PŘIHLÁŠKA VYNÁLEZU

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

(21) Číslo dokumentu:

1461-96

(19)

ČESKÁ REPUBLIKA

ÚŘAD PRŮMYSLOVÉHO VLASTNICTVÍ

(22) Přihlášeno: **21. 05. 96**

(32) Datum podání prioritní přihlášky: **02.06.95, 02.06.95, 02.06.95, 02.06.95, 02.06.95, 02.06.95, 02.06.95, 02.06.95**

(31) Číslo prioritní přihlášky: **95/459868, 95/458211, 95/459919, 95/459950, 95/458639, 95/458324, 95/458920, 95/459567**

(33) Země priority: **US, US, US, US, US, US, US, US**

(40) Datum zveřejnění přihlášky vynálezu: **14. 05. 97 (Věstník č. 5/97)**

(13) Druh dokumentu: **A3**

(51) Int. Cl.[6]:

C 07 D403/10
C 07 D413/10
C 07 D417/10
A 01 N43/66
// (C 07 D 403/10, C 07 D 251:30), (C 07 D 413/10, C 07 D 251:30), (C 07 D 417/10, C 07 D 251:30)

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

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

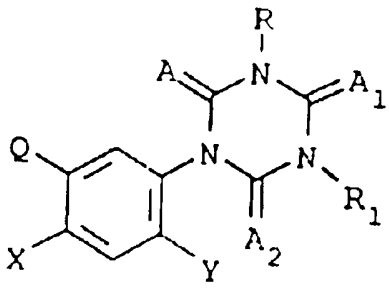
(74) Zástupce:
Čermák Karel Dr., Národní 32, Praha 1, 11000;

(54) Název přihlášky vynálezu:

1-(3-Heterocyklylfeny)-s-triazin-2,4,6-oxo nebo thiotriony a herbicidní prostředky na jejich bázi

(57) Anotace:

1-(3-Heterocyklylfenyl)-s-triazin-2,4,6-oxo-nebo thiotriony obecného vzorce I jsou herbicidními činidly. Řešení se dále týká herbicidních prostředků na jejich bázi a způsobu potlačování nežádoucích druhů rostlin.



(I)

CZ 1461-96 A3

ČJ. 0 1 2 6 4 0
DOŠLO 17. 11. 97
ÚŘAD PRŮMYSLOVÉHO VLASTNICTVÍ
PŘÍL. 1

1467-96

01-925-96-Če

1-(3-Heterocyklylfenyl)-s-triazin-2,4,6-oxo- nebo thiotriony a herbicidní prostředky na jejich bázi

Oblast techniky

Vynález se týká určitých 1-(3-heterocyklylfenyl)-s-triazin-2,4,6-oxo- nebo thiotrionů. Tyto sloučeniny jsou herbicidně účinné. Dále se vynález týká herbicidních prostředků na bázi těchto sloučenin a způsobu potlačování nežádoucích druhů rostlin pomocí těchto sloučenin a prostředků.

Dosavadní stav techniky

Plevel způsobuje ve světovém měřítku obrovské hospodářské ztráty tím, že snižuje výnosy a kvalitu plodin. V samotných Spojených státech amerických musí agronomické plodiny soutěžit se stovkami plevelných rostlin.

Přes existenci a dostupnost mnoha herbicidů nadále dochází ke škodám na plodinách způsobeným plevelnými rostlinami. Z tohoto důvodu pokračuje výzkum zaměřený na vytvoření nových a účinnějších herbicidů.

Určitá heterocyklylfenylová herbicidní činidla jsou známa (viz například WO 85/01939, EP 77938-A2 and US 5 356 863). Žádná z těchto publikací však nepopisuje heterocyklylfenylové sloučeniny, které jsou substituovány 1,3,5-triazin-2,4,6-trionovou skupinou.

V US patentech č. 4 876 253 a US 4 927 824 jsou popsány fungicidní 1,3,5-triazin-2,4,6-triony. Tyto patenty však nepopisují žádné heterocyklylfenylsubstituované 1,3,5-

triazin-2,4,6-triony a rovněž nezmiňují herbicidní použití těchto sloučenin.

V EP 640600-A1 a US patentu č. 4 512 797 jsou popsány herbicidní 1,3,5-triazin-2,4,6-triony. Tyto publikace se však netýkají heterocyklylfenylsubstituovaných 1,3,5-triazin-2,4,6-trionových sloučenin.

Úkolem tohoto vynálezu je vyvinout sloučeniny, které by byly vysoce účinné při potlačování nežádoucích druhů rostlin.

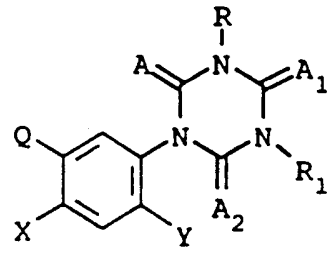
Dalším úkolem tohoto vynálezu je vyvinout způsob potlačování nežádoucích druhů rostlin.

Tyto a další úkoly, které vynález řeší, jsou zřejmé z následujícího podrobného popisu.

Podstata vynálezu

Předmětem vynálezu jsou 1-(3-heterocyklylfenyl)-s-triazin-2,4,6-oxo- nebo thiotrionové sloučeniny, které jsou užitečné jako herbicidní činidla.

1-(3-heterocyklylfenyl)-s-triazin-2,4,6-oxo- nebo thiotrionové sloučeniny podle vynálezu mají strukturu, která odpovídá obecnému vzorci I



(I)

kde

X a Y představuje každý nezávisle atom vodíku, atom halogenu, nitroskupinu, kyanoskupinu, alkylskupinu s 1 až 4 atomy uhlíku, halogenalkylskupinu s 1 až 4 atomy uhlíku, alkoxyskupinu s 1 až 4 atomy uhlíku, halogenalkoxyskupinu s 1 až 4 atomy uhlíku nebo skupinu vzorce $S(O)_mR_2$;

m představuje celé číslo 0, 1 nebo 2;

R_2 představuje alkylskupinu s 1 až 4 atomy uhlíku nebo halogenalkylskupinu s 1 až 4 atomy uhlíku;

R představuje atom vodíku, alkylskupinu s 1 až 6 atomy uhlíku, alkoxyalkylskupinu se 2 až 12 atomy uhlíku, alkylkarbonylalkylskupinu se 3 až 12 atomy uhlíku, halogenalkylkarbonylalkylskupinu se 3 až 12 atomy uhlíku, alkoxykarbonylalkylskupinu se 3 až 12 atomy uhlíku, halogenalkoxykarbonylalkylskupinu se 3 až 12 atomy uhlíku, alkenylskupinu se 3 až 6 atomy uhlíku, alkinylskupinu se 3 až 6 atomy uhlíku, atom alkalického kovu,

fenylskupinu, která je popřípadě substituována jedním až třemi substituenty zvolenými ze souboru zahrnujícího atom halogenu, alkylskupinu s 1 až 4 atomy uhlíku, alkoxyskupinu s 1 až 4 atomy uhlíku a halogenalkoxyskupinu s 1 až 4 atomy uhlíku, nebo

benzylskupinu, která je popřípadě substituována jedním až třemi substituenty zvolenými ze souboru zahrnujícího atom halogenu, alkylskupinu s 1 až 4 atomy uhlíku, alkoxyskupinu s 1 až 4 atomy uhlíku a halogenalkoxyskupinu s 1 až 4 atomy uhlíku;

R_1 představuje atom vodíku, alkenylskupinu se 3 až 6 atomy uhlíku, alkinylskupinu se 3 až 6 atomy uhlíku, kyanoskupinu,

alkylskupinu s 1 až 12 atomy uhlíku, která je popřípadě substituována jedním nebo více atomy halogenu nebo jedním substituentem zvoleným ze souboru zahrnujícího kyanoskupinu, skupinu vzorce $C(O)R_3$, $C(W)R_4$, $OC(O)R_5$, $CH_2OC(O)R_5$, OR_4, CH_2OR_4 a $CR_6(OR_7)_2$ nebo jednou fenylskupinou, která je popřípadě substituována jedním až třemi substituenty zvolenými ze souboru zahrnujícího atom halogenu, alkylskupinu s 1 až 4 atomy uhlíku, alkoxyskupinu s 1 až 4 atomy uhlíku a halogenalkoxyskupinu s 1 až 4 atomy uhlíku, nebo

fenylskupinu, která je popřípadě substituována jedním až třemi substituenty zvolenými ze souboru zahrnujícího atom halogenu, alkylskupinu s 1 až 4 atomy uhlíku, alkoxyskupinu s 1 až 4 atomy uhlíku a halogenalkoxyskupinu s 1 až 4 atomy uhlíku;

R_3 představuje hydroxyskupinu nebo skupinu vzorce OR_8, SR_8 nebo NR_9R_{10};

W představuje atom kyslíku nebo skupinu vzorce NOR_9, $NCOR_9$ nebo $NNHCONH_2$;

R_4, R_5 a R_6 představuje každý nezávisle atom vodíku, alkylskupinu s 1 až 4 atomy uhlíku nebo halogenalkylskupinu s 1 až 4 atomy uhlíku;

R_7 představuje alkylskupinu s 1 až 4 atomy uhlíku;

R_8 představuje

alkylskupinu s 1 až 6 atomy uhlíku, která je popřípadě substituována substituentem zvoleným ze souboru zahrnujícího alkoxyskupinu s 1 až 4 atomy uhlíku, alkylthioskupinu s 1 až 4 atomy uhlíku, atom halogenu, hydroxyskupinu, cykloalkylskupinu se 3 až 6 atomy uhlíku, furylskupinu a fenylskupinu, která je popřípadě substituována jedním nebo více substituenty zvolenými ze souboru zahrnujícího atom halogenu, kyanoskupinu, nitroskupinu, alkylskupinu s 1 až 4 atomy uhlíku, halogenalkylskupinu s 1 až 4 atomy uhlíku, alkoxyskupinu s 1 až 4 atomy uhlíku a halogenalkoxyskupinu s 1 až 4 atomy uhlíku,

alkenylskupinu se 3 až 6 atomy uhlíku, která je popřípadě substituována substituentem zvoleným ze souboru zahrnujícího alkoxyskupinu s 1 až 4 atomy uhlíku, atom halogenu, cykloalkylskupinu se 3 až 6 atomy uhlíku a fenylskupinu, která je popřípadě substituována jedním nebo více substituenty zvolenými ze souboru zahrnujícího atom halogenu, kyanoskupinu, nitroskupinu, alkylskupinu s 1 až 4 atomy uhlíku, halogenalkylskupinu s 1 až 4 atomy uhlíku, alkoxyskupinu s 1 až 4 atomy uhlíku a halogenalkoxyskupinu s 1 až 4 atomy uhlíku,

alkinylskupinu se 3 až 6 atomy uhlíku, která je popřípadě substituována alkoxyskupinou s 1 až 4 atomy uhlíku nebo atomem halogenu;

cykloalkylskupinu se 3 až 6 atomy uhlíku,

skupinu vzorce $N=C(R_4R_5)$ nebo

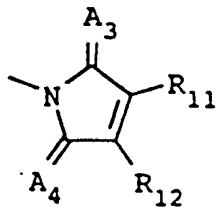
atom alkalického kovu, kovu alkalických zemin, manganu, mědi, zinku, kobaltu, stříbra, niklu, amonný nebo organoamoniový kation;

R_9 a R_{10} představuje každý nezávisle vždy atom vodíku, alkylskupinu s 1 až 6 atomy uhlíku,

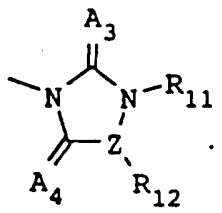
benzylskupinu, která je popřípadě substituována jedním nebo více substituenty zvolenými ze souboru zahrnujícího atom halogenu, kyanoskupinu, nitroskupinu, alkylskupinu s 1 až 4 atomy uhlíku, halogenalkylskupinu s 1 až 4 atomy uhlíku, alkoxyskupinu s 1 až 4 atomy uhlíku a halogenalkoxyskupinu s 1 až 4 atomy uhlíku, nebo

fenylskupinu, která je popřípadě substituována jedním nebo více substituenty zvolenými ze souboru zahrnujícího atom halogenu, kyanoskupinu, nitroskupinu, alkylskupinu s 1 až 4 atomy uhlíku, halogenalkylskupinu s 1 až 4 atomy uhlíku, alkoxyskupinu s 1 až 4 atomy uhlíku a halogenalkoxyskupinu s 1 až 4 atomy uhlíku;

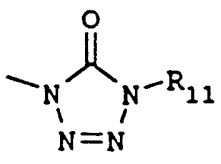
Q představuje skupinu vzorce Q1 až Q32



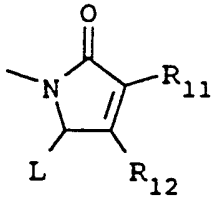
Q1



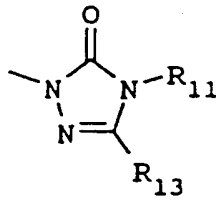
Q2



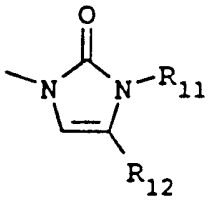
Q3



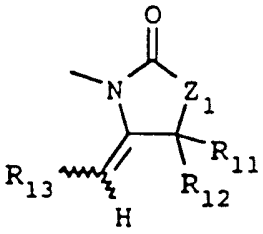
Q4 ,



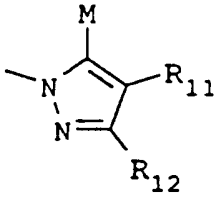
Q5 ,



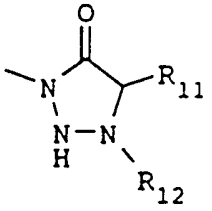
Q6 .



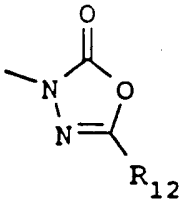
Q7 ,



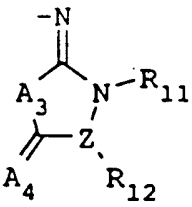
Q8 ,



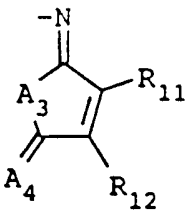
Q9 ,



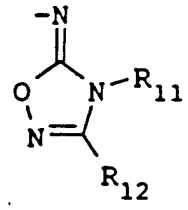
Q10 ,



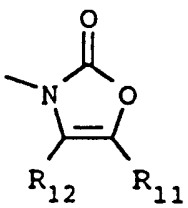
Q11 ,



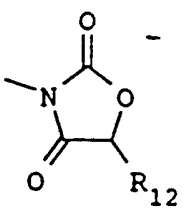
Q12 ,



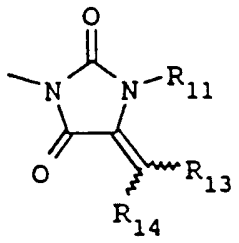
Q13 ,



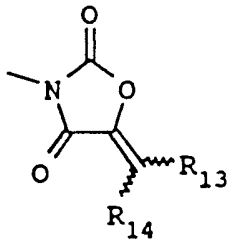
Q14 ,



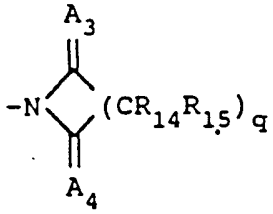
Q15 ,



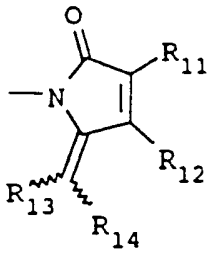
Q16



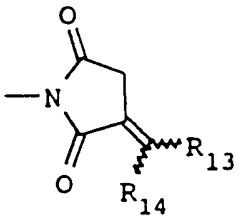
Q17



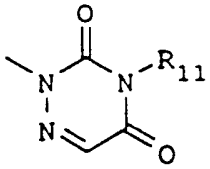
Q18



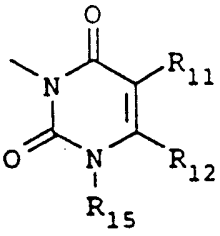
Q19



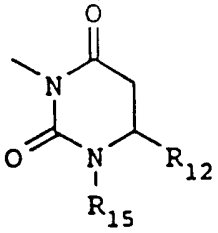
Q20



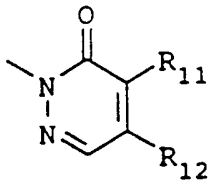
Q21



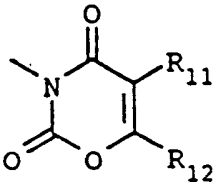
Q22



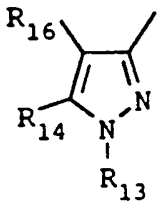
Q23



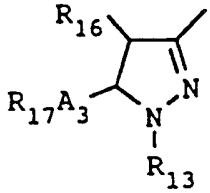
Q24



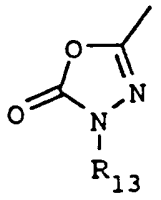
Q25



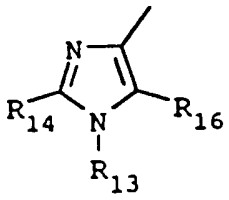
Q26



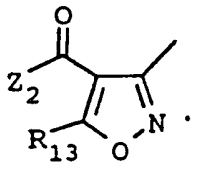
Q27



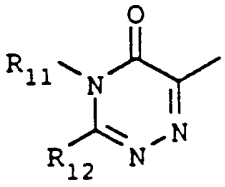
Q28



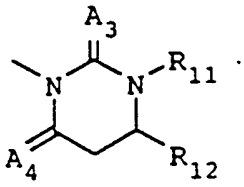
Q29



Q30



nebo



Q31 Q32

R_{11} a R_{12} představuje nezávisle vždy

atom vodíku,

alkylskupinu s 1 až 6 atomy uhlíku, která je popřípadě substituována jedním nebo více atomy halogenu, nebo

cykloalkylskupinu se 3 až 6 atomy uhlíku, která je popřípadě substituována jedním nebo více atomy halogenu, a dále též

R_{11} a R_{12} dohromady s atomy, k nimž jsou připojeny, představují čtyř- až sedmičlenný nasycený nebo nenasycený kruh, který je popřípadě přerušen atomem kyslíku, $S(O)_r$ nebo atomem dusíku a který je popřípadě substituován jednou až třemi methylskupinami nebo jedním nebo více atomy halogenu;

R_{13}, R_{14} a R_{15} představuje nezávisle vždy atom vodíku, alkylskupinu s 1 až 3 atomy uhlíku nebo halogenalkylskupinu s 1 až 3 atomy uhlíku;

R_{16} představuje atom vodíku nebo halogenu;

R_{17} představuje alkylskupinu s 1 až 4 atomy uhlíku nebo halogenalkylskupinu s 1 až 4 atomy uhlíku;

A, A_1, A_2, A_3 a A_4 představuje nezávisle vždy atom kyslíku nebo síry;

L představuje hydroxyskupinu, atom halogenu, alkoxyskupinu s 1 až 3 atomy uhlíku nebo alkylthioskupinu s 1 až 3 atomy uhlíku;

M představuje atom halogenu nebo alkylskupinu s 1 až 3 atomy uhlíku;

Z představuje atom dusíku nebo skupinu CH;

Z_1 představuje skupinu NR_9 nebo atom kyslíku;

Z_2 představuje skupinu OR_7 nebo NR_9R_{10};

r představuje celé číslo 0, 1 nebo 2; a

q představuje celé číslo 2, 3 nebo 4.

Předmětem vynálezu jsou dále také herbicidní prostředky na bázi výše uvedených sloučenin a způsoby použití těchto sloučenin a prostředků. Zjistilo se, že sloučeniny podle tohoto vynálezu a prostředky na jejich bázi se hodí pro potlačování nežádoucích druhů rostlin. Sloučeniny podle

vynálezu jsou zvláště užitečné pro selektivní potlačování nežádoucích druhů rostlin za přítomnmosti plodin.

Dalším předmětem vynálezu je způsob potlačování nežádoucích druhů rostlin, jehož podstata spočívá v tom, že se na listy těchto rostlin nebo na půdu nebo do vody obsahující semena nebo jiné propagační orgány těchto rostlin aplikuje herbicidně účinné množství 1-(3-heterocyklylfenyl)-s-triazin-2,4,6-oxo- nebo thiotrionové sloučeniny obecného vzorce I.

Přednost se dává sloučeninám podle vynálezu obecného vzorce I, kde

X představuje atom vodíku nebo halogenu;

Y představuje atom vodíku, atom halogenu, nitroskupinu nebo kyanoskupinu;

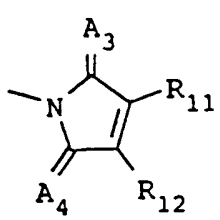
R představuje atom vodíku, alkylskupinu s 1 až 4 atomy uhlíku, alkoxymethylskupinu s 1 až 4 atomy uhlíku v alkoxylové části, alkoxykarbonylmethylskupinu s 1 až 4 atomy uhlíku v alkoxylové části, alkenylskupinu se 3 až 6 atomy uhlíku nebo alkinylskupinu se 3 až 6 atomy uhlíku;

R_1 představuje atom vodíku, alkenylskupinu se 3 až 6 atomy uhlíku, alkinylskupinu se 3 až 6 atomy uhlíku nebo alkylskupinu s 1 až 6 atomy uhlíku, která je popřípadě substituována jednou skupinou $C(O)R_3$;

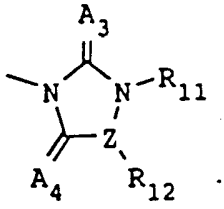
R_3 přestavuje hydroxyskupinu nebo skupinu OR_8;

R_8 představuje alkylskupinu s 1 až 6 atomy uhlíku nebo atom alkalického kovu nebo amonný nebo organoamoniový kation;

Q představuje skupinu obecného vzorce Q1, Q2 nebo Q11

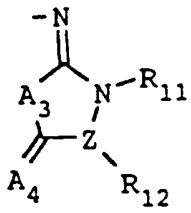


Q1



Q2

nebo



Q11

R_{11} a R_{12} dohromady s atomy, k nimž jsou připojeny, tvoří kruh, v němž seskupení $R_{11}R_{12}$ představuje alkylenskupinu se 2 až 5 atomy uhlíku, která je popřípadě přerušena zbytkem $S(O)_r$ a která je popřípadě substituována jednou až třemi methylskupinami nebo jedním nebo více atomy halogenu, nebo $R_{11}R_{12}$ představuje skupinu $-CR_{18}=CR_{19}-CR_{20}=CR_{21}-$, kde R_{18}, R_{19}, R_{20} a R_{21} představuje každý nezávisle atom vodíku, atom halogenu nebo methylskupinu;

A, A_1 a A_2 představuje každý atom kyslíku;

A_3 a A_4 představuje každý nezávisle atom kyslíku nebo síry;

Z představuje atom dusíku nebo skupinu CH;

r představuje celé číslo 0, 1 nebo 2.

Větší přednost se jako herbicidním činidům dává sloučeninám podle vynálezu obecného vzorce I, kde

X a Y představuje každý nezávisle atom vodíku, fluoru nebo chloru;

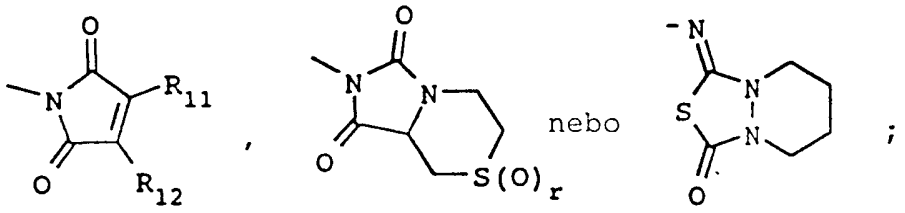
R představuje atom vodíku, alkylskupinu s 1 až 4 atomy uhlíku, alkoxymethylskupinu s 1 až 4 atomy uhlíku v alkoxylové části, alkoxykarbonylmethylskupinu s 1 až 4 atomy uhlíku v alkoxylové části, allylskupinu nebo propargylskupinu;

R_1 představuje allylskupinu, propargylskupinu nebo alkylskupinu s 1 až 4 atomy uhlíku, která je popřípadě substituována jednou skupinou $C(O)R_3$;

R_3 představuje hydroxyskupinu nebo skupinu OR_8;

R_8 představuje alkylskupinu s 1 až 6 atomy uhlíku;

Q představuje skupinu vzorce



;

R_{11} a R_{12} dohromady s atomy, k nimž jsou připojeny, tvoří kruh, v němž seskupení $R_{11}R_{12}$ představuje butylenskupinu, která je popřípadě substituována jednou až třemi methylskupinami;

A, A_1 a A_2 představuje každý atom kyslíku; a

r představuje celé číslo 0 nebo 1.

Největší přednost se jako sloučeninám zvláště vhodným pro potlačování nežádoucích druhů rostlin dává sloučeninám podle vynálezu obecného vzorce I, kde

X představuje atom fluoru nebo chloru;

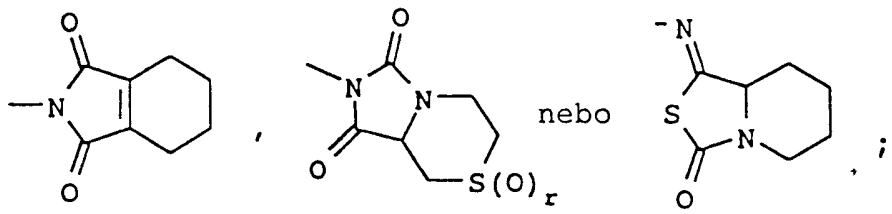
Y představuje atom chloru;

R představuje alkylskupinu s 1 až 4 atomy uhlíku, allylskupinu nebo propargylskupinu;

R_1 představuje skupinu vzorce $CH_2CO_2R_8$;

R_8 představuje alkylskupinu s 1 až 4 atomy uhlíku;

Q představuje skupinu vzorce



;

A, A_1 a A_2 představuje každý atom kyslíku; a

r představuje celé číslo 0 nebo 1.

Jako 1-(3-Heterocyklylfenyl)-s-triazin-2,4,6-oxotrionové sloučeniny podle vynálezu, které jsou zvláště účinnými herbicidními činidly, je možno mimo jiné uvést:

isopropyl 3-{2-chlor-4-fluor-5-[5,6,8,8a-tetrahydro-1,3-dioxo-1H-imidazo[5,1-c][1,4]thiazin-2(3H)-yl]fenyl}tetrahydro-5-methyl-2,4,6-trioxo-s-triazin-1(2H)-acetát;

isopropyl-3-{2-chlor-4-fluor-5-[(tetrahydro-3-oxo-1H,3H-[1,3,4]thiadiazolo[3,4-a]pyridazin-1-yliden)amino]fenyl}-tetrahydro-5-methyl-2,4,6-trioxo-s-triazin-1(2H)-acetát;

isopropyl-3-[2-chlor-4-fluor-5-(tetrahydro-1,3,7-trioxo-1H-imidazo[5,1-c][1,4]thiazin-2(3H)-yl)fenyl]tetrahydro-5-methyl-2,4,6-trioxo-s-triazin-1(2H)-acetát;

isopropyl-3-[2-chlor-4-fluor-5-(3-fluorftalimido)fenyl]-tetrahydro-5-methyl-2,4,6-trioxo-s-triazin-1(2H)-acetát;

terc.butyl-3-[2-chlor-5-(1-cyklohexen-1,2-dikarboximido)-4-fluorfenyl]tetrahydro-5-methyl-2,4,6-trioxo-s-triazin-1(2H)-acetát;

isopropyl-3-[2-chlor-5-(1-cyklohexen-1,2-dikarboximido)-4-fluorfenyl]tetrahydro-5-methyl-2,4,6-trioxo-s-triazin-1(2H)-acetát a

methyl-3-[2-chlor-5-(1-cyklohexen-1,2-dikarboximido)-4-fluorfenyl]tetrahydro-5-methyl-2,4,6-trioxo-s-triazin-1(2H)-acetát.

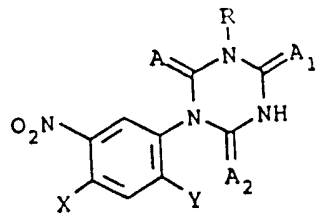
Jako halogen je například možno uvést fluor, chlor, brom nebo jod. Do rozsahu pojmu "halogenalkylskupina s 1 až 4 atomy uhlíku", jak se ho používá v popisu i nárocích, spadají alkylskupiny s 1 až 4 atomy uhlíku, které jsou substituovány jedním nebo více atomy halogenu. Uvedená definice analogicky platí také pro pojem "halogenalkyl-skupina s 1 až 3 atomy uhlíku" a "halogenalkoxysku-pina s 1 až 4 atomy uhlíku". V obecném vzorci I uvedeném výše se pod pojmem "alkalický kov" rozumí sodík, draslík a lithium, pod pojmem "kovy alkalických zemin" se rozumí hořčík a vápník. Dále se pod pojmem "organoamonium" rozumí kladně nabitý atom dusíku, k němuž jsou připojeny 1 až 4 alifatické skupiny, z nichž každá obsahuje 1 až 16 atomů uhlíku.

Nyní bylo zjištěno, že některé sloučeniny podle

vynálezu jsou zvláště užitečné pro selektivní potlačování nežádoucích druhů rostlin za přítomnosti důležitých zemědělských plodin.

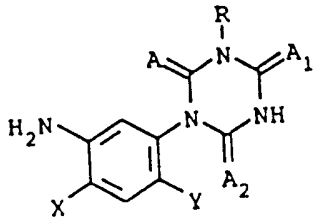
Sloučeniny obecného vzorce I, kde Q představuje skupinu vzorce Q1 je možno vyrobit redukcí 3-(3-nitrofenyl)-s-triazin-2,4,6-oxo- nebo thiotrionové sloučeniny vzorce II za standarních podmínek, jako je katalytická hydrogenace nebo chemická redukce za vzniku aminu vzorce III. Amin vzorce III se nechá reagovat s anhydridem vzorce IV, přednostně za zvýšené teploty za přítomnosti kyseliny, jako kyseliny octové, čímž se získá sloučenina obecného vzorce I, kde R_1 představuje atom vodíku, kterou je možno alkylovat alkylačním činidlem vzorce V za přítomnosti báze na sloučeninu obecného vzorce I, kde R_1 je různý od vodíku. Tato reakční sekvence je ilustrována ve schematu I.

S c h e m a I



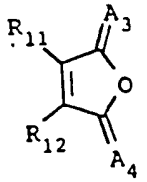
(II)

[H]

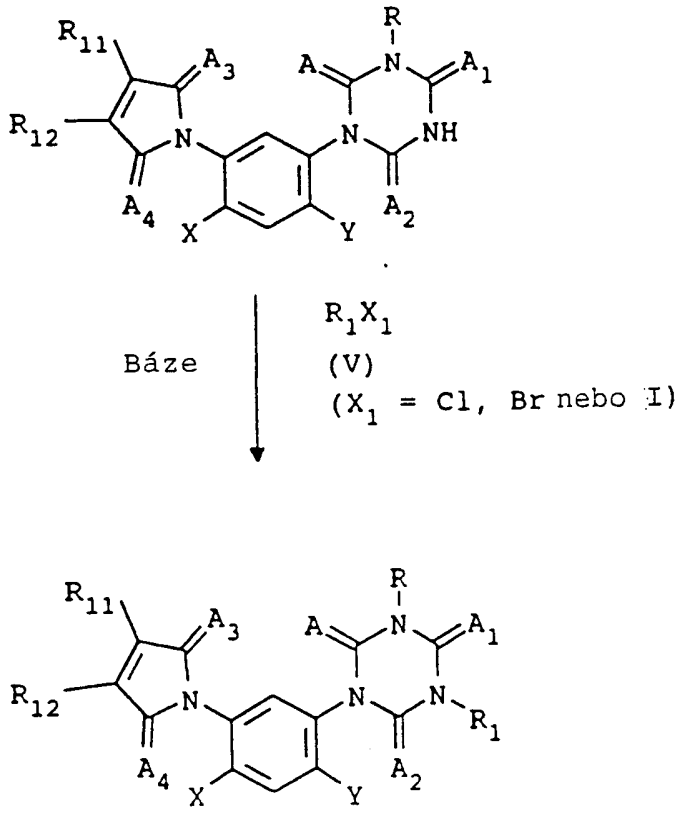


(III)

kyselina

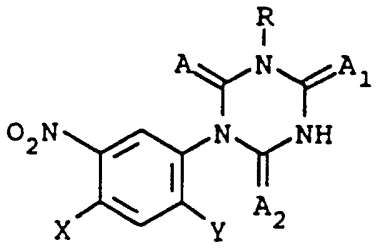


S c h e m a I - pokračování



Alternativně je sloučeniny obecného vzorce I, kde Q představuje skupinu Q1 a R_1 nepředstavuje atom vodíku, možno vyrobit alkylací 3-(3-nitrofenyl)-s-triazin-2,4,6-oxo- nebo thiotrionové sloučeniny vzorce II alkylačním činidlem vzorce V za přítomnosti báze. Vzniklá 3-(3-nitrofenyl)-s-triazin-2,4,6-oxo- nebo thiotrionová sloučenina vzorce VI se redukuje za standardních podmínek na amin vzorce VII, který se nechá reagovat s anhydridem vzorce IV, přednostně za zvýšené teploty a za přítomnosti kyseliny, jako je kyselina octová. Tato reakční sekvence je ilustrována ve schematu II.

Schema II



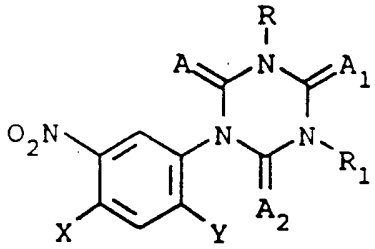
(II)

Báze

R_1X_1

(V)

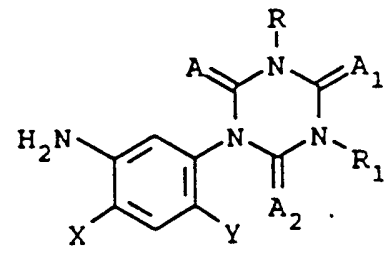
(X_1 = Cl, Br nebo I)



(VI)

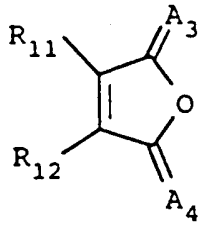
[H]

S c h e m a I I - pokračování

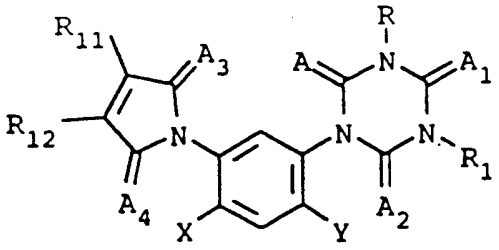


(VII)

kyselina



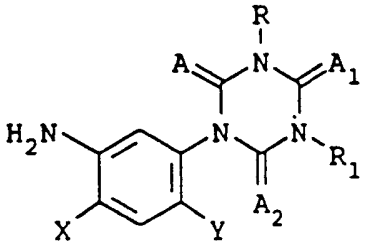
(IV)



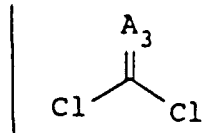
Sloučeniny obecného vzorce I, kde Q představuje skupinu vzorce Q2 a Z představuje CH, je možno vyrobit reakcí aminu vzorce VII s fosgenem nebo thiofosgenem za přítomnosti inertního rozpouštědla. Vzniklý isokyanát nebo thioisokyanát vzorce VIII se nechá reagovat s aminoesterem vzorce IX za přítomnosti báze, jako triethylaminu. Výsledná intermediární sloučenina se cyklizuje působením kyseliny nebo báze za přítomnosti inertního organického rozpouštědla,

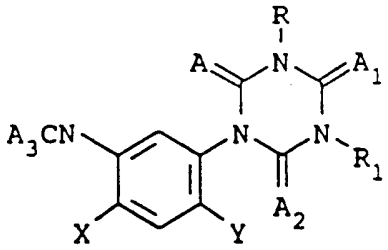
jako ethanolu. Tato reakční sekvence je ilustrována ve schematu III

Schema III



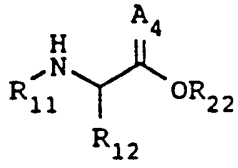
(VII)





(VIII)

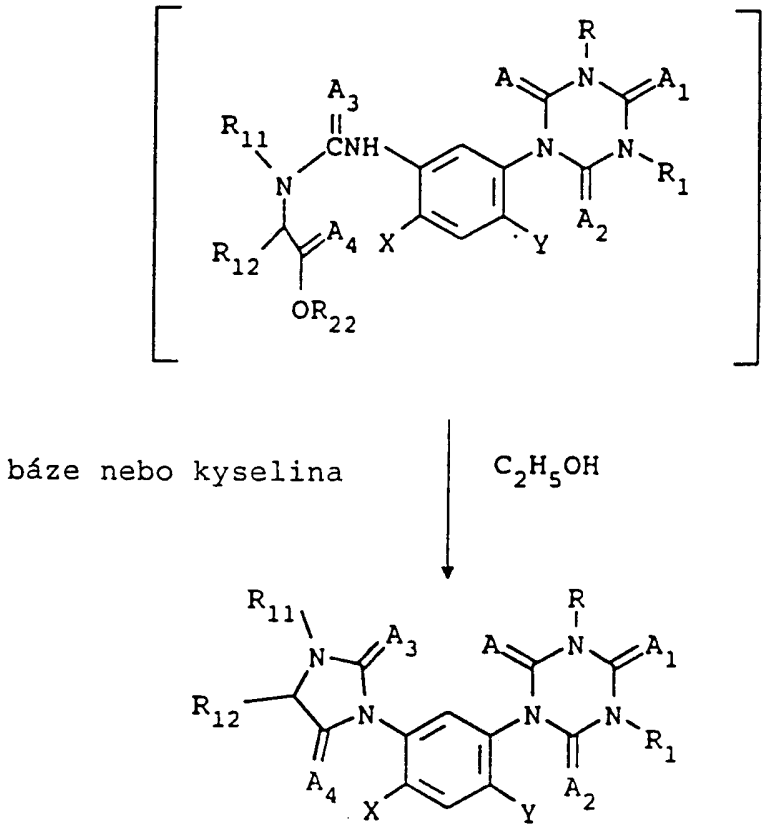
Báze



(IX)

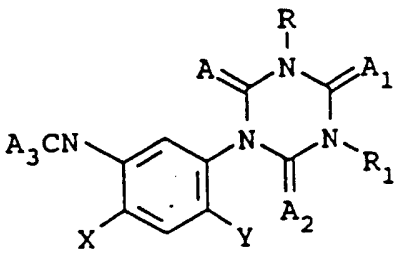
(R_{22} = C_1-C_4alkyl)

S c h e m a I I I - pokračování

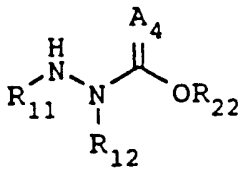


Sloučeniny obecného vzorce I, kde Q představuje skupinu Q2 a Z představuje atom dusíku, je možno vyrobit reakcí isokyanátu nebo thioisokyanátu vzorce VIII se substituovaným hydrazinem vzorce X za vzniku intermediární sloučeniny. Tato intermediární sloučenina se cyklizuje působením báze. Tato reakční sekvence je ilustrována ve schematu IV.

Schema IV

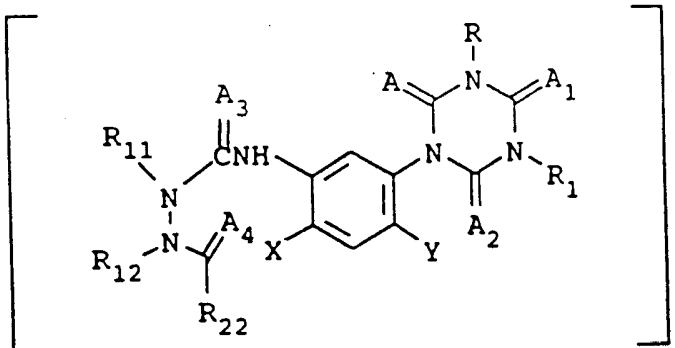


(VIII)

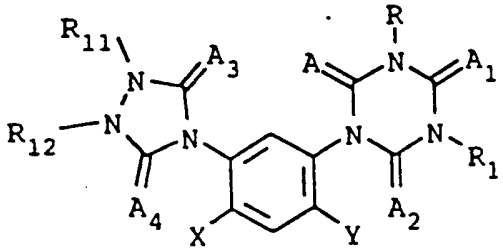


(X)

(R_{22} = C_1-C_4alkyl)

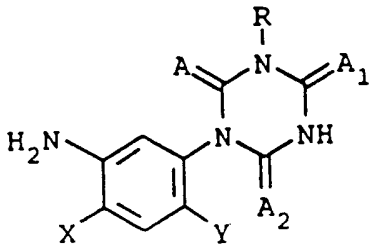


báze

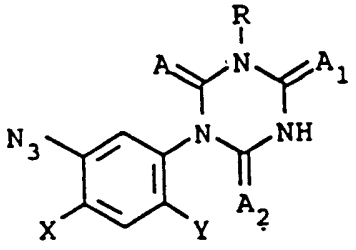


Sloučeniny obecného vzorce I, kde Q přestavuje skupinu Q3, je možno vyrobit reakcí aminu vzorce III s dusitanem sodným, azidem sodným, kyselinou octovou, kyselinou chlorovodíkovou a octanem sodným nebo dusitanem sodným, hydrátem hydrazinu a kyselinou octovou, za vzniku azidu vzorce XI. Azid vzorce XI se nechá reagovat s isokyanátem vzorce XII na požadovanou sloučeninu obecného vzorce I, kde R_1 představuje atom vodíku. Sloučeninu obecného vzorce I, kde R_1 představuje atom vodíku, je popřípadě možno alkylovat alkylačním činidlem vzorce V za přítomnosti báze. Tato reakční sekvence je ilustrována ve schematu V.

S c h e m a V



(III)

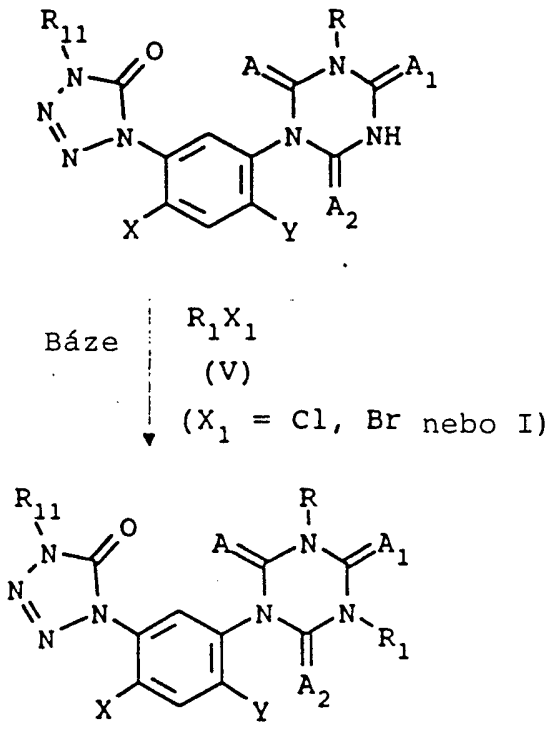


(XI)

$R_{11}NCO$

(XII)

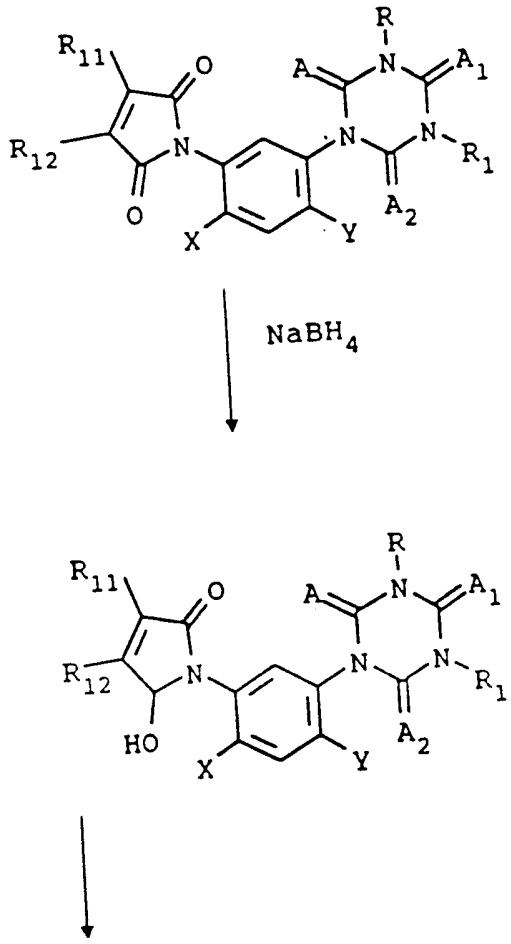
S c h e m a V - pokračování



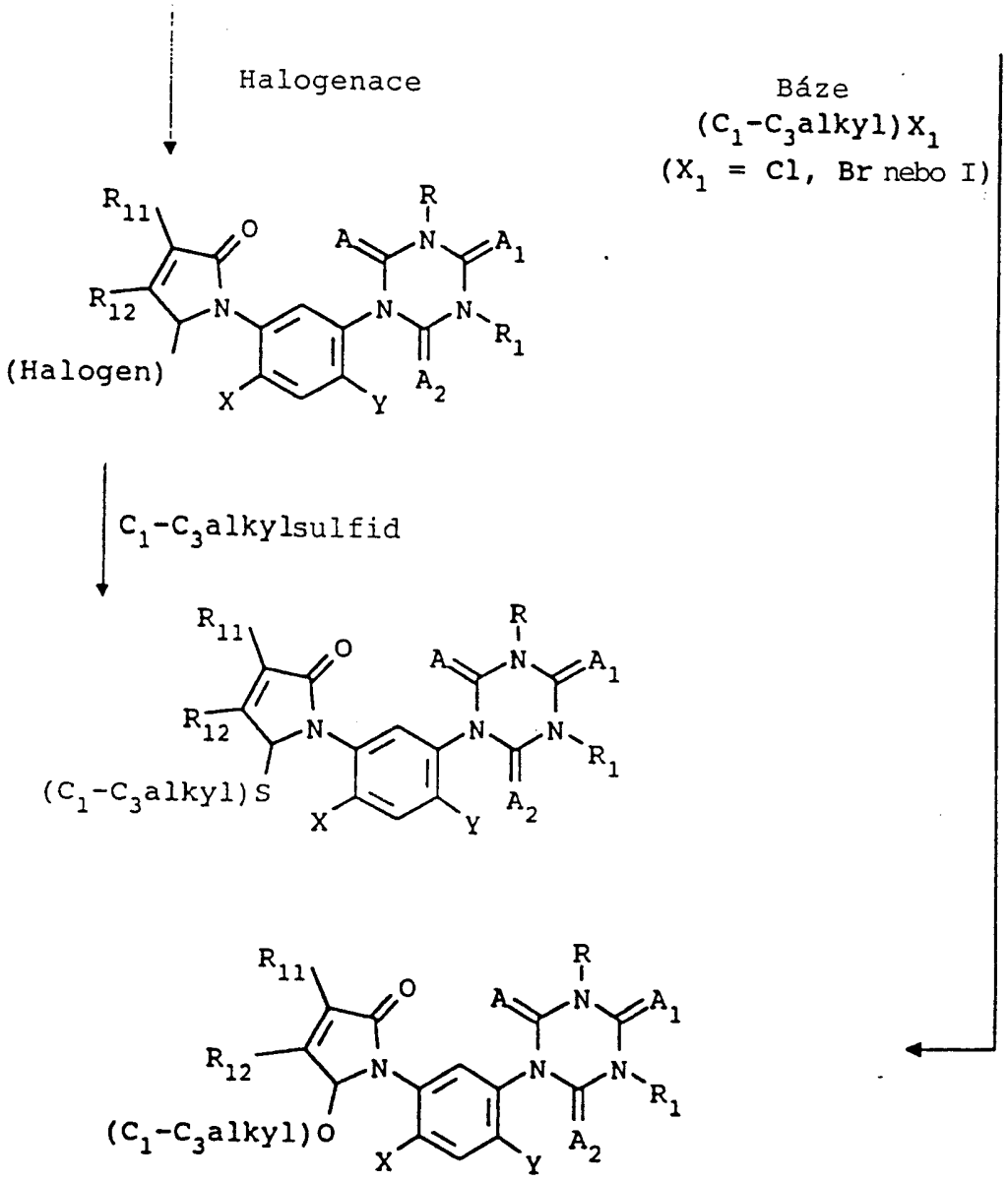
Sloučeniny obecného vzorce I, kde Q představuje skupinu Q4, je možno vyrobit reakcí sloučeniny vzorce I, kde Q přestavuje skupinu Q1 a A_3 a A_4 představují atomy kyslíku, reakcí tetrahydroboritanu sodného za vzniku sloučeniny, kde L představuje hydroxyskupinu. Tato sloučenina se nechá reagovat s bází a vhodným alkylačním činidlem, čímž se získá sloučenina, kde L představuje alkoxyskupinu s 1 až 3 atomy uhlíku, nebo se sloučenina, kde L představuje hydroxyskupinu, nechá reagovat s halogenačním činidlem, jako chloridem fosforitým, thionylchloridem, bromidem fosforitým, směsí trifenylfosfinu a bromu, jodidem fosforitým nebo směsí trifenylfosfinu a jodu, v inertním rozpouštědle, jako chloroformu. Získá se sloučenina, kde L představuje atom halogenu, která se dále nechá reagovat s alkylsulfidem s 1 až 3 atomy uhlíku na sloučeninu, kde L představuje

alkylthioskupinu s 1 až 3 atomy uhlíku. Tyto reakční sekvence jsou ilustrovány ve schematu VI.

S c h e m a V I



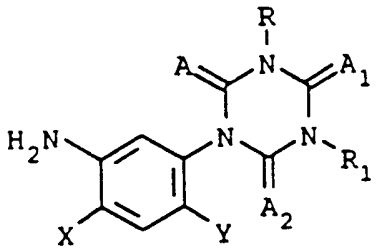
S c h e m a V I - pokračování



Sloučeniny obecného vzorce I, kde Q představuje skupinu Q5, je možno vyrobit diazotací aminu vzorce VII za použití standardních postupů. Vznikne intermediární sloučenina, která se redukuje siřičitanem sodným na hydrazin vzorce XIV. Hydrazin se poté nechá reagovat s iminoetherem vzorce

XV na amidrazon vzorce XVI. Amidrazon vzorce XVI se nechá reagovat s fosgenem nebo vhodným ekvivalentem fosgenu, popřípadě za přítomnosti triethylaminu, za vzniku požadované sloučeniny. Tato reakční sekvence je ilustrována ve schematu VII.

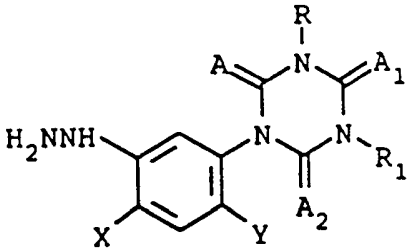
Schema VII



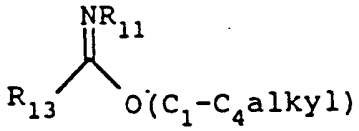
(VII)

1) Diazotace

2) Na_2SO_3

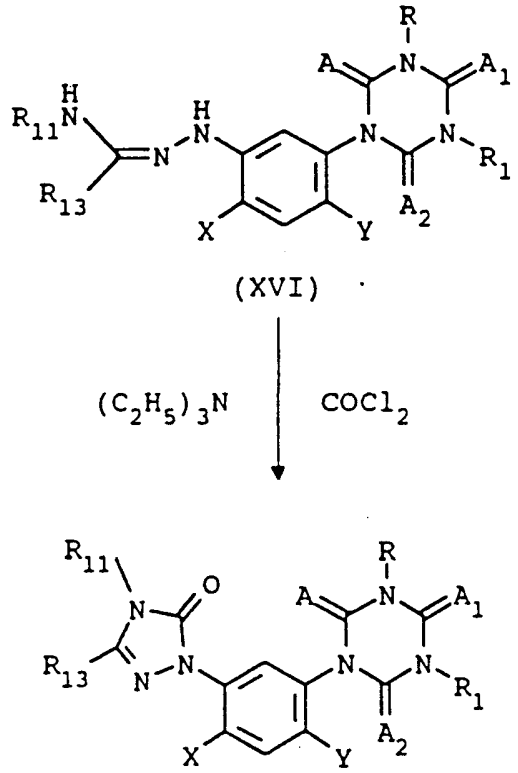


(XIV)



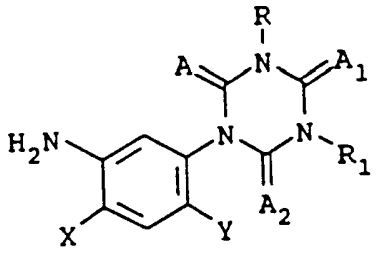
(XV)

S c h e m a V I I - pokračování

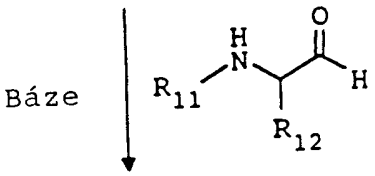


Sloučeniny obecného vzorce I, kde Q představuje skupinu Q6, je možno připravit kondenzací aminu vzorce VII s β-aminoaldehydem vzorce XVII za přítomnosti báze. Vzniklá intermediární sloučenina se nechá reagovat s fosgenem nebo ekvivalentem fosgenu. Tato reakční sekvence je ilustrována ve schematu VIII.

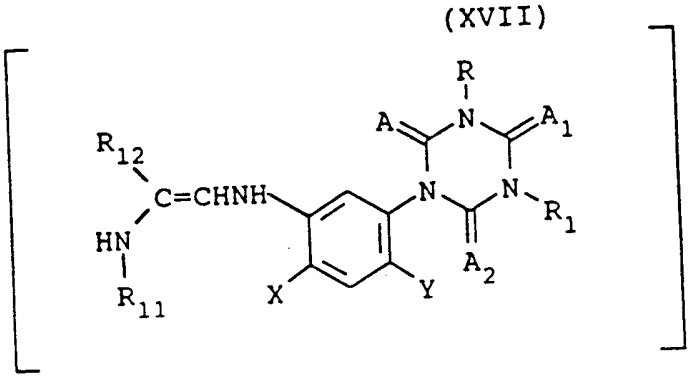
Schema VIII

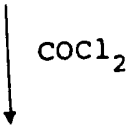


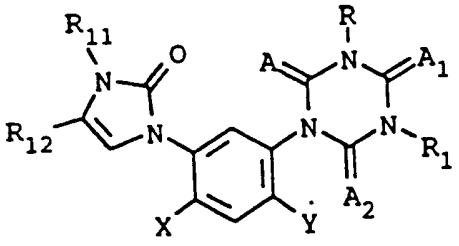
(VII)



(XVII)

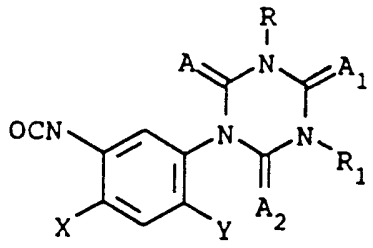






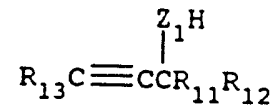
Sloučeniny obecného vzorce I, kde Q představuje skupinu Q7, je možno vyrobit reakcí isokyanátu vzorce VIII se substituovaným alkinem vzorce XVIII za přítomnosti báze, popřípadě za zvýšené teploty. Tato reakce je ilustrována ve schematu IX.

S c h e m a I X

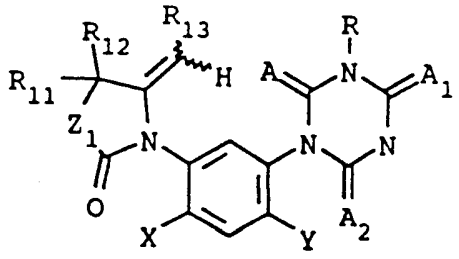


(VIII)

Báze



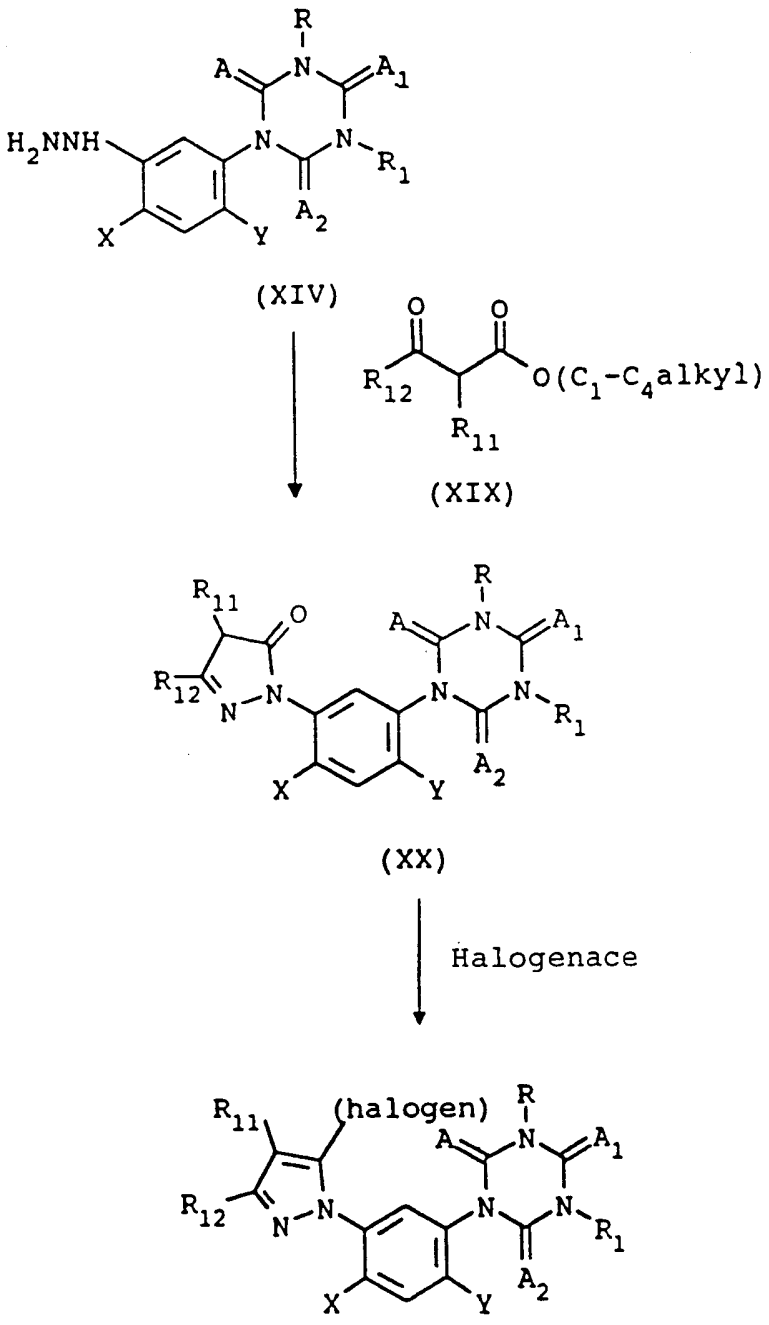
(XVIII)



Sloučeniny obecného vzorce I, kde Q představuje skupinu Q8 a M představuje atom halogenu, je možno vyrobit reakcí hydrazinu vzorce XIV nebo jeho hydrochloridové soli s 2-alkoxykarbonylalkanonem vzorce XIX popřípadě za přítomnosti báze, jako triethylaminu nebo octanu sodného, v inertním rozpouštědle, jako ethanolu nebo toluenu. Vzniklý 2,3-dihydropyrazol-3-on vzorce XX se halogenuje halogenač-

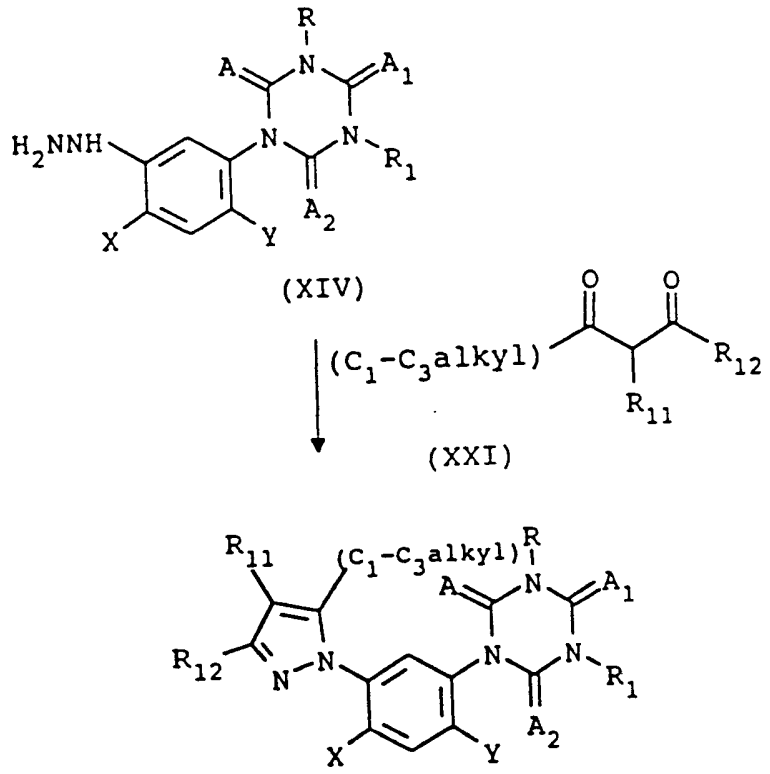
ním činidlem, jako je oxychlorid fosforečný nebo oxybromid fosforečný. Tato reakční sekvence je ilustrována ve schematu X.

Schema X



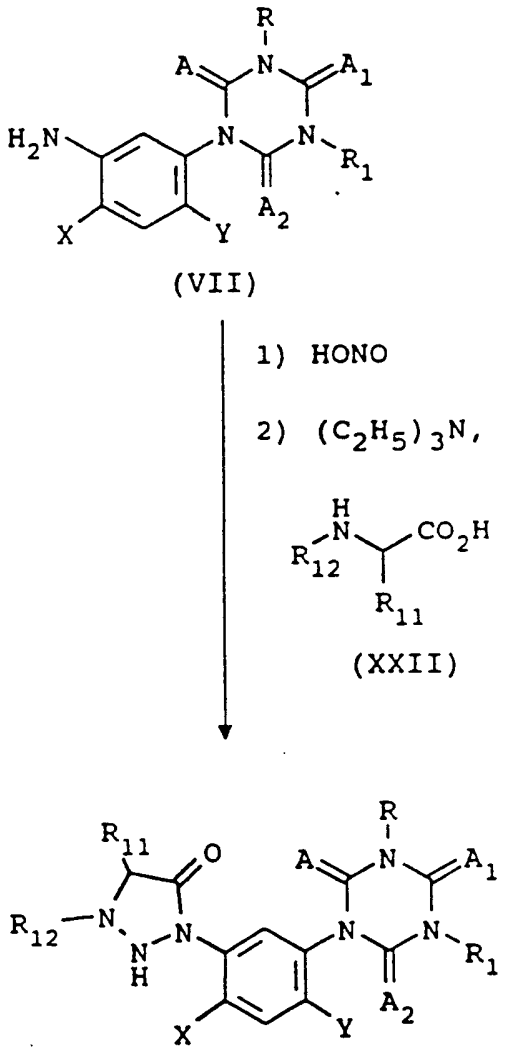
Sloučeniny obecného vzorce I, kde Q představuje skupinu Q8 a M představuje alkylskupinu s 1 až 3 atomy uhlíku, je možno vyrobit reakcí hydrazinu vzorce XIV s 1,3-diketonem vzorce XXI popřípadě za přítomnosti báze v inertním rozpouštědle. Tato reakce je ilustrována ve schematu XI.

Schema XI



Sloučeniny vzorce I, kde Q představuje skupinu Q9, je možno vyrobit diazotací aminu vzorce VII na intermediární diazoniovou sůl. Tato intermediární diazoniová sůl se in situ nechá reagovat s β-aminokyselinou vzorce XXII za přítomnosti triethylaminu. Tato reakční sekvence je ilustrována ve schematu XII.

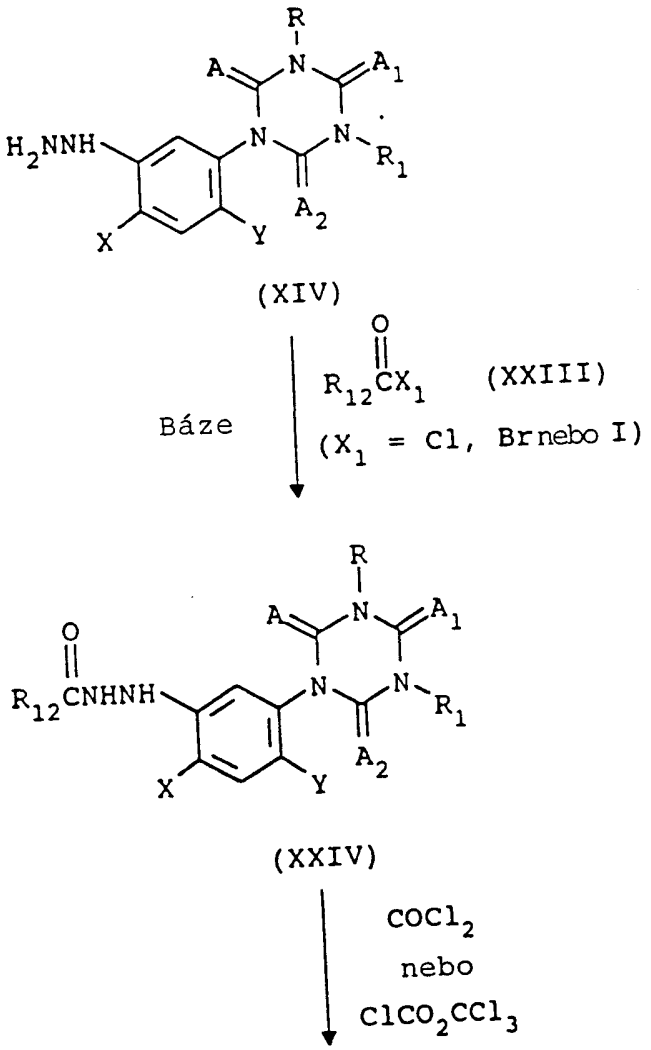
Schema XII



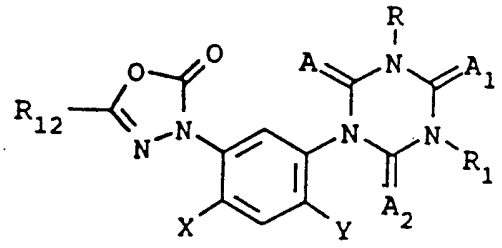
Sloučeniny obecného vzorce I, kde Q představuje skupinu Q10, je možno vyrobit reakcí hydrazinu vzorce XIV s acylhalogenidem vzorce XXIII za přítomnosti báze, jako triethylaminu nebo pyridinu. Vzniklý arylhydrazid vzorce XXIV se nechá reagovat s trichlormethylchlorformiátem a fosgenem nebo vhodným ekvivalentem fosgenu popřípadě za přítomnosti

triethylaminu. Tato reakční sekvence je ilustrována ve schematu XIII.

S c h e m a X I I I

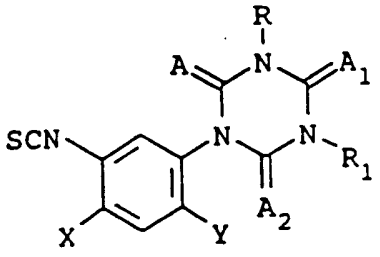


S c h e m a X I I I - pokračování

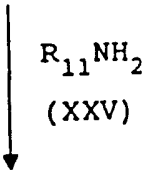


Sloučeniny obecného vzorce I, kde Q představuje skupinu Q11, A_3 představuje atom síry, A_4 představuje atom kyslíku a Z představuje skupinu CH, je možno vyrobit reakcí isothiokyanátu vzorce VIII s aminem vzorce XXV za vzniku thiomočoviny vzorce XXVI. Tato thiomočovina se nechá reagovat s α-halogenkarbonylhalogenidem vzorce XXVII za přítomnosti báze. Tato reakční sekvence je ilustrována ve schematu XIV.

S c h e m a X I V



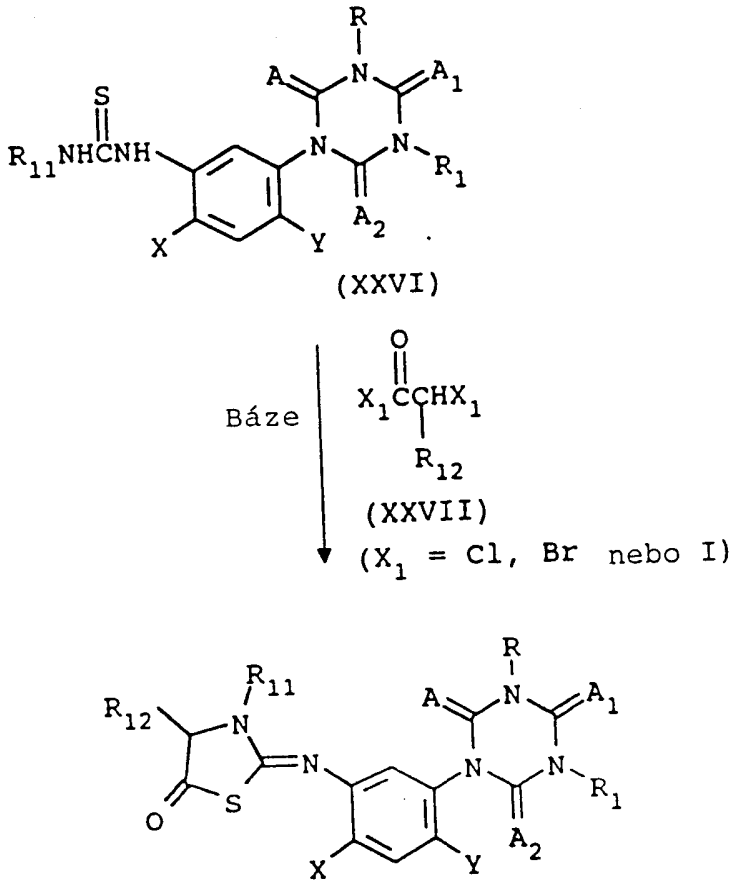
(VIII)



$R_{11}NH_2$

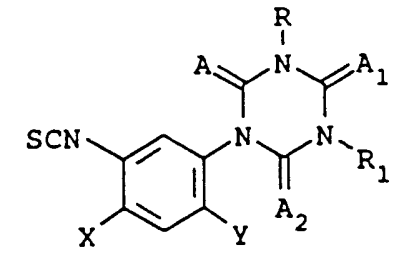
(XXV)

S c h e m a X I V - pokračování

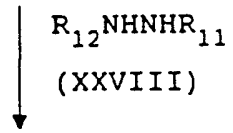


Sloučeniny obecného vzorce I, kde Q představuje skupinu Q11, A_3 představuje atom síry, A_4 představuje atom kyslíku a Z představuje atom dusíku, je možno vyrobit reakcí isothiokyanátu vzorce VIII se substituovaným hydrazinem vzorce XXVIII za vzniku intermediární sloučeniny vzorce XXIX. Tato intermediární sloučenina se nechá reagovat s fosfenem nebo vhodným ekvivalentem fosgenu za přítomnosti báze, jako triethylaminu. Tato reakční sekvence je ilustrována ve schematu XV.

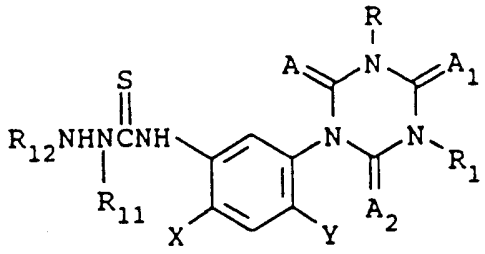
Schema XV



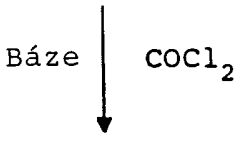
(VIII)

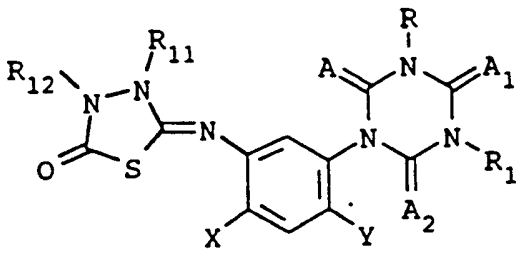


(XXVIII)



(XXIX)

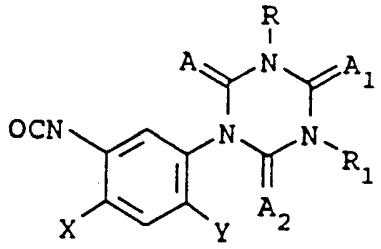




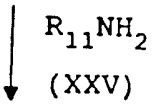
Sloučeniny obecného vzorce I, kde Q přestavuje skupinu Q11, A_3 a A_4 představují atomy kyslíku a Z představuje skupinu CH, je možno vyrobit reakcí isokyanátu vzorce VIII s aminem vzorce XXV za vzniku močoviny vzorce XXX. Močovina vzorce XXX se dehydratuje na karbodiimid

vzorce XXXI, který se nechá reagovat s α-halogenkarbonylhalogenidem vzorce XXVII za vzniku halogenamidinu vzorce XXXII. Halogenamidin vzorce XXXIII se hydrolyzuje působením vodné kyseliny na acylmočovinu, která se zahříváním in situ převeden a O-acylmočovinu vzorce XXXIII. O-Acylmočovina vzorce XXXIII se nechá reagovat s bází, jako triethylaminem. Tato reakční sekvence je ilustrována ve schematu XVI.

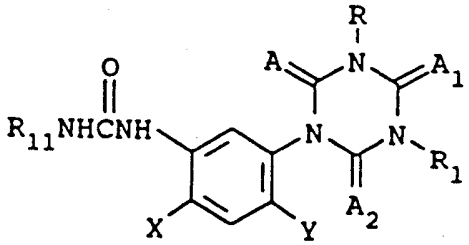
S c h e m a X V I



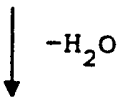
(VIII)



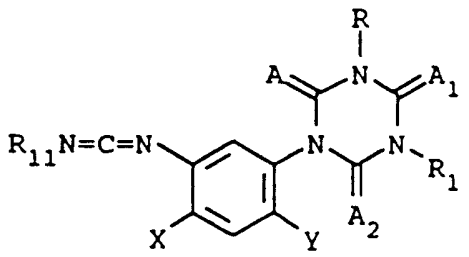
(XXV)



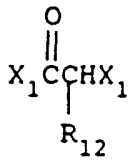
(XXX)



S c h e m a X V I - pokračování

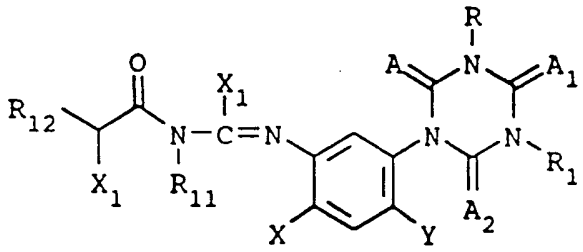


(XXXI)



(XXVII)

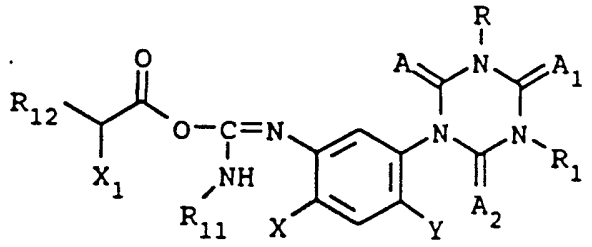
(X_1 = Cl, Br nebo I)



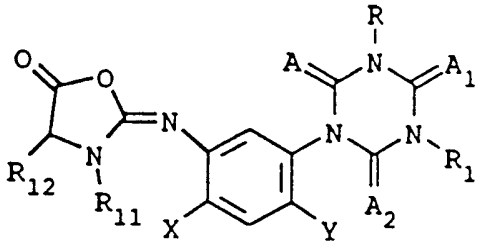
(XXXII)

1) H_3O^+
2) Δ

S c h e m a X V I - pokračování

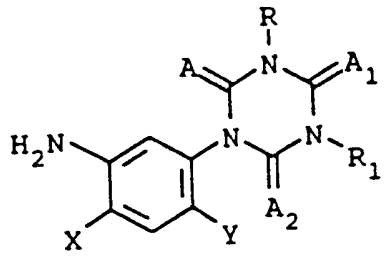


(XXXIII)

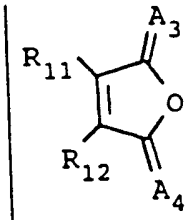


Sloučeniny obecného vzorce I, kde Q představuje skupinu vzorce Q12, je možno připravit reakcí aminu vzorce VII s anhydridem vzorce IV za vzniku amidu kyseliny vzorce XXXIV. Amid kyseliny vzorce XXXIV se dehydratuje působením dehydratačního činidla, jako je 1,3-dicyklohexylkarbodiimid. Tato reakční sekvence je ilustrována ve schematu XVII.

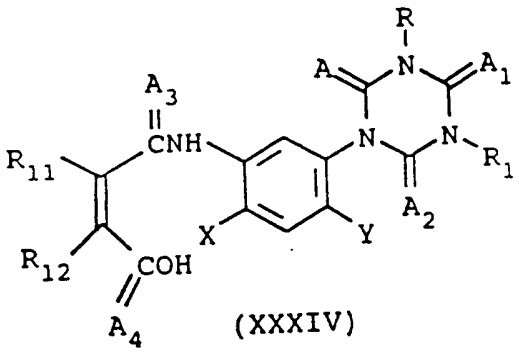
Schema XVII



(VII)

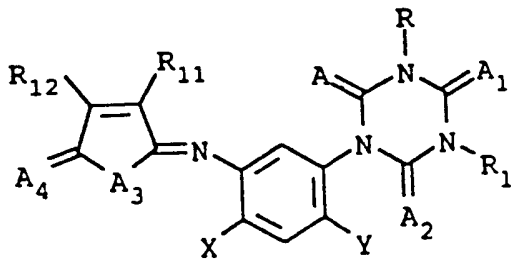


(IV)



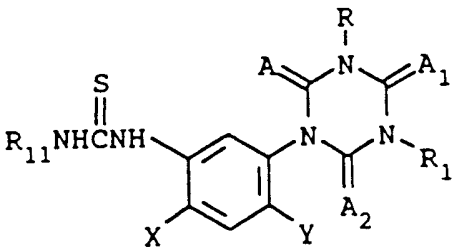
(XXXIV)

$-H_2O$



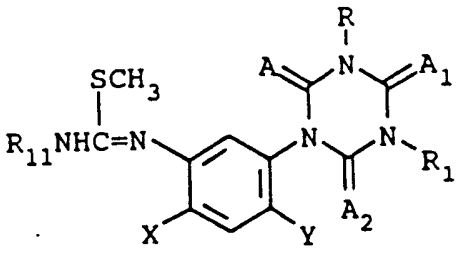
Sloučeniny obecného vzorce I, kde Q představuje skupinu vzorce Q13, je možno připravit reakcí thiomočoviny vzorce XXVI s jodmethanem za vzniku isothiomočoviny vzorce XXXV, která se nechá reagovat s chloroximem vzorce XXXVI. Tato reakční sekvence je ilustrována ve schematu XVIII.

S c h e m a X V I I I

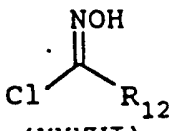


(XXVI)

CH_3I

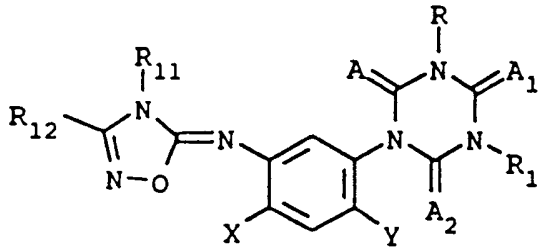


(XXXV)



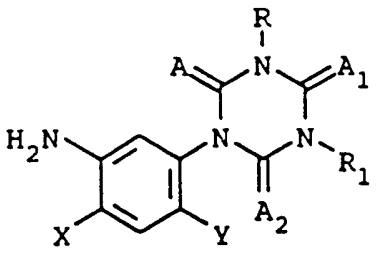
(XXXVI)

S c h e m a X V I I I - pokračování

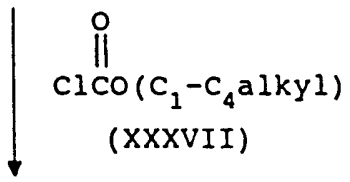


Sloučeniny obecného vzorce I, kde Q představuje skupinu vzorce Q14, je možno vyrobit reakcí aminu vzorce VII s chlorformiátem vzorce XXXVII za vzniku karbamátu vzorce XXXVIII. Karbamát vzorce XXXVIII se nechá reagovat s halogenketonem vzorce XXXIX za přítomnosti báze. Tato reakční sekvence je ilustrována ve schematu XIX.

S c h e m a X I X

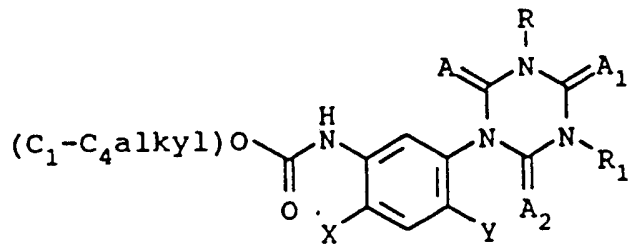


(VII)

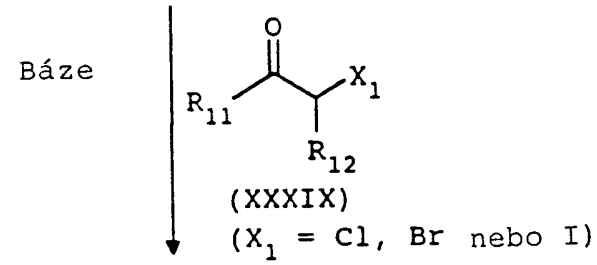


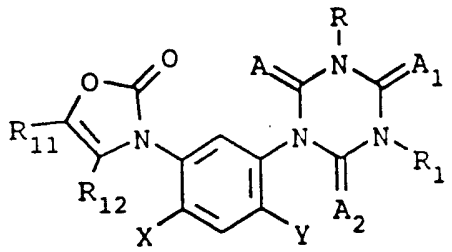
(XXXVII)

S c h e m a X I X - pokračování



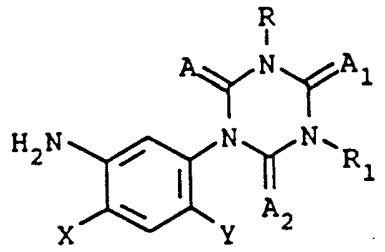
(XXXVIII)



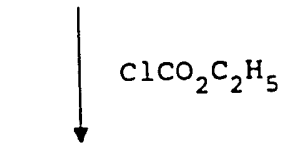


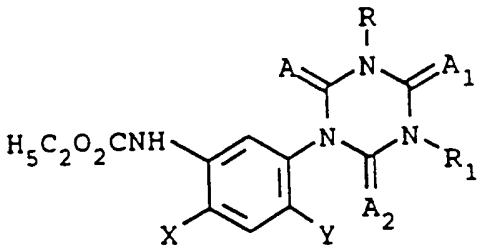
Sloučeniny obecného vzorce I, kde Q přestavuje skupinu vzorce Q15, je možno vyrobit reakcí aminu vzorce VII s ethylchlorformiátem za vzniku karbamátu vzorce XL. Karbamát vzorce XL se nechá reagovat s hydroxyesterem vzorce XLI při zvýšené teplotě za odstraňování ethanolu. Tato reakční sekvence je ilustrována ve schematu XX.

Schema XX

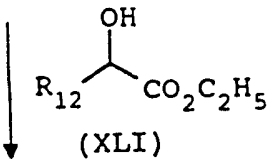


(VII)

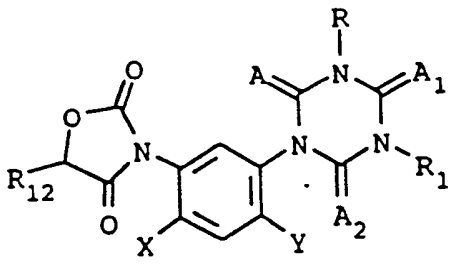




(XL)



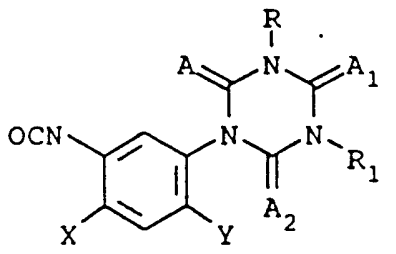
(XLI)



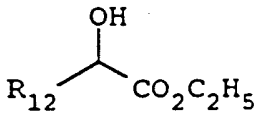
Alternativně je sloučeniny obecného vzorce I, kde Q přestavuje skupinu vzorce Q15, možno vyrobit reakcí isokyanátu vzorce VIII s hydroxyesterem vzorce XLII za vzniku

intermediární sloučeniny vzorce XLIII. Tato intermediární sloučenina vzorce XLIII se nechá reagovat s bází, jako octanem sodným, v inertním rozpouštědla, jako toluenu. Tato reakční sekvence je ilustrována ve schematu XXI.

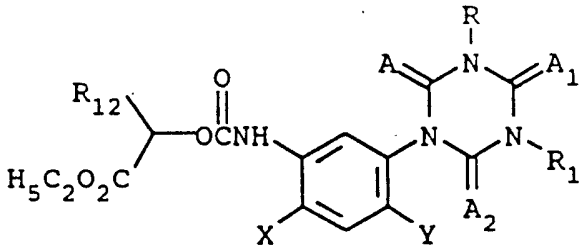
S c h e m a X X I



(VIII)

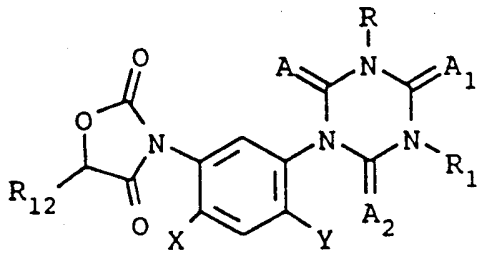


(XLII)



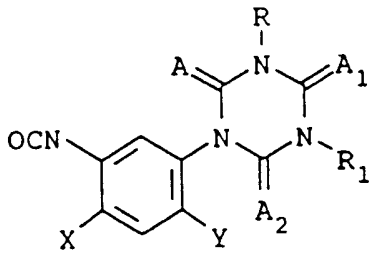
(XLIII)

Báze

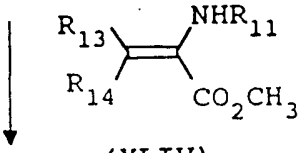


Sloučeniny obecného vzorce I, kde Q přestavuje skupinu vzorce Q16, je možno vyrobit reakcí isokyanátu vzorce VIII s α-amino-α,β-nenasyceným esterem vzorce XLIV za vzniku močoviny vzorce XLV. Močovina vzorce XLV se nechá reagovat s bází, jako octanem sodným, v inertním rozpouštědle, jako toluenu, při zvýšené teplotě. Tato reakční sekvence je ilustrována ve schematu XXII.

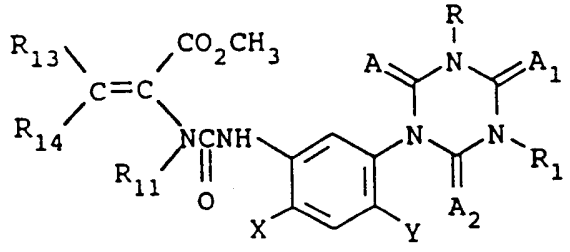
S c h e m a X X I I



(VIII)



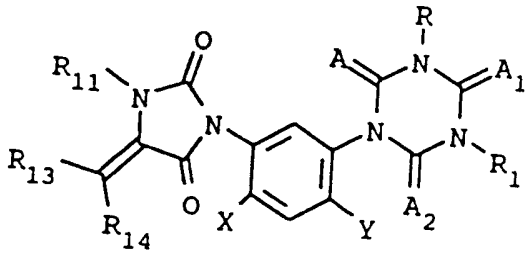
(XLIV)



(XLV)

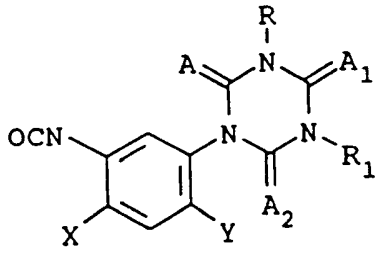
Báze

S c h e m a X X I I - pokračování



Alternativně je sloučeniny obecného vzorce I, kde Q přestavuje skupinu vzorce Q16, možno vyrobit reakcí isokyanátu vzorce VIII s aminokyselinou vzorce XLVI za vzniku močoviny vzorce XLVII. Tato močovina se nechá reagovat s vodnou kyselinou na hydantoin vzorce XLVIII, který se podrobí působení acetalu vzorce XLIX. Tato reakční sekvence je ilustrována ve schematu XXIII.

S c h e m a X X I I I

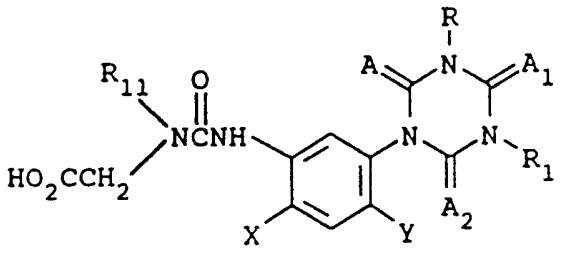


(VIII)

$R_{11}NHCH_2CO_2H$

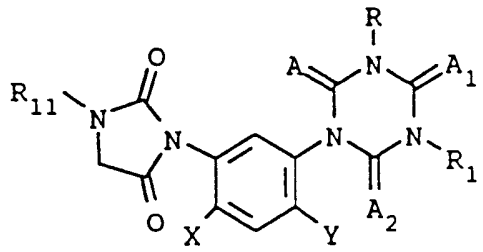
(XLVI)

S c h e m a X X I I I - pokračování

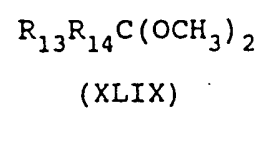


(XLVII)

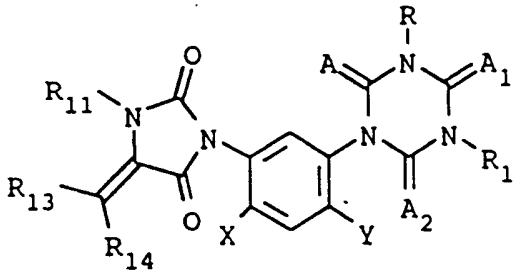




(XLVIII)



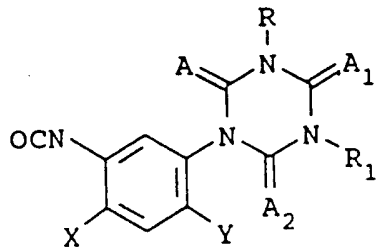
(XLIX)



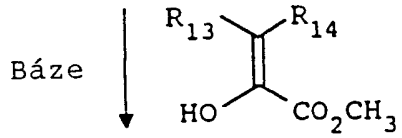
Sloučeniny obecného vzorce I, kde Q představuje skupinu vzorce Q17, je možno vyrobit reakcí isokyanátu vzorce

VIII s hydroxyalkenoátem vzorce L za přítomnosti báze, jako triethylaminu. Tato reakce je znázorněna ve schematu XXIV.

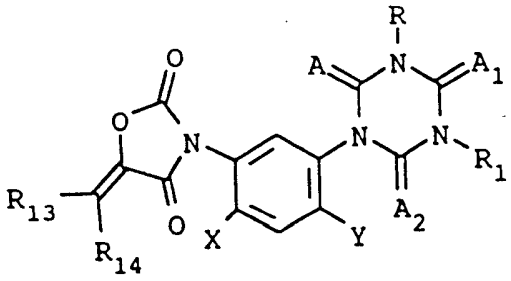
S c h e m a X X I V



(VIII)

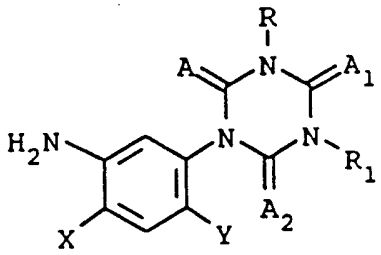


(L)



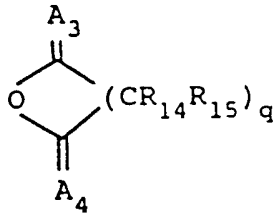
Sloučeniny obecného vzorce I, kde Q představuje skupinu vzorce Q18, je možno vyrobit reakcí aminu vzorce VII s anhydridem vzorce LI za přítomnosti kyseliny, jako je kyselina octová, přednostně při zvýšené teplotě. Tato reakce je ilustrována ve schematu XXV.

Schema XXV

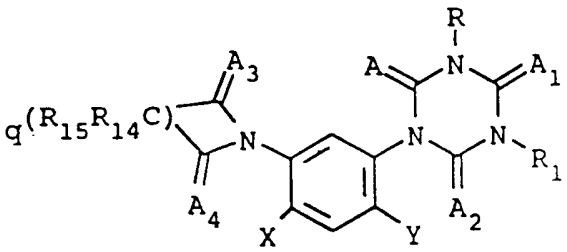


(VII)

Kyselina

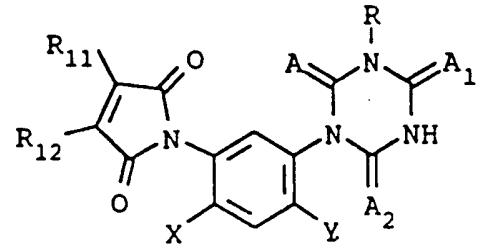


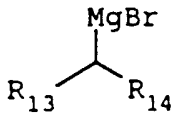
(LI)



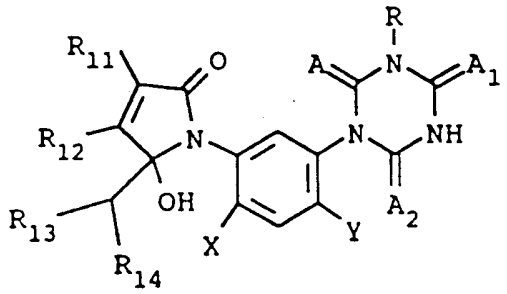
Sloučeniny obecného vzorce I, kde Q představuje skupinu vzorce Q19, je možno vyrobit reakcí sloučeniny obecného vzorce I, kde Q představuje skupinu vzorce Q1, A_3 a A_4 představují atomy kyslíku a R_1 představuje atom vodíku, s Grignardovým činidlem vzorce LII v rozpouštědle, jako je diethylether nebo tetrahydrofuran, při zvýšené teplotě, přičemž vznikne intermediární sloučenina vzorce LIII. Sloučenina vzorce LIII se nechá reagovat s hydrogensíranem draselným při zvýšené teplotě za vzniku požadované sloučeniny obecného vzorce I, kde R_1 představuje atom vodíku, kterou je možno působením alkylačního činidla vzorce V za přítomnosti báze alkylovat. Tato reakční sekvence je ilustrována ve schematu XXVI.

Schema XXVI

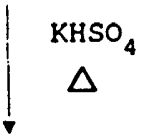




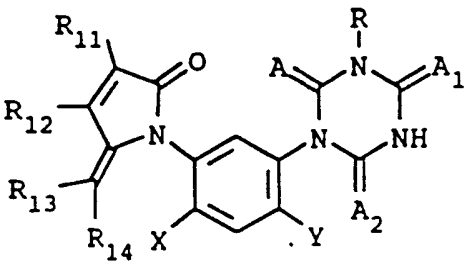
(LII)



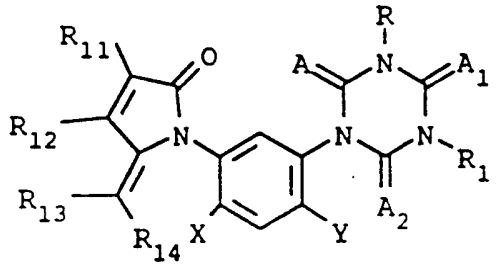
(LIII)



S c h e m a X X V I - pokračování

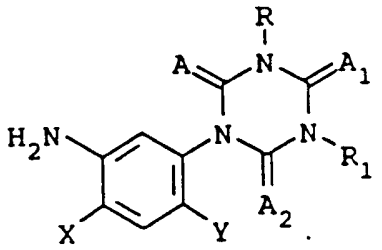


R_1X_1
(V)
(X_1 = Cl, Br nebo I)

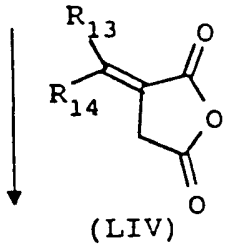


Sloučeniny obecného vzorce I, kde Q představuje skupinu vzorce Q20, je možno vyrobit reakcí aminu vzorce VII s anhydridem vzorce LIV v acetanhydridu za přítomnosti katalytického množství octanu sodného při zvýšené teplotě, v kyselině octové při zvýšené teplotě nebo v xylenu za přítomnosti katalytického množství p-toluensulfonové kyseliny při zvýšené teplotě. Tato reakční sekvence je ilustrována ve schematu XXVII.

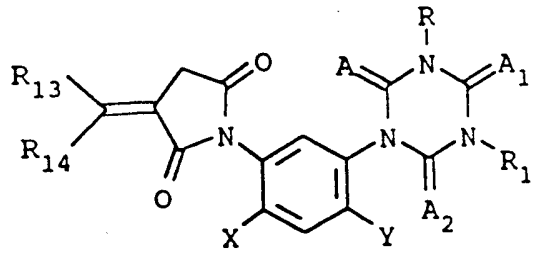
Schema XXVII



(VII)

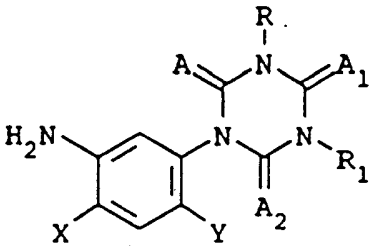


(LIV)

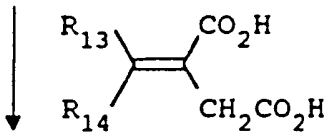


Alternativně je sloučeniny obecného vzorce I, kde Q představuje skupinu vzorce Q20, možno vyrobit reakcí aminu vzorce VII s dvojsytnou kyselinou vzorce LV v xylenu při teplotě zpětného toku. Tato reakce je ilustrována ve schematu XXVIII.

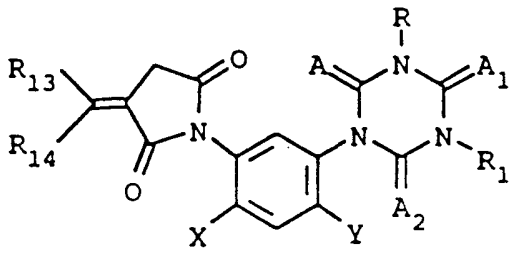
Schema XXVIII



(VII)

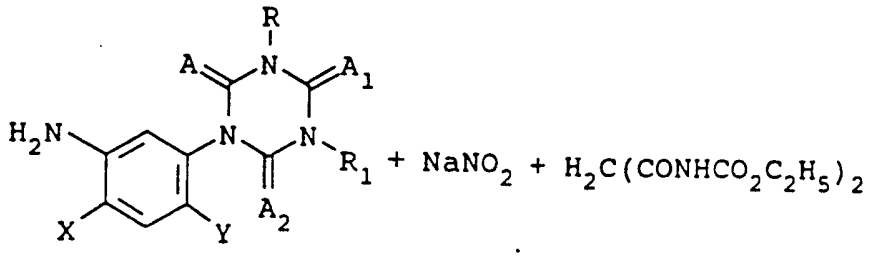


(LV)



Sloučeniny obecného vzorce I, kde Q představuje skupinu vzorce Q21, je možno vyrobit reakcí aminu obecného vzorce VII s ethylmalonyldiurethanem a dusitanem sodným v kyselině octové s obsahem katalytického množství koncentrované kyseliny chlorovodíkové za vzniku hydrazonu vzorce LVI. Hydrazon vzorce LVI se cyklizuje na triazindion vzorce LVII, který se dekarboxyluje reakcí s merkaptooctovou kyselinou při zvýšené teplotě. Sloučenina obecného vzorce I, kde Q představuje skupinu vzorce Q21 a R_{11} představuje atom vodíku se popřípadě alkyluje alkylhalogenidem za přítomnosti báze, jako natriumhydridu. Tato reakční sekvence je ilustrována ve schematu XXIX.

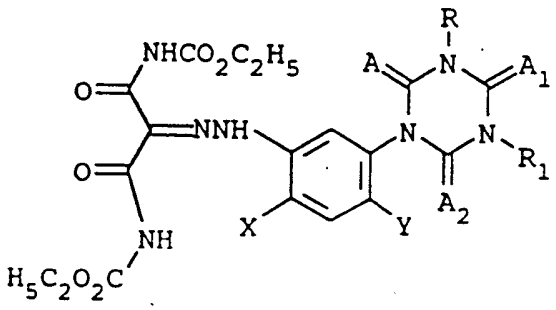
Schema XXIX



(VII)

CH_3CO_2H

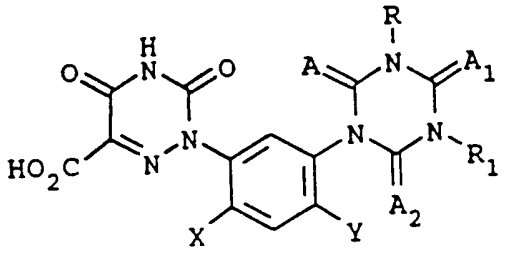
HCl/H_2O



(LVI)

Báze

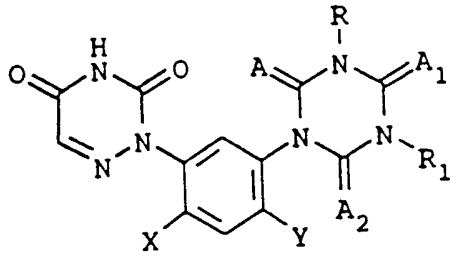
S c h e m a X X I X - pokračování



(LVII)

$HSCH_2CO_2H$

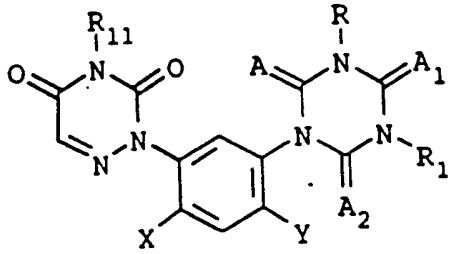
△



Báze

$R_{11}X_1$

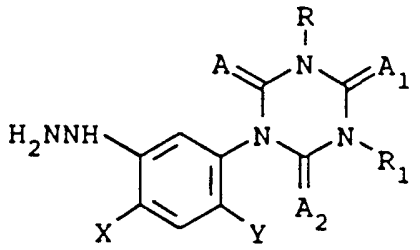
(X_1 = Cl, Br nebo I)



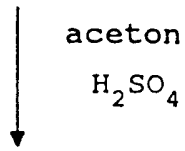
Alternativně je sloučeniny obecného vzorce I, kde Q představuje skupinu vzorce Q21 a R_{11} představuje atom vodíku, možno vyrobit reakcí hydrazinu vzorce XIV s acetonem v

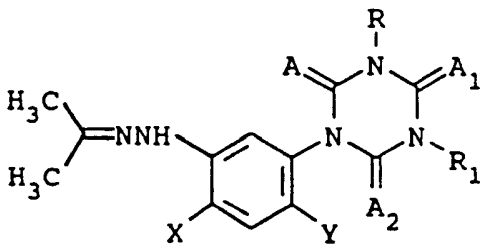
roztoku kyseliny sírové za vzniku hydrazonu vzorce LVIII. Hydrazon vzorce LVIII se nechá reagovat s kyanatanem draselným v roztoku kyseliny octové. Vzniklý triazolidin vzorce LIX se nechá reagovat s kyselinou glyoxylovou a kyselinou sírovou. Tato reakční sekvence je ilustrována ve schematu XXX.

S c h e m a X X X

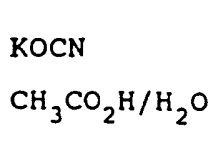


(XIV)

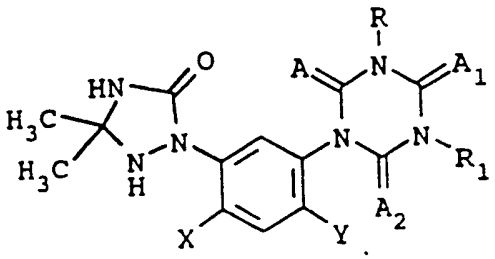




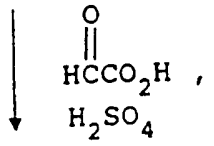
(LVIII)

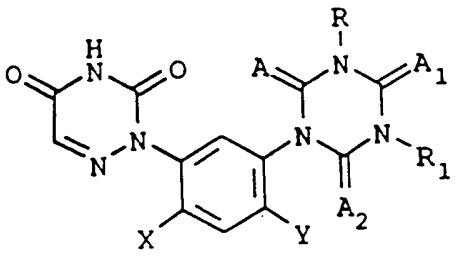


S c h e m a X X X - pokračování



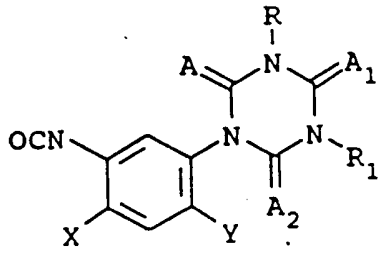
(LIX)





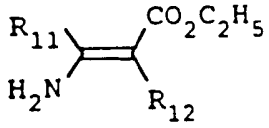
Sloučeniny obecného vzorce I, kde Q představuje skupinu vzorce Q22 a R_1 se liší od vodíku, je možno vyrobit reakcí sloučeniny vzorce VIII s aminoesterem vzorce LX za přítomnosti báze, jako natriumhydridu, za vzniku intermediární sloučeniny vzorce LXI. Intermediární sloučenina vzorce LXI se cyklizuje popřípadě za přítomnosti kyseliny nebo báze. Sloučenina obecného vzorce I, kde Q představuje skupinu vzorce Q22 a R_{16} představuje atom vodíku, se popřípadě alkyluje alkylhalogenidem s 1 až 3 atomy uhlíku za přítomnosti báze, jako je natriumhydrid. Tato reakční sekvence je ilustrována ve schematu XXXI.

Schema XXXI

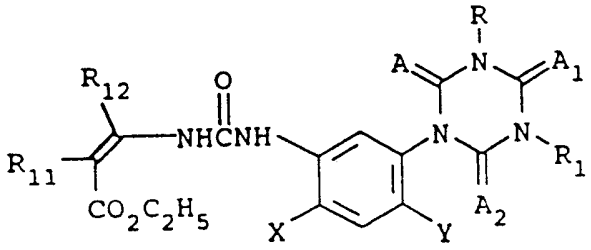


(VIII)

Báze

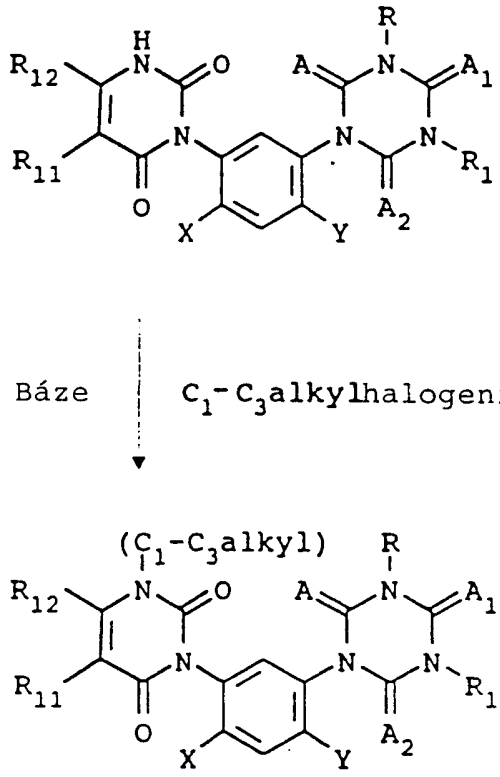


(LX)



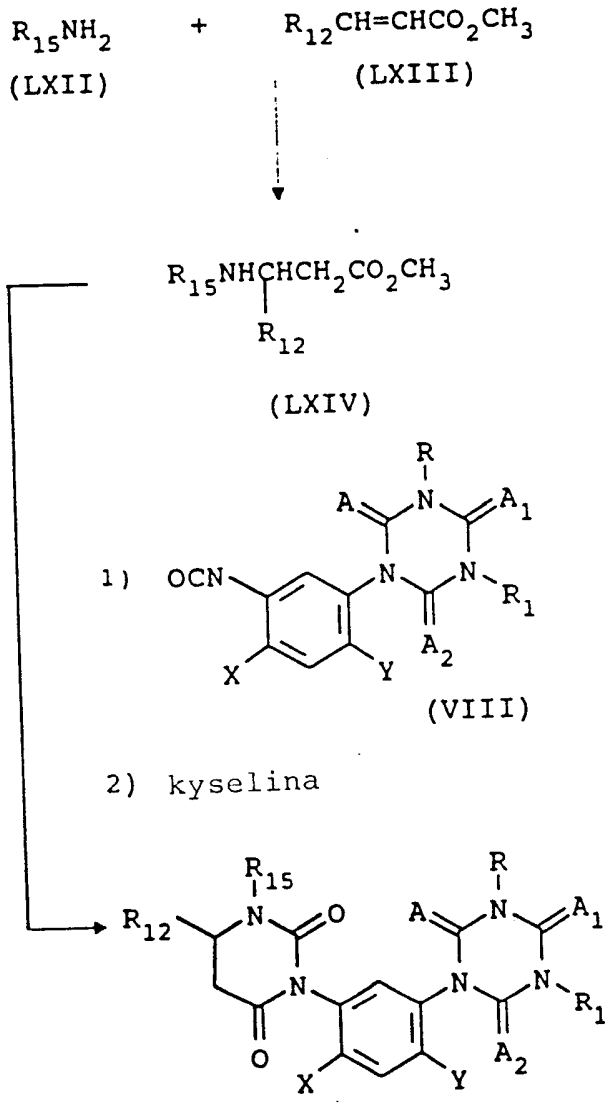
(LXI)

S c h e m a X X X I - pokračování



Sloučeniny obecného vzorce I, kde Q představuje skupinu vzorce Q23, je možno vyrobit reakcí aminu vzorce LXII s α,β-nenasyceným esterem vzorce LXIII za vzniku aminoesteru vzorce LXIV. Aminoester vzorce LXIV podrobí reakci s isokyanátem vzorce VIII následované zahříváním za kyselých podmínek. Tato reakční sekvence je ilustrována ve schematu X XXXII.

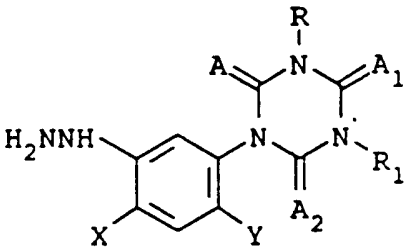
Schema XXXII



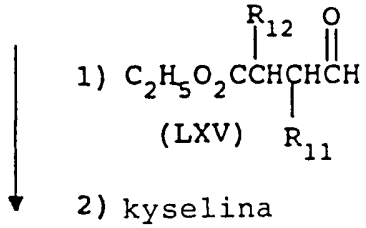
Sloučeniny obecného vzorce I, kde Q představuje skupinu vzorce Q24, je možno vyrobit reakcí hydrazinu vzorce XIV s formylpropionátem vzorce LXV a následnou cyklizací za kyselých podmínek. Vzniklý dihydropyridazinon vzorce LXVI se dehydrogenuje působením chloranilu nebo 2,3-dichlor-5,6-dikyanobenzochinonu (DDQ) v inertním rozpouštědle, jako

dioxanu nebo toluenu, při zvýšené teplotě. Tato reakční sekvence je ilustrována ve schematu XXXIII.

S c h e m a X X X I I I

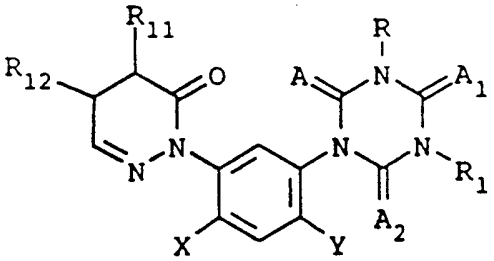


(XIV)



1) $C_2H_5O_2CCH(R_{12})CH(=O)CH(R_{11})$ (LXV)

2) kyselina

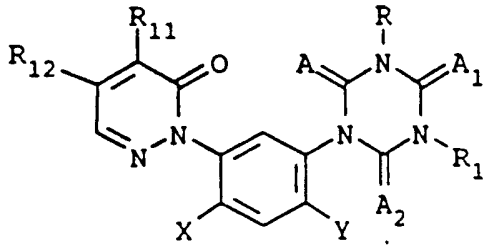


(LXVI)

DDQ nebo chloranil

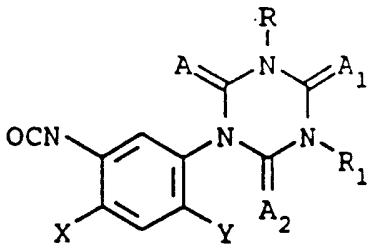
Δ

S c h e m a X X X I I I - pokračování

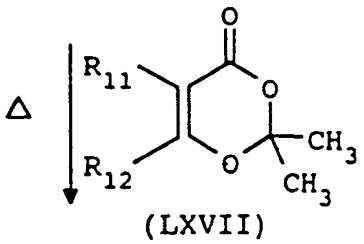


Sloučeniny obecného vzorce I, kde Q představuje skupinu vzorce Q25, je možno vyrobit reakcí isokyanátu vzorce VIII s acetonidem vzorce LXVII při zvýšené teplotě. Tato reakce je ilustrována ve schematu XXXIV.

S c h e m a X X X I V

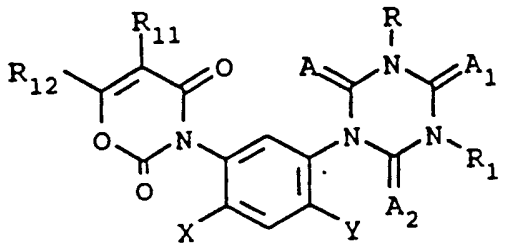


(VIII)



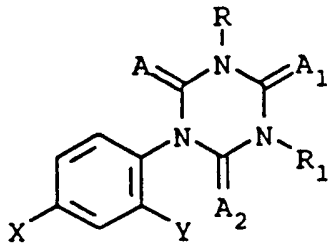
(LXVII)

S c h e m a X X X I V - pokračování

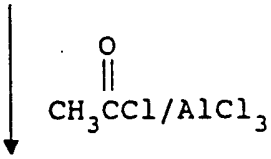


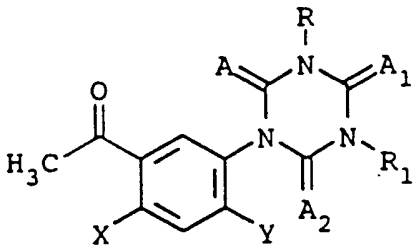
Sloučeniny obecného vzorce I, kde Q představuje skupinu vzorce Q26, je možno vyrobit reakcí 3-(substituovaný fenyl)-s-triazin-2,4,6-oxo- nebo thiotrionu vzorce LXVIII s acetylchloridem za přítomnosti chloridu hlinitého. Vzniklý keton vzorce LXIX se nechá reagovat s esterem vzorce LXX na diketonovou sloučeninu vzorce LXXI, která se reakcí s hydrazinem vzorce LXXII převede na sloučeninu obecného vzorce I, kde Q představuje skupinu vzorce Q26 a R_{16} představuje atom vodíku, která se poté popřípadě halogenuje. Tato reakční sekvence je ilustrována ve schematu XXXV.

Schema XXXV



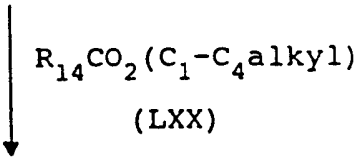
(LXVIII)



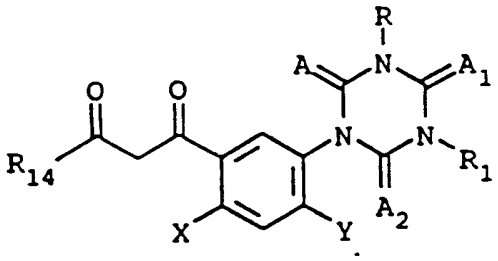


(LXIX)

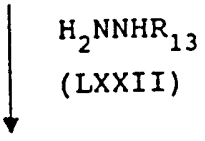
Báze



(LXX)

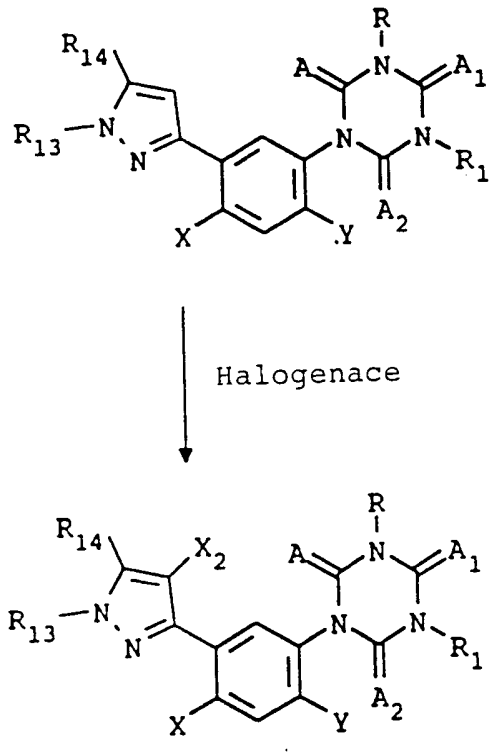


(LXXI)



(LXXII)

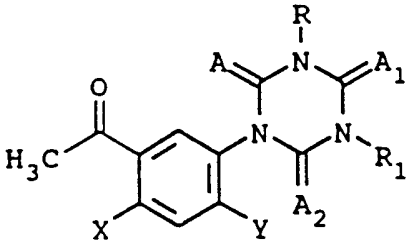
Schema XXXV - pokračování



(X_2 = halogen)

Sloučeniny obecného vzorce I, kde Q představuje skupinu vzorce Q27, je možno vyrobit reakcí ketonu vzorce LXIX s karbonátem nebo thiokarbonátem vzorce LXXIII za přítomnosti báze za vzniku esteru nebo thioxoesteru vzorce LXXIV. Sloučenina vzorce LXXIV se nechá reagovat s hydrazinem vzorce LXXII na intermediární sloučeninu vzorce LXXV, která se alkyluje alkylačním činidlem vzorce LXXVI za přítomnosti báze. Vzniklá sloučenina obecného vzorce I, kde Q představuje skupinu vzorce Q27 a R_{16} představuje atom vodíku, se poté popřípadě halogenuje. Tato reakční sekvence je ilustrována ve schematu XXXVI.

Schema XXXVI

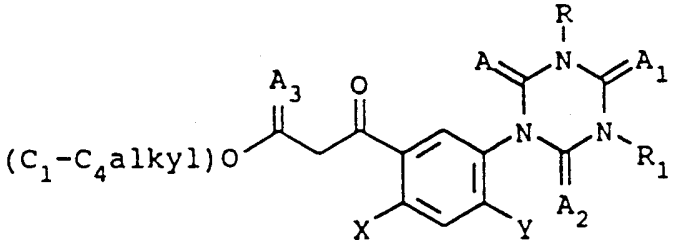


(LXIX)

Báze

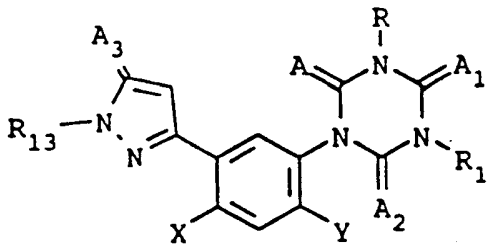
A_3
||
$C(O\text{-}C_1\text{-}C_4alkyl)_2$

(LXXIII)



(LXXIV)

H_2NNHR_{13}
(LXXII)

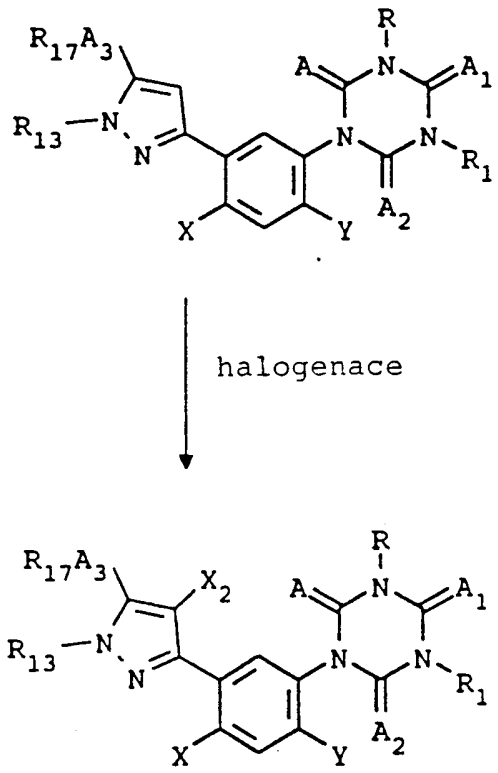


(LXXV)

Báze

$R_{17}X_1$
(LXXVI)
(X_1 = Cl, Br nebo I)

S c h e m a X X X V I - pokračování

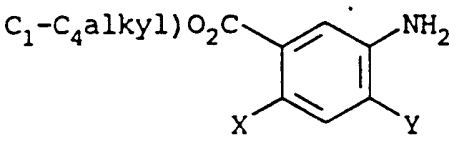


(X_2 = halogen)

Sloučeniny obecného vzorce I, kde Q představuje skupinu vzorce Q28, je možno vyrobit reakcí anilinu vzorce LXXVII s isokyanátem nebo isothiokyanátem vzorce LXXVIII za vzniku močoviny nebo thiomočoviny vzorce LXXIX. Sloučenina vzorce LXXIX se cyklizuje reakcí s isokyanátem nebo thioisokyanátem vzorce LXXX na 3-(substituovaný fenyl)-s-triazin-2,4,6-oxo- nebo thiotrion vzorce LXXXI, který se postupně podrobí působení báze, thionylchloridu a hydrazinu vzorce LXXII. Vzniklá intermediární sloučenina vzorce LXXXII se nechá reagovat s fosgenem nebo ekvivalentem fosgenu za vzniku sloučeniny obecného vzorce I, kde Q představuje

skupinu vzorce Q28 a R_1 představuje atom vodíku, kterou je možno alkylovat působením alkylačního činidla vzorce V za přítomnosti báze. Tato reakční sekvence je ilustrována ve schematu XXXVII.

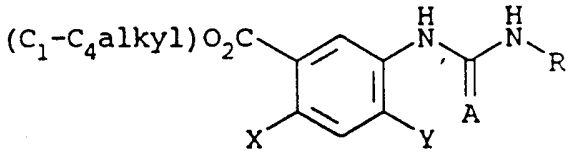
S c h e m a X X X V I I



(LXXVII)

RNCA

(LXXVIII)

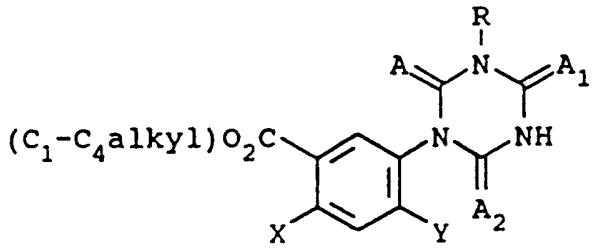


(LXXIX)

A_2
||
ClCNCA$_1$

(LXXX)

Schema XXXVII - pokračování



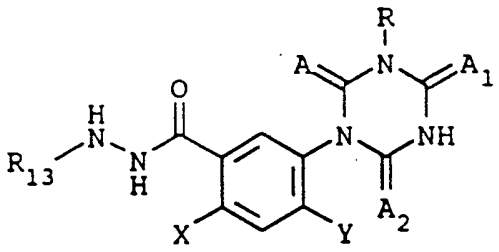
(LXXXI)

1) báze

2) $SOCl_2$

3) H_2NNHR_{13}

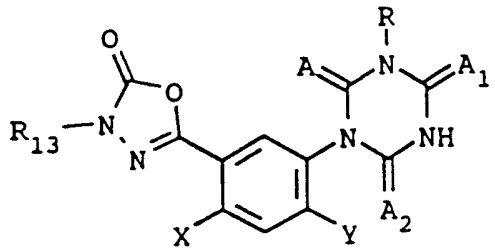
(LXXII)



(LXXXII)

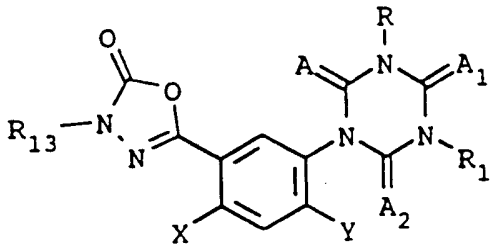
$COCl_2$

S c h e m a X X X V I I - pokračování



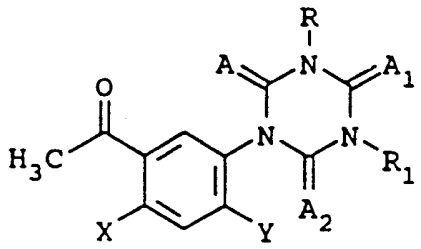
Báze

R_1X_1
(V)
(X_1 = Cl, Br nebo I)

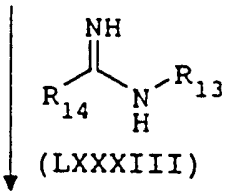


Sloučeniny obecného vzorce I, kde Q představuje skupinu vzorce Q29, je možno vyrobit reakcí ketonu vzorce LXIX s amidinem vzorce LXXXIII za vzniku sloučeniny obecného vzorce I, kde Q představuje skupinu vzorce Q29 a R_{16} představuje atom vodíku, která se popřípadě halogenuje. Tato reakce je ilustrována ve schematu XXXVIII.

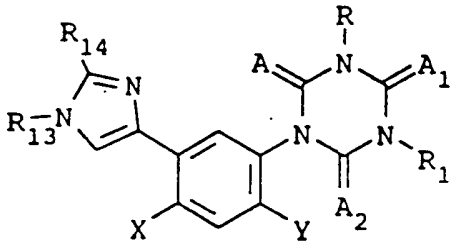
Schema XXXVIII



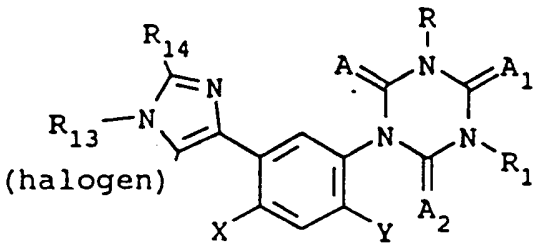
(LXIX)



(LXXXIII)



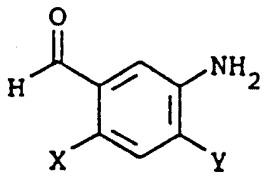
Halogenace



(halogen)

Sloučeniny obecného vzorce I, kde Q představuje skupinu vzorce Q30 a R_1 představuje atom vodíku, je možno vyrobit tak, že se amin vzorce LXXXIV nechá reagovat s isokyanátem nebo thioisokyanátem vzorce LXXVIII za vzniku močoviny nebo thiomočoviny vzorce LXXXV. Sloučenina vzorce LXXXV se cyklizuje působením isokyanátu nebo isothiokyanátu vzorce LXXX na 3-(substituovaný fenyl)-s-triazin-2,4,6-oxo- nebo thiotrion vzorce LXXXVI. Sloučenina vzorce LXXXVI se postupně podrobí působení hydroxidu amonného a chloračního činidla. Vzniklý chloroxim vzorce LXXXVII se nechá reagovat s alkinem vzorce LXXXVIII, čímž se získá sloučenina obecného vzorce I, kde Q přestavuje Q30, R_1 představuje atom vodíku a Z_2 představuje alkoxyskupinu s 1 až 4 atomy uhlíku. Na tuto sloučeninu se popřípadě působí postupně kyselinou nebo bází, thionylchloridem a aminem vzorce LXXXIX, čímž se získá sloučenina obecného vzorce I, kde Q představuje skupinu vzorce Q30, R_1 představuje atom vodíku a Z_2 představuje skupinu vzorce NR_9R_{10}. Tato reakční sekvence je ilustrována ve schematu XXXIX.

S c h e m a X X X I X

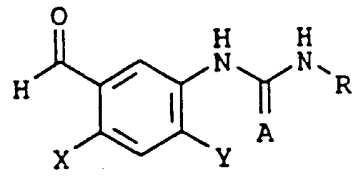


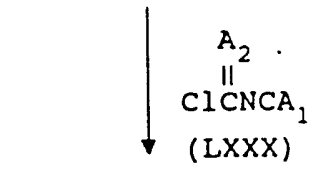
(LXXXIV)

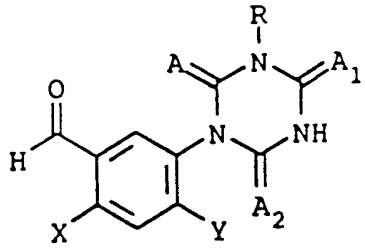
RNCA

(LXXVIII)

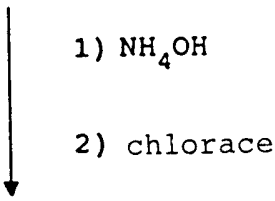
S c h e m a X X X I X - pokračování



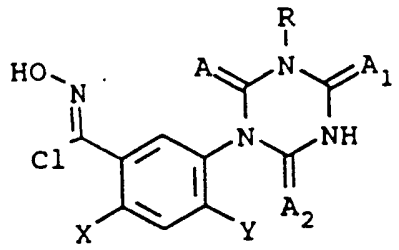




(LXXXVI)



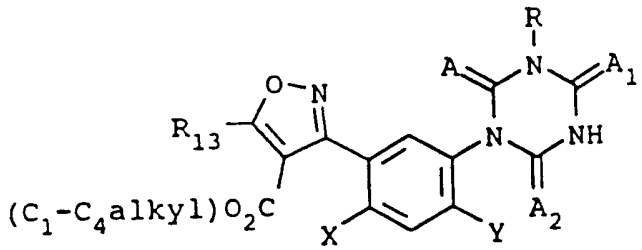
S c h e m a X X X I X - pokračování



(LXXXVII)

$R_{13}C\equiv CCO_2(C_1\text{-}C_4alkyl)$

(LXXXVIII)

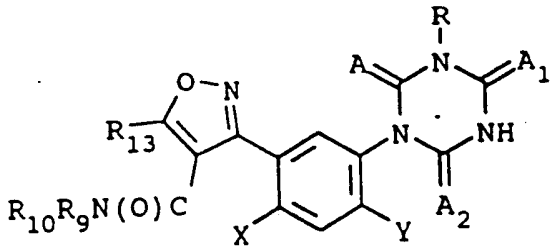


1) kyselina nebo báze

2) $SOCl_2$

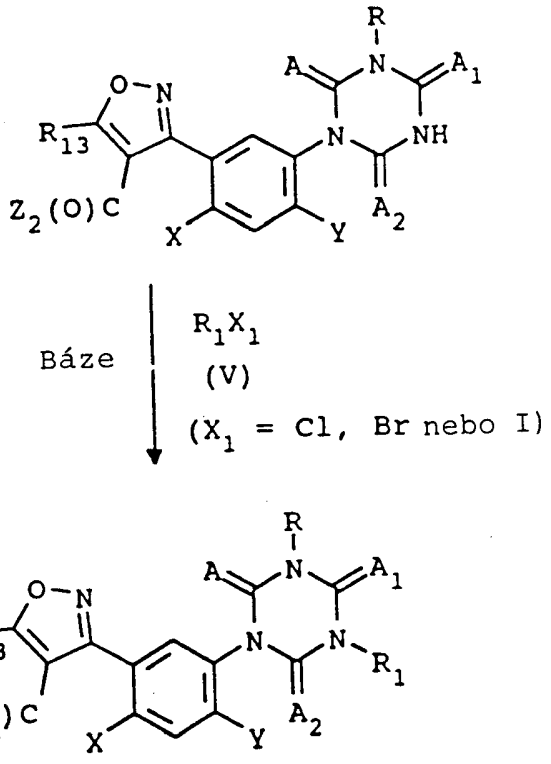
3) NHR_9R_{10}

(LXXXIX)



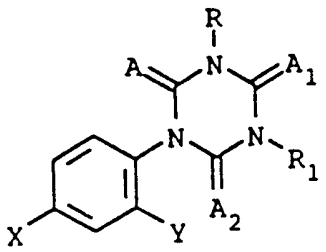
Sloučeniny obecného vzorce I, kde Q představuje skupinu vzorce Q30 a R_1 se liší od vodíku, je možno vyrobit alkylací sloučeniny obecného vzorce I, kde Q představuje skupinu vzorce Q30 a R_1 přestavuje atom vodíku, působením alkylačního činidla vzorce V za přítomnosti báze. Tato reakce je ilustrována ve schematu XL.

S c h e m a X L

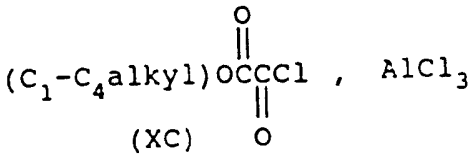


Sloučeniny obecného vzorce I, kde Q představuje skupinu vzorce Q31, je možno vyrobit reakcí 3-(substituovaný fenyl)-s-triazin-2,4,6-oxo- nebo thiotrionu vzorce LXVIII s esterem vzorce XC za přítomnosti chloridu hlinitého. Vzniklá intermediární sloučenina vzorce XCI se nechá reagovat se substituovaným aminem vzorce XCII. Tato reakční sekvence je ilustrována ve schematu XLI.

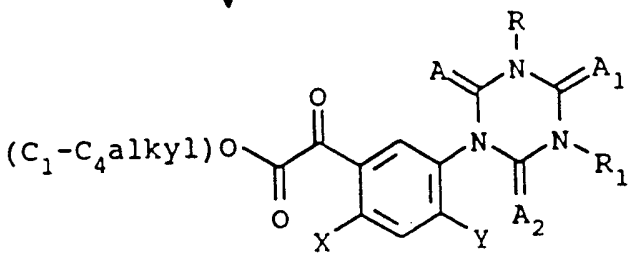
Schema XLI



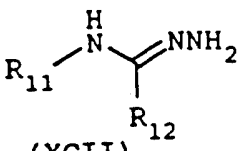
(LXVIII)



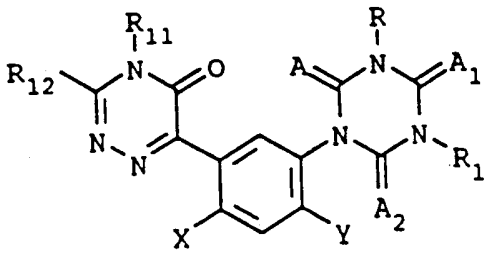
(XC)



(XCI)

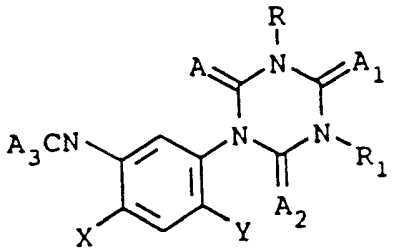


(XCII)

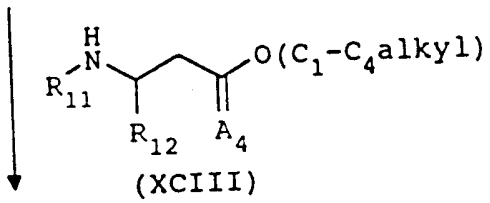


Sloučeniny obecného vzorce I, kde Q představuje skupinu vzorce Q32, je možno vyrobit reakcí isokyanátu nebo thioisokyanátu vzorce VIII s aminoesterem nebo aminothionoesterem vzorce XCIII v inertním rozpouštědle, přednostně při výšené teplotě. Tato reakce je ilustrována ve schematu XLII.

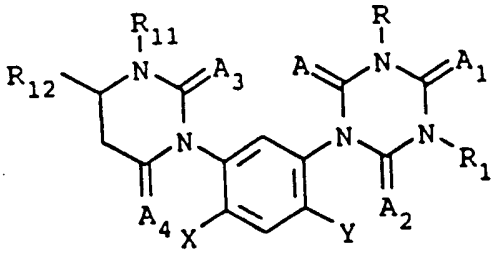
S c h e m a X L I I



(VIII)

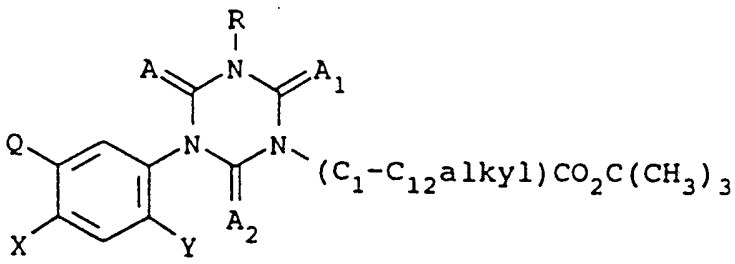


(XCIII)



Sloučeniny obecného vzorce I, kde R_3 představuje skupinu vzorce NR_9R_{10}, je možno vyrobit za použití standardních postupů, například tak, že se hydrolyzuje vhodný ester vzorce XCIV za přítomnosti trifluoroctové kyseliny, výsledná kyselina se nechá reagovat s thionylchloridem, čímž se získá chlorid kyseliny vzorce XCV. Chlorid vzorce XCV se nechá reagovat s aminem vzorce LXXXIX popřípadě za přítomnosti báze, čímž se získá požadovaný produkt. Tato reakční sekvence je ilustrována ve schematu XLIII.

S c h e m a X L I I I

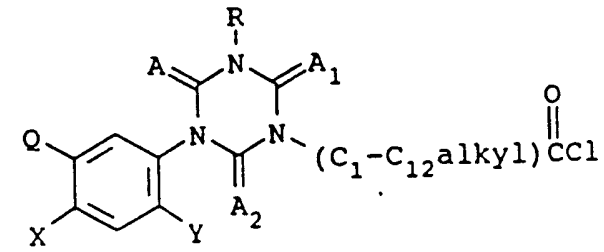


(XCIV)

1) CF_3CO_2H

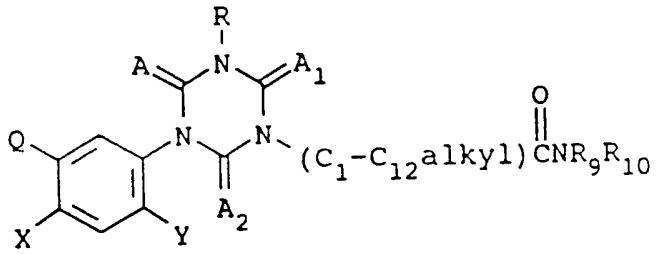
2) $SOCl_2$

S c h e m a X L I I I - pokračování



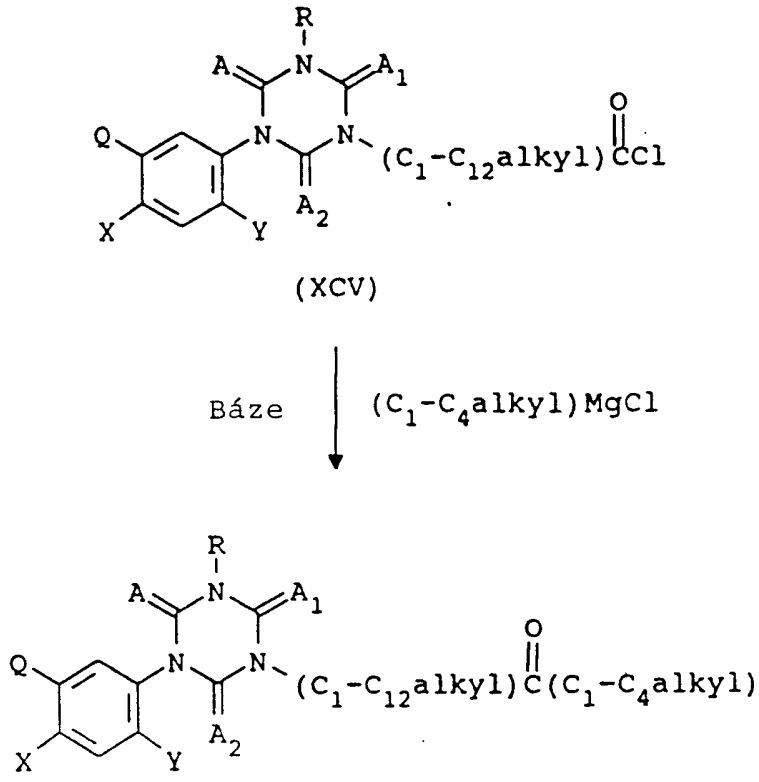
(XCV)

NHR_9R_{10}
(LXXXIX)



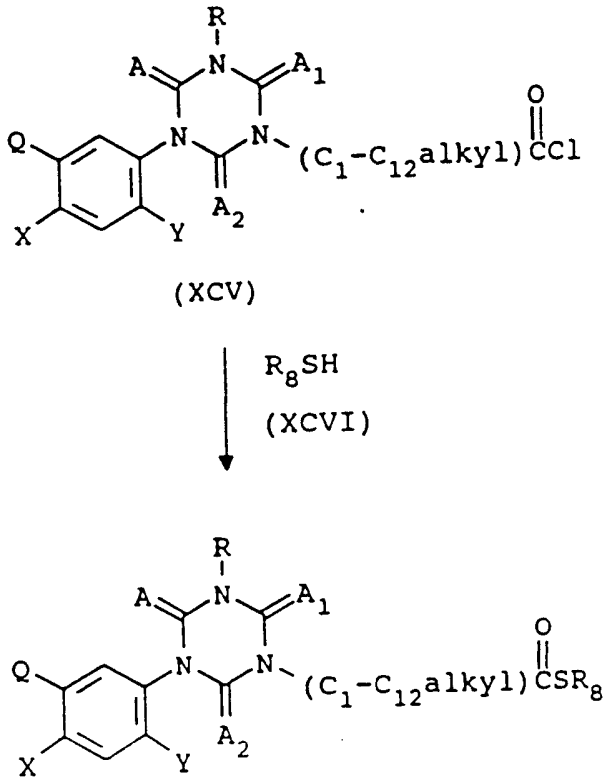
Sloučeniny obecného vzorce I, kde R_1 představuje alkylskupinu s 1 až 12 atomy uhlíku substituovanou skupinou C(O)alkyl s 1 až 4 atomy uhlíku v alkylové části, je možno vyrobit za použití chloridu kyseliny vzorce XCV postupem ilustrovaným ve schematu XLIV.

Schema XLIV



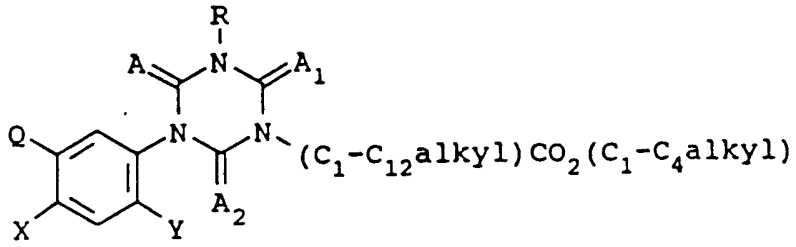
Sloučeniny obecného vzorce I, kde R_3 představuje skupinu vzorce SR_8, je možno vyrobit reakcí chloridu kyseliny vzorce XCV s thiolem vzorce XCVI. Tato reakce je ilustrována ve schematu XLV.

S c h e m a X L V



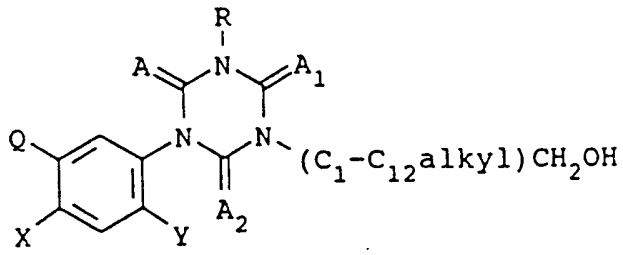
Sloučeniny obecného vzorce I, kde R_1 představuje alkylskupinu s 1 až 12 atomy uhlíku substituovanou jednou skupinou CH_2OR_4, je možno vyrobit redukcí sloučeniny vzorce XCVII na sloučeninu obecného vzorce I, kde R_4 představuje atom vodíku, která se popřípadě nechá reagovat s alkylhalogenidem s 1 až 4 atomy uhlíku za přítomnosti báze. Tato reakční sekvence je ilustrována ve schematu XLVI.

Schema XLVI



(XCVII)

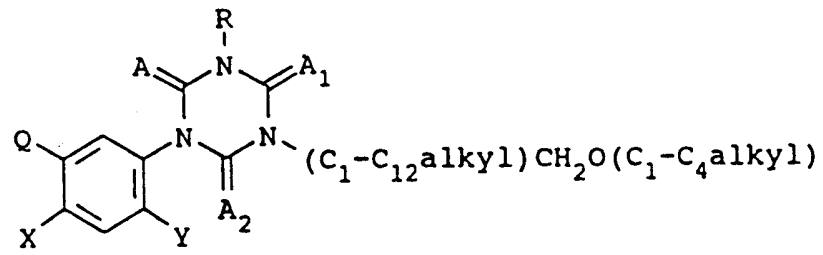
[H]



Báze

$X_1(C_1-C_4alkyl)$

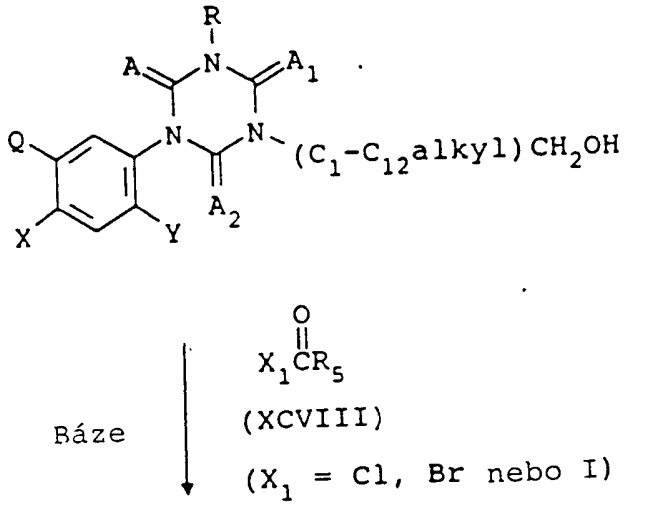
(X_1 = Cl, Br nebo I)



Podobně je možno sloučeniny obecného vzorce I, kde R_1 představuje alkylskupinu s 1 až 12 atomy uhlíku substituovanou jednou skupinou $CH_2OC(O)R_5$, vyrobit reakcí sloučeniny obecného vzorce I, kde R_1 představuje alkylskupinu s 1 až 12 atomy uhlíku substituovanou hydroxymethyl-

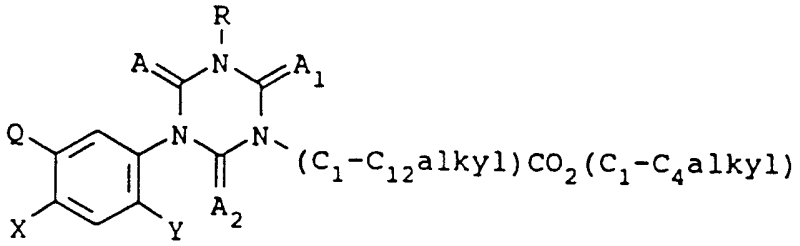
skupinou s acylhalogenidem vzorce XCVII za přítomnosti báze. Tato reakční sekvence je ilustrována ve schematu XLVII.

S c h e m a X L V I I



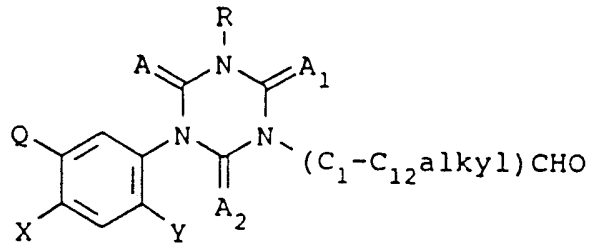
Sloučeniny obecného vzorce I, kde R_1 představuje alkylskupinu s 1 až 12 atomy uhlíku substituovanou jednou skupinou CHO nebo skupinou $CH(OR_6)_2$, je možno vyrobit redukcí sloučeniny vzorce XCVII na aldehyd vzorce XCIX, který se nechá reagovat s alkoholem vzorce C za přítomnosti kyseliny. Tato reakční sekvence je ilustrována ve schematu XLVIII.

Schema XLVIII



(XCVII)

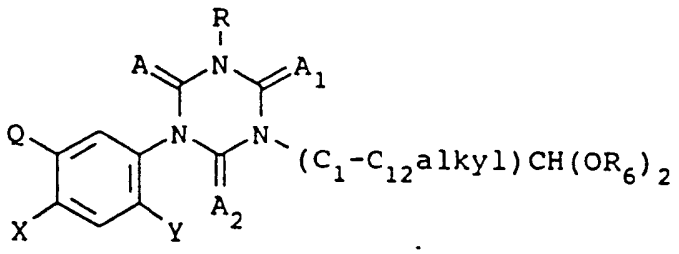
[H]



(XCIX)

Báze

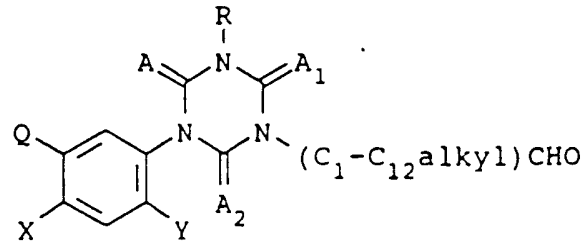
R_6OH
(C)



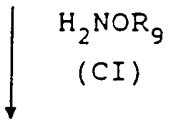
Sloučeniny obecného vzorce I, kde R_1 představuje alkylskupinu s 1 až 12 atomy uhlíku substituovanou jednou skupinou $HC=NOR_9$, je možno vyrobit reakcí aldehydu vzorce

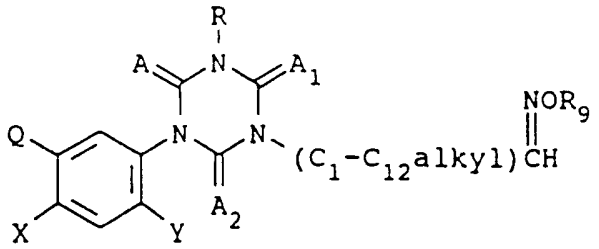
XCIX s aminem vzorce CI. Tato reakční sekvence je ilustrována ve schematu XLIX.

S c h e m a X L I X



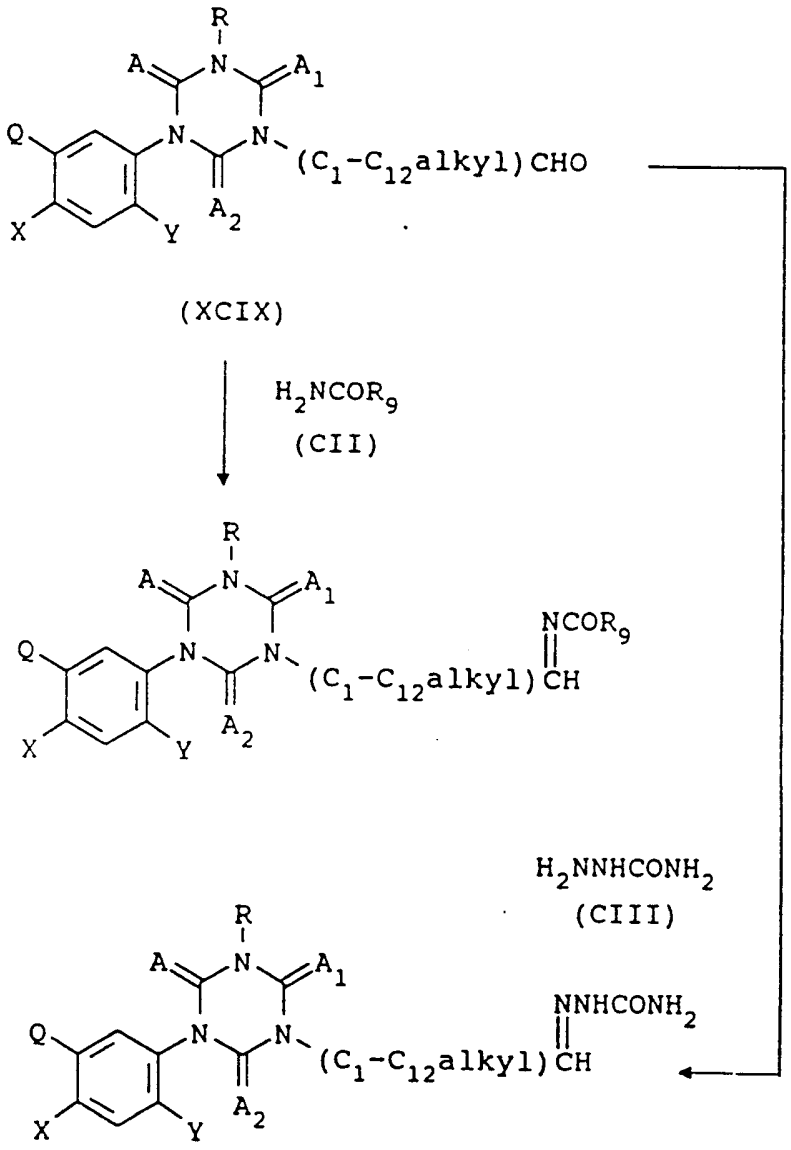
(XCIX)





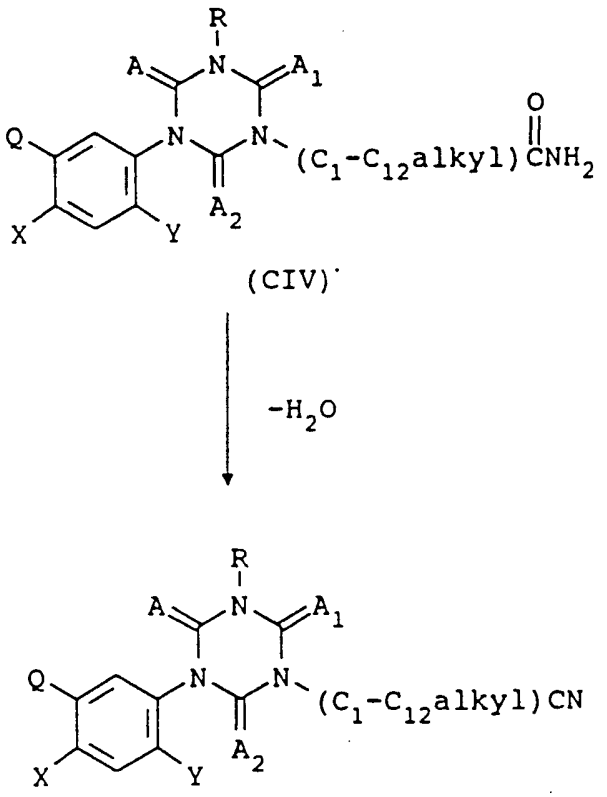
Podobně je sloučeniny obecného vzorce I, kde R_1 představuje alkylskupinu s 1 až 12 atomy uhlíku substituovanou jednou skupinou $HC=NCOR_9$ nebo skupinou $HC=NNHCONH_2$, možno vyrobit reakcí aldehydu vzorce XCIX s aminem vzorce CII nebo hydrazinem vzorce CIII. Tato reakční sekvence je ilustrována ve schematu L.

S c h e m a L



Sloučeniny obecného vzorce I, kde R_1 představuje alkylskupinu s 1 až 12 atomy uhlíku substituovanou kyanoskupinou, je možno vyrobit dehydratací amidu vzorce CIV za standardních podmínek. Tato reakce je ilustrována ve schematu LI.

Schema LI

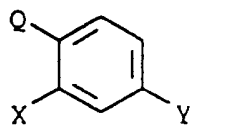


Sloučeniny obecného vzorce I, kde R_8 představuje atom alkalického kovu, kovu alkalických zemin, manganu, mědi, zinku, kobaltu, stříbra, niklu, amonný nebo organoamoniový kation a/nebo R představuje atom alkalického kovu, je možno vyrobit ze sloučenin obecného vzorce I, kde R_3 představuje hydroxyskupinu a/nebo R představuje atom vodíku, obvyklými postupy známými odborníkům v tomto oboru.

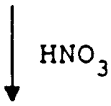
Sloučeniny obecného vzorce I, je rovněž možno vyrobit nitrací heterocyklylfenylové sloučeniny vzorce CV působením kyseliny dusičné. Vzniklá 3-nitro-1-heterocyklylfenylová sloučenina vzorce CVI se za standardních podmínek redukuje na 3-amino-1-heterocyklylfenylovou sloučeninu vzorce CVII, která se nechá reagovat s isokyanátem nebo isothiokyanátem vzorce LXXVIII. Získaná močovina nebo

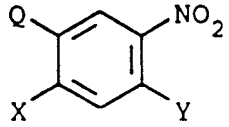
thiomočovina vzorce CVIII se cyklizuje reakcí s isokyanátem nebo isothiokyanátem vzorce LXXX, čímž se získá sloučenina obecného vzorce I, kde R_1 představuje atom vodíku. Tuto sloučeninu je možno alkylovat alkylačním činidlem vzorce V za přítomnosti báze. Tato reakční sekvence je ilustrována ve schematu LII.

S c h e m a L I I

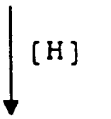


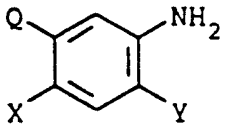
(CV)



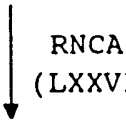


(CVI)

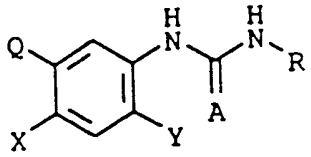




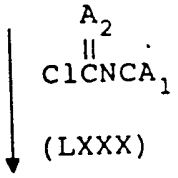
(CVII)



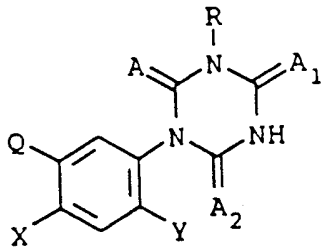
S c h e m a L I I - pokračování



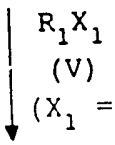
(CVIII)



(LXXX)

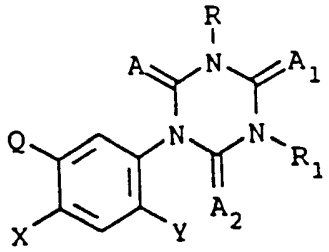


Báze



(V)

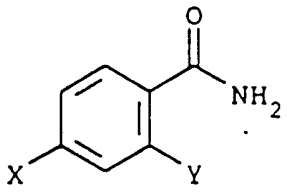
(X_1 = Cl, Br nebo I)



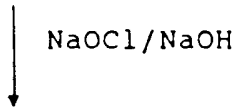
Výchozí sloučeniny vzorce II, kde A, A_1 a A_2 představují atomy kyslíku, je možno vyrobit reakcí amidu vzorce CIX s chlornanem sodným a hydroxidem sodným za vzniku isokyanátu vzorce CX. Isokyanát vzorce CX se nechá reagovat s aminem vzorce CXI na močovinu vzorce CXII, která se cyklizuje působením N-(chlorkarbonyl)isokyanátu na trion vzorce CXIII. Trion vzorce CXIII se nitruje reakcí s

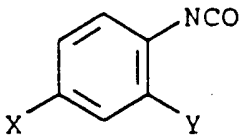
kyselinou dusičnou. Tato reakční sekvence je ilustrována ve schematu LIII.

S c h e m a L I I I

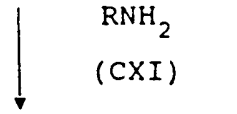


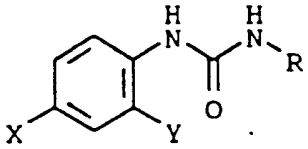
(CIX)



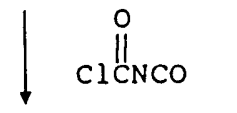


(CX)

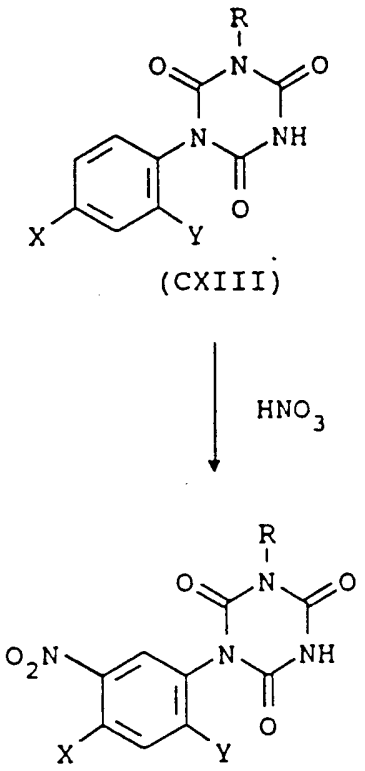




(CXII)

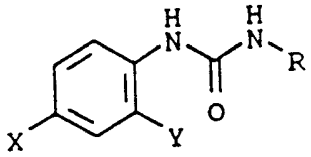


S c h e m a L I I I - pokračování



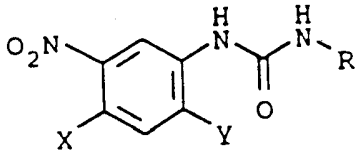
Sloučeniny vzorce II, kde A a A_2 představují atomy kyslíku a A_1 představuje atom síry, je možno vyrobit nitrací močoviny vzorce CXII za vzniku intermediární sloučeniny vzorce CXIV, která se nechá reagovat s isothiokyanátem vzorce CXV. Vzniklá intermediární sloučenina vzorce CXVI se cyklizuje působením báze. Tato reakční sekvence je ilustrována ve schematu LIV.

Schema LIV



(CXII)

HNO_3

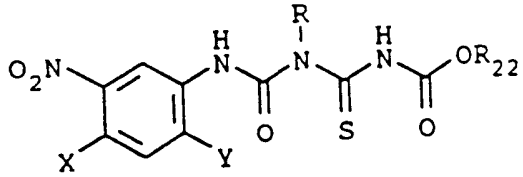


(CXIV)

$R_{22}OCNCS$

(CXV)

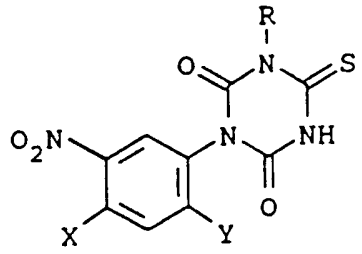
(R_{22} = C_1-C_4alkyl)



(CXVI)

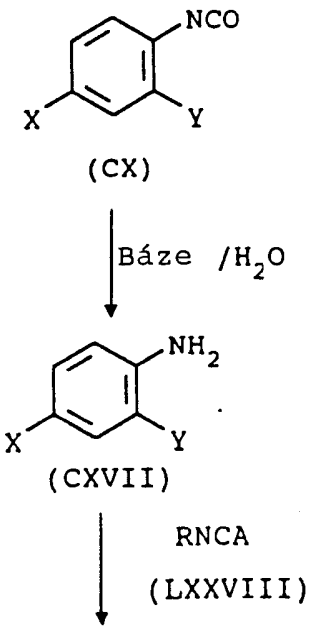
Báze

S c h e m a L I V - pokračování

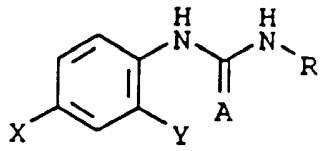


Sloučeniny obecného vzorce II, kde A představuje atom kyslíku nebo síry, A_1 představuje atom síry a A_2 představuje atom kyslíku, je možno vyrobit reakcí isokyanátu vzorce CX s vodnou bází za vzniku aminu vzorce CXVII. Amin vzorce CXVII se nechá reagovat s isokyanátem nebo isothiokyanátem vzorce LXXVIII na močovinu vzorce CXVIII, která se nitruje za vzniku intermediární sloučeninu vzorce CXIX. Tato intermediární sloučenina se nechá reagovat s isothiokyanátem vzorce CXV na intermediární sloučeninu vzorce CXX, která se působením báze cyklizuje. Tato reakční sekvence je ilustrována ve schematu LV.

S c h e m a L V

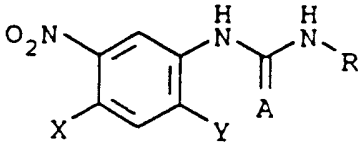


S c h e m a L V - pokračování



(CXVIII)

HNO_3

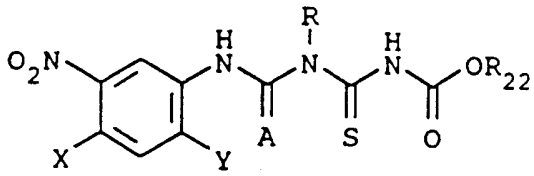


(CXIX)

$R_{22}OCNCS$

(CXV)

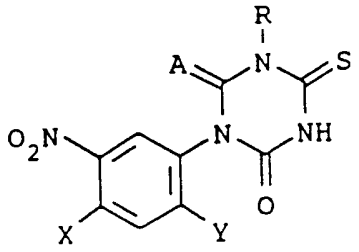
(R_{22} = C_1-C_4alkyl)



(CXX)

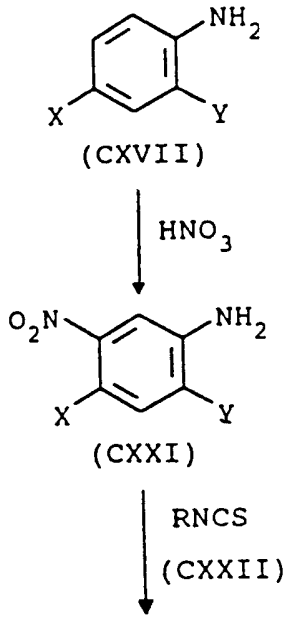
Báze

S c h e m a L V - pokračování

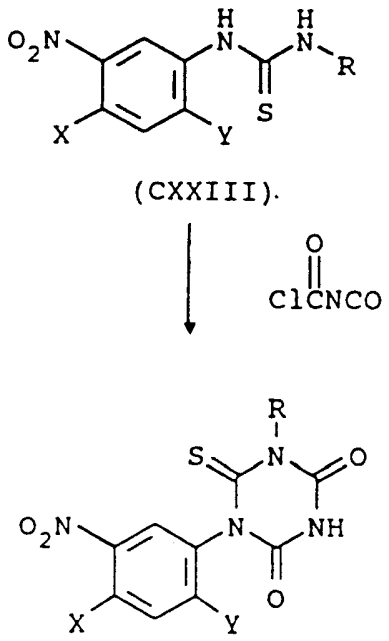


Sloučeniny vzorce II, kde A představuje atom síry a A_1 a A_2 představují atomy kyslíku, je možno vyrobit nitrací aminu vzorce CXVII za vzniku 3-nitroanilinu vzorce CXXI. 3-nitroanilin vzorce CXXI se nechá reagovat s isothiokyanátem vzorce CXXII na thiomočovinu vzorce CXXIII, která se cyklizuje reakcí s N-(chlorkarbonyl)isokyanátem. Tato reakční sekvence je ilustrována ve schematu LVI.

S c h e m a L V I

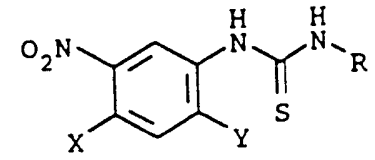


S c h e m a L V I - pokračování



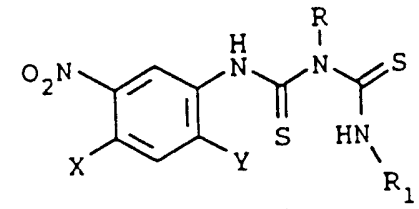
Sloučeniny vzorce VI, kde A a A_1 představují atomy síry a A_2 představuje atom kyslíku nebo síry, je možno vyrobit reakcí thiomočoviny vzorce CXXIII s isothiokyanátem vzorce CXXIV za vzniku intermediární sloučeniny vzorce CXXV, která se cyklizuje reakcí s fosgenem nebo thiofosgenem. Tato reakční sekvence je ilustrována ve schematu LVII.

Schema LVII



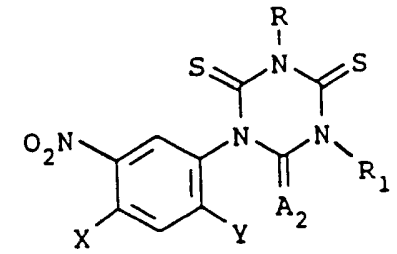
(CXXIII)

R_1NCS
(CXXIV)



(CXXV)

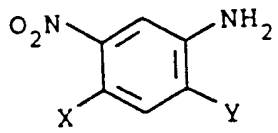
$C(A_2)Cl_2$



Sloučeniny vzorce VI, kde A a A_1 představuje každý nezávisle atom kyslíku nebo síry a A_2 představuje atom síry, je možno vyrobit reakcí aminu vzorce CXXI s isothiokyanátem

vzorce CXXIV za vzniku thiomočoviny vzorce CXXVI. Thiomočovina vzorce CXXVI se nechá reagovat s isokyanátem nebo isothiokyanátem vzorce CXXVII na intermediární sloučeninu vzorce CXXVIII, která se cyklizuje reakcí s fosgenem nebo thiofosgenem. Tato reakční sekvence je ilustrována ve schematu LVIII.

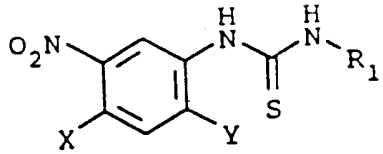
S c h e m a L V I I I



(CXXI)

R_1NCS

(CXXIV)

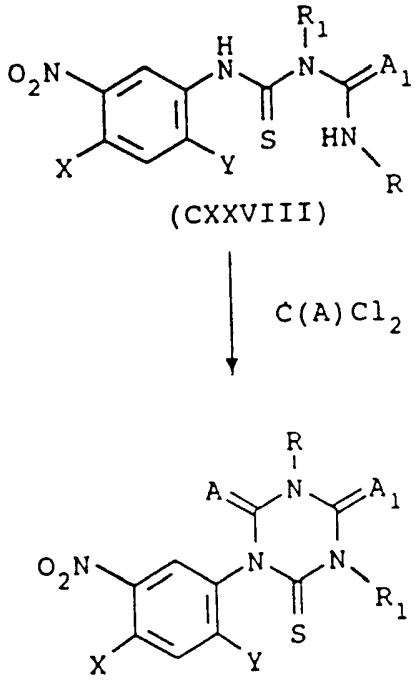


(CXXVI)

$RNCA_1$

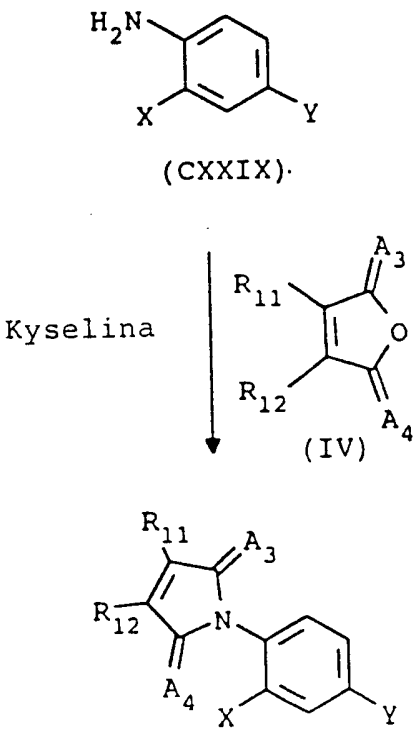
(CXXVII)

S c h e m a L V I I I - pokračování



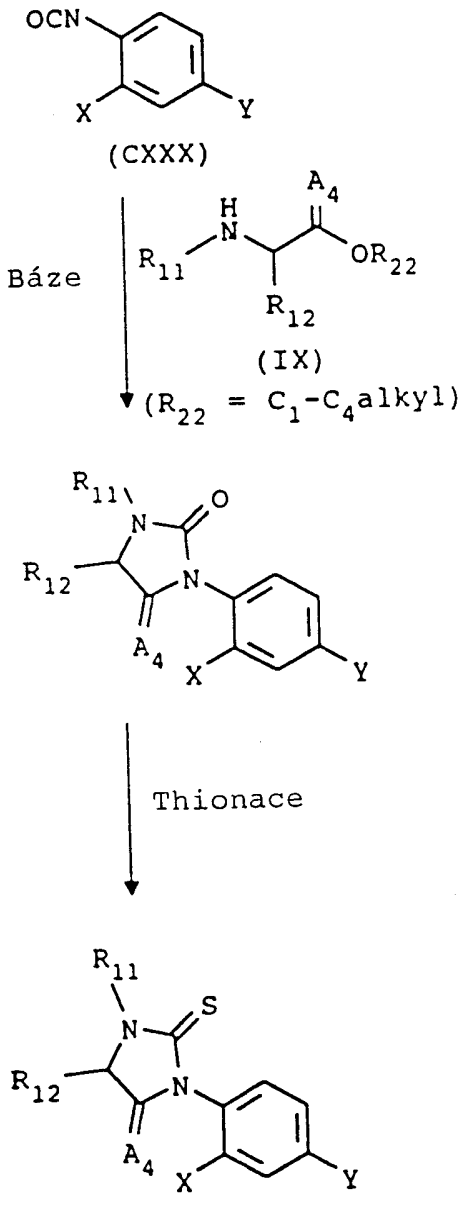
Výchozí sloučeninu vzorce CV, kde Q představuje skupinu vzorce Q1, je možno vyrobit reakcí anilinu vzorce CXXIX s anhydridem vzorce IV za přítomnosti kyseliny, jako kyseliny octové. Tato reakce je ilustrována ve schematu LIX.

Schema LIX



Sloučeniny vzorce CV, kde Q představuje skupinu vzorce Q2 a Z představuje skupinu CH, je možno vyrobit reakcí isokyanátu vzorce CXXX s aminoesterem vzorce IX za přítomnosti báze a případnou thionací vzniklé sloučeniny thionačním činidlem, jako je Lawessonovo reakční činidlo nebo sulfidem fosforečným P_4S_{10}. Tato reakce je ilustrována ve schematu LX.

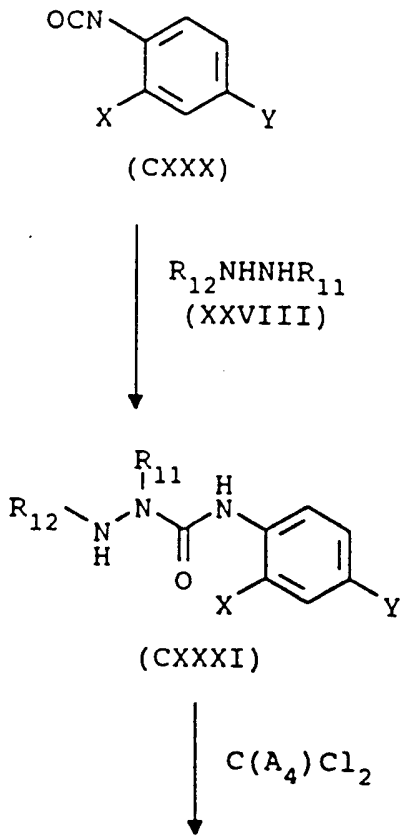
Schema LX



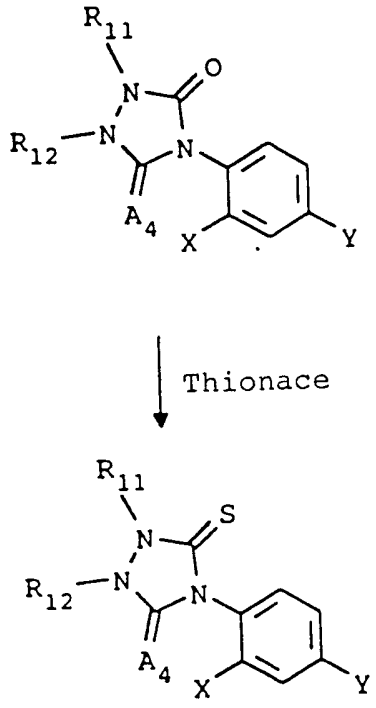
Výchozí sloučeniny vzorce CV, kde Q představuje skupinu vzorce Q2 a Z představuje atom dusíku, je možno vyrobit reakcí isokyanátu vzorce CXXX se substituovaným

hydrazinem vzorce XXVIII za vzniku intermediární sloučeniny vzorce CXXXI. Intermediární sloučenina vzorce CXXXI se nechá reagovat s fosgenem nebo thiofosgenem a vzniklá sloučenina vzorce CV, kde Q představuje skupinu vzorce Q2, Z představuje atom dusíku a A_3 představuje atom kyslíku, se popřípadě podrobí thionaci. Tato reakční sekvence je ilustrována ve schematu LXI.

S c h e m a L X I

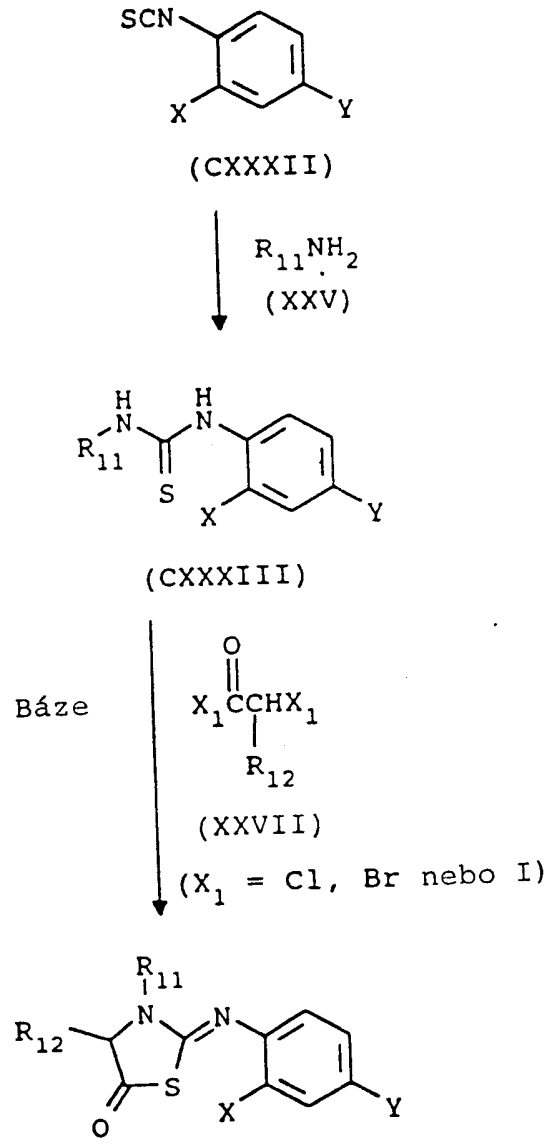


S c h e m a L X I - pokračování



Sloučeniny obecného vzorce CV, kde Q představuje skupinu vzorce Q11, A_3 představuje atom síry, A_4 představuje atom kyslíku a Z představuje skupinu CH, je možno vyrobit reakcí isothiokyanátu vzorce CXXXII s aminem vzorce XXV za vzniku thiomočoviny vzorce CXXXIII, která se za přítomnosti báze nechá reagovat s α-halogenkarbonylhalogenidem vzorce XXVII. Tato reakční sekvence je ilustrována ve schematu LXII.

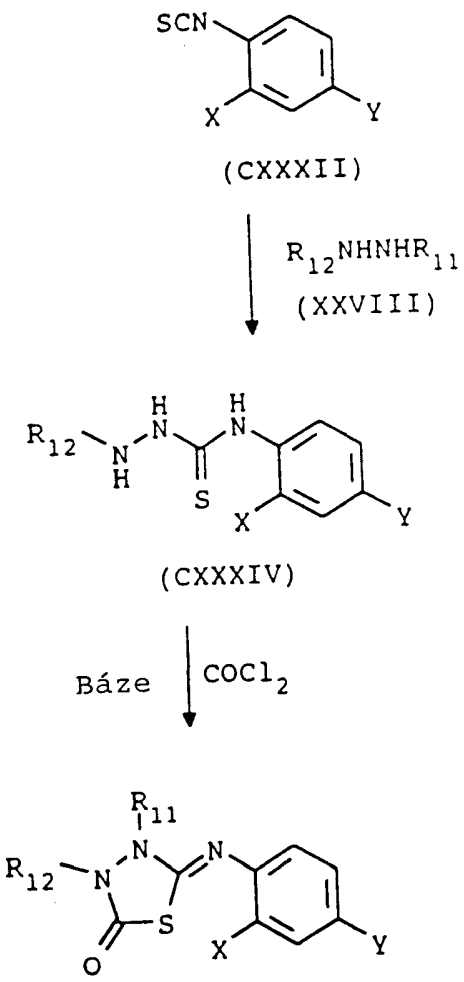
S c h e m a L X I I



Výchozí sloučeniny vzorce CV, kde Q představuje skupinu vzorce Q11, A_3 představuje atom síry, A_4 představuje atom kyslíku a Z představuje atom dusíku, je možno vyrobit reakcí isothiokyanátu vzorce CXXXII se substituovaným hydrazinem vzorce XXVIII za vzniku intermediární sloučeniny vzorce CXXXIV. Intermediární sloučenina vzorce CXXXIV se nechá reagovat s fosgenem nebo vhodným ekvivalentem

fosgenu za přítomnosti báze, jako je triethylamin. Tato reakční sekvence je ilustrována ve schematu LXIII.

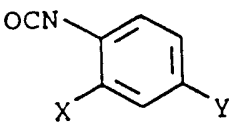
S c h e m a L X I I I



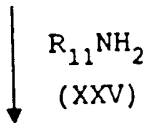
Sloučeniny vzorce CV, kde Q představuje skupinu vzorce Q11, A_3 a A_4 představují atomy kyslíku a Z představuje skupinu CH, je možno vyrobit reakcí isokyanátu vzorce CXXX s aminem vzorce XXV za vzniku močoviny vzorce CXXXV,

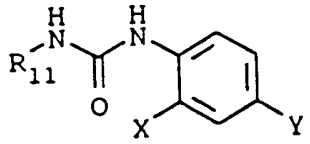
která se dehydratuje na karbodiimid vzorce CXXXVI. Karbodiimid vzorce CXXXVI se nechá reagovat s α-halogenkarbonylhalogenidem vzorce XXVII na halogenamidin vzorce CXXXVII, který se hydrolyzuje působením vodné kyseliny za vzniku acylmočoviny. Acylmočovina se in situ zahřívá, čímž vznikne O-acylmočovina vzorce CXXXVIII, která se nechá reagovat s bází, jako triethylaminem. Tato reakční sekvence je ilustrována ve schematu LXIV.

S c h e m a L X I V

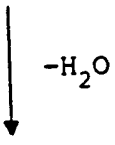


(CXXX)

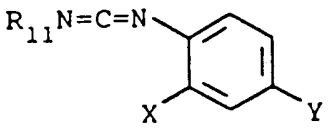




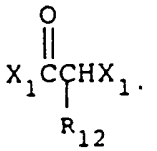
(CXXXV)



S c h e m a L X I V - pokračování

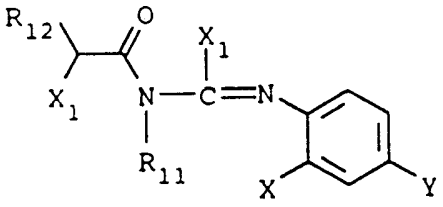


(CXXXVI)



(XXVII)

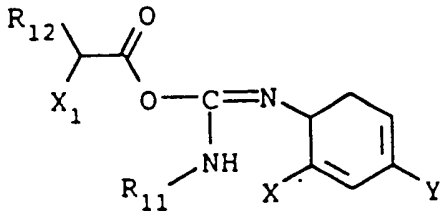
(X_1 = Cl, Br nebo I)



(CXXXVII)

1) H_3O^+

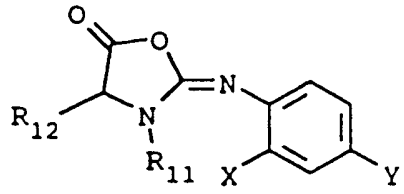
2) Δ



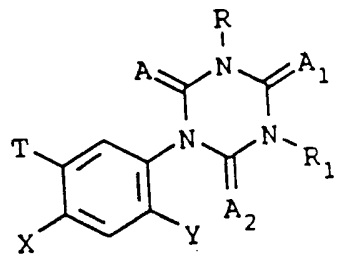
(CXXXVIII)

Báze

S c h e m a L X I V - pokračování



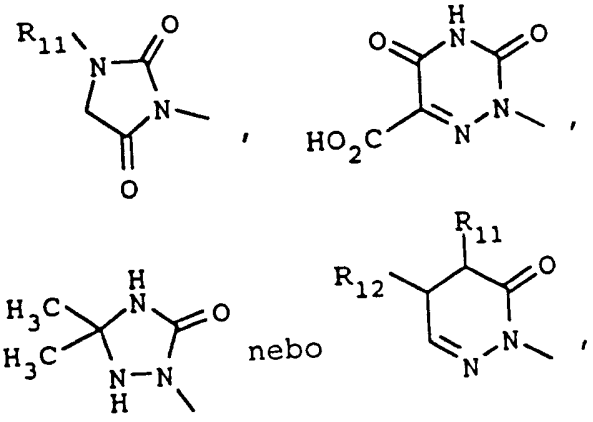
Předmětem vynálezu jsou rovněž intermediární sloučeniny, které jsou užitečné pro přípravu sloučenin obecného vzorce I. Struktura těchto intermediárních sloučenin odpovídá obecnému vzorci CXXXIX



(CXXXIX)

kde

T přestavuje skupinu vzorce $-NH_2$, -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 atomy uhlíku), $-C(O)CH_2C(O)R_{11}$, $-C(O)CH_2C(A_3)O$(alkyl s 1 až 4 atomy uhlíku), $-CO_2$(alkyl s 1 až 4 atomy uhlíku), $-N=C=NR_{11}$, $-NHC(O)NHR_{11}$, $-NHC(S)NR_{11}HNR_{12}$, $-N=C(SCH_3)NHR_{11}$, $-NHCO_2$(alkyl s 1 až 4 atomy uhlíku), -C(Cl)=NOH,



X a Y představuje každý nezávisle atom vodíku, atom halogenu, nitroskupinu, kyanoskupinu, alkylskupinu s 1 až 4 atomy uhlíku, halogenalkylskupinu s 1 až 4 atomy uhlíku, alkoxyskupinu s 1 až 4 atomy uhlíku, halogenalkoxyskupinu s 1 až 4 atomy uhlíku nebo skupinu vzorce $S(O)_mR_2$;

m představuje celé číslo 0, 1 nebo 2;

R_2 představuje alkylskupinu s 1 až 4 atomy uhlíku nebo halogenalkylskupinu s 1 až 4 atomy uhlíku;

R představuje atom vodíku, alkylskupinu s 1 až 6 atomy uhlíku, alkoxyalkylskupinu se 2 až 12 atomy uhlíku, alkylkarbonylalkylskupinu se 3 až 12 atomy uhlíku, halogenalkylkarbonylalkylskupinu se 3 až 12 atomy uhlíku, alkoxykarbonylalkylskupinu se 3 až 12 atomy uhlíku, halogenalkoxykarbonylalkylskupinu se 3 až 12 atomy uhlíku, alkenylskupinu se 3 až 6 atomy uhlíku, alkinylskupinu se 3 až 6 atomy uhlíku,

fenylskupinu, která je popřípadě substituována jedním až třemi substituenty zvolenými ze souboru zahrnujícího atom halogenu, alkylskupinu s 1 až 4 atomy uhlíku, alkoxyskupinu s 1 až 4 atomy uhlíku a halogenalkoxyskupinu s 1 až 4 atomy uhlíku, nebo

benzylskupinu, která je popřípadě substituována jedním až třemi substituenty zvolenými ze souboru zahrnujícího atom halogenu, alkylskupinu s 1 až 4 atomy uhlíku, alkoxyskupinu s 1 až 4 atomy uhlíku a halogenalkoxyskupinu s 1 až 4 atomy uhlíku;

R_1 představuje atom vodíku, alkenylskupinu se 3 až 6 atomy uhlíku, alkinylskupinu se 3 až 6 atomy uhlíku, kyanoskupinu,

alkylskupinu s 1 až 12 atomy uhlíku, která je popřípadě substituována jedním nebo více atomy halogenu nebo jedním substituentem zvoleným ze souboru zahrnujícího kyanoskupinu, skupinu vzorce $C(O)R_3$, $OC(O)R_5$, $CH_2OC(O)R_5$, OR_4, CH_2OR_4 a $CR_6(OR_7)_2$ nebo jednou fenylskupinou, která je popřípadě substituována jedním až třemi substituenty zvolenými ze souboru zahrnujícího atom halogenu, alkylskupinu s 1 až 4 atomy uhlíku, alkoxyskupinu s 1 až 4 atomy uhlíku a halogenalkoxyskupinu s 1 až 4 atomy uhlíku, nebo

fenylskupinu, která je popřípadě substituována jedním až třemi substituenty zvolenými ze souboru zahrnujícího atom halogenu, alkylskupinu s 1 až 4 atomy uhlíku, alkoxyskupinu s 1 až 4 atomy uhlíku a halogenalkoxyskupinu s 1 až 4 atomy uhlíku;

R_3 představuje skupinu vzorce OR_8, SR_8 nebo NR_9R_{10};

R_4, R_5 a R_6 představuje každý nezávisle atom vodíku, alkylskupinu s 1 až 4 atomy uhlíku nebo halogenalkylskupinu s 1 až 4 atomy uhlíku;

R_7 představuje alkylskupinu s 1 až 4 atomy uhlíku;

R_8 představuje

alkylskupinu s 1 až 6 atomy uhlíku, která je popřípadě substituována substituentem zvoleným ze souboru zahrnujícího alkoxyskupinu s 1 až 4 atomy uhlíku, alkylthioskupinu s 1 až 4 atomy uhlíku, atom halogenu, hydroxyskupinu, cykloalkylskupinu se 3 až 6 atomy uhlíku, furylskupinu a fenylskupinu, která je popřípadě substituována jedním nebo více substituenty zvolenými ze souboru zahrnujícího atom halogenu, kyanoskupinu, nitroskupinu, alkylskupinu s 1 až 4 atomy uhlíku, halogenalkylskupinu s 1 až 4 atomy uhlíku, alkoxyskupinu s 1 až 4 atomy uhlíku a halogenalkoxyskupinu s 1 až 4 atomy uhlíku,

alkenylskupinu se 3 až 6 atomy uhlíku, která je popřípadě substituována substituentem zvoleným ze souboru zahrnujícího alkoxyskupinu s 1 až 4 atomy uhlíku, atom halogenu, cykloalkylskupinu se 3 až 6 atomy uhlíku a fenylskupinu, která je popřípadě substituována jedním nebo více substituenty zvolenými ze souboru zahrnujícího atom halogenu, kyanoskupinu, nitroskupinu, alkylskupinu s 1 až 4 atomy uhlíku, halogenalkylskupinu s 1 až 4 atomy uhlíku, alkoxyskupinu s 1 až 4 atomy uhlíku a halogenalkoxyskupinu s 1 až 4 atomy uhlíku,

alkinylskupinu se 3 až 6 atomy uhlíku, která je popřípadě substituována alkoxyskupinou s 1 až 4 atomy uhlíku nebo atomem halogenu; nebo

cykloalkylskupinu se 3 až 6 atomy uhlíku;

R_9 a R_{10} představuje každý nezávisle vždy atom vodíku, alkylskupinu s 1 až 6 atomy uhlíku,

benzylskupinu, která je popřípadě substituována jedním nebo více substituenty zvolenými ze souboru zahrnujícího atom halogenu, kyanoskupinu, nitroskupinu, alkylskupinu s 1 až 4 atomy uhlíku, halogenalkylskupinu s 1 až 4 atomy uhlíku, alkoxyskupinu s 1 až 4 atomy uhlíku a halogenalkoxyskupinu s 1 až 4 atomy uhlíku, nebo

fenylskupinu, která je popřípadě substituována jedním nebo více substituenty zvolenými ze souboru zahrnujícího atom halogenu, kyanoskupinu, nitroskupinu, alkylskupinu s 1 až 4 atomy uhlíku, halogenalkylskupinu s 1 až 4 atomy uhlíku, alkoxyskupinu s 1 až 4 atomy uhlíku a halogenalkoxyskupinu s 1 až 4 atomy uhlíku;

R_{11} a R_{12} představuje nezávisle vždy

atom vodíku,

alkylskupinu s 1 až 6 atomy uhlíku, která je popřípadě substituována jedním nebo více atomy halogenu, nebo

cykloalkylskupinu se 3 až 6 atomy uhlíku, která je popřípadě substituována jedním nebo více atomy halogenu, a dále

R_{11} a R_{12} dohromady s atomy, k nimž jsou připojeny, představují čtyř- až sedmičlenný nasycený nebo nenasycený kruh, který je popřípadě přerušen atomem kyslíku, $S(O)_r$ nebo atomem dusíku a který je popřípadě substituován jednou až třemi methylskupinami nebo jedním nebo více atomy halogenu;

R_{13} představuje atom vodíku, alkylskupinu s 1 až 3 atomy uhlíku nebo halogenalkylskupinu s 1 až 3 atomy uhlíku;

A, A_1, A_2 a A_3 představuje nezávisle vždy atom kyslíku nebo síry; a

r představuje celé číslo 0, 1 nebo 2.

Přednost se dává intermediárním sloučeninám vzorce CXXXIX, kde

T představuje skupinu $-NH_2$, -NCO, -NCS, $-N_3$, $-NHNH_2$, $-NHC(S)NHR_{11}$, $-NHC(O)NHR_{11}$, $-NHC(S)NR_{11}NHR_{12}$ nebo $-N=C=NR_{11}$;

X představuje atom vodíku nebo halogenu;

Y představuje atom vodíku, atom halogenu, nitroskupinu nebo kyanoskupinu;

R představuje atom vodíku, alkylskupinu s 1 až 4 atomy uhlíku, alkoxymethylskupinu s 1 až 4 atomy uhlíku v alkoxylové části, alkoxykarbonylmethylskupinu s 1 až 4 atomy uhlíku v alkoxylové části, alkenylskupinu se 3 až 6 atomy uhlíku nebo alkinylskupinu se 3 až 6 atomy uhlíku;

R_1 představuje atom vodíku, alkenylskupinu se 3 až 6 atomy uhlíku, alkinylskupinu se 3 až 6 atomy uhlíku nebo alkylskupinu s 1 až 6 atomy uhlíku, která je popřípadě substituována jednou skupinou CO_2R_8;

R_8 představuje alkylskupinu s 1 až 6 atomy uhlíku;

R_{11} a R_{12} představuje nezávisle vždy atom vodíku nebo alkylskupinu s 1 až 4 atomy uhlíku, nebo R_{11} a R_{12} dohromady s atomy, k nimž jsou připojeny, tvoří kruh, v němž seskupení $R_{11}R_{12}$ představuje alkylenskupinu se 2 až 5 atomy uhlíku, která je popřípadě přerušena zbytkem $S(O)_r$ a která je popřípadě substituována jednou až třemi methylskupinami nebo jedním nebo více atomy halogenu;

A, A_1 a A_2 představuje každý atom kyslíku; a

r představuje celé číslo 0, 1 nebo 2.

Větší přednost se dává intermediárním sloučeninám podle vynálezu obecného vzorce CXXXIX,

kde

T představuje skupinu $-NH_2$, -NCO, -NCS, $-NHC(S)NHR_{11}$ nebo $-NHC(O)NHR_{11}$;

X a Y představuje každý nezávisle atom vodíku, fluoru nebo chloru;

R představuje atom vodíku, alkylskupinu s 1 až 4 atomy uhlíku, alkoxymethylskupinu s 1 až 4 atomy uhlíku v alkoxylové části, alkoxykarbonylmethylskupinu s 1 až 4 atomy uhlíku v alkoxylové části, allylskupinu nebo propargylskupinu;

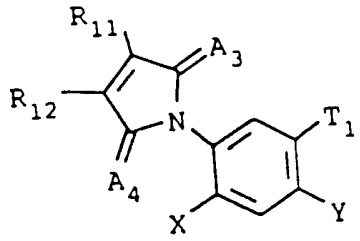
R_1 představuje atom vodíku, allylskupinu, propargylskupinu nebo alkylskupinu s 1 až 4 atomy uhlíku, která je popřípadě substituována jednou skupinou CO_2R_8;

R_8 představuje alkylskupinu s 1 až 4 atomy uhlíku;

R_{11} představuje atom vodíku nebo alkylskupinu s 1 až 4 atomy uhlíku; a

A, A_1 a A_2 představuje každý atom kyslíku.

Předmětem vynálezu jsou také intermediární sloučeniny obecného vzorce CXL



(CXL)

kde

T_1 představuje skupinu NO_2, NH_2 nebo -NHC(A)NHR;

A, A_3 a A_4 představuje každý nezávisle atom kyslíku nebo síry;

X a Y představuje každý nezávisle atom vodíku, atom halogenu, nitroskupinu, kyanoskupinu, alkylskupinu s 1 až 4 atomy uhlíku, halogenalkylskupinu s 1 až 4 atomy uhlíku, alkoxyskupinu s 1 až 4 atomy uhlíku, halogenalkoxyskupinu s 1 až 4 atomy uhlíku nebo skupinu vzorce $S(O)_mR_2$;

m představuje celé číslo 0, 1 nebo 2;

R_2 představuje alkylskupinu s 1 až 4 atomy uhlíku nebo halogenalkylskupinu s 1 až 4 atomy uhlíku;

R představuje atom vodíku, alkylskupinu s 1 až 6 atomy uhlíku, alkoxyalkylskupinu se 2 až 12 atomy uhlíku, alkylkarbonylalkylskupinu se 3 až 12 atomy uhlíku, halogenalkylkarbonylalkylskupinu se 3 až 12 atomy uhlíku, alkoxykarbonylalkylskupinu se 3 až 12 atomy uhlíku, halogenalkoxykarbonylalkylskupinu se 3 až 12 atomy uhlíku, alkenylskupinu se 3 až 6 atomy uhlíku, alkinylskupinu se 3 až 6 atomy uhlíku,

fenylskupinu, která je popřípadě substituována jedním až třemi substituenty zvolenými ze souboru zahrnujícího atom halogenu, alkylskupinu s 1 až 4 atomy uhlíku, alkoxyskupinu s 1 až 4 atomy uhlíku a halogenalkoxyskupinu s 1 až 4 atomy uhlíku, nebo

benzylskupinu, která je popřípadě substituována jedním až třemi substituenty zvolenými ze souboru zahrnujícího atom halogenu, alkylskupinu s 1 až 4 atomy uhlíku, alkoxyskupinu s 1 až 4 atomy uhlíku a halogenalkoxyskupinu s 1 až 4 atomy uhlíku;

R_{11} a R_{12} představuje nezávisle vždy

atom vodíku,

alkylskupinu s 1 až 6 atomy uhlíku, která je popřípadě substituována jedním nebo více atomy halogenu, nebo

cykloalkylskupinu se 3 až 6 atomy uhlíku, která je popřípadě substituována jedním nebo více atomy halogenu, a dále též

R_{11} a R_{12} dohromady s atomy, k nimž jsou připojeny, představují čtyř- až sedmičlenný nasycený nebo nenasycený kruh, který je popřípadě přerušen atomem kyslíku, $S(O)_r$ nebo atomem dusíku a který je popřípadě substituován jednou až třemi methylskupinami nebo jedním nebo více atomy halogenu; a

r představuje celé číslo 0, 1 nebo 2.

Přednost se dává intermediárním sloučeninám obecného vzorce CXL, kde

T_1 představuje skupinu NO_2, NH_2 nebo -NHC(O)NHR;

A_3 a A_4 představuje každý atom kyslíku;

X a Y představuje každý nezávisle atom vodíku nebo atom halogenu;

R představuje alkylskupinu s 1 až 6 atomy uhlíku, alkenylskupinu se 3 až 6 atomy uhlíku nebo alkinylskupinu se 3 až 6 atomy uhlíku;

R_{11} a R_{12} dohromady s atomy, k nimž jsou připojeny, tvoří kruh, v němž seskupení $R_{11}R_{12}$ představuje alkylenskupinu se 2 až 5 atomy uhlíku, která je popřípadě přerušena zbytkem $S(O)_r$ a která je popřípadě substituována jednou až třemi methylskupinami nebo jedním nebo více atomy halogenu, nebo $R_{11}R_{12}$ představuje skupinu $-CR_{18}=CR_{19}-CR_{20}=CR_{21}-$, kde R_{18}, R_{19}, R_{20} a R_{21} představuje každý nezávisle atom vodíku, atom halogenu nebo methylskupinu; a

r představuje celé číslo 0, 1 nebo 2.

Větší přednost se dává intermediárním sloučeninám obecného vzorce CXL, kde

T_1 představuje skupinu NO_2, NH_2 nebo -NHC(O)NHR;

A_3 a A_4 představuje každý atom kyslíku;

X představuje atom fluoru nebo chloru;

Y představuje atom chloru;

R představuje alkylskupinu s 1 až 4 atomy uhlíku, allylskupinu nebo propargylskupinu; a

R_{11} a R_{12} dohromady s atomy, k nimž jsou připojeny, tvoří kruh, v němž seskupení $R_{11}R_{12}$ představuje butylenskupinu, která je popřípadě substituována jednou až třemi methylskupinami.

Sloučeniny obecného vzorce I podle tohoto vynálezu jsou účinnými herbicidními činidly, která jsou užitečná pro potlačování celé řady nežádoucích druhů rostlin. Tyto sloučeniny jsou účinné pro potlačování plevelných rostlin jak v suché, tak zamokřené půdě. Jsou také užitečné jako vodní herbicidy. Sloučeniny podle vynálezu se mohou aplikovat na listy, půdu nebo do vody obsahující semena nebo jiné propagační orgány nežádoucích druhů rostlin, jako jsou odnože, hlízy nebo rhizomy, v dávce v rozmezí asi od 0,016 do asi 4,0 kg/ha a přednostně od asi 0,032 do asi 2,0 kg/ha.

Sloučeniny podle vynálezu obecného vzorce I se nejlépe hodí pro použití jako širokospektrální herbicidy, zejména při postemergentní aplikaci na místo, na němž se má potlačení plevele dosáhnout. Určité sloučeniny podle vynálezu jsou však selektivní. Některé z nich jsou například

selektivní při aplikaci v kulturách takových plodin, jako je soja, rýže a kukuřice.

Sloučeniny podle vynálezu sice účinně potlačují nežádoucí druhy rostlin, i když se jich používá samotných, ale mohou se také při použití kombinovat s jinými biologickými chemikáliemi, včetně jiných herbicidů.

Sloučeniny obecného vzorce I podle tohoto vynálezu je možno aplikovat na plodiny v podobě pevného nebo kapalného herbicidního prostředku obsahujícího herbicidně účinné množství sloučeniny obecného vzorce I, které je dispergováno nebo rozpuštěno v inertním pevném nebo kapalném agronomicky vhodném nosiči. Prostředky podle vynálezu je možno aplikovat preemergentně nebo postemergentně.

S výhodou je možno sloučeniny obecného vzorce I zpracovávat na emulgovatelné koncentráty, smáčitelné prášky, granulární prostředky, tekuté koncentráty apod.

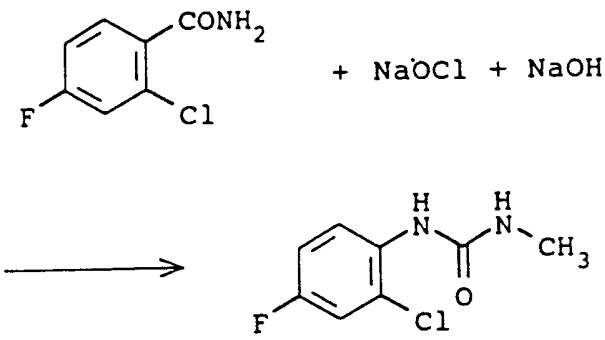
Vynález je blíže objasněn v následujících příkladech provedení. Tyto příklady mají výhradně ilustrativní význam a v žádném ohledu rozsah vynálezu neomezují. Pro rozsah ochrany jsou rozhodující připojené patentové nároky.

Zkratkou NMR se označuje nukleární magnetická resonanční spektroskopie.

Příklady provedení vynálezu

P ř í k l a d 1

Příprava 1-(2-chlor-4-fluorfenyl)-3-methylmočoviny

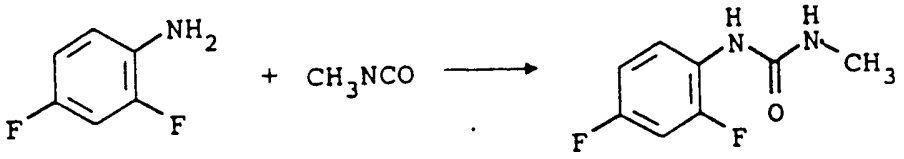


Směs 50% roztoku hydroxidu sodného (28 g, 0,35 mol) a 5% roztoku chlornanu sodného (226 ml) se při 0°C přidá ke směsi 2'-chlor-4'-fluorbenzamidu (50 g, 0,288 mol) v methanolu. Po dokončení přídavku se ke směsi při 0°C přidá 55 ml 40% roztoku methylaminu. Výsledná reakční směs se 6 hodin za míchání zahřívá na 55°C, ochladí na teplotu místnosti a přefiltruje. Získaná pevná látka se promyje postupně vodou a hexany a vysuší na vzduchu. Získá se sloučenina uvedená v nadpisu ve formě bílé pevné látky (30 g) o teplotě tání 174 až 178°C.

V podstatě stejným postupem, ale za použití 2',4'-dichlorbenzamidu namísto 2'-chlor-4'-fluorbenzamidu, se získá 1-(2,4-dichlorfenyl)-3-methylmočovina ve formě béžové pevné látky.

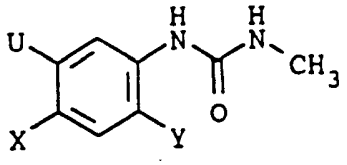
P ř í k l a d 2

Příprava 1-(2,4-difluorfenyl)-3-methylmočoviny



Methylisokyanát (9,6 g, 10 ml, 0,174 mol) se přidá k roztoku 2,4-difluoranilinu (15 g, 0,116 mol) v toluenu. Reakční směs se míchá 1 hodinu a poté se z ní filtrací oddělí pevná látka. Tato pevná látka se promyje hexany a vysuší na vzduchu. Získá se sloučenina uvedená v nadpisu ve formě špinavě bílé pevné látky o teplotě tání 182 až 183°C.

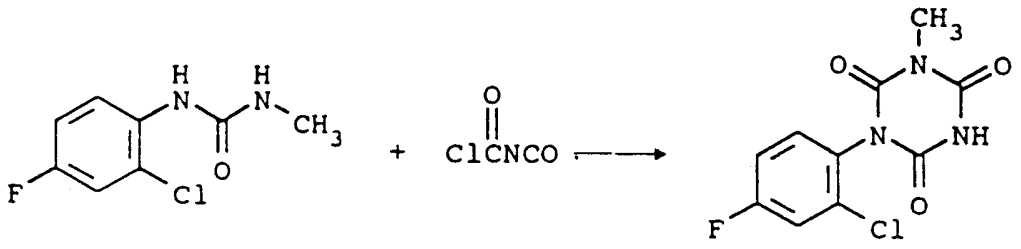
V podstatě stejným způsobem, ale za použití vhodně substituovaného anilinu, se vyrobí následující sloučeniny:



U	X	Y	t.t. (°C)
NO_2	H	F	229-232
H	F	Cl	-

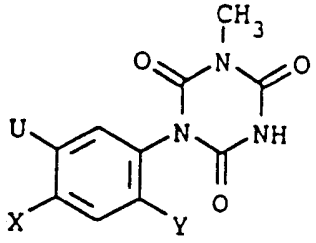
P ř í k l a d 3

Příprava 1-(2-chlor-4-fluorfenyl)-3-methyl-s-triazin-2,4,6-(1H,3H,5H)-trionu



N-(Chlorkarbonyl)isokyanát (18,97 g, 0,180 mol) se přidá ke směsi 1-(2-chlor-4-fluorfenyl)-3-methylmočoviny (29,2 g, 0,144 mol) v toluenu. Reakční směs se míchá 90 minut a přefiltruje. Získá se 32,1 g sloučeniny uvedené v nadpisu ve formě bílé pevné látky o teplotě tání 225 až 228°C.

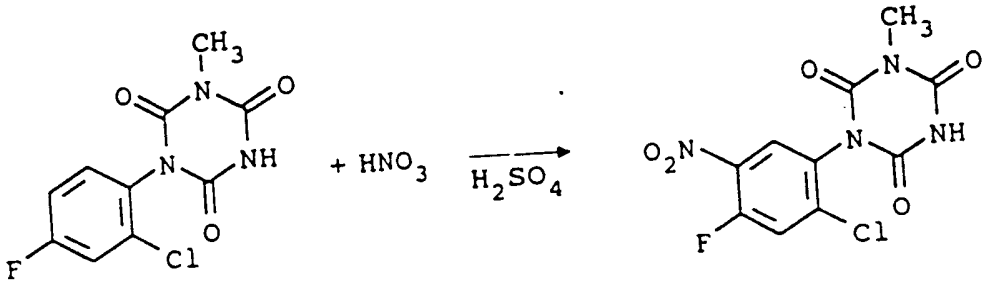
V podstatě stejným způsobem, ale za použití vhodně substituované močoviny se vyrobí následující sloučeniny:



U	X	Y	t.t. (°C)
H	F	F	242-245
H	Cl	Cl	200-204
NO_2	H	F	180-183

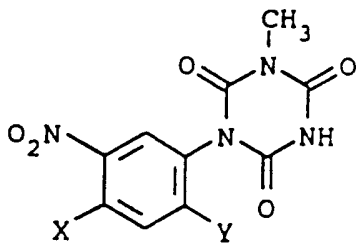
P ř í k l a d 4

Příprava 1-(2-chlor-4-fluor-5-nitrofenyl)-3-methyl-s-triazin-2,4,6(1H,3H,5H)-trionu



Kyselina dusičná (70%, 8,3 ml, 0,131 mol) se přidá k roztoku 1-(2-chlor-4-fluorfenyl)-3-methyl-s-triazin-2,4,6-(1H,3H,5H)-trionu (32,4 g, 0,119 mol) v koncentrované kyselině sírové, přičemž se teplota reakční směsi udržuje pod 10°C. Po dokončení přídavku se reakční směs míchá 30 minut při teplotě místnosti, ochladí na 10°C a zředí ledovou vodou. Vzniklá vodná směs se přefiltruje a oddělená pevná látka se promyje vodou a vysuší na vzduchu. Získá se 28,5 g sloučeniny uvedené v nadpisu ve formě bílé pevné látky o teplotě tání 135 až 139°C.

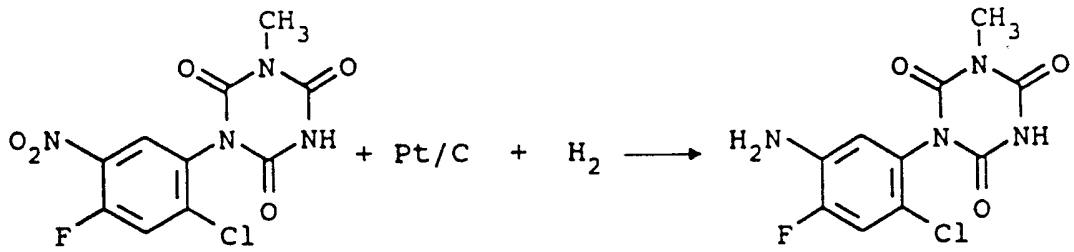
V postatě stejným způsobem, ale za použití vhodně substituovaného 1-fenyl-3-methyl-s-triazin-2,4,6(1H,3H,5H)-trionu se získají následující sloučeniny:



X	Y	t.t. (°C)
F	F	100-120
Cl	Cl	220-222

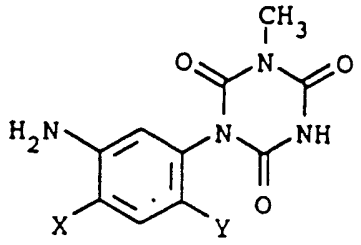
Příklad 5

Příprava 1-(5-amino-2-chlor-4-fluorfenyl)-3-methyl-s-triazin-2,4,6(1H,3H,5H)-trionu



Směs 1-(2-chlor-4-fluor-5-nitrofenyl)-3-methyl-s-triazin-2,4,6(1H,3H,5H)-trionu (28,5 g, 0,09 mol) a 5% platiny na aktivním uhlí (1 g) v ethylacetátu se hydrogenuje za tlaku 378 kPa až do skončení absorpce vodíku. Reakční směs se poté přefiltruje a filtrát se zkoncentruje za sníženého tlaku. Získá se sloučenina uvedená v nadpisu ve formě bílé pevné látky o teplotě tání 244 až 245°C.

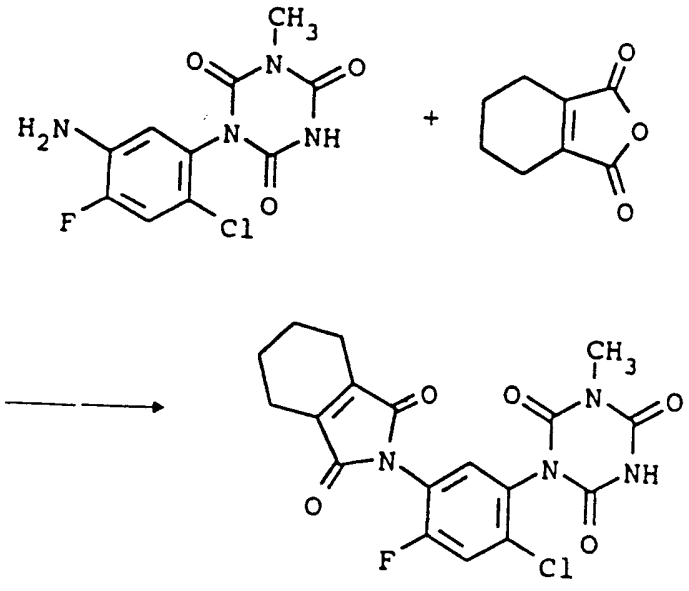
V podstatě stejným způsobem, ale za použití vhodně substituovaného 1-nitrofenyl-3-methyl-s-triazin-2,4,6-(1H,3H,5H)-trionu se vyrobí následující sloučeniny:



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

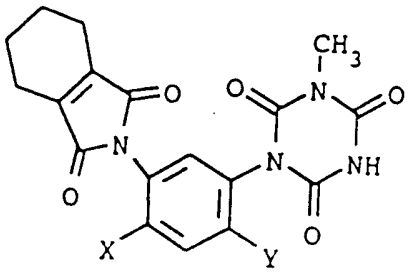
Příklad 6

Příprava 1-[4-chlor-2-fluor-5-(hexahydro-3-methyl)-2,4,6-trioxo-s-triazin-1-yl)fenyl]-1-cyklohexen-1,2-dikarboximidu



Směs 1-(5-amino-2-chlor-4-fluorfenyl)-3-methyl-s-triazin-2,4,6(1H,3H,5H)-trionu (23,4g, 0,0816 mol) a anhydridu 3,4,5,6-tetrahydroftalové kyseliny (13,04 g, 0,0857 mol) v ledové kyselině octové se míchá 8 hodin při 100°C, ochladí na 25°C a nalije do vody. Výsledná vodná směs se přefiltruje a oddělená pevná látka se promyje vodou a vysuší za vakua. Získá se sloučenina uvedená v nadpisu (22,5 g) ve formě béžové pevné látky o teplotě tání 154 až 165°C.

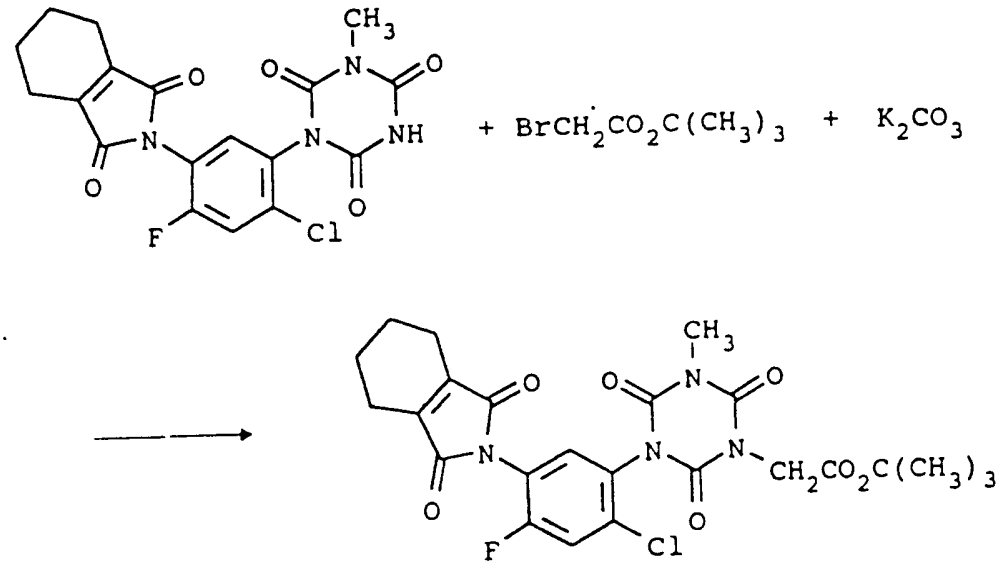
V podstatě stejným způsobem, ale za použití vhodně substituovaného 1-(aminofenyl)-3-methyl-s-triazin-2,4,6-(1H,3H,5H)-trionu se vyrobí následující sloučeniny:



X	Y	t.t.(°C)
F	F	135-150
Cl	Cl	125-135
H	F	

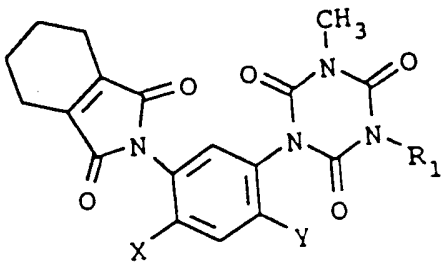
P ř í k l a d 7

Příprava terc.butyl-3-[2-chlor-5-(1-cyklohexen-1,2-dikarboximido)-4-fluorfenyl]tetrahydro-5-methyl-2,4,6-trioxo-s-triazin-1(2H)-acetátu



Směs 1-[4-chlor-2-fluor-5-(hexahydro-3-methyl)-2,4,6-trioxo-s-triazin-1-yl)fenyl]-1-cyklohexen-1,2-dikarboximidu (8 g, 0,0199 mol) a uhličitanu draselného (4,13 g, 0,0299 mol) v N,N-dimethylformamidu se smísí s terc.butylbromacetátem (5,82 g, 0,0299 mol). Vzniklá směs se míchá 18 hodin při teplotě místnosti a nalije do vody. Vodná směs se přefiltruje a oddělená pevná látka se promyje vodou a vysuší na vzduchu. Získá se 6,13 g sloučeniny uvedené v nadpisu ve formě bílé pevné látky o teplotě tání 105 až 115°C.

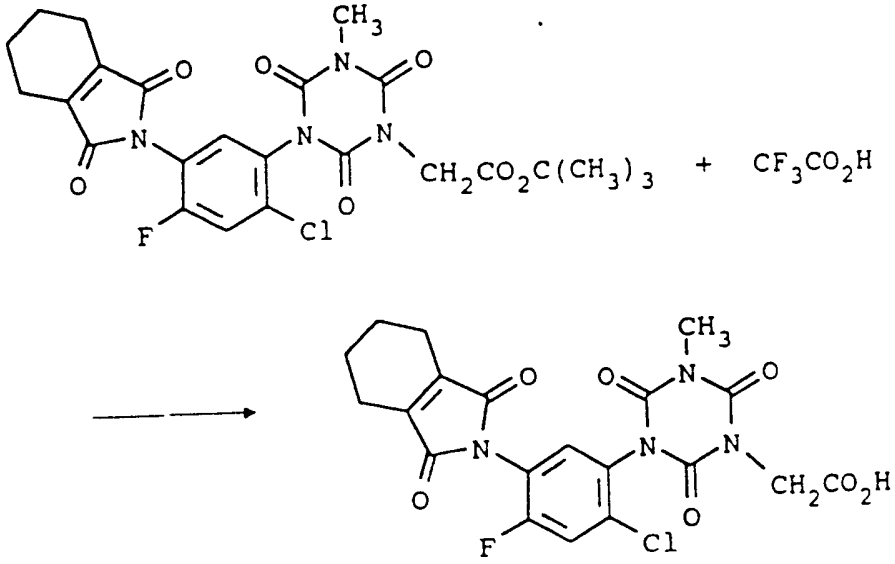
V podstatě stejným způsobem, ale za použití vhodně substituovaného 1-[5-(hexahydro-3-methyl-2,4,6-trioxo-s-triazin-1-yl)fenyl]-1-cyklohexen-1,2-dikarboximidu a vhodného alkylačního činidla se získají následující sloučeniny:



X	Y	R_1	t.t.(°C)
F	F	$CH_2CO_2CH_3$	100-115
F	Cl	$CH_2CO_2CH_3$	95-110
Cl	Cl	$CH_2CO_2C(CH_3)_3$	95-100
Cl	Cl	$CH_2CO_2CH_3$	120-125
H	F	$CH_2CO_2CH_3$	110-120
F	Cl	$CH_2CH=CH_2$	91-106
F	Cl	$CH_2C\equiv CH$	105-122

P ř í k l a d 8

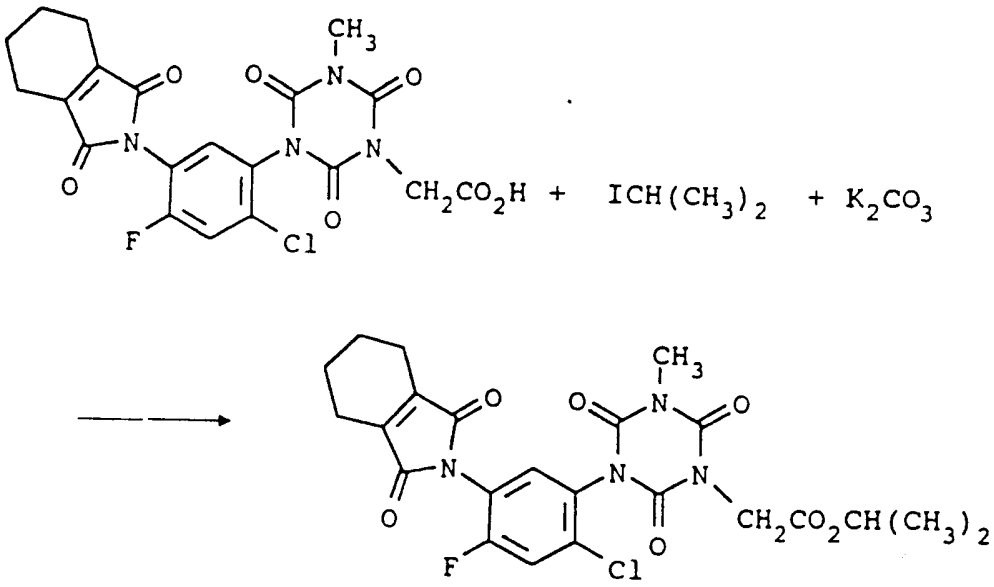
Příprava 3-[2-chlor-5-(1-cyklohexen-1,2-dikarboximido)-4-fluorfenyl]tetrahydro-5-methyl-2,4,6-trioxo-s-triazin-1(2H)-octové kyseliny



Roztok terc.butyl-3-[2-chlor-5-(1-cyklohexen-1,2-dikarboximido)-4-fluorfenyl]tetrahydro-5-methyl-2,4,6-trioxo-s-triazin-1(2H)-acetátu (5,92 g, 0,011 mol) v trifluoroctové kyselině se 2 hodiny zahřívá ke zpětnému toku, ochladí na teplotu místnosti a zkoncentruje za sníženého tlaku. Jantarově zbarvený pryskyřičný zbytek se rozpustí v etheru a výsledný roztok se zkoncentruje za sníženého tlaku. Získá se sloučenina uvedená v nadpisu (3,62 g) ve formě žluté pevné látky o teplotě tání 75 až 80°C.

P ř í k l a d 9

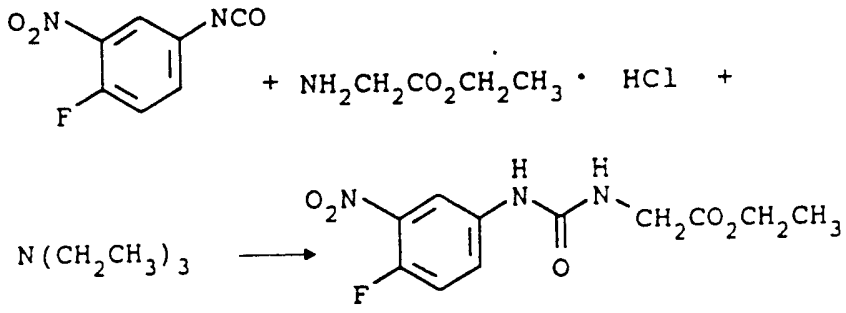
Příprava isopropyl-3-[2-chlor-5-(1-cyklohexen-1,2-dikarboximido)-4-fluorfenyl]tetrahydro-5-methyl-2,4,6-trioxo-s-triazin-1(2H)-acetátu



Roztok 3-[2-chlor-5-(1-cyklohexen-1,2-dikarboximido)-4-fluorfenyl]tetrahydro-5-methyl-2,4,6-trioxo-s-triazin-1(2H)-octové kyseliny (1,5 g, 3,13 mmol) v N,N-dimethylformamidu se smísí s 2-jodpropanem (0,849 g, 5 mmol) a uhličitanem draselným (0,69 g, 5 mmol). Vzniklá směs se míchá přes noc při teplotě místnosti a nalije do vody. Vodná směs se přefiltruje a oddělená pevná látka se vysuší na vzduchu. Získá se sloučenina uvedená v nadpisu (0,6 g) ve formě béžové pevné látky o teplotě tání 100 až 130°C.

P ř í k l a d 1 0

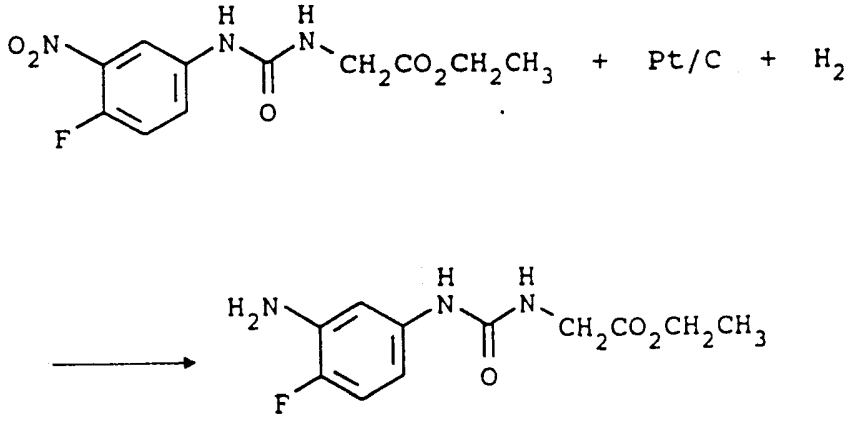
Příprava ethylesteru N-[(4-fluor-3-nitrofenyl)karbamoyl]-glycinu



Roztok 4-fluor-3-nitrofenylisokyanátu (10 g, 0,055 mol) v bezvodém tetrahydrofuranu se ochladí na 0°C a smísí s hydrochloridem ethylesteru glycinu (7,7 g, 0,055 mol). Výsledná směs se smísí s triethylaminem (5,56 g, 0,055 mol), přičemž se teplota reakční směsi udržuje pod 10°C. Reakční směs se míchá 1 hodinu při teplotě místnosti a nalije do vody. Vodná směs se extrahuje etherem. Spojené organické extrakty se promyjí postupně 1N kyselinou chlorovodíkovou a roztokem chloridu sodného, vysuší bezvodým síranem hořečnatým a zkoncentrují za sníženého tlaku. Pevný zbytek se vysuší na vzduchu. Získá se sloučenina uvedená v nadpisu (8,8 g) ve formě žluté pevné látky o teplotě tání 115 až 120°C.

P ř í k l a d 1 1

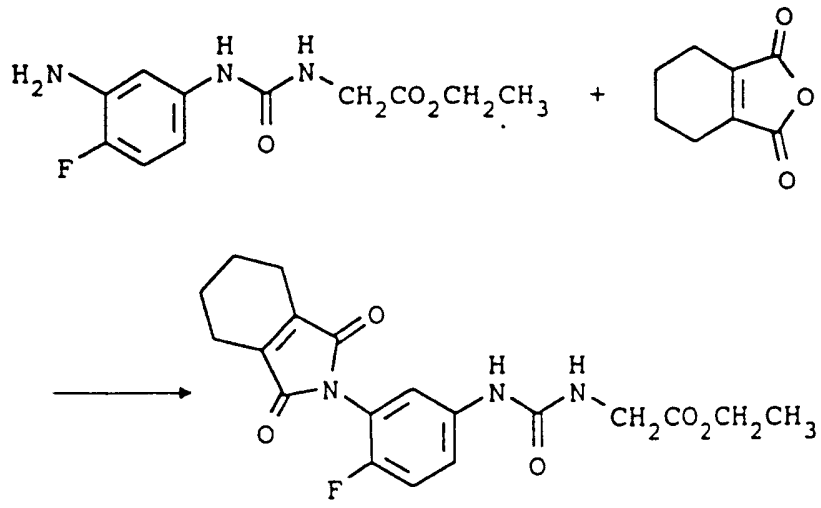
Příprava ethylesteru N-[(3-amino-4-fluorfenyl)karbamoyl]-glycinu



Směs ethylesteru N-[(4-fluor-3-nitrofenyl)karbamoyl]glycinu (8 g, 0,029 mol) a 5% platiny na aktivním uhlí (0,5 g) v ethylacetátu se hydrogenuje za tlaku 343,5 kPa až do skončení absorpce vodíku. Reakční směs se poté přefiltruje a chladí v ledové lázni, dokud nevznikne pevná látka. Pevná látka se shromáždí filtrací a vysuší na vzduchu. Získá se sloučenina uvedená v nadpisu (4,5 g) ve formě bílé pevné látky o teplotě tání 152 až 153°C.

P ř í k l a d 1 2

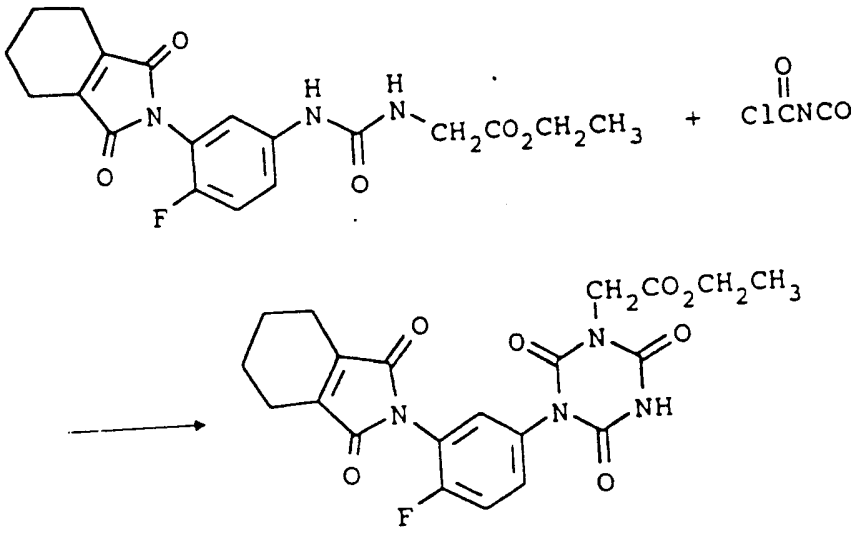
Příprava ethylesteru (N-[3-(1-cyklohexen-1,2-dikarboximido)-4-fluorfenyl]karbamoyl)glycinu



Roztok ethylesteru N-[(3-amino-4-fluorfenyl)karbamoyl]glycinu (4 g, 0,0157 mol) v kyselině octové se smísí s anhydridem 3,4,5,6-tetrahydroftalové kyseliny (2,43 g, 0,016 mol). Vzniklá směs se 8 hodin zahřívá na 100°C, ochladí na teplotu místnosti a nalije do vody. Vodná směs se přefiltruje a oddělená pevná látka se překrystaluje ze směsi ethylacetátu a hexanů. Získá se sloučenina uvedená v nadpisu ve formě žluté pevné látky o teplotě tání 72 až 82°C.

P ř í k l a d 1 3

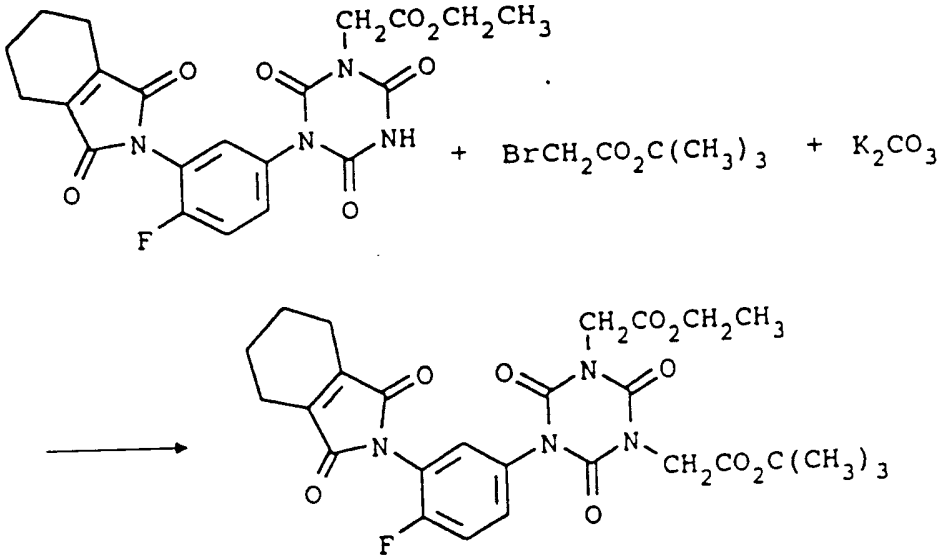
Příprava ethyl-3-[3-(1-cyklohexen-1,2-dikarboximido)-4-fluorfenyl]tetrahydro-2,4,6-trioxo-s-triazin-1(2H)-acetátu



Roztok ethylesteru {N-[3-(1-cyklohexen-1,2-dikarboximido)-4-fluorfenyl]karbamoyl}glycinu (2,45 g, 6,3 mmol) v toluenu se smísí s N-(chlorkarbonyl)isokyanátem (0,77 g, 7,3 mmol). Výsledná směs se míchá 12 hodin při 60°C a zkoncentruje za sníženého tlaku. Pevný zbytek se 24 hodin suší za vakua při 85°C. Získá se 2,13 g sloučeniny uvedené v nadpisu ve formě žluté pevné látky o teplotě tání 135 až 150°C.

P ř í k l a d 1 4

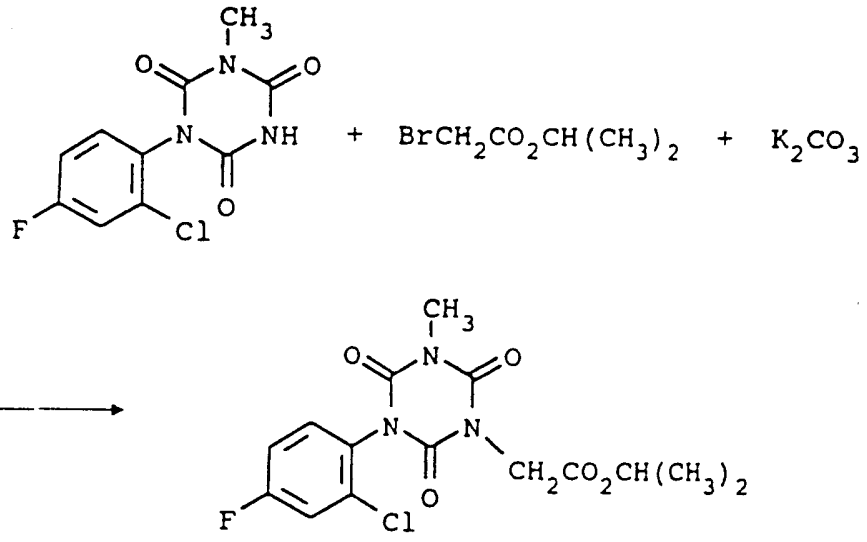
Příprava 1-terc.butylethylesteru 5-[3-(1-cyklohexen-1,2-dikarboximido)-4-fluorfenyl]dihydro-2,4,6-trioxo-s-triazin-1,3(2H,4H)-dioctové kyseliny



Terc.butylbromacetát (0,689 g, 3,5 mmol) a uhličitan draselný (0,484 g, 3,5 mmol) se odděleně přidají k roztoku ethyl-3-[3-(1-cyklohexen-1,2-dikarboximido)-4-fluorfenyl]tetrahydro-2,4,6-trioxo-s-triazin-1(2H)-acetátu (1,35 g, 2,9 mmol) v N,N-dimethylformamidu. Reakční směs se míchá 18 hodin při teplotě místnosti, nalije do vody a vodná směs se extrahuje etherem. Organické extrakty se spojí, promyjí roztokem chloridu sodného, vysuší bezvodým síranem hořečnatým a zkoncentrují za sníženého tlaku. Získá se 0,8 g sloučeniny uvedené v nadpisu ve formě jantarově zbarvené pevné látky o teplotě tání 95 až 105°C.

P ř í k l a d 1 5

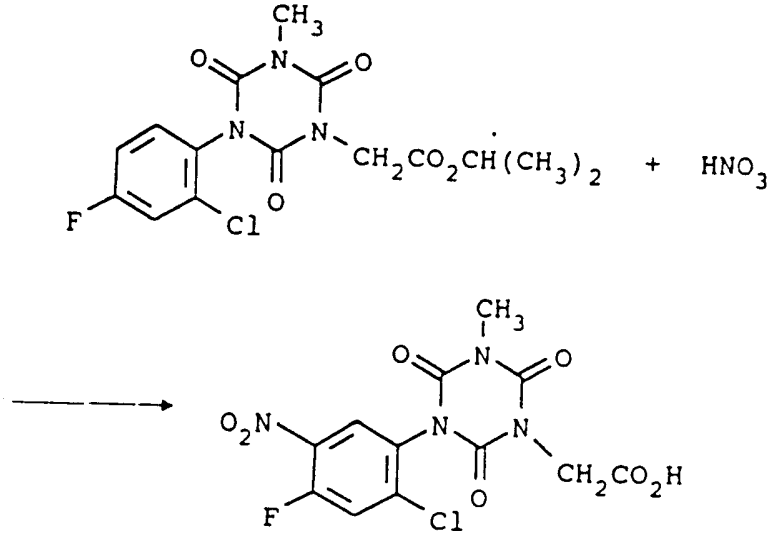
Příprava isopropyl-3-(2-chlor-4-fluorfenyl)tetrahydro-5-methyl-2,4,6-trioxo-s-triazin-1(2H)-acetátu



Směs 1-(2-chlor-4-fluorfenyl)-3-methyl-s-triazin-2,4,6(1H,3H,5H)-trionu (40,9 g, 0,150 mol), uhličitanu draselného (31,1 g, 0,225 mol) a isopropylbromacetátu (29,1 ml, 0,225 mol) v N,N-dimethylformamidu se míchá 2 hodiny při teplotě místnosti a nalije do vody. Vodná směs se extrahuje ethylacetátem. Organické extrakty se promyjí postupně vodou a roztokem chloridu sodného, vysuší bezvodým síranem hořečnatým a zkoncentrují za sníženého tlaku. Olejovitý zbytek se podrobí mžikové chromatografii na sloupci silikagelu za použití 0 až 10% etheru v methylenchloridu, jako elučního činidla. Získá se sloučenina uvedená v nadpisu (51,5 g) ve formě bílé pevné látky o teplotě tání 127 až 128°C.

P ř í k l a d 1 6

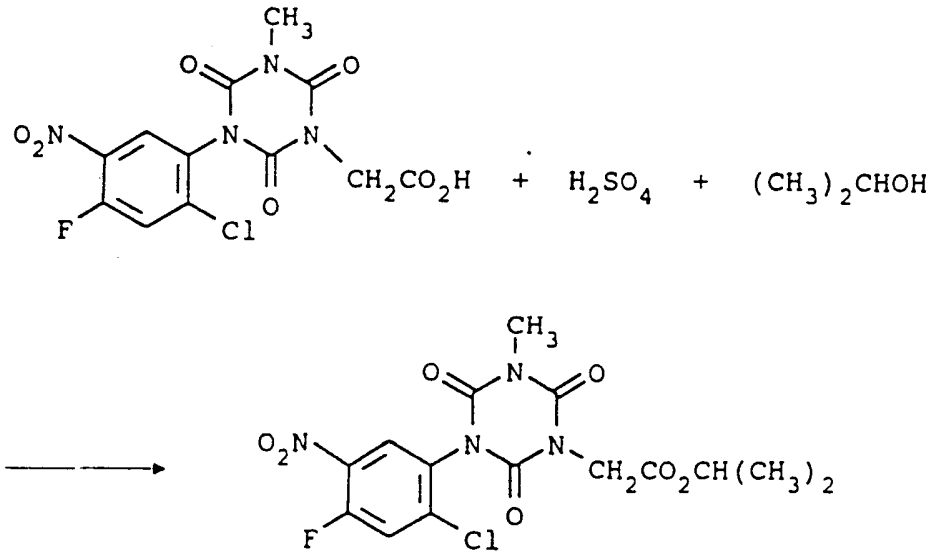
Příprava 3-(2-chlor-4-fluor-5-nitrofenyl)tetrahydro-5-methyl-2,4,6-trioxo-s-triazin-1(2H)-octové kyseliny



Roztok isopropyl-3-(2-chlor-4-fluorfenyl)tetrahydro-5-methyl-2,4,6-trioxo-s-triazin-1(2H)-acetátu (48,7 g, 0,0508 mol) v koncentrované kyselině sírové se ochladí na 0°C a smísí s 90% kyselinou dusičnou (2,6 ml). Vzniklá směs se míchá přes noc při teplotě místnosti, smísí s 90% kyselinou dusičnou (1,0 ml), míchá 4 hodiny, smísí s dalším množstvím 90% kyseliny dusičné (2,0 ml), míchá přes noc při teplotě místnosti, smísí s 90% kyselinou dusičnou (1,0 ml), míchá 1 hodinu a nalije na led. Vodný roztok se přefiltruje, oddělená pevná látka se rozpustí v etheru, vysuší síranem hořečnatým a zkoncentruje za sníženého tlaku. Získá se sloučenina uvedená v nadpisu ve formě žluté pěny, která se identifikuje NMR spektrální analýzou.

P ř í k l a d 1 7

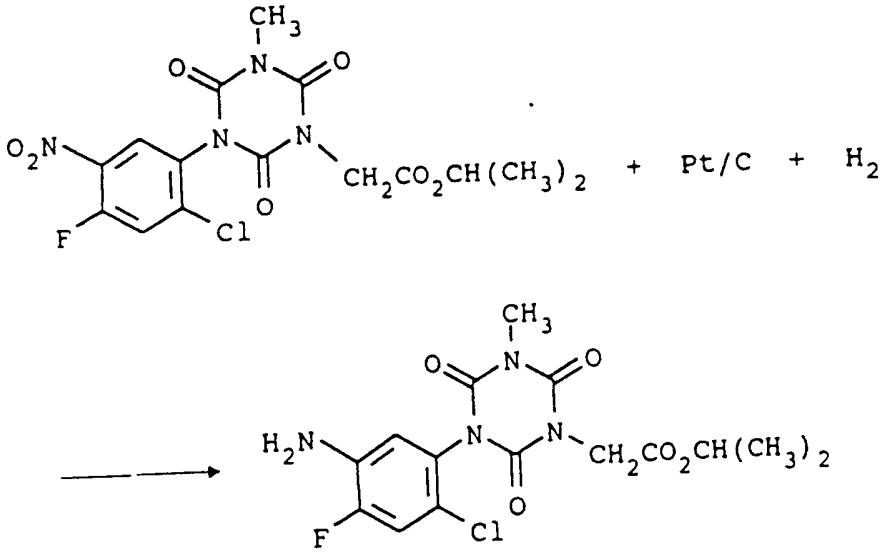
Příprava isopropyl-3-(2-chlor-4-fluor-5-nitrofenyl)tetrahydro-5-methyl-2,4,6-trioxo-s-triazin-1(2H)-acetátu



Roztok 3-(2-chlor-4-fluor-5-nitrofenyl)tetrahydro-5-methyl-2,4,6-trioxo-s-triazin-1(2H)-octové kyseliny (43,6 g, 0,105 mol) a koncentrované kyseliny sírové (25 ml) ve 2-propanolu (300 ml) se 12 hodin zahřívá ke zpětnému toku, ochladí na teplotu místnosti a přefiltruje. Oddělená pevná látka se vysuší. Získá se sloučenina uvedená v nadpisu ve formě špinavě bílé pevné látky, která se identifikuje NMR spektrální analýzou. Filtrát se zčásti zkoncentruje za sníženého tlaku a nalije na led. Vzniklá vodná směs se extrahuje ethylacetátem. Organické extrakty se vysuší bezvodým síranem hořečnatým a zkoncentrují za sníženého tlaku. Oranžový olejovitý zbytek se podrobí mžikové chromatografii na sloupci silikagelu za použití 2,5 až 5% etheru v methylenchloridu, jako elučního činidla. Získá se další frakce sloučeniny uvedené v nadpisu ve formě žluté pěny.

P ř í k l a d 1 8

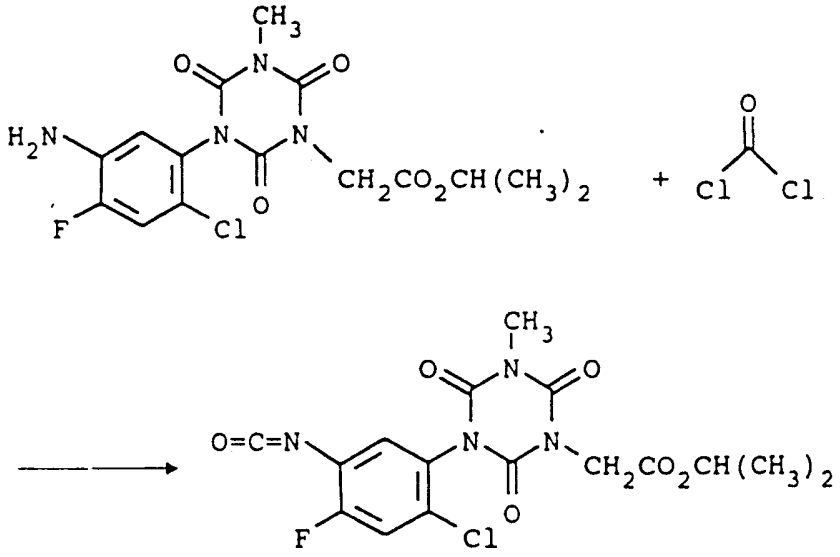
Příprava isopropyl-3-(5-amino-2-chlor-4-fluorfenyl)tetrahydro-5-methyl-2,4,6-trioxo-s-triazin-1(2H)-acetátu



Směs isopropyl-3-(2-chlor-4-fluor-5-nitrofenyl)-tetrahydro-5-methyl-2,4,6-trioxo-s-triazin-1(2H)-acetátu (34,8 g, 0,0835 mol) a 5% platiny na aktivním uhlí (3,48 g) v ethylacetátu se hydrogenuje až do absorpce asi 618 kPa vodíku. Reakční směs se přefiltruje a filtrát se zkoncentruje za sníženého tlaku. Zbytek ve formě pěny se chromatografuje na sloupci silikagelu za použití 10 až 20% etheru v methylenchloridu, jako elučního činidla. Získá se žlutá pěna, která obsahuje dvě sloučeniny. Směs pěny a 5% platiny na uhlíku (3,5 g) v ethylacetátu se hydrogenuje až do absorpce 34,35 kPa vodíku. Reakční směs se poté přefiltruje a filtrát se zkoncentruje za sníženého tlaku. Získá se sloučenina uvedená v nadpisu ve formě žluté pěny, která se identifikuje NMR spektrální analýzou.

P ř í k l a d 1 9

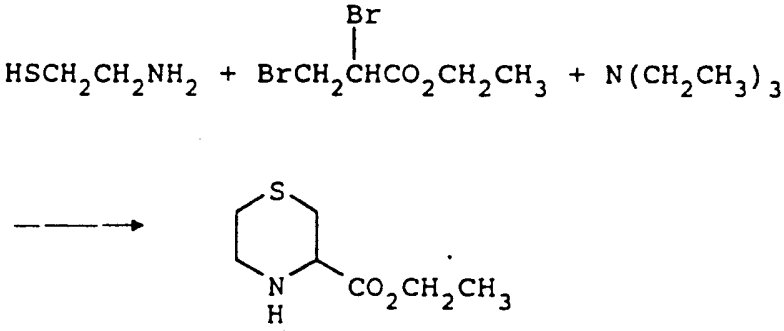
Příprava isopropyl-3-(2-chlor-4-fluor-5-isokyanatofenyl)-tetrahydro-5-methyl-2,4,6-trioxo-s-triazin-1(2H)-acetátu



Směs isopropyl-3-(5-amino-2-chlor-4-fluorfenyl)-tetrahydro-5-methyl-2,4,6-trioxo-s-triazin-1(2H)-acetátu (4,0 g, 0,0103 mol) v toluenu se smísí s 1,93M roztokem fosgenu v toluenu (19 ml). Vzniklá směs se 3 hodiny vaří pod zpětným chladičem, ochladí, zčásti zkoncentruje za sníženého tlaku, zředí toluenem, zčásti zkoncentruje za sníženého tlaku, zředí toluenem a zkoncentruje za sníženého tlaku. Získá se sloučenina uvedená v nadpisu ve formě žluté pěny, která se identifikuje ^{1}H NMR spektrální analýzou.

P ř í k l a d 2 0

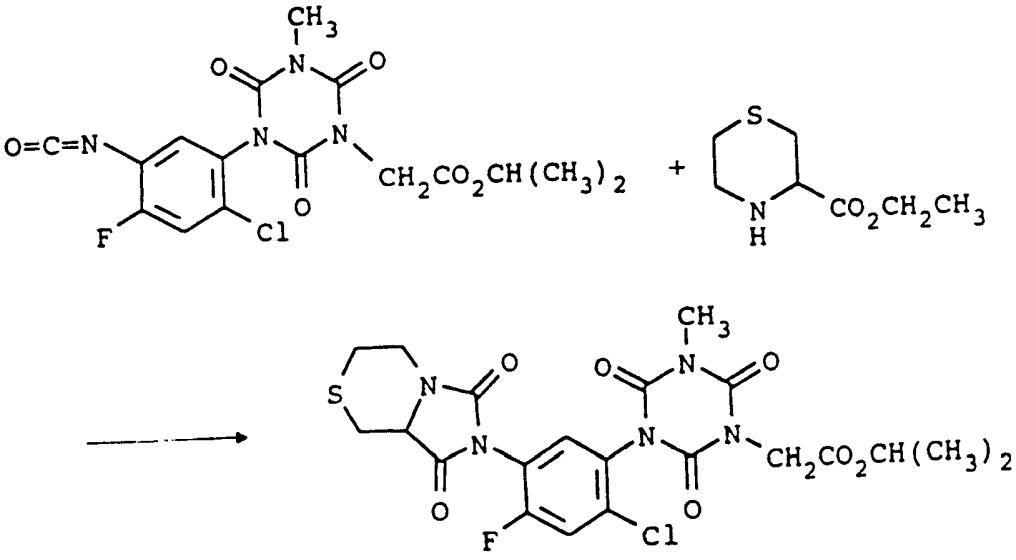
Příprava ethyl-3-thiomorfolinkarboxylátu



Teplý roztok 2-aminoethanthiolu (10,0 g, 0,130 mol) a triethylaminu (36 ml, 0,260 mol) v chloroformu se přidá během 5 minut k roztoku ethyl-2,3-dibrompropionátu (33,9 g, 0,130 mol) ve směsi chloroformu a toluenu v poměru 1 : 1,6. Reakční směs se míchá 2,5 hodiny při teplotě místnosti, přefiltruje a filtrát se zkoncentruje za sníženého tlaku. Kapalný oranžový zbytek se podrobí vakuové destilaci, čímž se získá sloučenina uvedená v nadpisu ve formě bezbarvé kapaliny o teplotě varu 121 až 124°C za tlaku 340 Pa.

P ř í k l a d 2 1

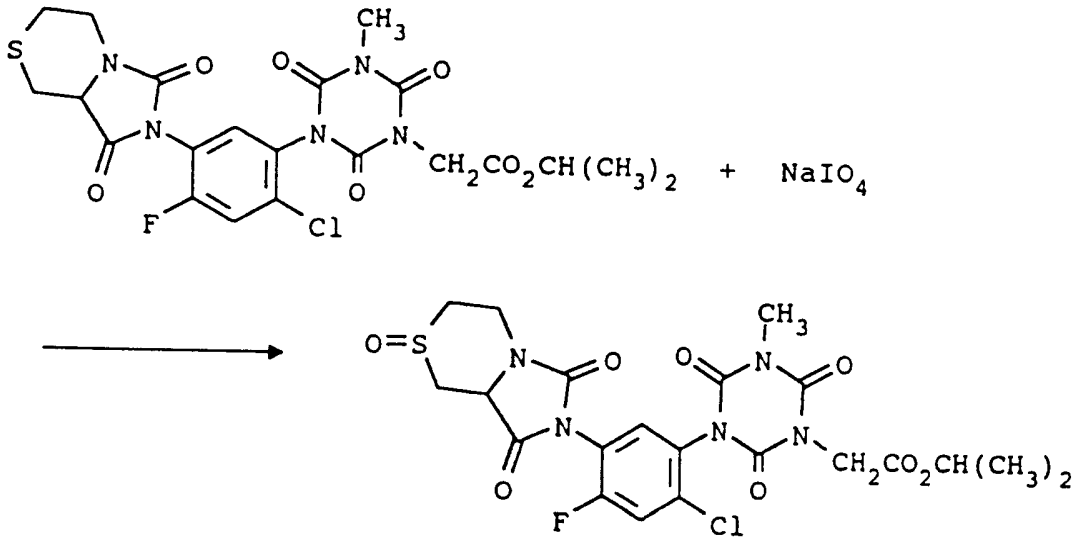
Příprava isopropyl-3-{2-chlor-4-fluor-5-[5,6,8,8a-tetrahydro-1,3-dioxo-1H-imidazo[5,1c][1,4]-thiazin-2(3H)-yl]-fenyl}tetrahydro-5-methyl-2,4,6-trioxo-s-triazin-1(2H)-acetátu



Roztok isopropyl-3-(2-chlor-4-fluor-5-isokyanatofenyl)tetrahydro-5-methyl-2,4,6-trioxo-s-triazin-1(2H)-acetátu (3,11 g, 7,5 mmol) a ethyl-3-thiomorfolinkarboxylátu (1,44 g, 8,2 mmol) v toluenu se míchá 1 hodinu při teplotě místnosti a smísí s několika kapkami ethyl-3-thiomorfolinkarboxylátu. Vzniklá směs se míchá přes noc při teplotě místnosti a filtrací se oddělí žlutá pevná látka. Filtrát se vysuší a zkoncentruje za sníženého tlaku. Zbytek ve formě oranžové pěny a pevná látka se spojí a chromatografují na silikagelu za použití 10% etheru v methylenchloridu, jako elučního činidla. Získaná oranžová pěna, která obsahuje dvě sloučeniny, se podrobí mžikové chromatografii na silikagelu za použití 15% ethylacetátu v methylenchloridu, jako elučního činidla. Získá se sloučenina uvedená v nadpisu ve formě špinavě bílé pěny o teplotě tání 147 až 155°C.

P ř í k l a d 2 2

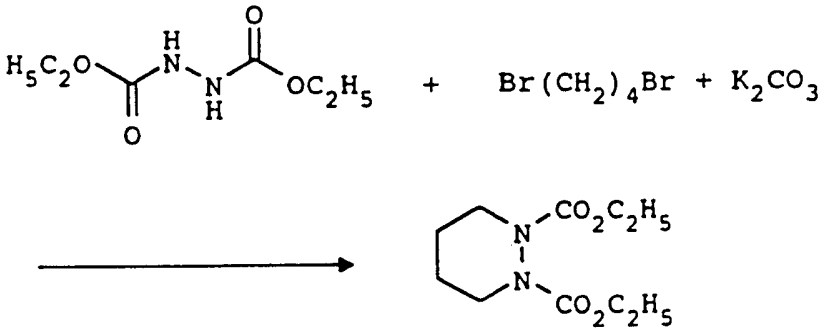
Příprava isopropyl-3-[2-chlor-4-fluor-5-(tetrahydro-1,3,7-trioxo-1H-imidazo[5,1-c][1,4]thiazin-2(3H)-yl)fenyl]-tetrahydro-5-methyl-2,4,6-trioxo-s-triazin-1(2H)-acetátu



Směs isopropyl-3-{2-chlor-4-fluor-5-[5,6,8,8a-tetrahydro-1,3-dioxo-1H-imidazo[5,1c][1,4]-thiazin-2(3H)-yl]-fenyl}tetrahydro-5-methyl-2,4,6-trioxo-s-triazin-1(2H)-acetátu (0,95 g, 1,75 mmol) v methanolu (10 ml) se během 15 minut přidá k roztoku jodistanu sodného (0,38 g, 1,78 mmol) ve vodě (10 ml), který byl předem ochlazen na 0 až 5°C. Po dokončení přídavku se reakční směs míchá přes noc při teplotě místnosti a zředí methylenchloridem. Zředěná směs se promyje postupně 1M roztokem dihydrogenfosforečnanu draselného a roztokem chloridu sodného, vysuší bezvodým síranem hořečnatým a zkoncentruje za sníženého tlaku. Zbytek ve formě žluté pěny se podrobí mžikové chromatografii na silikagelu za použití 10% etheru v methylenchloridu a 2,5% methanolu v methylenchloridu, jako elučního činidla. Získá se sloučenina uvedená v nadpisu ve formě bílé pěny (0,59 g) o teplotě tání 175 až 180°C.

P ř í k l a d 2 3

Příprava diethylesteru
tetrahydro-1,2-pyridazindikarboxylové kyseliny

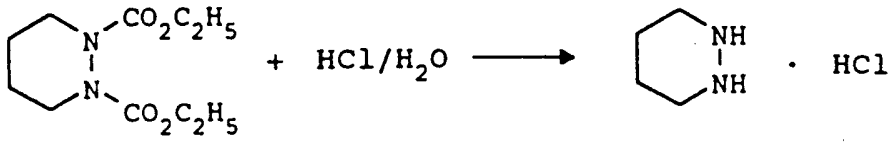


1,4-Dibrombutan (81,4 ml, 0,682 mol) se během 1 hodiny přidá ke směsi 1,2-diethoxykarbonylhydrazinu (100 g, 0,568 mol) a uhličitanu draselného (158 g, 1,14 mol) v acetonitrilu (600 ml). Výsledná reakční směs se 6 hodin zahřívá ke zpětnému toku, ochladí na teplotu místnosti a přefiltruje. Filtrát se zkoncentruje za sníženého tlaku a

získaná žlutá kapalina se předestiluje za sníženého tlaku. Získá se sloučenina uvedená v nadpisu (90,8 g) ve formě bezbarvé kapaliny o teplotě varu 115 až 120°C za tlaku 120 Pa.

P ř í k l a d 24

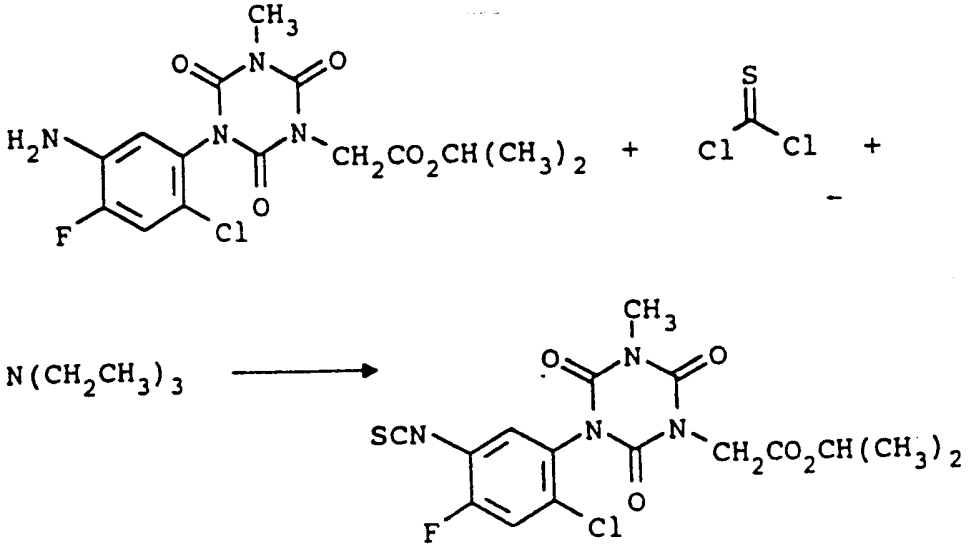
Příprava hydrochloridu hexahydropyridazinu



Roztok diethylesteru tetrahydro-1,2-pyridazin-dikarboxylové kyseliny (45,0 g, 0,195 mol) v koncentrované kyselině chlorovodíkové (190 ml) se přes noc zahřívá ke zpětnému toku a zkoncentruje za sníženého tlaku. Bílý pevný zbytek se 1 hodinu míchá v acetonitrilu, načež se vzniklá směs přefiltruje a oddělená pevná látka se vysuší. Získá se sloučenina uvedená v nadpisu (19,5 g) ve formě bílé pevné látky o teplotě tání 163°C.

P ř í k l a d 25

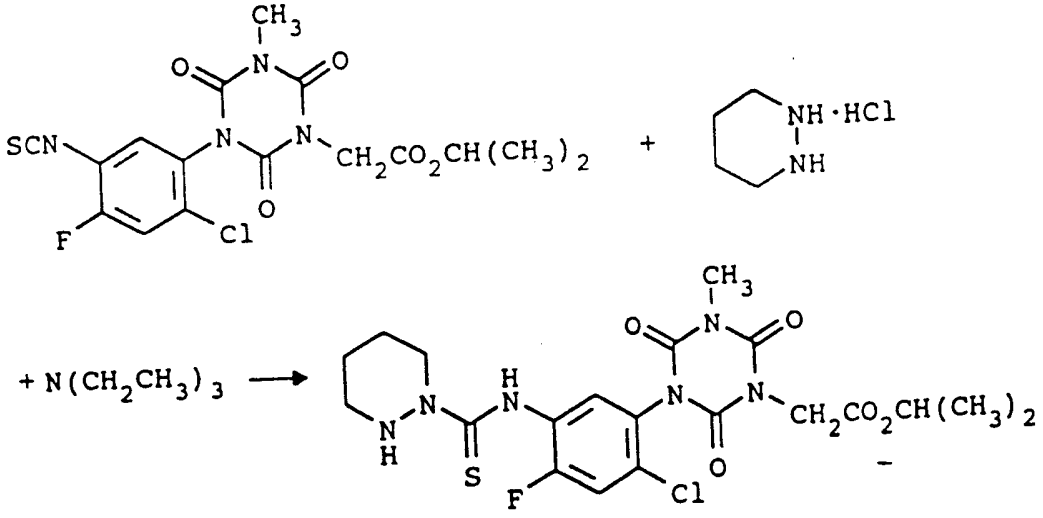
Příprava isopropyl-3-(2-chlor-4-fluor-5-isothiokyanato)-fenyl)tetrahydro-5-methyl-2,4,6-trioxo-s-triazin-1(2H)-acetátu



Thiofosgen (0,50 ml, 6,5 mmol) se během 45 minut přidá k roztoku isopropyl-3-(5-amino-2-chlor-4-fluorfenyl)-tetrahydro-5-methyl-2,4,6-trioxo-s-triazin-1(2H)-acetátu (2,5 g, 6,5 mmol) a triethylaminu (1,8 ml, 13,0 mmol) v tetrahydrofuranu. Reakční směs se míchá 4 hodiny při teplotě místnosti a zředí tetrahydrofuranem. Zředěná směs se přefiltruje a filtrát se zkoncentruje za sníženého tlaku. Získá se sloučenina uvedená v nadpisu ve formě oranžového oleje, která se identifikuje NMR spektrální analýzou.

P ř í k l a d 2 6

Příprava isopropyl-3-{2-chlor-4-fluor-5-[(tetrahydropyridazin-1(2H)-yl)thiokarboxamido]fenyl}tetrahydro-5-methyl-2,4,6-trioxo-s-triazin-1(2H)-acetátu

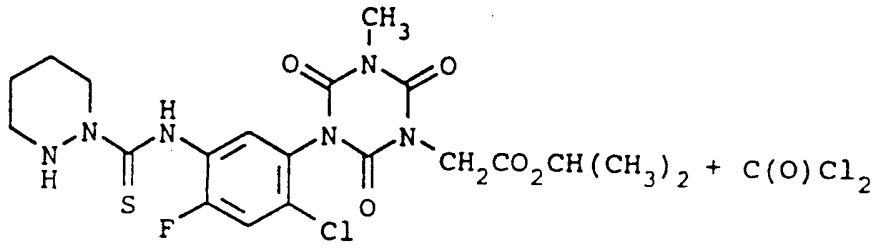


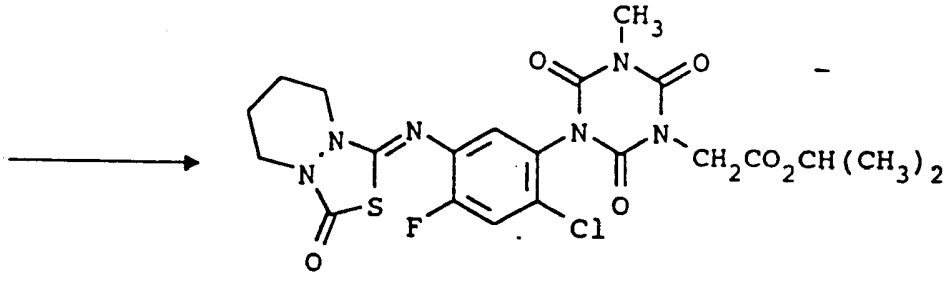
Triethylamin (2,5 ml, 18,2 mmol) se přikape ke směsi isopropyl-3-(2-chlor-4-fluor-5-isothiokyanatofenyl)-tetrahydro-5-methyl-2,4,6-trioxo-s-triazin-1(2H)-acetátu (2,79 g, 6,5 mmol) a hydrochloridu hexahydropyridazinu (1,45 g, 9,1 mmol) v methanolu, přičemž se teplota reakční směsi udržuje na 20 až 25°C. Po dokončení přídavku se reakční směs míchá přes noc při teplotě místnosti, zčásti zkoncentruje za

sníženého tlaku a zředí ethylacetátem. Organická fáze se oddělí, promyje postupně vodou a roztokem chloridu sodného, vysuší bezvodým síranem hořečnatým a zkoncentruje za sníženého tlaku. Zbytek ve formě oranžové pěny se podrobí mžikové chromatorafii na silikagelu za použití 2,5 až 10% etheru v methylenchloridu, jako elučního činidla. Získá se sloučenina uvedená v nadpisu (2,15 g) ve formě žluté pěny o teplotě tání 105 až 110°C

P ř í k l a d 2 7

Příprava isopropyl-3-{2-chlor-4-fluor-5-[(tetrahydro-3-oxo-1H,3H-[1,3,4]thiadiazolo[3,4-a]pyridazin-1-yliden)amino]-fenyl}tetrahydro-5-methyl-2,4,6-trioxo-s-triazin-1(2H)-acetátu



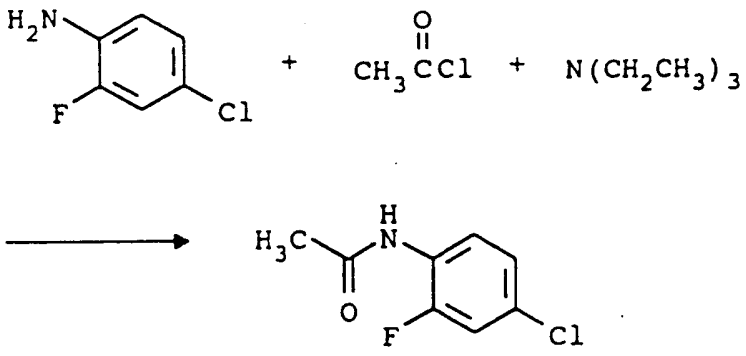


Roztok isopropyl-3-{2-chlor-4-fluor-5-[(tetrahydropyridazin-1(2H)-yl)thiokarboxamido]fenyl}tetrahydro-5-methyl-2,4,6-trioxo-s-triazin-1(2H)-acetátu (1,50 g, 2,9 mmol) v 1,2-dichlorethanu se během 30 minut přidá k 20% roztoku fosgenu v toluenu (2,91 ml, 5,6 mmol), který byl předem ochlazen na 0 až 5°C. Po dokončení přídavku se reakční směs míchá 2 hodiny při teplotě místnosti, promyje postupně vodou a roztokem chloridu sodného, vysuší bezvo-

dým síranem hořečnatým a zkoncentruje za sníženého tlaku. Zbytek ve formě žluté pěny se podrobí mžikové chromatografii na silikagelu za použití 2,5 až 10% etheru v methylenchloridu, jako elučního činidla. Získá se sloučenina uvedená v nadpisu (1,18 g) ve formě bílé pěny o teplotě tání 97 až 107°C.

P ř í k l a d 2 8

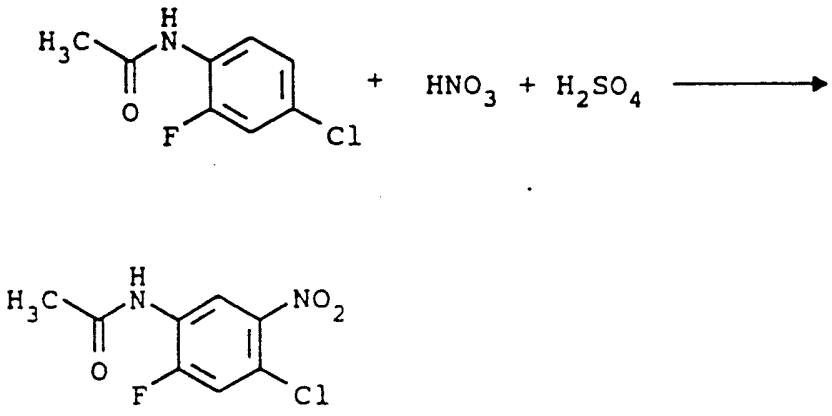
Příprava 4'-chlor-2'-fluoracetanilidu



Acetylchlorid (24,2 ml, 0,34 mol) se pomalu přidá k roztoku 4-chlor-2-fluoranilinu (49,4 g, 0,34 mol) a triethylaminu (47 ml, 0,34 mol) v tetrahydrofuranu, přičemž se teplota reakční směsi udržuje pod 20°C. Po dokončení přídavku se reakční směs míchá přes noc při teplotě místnosti a nalije do ethylacetátu. Organický roztok se promyje postupně vodou a roztokem chloridu sodného, vysuší bezvodým síranem hořečnatým a zkoncentruje za sníženého tlaku. Špinavě bílý pevný zbytek se míchá několik minut v ethanolu a filtrací se oddělí sloučenina uvedená v nadpisu ve formě bílé pevné látky.

P ř í k l a d 2 9

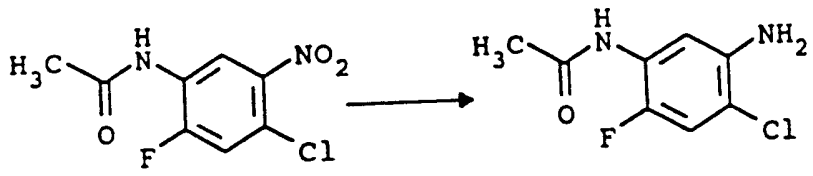
Příprava 4'-chlor-2'-fluor-5'-nitroacetanilidu



Směs 4'-chlor-2'-fluoracetanilidu (51 g, 0,272 mol) v koncentrované kyselině sírové (100 ml) se ochladí na 0°C a během 45 minut smísí s kyselinou dusičnou (90%, 14 ml, 0,300 mol). Výsledná směs se míchá 10 minut a nalije na led. Vodná směs se přefiltruje a oddělená zlatohnědá pevná látka se promyje vodou, přes noc vysuší a překrystaluje ze směsi chloroformu a hexanů v poměru 17 : 1. Získá se sloučenina uvedená v nadpisu ve formě žluté pevné látky.

P ř í k l a d 3 0

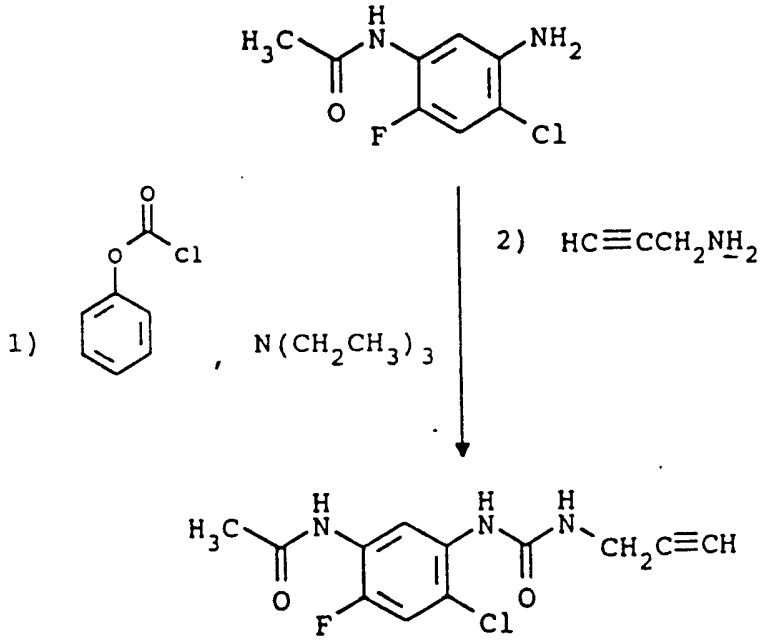
Příprava 5'-amino-4'-chlor-2'-fluoracetanilidu



Směs 4'-chlor-2'-fluor-5'-nitroacetanilidu (35,2 g, 151 mmol) a 5% platiny na uhlíku (7,0 g, 20 % hmot.) ve směsi ethanolu a tetrahydrofuranu v poměru 2 : 1 se hydrogenuje až do absorpce 192 kPa vodíku. Poté se reakční směs přefiltruje a zkoncentruje za sníženého tlaku. Získá se sloučenina uvedená v nadpisu ve formě zlatohnědé pevné látky, která se identifikuje ^{1}H NMR spektrální analýzou.

P ř í k l a d 3 1

Příprava 1-(5-acetamido-2-chlor-4-fluorfenyl)-3-(2-propinyl)-močoviny

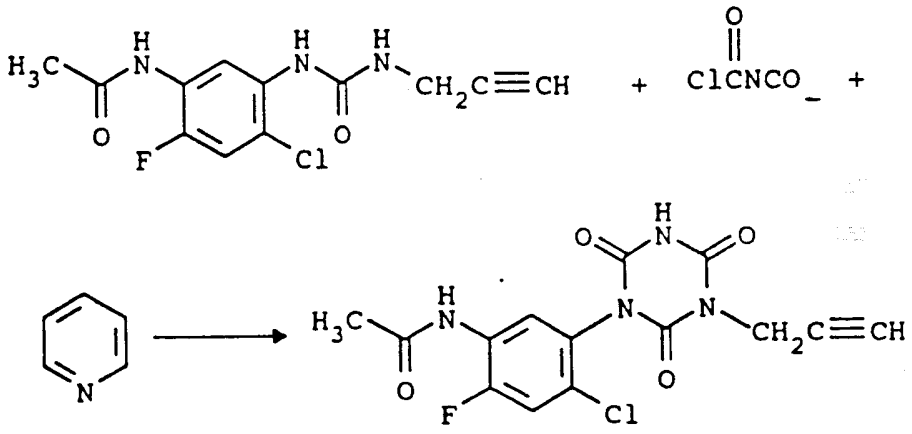


Roztok 5'-amino-4'-chlor-2'-fluoracetanilidu (11,25 g, 55,6 mmol) a triethylaminu (7,70 ml, 55,6 mmol) v tetrahydrofuranu se přikape k míchanému roztoku fenylchlorformiátu (8,70 ml, 69,4 mmol) v tetrahydrofuranu, přičemž se teplota reakční směsi udržuje na 25 až 30°C. Po dokončení přídavku se reakční směs míchá 75 minut při teplotě místnosti a nalije do ethylacetátu. Organická směs se promyje postupně vodou, nasyceným roztokem hydrogenuhličitanu sodného a

roztokem chloridu sodného, vysuší bezvodým síranem hořečnatým a zkoncentruje za sníženého tlaku. Zlatohnědý pevný zbytek se rozpustí v tetrahydrofuranu a vzniklý roztok se smísí s propargylaminem (9,52 ml, 139 mmol). Výsledná směs se 1 hodinu zahřívá ke zpětnému toku a nalije do vody. Vodná směs se přefiltruje a oddělená pevná látka se promyje postupně vodou, 0,5N kyselinou chlorovodíkovou a vodou a přes noc vysuší. Získá se sloučenina uvedená v nadpisu ve formě béžové pevné látky.

P ř í k l a d 3 2

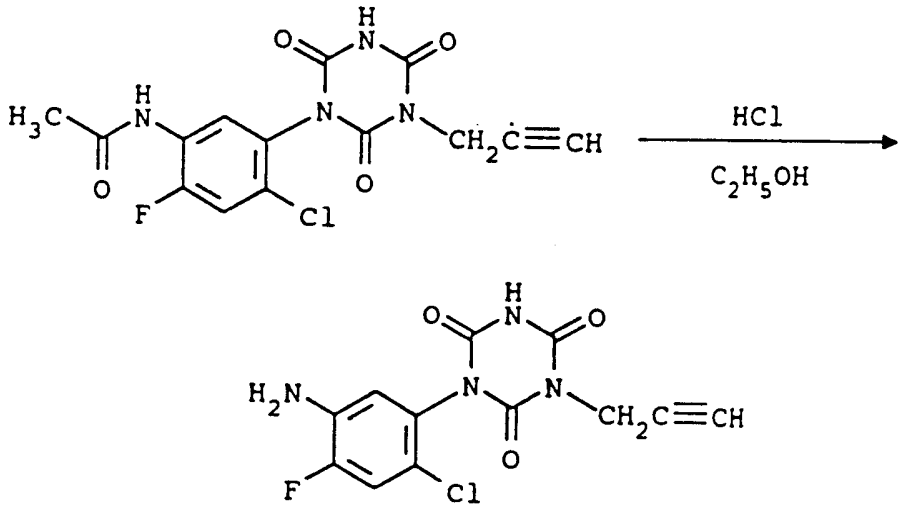
Příprava 4'-chlor-2'-fluor-5'-[hexahydro-2,4,6-trioxo-3-(2-propinyl)-s-triazin-1-yl]acetanilidu



Směs 1-(5-acetamido-2-chlor-4-fluorfenyl)-3-(2-propinyl)močoviny (4,50 g, 15,9 mmol) a pyridinu (2,56 ml, 31,8 mmol) v methylenchloridu se smísí s N-(chlorkarbonyl)isokyanátem (1,92 ml, 23,9 mmol). Reakční směs se míchá přes noc při teplotě místnosti a 90 minut zahřívá ke zpětnému toku, ochladí na teplotu místnosti a smísí s dalším množstvím pyridinu (1,30 ml) a N-(chlorkarbonylisokyanátu (1,92 ml). Vzniklá směs se míchá 10 minut, ochladí na teplotu místnosti a filtrací se oddělí pevná látka, která se promyje vodou a hexany a vysuší. Získá se sloučenina uvedená v nadpisu ve formě zlatohnědé pevné látky.

P ř í k l a d 3 3

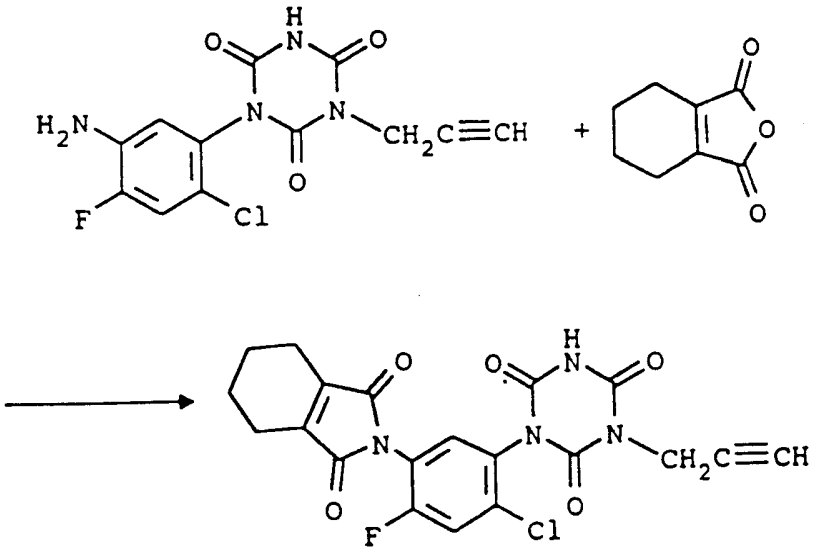
Příprava 1-(5-amino-2-chlor-4-fluorfenyl)-3-(2-propinyl)-s-triazin-2,4,6-(1H,3H,5H)-trionu



Směs 4'-chlor-2'-fluor-5'-[hexahydro-2,4,6-trioxo-3-(2-propinyl)-s-triazin-1-yl]acetanilidu (3,00 g, 8,5 mmol) a 3N kyseliny chlorovodíkové (25 ml) v ethanolu (50 ml) se 3 hodiny zahřívá ke zpětnému toku, ochladí na teplotu místnosti a nalije do ethylacetátu. Ke vzniklému organickému roztoku se přidá 3N roztok hydroxidu sodného (25 ml) a oddělí se fáze. Organická fáze se promyje postupně nasyceným roztokem hydrogenuhličitanu sodného a roztokem chloridu sodného a zkoncentruje za sníženého tlaku. Získá se sloučenina uvedená v nadpisu (2,17 g) ve formě béžové pevné látky o teplotě tání 118 až 121°C.

P ř í k l a d 3 4

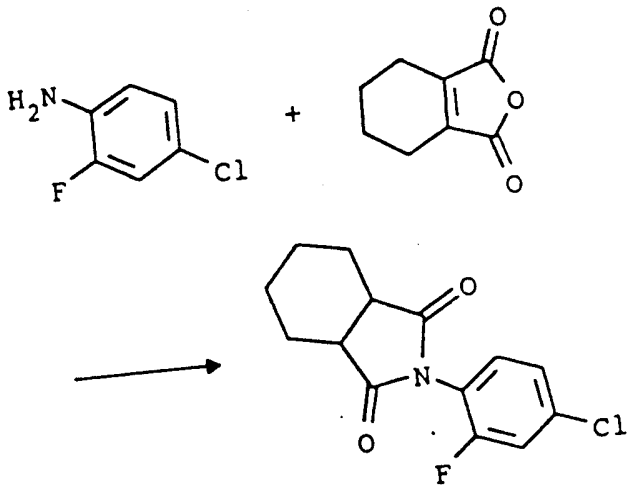
Příprava N-{4-chlor-2-fluor-5-[hexahydro-2,4,6-trioxo-3-(2-propinyl)-s-triazin-1-yl]fenyl}-1-cyklohexen-1,2-dikarboximidu



Roztok 1-(5-amino-2-chlor-4-fluorfenyl)-3-(2-propinyl)-s-triazin-2,4,6-(1H,3H,5H)-trionu (1,50 g, 4,83 mmol) a anhydridu 3,4,5,6-tetrahydroftalové kyseliny (0,73 g, 4,83 mmol) v kyselině octové (3 ml) se 5 hodin zahřívá na 100°C, ochladí a nalije do ethylacetátu. Organická směs se promyje postupně vodou, nasyceným roztokem hydrogenuhličitanu sodného a roztokem chloridu sodného, vysuší bezvodým síranem hořečnatým a zkoncentruje za sníženého tlaku. Polopevný žlutý zbytek se podrobí mžikové chromatografii na silikagelu za použití směsi ethylacetátu a hexanů v poměru 1 : 2, jako elučního činidla. Získá se sloučenina uvedená v nadpisu (1,20 g) ve formě bílé pevné látky o teplotě tání 127 až 135°C.

P ř í k l a d 3 5

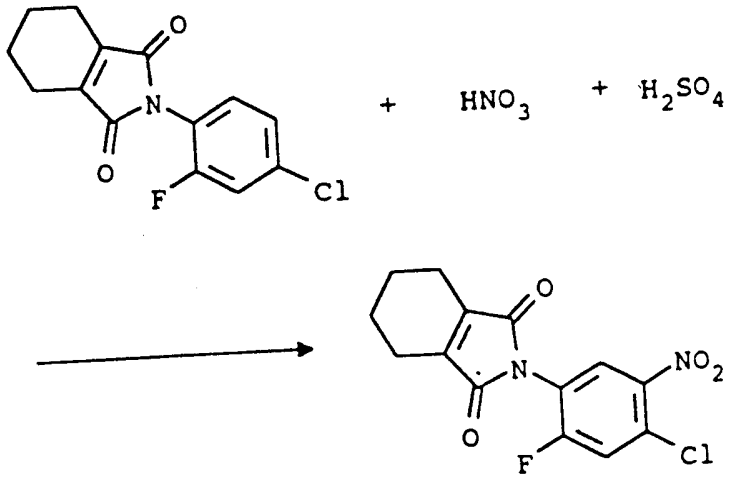
Příprava N-(4-chlor-2-fluorfenyl)-1-cyklohexen-1,2-dikarboximidu



Směs 4-chlor-2-fluoranilinu (19,0 g, 130,6 mmol) a anhydridu 3,4,5,6-tetrahydroftalové kyseliny (19,85 g, 130,6 mmol) v kyselině octové (150 ml) se 2 hodiny zahřívá ke zpětnému toku, smísí s dalším 4-chlor-2-fluoranilinem (3,0 g). Vzniklá směs se 90 minut zahřívá ke zpětnému toku, míchá přes noc při teplotě místnosti a nalije do směsi vody a ethylacetátu. Organická fáze se promyje postupně vodou, nasyceným roztokem hydrogenuhličitanu sodného a roztokem chloridu sodného, vysuší bezvodým síranem hořečnatým a zkoncentruje za sníženého tlaku. Purpurový olejovitý zbytek se podrobí mžikové chromatografii na silikagelu za použití 15% až 20% ethylacetátu v hexanech, jako elučního činidla. Získá se sloučenina uvedená v nadpisu (25,3 g) ve formě špinavě bílé pevné látky o teplotě tání 81 až 82°C.

P ř í k l a d 3 6

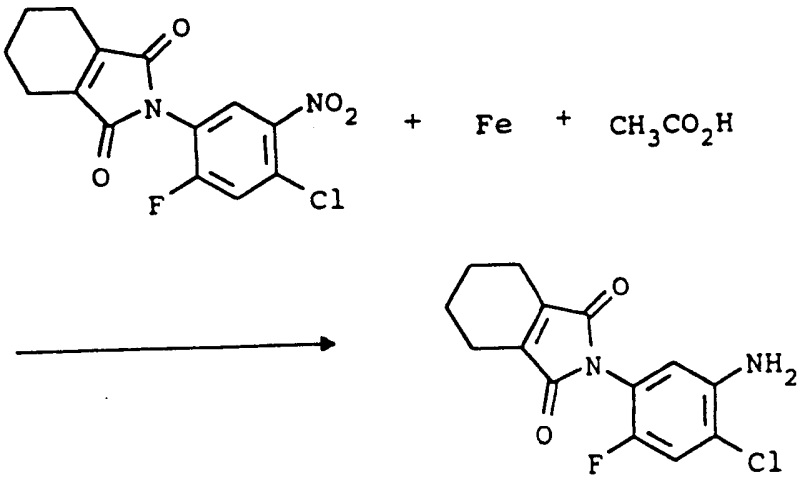
Příprava N-(4-chlor-2-fluor-5-nitrofenyl)-1-cyklohexen-1,2-dikarboximidu



Směs N-(4-chlor-2-fluorfenyl)-1-cyklohexen-1,2-dikarboximidu (24,4 g, 86,7 mmol) v kyselině sírové (150 ml) se ochladí na -3°C a po kapkách smísí s kyselinou dusičnou (70%, 6,70 ml, 104 mmol), přičemž se teplota reakční směsi udržuje na 0 až 2°C. Reakční směs se míchá 90 minut při teplotě místnosti a nalije na led. Vodná směs se míchá několik minut a poté přefiltruje. Oddělená pevná látka se promyje vodou a vysuší. Získá se sloučenina uvedená v nadpisu (28,6 g) ve formě bílého prášku o teplotě tání 152 až 155°C.

P ř í k l a d 3 7

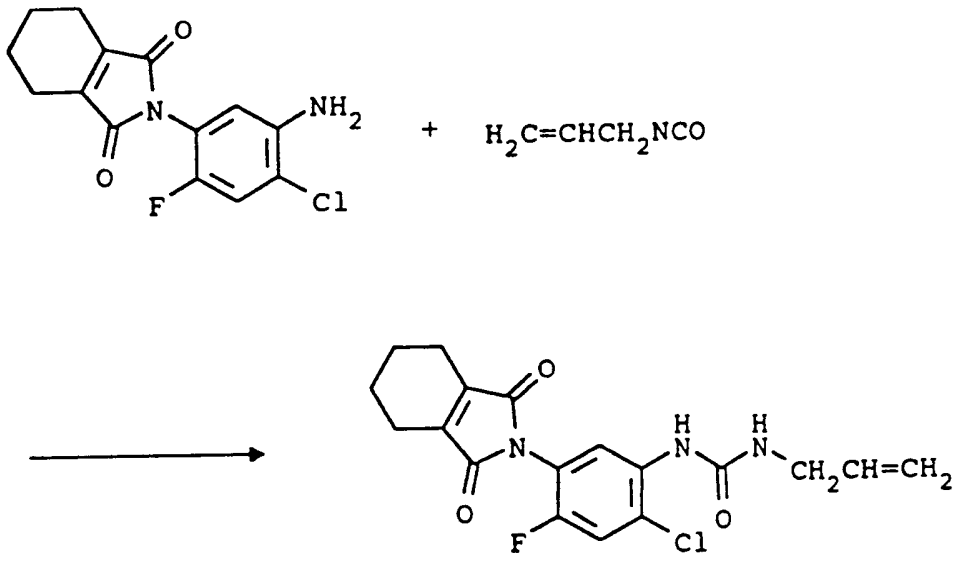
Příprava N-(5-amino-4-chlor-2-fluorfenyl)-1-cyklohexen-1,2-dikarboximidu



Železný prach (7,30 g, 130,7 mmol) se po částech při 65°C přidá ke směsi N-(4-chlor-2-fluor-5-nitrofenyl)-1-cyklohexen-1,2-dikarboximidu (10,6 g, 32,7 mmol) v kyselině octové (100 ml). Po dokončení přídavku se reakční směs míchá 10 minut a přefiltruje přes infusoriovou hlinku. Filtrát se zkoncentruje za sníženého tlaku. Tmavý pevný zbytek se smísí s roztokem ethylacetátu a nasyceného roztoku hydrogenuhličitanu sodného, výsledná směs se přefiltruje přes infusoriovou hlinku a oddělí se fáze. Organická fáze se promyje postupně nasyceným roztokem hydrogenuhličitanu sodného a roztokem chloridu sodného, vysuší bezvodým síranem hořečnatým a zkoncentruje za sníženého tlaku. Získá se sloučenina uvedená v nadpisu ve formě žluté pevné látky.

P ř í k l a d 3 8

Příprava 1-allyl-3-[2-chlor-5-(1-cyklohexen-1,2-dikarboximido)-4-fluorfenyl]močoviny

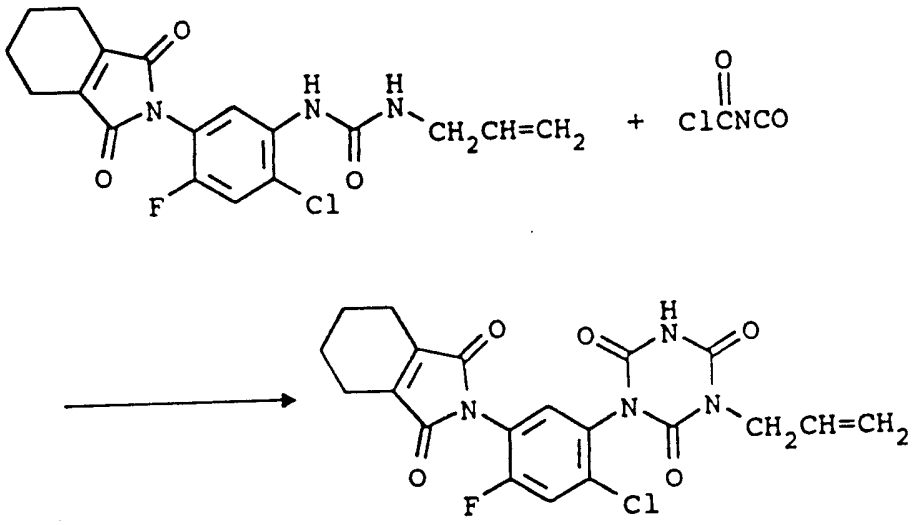


Směs N-(5-amino-4-chlor-2-fluorfenyl)-1-cyklohexen-1,2-dikarboximidu (3,50 g, 11,9 mmol) v toluenu (25 ml) se smísí s allylisokyanátem (2,10 ml, 23,8 mmol). Reakční směs

se 21 hodin zahřívá na 60°C a smísí s dalším množstvím allyisokyanátu (0,53 ml). Výsledná směs se zahřívá 3 hodiny na 60°C, ochladí na 20 až 30°C a přefiltruje. Oddělená pevná látka se promyje hexany. Získá se sloučenina uvedená v nadpisu (3,15 g) ve formě zlatohnědé pevné látky o teplotě tání 236 až 238°C.

P ř í k l a d 3 9

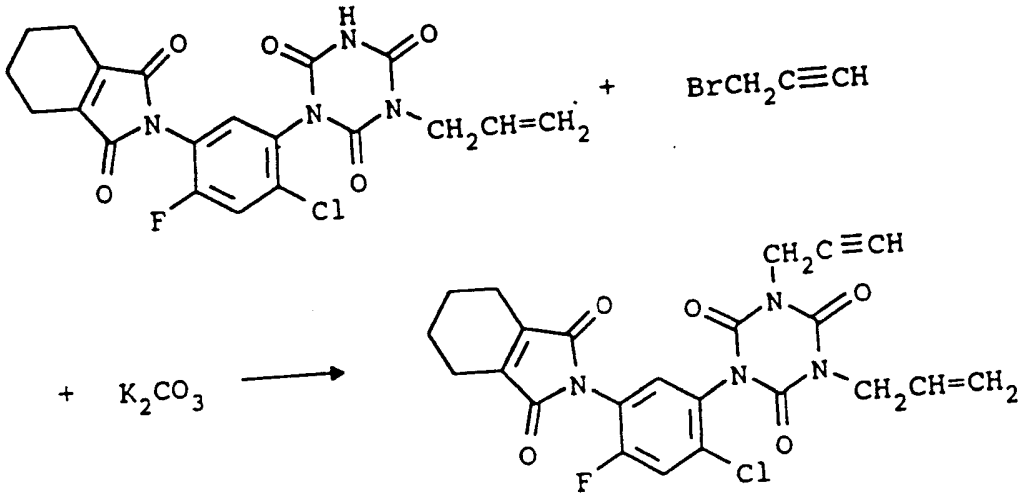
Příprava N-[5-(3-allylhexahydro-2,4,6-trioxo-s-triazin-1-yl)-4-chlor-2-fluorfenyl]-1-cyklohexen-1,2-dikarboximidu



Směs 1-allyl-3-[2-chlor-5-(1-cyklohexen-1,2-dikarboximido)-4-fluorfenyl]močoviny (2,34 g, 6,21 mmol) v toluenu (25 ml) se smísí s N-(chlorkarbonyl)isokyanátem (0,75 ml, 9,31 mmol). Výsledná směs se míchá 3 hodiny při 60°C, ochladí na teplotu místnosti a zkoncentruje za sníženého tlaku. Olejovitý zbytek se podrobí mžikové chromatografii na silikagelu za použití směsi ethylacetátu a hexanů v poměru 2 : 3, jako elučního činidla. Získá se sloučenina uvedená v nadpisu (2,6 g) ve formě bílé pevné látky o teplotě tání 130 až 145°C.

P ř í k l a d 4 0

Příprava N-{5-[3-allylhexahydro-2,4,6-trioxo-5-(2-propinyl)-s-triazin-1-yl]-4-chlor-2-fluorfenyl}-1-cyklohexen-1,2-dikarboximidu



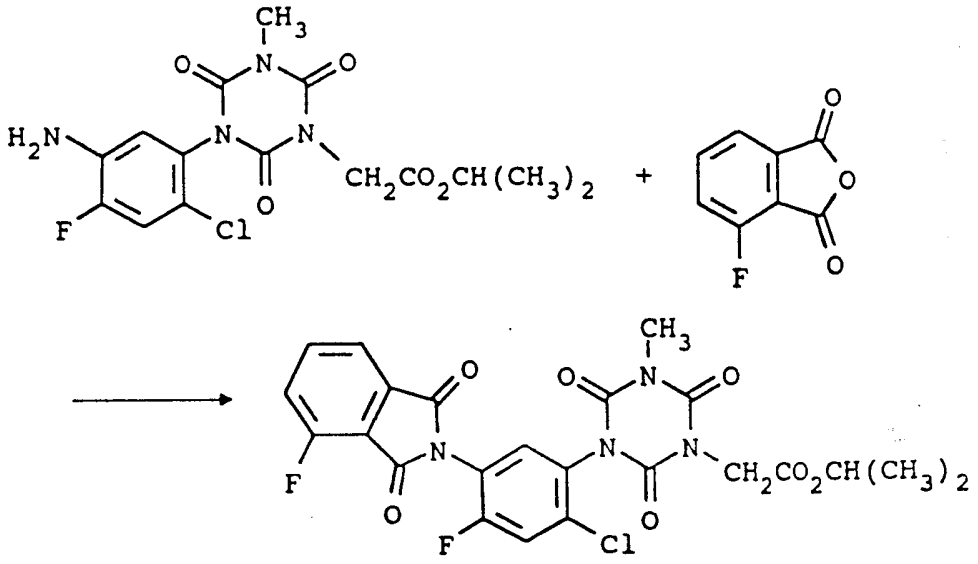
Propargylbromid (0,37 ml, 3,36 mmol) se přidá ke směsi N-[5-(3-allylhexahydro-2,4,6-trioxo-s-triazin-1-yl)-4-chlor-2-fluorfenyl]-1-cyklohexen-1,2-dikarboximidu (1,00 g, 2,24 mmol) a uhličitanu draselného (0,62 g, 4,48 mmol) v N,N-dimethylformamidu. Reakční směs se míchá 7 hodin a nalije do ethylacetátu. Organický roztok se promyje postupně vodou a roztokem chloridu sodného, vysuší bezvodým síranem hořečnatým a zkoncentruje za sníženého tlaku. Žlutý olejovitý zbytek se podrobí mžikové chromatografii na silikagelu za použití směsi ethylacetátu a hexanů v poměru 1 : 4, jako elučního činidla. Získá se sloučenina uvedená v nadpisu (0,60 g) ve formě bílé pevné látky o teplotě tání 107 až 114°C.

V podstatě stejným způsobem, ale za použití allylbromidu namísto propargylbromidu se získá N-[4-chlor-

5-(3,5-diallylhexahydro-2,4,6-trioxo-s-triazin-1-yl)-2-fluorfenyl]-1-cyklohexen-1,2-dikarboximid ve formě bílé pevné látky o teplotě tání 80 až 85°C.

Příklad 41

Příprava isopropyl-3-[2-chlor-4-fluor-5-(3-fluorftalimido)-fenyl]tetrahydro-5-methyl-2,4,6-trioxo-s-triazin-1(2H)-acetátu



Roztok isopropyl-3-(5-amino-2-chlor-4-fluorfenyl)-tetrahydro-5-methyl-2,4,6-trioxo-s-triazin-1(2H)-acetátu (1,0 g, 2,6 mmol) a anhydridu 3-fluorftalové kyseliny (0,51 g, 3,1 mmol) v kyselině octové se 6 hodin zahřívá ke zpětnému toku, míchá několik dní při teplotě místnosti a nalije na led. Vodná směs se přefiltruje a oddělená pevná látka se vysuší a chromatografuje na silikagelu za použití 2,5% etheru v methylenchloridu, jako elučního činidla. Získá se sloučenina uvedená v nadpisu ve formě žluté pěny o teplotě tání 119 až 125°C.

P ř í k l a d 4 2

Hodnocení postemergentní herbicidní účinnosti zkoušených sloučenin

Postemergentní herbicidní účinnost sloučenin podle vynálezu se demonstruje následujícími zkouškami, při nichž se různé dvojděložné a jednoděložné rostliny ošetří zkoušenými sloučeninami dispergovanými ve směsi vody a acetonu. Při těchto zkouškách se semenáčky rostlin nechají růst po dobu přibližně 2 týdnů na malých zkušebních plochách. Zkoušené sloučeniny se dispergují ve směsi vody a acetonu 50 : 50 s obsahem 0,5 % Tween 20 (polyoxyethylensorbitan-monolaurátový surfaktant od firmy Atlas Chemical Industries) v množství postačujícím pro zajištění ošetření ekvivalentního 0,125 až 0,500 kg/ha, vztaženo na účinnou sloučeninu při aplikaci na rostliny pomocí rozprašovací hubice, která pracuje za tlaku 275 kPa předepsanou dobu. Po postřiku se rostliny umístí na skleníkové police a ošetřují obvyklým způsobem srovnatelným s běžnými skleníkovými praktikami. 4 až 5 týdnů po ošetření se semenáčky prohlédnou a klasifikují podle dále uvedeného systému. Zjištěná data jsou uvedena v tabulce I. Pokud se s určitou sloučeninou provede více než jedna zkouška, představují uvedená data průměrné hodnoty.

Druhy rostlin použité při těchto zkouškách jsou identifikovány zkratkami, kterých se používá v hlavičce tabulek, českým názvem a latinským názvem.

Sloučeniny, kterých se používá při zkouškách postemergentní a preemergentní herbicidní účinnosti, jsou identifikovány číslem a chemickým názvem. V tabulce I jsou použité sloučeniny identifikovány příslušným číslem.

Klasifikační stupnice pro hodnocení herbicidní účinnosti

Výsledky hodnocení herbicidní účinnosti se klasifikují některým ze stupňů 0 až 9 z dále uvedené klasifikační stupnice. Tato klasifikační stupnice je založena na vizuálním hodnocení postoje, robustnosti, malformace, velikosti, chlorose a celkového vzhledu rostliny ve srovnání s kontrolními rostlinami.

Stupeň	Význam	Potlačení (%) ve srovnání s kontrolou
9	Úplné usmrcení	100
8	Téměř úplné usmrcení	91 až 99
7	Dobrá herbicidní účinnost	80 až 90
6	Herbicidní účinnost	65 až 79
5	Nepopiratelné poškození	45 až 64
4	Poškození	30 až 44
3	Malá účinnost	16 až 29
2	Nepatrná účinnost	6 až 15
1	Stopová účinnost	1 až 5
0	Žádná účinnost	0
-	Nehodnoceno	

Druhy rostlin použité při zkouškách herbicidní účinnosti

Zkratka	Český název	Latinský název
ABUTH	abutilon	Abutilon theophrasti, medic
AMBEL	ambrosie	Ambrosia artemisiifolia, L.

Zkratka	Český název	Latinský název
CASOB	kasie	Cassia obtusifolia, L.
CHEAL	merlík bílý	Chenopodium album, L.
IPOSS	povíjnice	Ipomoea spp.
GALAP	svízel přítula	Galium aparine
ECHCG	ježatka kuří noha	Echinochloa crus-galli, (L)Beau
SETVI	bér zelený	Setaria viridis, (L) Beauv.
GLXMAW	soja.odr.Williams	Glycine max (L) Merr.odr.Williams
ORYSAT	rýže,odr.Tebonnet	Oryza sativa, L., odr. Tebonnet
TRZAWO	ozimá pšenice, odrůda Apollo	Triticum aestivum, odr. Apollo
ZEAMX	kukuřice	Zea mays, L.

Sloučeniny hodnocené jako herbicidní činidla

Sloučenina číslo	
1	Methyl-3-[2-chlor-5-(1-cyklohexen-1,2-dikarboximido)-4-fluorfenyl]tetrahydro-5-methyl-2,4,6-trioxo-s-triazin-1(2H)-acetát
2	terc.butyl-3-[2-chlor-5-(1-cyklohexen-1,2-dikarboximido)-4-fluorfenyl]tetrahydro-5-methyl-2,4,6-trioxo-s-triazin-1(2H)-acetát

3 3-[2-chlor-5-(1-cyklohexen-1,2-dikarboximido)-4-fluorfenyl]tetrahydro-5-methyl-2,4,6-trioxo-s-triazin-1(2H)-octová kyselina

4 isopropyl-3-[2-chlor-5-(1-cyklohexen-1,2-dikarboximido)-4-fluorfenyl]tetrahydro-5-methyl-2,4,6-trioxo-s-triazin-1(2H)-acetát

5 methyl-3-[5-(1-cyklohexen-1,2-dikarboximido)-2-fluorfenyl]tetrahydro-5-methyl-2,4,6-trioxo-s-triazin-1(2H)-acetát

6 methyl-3-[2,4-dichlor-5-(1-cyklohexen-1,2-dikarboximido)fenyl]tetrahydro-5-methyl-2,4,6-trioxo-s-triazin-1(2H)-acetát

7 terc.butyl-3-[2,4-dichlor-5-(1-cyklohexen-1,2-dikarboximido)fenyl]tetrahydro-5-methyl-2,4,6-trioxo-s-triazin-1(2H)-acetát

8 1-terc.butyl, ethyldiester 5-[3-(1-cyklohexen-1,2-dikarboximido)-4-fluorfenyl]dihydro-2,4,6-trioxo-s-triazin-1,3(2H,4H)-dioctové kyseliny

9 ethyl-3-[3-(1-cyklohexen-1,2-dikarboximido)-4-fluorfenyl]tetrahydro-2,4,6-trioxo-s-triazin-1(2H)-acetát

10 methyl-3-[5-(1-cyklohexen-1,2-dikarboximido)-2,4-difluorfenyl]-5-methyl-2,4,6-trioxo-s-triazin-1(2H)-acetát

11 isopropyl-3-[2-chlor-4-fluor-5-(3-fluor-ftalimido)fenyl]tetrahydro-5-methyl-2,4,6-trioxo-s-triazin-1(2H)-acetát

12 isopropyl-3-{2-chlor-4-fluor-5-[5,6,8,8a-tetrahydro-1,3-dioxo-1H-imidazo[5,1c][1,4]-thiazin-2(3H)-yl]fenyl}tetrahydro-5-methyl-2,4,6-trioxo-s-triazin-1(2H)-acetát

13 isopropyl-3-{2-chlor-4-fluor-5-[(tetrahydro-3-oxo-1H,3H-[1,3,4]thiadiazolo[3,4-a]pyri-dazin-1-yliden)amino]fenyl}tetrahydro-5-methyl-2,4,6-trioxo-s-triazin-1(2H)-acetát

14 isopropyl-3-[2-chlor-4-fluor-5-(tetrahydro-1,3,7-trioxo-1H-imidazo[5,1-c][1,4]thiazin-2(3H)-yl)fenyl]tetrahydro-5-methyl-2,4,6-trioxo-s-triazin-1(2H)-acetát

15 N-(4-chlor-2-fluor-5-[hexahydro-2,4,6-trioxo-3-(2-propinyl)-s-triazin-1-yl]fenyl}-1-cyklohexen-1,2-dikarboximid

16 N-(4-chlor-2-fluor-5-[hexahydro-3-methyl-2,4,6-trioxo-5-(2-propinyl)-s-triazin-1-yl]fenyl}-1-cyklohexen-1,2-dikarboximid

17 N-[5-(3-allylhexahydro-5-methyl-2,4,6-trioxo-s-triazin-1-yl)-4-chlor-2-fluorfenyl]-1-cyklohexen-1,2-dikarboximid

18 N-[5-(3-allylhexahydro-2,4,6-trioxo-s-triazin-1-yl)-4-chlor-2-fluorfenyl]-1-cyklohexen-1,2-dikarboximid

19 N-[4-chlor-5-(3,5-diallylhexahydro-2,4,6-trioxo-s-triazin-1-yl)-2-fluorfenyl]-1-cyklohexen-1,2-dikarboximid

20 N-(5-[3-allylhexahydro-2,4,6-trioxo-5-(2-propinyl)-s-triazin-1-yl]-4-chlor-2-fluorfenyl)-1-cyklohexen-1,2-dikarboximid

T a b u l k a I

Hodnocení postemergentní herbicidní účinnosti zkoušených sloučenin

Sl. 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

Sl. č.	dávka (kg/ha)	ABUTH	AMBEL	CASOB	CHEAL	IPOSS	GALAP	ECHCG	SETVI	GLXMAW	ORYSAT	TRZAWO	ZEAMX
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

Sl. 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

Sl. č.	dávka (kg/ha)	ABUTH	AMBEL	CASOB	CHEAL	IPOSS	GALAP	ECHCG	SETVI	GLXMAW	ORYSAT	TRZAWO	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

Sl. 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 ř í k l a d 4 3

Hodnocení preemergentní herbicidní účinnosti zkoušených sloučenin

Preemergentní herbicidní účinnost sloučenin podle vynálezu se demonstruje následujícími zkouškami, při nichž se semena různých dvojděložných a jednoděložných rostlin odděleně smísí se zemí pro přesazování rostlin v kořenáčích, přičemž vzniklá směs se umístí jako vrchní vrstva o tloušťce přibližně 2,5 cm v oddělených pohárcích o objemu 0,47 litru. Po zasetí, které se tímto způsobem provede, se pohárky ošetří zkoušenými sloučeninami rozpuštěnými ve směsi vody a acetonu v množství postačujícím pro zajištění ošetření ekvivalentního 0,125 až 0,500 kg/ha, vztaženo na účinnou sloučeninu. Po postřiku se pohárky umístí na skleníkové police, zavodní a dále se ošetřují obvyklým způsobem srovnatelným s běžnými skleníkovými praktikami. 4 až 5 týdnů po ošetření se zkouška ukončí a pohárky se prohlédnou a klasifikují podle systému uvedeného v příkladu 42.

Zjištěná data jsou uvedena v tabulce II. V tabulce II jsou zkoušené sloučeniny identifikovány číslem, které jim bylo přiděleno v příkladu 42

Tabulka II

Hodnocení preemergentní herbicidní účinnosti zkoušených sloučenin

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

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

Sl. 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

Sl. č.	dávka (kg/ha)	ABUTH	AMBEL	CASOB	CHEAL	IPOSS	GALAP	ECHCG	SETVI	GLXMAW	ORYSAT	TRZAWO	ZEAMX
13	0,500	9,0	8,0	9,0	9,0	6,0	9,0	0,0	7,0	0,0	2,0	1,0	1,0
	0,250	9,0	3,0	9,0	9,0	5,0	8,0	0,0	7,0	0,0	1,0	0,0	0,0
	0,125	9,0	0,0	5,0	9,0	2,0	9,0	0,0	0,0	0,0	0,0	0,0	0,0
14	0,500	4,0	3,0	4,0	9,0	3,0	9,0	0,0	1,0	0,0	4,0	2,0	1,0
	0,250	0,0	2,0	2,0	6,0	1,0	7,0	0,0	0,0	0,0	2,0	1,0	0,0
	0,125	0,0	0,0	2,0	7,0	0,0	7,0	0,0	0,0	0,0	0,0	0,0	0,0
16	0,500	9,0	2,0	0,0	9,0	0,0	4,0	0,0	3,0	0,0	0,0	0,0	2,0
	0,250	6,0	0,0	0,0	8,0	0,0	0,0	0,0	0,0	0,0	0,0	0,0	1,0
	0,125	2,0	0,0	0,0	6,0	0,0	0,0	0,0	0,0	0,0	0,0	0,0	0,0
17	0,500	9,0	2,0	0,0	9,0	0,0	4,0	0,0	3,0	0,0	2,0	0,0	3,0
	0,250	3,0	0,0	0,0	9,0	0,0	7,0	0,0	0,0	0,0	0,0	0,0	0,0
	0,125	0,0	0,0	0,0	6,0	0,0	0,0	0,0	0,0	0,0	0,0	0,0	0,0

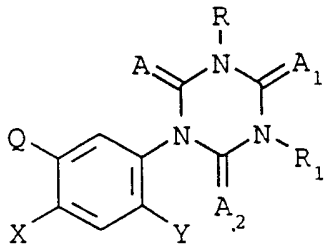
Sl. č.	dávka (kg/ha)	ABUTH	AMBEL	CASOB	CHEAL	IPOSS	GALAP	ECHCG	SETVI	GLXMAW	ORYSAT	TRZAWO	ZEAMX
18	0,500	0,0	0,0	0,0	7,0	4,0	4,0	0,0	0,0	0,0	0,0	0,0	0,0
	0,250	0,0	0,0	0,0	5,0	0,0	0,0	0,0	0,0	0,0	0,0	0,0	0,0
	0,125	0,0	0,0	0,0	0,0	0,0	0,0	0,0	0,0	0,0	0,0	0,0	0,0

1467-96

PŘIJ. 17. 11. 97 005/10 0126410

PATENTOVÉ NÁROKY

1. Sloučeniny obecného vzorce I



(I)

kde

X a Y představuje každý nezávisle atom vodíku, atom halogenu, nitroskupinu, kyanoskupinu, alkylskupinu s 1 až 4 atomy uhlíku, halogenalkylskupinu s 1 až 4 atomy uhlíku, alkoxyskupinu s 1 až 4 atomy uhlíku, halogenalkoxyskupinu s 1 až 4 atomy uhlíku nebo skupinu vzorce $S(O)_mR_2$;

m představuje celé číslo 0, 1 nebo 2;

R_2 představuje alkylskupinu s 1 až 4 atomy uhlíku nebo halogenalkylskupinu s 1 až 4 atomy uhlíku;

R představuje atom vodíku, alkylskupinu s 1 až 6 atomy uhlíku, alkoxyalkylskupinu se 2 až 12 atomy uhlíku, alkylkarbonylalkylskupinu se 3 až 12 atomy uhlíku, halogenalkylkarbonylalkylskupinu se 3 až 12 atomy uhlíku, alkoxykarbonylalkylskupinu se 3 až 12 atomy uhlíku, halogenalkoxykarbonylalkylskupinu se 3 až 12 atomy uhlíku, alkenylskupinu se 3 až 6 atomy uhlíku, alkinylskupinu se 3 až 6 atomy uhlíku, atom alkalického kovu,

fenylskupinu, která je popřípadě substituována jedním až třemi substituenty zvolenými ze souboru zahrnujícího atom halogenu, alkylskupinu s 1 až

4 atomy uhlíku, alkoxyskupinu s 1 až 4 atomy uhlíku a halogenalkoxyskupinu s 1 až 4 atomy uhlíku, nebo

benzylskupinu, která je popřípadě substituována jedním až třemi substituenty zvolenými ze souboru zahrnujícího atom halogenu, alkylskupinu s 1 až 4 atomy uhlíku, alkoxyskupinu s 1 až 4 atomy uhlíku a halogenalkoxyskupinu s 1 až 4 atomy uhlíku;

R_1 představuje atom vodíku, alkenylskupinu se 3 až 6 atomy uhlíku, alkinylskupinu se 3 až 6 atomy uhlíku, kyanoskupinu,

alkylskupinu s 1 až 12 atomy uhlíku, která je popřípadě substituována jedním nebo více atomy halogenu nebo jedním substituentem zvoleným ze souboru zahrnujícího kyanoskupinu, skupinu vzorce $C(O)R_3$, $C(W)R_4$, $OC(O)R_5$, $CH_2OC(O)R_5$, OR_4, CH_2OR_4 a $CR_6(OR_7)_2$ nebo jednou fenylskupinou, která je popřípadě substituována jedním až třemi substituenty zvolenými ze souboru zahrnujícího atom halogenu, alkylskupinu s 1 až 4 atomy uhlíku, alkoxyskupinu s 1 až 4 atomy uhlíku a halogenalkoxyskupinu s 1 až 4 atomy uhlíku, nebo

fenylskupinu, která je popřípadě substituována jedním až třemi substituenty zvolenými ze souboru zahrnujícího atom halogenu, alkylskupinu s 1 až 4 atomy uhlíku, alkoxyskupinu s 1 až 4 atomy uhlíku a halogenalkoxyskupinu s 1 až 4 atomy uhlíku;

R_3 představuje hydroxyskupinu nebo skupinu vzorce OR_8, SR_8 nebo NR_9R_{10};

W představuje atom kyslíku nebo skupinu vzorce NOR_9, $NCOR_9$ nebo $NNHCONH_2$;

R_4, R_5 a R_6 představuje každý nezávisle atom vodíku, alkylskupinu s 1 až 4 atomy uhlíku nebo halogenalkylskupinu s 1 až 4 atomy uhlíku;

R_7 představuje alkylskupinu s 1 až 4 atomy uhlíku;

R_8 představuje

alkylskupinu s 1 až 6 atomy uhlíku, která je popřípadě substituována substituentem zvoleným ze souboru zahrnujícího alkoxyskupinu s 1 až 4 atomy uhlíku, alkylthioskupinu s 1 až 4 atomy uhlíku, atom halogenu, hydroxyskupinu, cykloalkylskupinu se 3 až 6 atomy uhlíku, furylskupinu nebo fenylskupinu, která je popřípadě substituována jedním nebo více substituenty zvolenými ze souboru zahrnujícího atom halogenu, kyanoskupinu, nitroskupinu, alkylskupinu s 1 až 4 atomy uhlíku, halogenalkylskupinu s 1 až 4 atomy uhlíku, alkoxyskupinu s 1 až 4 atomy uhlíku a halogenalkoxyskupinu s 1 až 4 atomy uhlíku,

alkenylskupinu se 3 až 6 atomy uhlíku, která je popřípadě substituována substituentem zvoleným ze souboru zahrnujícího alkoxyskupinu s 1 až 4 atomy uhlíku, atom halogenu, cykloalkylskupinu se 3 až 6 atomy uhlíku a fenylskupinu, která je popřípadě substituována jedním nebo více substituenty zvolenými ze souboru zahrnujícího atom

halogenu, kyanoskupinu, nitroskupinu, alkylskupinu s 1 až 4 atomy uhlíku, halogenalkylskupinu s 1 až 4 atomy uhlíku, alkoxyskupinu s 1 až 4 atomy uhlíku a halogenalkoxyskupinu s 1 až 4 atomy uhlíku,

alkinylskupinu se 3 až 6 atomy uhlíku, která je popřípadě substituována alkoxyskupinou s 1 až 4 atomy uhlíku nebo atomem halogenu;

cykloalkylskupinu se 3 až 6 atomy uhlíku,

skupinu vzorce $N=C(R_4R_5)$ nebo

atom alkalického kovu, kovu alkalických zemin, manganu, mědi, zinku, kobaltu, stříbra, niklu, amonný nebo organoamoniový kation;

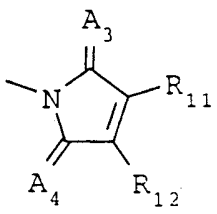
R_9 a R_{10} představuje každý nezávisle vždy atom vodíku, alkylskupinu s 1 až 6 atomy uhlíku,

benzylskupinu, která je popřípadě substituována jedním nebo více substituenty zvolenými ze souboru zahrnujícího atom halogenu, kyanoskupinu, nitroskupinu, alkylskupinu s 1 až 4 atomy uhlíku, halogenalkylskupinu s 1 až 4 atomy uhlíku, alkoxyskupinu s 1 až 4 atomy uhlíku a halogenalkoxyskupinu s 1 až 4 atomy uhlíku, nebo

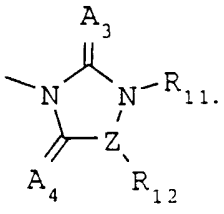
fenylskupinu, která je popřípadě substituována jedním nebo více substituenty zvolenými ze souboru zahrnujícího atom halogenu, kyanoskupinu, nitroskupinu, alkylskupinu s 1 až 4 atomy uhlíku, halogenalkylskupinu s 1 až 4 atomy uhlíku,

alkoxyskupinu s 1 až 4 atomy uhlíku a halogenalkoxyskupinu s 1 až 4 atomy uhlíku;

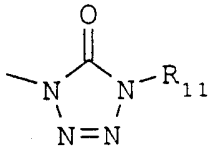
Q představuje skupinu vzorce Q1 až Q32



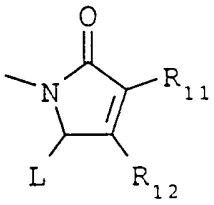
Q1



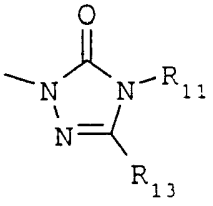
Q2



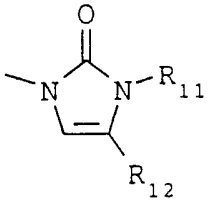
Q3



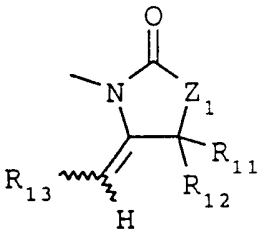
Q4



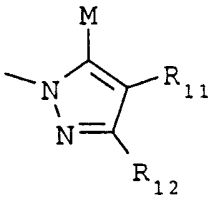
Q5



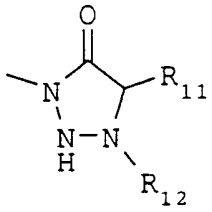
Q6



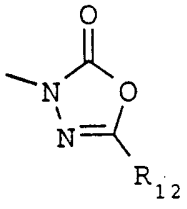
Q7



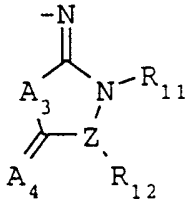
Q8



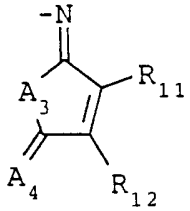
Q9



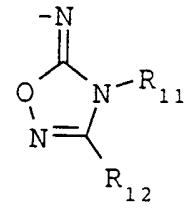
Q10



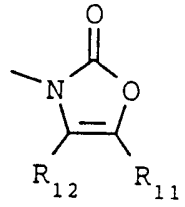
Q11



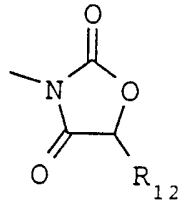
Q12



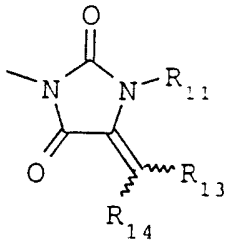
Q13



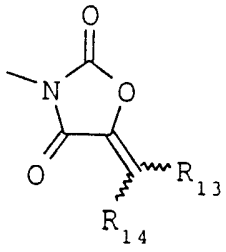
Q14



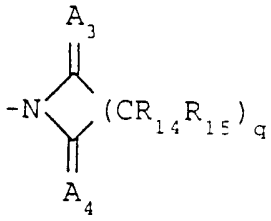
Q15



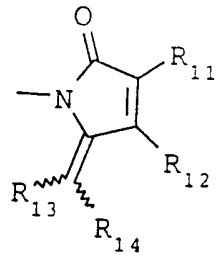
Q16



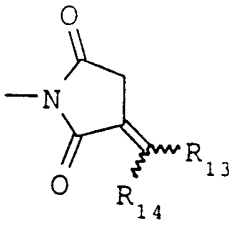
Q17



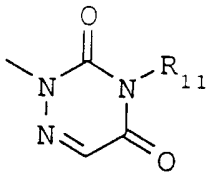
Q18



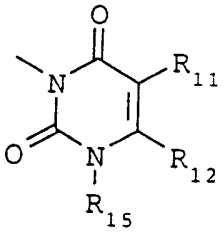
Q19



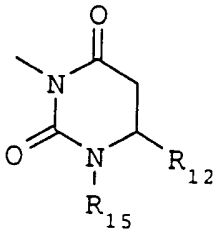
Q20



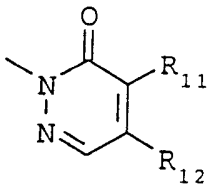
Q21



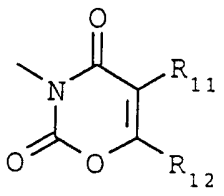
Q22



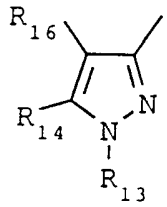
Q23



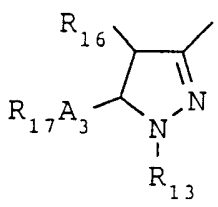
Q24



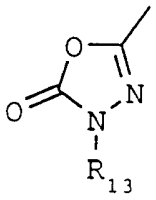
Q25



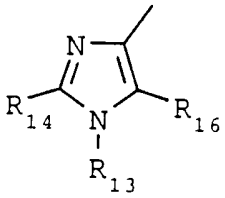
Q26



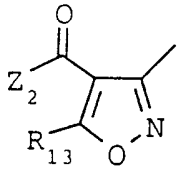
Q27



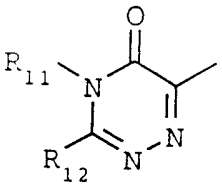
Q28



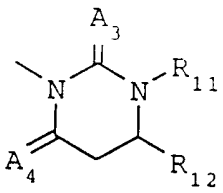
Q29



Q30



nebo



Q31 Q32

R_{11} a R_{12} představuje nezávisle vždy

atom vodíku,

alkylskupinu s 1 až 6 atomy uhlíku, která je popřípadě substituována jedním nebo více atomy halogenu, nebo

cykloalkylskupinu se 3 až 6 atomy uhlíku, která je popřípadě substituována jedním nebo více atomy halogenu, a dále

R_{11} a R_{12} dohromady s atomy, k nimž jsou připojeny představují čtyř až sedmičlenný nasycený nebo nenasycený kruh, který je popřípadě přerušen atomem kyslíku, $S(O)_r$ nebo atomem dusíku a který je popřípadě substituován jednou až třemi methylskupinami nebo jedním nebo více atomy halogenu;

R_{13}, R_{14} a R_{15} představuje nezávisle vždy atom vodíku, alkylskupinu s 1 až 3 atomy uhlíku nebo halogenalkylskupinu s 1 až 3 atomy uhlíku;

R_{16} představuje atom vodíku nebo halogenu;

R_{17} představuje alkylskupinu s 1 až 4 atomy uhlíku nebo halogenalkylskupinu s 1 až 4 atomy uhlíku;

A, A_1, A_2, A_3 a A_4 představuje nezávisle vždy atom kyslíku nebo síry;

L představuje hydroxyskupinu, atom halogenu, alkoxyskupinu s 1 až 3 atomy uhlíku nebo alkylthioskupinu s 1 až 3 atomy uhlíku;

M představuje atom halogenu nebo alkylskupinu s 1 až 3 atomy uhlíku;

Z představuje atom dusíku nebo skupinu CH;

Z_1 představuje skupinu NR_9 nebo atom kyslíku;

Z_2 představuje skupinu OR_7 nebo NR_9R_{10};

r představuje celé číslo 0, 1 nebo 2; a

q představuje celé číslo 2, 3 nebo 4.

2. Sloučeniny podle nároku 1 obecného vzorce I, kde

X představuje atom fluoru nebo chloru;

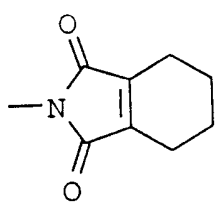
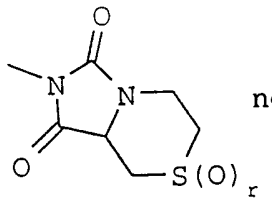
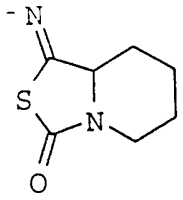
Y představuje atom chloru;

R představuje alkylskupinu s 1 až 4 atomy uhlíku, allylskupinu nebo propargylskupinu;

R_1 představuje skupinu vzorce $CH_2CO_2R_8$;

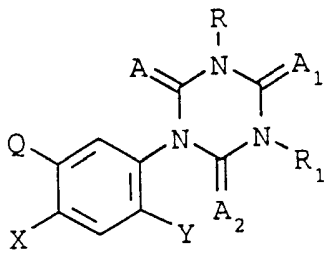
R_8 představuje alkylskupinu s 1 až 4 atomy uhlíku;

Q představuje skupinu vzorce



nebo


3. Sloučenina podle nároku 2, kterou je isopropyl-3-{2-chlor-4-fluor-5-[5,6,8,8a-tetrahydro-1,3-dioxo-1H-imidazo[5,1-c][1,4]thiazin-2(3H)-yl]fenyl}tetrahydro-5-methyl-2,4,6-trioxo-s-triazin-1(2H)-acetát.

4. Způsob potlačování nežádoucích druhů rostlin, v y z n a č u j í c í s e t í m , že se na listy těchto rostlin nebo na půdu nebo do vody obsahující semena nebo jiné propagační orgány těchto rostlin aplikuje herbicidně účinné množství sloučeniny podle nároku 1 obecného vzorce I



(I)

kde X, Y, R, R_1, A, A_1, A_2 a Q mají význam uvedený v nároku 1.

5. Způsob podle nároku 4, v y z n a č u j í c í s e t í m , že sloučenina je zvolena ze souboru zahrnujícího

isopropyl 3-{2-chlor-4-fluor-5-[5,6,8,8a-tetrahydro-1,3-dioxo-1H-imidazo[5,1-c][1,4]thiazin-2(3H)-yl]fenyl}tetrahydro-5-methyl-2,4,6-trioxo-s-triazin-1(2H)-acetát;

terc.butyl-3-[2-chlor-5-(1-cyklohexen-1,2-dikarboximido)-4-fluorfenyl]tetrahydro-5-methyl-2,4,6-trioxo-s-triazin-1(2H)-acetát;

isopropyl-3-[2-chlor-5-(1-cyklohexen-1,2-dikarboximido)-4-fluorfenyl]tetrahydro-5-methyl-2,4,6-trioxo-s-triazin-1(2H)-acetát;

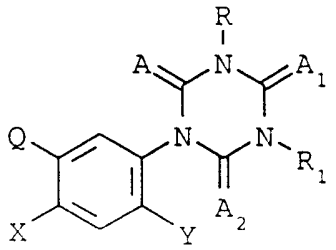
methyl-3-[2-chlor-5-(1-cyklohexen-1,2-dikarboximido)-4-fluorfenyl]tetrahydro-5-methyl-2,4,6-trioxo-s-triazin-1(2H)-acetát;

isopropyl 3-{2-chlor-4-fluor-5-[(tetrahydro-3-oxo-1H,3H-[1,3,4]thiadiazolo[3,4-a]pyridazin-1-yliden)amino]fenyl}-tetrahydro-5-methyl-2,4,6-trioxo-s-triazin-1(2H)-acetát a

isopropyl 3-[2-chlor-4-fluor-5-(tetrahydro-1,3,7-trioxo-1H-imidazo[5,1-c][1,4]thiazin-2(3H)-yl)fenyl]tetrahydro-5-methyl-2,4,6-trioxo-s-triazin-1(2H)-acetát.

6. Způsob podle nároku 4, v y z n a č u j í c í s e t í m , že se sloučenina aplikuje na listy rostlin nebo do půdy nebo do vody, které obsahují semena nebo jiné propagační orgány těchto rostlin v dávce asi 0,016 kg/ha až 4,0 kg/ha.

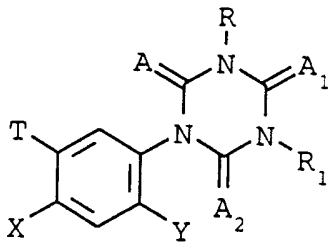
7. Herbicidní prostředek, v y z n a č u j í c í s e t í m , že obsahuje inertní pevný nebo kapalný nosič a herbicidně účinné množství sloučeniny podle nároku 1 obecného vzorce I



(I)

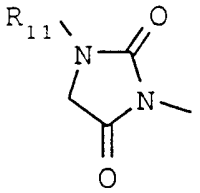
kde X, Y, R, R_1, A, A_1, A_2 a Q mají význam uvedený v nároku 1.

8. Sloučeniny obecného vzorce

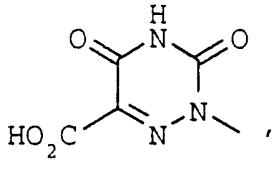


kde

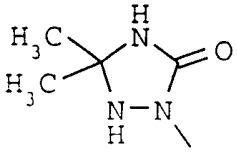
T přestavuje skupinu vzorce $-NH_2$, -NCO, -NCS, $-N_3$, $NHNH_2$, $NHC(S)NHR_{11}$, $-C(O)NHNHR_{13}$, -C(O)H, $-C(O)CH_3$, $-C(O)CO_2$(alkyl s 1 až 4 atomy uhlíku), $-C(O)CH_2C(O)R_{11}$, $-C(O)CH_2C(A_3)O$(alkyl s 1 až 4 atomy uhlíku), $-CO_2$(alkyl s 1 až 4 atomy uhlíku), $-N=C=NR_{11}$, $-NHC(O)NHR_{11}$, $-NHC(S)NR_{11}HNR_{12}$, $-N=C(SCH_3)NHR_{11}$, $-NHCO_2$(alkyl s 1 až 4 atomy uhlíku), -C(Cl)=NOH,



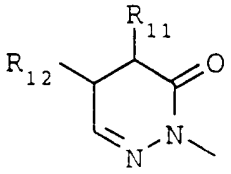
,



,



nebo



;

X a Y představuje každý nezávisle atom vodíku, atom halogenu, nitroskupinu, kyanoskupinu, alkylskupinu s 1 až 4 atomy uhlíku, halogenalkylskupinu s 1 až 4 atomy uhlíku, alkoxyskupinu s 1 až 4 atomy uhlíku, halogenalkoxyskupinu s 1 až 4 atomy uhlíku nebo skupinu vzorce $S(O)_mR_2$;

m představuje celé číslo 0, 1 nebo 2;

R_2 představuje alkylskupinu s 1 až 4 atomy uhlíku nebo halogenalkylskupinu s 1 až 4 atomy uhlíku;

R představuje atom vodíku, alkylskupinu s 1 až 6 atomy uhlíku, alkoxyalkylskupinu se 2 až 12 atomy uhlíku, alkylkarbonylalkylskupinu se 3 až 12 atomy

uhlíku, halogenalkylkarbonylalkylskupinu se 3 až 12 atomy uhlíku, alkoxykarbonylalkylskupinu se 3 až 12 atomy uhlíku, halogenalkoxykarbonylalkylskupinu se 3 až 12 atomy uhlíku, alkenylskupinu se 3 až 6 atomy uhlíku, alkinylskupinu se 3 až 6 atomy uhlíku,

fenylskupinu, která je popřípadě substituována jedním až třemi substituenty zvolenými ze souboru zahrnujícího atom halogenu, alkylskupinu s 1 až 4 atomy uhlíku, alkoxyskupinu s 1 až 4 atomy uhlíku a halogenalkoxyskupinu s 1 až 4 atomy uhlíku, nebo

benzylskupinu, která je popřípadě substituována jedním až třemi substituenty zvolenými ze souboru zahrnujícího atom halogenu, alkylskupinu s 1 až 4 atomy uhlíku, alkoxyskupinu s 1 až 4 atomy uhlíku a halogenalkoxyskupinu s 1 až 4 atomy uhlíku;

R_1 představuje atom vodíku, alkenylskupinu se 3 až 6 atomy uhlíku, alkinylskupinu se 3 až 6 atomy uhlíku, kyanoskupinu,

alkyl skupinu s 1 až 12 atomy uhlíku, která je popřípadě substituována jedním nebo více atomy halogenu nebo jedním substituentem zvoleným ze souboru zahrnujícího kyanoskupinu, skupinu vzorce $C(O)R_3$, $OC(O)R_5$, $CH_2OC(O)R_5$, OR_4, CH_2OR_4 a $CR_6(OR_7)_2$ nebo jednou fenylskupinou, která je popřípadě substituována jedním až třemi substituenty zvolenými ze souboru zahrnujícího atom halogenu, alkylskupinu s 1 až 4 atomy uhlíku, alkoxyskupinu

s 1 až 4 atomy uhlíku a halogenalkoxyskupinu s 1 až 4 atomy uhlíku, nebo

fenylskupinu, která je popřípadě substituována jedním až třemi substituenty zvolenými ze souboru zahrnujícího atom halogenu, alkylskupinu s 1 až 4 atomy uhlíku, alkoxyskupinu s 1 až 4 atomy uhlíku a halogenalkoxyskupinu s 1 až 4 atomy uhlíku;

R_3 představuje skupinu vzorce OR_8, SR_8 nebo NR_9R_{10};

R_4, R_5 a R_6 představuje každý nezávisle atom vodíku, alkylskupinu s 1 až 4 atomy uhlíku nebo halogenalkylskupinu s 1 až 4 atomy uhlíku;

R_7 představuje alkylskupinu s 1 až 4 atomy uhlíku;

R_8 představuje

alkylskupinu s 1 až 6 atomy uhlíku, která je popřípadě substituována substituentem zvoleným ze souboru zahrnujícího alkoxyskupinu s 1 až 4 atomy uhlíku, alkylthioskupinu s 1 až 4 atomy uhlíku, atom halogenu, hydroxyskupinu, cykloalkylskupinu se 3 až 6 atomy uhlíku, furylskupinu nebo fenylskupinu, která je popřípadě substituována jedním nebo více substituenty zvolenými ze souboru zahrnujícího atom halogenu, kyanoskupinu, nitroskupinu, alkylskupinu s 1 až 4 atomy uhlíku, halogenalkylskupinu s 1 až 4 atomy uhlíku, alkoxyskupinu s 1 až 4 atomy uhlíku a halogenalkoxyskupinu s 1 až 4 atomy uhlíku,

alkenylskupinu se 3 až 6 atomy uhlíku, která je popřípadě substituována substituentem zvoleným ze souboru zahrnujícího alkoxyskupinu s 1 až 4 atomy uhlíku, atom halogenu, cykloalkylskupinu se 3 až 6 atomy uhlíku a fenylskupinu, která je popřípadě substituována jedním nebo více substituenty zvolenými ze souboru zahrnujícího atom halogenu, kyanoskupinu, nitroskupinu, alkylskupinu s 1 až 4 atomy uhlíku, halogenalkylskupinu s 1 až 4 atomy uhlíku, alkoxyskupinu s 1 až 4 atomy uhlíku a halogenalkoxyskupinu s 1 až 4 atomy uhlíku,

alkinylskupinu se 3 až 6 atomy uhlíku, která je popřípadě substituována alkoxyskupinou s 1 až 4 atomy uhlíku nebo atomem halogenu; nebo

cykloalkylskupinu se 3 až 6 atomy uhlíku;

R_9 a R_{10} představuje každý nezávisle vždy atom vodíku, alkylskupinu s 1 až 6 atomy uhlíku,

benzylskupinu, která je popřípadě substituována jedním nebo více substituenty zvolenými ze souboru zahrnujícího atom halogenu, kyanoskupinu, nitroskupinu, alkylskupinu s 1 až 4 atomy uhlíku, halogenalkylskupinu s 1 až 4 atomy uhlíku, alkoxyskupinu s 1 až 4 atomy uhlíku a halogenalkoxyskupinu s 1 až 4 atomy uhlíku, nebo

fenylskupinu, která je popřípadě substituována jedním nebo více substituenty zvolenými ze souboru zahrnujícího atom halogenu, kyanoskupinu, nitroskupinu, alkylskupinu s 1 až 4 atomy uhlíku, halogenalkylskupinu s 1 až 4 atomy uhlíku,

alkoxyskupinu s 1 až 4 atomy uhlíku a halogenalkoxyskupinu s 1 až 4 atomy uhlíku;

R_{11} a R_{12} představuje nezávisle vždy

atom vodíku,

alkylskupinu s 1 až 6 atomy uhlíku, která je popřípadě substituována jedním nebo více atomy halogenu, nebo

cykloalkylskupinu se 3 až 6 atomy uhlíku, která je popřípadě substituována jedním nebo více atomy halogenu, a dále též

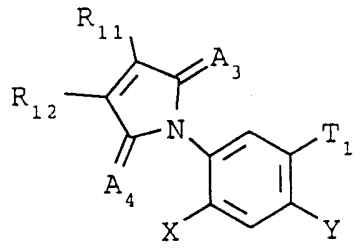
R_{11} a R_{12} dohromady s atomy, k nimž jsou připojeny, představují čtyř- až sedmičlenný nasycený nebo nenasycený kruh, který je popřípadě přerušen atomem kyslíku, $S(O)_r$ nebo atomem dusíku a který je popřípadě substituován jednou až třemi methylskupinami nebo jedním nebo více atomy halogenu;

R_{13} představuje atom vodíku, alkylskupinu s 1 až 3 atomy uhlíku nebo halogenalkylskupinu s 1 až 3 atomy uhlíku;

A, A_1, A_2 a A_3 představuje nezávisle vždy atom kyslíku nebo síry; a

r představuje celé číslo 0, 1 nebo 2.

9. Sloučeniny obecného vzorce



kde

T_1 představuje skupinu NO_2, NH_2 nebo -NHC(A)NHR;

A, A_3 a A_4 představuje každý nezávisle atom kyslíku nebo síry;

X a Y představuje každý nezávisle atom vodíku, atom halogenu, nitroskupinu, kyanoskupinu, alkylskupinu s 1 až 4 atomy uhlíku, halogenalkylskupinu s 1 až 4 atomy uhlíku, alkoxyskupinu s 1 až 4 atomy uhlíku, halogenalkoxyskupinu s 1 až 4 atomy uhlíku nebo skupinu vzorce $S(O)_mR_2$;

m představuje celé číslo 0, 1 nebo 2;

R_2 představuje alkylskupinu s 1 až 4 atomy uhlíku nebo halogenalkylskupinu s 1 až 4 atomy uhlíku;

R představuje atom vodíku, alkylskupinu s 1 až 6 atomy uhlíku, alkoxyalkylskupinu se 2 až 12 atomy uhlíku, alkylkarbonylalkylskupinu se 3 až 12 atomy uhlíku, halogenalkylkarbonylalkylskupinu se 3 až 12 atomy uhlíku, alkoxykarbonylalkylskupinu se 3 až 12 atomy uhlíku, halogenalkoxykarbonylalkylskupinu se 3 až 12 atomy uhlíku, alkenylskupinu se 3 až 6 atomy uhlíku, alkinylskupinu se 3 až 6 atomy uhlíku,

fenylskupinu, která je popřípadě substituována jedním až třemi substituenty zvolenými ze souboru zahrnujícího atom halogenu, alkylskupinu s 1 až 4 atomy uhlíku, alkoxyskupinu s 1 až 4 atomy uhlíku a halogenalkoxyskupinu s 1 až 4 atomy uhlíku, nebo

benzylskupinu, která je popřípadě substituována jedním až třemi substituenty zvolenými ze souboru zahrnujícího atom halogenu, alkylskupinu s 1 až 4 atomy uhlíku, alkoxyskupinu s 1 až 4 atomy uhlíku a halogenalkoxyskupinu s 1 až 4 atomy uhlíku;

R_{11} a R_{12} představuje nezávisle vždy

atom vodíku,

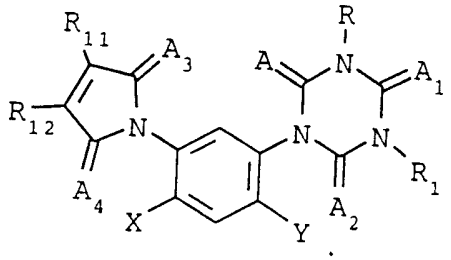
alkylskupinu s 1 až 6 atomy uhlíku, která je popřípadě substituována jedním nebo více atomy halogenu, nebo

cykloalkylskupinu se 3 až 6 atomy uhlíku, která je popřípadě substituována jedním nebo více atomy halogenu, a dále též

R_{11} a R_{12} dohromady s atomy, k nimž jsou připojeny, představují čtyř- až sedmičlenný nasycený nebo nenasycený kruh, který je popřípadě přerušen atomem kyslíku, $S(O)_r$ nebo atomem dusíku a který je popřípadě substituován jednou až třemi methylskupinami nebo jedním nebo více atomy halogenu; a

r představuje celé číslo 0, 1 nebo 2.

10. Způsob výroby sloučenin obecného vzorce



kde

X a Y představuje každý nezávisle atom vodíku, atom halogenu, nitroskupinu, kyanoskupinu, alkylskupinu s 1 až 4 atomy uhlíku, halogenalkylskupinu s 1 až 4 atomy uhlíku, alkoxyskupinu s 1 až 4 atomy uhlíku, halogenalkoxyskupinu s 1 až 4 atomy uhlíku nebo skupinu vzorce $S(O)_mR_2$;

m představuje celé číslo 0, 1 nebo 2;

R_2 představuje alkylskupinu s 1 až 4 atomy uhlíku nebo halogenalkylskupinu s 1 až 4 atomy uhlíku;

R představuje alkylskupinu s 1 až 6 atomy uhlíku, alkoxyalkylskupinu se 2 až 12 atomy uhlíku, alkylkarbonylalkylskupinu se 3 až 12 atomy uhlíku, halogenalkylkarbonylalkylskupinu se 3 až 12 atomy uhlíku, alkoxykarbonylalkylskupinu se 3 až 12 atomy uhlíku, halogenalkoxykarbonylalkylskupinu se 3 až 12 atomy uhlíku, alkenylskupinu se 3 až 6 atomy uhlíku, alkinylskupinu se 3 až 6 atomy uhlíku,

fenylskupinu, která je popřípadě substituována jedním až třemi substituenty zvolenými ze souboru zahrnujícího atom halogenu, alkylskupinu s 1 až 4 atomy uhlíku, alkoxyskupinu s 1 až 4 atomy

uhlíku a halogenalkoxyskupinu s 1 až 4 atomy uhlíku, nebo

benzylskupinu, která je popřípadě substituována jedním až třemi substituenty zvolenými ze souboru zahrnujícího atom halogenu, alkylskupinu s 1 až 4 atomy uhlíku, alkoxyskupinu s 1 až 4 atomy uhlíku a halogenalkoxyskupinu s 1 až 4 atomy uhlíku;

R_1 představuje atom vodíku, alkenylskupinu se 3 až 6 atomy uhlíku, alkinylskupinu se 3 až 6 atomy uhlíku,

alkylskupinu s 1 až 12 atomy uhlíku, která je popřípadě substituována jedním nebo více atomy halogenu nebo jedním substituentem zvoleným ze souboru zahrnujícího kyanoskupinu, skupinu vzorce $C(O)R_3$, $OC(O)R_5$, $CH_2OC(O)R_5$, OR_4, CH_2OR_4 a $CR_6(OR_7)_2$ nebo jednou fenylskupinou, která je popřípadě substituována jedním až třemi substituenty zvolenými ze souboru zahrnujícího atom halogenu, alkylskupinu s 1 až 4 atomy uhlíku, alkoxyskupinu s 1 až 4 atomy uhlíku a halogenalkoxyskupinu s 1 až 4 atomy uhlíku, nebo

fenylskupinu, která je popřípadě substituována jedním až třemi substituenty zvolenými ze souboru zahrnujícího atom halogenu, alkylskupinu s 1 až 4 atomy uhlíku, alkoxyskupinu s 1 až 4 atomy uhlíku a halogenalkoxyskupinu s 1 až 4 atomy uhlíku;

R_3 představuje skupinu vzorce OR_8, SR_8 nebo NR_9R_{10};

R_4, R_5 a R_6 představuje každý nezávisle atom vodíku, alkylskupinu s 1 až 4 atomy uhlíku nebo halogenalkylskupinu s 1 až 4 atomy uhlíku;

R_7 představuje alkylskupinu s 1 až 4 atomy uhlíku;

R_8 představuje

alkylskupinu s 1 až 6 atomy uhlíku, která je popřípadě substituována substituentem zvoleným ze souboru zahrnujícího alkoxyskupinu s 1 až 4 atomy uhlíku, alkylthioskupinu s 1 až 4 atomy uhlíku, atom halogenu, hydroxyskupinu, cykloalkylskupinu se 3 až 6 atomy uhlíku, furylskupinu nebo fenylskupinu, která je popřípadě substituována jedním nebo více substituenty zvolenými ze souboru zahrnujícího atom halogenu, kyanoskupinu, nitroskupinu, alkylskupinu s 1 až 4 atomy uhlíku, halogenalkylskupinu s 1 až 4 atomy uhlíku, alkoxyskupinu s 1 až 4 atomy uhlíku a halogenalkoxyskupinu s 1 až 4 atomy uhlíku,

alkenylskupinu se 3 až 6 atomy uhlíku, která je popřípadě substituována substituentem zvoleným ze souboru zahrnujícího alkoxyskupinu s 1 až 4 atomy uhlíku, atom halogenu, cykloalkylskupinu se 3 až 6 atomy uhlíku a fenylskupinu, která je popřípadě substituována jedním nebo více substituenty zvolenými ze souboru zahrnujícího atom halogenu, kyanoskupinu, nitroskupinu, alkylskupinu s 1 až 4 atomy uhlíku, halogenalkylskupinu s 1 až 4 atomy uhlíku, alkoxyskupinu s 1 až 4 atomy uhlíku a halogenalkoxyskupinu s 1 až 4 atomy uhlíku,

alkinylskupinu se 3 až 6 atomy uhlíku, která je popřípadě substituována alkoxyskupinou s 1 až 4 atomy uhlíku nebo atomem halogenu;

cykloalkylskupinu se 3 až 6 atomy uhlíku;

R_9 a R_{10} představuje každý nezávisle vždy atom vodíku, alkylskupinu s 1 až 6 atomy uhlíku,

benzylskupinu, která je popřípadě substituována jedním nebo více substituenty zvolenými ze souboru zahrnujícího atom halogenu, kyanoskupinu, nitroskupinu, alkylskupinu s 1 až 4 atomy uhlíku, halogenalkylskupinu s 1 až 4 atomy uhlíku, alkoxyskupinu s 1 až 4 atomy uhlíku a halogenalkoxyskupinu s 1 až 4 atomy uhlíku, nebo

fenylskupinu, která je popřípadě substituována jedním nebo více substituenty zvolenými ze souboru zahrnujícího atom halogenu, kyanoskupinu, nitroskupinu, alkylskupinu s 1 až 4 atomy uhlíku, halogenalkylskupinu s 1 až 4 atomy uhlíku, alkoxyskupinu s 1 až 4 atomy uhlíku a halogenalkoxyskupinu s 1 až 4 atomy uhlíku;

R_{11} a R_{12} představuje nezávisle vždy

atom vodíku,

alkylskupinu s 1 až 6 atomy uhlíku, která je popřípadě substituována jedním nebo více atomy halogenu, nebo

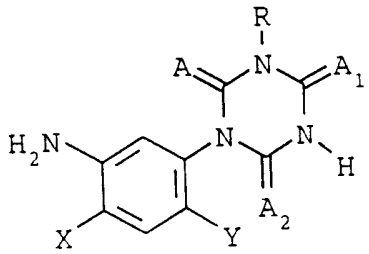
cykloalkylskupinu se 3 až 6 atomy uhlíku, která je popřípadě substituována jedním nebo více atomy halogenu, a dále též

R_{11} a R_{12} dohromady s atomy, k nimž jsou připojeny představují čtyř- až sedmičlenný nasycený nebo nenasycený kruh, který je popřípadě přerušen atomem kyslíku, $S(O)_r$ nebo atomem dusíku a který je popřípadě substituován jednou až třemi methylskupinami nebo jedním nebo více atomy halogenu;

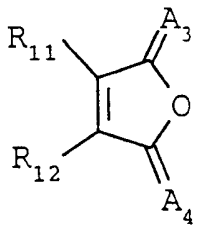
A, A_1, A_2, A_3 a A_4 představuje nezávisle vždy atom kyslíku nebo síry; a

r představuje celé číslo 0, 1 nebo 2,

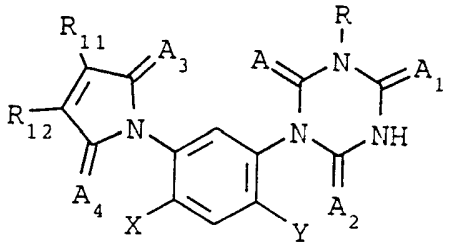
v y z n a č u j í c í s e t í m , že se amin obecného vzorce



kde X, Y, R, A, A_1 a A_2 mají výše uvedený význam, nechá reagovat s anhydridem obecného vzorce



kde R_{11}, R_{12}, A_3 a A_4 mají výše uvedený význam, za přítomnosti kyseliny za vzniku požadované sloučeniny obecného vzorce



kde X, Y, R, R_{11}, R_{12}, A, A_1, A_2, A_3 a A_4 mají výše uvedený význam a popřípadě se požadovaná sloučenina, kde R_1 představuje atom vodíku alkyluje alkylačním činidlem obecného vzorce

$$R_1X_1$$

kde

R_1 představuje alkenylskupinu se 3 až 6 atomy uhlíku, alkinylskupinu se 3 až 6 atomy uhlíku,

alkylskupinu s 1 až 12 atomy uhlíku která je popřípadě substituovaná jedním nebo více atomy halogenu nebo jedním substituentem zvoleným ze souboru zahrnujícího kyanoskupinu, skupinu vzorce $C(O)R_3$, $OC(O)R_5$, $CH_2OC(O)R_5$, OR_4, CH_2OR_4 a $CR_6(OR_7)_2$ nebo jednou fenylskupinou, která je popřípadě substituována jedním až třemi substituenty zvolenými ze souboru zahrnujícího atom halogenu, alkylskupinu s 1 až 4 atomy uhlíku, alkoxyskupinu s 1 až 4 atomy uhlíku a halogenalkoxyskupinu s 1 až 4 atomy uhlíku, nebo

fenylskupinu, která je popřípadě substituována jedním až třemi substituenty zvolenými ze souboru

zahrnujícího atom halogenu, alkylskupinu s 1 až 4 atomy uhlíku, alkoxyskupinu s 1 až 4 atomy uhlíku a halogenalkoxyskupinu s 1 až 4 atomy uhlíku;

X_1 představuje atom chloru, bromu nebo jodu;

za přítomnosti báze.