1 až 4 atómami uhlíka, alkoxy skupinu s 1 až 4 atómami uhlíka, halogénalkoxy skupinu s 1 až 4 atómami uhlíka alebo skupinu vzorca $S(O)_m R^2$;

m predstavuje celé číslo 0, 1 alebo 2;

R^2 predstavuje alkylskupinu s 1 až 4 atómami uhlíka alebo halogénalkylskupinu s 1 až 4 atómami uhlíka;

R predstavuje atóm vodíka, alkylskupinu s 1 až 6 atómami uhlíka, alkoxyalkylskupinu s 2 až 12 atómami uhlíka, alkylkarbonylalkylskupinu s 3 až 12 atómami uhlíka, halogénalkylkarbonylalkylskupinu s 3 až 12 atómami uhlíka, alkoxykarbonylalkylskupinu s 3 až 12 atómami uhlíka, halogénalkoxykarbonylalkylskupinu s 3 až 12 atómami uhlíka, alkenylskupinu s 3 až 6 atómami uhlíka, alkinylskupinu s 3 až 6 atómami uhlíka, atóm alkalického kovu,

fenylskupinu, ktorá je prípadne substituovaná jedným až tromi substituentmi zvolenými zo súboru

zahrňajúceho atóm halogénu, alkylskupinu s 1 až 4 atómami uhlíka, alkoxy skupinu s 1 až 4 atómami uhlíka a halogénalkoxy skupinu s 1 až 4 atómami uhlíka, alebo

benzylskupinu, ktorá je prípadne substituovaná jedným až tromi substituentmi zvolenými zo súboru zahrňajúceho atóm halogénu, alkylskupinu s 1 až 4 atómami uhlíka, alkoxy skupinu s 1 až 4 atómami uhlíka a halogénalkoxy skupinu s 1 až 4 atómami uhlíka;

R¹

predstavuje atóm vodíka, alkenylskupinu s 3 až 6 atómami uhlíka, alkynylskupinu s 3 až 6 atómami uhlíka, kyanoskupinu,

alkylskupinu s 1 až 12 atómami uhlíka, ktorá je prípadne substituovaná jedným alebo viacerými atómami halogénu alebo jedným substituentom zvoleným zo súboru zahrňajúceho kyanoskupinu, skupinu vzorca $C(O)R^3$, $C(W)R^4$, $OC(O)R^5$, $CH_2OC(O)R^5$, OR^4 , CH_2OR^4 a $CR^6(OR^7)_2$ alebo jednou fenylskupinou, ktorá je prípadne substituovaná jedným až tromi substituentmi zvolenými zo súboru zahrňajúceho atóm halogénu, alkylskupinu s 1 až 4 atómami uhlíka, alkoxy skupinu s 1 až 4 atómami uhlíka a halogénalkoxy skupinu s 1 až 4 atómami uhlíka, alebo

fenylskupinu, ktorá je prípadne substituovaná jedným až tromi substituentmi zvolenými zo súboru zahrňajúceho atóm halogénu, alkylskupinu s 1 až 4 atómami uhlíka, alkoxy skupinu s 1 až 4 atómami uhlíka a halogénalkoxy skupinu s 1 až 4 atómami uhlíka;

R^3 predstavuje hydroxyskupinu alebo skupinu vzorca OR^8 , SR^8 alebo NR^9R^{10} ;

W predstavuje atóm kyslíka alebo skupinu vzorca NOR^9 , $NCOR^9$ alebo $NNHCONH_2$;

R^4 , R^5 a R^6 predstavuje každý nezávisle atóm vodíka, alkylskupinu s 1 až 4 atómami uhlíka alebo halogénalkylskupinu s 1 až 4 atómami uhlíka;

R^7 predstavuje alkylskupinu s 1 až 4 atómami uhlíka;

R^8 predstavuje alkylskupinu s 1 až 6 atómami uhlíka, ktorá je prípadne substituovaná substituentom zvoleným zo súboru zahŕňajúceho alkoxy skupinu s 1 až 4 atómami uhlíka, alkyltioskupinu s 1 až 4 atómami uhlíku, atóm halogénu, hydroxyskupinu, cykloalkylskupinu s 3 až 6 atómami uhlíka, furylskupinu alebo fenylskupinu, ktorá je prípadne substituovaná jedným alebo viacerými substituentmi zvolenými ze súboru zahŕňajúceho atóm halogénu, kyanoskupinu, nitroskupinu, alkylskupinu s 1 až 4 atómami uhlíka, halogénalkylskupinu s 1 až 4 atómami uhlíka, alkoxy skupinu s 1 až 4 atómami uhlíka a halogénalkoxy skupinu s 1 až 4 atómami uhlíka,

alkenylskupinu s 3 až 6 atómami uhlíka, ktorá je prípadne substituovaná substituentom zvoleným zo súboru zahŕňajúceho alkoxy skupinu s 1 až 4 atómami uhlíka, atóm halogénu, cykloalkylskupinu s 3 až 6 atómami uhlíka a fenylskupinu, ktorá je prípadne substituovaná jedným alebo viacerými substituentmi zvolenými zo súboru zahŕňajúceho atóm halogénu, kyanoskupinu, nitroskupinu, alkylsku-

pinu s 1 až 4 atómami uhlíka, halogénalkylskupinu s 1 až 4 atómami uhlíka, alkoxy skupinu s 1 až 4 atómami uhlíka a halogénalkoxy skupinu s 1 až 4 atómami uhlíka,

alkynylskupinu s 3 až 6 atómami uhlíka, ktorá je prípadne substituovaná alkoxy skupinou s 1 až 4 atómami uhlíka alebo atómom halogénu;

cykloalkylskupinu s 3 až 6 atómami uhlíka,

skupinu vzorca $N=C(R^4R^5)$ alebo

atóm alkalického kovu, kovu alkalických zemín, mangánu, medi, zinku, kobaltu, striebra, niklu, amónny alebo organoamóniový kation;

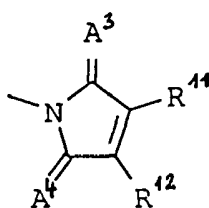
R^9 a R^{10} predstavuje každý nezávisle vždy atóm vodíka, alkylskupinu s 1 až 6 atómami uhlíka,

benzylskupinu, ktorá je prípadne substituovaná jedným alebo viacerými substituentmi zvolenými zo súboru zahŕňajúceho atóm halogénu, kyanoskupinu, nitroskupinu, alkylskupinu s 1 až 4 atómami uhlíka, halogénalkylskupinu s 1 až 4 atómami uhlíka, alkoxy skupinu s 1 až 4 atómami uhlíka a halogénalkoxy skupinu s 1 až 4 atómami uhlíka, alebo

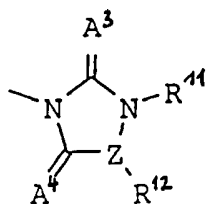
fenylskupinu, ktorá je prípadne substituovaná jedným alebo viacerými substituentmi zvolenými zo súboru zahŕňajúceho atóm halogénu, kyanoskupinu, nitroskupinu, alkylskupinu s 1 až 4 atómami uhlíka, halogénalkylskupinu s 1 až 4 atómami uhlíka,

alkoxyskupinu s 1 až 4 atómami uhlika a halogén-
alkoxyskupinu s 1 až 4 atómami uhlika;

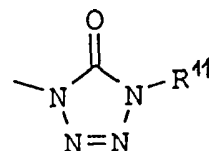
Q predstavuje skupinu vzorca Q1 až Q32



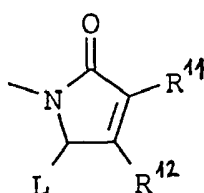
Q1



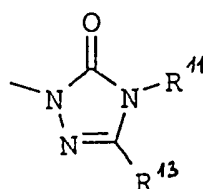
Q2



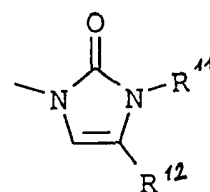
Q3



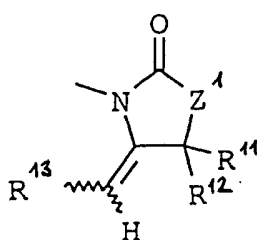
Q4



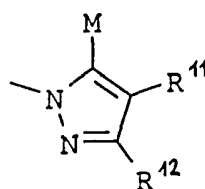
Q5



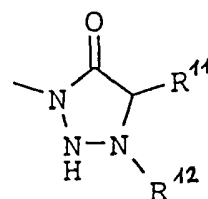
Q6



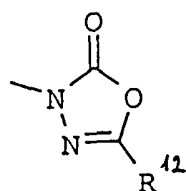
Q7



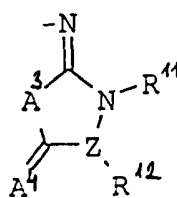
Q8



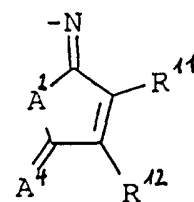
Q9



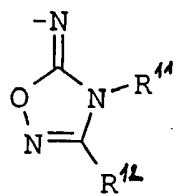
Q10



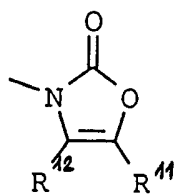
Q11



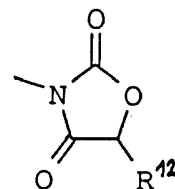
Q12



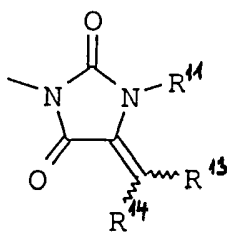
Q13



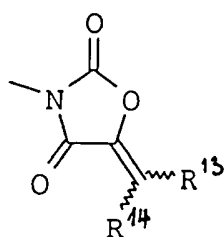
Q14



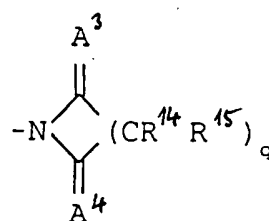
Q15



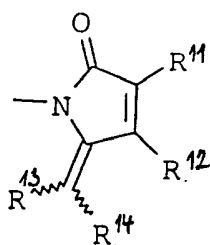
Q16



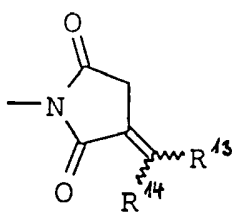
Q17



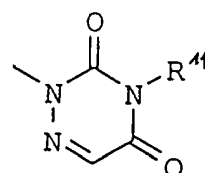
Q18



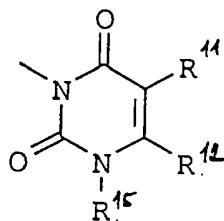
Q19



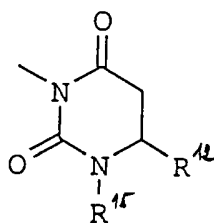
Q20



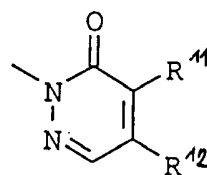
Q21



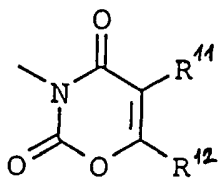
Q22



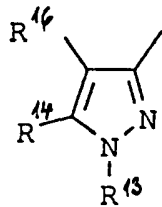
Q23



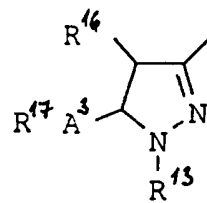
Q24



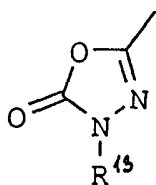
Q25



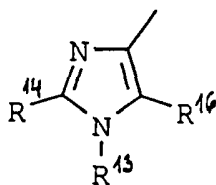
Q26



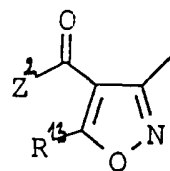
Q27



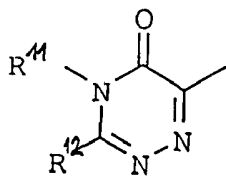
Q28



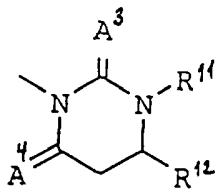
Q29



Q30



Q31



Q32

R^{11} a R^{12} predstavuje nezávisle vždy

atóm vodíka,

alkylskupinu s 1 až 6 atómami uhlíka, ktorá je
prípadne substituovaná jedným alebo viacerými
atómami halogénu, alebo

cykloalkylskupinu s 3 až 6 atómami uhlíka, ktorá je prípadne substituovaná jedným alebo viacerými atómami halogénu, a ďalej

R^{11} a R^{12} dohromady s atómami, ku ktorým sú pripojené predstavujú štvor- až sedemčlenný nasýtený alebo nenasýtený kruh, ktorý je prípadne prerušený atómom kyslíka, $S(O)_r$ alebo atómom dusíka a ktorý je prípadne substituovaný jednou až tromi metylskupinami alebo jedným alebo viacerými atómami halogénu;

R^{13} , R^{14} a R^{15} predstavuje nezávisle vždy atóm vodíka, alkylskupinu s 1 až 3 atómami uhlíka alebo halogénalkylskupinu s 1 až 3 atómami uhlíka;

R^{16} predstavuje atóm vodíka alebo halogénu;

R^{17} predstavuje alkylskupinu s 1 až 4 atómami uhlíka alebo halogénalkylskupinu s 1 až 4 atómami uhlíka;

A , A^1 , A^2 , A^3 a A^4 predstavuje nezávisle vždy atóm kyslíka alebo síry;

L predstavuje hydroxyskupinu, atóm halogénu, alkoxy- skupinu s 1 až 3 atómami uhlíka alebo alkyltioskupinu s 1 až 3 atómami uhlíka;

M predstavuje atóm halogénu alebo alkylskupinu s 1 až 3 atómami uhlíka;

Z predstavuje atóm dusíka alebo skupinu CH ;

Z^1 predstavuje skupinu NR^9 alebo atóm kyslíka;

Z^2 predstavuje skupinu OR^7 alebo NR^9R^{10} ;

r predstavuje celé číslo 0, 1 alebo 2; a

q predstavuje celé číslo 2, 3 alebo 4.

2. Zlúčeniny podľa nároku 1 všeobecného vzorca I, kde

X predstavuje atóm fluóru alebo chlóru;

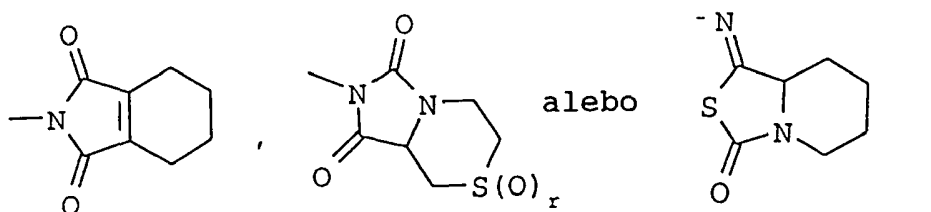
Y predstavuje atóm chlóru;

R predstavuje alkylskupinu s 1 až 4 atómami uhlíka, alylskupinu alebo propargylskupinu;

R¹ predstavuje skupinu vzorca CH₂CO₂R⁸;

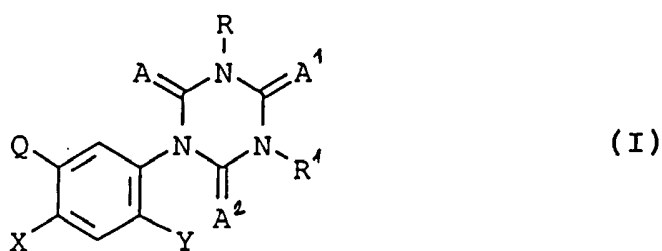
R⁸ predstavuje alkylskupinu s 1 až 4 atómami uhlíka;

Q predstavuje skupinu vzorca



3. Zlúčenina podľa nároku 2, ktorou je izopropyl-3-{2-chlór-4-fluór-5-[5,6,8,8a-tetrahydro-1,3-di-oxo-1H-imidazo[5,1-c][1,4]tiazín-2(3H)-yl]fenyl}tetrahydro-5-metyl-2,4,6-trioxo-s-triazín-1(2H)-acetát.

4. Spôsob potlačovania nežiadúcich druhov rastlín, v y z n a č u j ú c i s a t ý m , že sa na listy týchto rastlín alebo na pôdu alebo do vody obsahujúcej semená alebo iné rozmnožovacie orgány týchto rastlín aplikuje herbicídne účinné množstvo zlúčeniny podľa nároku 1 všeobecného vzorca I



kde X, Y, R, R¹, A, A¹, A² a Q majú význam uvedený v nároku 1.

5. Spôsob podľa nároku 4, v y z n a č u j ú c i s a t ý m, že zlúčenina je zvolená zo súboru zahrňajúceho

izopropyl 3-{2-chlór-4-fluór-5-[5,6,8,8a-tetrahydro-1,3-di-oxo-1H-imidazo[5,1-c][1,4]tiazín-2(3H)-yl]fenyl}tetrahydro-5-metyl-2,4,6-trioxo-s-triazín-1(2H)-acetát;

terc.butyl-3-[2-chlór-5-(1-cyklohexén-1,2-dikarboximido)-4-fluórfenyl]tetrahydro-5-metyl-2,4,6-trioxo-s-triazín-1(2H)-acetát;

izopropyl-3-[2-chlór-5-(1-cyklohexén-1,2-dikarboximido)-4-fluórfenyl]tetrahydro-5-metyl-2,4,6-trioxo-s-triazín-1(2H)-acetát;

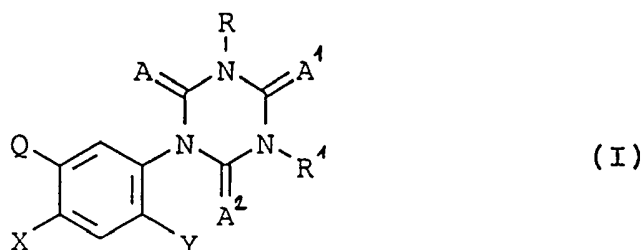
metyl-3-[2-chlór-5-(1-cyklohexén-1,2-dikarboximido)-4-fluórfenyl]tetrahydro-5-metyl-2,4,6-trioxo-s-triazín-1(2H)-acetát;

izopropyl 3-{2-chlór-4-fluór-5-[(tetrahydro-3-oxo-1H,3H-[1,3,4]tiadiazolo[3,4-a]pyridazín-1-ylidén)amino]fenyl}-tetrahydro-5-metyl-2,4,6-trioxo-s-triazín-1(2H)-acetát a

izopropyl 3-[2-chlór-4-fluór-5-(tetrahydro-1,3,7-trioxo-1H-imidazo[5,1-c][1,4]tiazín-2(3H)-yl)fenyl]tetrahydro-5-metyl-2,4,6-trioxo-s-triazín-1(2H)-acetát.

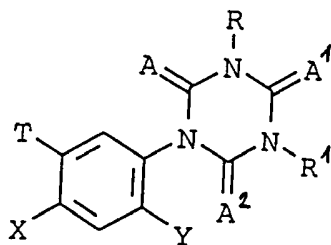
6. Spôsob podľa nároku 4, v y z n a č u j ú c i s a t ý m, že sa zlúčenina aplikuje na listy rastlín alebo do pôdy alebo do vody, ktoré obsahujú semená alebo iné rozmnožovacie orgány týchto rastlín v dávke asi 0,016 kg/ha až 4,0 kg/ha.

7. Herbicídny prostriedok, v y z n a č u j ú c i s a t ý m, že obsahuje inertný pevný alebo kvapalný nosič a herbicídne účinné množstvo zlúčeniny podľa nároku 1 všeobecného vzorca I



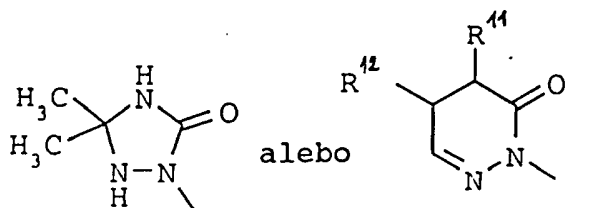
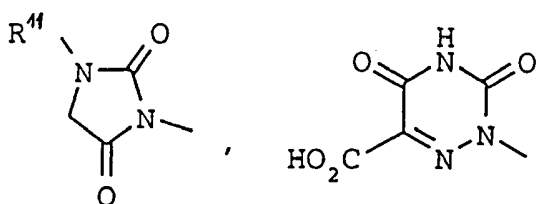
kde X, Y, R, R¹, A, A¹, A² a Q majú význam uvedený v nároku 1.

8. Zlúčeniny všeobecného vzorca



kde

T představuje skupinu vzorca $-\text{NH}_2$, $-\text{NCO}$, $-\text{NCS}$, $-\text{N}_3$, NHNH_2 , $\text{NHC}(\text{S})\text{NHR}^{11}$, $-\text{C}(\text{O})\text{NHNHR}^{13}$, $-\text{C}(\text{O})\text{H}$, $-\text{C}(\text{O})\text{CH}_3$, $-\text{C}(\text{O})\text{CO}_2(\text{alkyl s 1 až 4 atómami uhlika})$, $-\text{C}(\text{O})\text{CH}_2\text{C}(\text{O})\text{R}^{11}$, $-\text{C}(\text{O})\text{CH}_2\text{C}(\text{A}^3)\text{O}(\text{alkyl s 1 až 4 atómami uhlika})$, $-\text{CO}_2(\text{alkyl s 1 až 4 atómami uhlika})$, $-\text{N}=\text{C}=\text{NR}^{11}$, $-\text{NHC}(\text{O})\text{NHR}^{11}$, $-\text{NHC}(\text{S})\text{NR}^{11}\text{HNR}^{12}$, $-\text{N}=\text{C}(\text{SCH}_3)\text{NHR}^{11}$, $-\text{NHCO}_2(\text{alkyl s 1 až 4 atómami uhlika})$, $-\text{C}(\text{Cl})=\text{NOH}$,



X a Y představuje každý nezávisle atóm vodíka, atóm halogénu, nitroskupinu, kyanoskupinu, alkylskupinu s 1 až 4 atómami uhlika, halogénalkylskupinu s 1 až 4 atómami uhlika, alkoxy skupinu s 1 až 4 atómami uhlika, halogénalkoxy skupinu s 1 až 4 atómami uhlika alebo skupinu vzorca $\text{S}(\text{O})_m\text{R}^2$;

m predstavuje celé číslo 0, 1 alebo 2;

R^2 predstavuje alkylskupinu s 1 až 4 atómami uhlika alebo halogénalkylskupinu s 1 až 4 atómami uhlika;

R predstavuje atóm vodíka, alkylskupinu s 1 až 6 atómami uhlika, alkoxyalkylskupinu s 2 až 12 atómami uhlika, alkylkarbonylalkylskupinu s 3 až 12 atómami

uhlíka, halogénalkylkarbonylalkylskupinu s 3 až 12 atómami uhlíka, alkoxykarbonylalkylskupinu s 3 až 12 atómami uhlíka, halogénalkoxykarbonylalkylskupinu s 3 až 12 atómami uhlíka, alkenylskupinu s 3 až 6 atómami uhlíka, alkynylskupinu s 3 až 6 atómami uhlíka,

fenylskupinu, ktorá je prípadne substituovaná jedným až tromi substituentmi zvolenými zo súboru zahŕňajúceho atóm halogénu, alkylskupinu s 1 až 4 atómami uhlíka, alkoxy skupinu s 1 až 4 atómami uhlíka a halogénalkoxy skupinu s 1 až 4 atómami uhlíka, alebo

benzylskupinu, ktorá je prípadne substituovaná jedným až tromi substituentmi zvolenými zo súboru zahŕňajúceho atóm halogénu, alkylskupinu s 1 až 4 atómami uhlíka, alkoxy skupinu s 1 až 4 atómami uhlíka a halogénalkoxy skupinu s 1 až 4 atómami uhlíka;

R^1 predstavuje atóm vodíka, alkenylskupinu s 3 až 6 atómami uhlíka, alkynylskupinu s 3 až 6 atómami uhlíka, kyanoskupinu,

alkylskupinu s 1 až 12 atómami uhlíka, ktorá je prípadne substituovaná jedným alebo viacerými atómami halogénu alebo jedným substituentom zvoleným zo súboru zahŕňajúceho kyanoskupinu, skupinu vzorca $C(O)R^3$, $OC(O)R^5$, $CH_2OC(O)R^5$, OR^4 , CH_2OR^4 a $CR^6(OR^7)_2$ alebo jednou fenylskupinou, ktorá je prípadne substituovaná jedným až tromi substituentmi zvolenými zo súboru zahŕňajúceho atóm halogénu, alkylskupinu s 1 až 4 atómami uhlíka, alkoxy skupinu

s 1 až 4 atómami uhlíka a halogénalkoxyskupinu s 1 až 4 atómami uhlíka, alebo

fenylskupinu, ktorá je prípadne substituovaná jedným až tromi substituentmi zvolenými zo súboru zahrňajúceho atóm halogénu, alkylskupinu s 1 až 4 atómami uhlíka, alkoxy skupinu s 1 až 4 atómami uhlíka a halogénalkoxyskupinu s 1 až 4 atómami uhlíka;

R^3 predstavuje skupinu vzorca OR^8 , SR^8 alebo NR^9R^{10} ;

R^4 , R^5 a R^6 predstavuje každý nezávisle atóm vodíka, alkylskupinu s 1 až 4 atómami uhlíka alebo halogénalkylskupinu s 1 až 4 atómami uhlíka;

R^7 predstavuje alkylskupinu s 1 až 4 atómami uhlíka;

R^8 predstavuje alkylskupinu s 1 až 6 atómami uhlíka, ktorá je prípadne substituovaná substituentom zvoleným zo súboru zahrňajúceho alkoxy skupinu s 1 až 4 atómami uhlíka, alkyltioskupinu s 1 až 4 atómami uhlíka, atóm halogénu, hydroxyskupinu, cykloalkylskupinu s 3 až 6 atómami uhlíka, furylskupinu alebo fenylskupinu, ktorá je prípadne substituovaná jedným alebo viacerými substituentmi zvolenými zo súboru zahrňajúceho atóm halogénu, kyanoskupinu, nitroskupinu, alkylskupinu s 1 až 4 atómami uhlíka, halogénalkylskupinu s 1 až 4 atómami uhlíka, alkoxy skupinu s 1 až 4 atómami uhlíka a halogénalkoxyskupinu s 1 až 4 atómami uhlíka,

alkenylskupinu s 3 až 6 atómami uhlíka, ktorá je prípadne substituovaná substituentom zvoleným

zo súboru zahrňajúceho alkoxy skupinu s 1 až 4 atómami uhlíka, atóm halogénu, cykloalkylskupinu s 3 až 6 atómami uhlíka a fenylskupinu, ktorá je prípadne substituovaná jedným alebo viacerými substituentmi zvolenými zo súboru zahrňajúceho atóm halogénu, kyanoskupinu, nitroskupinu, alkylskupinu s 1 až 4 atómami uhlíka, halogénalkylskupinu s 1 až 4 atómami uhlíka, alkoxy skupinu s 1 až 4 atómami uhlíka a halogénalkoxy skupinu s 1 až 4 atómami uhlíka,

alkinylskupinu s 3 až 6 atómami uhlíka, ktorá je prípadne substituovaná alkoxy skupinou s 1 až 4 atómami uhlíka alebo atómom halogénu; alebo

cykloalkylskupinu s 3 až 6 atómami uhlíka;

R^9 a R^{10} predstavuje každý nezávisle vždy atóm vodíka, alkylskupinu s 1 až 6 atómami uhlíka,

benzylskupinu, ktorá je prípadne substituovaná jedným alebo viacerými substituentmi zvolenými zo súboru zahrňajúceho atóm halogénu, kyanoskupinu, nitroskupinu, alkylskupinu s 1 až 4 atómami uhlíka, halogénalkylskupinu s 1 až 4 atómami uhlíka, alkoxy skupinu s 1 až 4 atómami uhlíka a halogénalkoxy skupinu s 1 až 4 atómami uhlíka, alebo

fenylskupinu, ktorá je prípadne substituovaná jedným alebo viacerými substituentmi zvolenými zo súboru zahrňajúceho atóm halogénu, kyanoskupinu, nitroskupinu, alkylskupinu s 1 až 4 atómami uhlíka, halogénalkylskupinu s 1 až 4 atómami

uhlíka, alkoxy skupinu s 1 až 4 atómami uhlíka
a halogénalkoxy skupinu s 1 až 4 atómami uhlíka;

R^{11} a R^{12} predstavuje nezávisle vždy

atóm vodíka,

alkylskupinu s 1 až 6 atómami uhlíka, ktorá je
prípadne substituovaná jedným alebo viacerými
atómami halogénu, alebo

cykloalkylskupinu s 3 až 6 atómami uhlíka, ktorá je
prípadne substituovaná jedným alebo viacerými
atómami halogénu, a ďalej tiež

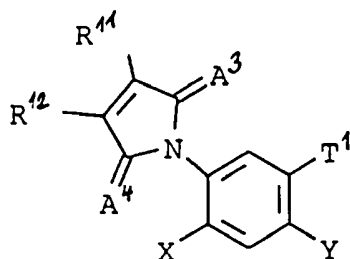
R^{11} a R^{12} dohromady s atómami, ku ktorým sú pripojené, pred-
stavujú štvor- až sedemčlenný nasýtený alebo nena-
sýtený kruh, ktorý je prípadne prerušený atómom
kyslíka, $S(O)_r$ alebo atómom dusíka a ktorý je prí-
padne substituovaný jednou až tromi metylskupinami
alebo jedným alebo viacerými atómami halogénu;

R^{13} predstavuje atóm vodíka, alkylskupinu s 1 až 3
atómami uhlíka alebo halogénalkylskupinu s 1 až 3
atómami uhlíka;

A , A^1 , A^2 a A^3 predstavuje nezávisle vždy atóm kyslíka
alebo síry; a

r predstavuje celé číslo 0, 1 alebo 2.

9. Zlúčeniny všeobecného vzorca



kde

T^1 predstavuje skupinu NO_2 , NH_2 alebo $-NHC(A)NHR$;

A , A^3 a A^4 predstavuje každý nezávisle atóm kyslíka alebo síry;

X a Y predstavuje každý nezávisle atóm vodíka, atóm halogénu, nitroskupinu, kyanoskupinu, alkylskupinu s 1 až 4 atómami uhlíka, halogénalkylskupinu s 1 až 4 atómami uhlíka, alkoxy skupinu s 1 až 4 atómami uhlíka, halogénalkoxy skupinu s 1 až 4 atómami uhlíka alebo skupinu vzorca $S(O)_m R^2$;

m predstavuje celé číslo 0, 1 alebo 2;

R^2 predstavuje alkylskupinu s 1 až 4 atómami uhlíka alebo halogénalkylskupinu s 1 až 4 atómami uhlíka;

R predstavuje atóm vodíka, alkylskupinu s 1 až 6 atómami uhlíka, alkoxyalkylskupinu s 2 až 12 atómami uhlíka, alkylkarbonylalkylskupinu s 3 až 12 atómami uhlíka, halogénalkylkarbonylalkylskupinu s 3 až 12 atómami uhlíka, alkoxykarbonylalkylskupinu s 3 až 12 atómami uhlíka, halogénalkoxykarbonylalkylskupinu s 3 až 12 atómami uhlíka, alkenylskupinu s 3 až 6 atómami uhlíka, alkynylskupinu s 3 až 6 atómami uhlíka,

fenylskupinu, ktorá je prípadne substituovaná jedným až tromi substituentmi zvolenými zo súboru zahŕňajúceho atóm halogénu, alkylskupinu s 1 až 4 atómami uhlíka, alkoxy skupinu s 1 až 4 atómami uhlíka a halogénalkoxy skupinu s 1 až 4 atómami uhlíka, alebo

benzylskupinu, ktorá je prípadne substituovaná jedným až tromi substituentmi zvolenými zo súboru zahŕňajúceho atóm halogénu, alkylskupinu s 1 až 4 atómami uhlíka, alkoxy skupinu s 1 až 4 atómami uhlíka a halogénalkoxy skupinu s 1 až 4 atómami uhlíka;

R^{11} a R^{12} predstavuje nezávisle vždy

atóm vodíka,

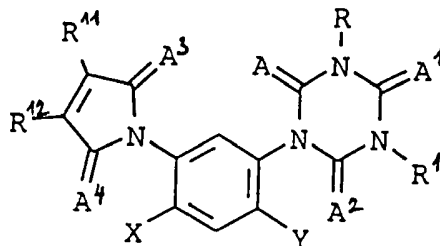
alkylskupinu s 1 až 6 atómami uhlíka, ktorá je prípadne substituovaná jedným alebo viacerými atómami halogénu, alebo

cykloalkylskupinu s 3 až 6 atómami uhlíka, ktorá je prípadne substituovaná jedným alebo viacerými atómami halogénu, a ďalej tiež

R^{11} a R^{12} dohromady s atómami, ku ktorým sú pripojené, predstavujú štvor- až sedemčlenný nasýtený alebo nenásýtený kruh, ktorý je prípadne prerušený atómom kyslíka, $S(O)_r$ alebo atómom dusíka a ktorý je prípadne substituovaný jednou až tromi metylskupinami alebo jedným alebo viacerými atómami halogénu; a

r predstavuje celé číslo 0, 1 alebo 2.

10. Spôsob výroby zlúčenín všeobecného vzorca



kde

X a Y predstavuje každý nezávisle atóm vodíka, atóm halogénu, nitroskupinu, kyanoskupinu, alkylskupinu s 1 až 4 atómami uhlíka, halogénalkylskupinu s 1 až 4 atómami uhlíka, alkoxy skupinu s 1 až 4 atómami uhlíka, halogénalkoxy skupinu s 1 až 4 atómami uhlíka alebo skupinu vzorca $S(O)_m R^2$;

m predstavuje celé číslo 0, 1 alebo 2;

R^2 predstavuje alkylskupinu s 1 až 4 atómami uhlíka alebo halogénalkylskupinu s 1 až 4 atómami uhlíka;

R predstavuje alkylskupinu s 1 až 6 atómami uhlíka, alkoxyalkylskupinu s 2 až 12 atómami uhlíka, alkylkarbonylalkylskupinu s 3 až 12 atómami uhlíka, halogénalkylkarbonylalkylskupinu s 3 až 12 atómami uhlíka, alkoxykarbonylalkylskupinu s 3 až 12 atómami uhlíka, halogénalkoxykarbonylalkylskupinu s 3 až 12 atómami uhlíka, alkenylskupinu s 3 až 6 atómami uhlíka, alkynylskupinu s 3 až 6 atómami uhlíka,

fenylskupinu, ktorá je prípadne substituovaná jedným až tromi substituentmi zvolenými zo súboru zahŕňajúceho atóm halogénu, alkylskupinu s 1 až 4 atómami uhlíka, alkoxy skupinu s 1 až 4 atómami

uhlíka a halogénalkoxyskupinu s 1 až 4 atómami uhlíka, alebo

benzylskupinu, ktorá je prípadne substituovaná jedným až tromi substituentmi zvolenými zo súboru zahrňajúceho atóm halogénu, alkylskupinu s 1 až 4 atómami uhlíka, alkoxyskupinu s 1 až 4 atómami uhlíka a halogénalkoxyskupinu s 1 až 4 atómami uhlíka;

R^1 predstavuje atóm vodíka, alkenylskupinu s 3 až 6 atómami uhlíka, alkynylskupinu s 3 až 6 atómami uhlíka,

alkylskupinu s 1 až 12 atómami uhlíka, ktorá je prípadne substituovaná jedným alebo viacerými atómami halogénu alebo jedným substituentom zvoleným zo súboru zahrňajúceho kyanoskupinu, skupinu vzorca $C(O)R^3$, $OC(O)R^5$, $CH_2OC(O)R^5$, OR^4 , CH_2OR^4 a $CR^6(OR^7)_2$ alebo jednou fenylskupinou, ktorá je prípadne substituovaná jedným až tromi substituentmi zvolenými zo súboru zahrňajúceho atóm halogénu, alkylskupinu s 1 až 4 atómami uhlíka, alkoxyskupinu s 1 až 4 atómami uhlíka a halogénalkoxyskupinu s 1 až 4 atómami uhlíka, alebo

fenylskupinu, ktorá je prípadne substituovaná jedným až tromi substituentmi zvolenými zo súboru zahrňajúceho atóm halogénu, alkylskupinu s 1 až 4 atómami uhlíka, alkoxyskupinu s 1 až 4 atómami uhlíka a halogénalkoxyskupinu s 1 až 4 atómami uhlíka;

R^3 predstavuje skupinu vzorca OR^8 , SR^8 alebo NR^9R^{10} ;

R^4 , R^5 a R^6 predstavuje každý nezávisle atóm vodíka, alkylskupinu s 1 až 4 atómami uhlíka alebo halogénalkylskupinu s 1 až 4 atómami uhlíka;

R^7 predstavuje alkylskupinu s 1 až 4 atómami uhlíka;

R^8 predstavuje alkylskupinu s 1 až 6 atómami uhlíka, ktorá je prípadne substituovaná substituentom zvoleným zo súboru zahrňajúceho alkoxy skupinu s 1 až 4 atómami uhlíka, alkyltio skupinu s 1 až 4 atómami uhlíka, atóm halogénu, hydroxy skupinu, cykloalkylskupinu s 3 až 6 atómami uhlíka, furylskupinu alebo fenylskupinu, ktorá je prípadne substituovaná jedným alebo viacerými substituentmi zvolenými zo súboru zahrňajúceho atóm halogénu, kyanoskupinu, nitroskupinu, alkylskupinu s 1 až 4 atómami uhlíka, halogénalkylskupinu s 1 až 4 atómami uhlíka, alkoxy skupinu s 1 až 4 atómami uhlíka a halogénalkoxy skupinu s 1 až 4 atómami uhlíka,

alkenylskupinu s 3 až 6 atómami uhlíka, ktorá je prípadne substituovaná substituentom zvoleným zo súboru zahrňajúceho alkoxy skupinu s 1 až 4 atómami uhlíka, atóm halogénu, cykloalkylskupinu s 3 až 6 atómami uhlíka a fenylskupinu, ktorá je prípadne substituovaná jedným alebo viacerými substituentmi zvolenými zo súboru zahrňajúceho atóm halogénu, kyanoskupinu, nitroskupinu, alkylskupinu s 1 až 4 atómami uhlíka, halogénalkylskupinu s 1 až 4 atómami uhlíka, alkoxy skupinu s 1 až 4 atómami uhlíka a halogénalkoxy skupinu s 1 až 4 atómami uhlíka,

alkynylskupinu s 3 až 6 atómami uhlíka, ktorá je
prípadne substituovaná alkoxyskupinou s 1 až 4
atómami uhlíka alebo atómom halogénu;

cykloalkylskupinu s 3 až 6 atómami uhlíka;

R^9 a R^{10} predstavuje každý nezávisle vždy atóm vodíka,
alkylskupinu s 1 až 6 atómami uhlíka,

benzylskupinu, ktorá je prípadne substituovaná jed-
ným alebo viacerými substituentmi zvolenými zo
súboru zahrňajúceho atóm halogénu, kyanoskupinu,
nitroskupinu, alkylskupinu s 1 až 4 atómami
uhlíka, halogénalkylskupinu s 1 až 4 atómami
uhlíka, alkoxyskupinu s 1 až 4 atómami uhlíka
a halogénalkoxyskupinu s 1 až 4 atómami uhlíka,
alebo

fenylskupinu, ktorá je prípadne substituovaná jed-
ným alebo viacerými substituentmi zvolenými zo
súboru zahrňajúceho atóm halogénu, kyanoskupinu,
nitroskupinu, alkylskupinu s 1 až 4 atómami
uhlíka, halogénalkylskupinu s 1 až 4 atómami
uhlíka, alkoxyskupinu s 1 až 4 atómami uhlíka
a halogénalkoxyskupinu s 1 až 4 atómami uhlíka;

R^{11} a R^{12} predstavuje nezávisle vždy
atóm vodíka,

alkylskupinu s 1 až 6 atómami uhlíka, ktorá je
prípadne substituovaná jedným alebo viacerými
atómami halogénu, alebo

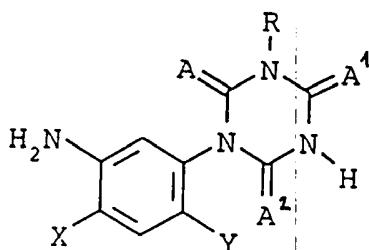
cykloalkylskupinu s 3 až 6 atómami uhlíka, ktorá je prípadne substituovaná jedným alebo viacerými atómami halogénu, a ďalej tiež

R^{11} a R^{12} dohromady s atómami, ku ktorým sú pripojené predstavujú štvor- až sedemčlenný nasýtený alebo nenasýtený kruh, ktorý je prípadne prerušený atómom kyslíka, $S(O)_r$ alebo atómom dusíka a ktorý je prípadne substituovaný jednou až tromi metylskupinami alebo jedným alebo viacerými atómami halogénu;

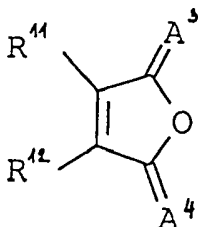
A , A^1 , A^2 , A^3 a A^4 predstavuje nezávisle vždy atóm kyslíka alebo síry; a

r predstavuje celé číslo 0, 1 alebo 2,

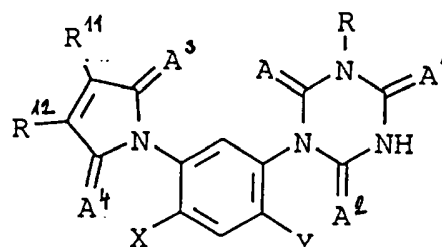
v y z n a č u j ú c i s a t ý m, že sa amín všeobecného vzorca



kde X , Y , R , A , A^1 a A^2 majú hore uvedený význam, nechá reagovať s anhydridom všeobecného vzorca



kde R^{11} , R^{12} , A^3 a A^4 majú hore uvedený význam, v prítomnosti kyseliny za vzniku požadovanej zlúčeniny všeobecného vzorca



kde X, Y, R, R^{11} , R^{12} , A, A^1 , A^2 , A^3 a A^4 majú hore uvedený význam a prípadne sa požadovaná zlúčenina, kde R^1 predstavuje atóm vodíka alkyluje alkylačným činidlom všeobecného vzorca



kde

R^1 predstavuje alkenylskupinu s 3 až 6 atómami uhlíka, alkynylskupinu s 3 až 6 atómami uhlíka,

alkylskupinu s 1 až 12 atómami uhlíka ktorá je prípadne substituovaná jedným alebo viacerými atómami halogénu alebo jedným substituentom zvoleným zo súboru zahŕňajúceho kyanoskupinu, skupinu vzorca $C(O)R^3$, $OC(O)R^5$, $CH_2OC(O)R^5$, OR^4 , CH_2OR^4 a $CR^6(OR^7)_2$ alebo jednou fenyľskupinou, ktorá je prípadne substituovaná jedným až tromi substituentmi zvolenými zo súboru zahŕňajúceho atóm halogénu, alkylskupinu s 1 až 4 atómami uhlíka, alkoxyskupinu s 1 až 4 atómami uhlíka a halogénalkoxyskupinu s 1 až 4 atómami uhlíka, alebo

fenylskupinu, ktorá je prípadne substituovaná jedným až tromi substituentmi zvolenými zo súboru zahŕňajúceho atóm halogénu, alkylskupinu s 1 až 4 atómami uhlíka, alkoxyskupinu s 1 až 4 atómami uhlíka a halogénalkoxyskupinu s 1 až 4 atómami uhlíka;

x¹ predstavuje atóm chlóru, brómu alebo jódu;

v prítomnosti bázy.