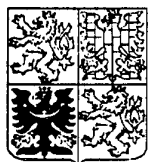


ČESKÁ
REPUBLIKA

(19)



ÚŘAD
PRŮMYSLOVÉHO
VLASTNICTVÍ

(21) Číslo přihlášky: **7553-87**

(22) Přihlášeno: 18. 10. 85

(30) Právo přednosti:

19. 10. 84 GB 84/8426473

23. 05. 85 GB 85/8513115

23. 05. 85 GB 85/8513104

(40) Zveřejněno: 16. 11. 94

(47) Uděleno: 06. 06. 95

(24) Oznámeno udělení ve Věstníku: 16. 08. 95

(13) Druh dokumentu: **B6**

(51) Int. Cl. ⁶:

C 07 C 57/00

(73) Majitel patentu:

ZENECA Limited, Londýn, GB;

(72) Původce vynálezu:

Anthony Vivienne Margaret, Bracknell, GB;

Beautement Kevin, Bracknell, GB;

Bushell Michael John, Bracknell, GB;

Clough John Martin, Bracknell, GB;

DeFraine Paul, Bracknell, GB;

Godfrey Christopher Richard Ayles,

Bracknell, GB;

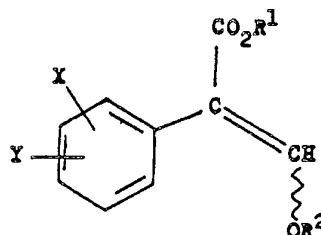
(54) Název vynálezu:

Způsob výroby derivátů akrylové kyseliny

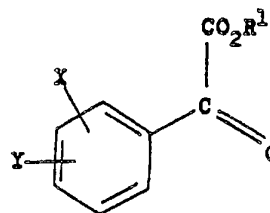
(57) Anotace:

Způsob výroby sloučenin obecného vzorce I, kde R^1 a R^2 znamenají vždy C₁₋₆-alkyl, fenyl či benzyl, X je vodík, halogen, hydroxyl, popřípadě substituovaný C₁₋₆-alkyl, popřípadě substituovaný C₂₋₆-alkenyl, fenyl, popřípadě fenylsubstituovaný C₂₋₆-alkinyl, halogen-C₁₋₄-alkyl, C₁₋₆-alkoxyl, C₃₋₆-alkoxyl, popřípadě fenylsubstituovaný C₂₋₆-alkenyloxyl, popřípadě substituovaný fenoxyl, naftyloxyl, popřípadě substituovaný pyridyloxyl, fenylthioskupina, fenylsulfinyl, fenylsulfenyl, fenyl-C₁₋₄-alkoxyl, C₁₋₄-alkylkarbonyloxyl, benzoyloxyl, aminoskupina, popřípadě substituovaná C₁₋₄alkylem nebo fenylem, benzoylaminoskupina, furoylaminoskupina, thienylkarbonylaminoskupina, nitroskupina, nitrilová skupina, zbytek -CO₂R³, kde R³ je C₁₋₄-alkyl, C₃₋₆-cykloalkyl, C₂₋₅-alkenyl, benzyl, popřípadě substituovaný fenyl či pyridyl, nebo zbytek -CONR⁴R⁵, kde R⁴ a R⁵ znamenají vodík, C₁₋₄-alkyl nebo C₃₋₆-cykloalkyl, nebo zbytek -COR⁶, kde R⁶ je vodík, popřípadě substituovaný fenyl nebo morfolinosku-

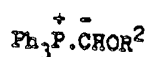
pina a Y je vodík, halogen, C₁₋₆-alkyl nebo nitroskupina a další.



(I)



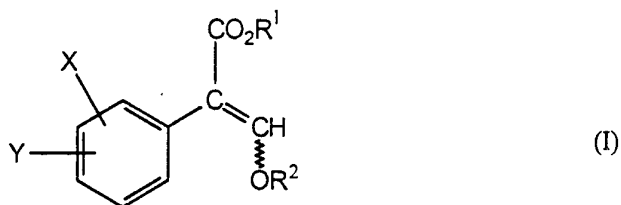
(II)



(V)

Vynález se týká způsobu výroby derivátů akrylové kyseliny, které jsou užitečné jako pesticidy, zejména jako fungicidy, a jako regulátory růstu rostlin.

V souhlase s tím popisuje vynález způsob výroby sloučenin obecného vzorce I



ve kterém

R^1 a R^2 nezávisle na sobě znamenají vždy alkylovou skupinu s 1 až 6 atomy uhlíku, fenylovou skupinu nebo benzylovou skupinu,

X představuje atom vodíku, atom halogenu, hydroxylovou skupinu, alkylovou skupinu s 1 až 6 atomy uhlíku, popřípadě substituovanou halogenem, alkoxy skupinou s 1 až 4 atomy uhlíku, alkylendioxy skupinou s 1 až 4 atomy uhlíku, fenylovou skupinou, která sama popřípadě nese substituent, vybraný ze skupiny, zahrnující atomy halogenů a alkoxy skupiny s 1 až 4 atomy uhlíku, fenoxyskupinou, pyridylovou skupinou, furylovou skupinou, thienylovou skupinou nebo alkoxykarbonylovou skupinou s 1 až 4 atomy uhlíku v alkoxylové části, alkenylovou skupinu se 2 až 6 atomy uhlíku, popřípadě substituovanou fenylovou skupinou, halogenalkylovou skupinou s 1 až 4 atomy uhlíku, kyano skupinou, alkylkarbonylovou skupinou s 1 až 4 atomy uhlíku v alkylové části, alkoxykarbonylovou skupinou s 1 až 4 atomy uhlíku v alkoxylové části, benzyloxykarbonylovou skupinou, furylovou skupinou nebo benzthiazolylovou skupinou, fenylovou skupinu, alkenylovou skupinu se 2 až 6 atomy uhlíku, popřípadě substituovanou fenylovou skupinou, halogenalkylovou skupinu s 1 až 4 atomy uhlíku, alkoxy skupinu s 1 až 6 atomy uhlíku, cykloalkoxy skupinu se 3 až 6 atomy uhlíku, alkenyloxyskupinu se 2 až 6 atomy uhlíku, popřípadě substituovanou fenylovou skupinou, fenoxyskupinu, popřípadě substituovanou halogenem, alkylovou skupinou s 1 až 4 atomy uhlíku, halogenalkylovou skupinou s 1 až 4 atomy uhlíku, popřípadě halogen substituovanou alkoxy skupinou s 1 až 6 atomy uhlíku, alkenyloxyskupinu se 2 až 6 atomy uhlíku, alkenyloxyskupinou se 2 až 6 atomy uhlíku, alkylkarbonyloxyskupinou s 1 až 4 atomy uhlíku v alkylové části, alkylsulfonyloxyskupinou s 1 až 4 atomy uhlíku, fenoxyskupinou, nitroskupinou, aminoskupinou, fenylovou skupinu, formylovou skupinu, hydroxyskupinu, formylaminoskupinu, alkylkarbonylamino skupinou s 1 až 4 atomy uhlíku v alkylové části nebo benzoylamino skupinou, naftyloxyskupinu, pyridyloxyskupinu, popřípadě substituovanou halogenalkylovou skupinou s 1 až 4 atomy uhlíku, fenylthioskupinu, fenylsulfinylo-

vou skupinu, fenylsulfenylovou skupinu, fenylalkoxyskupinu s 1 až 4 atomy uhlíku v alkoxylové části, alkylkarbo-nyloxyskupinu s 1 až 4 atomy uhlíku v alkylové části, benzoyloxyskupinu, aminoskupinu, popřípadě substituovanou alkylovou skupinou s 1 až 4 atomy uhlíku nebo fenylovou skupinou, benzoylaminoskupinu, furoylaminoskupinu, thienylkarbonylaminoskupinu, nitroskupinu, nitrilovou skupinu, zbytek vzorce $-CO_2R^3$, v němž R^3 představuje alkylovou skupinu s 1 až 4 atomy uhlíku, cykloalkylovou skupinu se 3 až 6 atomy uhlíku, alkenylovou skupinu se 2 až 5 atomy uhlíku, benzylovou skupinu, fenylovou skupinu, popřípadě substituovanou alkoxyskupinou s 1 až 4 atomy uhlíku, nebo pyridylovou skupinu, popřípadě substituovanou alkylovou skupinou s 1 až 4 atomy uhlíku, nebo zbytek vzorce $-CONR^4R^5$, v němž R^4 a R^5 nezávisle na sobě představují atom vodíku, alkylovou skupinu s 1 až 4 atomy uhlíku nebo cykloalkylovou skupinu se 3 až 6 atomy uhlíku, nebo zbytek vzorce $-COR^6$, v němž R^6 představuje atom vodíku, fenylovou skupinu, popřípadě substituovanou alkoxyskupinou s 1 až 4 atomy uhlíku nebo morfolinoskupinu a

Y znamená atom vodíku, atom halogenu, alkylovou skupinu s 1 až 6 atomy uhlíku, nitroskupinu nebo fenoxyskupinu, nebo

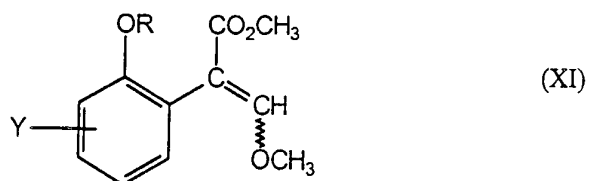
X a Y, které se nacházejí na fenylovém kruhu v sousedících polohách, jsou spolu spojeny za vzniku nakondenzovaného benzenového kruhu, popřípadě substituovaného fenylovou skupinou, nebo nakondenzovaného naftalenového, benzofuranového, benzothienylového, thianthrenylového nebo dibenzodioxinylového kruhu, nebo zbytku vzorce



a jejich stereoizomerů.

Sloučeniny vyráběné způsobem podle vynálezu obsahují nejméně jednu dvojnou vazbu uhlík-uhlík a někdy se získávají ve formě směsí geometrických izomerů. Tyto směsi lze ovšem dělit na individuální izomery a vynález zahrnuje jak tyto izomery, tak i jejich směsi. Alkylové skupiny ve významu jednotlivých obecných symbolů mohou mít přímý nebo rozvětvený řetězec. Jako příklady těchto skupin lze uvést skupinu metylovou, etylovou, propylovou (n- nebo izopropylovou) a butylovou (n-, sek.-, izo- nebo terc.butylovou). Výhodnou alkylovou skupinou jak pro symbol R^1 , tak pro symbol R^2 je skupina metylová.

Dále vynález popisuje způsob výroby sloučenin obecného vzorce XI



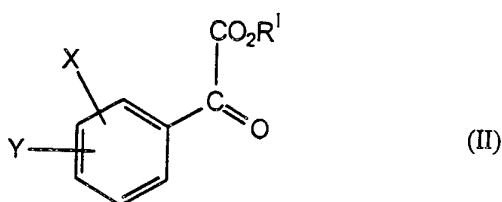
ve kterém

- R znamená fenylovou skupinu, popřípadě substituovanou halogenem, alkylovou skupinou s 1 až 4 atomy uhlíku, halogenalkylovou skupinou s 1 až 4 atomy uhlíku, alkoxy skupinou s 1 až 4 atomy uhlíku, fenoxyskupinou, nitroskupinou, aminoskupinou, fenylovou skupinou, formylovou skupinou, hydroxyskupinou, formylaminoskupinou, alkylkarbonylaminoskupinou s 1 až 4 atomy uhlíku v alkylové části nebo benzoylaminoskupinou a
- Y představuje atom vodíku, fluoru či chloru, metylovou skupinu nebo nitroskupinu,

a jejich stereoizomerů.

Jak již bylo uvedeno výše, jsou sloučeniny obecného vzorce I, ať už ve formě individuálních izomerů nebo směsí izomerů, užitečné jako pesticidy, zejména jako fungicidy, a jako regulátory růstu rostlin. V našem souvisejícím československém patentovém spisu č. 279 781 jsou popsány a chráněny příslušné prostředky, obsahující shora uvedené sloučeniny jako účinné látky, a jeden z možných způsobů výroby těchto sloučenin.

Předmětem projednávaného vynálezu je další způsob výroby shora definovaných sloučenin obecného vzorce I a jejich stereoizomerů, který se vyznačuje tím, že se sloučenina obecného vzorce II



ve kterém

R^1 , X a Y mají shora uvedený význam,

nechá reagovat se sloučeninou obecného vzorce V



ve kterém

Ph znamená fenylovou skupinu a

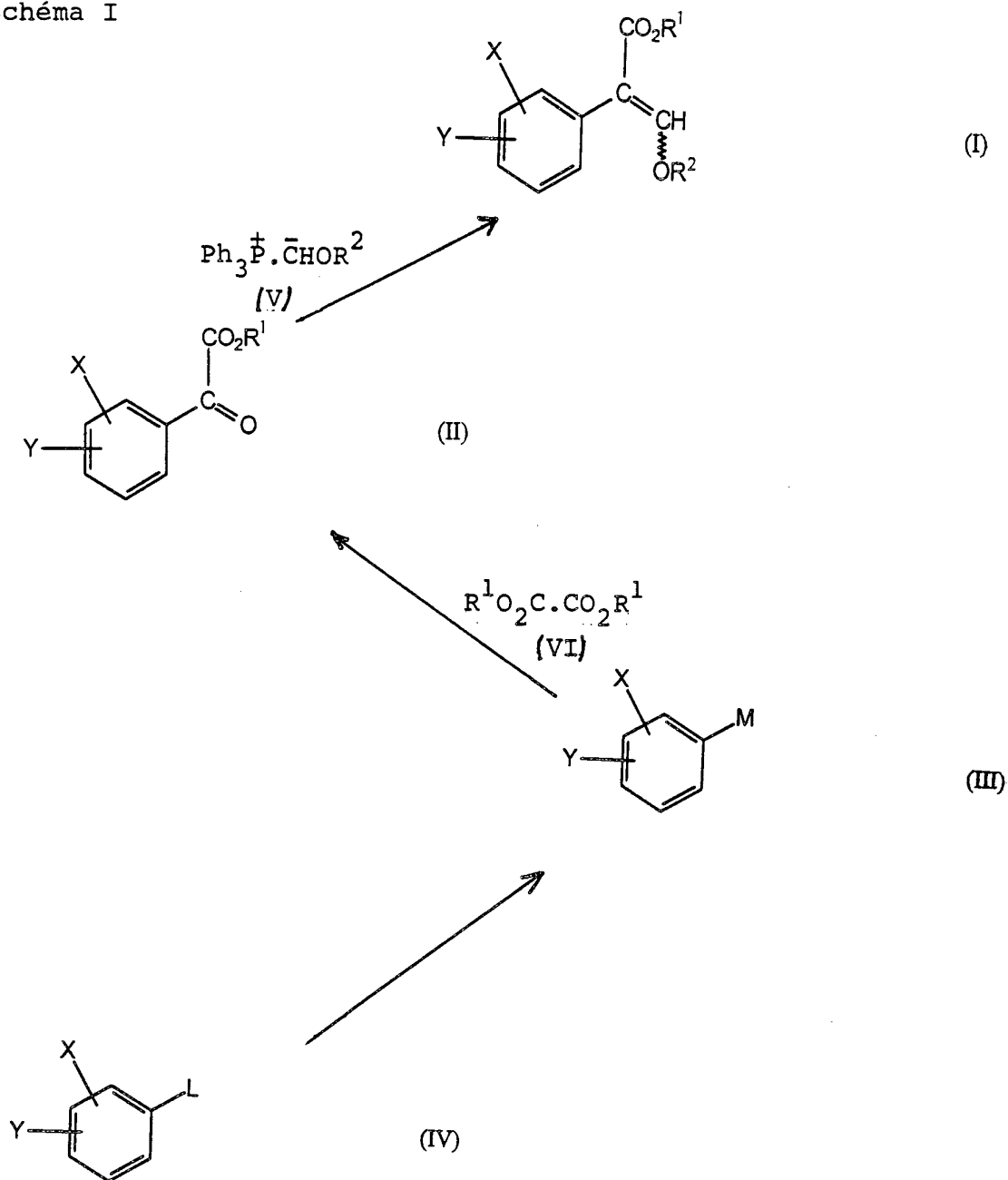
R^2 má shora uvedený význam,

a výsledný produkt se izoluje, popřípadě ve formě stereoizomeru.

Způsob podle vynálezu, doplněný přípravou výchozích látek, je možno popsat následujícím reakčním schématem I.

Ve vzorcích, uvedených v reakčním schématu I, mají symboly R^1 , R^2 , X a Y shora uvedený význam, L představuje atom halogenu (atom jodu, bromu nebo chloru) nebo atom vodíku a M znamená atom kovu (jako atom lithia) nebo atom kovu s napojeným atomem halogenu (jako skupinu MgI , $MgBr$ nebo $MgCl$).

Schéma I



Reakce ketoesterů obecného vzorce II s fosforany obecného vzorce V se provádí ve vhodném rozpouštědle, jako v dietyléteru (viz například W. Steglich, G. Schramm, T. Anke a F. Oberwinkler, evropská přihláška vynálezu č. 0044448, zveřejněná 04 07 80).

Ketoestery obecného vzorce II je možno připravit reakcí metalovaného derivátu obecného vzorce III s oxalátem obecného vzorce VI ve vhodném rozpouštědle, jako v dietyléteru nebo tetrahydrofuranu. S výhodou se tato reakce provádí tak, že se k míchanému roztoku nadbytku oxalátu obecného vzorce VI pomalu přidává roztok metalovaného derivátu obecného vzorce III (viz například L. M. Weinstock, R. B. Currie a A. V. Lovell, Synthetic Communications, 1981, 11, 943 a tam uvedené odkazy).

Metalované deriváty obecného vzorce III, v němž M znamená seskupení MgI, MgBr nebo MgCl (Grignardova činidla) lze připravit standardními metodami z odpovídajících aromatických halogenidů obecného vzorce IV, v němž L znamená jod, brom nebo chlor. Za přítomnosti určitých substituentů X, Y a Z je možno metalované deriváty obecného vzorce III, ve kterém M znamená lithium, připravit přímou lithiací sloučenin obecného vzorce VI, kde L znamená atom vodíku, za použití silně bázičského derivátu lithia, jako n-butyllithia nebo lithium-diizopropylamidu (viz například H. W. Gschwend a H. R. Rodriguez, Organic Reactions, 1979, 26, 1).

Sloučeniny obecného vzorce IV je možno připravit standardními metodami, popsanými v chemické literatuře.

Alternativní způsoby přípravy ketoesterů obecného vzorce II jsou popsány v chemické literatuře (viz například D. C. Atkinson, K. E. Godfrey, B. Meek, J. F. Saville a M. R. Stillings, J. Med. Chem., 1983, 26, 1353; D. Horne, J. Gaudino a W. J. Thompson, Tetraheron Lett., 1984, 25, 3529; a G. P. Axiotis, Tetrahedron Lett., 1981, 22, 1509).

Vynález ilustrují následující příklady provedení, jimiž se však rozsah vynálezu v žádném směru neomezuje. V těchto příkladech se k sušení roztoků používá síran hořečnatý, reakce, v nichž se používají nebo vznikají meziprodukty, reagující s vodou, se provádějí v dusíkové atmosféře a éterem se míní dietyléter. Pokud není uvedeno jinak, provádějí se chromatografie za použití silikagelu jako stacionární fáze. V IČ a NMR spektrech nejsou uváděny všechny absorpce, ale pouze vybrané signály. Tvary signálů v NMR spektrech se označují následujícími zkratkami:

s = singlet	t = triplet	
d = dublet	q = kvartet	m = multiplet

Příklad 1

Tento příklad ilustruje přípravu 2E,1"Z-metyl-3-metoxi-2-[2'-(2"-fenyletenyl)fenyl]propenoátu (sloučenina č. 13 z tabulky I).

K intenzivně míchané suspenzi 21,02 g benzyltrifenylfosfonium chloridu ve 250 ml suchého éteru se v jediné dávce přidá 5,30 g terc.butoxidu draselného. Po 25 minutách se k oranžové směsi přidá roztok 5,00 g 2-brombenzaldehydu v 50 ml suchého éteru,

přičemž směs zesvětlí. Po další hodině se reakční směs vylíje do vody a extrahuje se éterem. Extrakty se promyjí vodou, vysuší se, zahustí se za sníženého tlaku a zbytek se podrobí chromatografii za použití dichlormetanu jako elučního činidla. Získá se 5,95 g (výtěžek 85 %) 1-fenyl-2-(2-bromfenyl)etyleny ve formě téměř bezbarvého oleje, který je podle plynové chromatografie a hmotnostní spektroskopie tvořen směsí Z- a E-izomerů v poměru 6:1.

Roztok Grignardova činidla, připraveného z 5,58 g 1-fenyl-2-(2-bromfenyl)etyleny, popsaného výše, a 0,63 g hořčíku ve 20 ml suchého tetrahydrofuranu se během 30 minut přikape k míchanému roztoku 5,06 g dimetyl-oxalátu ve 40 ml tetrahydrofuranu, ochlazenému na -15 °C. Výsledná směs se míchá nejprve 30 minut při teplotě cca -15 °C a pak 1 hodinu při teplotě místnosti, načež se vylíje do zředěné kyseliny chlorovodíkové a extrahuje se éterem. Extrakty se promyjí vodou, vysuší se, zahustí se za sníženého tlaku a zbytek se podrobí dvojnásobné chromatografii [(i) 30% éter v petroléteru; (ii) 20% hexan v dichlormetanu]. Získá se 1,76 g (výtěžek 31 %) čistého izomerního Z-metyl-2-(2'-fenyletenyl)fenylglyoxalátu ve formě žlutého oleje.

¹H-NMR (deuterochloroform, hodnoty δ v ppm): 3,87 (3H, s), 6,78 (střed dvou dubletů, vždy 1H, J = 12 Hz).

K míchané suspenzi 6,78 g (metoxymetyl)trifenylfosfoniumchloridu v 80 ml suchého éteru se v jediné dávce přidá 2,00 g terc.butoxidu draselného. Po 25 minutách se ke vzniklé červeně zbarvené suspenzi přidá roztok 1,76 g Z-metyl-2-(2'-fenyletenyl)fenylglyoxalátu ve 20 ml suchého éteru, přičemž směs zesvětlí. Po 1,5 hodiny se reakční směs vylíje do vody a extrahuje se éterem. Extrakty se promyjí vodou, vysuší se, prolijí se krátkým sloupcem silikagelu, který se promyje dichlormetanem, a pak se pečlivě chromatografují za použití 30% éteru v petroléteru jako elučního činidla. Získá se 0,46 g (výtěžek 24 %) sloučeniny, uvedené v názvu, ve formě oleje.

IČ (film): 1715, 1635 cm⁻¹.

¹H-NMR (deuterochloroform, hodnoty δ v ppm): 3,62 (3H, s), 3,73 (3H, s), 6,48 (2H, s), 7,50 (1H, s).

Příklad 2

Tento příklad ilustruje přípravu E- a Z-metyl-3-metoxy-2-fenylpropenoátu (sloučeniny č. 1 a 2 z tabulky I).

K míchané suspenzi 34,3 g (metoxymetyl)trifenylfosfoniumchloridu ve 300 ml suchého éteru se v jediné dávce přidá 9,52 g terc.butoxidu draselného. Po 45 minutách se ke vzniklé červené suspenzi přidá roztok 8,20 g metylbenzoylformiátu ve 100 ml suchého éteru, přičemž dojde k exotermní reakci a zesvětlení směsi. Po 3 hodinách se reakční směs zředí vodou, vysuší se síranem hořečnatým, vyčeří se aktivním uhlím a zahustí se za sníženého tlaku. Získá se 36,39 g surového produktu ve formě žlutého oleje, který stáním částečně zkrystaluje. Tento produkt se nejprve v dichlormetanu prolije krátkým sloupcem silikagelu a pak se podrobí pečlivé chromatografii za použití směsi dichlormetanu

a petroléteru (2 : 1) jako elučního činidla. Jako první produkt se vymyje 4,83g (výtěžek 50 %) E-metyl-3-metoxi-2-fenylpropenoátu ve formě světle žlutého oleje.

IČ (film): 1710, 1630 cm^{-1} .

$^1\text{H-NMR}$ (deuterochloroform, hodnoty δ v ppm):
7,55 (s, olefinický proton).

Jako druhý produkt se vymyje 3,43 g (výtěžek 36 %) Z-metyl-3-metoxi-2-fenylpropenoátu ve formě světle žlutého oleje.

IČ (film): 1715, 1630 cm^{-1} .

$^1\text{H-NMR}$ (deuterochloroform, hodnoty δ v ppm):
3,76 (3H, s), 3,90 (3H, s), 6,65 (1H, s), 7,28 (5H, s).

Vzorek E-metyl-3-metoxi-2-fenylpropenoátu, připraveného z metyl-fenylacetátu postupem, popsáním v příkladech 4 a 7, tj. reakcí s natriumhydridem a metyl-formiátem, a reakcí výsledného enolu s uhličitanem draselným a dimetylsulfátem, stáním ztuhne a taje při 37 až 38 °C.

Příklad 3

Tento příklad ilustruje přípravu 2E,1"E- a 2Z,1"-E-metyl-3-metoxi-2-[2'-(2"-fenyletenyl)fenyl]propenoátu (sloučeniny č. 9 a 10 z tabulky I).

K míchanému roztoku benzylnagesiumchloridu (připraven z 12,64 g benzylchloridu a 2,68 g hořčíku) ve 120 ml suchého éteru se přikape roztok 18,50 g 2-brombenzaldehydu ve 20 ml suchého éteru. Během přidávání se tvoří hustá sraženina. Směs se 1 hodinu míchá při teplotě místnosti, pak se vylije do vody, okyselí se 2M kyselinou chlorovodíkovou a extrahuje se éterem. Extrakty se promyjí vodou, vysuší se, zahustí se a zbytek se podrobí chromatografii za použití směsi stejných dílů dichlormetanu a petroléteru jako elučního činidla. Získá se 10,95 (výtěžek 40 %) 1-(2-bromfenyl)-2-fenyletan-1-olu ve formě bílé pevné látky o teplotě tání 84 až 85 °C.

Směs 15,50 g 1-(2-bromfenyl)-2-fenyletan-1-olu a 150 ml ortofosforečné kyseliny se za míchání 1 hodinu zahřívá na 170 °C, pak se vylije do vody s ledem a extrahuje se éterem. Extrakty se promyjí vodou a po vysušení se zahustí. Získá se 14,29 g surového produktu ve formě oranžového oleje, který po destilačním vysušení (40 Pa, teplota v sušárně 140 °C) poskytne 12,53 g (výtěžek 86 %) E-1-fenyl-2-(2-bromfenyl)etylenu ve formě světle žlutého oleje, jehož čistota je podle plynové chromatografie 97 %.

Roztok Grignardova činidla, připraveného z 8,56 g E-1-fenyl-2-(2-bromfenyl)etylenu a 0,96 g hořčíku ve 20 ml suchého tetrahydrofuranu se během 30 minut přikape k míchanému roztoku 7,76 g dimetyl-oxalátu v 70 ml suchého tetrahydrofuranu, ochlazenému na -15 °C. Výsledná směs se 30 minut míchá při teplotě cca -15 °C a pak 1 hodinu při teplotě místnosti, načež se vylije do

zředěné kyseliny chlorovodíkové a extrahuje se éterem. Extrakty se promyjí vodou a po vysušení se zahustí. Získá se 17,22 g surového produktu ve formě žlutého oleje, který se vyčistí sloupcovou chromatografií za použití směsi stejných dílů dichlormetanu a petroléteru jako elučního činidla a pak destilačním vysušením (9,3 Pa; teplota v sušárně 170 °C). Získá se 2,01 g (výtěžek 23 %) E-metyl-2-(2'-fenyletenyl)fenylglyoxalátu ve formě žlutého oleje, který je podle plynové chromatografie čistý.

$^1\text{H-NMR}$ (deuterochloroform, hodnoty δ v ppm):
3,78 (3H, s), 6,88 (střed dvou dubletů, vždy 1H, $J = 16$ Hz)

K míchané suspenzi 7,41 g (metoxymetyl)trifenylfosfoniumchloridu ve 100 ml suchého éteru se v jediné dávce přidá 2,19 g terc.butoxidu draselného. Po 25 minutách se ke vzniklé červené suspenzi přidá roztok 1,92 g E-metyl-2-(2'-fenyletenyl)fenylglyoxalátu ve 20 ml suchého éteru, přičemž směs zesvětlí. Po 15 minutách se reakční směs vylije do vody a extrahuje se éterem. Extrakty se promyjí vodou a po vysušení se podrobí chromatografii za použití 30% éteru v petroléteru jako elučního činidla. Získají se následující produkty:

(i) 1,06 g (výtěžek 50 %) 2E,1"E-izomer sloučeniny, uvedené v názvu, vymytý jako první komponenta, ve formě světle žlutého oleje, který stáním zkrystaluje na bílý pevný produkt o teplotě tání 103 až 104 °C. Analytický vzorek tohoto produktu taje po překrystalování ze směsi éteru a petroléteru při 107 až 108 °C.

IČ (suspenze v nujolu): 1700, 1630 cm^{-1} .

$^1\text{H-NMR}$ (deuterochloroform, hodnoty δ v ppm):
3,68 (3H, s), 3,80 (3H, s), 7,06 (2H, s), 7,63 (1H, s).

(ii) 2Z,1"E-izomer sloučeniny, uvedené v názvu, vymytý jako druhá komponenta, ve formě viskózního oleje. Výtěžek činí 0,260 g (12 %)

IČ (film): 1710, 1625 cm^{-1} .

$^1\text{H-NMR}$ (deuterochloroform, hodnoty δ v ppm):
3,65 (3H, s), 3,92 (3H, s), 6,57 (1H, s), 6,99 a 7,24 (vždy 1H, d, $J = 16$ Hz).

Příklad 4

Tento příklad ilustruje přípravu E-metyl-2-(2-fenoxy)fenyl-3-metoxyakrylátu (sloučenina č. 1 z tabulky II).

K míchanému roztoku 12,3 g difenyléteru ve 150 ml suchého éteru se při teplotě -70 °C přidá 5,6 g terc.butoxidu draselného. Výsledná směs se při shora uvedené teplotě 15 minut míchá, načež se k ní přidá 30,5 ml 1,62M roztoku n-butyllithia v hexanu za vzniku červenohnědé suspenze, která se nechá ohřát na teplotu místnosti. Tato směs se během 20 minut přidá k míchané suspenzi 11,8 g dimetyloxalátu ve 250 ml éteru, ochlazené na -10 °C, a výsledná směs se nechá ohřát na teplotu místnosti. Po 30 minutách se reakční směs vylije do vody a extrahuje se éterem. Spoj-

né extrakty se promyjí vodou a po vysušení se zahustí na 14,21 g červeného oleje, který chromatografií za použití 20% éteru v petroléteru jako elučního činidla poskytne 2,23 g metyl-2-fenoxybenzoylformiátu ve formě žlutého oleje.

K suspenzi 8,93 g (metoxymetyl)trifenylfosfoniumchloridu ve 100 ml suchého éteru se za intenzivního míchání přidá 2,64 g terc.butoxidu draselného. Po 20 minutách se k výsledné červené suspenzi přidá roztok 2,23 g metyl-2-fenoxybenzoylformiátu ve 20 ml suchého éteru, přičemž směs zesvětlí. Po 15 minutách se reakční směs vylije do vody a extrahuje se éterem. Spojené extrakty se promyjí vodou a po vysušení se zahustí. Získá se 7,30 g žlutého olejovitého materiálu, který po chromatografii za použití dichlormetanu jako elučního činidla poskytne 0,61 g sloučeniny uvedené v názvu, ve formě bezbarvého oleje.

IČ (film): 1710, 1635 cm^{-1} .

$^1\text{H-NMR}$ (deuterochloroform, hodnoty δ v ppm):
3,60 (3H, s), 3,75 (3H, s), 7,47 (1H, s).

Příklad 5

Tento příklad popisuje přípravu E- a Z-metyl-3-metoxy-2-(2-fenoxyetyl)fenylpropenoátu (sloučeniny č. 1 a 177 z tabulky IV).

K míchané směsi 16,51 g 1-(2-bromfenyl)-2-fenyletan-1-olu (připraven postupem, popsáným v příkladu 3) a 13,80 g trietylsilanu se v jediné dávce přidá 46 ml trifluoroctové kyseliny. Výsledná směs se zhruba 22 hodin míchá při teplotě místnosti, načež se nadbytek trifluoroctové kyseliny odpaří za sníženého tlaku. Odparek se rozpustí v éteru, roztok se postupně promyje vodou, třikrát vodným roztokem hydrogenuhličitanu sodného a dvakrát vodou, vysuší se,, zahustí se za sníženého tlaku a odparek se chromatografuje za použití 10% dichlormetanu v petroléteru jako elučního činidla. Získá se 8,02 g (52 %) 1-(2-bromfenyl)-2-fenyletanu ve formě bezbarvého oleje.

Tento vzorek 1-(2-bromfenyl)-2-fenyletanu se ve dvou stupních převede na sloučeniny, uvedené v názvu. Používá se metody, popsané v příkladech 1 a 3, tj. reakce hořčnatého derivátu s dimetyl-oxalátem a následující reakce výsledného ketoesteru s metoxymetyltrifenylfosforanem. Při chromatografii se 30% éterem v petroléteru jako první vymyje E-izomer ve formě oleje.

IČ (film): 1705 a 1630 cm^{-1} .

$^1\text{H-NMR}$ (deuterochloroform, hodnoty δ v ppm):
2,79 (4H, s), 3,69 (3H, s), 3,79 (3H, s), 7,59 (1H, s).

Jako druhá komponenta se vymyje rovněž olejovitý Z-izomer.

IČ-(film): 1715, 1695 a 1630 cm^{-1} .

$^1\text{H-NMR}$ (deuterochloroform, hodnoty δ v ppm):
2,84 (4H, s), 3,68 (3H, s), 3,84 (3H, s), 6,24 (1H, s).

Příklad 6

Tento příklad ilustruje přípravu 2E,1"E- a 2Z,1"E-metyl-2-[2'-(2"-/2""-furyl/etenyl)fenyl]-3-metoxypropenoátu (sloučeniny č. 55 a 56 z tabulky I).

Směs 12,10 g 2-brombenzylbromidu a 8,56 ml trimetylfosfitu se míchá v baňce, napojené přes destilační hlavu na chladič. Tato reakční směs se 1 hodinu zahřívá na 110 °C, pak se k ní přidá dalších 5 ml trimetylfosfitu a v zahřívání se pokračuje 2,5 hodiny při 130 °C, přičemž teplota v destilační hlavě při této reakci se udržuje nejméně na 40 °C. Reakční směs se nechá zchladnout a těkavé frakce se odpaří za sníženého tlaku, čímž se jako zbytek získá 21,65 g téměř bezbarvé kapaliny. Po destilačním vysušení části tohoto kapalného produktu (18,35 g) se získá 8,02 g (55 %) dimetyl-2-brombenzylfosfonátu ve formě bezbarvé kapaliny, destilující při 175 až 180 °C/15 Pa, jejíž čistota podle plynové chromatografie činí 78 %. Analytický vzorek produktu, vyčištěný chromatografií za použití směsi etylacetátu a petroléteru (teplota varu 60 až 80 °C) v poměru 2 : 1, jako elučního činidla, má následující NMR spektrum:

¹H-NMR (deuterochloroform, hodnoty δ v ppm):
3,43 (2H, d, J = 23 Hz), 3,72 (d, J = 11 Hz).

K míchané suspenzi 0,979 g natriumhydridu ve 100 ml suchého dimetylformamidu se při teplotě místnosti přikape roztok 10,35 g dimetyl-2-brombenzylfosfonátu v 50 ml suchého dimetylformamidu, přičemž dochází k pění. Po 20 minutách se přidá roztok 3,56 g furfuralu v 50 ml suchého dimetylformamidu (exotermická reakce), výsledná směs se 4 hodiny míchá při teplotě místnosti, pak se zředí vodou a extrahuje se éterem. Extrakty se promyjí vodou, po vysušení síranem hořečnatým a odbarvení aktivním uhlím se zfiltrují, zahustí se za sníženého tlaku a zbytek se chromatografuje za použití petroléteru (teplota varu 40 až 60 °C) jako elučního činidla. Získá se 3,755 g E-1-(2-furyl)-2-(2-bromfenyl) etylenu ve formě světle žluté kapaliny, obsahující podle plynové chromatografie zhruba 6 % odpovídajícího Z-izomeru.

Tento etylenderivát se ve dvou stupních převede na sloučeniny, uvedené v názvu. Používá se metody, popsané v příkladech 1 a 3, tj. reakce hořečnatého derivátu s dimetyl-oxalátem a následující reakce výsledného ketoesteru s metoxymetylentri-fenylfosforanem. Při chromatografii se 30% éterem v petroléteru jako první vymyje olejovitý E,E-izomer.

IČ (film): 1715 a 1637 cm¹.

¹H-NMR (deuterochloroform, hodnoty δ v ppm):
3,68 (3H, s), 3,81 (3H, s), 6,31 (1H, d, J = 3,5 Hz),
6,40 (1H, dd, J = 3,5 a 2 Hz), 6,83 a 6,97 (vždy 1H, d, J = 16 Hz), 7,63 (1H, s).

Odpovídající Z,E-izomer představuje pevnou látku o teplotě tání 107,5 až 110 °C.

IČ (nujol): 1717 a 1625 cm¹.

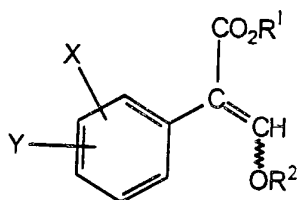
$^1\text{H-NMR}$ (deuterochloroform, hodnoty δ v ppm):

3,65 (3H, s), 3,93 (3H, s), 6,33 (1H, d, $J = 33,5$ Hz),
6,40 (1H, dd, $J = 3,5$ 2 Hz), 6,56 (1H, s), 6,82 a 7,10
(vždy 1H, d, $J = 16$ Hz).

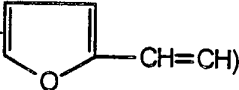
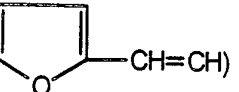
Příklad 7

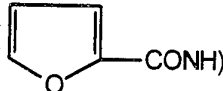
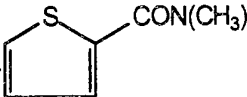
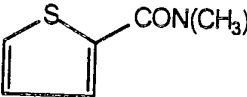
V následujících tabulkách jsou, kromě sloučenin, připravených v předcházejících příkladech, uvedeny další sloučeniny, spadající do rozsahu obecného vzorce I, které je možno připravit způsobem podle vynálezu.

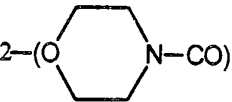
Tabulka 1

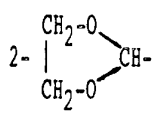
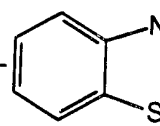


slouče- nina č.	R^1	R^2	X	Y	Z	teplota tání ($^{\circ}\text{C}$)	olefinický proton α)	izomer $^{+}$)
1	CH_3	CH_3	H	H	H	37 - 38	7,55	E
2	CH_3	CH_3	H	H	H	olej	6,65	Z
3	CH_3CH_2	CH_3	H	H	H	olej	7,53	E
4	CH_3	CH_3CH_2	H	H	H	olej	7,62	E
5	CH_3CH_2	CH_3CH_2	H	H	H	olej	7,62	E
6	$\text{C}_6\text{H}_5\text{CH}_2$	CH_3	H	H	H	olej	7,56	E
7	CH_3	$\text{C}_6\text{H}_5\text{CH}_2$	H	H	H	37-38	7,67	E
8	$(\text{CH}_3)_3\text{C}$	CH_3	H	H	H	olej	7,44	E
9	CH_3	CH_3	2-(E-C $_6\text{H}_5\text{CH}=\text{CH}$)	H	H	107-108	7,63	E
10	CH_3	CH_3	2-(E-C $_6\text{H}_5\text{CH}=\text{CH}$)	H	H	olej	6,57	Z
11	CH_3	CH_3	3-(E-C $_6\text{H}_5\text{CH}=\text{CH}$)	H	H	104-105	7,58	E
12	CH_3	CH_3	4-(E-C $_6\text{H}_5\text{CH}=\text{CH}$)	H	H	75-76	7,56	E
13	CH_3	CH_3	2-(Z-C $_6\text{H}_5\text{CH}=\text{CH}$)	H	H	olej	7,50	E
14	CH_3	CH_3	2-(Z-C $_6\text{H}_5\text{CH}=\text{CH}$)	H	H	93-94	6,34	Z

slouče- nina č.	R ¹	R ²	X	Y	Z	teplota tání (°C)	olefinický proton x)	izomer ⁺)
15	(CH ₃) ₃ C	CH ₃	2-(Z-C ₆ H ₅ CH=CH)	H	H	olej	7,37	E
16	CH ₃	(CH ₃) ₃ C	2-(Z-C ₆ H ₅ CH=CH)	H	H	olej	7,87	E
17	CH ₃	CH ₃	2-C ₆ H ₅ C=C	H	H	86-87	7,58	E
18	CH ₃	CH ₃	2-CH ₂ =CH	H	H	olej	7,56	E
19	CH ₃	CH ₃	2-Cl	H	H	65-66	7,60	E
20	CH ₃	CH ₃	4-Cl	H	H	61-62	7,56	E
21	CH ₃	CH ₃	2-Cl	4-Cl	H	68-69	7,56	E
22	CH ₃	CH ₃	2-Cl	6-Cl	H	141-142	7,61	E
23	CH ₃	CH ₃	3-Cl	5-Cl	H	126-127	7,58	E
24	CH ₃	CH ₃	3-Cl	5-Cl	H	olej	6,70	Z
25	CH ₃	CH ₃	2-Cl	6-F	H	79-80	7,62	E
26	CH ₃	CH ₃	2-CH ₃	H	H	olej	7,55	E
27	CH ₃	CH ₃	2-CH ₃	H	H	62-63	6,52	Z
28	CH ₃	CH ₃	2-(CO ² CH ₃)	H	H	olej	7,52	E
29	CH ₃	CH ₃	2-CF ₃	H	H	65-66	7,56	E
30	CH ₃	CH ₃	2-C ₆ H ₅	H	H	106-107	7,34	E
31	CH ₃	CH ₃	2-C ₆ H ₅ CO	H	H	82-85	7,30	E
32	CH ₃	CH ₃	2-C ₆ H ₅ O ₂ C	H	H	olej	7,43	E
33	CH ₃	CH ₃	2-(cyklohexyl)O ₂ C	H	H	olej	7,44	E
34	CH ₃	CH ₃	2-C ₆ H ₅ CH ₂	H	H	olej	7,48	E
35	CH ₃	CH ₃	2-(4-CH ₃ O-C ₆ H ₄)CH ₂	H	H	olej	7,50	E
36	CH ₃	CH ₃	2-NO ₂	H	H	84-85	pod aromatickou	E
37	CH ₃	CH ₃	2-C ₆ H ₅ S	H	H	olej	7,51	E
38	CH ₃	CH ₃	2-C ₆ H ₅ S(O)	H	H	olej	pod aromatickou	E
39	CH ₃	CH ₃	2-C ₆ H ₅ S(O) ₂	H	H	147-148 (rozklad)	pod aromatickou	
40	CH ₃	CH ₃	2-(E-  CH=CH)	H	H	olej	7,63	E
41	CH ₃	CH ₃	2-(E-  CH=CH)	H	H	107,5-110	6,56	Z
42	CH ₃	CH ₃	3-C ₆ H ₅ O	H	H	olej	7,54	E

slouče- nina č.	R ¹	R ²	X	Y	Z	teplota tání (°C)	olefinický proton ^{x)}	izomer ⁺
43	CH ₃	CH ₃	4-C ₆ H ₅ O	H	H	97-98	7,54	E
44	CH ₃	CH ₃	4-C ₆ H ₅ O	H	H	olej	6,64	Z
45	CH ₃	CH ₃	⊕	⊕	H	124-125	7,47	E
46	CH ₃	CH ₃	⊕	⊕	H	83-84	7,63	E
47	CH ₃	CH ₃	⊕	⊕	H	112-113	7,82	E
48	CH ₃	CH ₃	⊕	⊕	⊕	152-153	pod aromaticou	E
49	CH ₃	CH ₃	⊕	⊕	H	122-123	7,73	
50	CH ₃	CH ₃	2-(C ₆ H ₅ N(CH ₃))	H	H	olej	pod aromaticou	E
51	CH ₃	CH ₃	2-(4-CH ₃ O-C ₆ H ₄ CO)	H	H	olej	7,32	E
52	CH ₃	CH ₃	2-C ₆ H ₅ OCH ₂	H	H	olej	7,59	E
53	CH ₃	CH ₃	2-C ₆ H ₅ CONH	H	H	99-100	pod aromaticou	E
54	CH ₃	CH ₃	2- 	H	H	124-125,5	7,67	E
55	CH ₃	CH ₃	⊕	⊕	H	106-107	7,81	E
56	CH ₃	CH ₃	2-(CH ₃) ₃ C.C≡C)	H	H	olej	7,54	E
57	CH ₃	CH ₃	2-C ₆ H ₅ CH ₂ O ₂ C	H	H	olej	7,36	E
58	CH ₃	CH ₃	2-C ₂ H ₅ O ₂ C	H	H	olej	7,40	E
59	CH ₃	CH ₃	2- 	H	H	131-132	7,43	E
60	CH ₃	CH ₃	2-(CH ₃ CH ₂ O ₂ C)	H	H	118-119	6,42	Z
61	CH ₃	CH ₃	2- 	H	H	168,5-169,5	6,02	Z
62	CH ₃	CH ₃	2-(CH ₂ =CH)	H	H	olej	6,52	Z
63	CH ₃	CH ₃	2-Br	H	H	olej	pod aromaticou	E
64	CH ₃	CH ₃	⊕	⊕	H	158-159	7,70	E
65	CH ₃	CH ₃	⊕	⊕	H	134-135	7,64	E

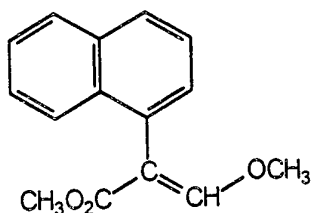
slouče- nina č.	R ¹	R ²	X	Y	Z	teplota tání (°C)	olefinický proton x)	izomer ^{†)}
66	CH ₃	CH ₃	⊕	⊕	H	104-105	6,57	Z
67	CH ₃	CH ₃	⊕	⊕	H	109-110		E
68	CH ₃	CH ₃	⊕	⊕	H	113-114	6,62	Z
69	CH ₃	CH ₃	⊕	⊕	H	139-140	6,50	Z
70	CH ₃	CH ₃	2-F	4-F	H	olej	7,6	E
71	CH ₃	CH ₃	2-(trans-C ₆ H ₅ )	H	H	olej	7,64	E
72	CH ₃	CH ₃	2-(trans-C ₆ H ₅ )	H	H	olej	7,47	E
73	CH ₃	CH ₃	2-Br	4-Br	H	olej	7,55	E
74	CH ₃	CH ₃	2-(2-CH ₃ -pyrid-3-yl)O ₂ C	H	H	olej	7,52	E
75	CH ₃	CH ₃	2-(trans-C ₆ H ₅ )	H	H	136-137	7,50	E
76	CH ₃	CH ₃	2-Br	4-Cl	H	olej	7,58	E
77	CH ₃	CH ₃	2-(E-C ₆ H ₅ C(CF ₃)=CH)	H	H	olej	7,62	E
78	CH ₃	CH ₃	2-C ₆ H ₅ CH ₂ S	H	H	65-68	7,54	E
79	CH ₃	CH ₃	2-C ₆ H ₅ SCO	H	H	101-105	7,46	E
80	CH ₃	CH ₃	2-C ₆ H ₅ CH ₂ O ₂ C	H	H	olej	6,49	Z
81	CH ₃	CH ₃	2-CH ₂ =CHCH ₂ O ₂ C	H	H	olej	7,45	E
82	CH ₃	CH ₃	2-C ₆ H ₁₁ N(CH ₃)CO	H	H	olej	7,50	
							7,53 ^{xx)}	E
83	CH ₃	CH ₃	2-(3-CH ₃ O-C ₆ H ₄)O ₂ C	H	H	olej	7,44	E
84	CH ₃	CH ₃	2-()	H	H	olej	7,54	E
85	CH ₃	CH ₃	2-(3-Cl-C ₆ H ₄)CH ₂	H	H	82	7,59	E
86	CH ₃	CH ₃	2-(4-Cl-C ₆ H ₄)CH ₂	H	H	104	7,59	E
87	CH ₃	CH ₃	2-CHO	H	H	67-69	7,69	E
88	CH ₃	CH ₃	2-(CH ₃ O) ₂ CH	H	H	56	7,54	E
89	CH ₃	CH ₃	2-C ₂ H ₅ O ₂ C-C(CN)=CH	H	H	93-96	7,67	E
90	CH ₃	CH ₃	2-C ₂ H ₅ O ₂ C-CH=CH	H	H	olej	7,63	E

slouče- nina č.	R ¹	R ²	X	Y	Z	teplota tání (°C)	olefinický proton ^{x)}	izomer ⁺
91	CH ₃	CH ₃		H	H	olej	7,56	E
92	CH ₃	CH ₃	2-CH ₃ O ₂ C-CH=CH	H	H	olej	7,64	E
93	CH ₃	CH ₃	2-CH ₃ CO-CH=CH	H	H	90-91	7,65	E
94	CH ₃	CH ₃	⊕	⊕	H	123-127	7,75	E
95	CH ₃	CH ₃		H	H	pevná látka	7,71	E
96	CH ₃	CH ₃	2-C ₆ H ₅ CH ₂ O-C-CH=CH	H	H	106-108	7,61	E
97	CH ₃	CH ₃	⊕	⊕	H	161-162	7,72	E
98	CH ₃	CH ₃	2-C ₃ H ₇ OCO	H	H	kapalina	7,47	E
99	CH ₃	CH ₃	2-BrCH ₂	H	H	84	7,61	E

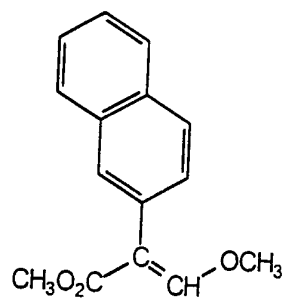
Legenda:

- x) chemický posun singletu, náležející olefinickému protonu na β-metoxyakrylátové skupině (deuterochloroform, hodnoty v ppm oproti tetrametylsilanu)
- xx) dva signály v důsledku existence amidických rotamerů
- +) geometrické uspořádání na β-metoxyakrylátové skupině
- ⊕ substituenty jsou nakondenzované kruhy;

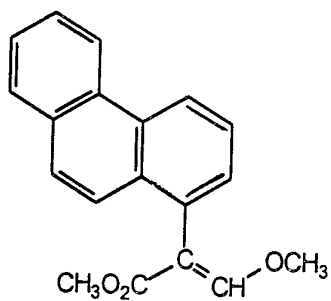
sloučeninou 45 je tedy látka vzorce



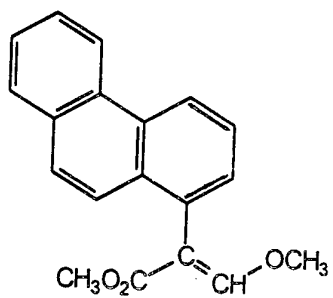
sloučeninou 46 je látka vzorce



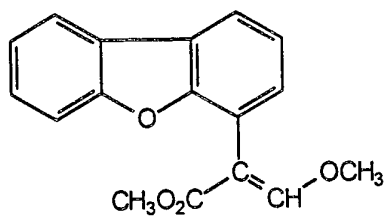
sloučeninou 47 je látka vzorce



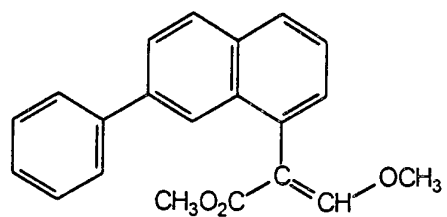
sloučeninou 48 je látka vzorce



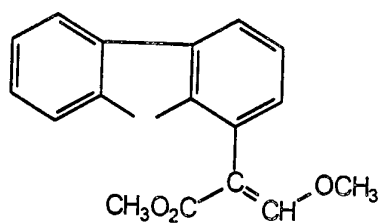
sloučeninou 49 je látka vzorce



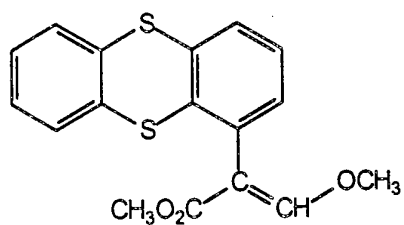
sloučeninou 55 je látka vzorce



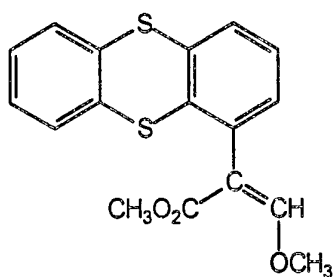
sloučeninou 64 je látka vzorce



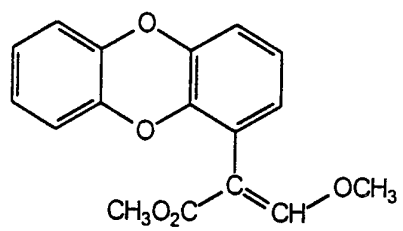
sloučeninou 65 je látka vzorce



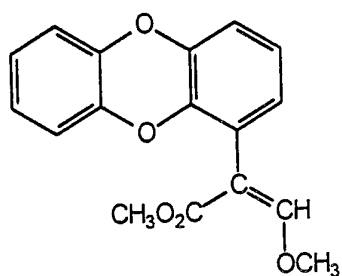
sloučeninou 66 je látka vzorce



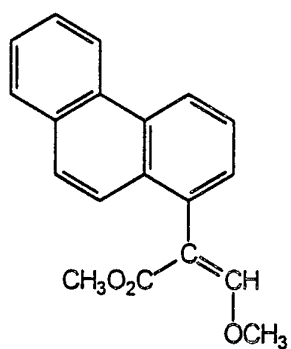
sloučeninou 67 je látka vzorce



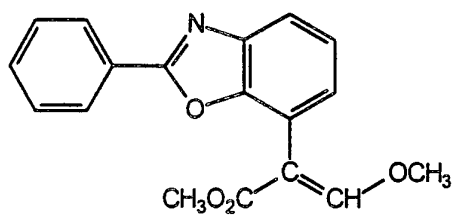
sloučeninou 68 je látka vzorce



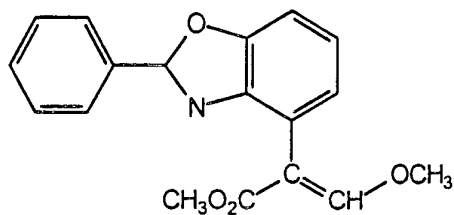
sloučeninou 69 je látka vzorce



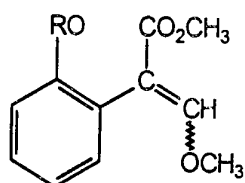
sloučeninou 94 je látka vzorce



sloučeninou 97 je látka vzorce



Tabulka II



slouče- nina č.	R	teplota tání (°C)	olefinický proton ^{x)}	izomer ⁺
1	C ₆ H ₅	olej	7,47	E
2	2-F-C ₆ H ₄	olej	7,42 (d ₆ -DMSO)	E
3	3-F-C ₆ H ₄	olej	7,5	E
4	4-F-C ₆ H ₄	77-78	7,50	E
5	2-Cl-C ₆ H ₄	olej	7,46	E
6	3-Cl-C ₆ H ₄	olej	7,45	E
7	4-Cl-C ₆ H ₄	olej	7,48	E
8	3-Br-C ₆ H ₄	olej	7,32	E
9	3-CH ₃ -C ₆ H ₄	olej	7,4	E
10	4-CH ₃ -C ₆ H ₄	80-81	7,50	E
11	3-CH ₃ O-C ₆ H ₄	olej	7,5	E
12	4-CH ₃ O-C ₆ H ₄	olej	7,51	E
13	3-C ₆ H ₅ O-C ₆ H ₄	olej	7,48	E
14	4-C ₆ H ₄ O-C ₆ H ₄	131-131,5	7,55	E

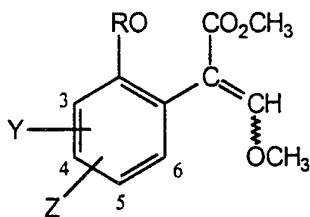
slouče- nina č.	R	teplota tání (°C)	olefinický proton ^{x)}	izomer ⁺)
15	3-NO ₂ -C ₆ H ₄	109-110	7,71	E
16	4-NO ₂ -C ₆ H ₄	107-108	7,49	E
17	4-NH ₂ -C ₆ H ₄	113,5-114,5	7,52	E
18	3-C ₆ H ₅ -C ₆ H ₄	pryskyřice	zakryt	E
19	4-C ₆ H ₅ -C ₆ H ₄	108-109	pod aromatikou	E
20	3-HO-C ₆ H ₄	115-116	7,40	E
21	4-HO-C ₆ H ₄	137-138	7,54	E
22	4-CH ₃ C(O)NH-C ₆ H ₄	43-45	7,48	E
23	2,4-di-F-C ₆ H ₃	kapalina	7,55	E
24	3,4-di-F-C ₆ H ₃	kapalina	7,43	E
25	3,5-di-F-C ₆ H ₃	olej	7,32	E
26	2,4-di-Cl-C ₆ H ₃	olej	7,48	E
27	2,6-di-Cl-C ₆ H ₃	132-133	7,62	E
28	3,4-di-Cl-C ₆ H ₃	olej	7,35	E
29	3,5-di-Cl-C ₆ H ₃	olej	7,50	E
30	3,5-di-CH ₃ O-C ₆ H ₃	kapalina	7,50	E
31	3-F, 4-Cl-C ₆ H ₃	kapalina	7,38	E
32	3-Cl, 4-F-C ₆ H ₃	olej	7,40	E
33	2-Cl, 5-CH ₃ O-C ₆ H ₃	pryskyřice	7,46	E
34	3-Cl, 5-CH ₃ O-C ₆ H ₃	olej	7,45	E
35	3-CH ₃ O, 4-Cl-C ₆ H ₃	pryskyřice	7,49	E
36	2,3,5,6-tetra-Cl-C ₆ H	126-128	7,56	E
37	pentafluorfenyl	79-81	7,58	E
38	H	125-126	7,60	E
39	CH ₃	olej	7,52	E
40	cyklohexyl	olej	7,38	E
41	CH ₂ CHCH ₂	olej	7,46	E
42	E-C ₆ H ₅ CH=CHCH ₂	olej	7,46	E
43	2-pyridyl	olej	7,43	E
44	2-(5'-CF ₃ -pyridyl)	olej	7,40	E
45	1-naftyl	olej	7,5	E
46	2-naftyl	90-91	pod aromatikou	E
47	C ₆ H ₅ CH ₂	76-77	7,49	E
48	CH ₃	74-75	6,55	Z

slouče- nina č.	R	teplota tání (°C)	olefinický proton ^{x)}	izomer ⁺
49	C ₆ H ₅	olej	6,60	Z
50	C ₆ H ₅ CO	73-75	7,50	E
51	4-C ₆ H ₅ C(O)NH-C ₆ H ₄	55-57	pod aromatikou	E
52	4-C ₂ H ₅ O-C ₆ H ₄	olej	7,5	E
53	4-NO-C ₆ H ₄	olej	6,61	Z
54	2-(benzoxazolyl)CH ₂	84-86	7,51	E
55	CH ₃ (CH ₂) ₅	olej	7,47	E
56	3-CF ₃ -C ₆ H ₄	olej	7,31	E
57	4-t-C ₄ H ₉ -CO	95-96	7,52	E
58	(CH ₃) ₂ CHCO	olej	7,47	E
59	3-C ₂ H ₅ O-C ₆ H ₅	pryskyřice	7,44	E
60	3-CH ₃ CO-O-C ₆ H ₅	pryskyřice	7,45	E
61	3-CH ₂ =CHCH ₂ O-C ₆ H ₅	pryskyřice	7,47	E
62	3-CH ₃ SO ₂ O-C ₆ H ₅	pryskyřice	7,45	E
63	3-C ₃ H ₇ O-C ₆ H ₅	pryskyřice	7,50	E
64	3-(CH ₃) ₂ CHO-C ₆ H ₅	pryskyřice	7,38	E
65	3-(C ₂ H ₅) ₂ CHCH ₂ O-C ₆ H ₅	pryskyřice	7,37	E
66	3-CHF ₂ -CF ₂ O-C ₆ H ₅	kapalina	7,28	E
67	3-CH≡CCH ₂ O-C ₆ H ₅	pryskyřice	7,45	E
68	4-CH ₂ =CHCH ₂ O-C ₆ H ₅	80-81	7,41	E
69	4-CH=CCH ₂ O-C ₆ H ₅	107-107,5	7,42	E
70	4-(CH ₃) ₂ CHO-C ₆ H ₅	86	7,41	E
71	4-CH ₃ CO-O-C ₆ H ₅	112	7,40	E
72	4-CH ₃ SO ₂ O-C ₆ H ₅	93-94	7,40	E
73	3-HCONH-C ₆ H ₅	kapalina	7,45	E
74	3-OHC-C ₆ H ₅	pryskyřice	7,46	E

Legenda:

- x) chemický posun singletu, náležejícího olefinickému protonu na β-metoxyakrylátové skupině (deuterochloroform, hodnoty v ppm oproti tetrametylsilanu)
- +) geometrické uspořádání na β-metoxyakrylátové skupině

V následující tabulce III jsou uvedeny sloučeniny obecného vzorce



Tabulka III

slouče- nina č.	R	Y	Z	teplota tání (°C)	olefinický izomer ⁺ proton ^{x)}
1	C ₆ H ₅	3-Cl	H	85-86	7,33 E
2	C ₆ H ₅	5-Cl	H	olej	7,47 E
3	C ₆ H ₅	5-NO ₂	H	olej	7,60 E
4	2-pyridyl	5-F	H	olej	7,40 E
5	2-pyridyl	5-Cl	H	91-93	- E
6	2-pyridyl	5-CH ₃	H	olej	- E
7	C ₆ H ₅	6-C ₆ H ₅ -O	H	olej	7,43 E
8		⊕	H	olej	7,59 E
9		⊕	H	106-107	6,53 Z

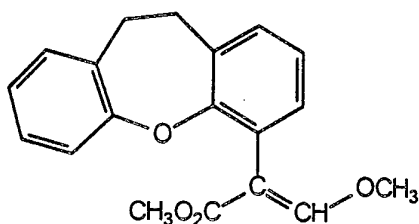
Legenda:

x) chemický posun singletu, náležejícího olefinickému protonu na β-metoxyakrylátové skupině (deuterochloroform, hodnoty v ppm oproti tetrametylsilanu)

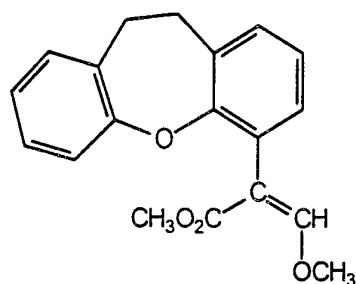
+) geometrické uspořádání na β-metoxyakrylátové skupině

⊕ substituenty jsou nakondenzované kruhy:

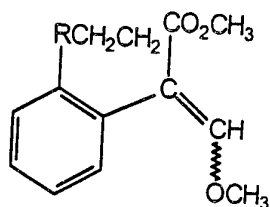
sloučeninou 8 je tedy látka vzorce



sloučeninou 9 je látka vzorce



Tabulka IV



slouče- nina č.	R	teplota tání (°C)	olefinický proton ^{x)}	izomer ⁺
1	C ₆ H ₅	olej	7,59	E
2	4-F-C ₆ H ₄	44,5-45,5	7,59	E
3	4-Cl-C ₆ H ₄	49-50	7,57	E
4	(CH ₃) ₃ C	olej	7,58	E
5	2-pyridyl	60-61	7,58	E
6	C ₆ H ₅	olej	6,24	Z
7	2-furyl	olej	7,59	E
8	2-thiofenyl	olej	7,60	E
9	C ₆ H ₅ CH ₂	olej	7,50	E
10	C ₂ H ₅ O ₂ C	kapalina	7,59	E

Legenda:

- x) chemický posun singletu, náležejícího olefinickému protonu na β-metoxyakrylátové skupině (deuterochloroform, hodnoty v ppm oproti tetrametylsilanu)
- +) geometrické uspořádání na β-metoxyakrylátové skupině

V následující tabulce V jsou uvedeny vybrané údaje protonových NMR spekter pro určité sloučeniny, popsané v tabulkách I až IV, vyskytující se ve formě olejů. Chemické posuny se vyjadřují v ppm oproti tetrametylsilanu, přičemž jako rozpouštědlo se používá vždy deuteriochloroform. Tvary signálů se označují následujícími zkratkami:

br nebo š = široký signál
 s = singlet
 d = dublet
 t = triplet
 q = kvartet
 m = multiplet

Tabulka V

slouče- tabulka
 nina č. č.

3	I	1,27 (3H, t, J = 7 Hz), 3,83 (3H, s), 4,21 (2H, q, J = 7 Hz), 7,32 (5H, br s), 7,53 (1H, s)
4	I	1,30 (3H, t, J = 7 Hz), 3,72 (3H, s), 4,06 (2H, q, J = 7 Hz), 7,31 (5H, br s), 7,62 (1H, s)
5	I	1,27 a 1,31 (2 triplety, J = 7 Hz, vždy 3H), 4,08 a 4,22 (2 kvartety, J = 7 Hz, vždy 2H), 7,33 (5H, br s), 7,62 (1H, s)
6	I	3,81 (3H, s), 5,21 (2H, s), 7,34 (10H, br s), 7,56 (1H, s)
8	I	1,49 (9H, s), 3,82 (3H, s), 7,31 (5H, br s), 7,44 (1H, s)
15	I	1,42 (9H, s), 3,70 (3H, s), 6,50 (2H, s), 7,37 (1H, s)
16	I	1,28 (9H, s), 3,83 (3H, s), 6,46 (2H? s), 7,87 (1H, s)
18	I	3,67 (3H, s), 3,79 (3H, s), 5,18 (1H, dd, J = 11 a 1 Hz), 5,65 (1H, dd, J = 18 a 1 Hz), 6,68 (1H, dd, J = 18 a 11 Hz), 7,57 (1H, s)
24	I	3,78 (3H, s), 3,95 (3H, s), 6,70 (1H, s)
26	I	2,18 (3H, s), ,68 (3H, s), 3,82 (3H, s), 7,55 (1H, s)

slouče- nina č.	tabulka č.	
28	I	3,68 (3H, s), 3,83 (6H, s), 7,25 - 7,6 (3H, m), 7,52 (1H, s), 7,9 - 8,1 (1H, m)
34	I	3,60 (3H, s), 3,66 (3H, s), 3,87 (2H, s), 7,48 (1H, s)
35	I	3,60 (3H, s), 3,70 (3H, s), 3,75 (3H, s), 3,80 (2H, s), 7,50 (1H, s)
36	I	3,6 (3H, s), 3,75 (3H, s), 7,0 - 8,15 (5H, m)
37	I	3,66 (3H, s), 3,76 (3H, s), 7,51 (1H, s)
38	I	3,56 (3H, s), 3,73 (3H, s), 7,1 - 7,7 (9H, m), 7,9 - 8,1 (1H, m)
42	I	3,73 (3H, s), 3,85 (3H, s), 7,54 (1H, s)
44	I	3,77 (3H, s), 3,91 (3H, s), 6,64 (1H, s)
50	I	3,05 (3H, s), 3,43 (3H, s), 3,61 (3H, s)
51	I	3,53 (3H, s), 3,67 (3H, s), 3,85 (3H, s), 7,32 (1H, s)
52	I	3,70 (3H, s), 3,80 (3H, s), 4,97 (2H, s), 7,59 (1H, s)
56	I	1,28 (9H, s), 3,68 (3H, s), 3,82 (3H, s), 7,54 (1H, s)
57	I	3,49 (3H, s), 3,61 (3H, s), 5,17 (2H, s), 7,1 - 7,5 (m), 7,36 (1H, s), 7,95 (1H, š d)
58	I	1,27 (3H, t), 3,59 (3H, s), 3,70 (2H, q), 3,72 (3H, s), 7,1 - 8,0 (4H, m), 7,40 (1H, s)
70	I	3,75 (3H, s), 3,85 (3H, s), 6,7 - 7,30 (3H, m), 7,6 (1H, a)
71	I	3,17 (2H, s), 3,72 (3H, s), 3,87 (3H, s), 7,22 - 7,42 (9H, m), 7,64 (1H, s)
72	I	2,85 - 3,07 (2H, m), 3,64 (3H, s), 3,73 (3H, s), 7,17 - 7,40 (9H, m), 7,47 (1H, s)

slouče- nina č.	tabulka č.	
73	I	3,70 (3H, s), 3,85 (3H, s), 7,00 - 7,10 (1H, d, J = 9 Hz), 7,39 - 7,50 (1H, m), 7,55 (1H, s), 7,79 (1H, s)
74	I	2,45 (3H, s), 3,65 (3H, s), 3,85 (3H, s), 7,15 - 7,18 (1H, m), 7,35 - 7,48 (3H, m), 7,52 (1H, s), 7,60 - 7,64 (1H, m), 8,24 (1H, m), 8,39 (1H, m)
76	I	3,71 (3H, s), 3,86 (3H, s), 7,16 (1H, d, J = 10 Hz), 7,27 (1H, d, J = 10 Hz), 7,58 (1H, s), 7,63 (1H, s)
77	I	3,73 (3H, s), 3,86 (3H, s), 6,75 - 6,80 (1H, m), 6,90 - 7,00 (1H, m), 7,10 - 7,20 (6H, m), 7,62 (1H, s)
80	I	3,49 (3H, s), 3,84 (3H, s), 5,24 (2H, s), 6,49 (1H, s), 7,0 - 7,5 (m), 7,9 (1H, dd)
81	I	7,61 (3H, s), 7,72 (3H, s), 4,68 (2H, d), 5,05 - 5,5 (2H, m), 5,65 - 6,3 (1H, m), 7,1 - 7,6 (m), 7,45 (1H, s), 7,98 (1H, š s)
82	I	0,9 - 1,9 (10H, m), 2,70 (s), 2,88 (s), 3,25 (m), 3,66 (s), 3,67 (s), 3,80 (s), 4,43 (m), 7,2 - 7,4 (m), 7,50 (s), 7,53 (s) (poznámka: zdvojení četných signálů je důsledkem existence amidických rotamerů; integrace odpovídá struktuře)
83	I	3,57 (3H, s), 3,64 (6H, s), 6,6 - 6,8 (3H, m), 7,05 - 7,45 (4H, m), 7,44 (1H, s), 8,05 (1H, š d)
84	I	3,30 (4H, m), 3,58 (4H, m), 3,69 (3H, s), 3,81 (3H, s), 7,2 - 7,45 (m), 7,54 (1H, s)
90	I	1,32 (3H, t), 3,70 (3H, s), 3,82 (3H, s), 4,24 (2H, q), 6,38 (1H, d), 7,15 - 7,40 (3H, m), 7,63 (1H, s), 7,65 (2H, m)
91	I	3,68 (3H, s), 3,80 (3H, s), 3,95 (2H, m), 4,08 (2H, m), 5,77 (1H, s), 7,15 (1H, m), 7,34 (2H, m), 7,56 (1H, s), 7,62 (1H, m)
92	I	3,70 (3H, s), 3,78 (3H, s), 3,81 (3H, s), 6,38 (1H, d), 7,15 - 7,4 (3H, m), 7,64 (1H, s), 7,66 (2H, m)

slouče- nina č.	tabulka č.	
93	I	1,25 (3H, t), 2,50 (2H, t), 2,81 (2H, t), 3,70 (3H, s), 3,82 (3H, s), 4,12 (2H, q), 7,0 - 7,3 (4H, m), 7,59 (1H, s)
95	I	3,72 (3H, s), 3,83 (3H, s), 7,2 - 7,5 (7H, m), 7,71 (1H, s), 7,75 - 7,80 (2H, m), 7,98 (1H, d)
98	I	3,61 (3H, s), 3,74 (3H, s), 4,13 (2H, t, J = 7 Hz), 7,47 (1H, s), 7,97 (1H, š d).
2	II	rozpuštědlo: d ₆ -DMSO 3,39 (3H, s), 3,61 (3H, s), 6,50 - 7,20 (8H, m), 7,42 (1H, s)
5	II	3,63 (3H, s), 3,78 (3H, s), 6,80 - 7,40 (8H, m), 7,46 (1H, s)
6	II	3,60 (3H, s), 3,76 (3H, s), 6,8 - 7,0 (4H, m), 7,14 - 7,32 (4H, m), 7,45 (1H, s)
7	II	3,62 (3H, s), 3,77 (3H, s), 7,48 (1H, s)
8	II	3,41 (3H, s), 3,55 (3H, s), 6,75 - 7,20 (8H, m), 7,32 (1H, s)
9	II	2,22 (3H, s), 3,55 (3H, s), 3,68 (3H, s), 6,4 - 7,4 (8H, m), 7,4 (1H, s)
12	II	3,66 (3H, s), 3,80 (3H, s), 3,82 (3H, s), 6,8 - 7,3 (8H, m), 7,51 (1H, s)
13	II	3,61 (3H, s), 3,78 (3H, s), 6,68 - 7,35 (13H, m), 7,48 (1H, s)
18	II	3,55 (3H, s), 3,71 (3H, s), 6,81 - 7,61 (14H, m) (olefinický proton zakryt aromatickými protony)
23	II	3,61 (3H, s), 3,78 (3H, s), 6,7 - 7,3 (7H, m), 7,55 (1H, s)
24	II	3,59 (3H, s), 3,73 (3H, s), 6,3 - 7,3 (7H, m), 7,43 (1H, s)
25	II	3,49 (3H, s), 3,60 (3H, s), 6,2 - 7,15 (7H, m), 7,32 (1H, s)

slouče- nina č.	tabulka č.	
26	II	3,65 (3H, s), 3,79 (3H, s), 7,48 (1H, s)
28	II	3,45 (3H, s), 3,55 (3H, s), 6,55 - 7,25 (7H, m), 7,35 (1H, s)
29	II	3,45 (3H, s), 3,70 (3H, s), 6,80 - 7,25 (7H, m), 7,50 (1H, s)
30	II	3,55 (3H, m), 3,65 (9H, m), 6,1 a 6,8 - 7,3 (1H a 6H, m), 7,50 (1H, s)
31	II	3,46 (3H, s), 3,63 (3H, s), 6,3 - 7,2 (7H, m), 7,38 (1H, s)
32	II	3,50 (3H, s), 3,65 (3H, s), 6,70 - 7,30 (7H, m), 7,40 (1H, s)
33	II	3,66 (3H, s), 3,67 (3H, s), 3,8 (3H, s), 6,37 - 7,27 (7H, m), 7,46 (1H, s)
34	II	3,60 (3H, s), 3,70 (3H, s), 3,71 (3H, s), 6,40 - 7,30 (7H, m), 7,45 (1H, s)
35	II	3,63 (3H, s), 3,7 (3H, s), 3,73 (3H, s), 6,48 - 7,24 (7H, m), 7,49 (1H, s)
39	II	3,70 (3H, s), 3,79 (3H, s), 3,82 (3H, s), 7,53 (1H, s)
40	II	1,1 - 2,1 (10H, m), 3,65 (3H, s), 3,76 (3H, s), 4,20 (1H, š, s), 7,38 (1H, s)
41	II	3,63 (3H, s), 3,80 (3H, s), 4,51 (2H, d), 5,05 - 6,39 (3H, m), 6,70 - 7,35 (4H, m), 7,46 (1H, s)
42	II	3,60 (3H, s), 3,74 (3H, s), 4,66 (2H, d), 6,00 - 7,40 (11H, m), 7,46 (1H, s)
49	II	3,54 (3H, s), 3,88 (3H, s), 6,60 (1H, s)
43	II	3,55 (3H, s), 3,74 (3H, s), 6,80 (1H, d), 6,95 (1H, m), 7,15 - 7,40 (4H, m), 7,43 (1H, s), 7,65 (1H, m), 8,19 (1H, m)
55	II	0,89 (3H, t), 1,20 - 1,50 (6H, m), 1,50 - 1,80 (2H, m), 3,68 (3H, s), 3,82 (3H, s), 3,92 (2H, t), 6,84 - 7,00 (2H, m), 7,10 - 7,30 (2H, m), 7,47 (1H, s)

slouče-
nina č. tabulka
 č.

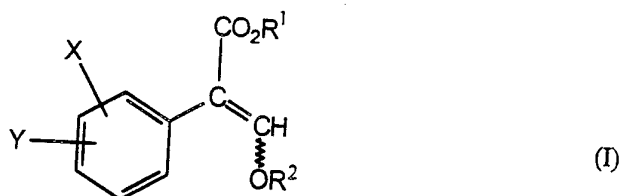
56	II	3,41 (3H, s), 3,51 (3H, s), 6,80 - 7,20 (8H, m), 7,31 (1H, s)
58	II	1,23 (6H, d), 2,3 - 3,0 (1H, m), 3,60 (3H, s), 3,69 (3H, s), 6,9 - 7,4 (m), 7,47 (1H, s)
59	II	1,3 (3H, t), 3,6 (3H, s), 3,76 (3H, s), 3,95 (2H, q), 6,44 - 7,34 (8H, m), 7,44 (1H, s)
60	II	2,31 (3H, s), 3,56 (3H, s), 3,7 (3H, s), 6,64 - 7,39 (8H, m), 7,45 (1H, s)
61	II	3,6 (3H, s), 3,77 (3H, s), 4,46 (1H, t), 4,52 (1H, t), 5,21 - 5,5 (2H, m), 5,86 - 6,21 (1H, m), 6,5 - 7,39 (8H, m), 7,47, 1H, m)
62	II	3,14 (3H, s), 3,62 (3H, s), 3,77 (3H, s), 6,83 - 7,38 (8H, m), 7,45 (1H, s)
63	II	1,83 (3H, t), 1,8 (2H, m), 3,64 (3H, s), 3,78 (3H, s), 3,87 (2H, t), 6,53 - 7,31 (8H, m), 7,50 (1H, s)
64	II	1,23 (6H, d), 3,54 (3H, s), 3,7 (3H, s), 4,39 (1H, m), 6,34 - 7,27 (8H, m), 7,38 (1H, s)
65	II	0,87 (6H, t), 1,38 (5H, m), 3,5 (3H, s), 3,64 (3H, s), 3,72 (2H, d), 6,3 - 7,25 (8H, m), 7,37 (1H, s)
66	II	3,0 (1H), 3,50 (3H, s), 3,60 (3H, s), 6,6 - 7,1 (8H, m), 7,28 (1H, s)
67	II	2,61 (1H, t), 3,62 (3H, s), 3,79 (3H, s), 4,65 (2H, d), 6,57 - 7,3 (8H, m), 7,45 (1H, s)
73	II	3,50 (3H, s), 3,65 (3H, s), 6,7 - 7,3 (8H, m), 7,45 (1H, s), 8,1 (1H)
74	II	3,60 (3H, s), 3,76 (3H, s), 7,00 (1H, d), 7,32 (6H, m), 7,46 (1H, s), 7,56 (1H, d), 9,94 (1H, s)
2	III	3,61 (3H, s), 3,78 (3H, s), 6,8 - 7,3 (8H, m), 7,47 (1H, s)
3	III	3,69 (3H, s), 3,88 (3H, s), 6,84 (1H, d), 7,60 (1H, s), 8,10 (1H, dd), 8,20 (1H, d)

slouče- nina č.	tabulka č.	
7	III	3,58 (3H, s), 3,68 (3H, s), 6,62 - 7,4 (13H, m), 7,43 (1H, s)
8	III	3,06 - 3,26 (4H, m), 3,56 (3H, s), 3,72 (3H, s), 6,88 - 7,20 (7H, m), 7,59 (1H, s)
5	IV	0,92 (9H, s), 3,72 (3H, s), 3,80 (3H, s), 7,58 (1H, s)
7	IV	2,81 (4H, s), 3,58 (3H, s), 3,80 (3H, s), 7,59 (1H, s)
8	IV	2,8 - 3,1 (4H, m), 3,72 (3H, s), 3,81 (3H, s), 7,60 (1H, s)
9	IV	1,80 - 1,92 (2H, m), 2,46 - 2,68 (4H, m), 3,69 (3H, s), 3,77 (3H, s), 7,50 (1H, s)
33	I	1,1 - 2,1 (m), 3,58 (3H, s), 3,67 (3H, s), 4,85 (1H, m), 7,44 (1H, s), 7,94 (1H, zdánlivý d, J = 7 Hz)
57	I	3,49 (3H, s), 3,62 (3H, s), 5,18 (2H, s), 7,35 (1H, s), 7,95 (1H, d, J = Hz), cca 7,3 (3H, m)
58	I	1,30 (3H, t, J = 7 Hz), 3,61 (3H, s), 3,75 (3H, s), 4,24 (2H, q, J = 7 Hz), 7,46 (1H, s), 7,97 (1H, zdánlivý d, J = 7 Hz), 7,15 - 7,5 (3H, m)
59	I	3,32 (3H, s), 3,51 (3H, s), 3,56 (3H, s), 6,54 - 7,5 (8H, m)
3	II	3,6 (3H, s), 3,76 (3H, s), 6,56 - 7,42 (8H, m), 7,5 (1H, s)
11	II	3,62 (3H, s), 3,75 (3H, s), 3,8 (3H, s), 6,7 - 7,4 (8H, m), 7,5 (1H, s)
19	II	3,55 (3H, s), 3,65 (3H, s), 6,6 - 7,2 (14H, m)
45	II	3,66 (3H, s), 3,82 (3H, s), ,86 - 8,36 (11H, m), 7,5 (1H, s)
46	II	3,5 (3H, s), 3,6 (3H, s), 6,7 - 7,95 (12H, m)
52	II	1,37 (3H, t), 3,62 (3H, s), 3,77 (3H, s), 3,98 (2H, q), 6,72 - 7,32 (8H, s), 7,5 (1H, s)

slouče- nina č.	tabulka č.	
62	I	3,67 (3H, s), 3,92 (3H, s), 5,23 (1H, dd), 5,65 (1H, dd), 6,52 (1H, s), 6,80 (1H, dd)
63	I	3,74 (3H, s), 3,88 (3H, s), 7,10 - 7,38 (3H, m), 7,50 - 7,68 (2H, m)
44	II	3,58 (3H, s), 3,72 (3H, s), 6,88 (1H, dd), 7,1 - 7,5 (4H, m), 7,40 (1H, s), 7,84 (1H, dd), 8,44 (1H, š)
53	II	3,49 (3H, s), 3,88 (3H, s), 6,61 (1H, s), 6,92 - 7,08 (3H, m), 7,2 - 7,4 (3H, m), 8,14 - 8,2 (2H, m).

P A T E N T O V É N Á R O K Y

1. Způsob výroby derivátů akrylové kyseliny obecného vzorce I



ve kterém

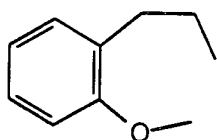
R^1 a R^2 nezávisle na sobě znamenají vždy alkylovou skupinu s 1 až 6 atomy uhlíku, fenylovou skupinu nebo benzylovou skupinu,

X představuje atom vodíku, atom halogenu, hydroxylovou skupinu, alkylovou skupinu s 1 až 6 atomy uhlíku, popřípadě substituovanou halogenem, alkoxy skupinou s 1 až 4 atomy uhlíku, alkylendioxy skupinou s 1 až 4 atomy uhlíku, fenylovou skupinou, která sama popřípadě nese substituent; vybraný ze skupiny, zahrnující atomy halogenů a alkoxy skupiny s 1 až 4 atomy uhlíku, fenoxyskupinou, pyridylovou skupinou, furylovou skupinou, thienylovou skupinou nebo alkoxykarbonylovou

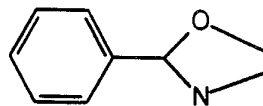
skupinou s 1 až 4 atomy uhlíku v alkoxylové části, alkenylovou skupinu se 2 až 6 atomy uhlíku, popřípadě substituovanou fenylovou skupinou, halogenalkylovou skupinou s 1 až 4 atomy uhlíku, kyanoskupinou, alkylkarbonylovou skupinou s 1 až 4 atomy uhlíku v alkylové části, alkoxykarbonylovou skupinou s 1 až 4 atomy uhlíku v alkoxylové části, benzyloxykarbonylovou skupinou, furylovou skupinou nebo benzthiazolylovou skupinou, fenylovou skupinu, alkinylovou skupinu se 2 až 6 atomy uhlíku, popřípadě substituovanou fenylovou skupinou, halogenalkylovou skupinu s 1 až 4 atomy uhlíku, alkoxyskupinu s 1 až 6 atomy uhlíku, cykloalkoxyskupinu se 3 až 6 atomy uhlíku, alkenyloxyskupinu se 2 až 6 atomy uhlíku, popřípadě substituovanou fenylovou skupinou, fenoxyskupinu, popřípadě substituovanou halogenem, alkylovou skupinou s 1 až 4 atomy uhlíku, halogenalkylovou skupinou s 1 až 4 atomy uhlíku, popřípadě halogensubstituovanou alkoxyskupinou s 1 až 6 atomy uhlíku, alkenyloxyskupinou se 2 až 6 atomy uhlíku, alkinyloxyskupinou se 2 až 6 atomy uhlíku, alkylkarbonyloxyskupinou s 1 až 4 atomy uhlíku v alkylové části, alkylsulfonyloxyskupinou s 1 až 4 atomy uhlíku, fenoxyskupinu, nitroskupinou, aminoskupinou, fenylovou skupinou, formylovou skupinou, hydroxyskupinou, formylaminoskupinou, alkylkarbonylaminoskupinou s 1 až 4 atomy uhlíku v alkylové části nebo benzoylaminoskupinou, naftyloxyskupinu, pyridyloxyskupinu, popřípadě substituovanou halogenalkylovou skupinou s 1 až 4 atomy uhlíku, fenylthioskupinu, fenylsulfinylovou skupinu, fenylsulfenylovou skupinu, fenylalkoxyskupinu s 1 až 4 atomy uhlíku v alkoxylové části, alkylkarbonyloxyskupinu s 1 až 4 atomy uhlíku v alkylové části, benzoyloxyskupinu, aminoskupinu, popřípadě substituovanou alkylovou skupinou s 1 až 4 atomy uhlíku nebo fenylovou skupinou, benzoylaminoskupinu, furoylaminoskupinu, thienylkarbonylaminoskupinu, nitroskupinu, nitrilovou skupinu, zbytek vzorce $-\text{CO}_2\text{R}^3$, v němž R^3 představuje alkylovou skupinu s 1 až 4 atomy uhlíku, cykloalkylovou skupinu se 3 až 6 atomy uhlíku, alkenylovou skupinu se 2 až 5 atomy uhlíku, benzylovou skupinu, fenylovou skupinu, popřípadě substituovanou alkoxyskupinou s 1 až 4 atomy uhlíku, nebo pyridylovou skupinu, popřípadě substituovanou alkylovou skupinou s 1 až 4 atomy uhlíku, nebo zbytek vzorce $-\text{CONR}^4\text{R}^5$, v němž R^4 a R^5 nezávisle na sobě představují atom vodíku, alkylovou skupinu s 1 až 4 atomy uhlíku nebo cykloalkylovou skupinu se 3 až 6 atomy uhlíku, nebo zbytek vzorce $-\text{COR}^6$, v němž R^6 představuje atom vodíku, fenylovou skupinu, popřípadě substituovanou alkoxyskupinou s 1 až 4 atomy uhlíku nebo morfolinoskupinu a

Y znamená atom vodíku, atom halogenu, alkylovou skupinu s 1 až 6 atomy uhlíku, nitroskupinu nebo fenoxyskupinu, nebo

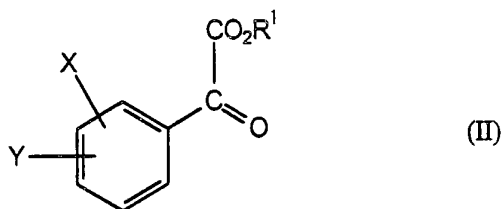
X a Y, které se nacházejí na fenylovém kruhu v sousedících polohách, jsou spolu spojeny za vzniku nakondenzovaného benzenového kruhu, popřípadě substituovaného fenylovou skupinou, nebo nakondenzovaného naftalenového, benzofuranylového, benzothienylového, thianthrenylového nebo dibenzodioxinylového kruhu, nebo zbytku vzorce



nebo



a jejich stereoizomerů, v y z n a č u j í c í s e t í m, že se sloučenina obecného vzorce II



ve kterém

R^1 , X a Y mají shora uvedený význam,

nechá reagovat se sloučeninou obecného vzorce V



ve kterém

Ph znamená fenylovou skupinu a

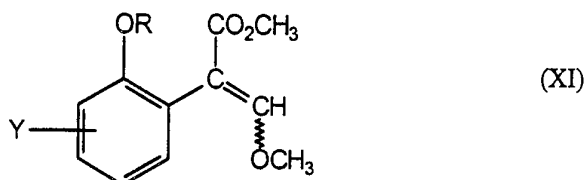
R^2 má shora uvedený význam,

a výsledný produkt se izoluje, popřípadě ve formě stereoizomeru.

2. Způsob podle nároku 1, v y z n a č u j í c í s e t í m, že se použijí odpovídající výchozí látky, za vzniku sloučenin shora uvedeného obecného vzorce I, kde jednotlivé obecné symboly mají význam jako v nároku 1 s tím, že zbytek ve významu symbolu X je na fenylovém kruhu navázán v orto-poloze vůči akrylátovému zbytku, a jejich stereoizomerů.
3. Způsob podle nároku 1 nebo 2, v y z n a č u j í c í s e t í m, že se použijí odpovídající výchozí látky, za vzniku sloučenin shora uvedeného obecného vzorce I, ve kterém R^1

a R^2 znamenají metylové skupiny a zbývající obecné symboly mají význam jako v nárocích 1 a 2, a jejich stereoizomerů.

4. Způsob podle nároku 1, v y z n a č u j í c í s e t í m, že se použijí odpovídající výchozí látky, za vzniku sloučenin obecného vzorce XI



ve kterém

R znamená fenylovou skupinu, popřípadě substituovanou halogenem, alkylovou skupinou s 1 až 4 atomy uhlíku, halogenalkylovou skupinou s 1 až 4 atomy uhlíku, alkoxy skupinou s 1 až 4 atomy uhlíku, fenoxyskupinou, nitroskupinou, aminoskupinou, fenylovou skupinou, formylovou skupinou, hydroxyskupinou, formylaminoskupinou, alkylkarbonylaminoskupinou s 1 až 4 atomy uhlíku v alkylové části nebo benzoylaminoskupinou a

Y představuje atom vodíku, fluoru či chloru, metylovou skupinu nebo nitroskupinu,

a jejich stereoizomerů.

5. Způsob podle nároku 1, v y z n a č u j í c í s e t í m, že se použijí odpovídající výchozí látky, za vzniku sloučenin shora uvedeného obecného vzorce I,

ve kterém

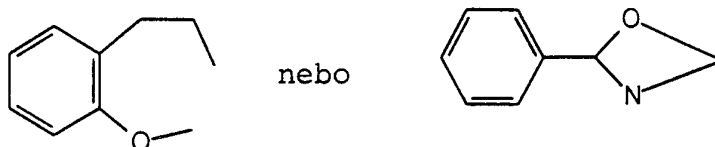
R^1 a R^2 nezávisle na sobě znamenají vždy alkylovou skupinu s 1 až 6 atomy uhlíku, fenylovou skupinu nebo benzylovou skupinu,

X představuje atom vodíku, atom halogenu, alkylovou skupinu s 1 až 6 atomy uhlíku, popřípadě substituovanou halogenem, alkoxy skupinou s 1 až 4 atomy uhlíku, alkylendioxy skupinou s 1 až 4 atomy uhlíku, fenylovou skupinou, která sama popřípadě nese substituent, vybraný ze skupiny, zahrnující atomy halogenů a alkoxy skupiny s 1 až 4 atomy uhlíku, fenoxyskupinou, pyridylovou skupinou, furylovou skupinou, thienylovou skupinou nebo alkoxykarbonylovou skupinou s 1 až 4 atomy uhlíku v alkoxylové části, alkenylovou skupinu se 2 až 6 atomy uhlíku, popřípadě substituovanou fenylovou skupinou, halogenalkylovou skupinou s 1 až 4 atomy uhlíku, kyanoskupinou, alkylkarbo-

nylovou skupinou s 1 až 4 atomy uhlíku v alkylové části, alkoxykarbonylovou skupinou s 1 až 4 atomy uhlíku v alkoxylové části, benzyloxykarbonylovou skupinou, furylovou skupinou nebo benzthiazolylovou skupinou, fenylovou skupinu, alkinylovou skupinu se 2 až 6 atomy uhlíku, popřípadě substituovanou fenylovou skupinou, halogenalkylovou skupinu s 1 až 4 atomy uhlíku, alkoxyskupinu s 1 až 6 atomy uhlíku, fenoxyskupinu, popřípadě substituovanou halogenem, alkylovou skupinou s 1 až 4 atomy uhlíku, halogenalkylovou skupinou s 1 až 4 atomy uhlíku, popřípadě halogen-substituovanou alkoxyskupinou s 1 až 6 atomy uhlíku, alkenyloxyskupinou se 2 až 6 atomy uhlíku, alkinyloxyskupinou se 2 až 6 atomy uhlíku, alkylkarbonyloxyskupinou s 1 až 4 atomy uhlíku v alkylové části, alkylsulfonyloxyskupinou s 1 až 4 atomy uhlíku, fenoxyskupinou, nitroskupinou, aminoskupinou, fenylovou skupinou, formylovou skupinou, hydroxyskupinou, formylaminoskupinou, alkylkarbonylaminoskupinou s 1 až 4 atomy uhlíku v alkylové části nebo benzoylaminoskupinou, naftyloxyskupinu, fenylalkoxyskupinu s 1 až 4 atomy uhlíku v alkoxylové části, alkylkarbonyloxyskupinu s 1 až 4 atomy uhlíku v alkylové části, benzoyloxyskupinu, aminoskupinu, popřípadě substituovanou alkylovou skupinou s 1 až 4 atomy uhlíku nebo fenylovou skupinou, benzoylaminoskupinu, furoylaminoskupinu, thienylkarbonylaminoskupinu, nitroskupinu, nitrilovou skupinu, zbytek vzorce $-\text{CO}_2\text{R}^3$, v němž R^3 představuje alkylovou skupinu s 1 až 4 atomy uhlíku, cykloalkylovou skupinu se 3 až 6 atomy uhlíku, alkenylovou skupinu se 2 až 5 atomy uhlíku, benzylovou skupinu nebo fenylovou skupinu, popřípadě substituovanou alkoxyskupinou s 1 až 4 atomy uhlíku, nebo zbytek vzorce $-\text{CONR}^4\text{R}^5$, v němž R^4 a R^5 nezávisle na sobě představují atom vodíku, alkylovou skupinu s 1 až 4 atomy uhlíku nebo cykloalkylovou skupinu se 3 až 6 atomy uhlíku, nebo zbytek vzorce $-\text{COR}^6$, v němž R^6 představuje atom vodíku nebo fenylovou skupinu, popřípadě substituovanou alkoxyskupinou s 1 až 4 atomy uhlíku a

Y znamená atom vodíku, atom halogenu, alkylovou skupinu s 1 až 6 atomy uhlíku, nitroskupinu nebo fenoxyskupinu, nebo

X a Y, které se nacházejí na fenylovém kruhu v sousedících polohách, jsou spolu spojeny za vzniku nakondenzovaného benzenového, naftalenového, benzofuranylového, benzothienylového, thianthrenylového nebo dibenzodioxinylového kruhu, nebo zbytku vzorce



a jejich stereoizomerů.

6. Způsob podle nároku 1, v y z n a č u j í c í s e t í m, že se použijí odpovídající výchozí látky, za vzniku sloučenin shora uvedeného obecného vzorce I,

ve kterém

R^1 a R^2 nezávisle na sobě znamenají vždy alkylovou skupinu s 1 až 6 atomy uhlíku, fenylovou skupinu nebo benzylovou skupinu,

X představuje atom vodíku, atom halogenu, alkylovou skupinu s 1 až 6 atomy uhlíku, popřípadě substituovanou halogenem, alkoxy skupinou s 1 až 4 atomy uhlíku, alkylendioxy skupinou s 1 až 4 atomy uhlíku, fenylovou skupinou, která sama popřípadě nese substituent, vybraný ze skupiny zahrnující atomy halogenů a alkoxy skupiny s 1 až 4 atomy uhlíku, fenoxyskupinou, pyridylovou skupinou, furylovou skupinou, thienylovou skupinou nebo alkoxykarbonylovou skupinou s 1 až 4 atomy uhlíku v alkoxylové části, alkenylovou skupinu se 2 až 6 atomy uhlíku, popřípadě substituovanou fenylovou skupinou, halogenalkylovou skupinou s 1 až 4 atomy uhlíku, kyanoskupinou, alkylkarbonylovou skupinou s 1 až 4 atomy uhlíku v alkylové části, alkoxykarbonylovou skupinou s 1 až 4 atomy uhlíku v alkoxylové části, benzyloxykarbonylovou skupinou, furylovou skupinou nebo benzthiazolylovou skupinou, fenylovou skupinu, alkinylovou skupinu se 2 až 6 atomy uhlíku, popřípadě substituovanou fenylovou skupinou, halogenalkylovou skupinu s 1 až 4 atomy uhlíku, alkoxy skupinu s 1 až 6 atomy uhlíku, fenoxyskupinu, popřípadě substituovanou halogenem, alkylovou skupinou s 1 až 4 atomy uhlíku, halogenalkylovou skupinou s 1 až 4 atomy uhlíku, popřípadě halogensubstituovanou alkoxy skupinou s 1 až 6 atomy uhlíku, alkenyloxyskupinou se 2 až 6 atomy uhlíku, alkinyloxyskupinou se 2 až 6 atomy uhlíku, alkylkarbonyloxyskupinou s 1 až 4 atomy uhlíku v alkylové části, alkylsulfonyloxyskupinou s 1 až 4 atomy uhlíku, fenoxyskupinou, nitroskupinou, aminoskupinou, fenylovou skupinou, formylovou skupinou, hydroxyskupinou, formylaminoskupinou, alkylkarbonylaminoskupinou s 1 až 4 atomy uhlíku v alkylové části nebo benzoylaminoskupinou, naftyloxyskupinu, fenylalkoxy skupinu s 1 až 4 atomy uhlíku v alkoxylové části, aminoskupinu, benzoylaminoskupinu, furoylaminoskupinu, thienylkarbonylaminoskupinu, nitroskupinu, nitrilovou skupinu, zbytek vzorce $-CO_2R^3$, v němž R^3 představuje alkylovou skupinu s 1 až 4 atomy uhlíku, cykloalkylovou

skupinu se 3 až 6 atomy uhlíku, alkenylovou skupinu se 2 až 5 atomy uhlíku, benzylovou skupinu nebo fenylovou skupinu, popřípadě substituovanou alkoxy skupinou s 1 až 4 atomy uhlíku, nebo zbytek vzorce $-\text{CONR}^4\text{R}^5$, v němž R^4 a R^5 nezávisle na sobě představují atom vodíku, alkylovou skupinu s 1 až 4 atomy uhlíku nebo cykloalkylovou skupinu se 3 až 6 atomy uhlíku, nebo zbytek vzorce $-\text{COR}^6$, v němž R^6 představuje atom vodíku nebo fenylovou skupinu, popřípadě substituovanou alkoxy skupinou s 1 až 4 atomy uhlíku a

Y znamená atom vodíku, atom halogenu, alkylovou skupinu s 1 až 6 atomy uhlíku, nitroskupinu nebo fenoxyskupinu,

a jejich stereoizomerů.

Konec dokumentu
