

63195

A KÖZZÉTETELI
PÉLDÁNY

α -PIRIMIDINIL-AKRILSAV-SZÁRMAZÉKOK, ELJÁRÁS AZ ELŐÁLLÍTÁSUKRA ÉS
ALKALMAZÁSUK FUNGICIDKÉNT.
SANDOZ A.G., Bázél, Svájc

A bejelentés napja: 1995.01.10

Elsőbbsége: 1994.01.18 (9400889 3) GB.

Kivonat

69054

A találmány (I) általános képletű vegyületekre és azok felhasználására fitopatogének irtására, továbbá az ilyen felhasználást megkönnyítő kompozíciókra, valamint a (I) általános képletű vegyületek előállítására vonatkozik. A (I) általános képletben

R¹ jelentése C₁₋₄ alkoxicsoport vagy -NR⁸R⁹ általános képletű csoport,

R² jelentése C₁₋₄ alkil-, C₁₋₄ haloalkil-, aril-, ariloxi-, C₃₋₅ alkenil-oxi-, C₃₋₅ alkinil-oxi-, halogén-, aril-C₁₋₄ alkoxi-, aril-oxi-C₁₋₄ alkil-, aril-oxi-C₁₋₄ alkoxi-, aril-C₃₋₅ alkenil-oxi-, heteroaril-, heteroaril-oxi-, C₁₋₄ alkoxi-, C₂₋₅ alkenil-, C₂₋₅ alkinil- vagy C₁₋₄ alkoxi-karbonil-csoport, -CONR¹⁰R¹¹, -O-CONR¹⁰R¹¹, -CR⁷=N-NR⁶R¹², -CR⁷=N-O-R⁶ vagy (a) általános képletű csoport,

R³ jelentése hidrogén- vagy halogénatom vagy C₁₋₄ alkil-, C₁₋₄ alkoxi-, ciano- vagy nitrocsoport,

R⁴ jelentése hidrogénatom, halogénatom, C₁₋₄ alkoxi- vagy C₁₋₄ alkilcsoport,

R⁵ jelentése hidrogénatom vagy metilcsoport,

R⁶ jelentése C₁₋₁₂ alkil-, C₃₋₁₂ alkenil-, C₃₋₁₂ alkinil-, aril-C₁₋₄ alkil-, aril- vagy heteroarilcsoport,

R⁷ jelentése hidrogénatom vagy metilcsoport,

R^8 és R^9 jelentése egymástól függetlenül C_{1-4} alkilcsoport,
vagy pedig jelentésük együtt C_{3-6} alkiléncsoport,

R^{10} és R^{11} jelentése egymástól függetlenül C_{1-4} alkilcso-
port, vagy pedig együtt C_{3-6} alkiléncsoportot vagy olyan
 C_{3-6} alkiléncsoportot jelentenek, amely oxigén- vagy
kénatommal van megszakítva,

R_{12} jelentése hidrogénatom vagy metilcsoport,

E jelentése C_{1-3} alkiléncsoport,

X jelentése CH vagy nitrogénatom és

Y jelentése OCH_3 , NH_2 , $NHCH_3$ vagy $N(CH_3)_2$ csoport.

JK.

63/95

A

6. 1. 15. 1.

**KÖZZETETELI
PÉLDÁNY**

Képviselő:

Danubia Szabadalmi és Védjegy Iroda Kft.

Budapest

USC6 - ACN 43154

COTD.239/24

α -PIRIMIDINIL-AKRILSAV-SZÁRMAZÉKOK, ELJÁRÁS AZ ELŐÁLLÍTÁSUKRA
ÉS ALKALMAZÁSUK FUNGICIDHENT.

SANDOZ A.G., Bazel, Svájc

Feltalálók:

Dr. EBERLE Martin, Bottmingen, Svájc

Dr. SCHAUB Fritz, Aesch, Svájc

Dr. CRAIG Gerald Wayne, Bazel, Svájc

A bejelentés napja: 1995. 01. 10.

Elsőbbsége: 1994. 01. 18. (9400889.3) ^{GB}Anglia

Aktaszámunk: 80889-2703-fa

Ügyintézőnk: dr. Palágyi

A találmány új α -pirimidinil-ecetsav-származékokra, azok szintézisére, valamint e vegyületek fitopatogének irtására való felhasználására vonatkozik.

Az α -(pirid-3-il)- β -metoxi-akrilátok ismertek a 243 012 sz. európai közrebocsátási iratból. Ezeket a vegyületeket mezőgazdasági és kertészeti fungicidekként való felhasználásra javasolták.

Most azt találtuk, hogy a (I) általános képletű 2-(4-fenoxi-pirimidin-5-il)-ecetsav-származékok rendkívül hatá-
sosak fitopatogének ellen - a képletben

- R^1 jelentése C_{1-4} alkoxicsoport vagy $-NR^8R^9$ általános képletű csoport,
- R^2 jelentése C_{1-4} alkil-, C_{1-4} haloalkil-, aril-, ariloxi-, C_{3-5} alkenil-oxi-, C_{3-5} alkinil-oxi-, halogén-, aril-
- C_{1-4} alkoxi-, aril-oxi- C_{1-4} alkil-, aril-oxi- C_{1-4} alk-
oxi-, aril- C_{3-5} alkenil-oxi-, heteroaril-, heteroaril-
-oxi-, C_{1-4} alkoxi-, C_{2-5} alkenil-, C_{2-5} alkinil- vagy
 C_{1-4} alkoxi-karbonil-csoport, $-CONR^{10}R^{11}$, $-O-CONR^{10}R^{11}$,
 $-CR^7=N-NR^6R^{12}$, $-CR^7=N-O-R^6$ vagy (a) általános képletű
csoport,
- R^3 jelentése hidrogén- vagy halogénatom vagy C_{1-4} alkil-,
 C_{1-4} alkoxi-, ciano- vagy nitrocsoport,
- R^4 jelentése hidrogénatom, halogénatom, C_{1-4} alkoxi- vagy
 C_{1-4} alkilcsoport,
- R^5 jelentése hidrogénatom vagy metilcsoport,
- R^6 jelentése C_{1-12} alkil-, C_{3-12} alkenil-, C_{3-12} alkinil-,
aryl- C_{1-4} alkil-, aril- vagy heteroarilcsoport,
- R^7 jelentése hidrogénatom vagy metilcsoport,

R⁸ és R⁹ jelentése egymástól függetlenül C₁₋₄ alkilcsoport,
vagy pedig jelentésük együtt C₃₋₆ alkilénecssoport,

R¹⁰ és R¹¹ jelentése egymástól függetlenül C₁₋₄ alkilcsoport, vagy pedig együtt C₃₋₆ alkilénecssoportot vagy olyan C₃₋₆ alkilénecssoportot jelentenek, amely oxigén- vagy kénatommal van megszakítva,

R₁₂ jelentése hidrogénatom vagy metilcsoport,

E jelentése C₁₋₃ alkilénecssoport,

X jelentése CH vagy nitrogénatom és

Y jelentése OCH₃, NH₂, NHCH₃ vagy N(CH₃)₂ csoport.

A (I) általános képletű vegyületek szubsztituenseinek meghatározásakor az alkilcsoport megjelölés egyenes szénláncú és elágazó szénláncú alkilcsoportokat jelent, amelyek közül előnyösek az elágazó szénláncú, valamint a rövid szénláncú alkilcsoportok. Példaként megemlítjük a metil-, etil-, n-propil, izopropil-, n-butyl-, izobutyl-, terc-butyl és szek-butyl-csoportokat. Az alkoxics csoportok példáuliként megemlítjük a metoxi, az etoxi, az n-propoxi-, az izopropoxi-, az n-butyl-oxi-, az izobutyl-oxi-, a terc-butyl-oxi és a szek-butyl-oxi-csoportokat. A "halogén" megjelölés fluor-, klór-, bróm- és jódatomokra vonatkozik, amelyek közül a fluor- és a klóratom előnyös. A "halo-alkil" megjelölés egyenes vagy elágazó szénláncú vagy olyan alkilcsoportokra vonatkozik, amelyek egy vagy több halogénatomot tartalmaznak; ezek közül előnyösek az egyenes és rövid szénláncú olyan alkilcsoportok, amelyek fluor- vagy klóratomot tartalmaznak. Példaként megemlítjük a trifluor-metil-, a difluor-metil-, a 2,2,2-trifluor-etil- és a 2,2,3,3,3-pentafluor-

-propil-csoportot. Az "aril" megjelölés aromás szénhidrogén-csoportokra, például a fenil-, a naftil- vagy az antracenil-csoportra vonatkozik, amelyek közül a fenilcsoport előnyös. Az arilcsoport előnyösen tovább lehet szubsztituálva. Az "aril-oxi-csoport" megjelölés olyan arilcsoportra vonatkozik, amely oxigénatomon keresztül kapcsolódik. Erre példaként megemlítjük a fenoxi-, a naftil-oxi- és az antracenil-oxi-csoportot. Az aril-oxi-csoport előnyösen az arilrészen tovább lehet szubsztituálva. Az "alkenil-oxi-csoport" példáuliként megemlítjük az allil-oxi-, a 2-butenil-oxi-, a 3-butenil-oxi-, a 2-pentenil-oxi-, a 2-metallil-oxi-, 3-pentenil-oxi-, a 4-pentenil-oxi-, a 2-metil-2-butenil-oxi-, a 3-metil-2-butenil-oxi- és a 3-metil-3-butenil-oxi-csoportot. Az "alkinil-oxi-csoport" példáuliként megemlítjük a propargil-oxi-, a 2-butinil-oxi-, a 3-butinil-oxi-, a 2-pentinil-oxi-, a 3-pentinil-oxi-, a 4-pentinil-oxi-, a 2-metil-3-butinil-oxi- és az 1-metil-propargil-oxi-csoportot. Az "aril-alkoxi-csoport" például benzil-oxi-, 2-fenil-etoxi-, 1-fenil-etoxi- vagy 3-fenil-propoxi-csoport lehet. Az aril-alkoxi-csoport előnyösen az arilrészen tovább lehet szubsztituálva.

Az R^4 és az R^5 szubsztituensek által együtt képezett alkilénhíd egyenes vagy elágazó lehet. Példáiként megemlítjük a $-(CH_2)_3-$, a $-(CH_2)_4-$, a $-(CH_2)_5-$ és a $-CH_2-CH_2-CH(CH_3)-CH_2-$ csoportokat. Az "E" jelölésű alkilénlánc például $-CH_2-$, $-CH_2-CH_2-$, $-C(CH_3)_2-$ vagy $-CH(CH_3)-$ csoport lehet.

Az "aril-oxi-alkoxi-csoport" példáuliként megemlítjük a

fenoxi-metoxi-csoportot, az 1-fenoxi-etoxi-csoportot, a 2-fenoxi-etoxi-csoportot, a 3-fenoxi-propoxi-csoportot és a 2-fenoxi-propoxi-csoportot. Az aril-oxi-alkoxi-csoport adott esetben az arilrészen tovább lehet szubsztituálva. Az "aril-alkenil-oxi-csoport" példájaként megemlítjük a 3-fenil-allil-oxi-csoportot és a 3-fenil-metallil-oxi-csoportot. Az aril-alkenil-oxi-csoport adott esetben az arilrészen tovább lehet szubsztituálva. Az "aril-oxi-alkil-csoport" vagy a "heteroaril-oxi-alkil-csoport" olyan aril- vagy heteroaril csoportot jelent, amely oxigénatomon keresztül kapcsolódik az alkillánchoz. Jellegzetes példákként megemlítjük a fenoxi-metil-csoportot, a fenoxi-etil-csoportot és a fenoxi-propil-csoportot. Az aril-oxi-alkil-csoport és a heteroaril-oxi-csoport adott esetben az aromás gyűrűn tovább lehet szubsztituálva.

Az "alkenilcsoport" példáiként megemlítjük a vinilcsoportot, az allilcsoportot, a 2-butenilcsoportot, a 3-butenilcsoportot, a 2-pentenilcsoportot, a 2-metallilcsoportot, a 3-pentenilcsoportot, a 4-pentenilcsoportot, a 2-metil-2-butenil-csoportot, a 3-metil-2-butenil-csoportot és a 3-metil-3-butenil-csoportot. Az "alkinilcsoport" példáiként megemlítjük az etinil-, a propargil-, a 2-butinil-, a 3-butinil-, a 2-pentinil-, a 3-pentinil-, a 4-pentinil-, a 2-metil-3-butinil- és az 1-metil-propargil-csoportot. A "heteroarilcsoport" megjelölés az olyan aromás 5- vagy 6-tagú gyűrűs csoportokra vonatkozik, amelyek 1, 2 vagy 3 nitrogén-, oxigén- vagy kénatomot tartalmaznak és amelyek egy másik heteroarilcsoporttal vagy arilcsoporttal kondenzálva is lehetnek.

Ilyen csoportok példáulként megemlítjük a piridil-, a pirimidinil-, a tienil-, az oxazolil-, az oxadiazolil-, a triazolil-, a tiadiazolil-, a furil-, az izoxazolil-, a tiazolil-, az imidazolil-, a pirazolil-, a benzotiazolil-, a benzoxazolil- és a hasonló csoportokat.

A "heteroaril-oxi-csoport" megjelölés az oxigénhídon keresztül kapcsolódó heteroarilcsoportokra vonatkozik.

Az R^8 és az R^9 szubsztituensek vagy az R^{10} és az R^{11} szubsztituensek által a szomszédos nitrogénatommal együtt képezett alkilénhidak például azzal a nitrogénatommal együtt, amelyhez kapcsolódnak, pirrolidinil- vagy piperidinilcsoportot képezhetnek. Ahol az alkilénláncot oxigénatom vagy kénatom szakítja meg, az $NR^{10}R^{11}$ csoport például N-morfolinil-csoport vagy N-tiomorfolinil-csoport lehet.

Az "alkoxi-karbonil-csoport" példáulként megemlítjük a metoxi-karbonil-csoportot, az etoxi-karbonil-csoportot és a propoxi-karbonil-csoportot.

A különböző egyéb meghatározások kombinálásával létrejövő csoportokban az egyes meghatározások ugyanolyan jelentésűek, mint amilyeneket az egyes részleges meghatározásokra külön megadtunk.

A fentebbi arilcsoportok és heteroarilcsoportok tovább lehetnek szubsztituálva. Amikor az arilcsoport vagy a heteroarilcsoport szubsztituálva van, a szubsztituensek előnyösen az alábbi csoportok közül egyet vagy kettőt jelenthetnek: halogénatom, C_{1-4} alkilcsoport, C_{1-4} alkoxilcsoport, C_{1-4} haloalkilcsoport, C_{1-4} haloalkoxics csoport, cianocsoport, nitrocsoport, fenilcsoport vagy fenoxics csoport, ahol a fenil-

csoport és a fenoxicssoport tovább lehet szubsztituálva egy vagy két halogénatommal, C_{1-4} alkilcsoporttal, C_{1-4} alkoxicssoporttal, C_{1-4} haloalkilcsoporttal, cianocsoporttal vagy nitrocsoporttal.

A (I) általános képletű vegyületek előnyös alcsoportjait képezik azok a vegyületek, amelyekben

- a) R^1 jelentése metoxicssoport vagy dimetil-amino-csoport vagy
- b) R^2 jelentése fenilcsoport, fenoxicssoport, C_{1-4} alkilcsoport, $-C(CH_3)=N-O-R^6$ csoport vagy CF_3 csoport, vagy tiazolilcsoport vagy oxazolilcsoport, ahol a két utóbbi csoport adott esetben szubsztituálva lehet fenilcsoporttal, C_{1-4} alkilcsoporttal vagy CF_3 csoporttal, és R^6 jelentése C_{1-6} alkilcsoport vagy allilcsoport vagy benzilcsoport vagy 2-fenil-etil-csoport, ahol a két utóbbi csoport a fenilgyűrűn szubsztituálva lehet C_{1-4} alkilcsoporttal, C_{1-4} alkoxicssoporttal, halogénatommal vagy CF_3 csoporttal; vagy
- c) R^3 jelentése hidrogénatom vagy
- d) R^4 jelentése hidrogénatom vagy metilcsoport vagy
- e) R^5 jelentése hidrogénatom vagy metilcsoport.

A (I) általános képletű vegyületek egy további előnyös alcsoportjában R^1 jelentése metoxicssoport vagy dimetil-amino-csoport, R^2 jelentése fenilcsoport, fenoxicssoport, C_{1-4} alkilcsoport, $-C(CH_3)=N-O-R^6$ csoport vagy CF_3 csoport, vagy tiazolil- vagy izoxazolilcsoport, ahol a két utóbbi csoport adott esetben szubsztituálva lehet fenilcsoporttal, C_{1-4} alkilcsoporttal vagy CF_3 csoporttal; R^3 jelentése

hidrogénatom; R^4 jelentése hidrogénatom vagy metilcsoport; és R^5 jelentése hidrogénatom vagy metilcsoport; és R^6 jelentése C_{1-6} alkilcsoport vagy allilcsoport vagy benzilcsoport vagy 2-fenil-etilcsoport, ahol a két utóbbi csoport adott esetben szubsztituálva lehet a fenilgyűrűn C_{1-4} alkilcsoporttal, C_{1-4} alkoxicssoporttal, halogénatommal vagy CF_3 csoporttal.

A (I) általános képletű vegyületek előnyös képviselőiként az alábbiakat nevezzük meg:

metil- α -[4-(3-metil-5-izopropil-fenoxi)-6-metoxi-pirimidin-5-il]- β -metoxi-akrilát;
 metil- α -[4-(3-terc-butyl-fenoxi)-6-metoxi-pirimidin-5-il]- β -metoxi-akrilát;
 metil- α -[4-(3-terc-butyl-fenoxi)-6-dimetil-amino-pirimidin-5-il]- β -metoxi-akrilát;
 metil- α -[4-(3-izopropil-fenoxi)-6-metoxi-pirimidin-5-il]- β -metoxi-akrilát;
 metil- α -[4-(3-trifluor-metil-fenoxi)-6-metoxi-pirimidin-5-il]- β -metoxi-akrilát;
 metil- α -[4-(3-fenoxi-fenoxi)-6-metoxi-pirimidin-5-il]- β -metoxi-akrilát;
 metil-2-[4-(3-(1-(3-klór-benzil-oxi-imino)-etil)-fenoxi)-6-dimetil-amino-pirimidin-5-il]-2-metoxi-imino-acetát;
 metil-2-[4-(3-(1-etoxi-imino)-etil)-fenoxi)-6-dimetil-amino-pirimidin-5-il]-2-metoxi-imino-acetát;
 metil- α -[4-(3-(1-metoxi-imino)-etil)-fenoxi)-6-metoxi-2-metil-pirimidin-5-il]- β -metoxi-akrilát;
 metil- α -[4-(3-trifluor-metil-fenoxi)-6-metoxi-2-metil-piri-

midin-5-il]- β -metoxi-akrilát;

metil-2-[4-(3-(1-etoxi-imino)-etil)-fenoxi)-6-dimetil-amino-
-2-metil-pirimidin-5-il]-2-metoxi-imino-acetát;

metil-2-[4-(3-(1-(2,5-dimetil-benzil-oxi-imino)-etil)-fen-
oxi)-6-dimetil-amino-pirimidin-5-il]-2-metoxi-imino-ace-
tát;

metil-2-[4-(3-(1-(3-klór-benzil-oxi-imino)-etil)-fenoxi)-6-
-dimetil-amino-2-metil-pirimidin-5-il]-2-metoxi-imino-ace-
tát;

metil-2-[4-(3-(1-(2,5-dimetil-benzil-oxi-imino)-etil)-fen-
oxi)-6-dimetil-amino-2-metil-pirimidin-5-il]-2-metoxi-imino-
no-acetát;

metil-2-[4-(3-(1-(2,5-diklór-benzil-oxi-imino)-etil)-fen-
oxi)-6-dimetil-amino-2-metil-pirimidin-5-il]-2-metoxi-imino-
no-acetát;

metil- α -[4-(3-(1-(2,5-dimetil-benzil-oxi-imino)-etil)-fen-
oxi)-6-metoxi-2-metil-pirimidin-5-il]- β -metoxi-akrilát;

metil- α -[4-(3-(1-(3-klór-benzil-oxi-imino)-etil)-fenoxi)-6-
-metoxi-2-metil-pirimidin-5-il]- β -metoxi-akrilát;

metil- α -[4-(3-(1-(2,5-dimetil-benzil-oxi-imino)-etil)-fen-
oxi)-6-metoxi-pirimidin-5-il]- β -metoxi-akrilát;

metil-2-[4-(3-(1-(3-klór-benzil-oxi-imino)-etil)-fenoxi)-6-
-metoxi-pirimidin-5-il]-2-metoxi-imino-acetát;

metil-2-[4-(3-(3-trifluor-metil-izoxazol-5-il)-fenoxi)-6-di-
metil-amino-pirimidin-5-il]-2-metoxi-imino-acetát;

metil-2-[4-(3-fenil-fenoxi)-6-dimetil-amino-pirimidin-5-il]-
-2-metoxi-imino-acetát;

metil-2-[4-(5-metil-3-izopropil-fenoxi)-6-dimetil-amino-pi-

rimidin-5-il]-2-metoxi-imino-acetát;
metil-2-[4-(5-metil-3-izopropil-fenoxi)-6-dimetil-amino-2-
-metil-pirimidin-5-il]-2-metoxi-imino-acetát;
metil-2-[4-(3-(2-metil-benzil-oxi)-fenoxi)-6-dimetil-amino-
-pirimidin-5-il]-2-metoxi-imino-acetát;
metil-2-[4-(3-(2-metil-benzil-oxi)-fenoxi)-6-dimetil-amino-
-2-metil-pirimidin-5-il]-2-metoxi-imino-acetát;
metil-2-[4-(3-fenil-etoxi)-fenoxi)-6-dimetil-amino-pirimi-
din-5-il]-2-metoxi-imino-acetát;
metil-2-[4-(3-fenil-etoxi)-fenoxi)-6-dimetil-amino-2-metil-
-pirimidin-5-il]-2-metoxi-imino-acetát;
metil-2-[4-(3-(2-fenil-tiazol-4-il)-fenoxi)-6-dimetil-ami-
no-pirimidin-5-il]-2-metoxi-imino-acetát;
metil-2-[4-(3-(2-fenil-tiazol-4-il)-fenoxi)-6-dimetil-amino-
-2-metil-pirimidin-5-il]-2-metoxi-imino-acetát;
metil-2-[4-(3-(3-trifluor-metil-izoxazol-5-il)-fenoxi)-6-di-
metil-amino-2-metil-pirimidin-5-il]-2-metoxi-imino-acetát;
metil-2-[4-(3-fenil-fenoxi)-6-dimetil-amino-2-metil-pirimi-
din-5-il]-2-metoxi-imino-acetát;
N-metil-2-[4-(3-fenil-fenoxi)-6-dimetil-amino-2-metil-pirimi-
din-5-il]-2-metoxi-imino-acetamid;
metil- α -[4-(3-fenil-fenoxi)-6-dimetil-amino-2-metil-pirimi-
din-5-il]- β -metoxi-akrilát;
metil- α -[4-(3-(3-trifluor-metil-izoxazol-5-il)-fenoxi)-6-
-metoxi-pirimidin-5-il]- β -metoxi-akrilát;
metil- α -[4-(3-(3-trifluor-metil-izoxazol-5-il)-fenoxi)-6-
-metoxi-2-metil-pirimidin-5-il]- β -metoxi-akrilát;
metil- α -[4-(5-metil-3-izopropil-fenoxi)-6-metoxi-2-metil-pi-

rimidin-5-il]- β -metoxi-akrilát; és
 metil- α -[4-(3-(2-metil-fenoxi)-fenoxi)-6-metoxi-2-metil-pi-
 rimidin-5-il]- β -metoxi-akrilát.

A (I) és a (II) képletekben a kettős kötés E- vagy Z-
 alakú lehet. Ebben a leírásban az E- és a Z-alakokat külön
 azonosítjuk, ahol ilyen izomerekről van szó. Minden egyéb
 esetben a két izomer elegyéről van szó. Az alkalmazott szin-
 tézis-feltételektől függően az E- és a Z-izomerek különböző
 arányokban képződnek, amely arányok 100 % E / 0 % Z-től kö-
 rülbelül 30 % E / 70 % Z-ig terjednek.

Amikor a szintézis során az E- és a Z-izomereket kap-
 juk, azokat ismert módszerekkel, így például kristályosítás-
 sal, kromatográfiával vagy desztillálással különíthetjük el
 egymástól.

A (I) általános képletű vegyületeket olyan módon állít-
 hatjuk elő, hogy egy (II) általános képletű vegyületet -
 amely képletben R^1 , R^2 , R^3 , R^4 , R^5 és X jelentése a fenti -
 O-metilezünk, és ilyen módon (Ia) általános képletű vegyüle-
 teket kapunk, amely képletben X, R^1 , R^2 , R^3 , R^4 , R^5 és X je-
 lentése a fenti, és adott esetben a (Ia) általános képletű
 vegyületeket NH_3 -mal, NH_2CH_3 -mal vagy $-NH(CH_3)_2$ -vel végzett
 amidálási reakcióval (Ib) általános képletű vegyületekké
 alakítjuk, amely képletben R^1 , R^2 , R^3 , R^4 , R^5 és X jelentése
 a fenti, míg Y' jelentése NH_2 , $NHCH_3$ vagy $N(CH_3)_2$ képletű
 csoport.

Az O-metilezést a 3-metoxi-akrilátok előállítása kap-
 csán ismert módszerekkel folytathatjuk le, szokásos meti-
 lezőszereket használva. Az ilyen metilezőszerek példái-

ként megemlítjük a metil-jodidot és a dimetil-szulfátot. Az O-metilezést célszerűen egy bázis jelenlétében folytatjuk le.

A reakcióhőmérséklet célszerűen 0 °C és a reakcióelegy forráspontja közötti hőmérséklettartományban fekszik, például körülbelül szobahőmérséklet. Kívánt esetben semleges oldószereket használhatunk. A megfelelő bázisok például megemlítjük az alkálifém-hidrideket, így a nátrium-hidridet, az alkáli-metil-alkoholátokat, így a nátrium-metilátot, az alkálifém-karbonátokat és a nátrium-hidrogén-karbonátot. A megfelelő semleges oldószerek például megemlítjük az aromás szénhidrogéneket, így a benzolt és a toluolt; az éte-
reket, így a dietil-étert, a tetrahidrofuránt és az 1,2-dimetoxi-etánt; a poláris oldószereket, így a dimetil-formamidot, a dimetil-szulfoxidot, a vizet és az alkoholokat, így a metanolt; az acetont, vagy a felsorolt oldószerek közül kettőnek vagy többnek az elegyét. A kívánt végterméket ismert módszerekkel különítjük el és tisztítjuk, például az oldószer bepárlásával, kromatográfiával és kristályosítással.

Az (I) általános képletű vegyületek bázikus jellegűek, és ezért megfelelően erős savakkal, így sósavval vagy hidrogén-bromiddal sókat képezhetnek.

Az (Ia) általános képletű alcsoportba tartozó vegyületeknek a (Ib) alcsoportba tartozó vegyületekké történő átalakítása transzamidálási eljárás, amelyet az ilyen típusú amidálási reakciók céljából szokásosan alkalmazott reakciófeltételek mellett hajthatunk végre. Előnyösen a (Ia) álta-

lános képletű ($Y = OCH_3$) észter vegyületeket egy amin-komponenssel (ammóniával, metil-aminnal vagy dimetil-aminnal) kezeljük. Előnyös esetben a reakciót inert poláris oldószerben, így dimetil-formamidban folytatjuk le, vagy pedig az amin feleslegében. A reakcióhőmérséklet nem kritikus, de előnyösen $0\text{ }^{\circ}\text{C}$ és $+60\text{ }^{\circ}\text{C}$ között van, például szobahőmérséklet.

Az olyan (II) általános képletű vegyületeket, amelyekben X jelentése CH csoport, olyan módon állíthatjuk elő, hogy (III) általános képletű vegyületeket - ahol R^1 , R^2 , R^3 , R^4 és R^5 jelentése a fenti - egy formilezőszerrel, például N,N-diformil-metil-aminnal vagy metil-formiáttal reagáltatunk egy bázis jelenlétében.

Ez a reakció lényegileg Claisen-típusú reakció, és az ilyen reakciók esetében általánosan ismert reakciófeltételek mellett folytatható le. A (III) általános képletű vegyületeknek (II) általános képletű vegyületekké való átalakítási reakcióját inert oldószerben folytathatjuk le. A megfelelő oldószernek példáiként azokat említjük meg, amelyeket a (II) általános képletű vegyületek O-metilezési reakciói során felhasználható oldószerként már leírtunk. A megfelelő bázisok példáiként a Claisen-típusú reakció során jellegzetesen használt bázisokat említjük meg, így például az alkálifém-alkoholátokat, például a nátrium-metilátot; az alkálifém-hidrideket, például a nátrium-hidridet; továbbá a lítium-amidokat és a nátrium-amidokat, például a lítium-dietyl-amidot. A reakcióhőmérséklet széles határok között változhat, például $0\text{ }^{\circ}\text{C}$ -tól a reakcióelegy forráspont-

jáig, és előnyösen szobahőmérséklet vagy ahhoz közeli hőmérséklet lehet.

Az olyan (II) általános képletű vegyületeket, amelyekben X jelentése nitrogénatom, olyan módon állíthatjuk elő, hogy egy (III) általános képletű vegyületet egy alkil-nitrittel reagáltatunk egy bázis és adott esetben egy semleges oldószer jelenlétében. Ennek az eljárásnak egy változata szerint az olyan (II) általános képletű vegyületeket, amelyekben X jelentése nitrogénatom, olyan módon is elő lehet állítani, hogy egy (III) általános képletű vegyületet sósav jelenlétében egy alkil-nitrittel reagáltatunk, adott esetben egy inert oldószerben. A reakcióhőmérséklet célszerűen $-40\text{ }^{\circ}\text{C}$ és $+30\text{ }^{\circ}\text{C}$ között van, például körülbelül $-20\text{ }^{\circ}\text{C}$ és $0\text{ }^{\circ}\text{C}$ között. Kívánt esetben inert oldószereket használhatunk. A megfelelő bázisok példáulként megemlítjük az alkálifém-hidroxidokat, így a nátrium-hidroxidot, az alkálifém-hidrideket, így a nátrium-hidridet, továbbá az alkálifém-alkoholátokat, így a nátrium-metilátot. A megfelelő inert oldószerek példáulként megemlítjük az aromás szénhidrogéneket, így a benzolt és a toluolt; az étereket, így a dietil-étert, a tetrahidrofuránt és az 1,2-dimetoxi-etánt; a poláris oldószereket, így a dimetil-formamidot, a dimetil-szulfoxidot, a vizet és az alkoholokat, így a metanolt; az acetont, valamint a felsorolt oldószerek közül kettőnek vagy többnek az elegyét.

A (III) általános képletű vegyületeknek (II) általános képletű vegyületekké, majd az utóbbiaknak (I) általános képletű vegyületekké történő kétlépcsős átalakítási reakció-

jának egy változata szerint a (I) általános képletű vegyületeket egylépcsős reakcióban is előállíthatjuk (III) általános képletű vegyületekből elkülönítés és a közbenső vegyületként kapott (II) általános képletű vegyületek tisztítása nélkül.

A (III) általános képletű ecetsav-észtereket a (IV) általános képletű vegyületekből - ahol R^1 jelentése C_{1-4} alkoxicsoport és R^5 jelentése a fenti - olyan módon állíthatjuk elő, hogy a (IVa) általános képletű vegyületet egy (V) általános képletű fenollal reagáltatjuk - amely képletben R^2 , R^3 és R^4 jelentése a fenti - egy bázis és egy inert oldószer jelenlétében. Megfelelő bázisok és oldószerek ugyanazok lehetnek, mint amilyeneket a (II) általános képletű vegyületeknek a (I) általános képletű vegyületekké történő átalakítási reakciójában használhatunk.

A (III) általános képletű ecetsav-észtereket (IVb) általános képletű vegyületekből is előállíthatjuk - ahol R^1 jelentése $-NR^8R^9$ képletű csoport, míg R^2 , R^3 , R^4 és R^5 jelentése a fenti - HNR^8R^9 általános képletű aminnal való reagáltatás útján - ahol R^8 és R^9 jelentése a fenti.

A (IVa) általános képletű vegyületeket olyan módon állíthatjuk elő, hogy egy (VI) általános képletű diklór-pirimidinil-ecetsav-észtert - ahol R^5 jelentése a fenti - egy (VII) általános képletű vegyülettel - ahol R^1 jelentése a fenti - reagáltatunk egy bázis és egy inert oldószer jelenlétében.

A (IVb) általános képletű vegyületeket olyan módon állíthatjuk elő, hogy egy (VI) általános képletű észtert -

ahol R^5 jelentése a fenti - egy (V) általános képletű fenol-
lal - ahol R^2 , R^3 és R^4 jelentése a fenti - reagáltatunk egy
bázis és egy inert oldószer jelenlétében. A reakcióhőmérsék-
letet hűtéssel előnyösen $+20\text{ }^{\circ}\text{C}$ alatt tartjuk. Megfelelő
bázisok például a nátrium-metilát, amikor R^1 metoxicsoportot
jelent, illetve tercier aminokat, például trietil-amint
használhatunk bázisként, amikor R^1 jelentése NR^8R^9 általános
képletű csoport, ahol R^8 és R^9 jelentése a fenti.

A (VI) általános képletű vegyületeket úgy állíthatjuk
elő, hogy egy (VIII) általános képletű vegyületet - ahol R^5
jelentése a fenti - egy klórozószerezrel reagáltatunk, előnyö-
sen egy bázis jelenlétében.

A reakciót előnyösen emelt hőmérsékleten ($+130\text{ }^{\circ}\text{C}$ -ig)
hajtjuk végre. Megfelelő klórozószerek a POCl_3 , a COCl_2 , az
 SOCl_2 vagy a PCl_5 . Megfelelő bázisok a tercier aminok, így
az N,N-dietil-anilin.

A (VIII) általános képletű vegyületeket olyan módon
állíthatjuk elő, hogy egy (IX) képletű vegyületet formami-
dinnel vagy acetamidinnel reagáltatunk egy bázis jelenlé-
tében.

A reakciót előnyösen hűtés mellett, $-20\text{ }^{\circ}\text{C}$ és $+20\text{ }^{\circ}\text{C}$
közötti hőmérsékleten hajtjuk végre inert oldószerben. Meg-
felelő oldószer a metanol, míg megfelelő bázis a nátrium-me-
tilát.

A (II), (III), (IVa), (IVb), (VI) és (VIII) általános
képletű közbenső vegyületeket kimondottan a (I) általános
képletű vegyületek szintéziséhez fejlesztettük ki. Ezért
ezek a vegyületek is a találmány részét képezik.

Amikor a (I) általános képletű vegyületeknek egy másik (I) általános képletű vegyületté való átalakítására van szükség, például bizonyos csoportoknak olyan más csoportokká való átalakítására, amelyek a (I) általános képletű vegyület körébe tartoznak, az ilyen átalakítást önmagukban ismert kémiai módszerekkel, például acetalizálással, amidálással, átészterezéssel és hasonlókkal valósíthatjuk meg.

A (V), (VII) és (IX) általános képletű kiindulási vegyületek ismertek vagy önmagukban ismert módszerekkel állíthatók elő, vagy pedig ismert vegyületek előállítására használt módszerekhez hasonló módszerekkel állíthatók elő.

Az olyan (III) általános képletű közbenső vegyületeket, amelyekben R^2 jelentése $-C(CH_3)=N-O-R^6$ képletű vagy (a) képletű csoport, előnyösen olyan módon állíthatjuk elő, hogy a (X) általános képletű megfelelő karbonilvegyületet - amelyben R^1 , R^3 , R^4 , R^5 és R^7 jelentése a fenti - egy (XI) általános képletű megfelelő acetalizálószerrel - ahol E jelentése a fenti - vagy egy (XII) általános képletű oximképzőszerrel - ahol R^6 jelentése a fenti - reagáltatjuk.

A (X) általános képletű vegyületeket a (I) általános képletű vegyületek szintéziséhez állítottuk célzatosan elő. Ezért ezek a vegyületek is a találmány részét képezik.

A (I) általános képletű vegyületek hatásos szerek fitopatogének ellen.

A vegyületek előnyös fungicid hatékonyságát *in vivo* kísérletekkel határoztuk meg 0,5 - 500 mg hatóanyag/l koncentrációkban *Uromyces appendiculatus*-szal szemben babon, *Puccinia triticina*-val szemben búzán, *Sphaerotheca fuliginea*-

val szemben uborkán, *Erysiphe graminis*-szel szemben búzán és árpán, *Podosphaera leucotricha*-val szemben almán, *Uncinula necator*-ral szemben szőlőn, *Leptosphaeria nodorum*-mal szemben búzán, *Cochliobolus sativus*-szal és *Pyrenophora graminea*-val szemben árpán, *Venturia inaequalis*-szal szemben almán, *Phytophthora infestans*-szal szemben paradicsomon és *Plasmodiophora viticola*-val szemben szőlőn.

A (I) általános képletű vegyületek közül számosnak kitűnő a növény általi tűrése és a szisztémás hatása. A találmány szerinti vegyületek ezért javallhatók növények, magvak és talaj kezelésére fitopatogén gombák leküzdésére; ilyen gombák példáulként megemlítjük az *Uredinales* (rozsdák) rendjébe tartozó *Basidiomycetes* gombákat, így a *Puccinia* spp-t, a *Hemileia* spp-t és az *Uromyces* spp-t; továbbá az *Erysiphales* (porüszög) rendjébe tartozó *Ascomycetes* gombákat, így az *Erysiphe* spp-t, a *Podosphaera* spp-t, az *Uncinula* spp-t és a *Sphaerotheca* spp-t; továbbá a *Cochliobolus*-t; a *Pyrenophora* spp-t; a *Venturia* spp-t; a *Mycosphaerella* spp-t, a *Leptosphaeria*-t; a *Deuteromycetes* gombákat, így a *Pyricularia*-t, a *Pellicularia*-t (*Corticium*), a *Botrytis*-t; valamint a *Oomycetes* gombákat, így a *Phytophthora* spp-t és a *Plasmodiophora*-t.

A (I) általános képletű vegyületek különösen hatékonyak a porüszög és a rozsdagombák, a *Pyrenophora* és a *Leptosphaeria* gombák ellen, elsősorban az egyszikű növények, így a gabonafélék - ideértve a búzát és a zabot - kártevői ellen.

A találmány szerinti vegyületek felhasználandó mennyisége különböző tényezőktől, így az alkalmazott vegyülettől,

a kezelés tárgyától (a növénytől, a talajtól, a magtól), a kezelés típusától (ami például permetezés, porozás, magcsávázás lehet), a kezelés céljától (megelőző vagy gyógyító), a kezelendő gomba típusától és az alkalmazás időpontjától is függhet.

Általában kielégítő eredményeket kaphatunk, ha a találmány szerinti vegyületeket körülbelül 0,01-1,0 kg/ha, előnyösen körülbelül 0,05-0,5 kg/ha hatóanyag mennyiségben alkalmazunk növény- vagy talajkezelés esetén; például 0,05-0,5 kg/ha mennyiségben szántóföldi kezelés esetén gabonanövényeken, vagy pedig 5-50 g hatóanyag/hektoliter koncentrációkban gyümölcsök, szőlők és főzelékfélék esetében (300-1000 l/ha alkalmazási térfogatban - a levél méretétől vagy a termés térfogatától függően -, ami közelítőleg 15-500 g/ha alkalmazási mennyiségnek felel meg). A kezelést kívánt esetben meg lehet ismételni, például 8-30 nap időközönként.

Amikor a találmány szerinti vegyületeket magkezelésre használjuk, általában kielégítő eredményeket kapunk, ha a vegyületeket körülbelül 0,05-0,5 g/kg mag, előnyösen körülbelül 0,1-0,3 g/kg mag mennyiségben használjuk.

A "talaj" kifejezést itt olyan értelemben használjuk, hogy az felölel bármilyen szokásos termesztőközeget, legyen az természetes vagy mesterséges közeg.

A találmány szerinti vegyületeket igen sokféle növény, ill. termés esetében fel lehet használni, így például szója, kávé, dísznövények (például pelargónium, rózsák), főzelékfélések (például borsó, uborka, zeller, burgonya és bab növények), cukorrépa, cukornád, gyapot, len, kukorica, szőlő,

magvas gyümölcsök és csonthéjas gyümölcsök (például alma, körte, szilva), valamint gabonafélék (például búza, árpa, zab, rizs) esetében.

A találmány oltalmi köre kiterjed az olyan fungicid kompozíciókra is, amelyek fungicidként egy (I) általános képletű vegyületet tartalmaznak valamilyen mezőgazdaságilag elfogadható hígítószerrel (a továbbiakban: hígítószer) együtt. Ezeket a kompozíciókat a szokásos módon állíthatjuk elő, például úgy, hogy egy találmány szerinti vegyületet egy hígítószerrel és adott esetben további komponensekkel, így például felületaktív anyagokkal elegyítünk.

Az itt használt "hígítószer" kifejezés folyékony vagy szilárd, mezőgazdaságilag elfogadható olyan anyagot jelent, amely hozzáadható a hatóanyaghoz, és azt könnyebben vagy jobban alkalmazhatóvá teszi, illetve a hatóanyagot használható vagy kívánatos hatásereőségűvé hígítja. Az ilyen hígítószer példaként megemlítjük a talkumot, a kaolint, a diatomaföldet, a xilolt és a vizet.

Különösen a permet alakban használt készítmények, így a vízben diszpergálható koncentrátumok vagy nedvesíthető porok tartalmazhatnak felületaktív anyagokat, így nedvesítő- vagy diszpergálószeret, például formaldehidnek naftalinszulfonáttal képezett kondenzációs termékét, alkil-arilszulfonátot, ligninszulfonátot, zsíralkil-szulfátot, etoxilezett alkil-fenolt és etoxilezett zsíralkoholt.

A készítmények általában 1-90 tömeg% hatóanyagot, 0-20 tömeg% mezőgazdaságilag elfogadható felületaktív anyagot és 10-99 tömeg% hígítószert tartalmaznak. A kompozíció kon-

centrált formái, például az emulzió-koncentrátumok általában 5-70 tömeg%, előnyösen 10-50 tömeg% hatóanyagot tartalmaznak. A készítmények alkalmazási formái általában 1-5000 ppm találmány szerinti hatóanyagot tartalmaznak. Jellegzetes permetszuszpenziók például 10-1000 ppm, előnyösen 50-500 ppm, még előnyösebben 100-500 ppm hatóanyagot tartalmaznak.

A találmány szerinti kompozíciók a szokásos hígítószer-ek és felületaktív anyagok mellett egyes célokra szolgáló további adalékanyagokat tartalmazhatnak, így például stabilizátorokat, dezaktivátorokat (aktív felületű szilárd készítmények vagy hordozók számára), a növények leveleihez való tapadást javító anyagokat, korrózió-inhibitorokat, habzásgátló anyagokat és színezőanyagokat. A készítményekben további, hasonló vagy kiegészítő fungicid hatékonyságú fungicidek is jelen lehetnek, így például kén, klorotalonil, euparen; guanidin-fungicidek, így guazatin; ditio-karbamátok, így mankozeb, maneb, zineb, propineb; triklór-metán-szulfenil-ftálimidek és azok analógjai, így kaptán, kaptafol és folpet; benzimidazolok, így karbendazim, benomil; azolok, így ciprokonazol, fluszilazol, flutriafol, hexakonazol, propikonazol, tebukonazol, epoxikonazol, prokloraz; morfolinok, így fenpropimorf, fenpropidin és egyéb, kedvező hatású anyagok, így cimoxanil, oxadixil, metalaxil, továbbá inszekticidek és akaricidek is jelen lehetnek a készítményben.

Növényi fungicidek kialakítására az alábbi példákat adjuk meg:

a) Nedvesíthető porkészítmény

10 rész (I) általános képletű vegyületet elegyítünk és megőrölünk 4 rész szintetikus finom szilícium-dioxiddal, 3 rész nátrium-lauril-szulfáttal, 7 rész nátrium-lignin-szulfonáttal, 66 rész finoman elosztott kaolinnal és 10 rész diatomafölddel, amíg el nem érjük a körülbelül 5 μ -os részecskeméretet. Az így kapott nedvesíthető port vízzel hígítjuk, mielőtt felhasználnánk permetezőfolyadékként, amelyet levélpermetként vagy gyökéráztató oldatként alkalmazhatunk.

b) Szemcsék

Tumbler-keverőben 94,5 tömegrész kvarchomokra rápermetezünk 0,5 tömegrész kötőanyagot (nem-ionos tenzidet), majd az egészet alaposan összekeverjük. Ezután hozzáadunk 5 súlyrész (I) általános képletű, találmány szerinti vegyületet, és az alapos keverést mindaddig folytatjuk, amíg 0,3-0,7 mm részecsketartományba eső granulátumot nem kapunk (ahol szükséges, a szemcséket 1-5 tömeg% talkum hozzáadásával megszárazíthatjuk). A szemcséket úgy használjuk fel, hogy a kezelendő növény melletti talajba visszük be őket.

c) Emulzió-koncentrátum

A (I) általános képletű, találmány szerinti vegyületből 10 tömegrészt összekeverünk 10 tömegrész emulgeálószerrel és 80 tömegrész xilollal. Az így kapott koncentrátumot vízzel hígítjuk felhasználás előtt a kívánt koncentrációjú emulzió előállítására céljából.

d) Magkezelés

A (I) általános képletű vegyületből 45 részt elegyítünk

1,5 rész diamil-fenil-dekaglikol-éter-etilén-oxid addukttal, 2 rész orsóolajjal, 51 rész finom talkummal és 0,5 rész ro-danin B színezékkel. A keveréket kontraplex malomban 10 000 fordulat/perc sebességgel mindaddig őröljük, amíg 20 μ -nál kisebb átlagos részecskeméretet nem kapunk. Az így kapott száraz por jó tapadóképeségű, felhasználható magok bevoná-sára például olyan módon, hogy egy lassan forgó edényben 2-5 percen át elegyítjük a magokat a porral.

A következő példákkal tovább ismertetjük a találmányt az oltalmi kör korlátozása nélkül. A hőmérsékletértékeket °C-ban adjuk meg.

1. példa

Metil- α -[4-(3-metil-fenoxi)-6-metoxi-pirimidin-5-il]- β -metoxi-akrilát [(1) képletű vegyület]

a) Metil-4,6-dihidroxi-pirimidin-5-il-acetát [(2) kép-letű vegyület]

600 g (3,0 mol) trimetil-etán-1,1,2-trikarboxilátot és 312 g (3,0 mol) formamidint adunk egymást követően 324 g (6,0 mol) nátrium-metilát 1800 ml metanollal készített, élénken kevert oldatához 0° C hőmérsékleten. A reakcióele-gyet 12 órán át keverjük, majd 300 ml terc-butil-metil-éter-rel hígítjuk és szívatással szűrjük. Az így kapott sóele-gyet 1000 ml vízben szuszpendáljuk, majd 600 ml tömény só-savval megsavanyítjuk. Szűrés és szárítás után fehér szilárd anyagként 420 g 4,6-dihidroxi-pirimidin-5-il-acetátot vagy annak tautomer alakját kapjuk 200 °C-nál magasabb olvadás-ponttal.

b) Metil-4,6-diklór-pirimidin-5-il-acetát [(3) képletű vegyület]

204 g (1,1 mol) 4,6-dihidroxipirimidin-5-il-acetát 303 ml (3,3 mol) foszfor-oxi-kloriddal készített szuszpenzióját és 352 ml (2,2 mol) N,N-dietil-anilint 3 órán át 130 °C-ra melegítünk. Az így kapott sötét színű, homogén elegyet tört jég hozzáadásával hidrolizáljuk, miközben a hőmérsékletet +30 °C alatt tartjuk. Dietil-éterrel végzett extrahálás, magnézium-szulfáttal végzett szárítás és hexánból végzett kristályosítás után 195 g metil-4,6-diklór-pirimidin-5-il-acetátot kapunk krémszínű kristályok alakjában, 65-67 °C olvadásponttal.

c) Metil-4-klór-6-metoxipirimidin-5-il-acetát [(4) képletű vegyület]

112 ml 5,4 mólos metanolos nátrium-metilát oldatot szobahőmérsékleten hűtés közben hozzáadjuk 120 g (0,54 mol) metil-4,6-diklór-pirimidin-5-il-acetát 200 ml 1,2-dimetoxietánnal készített oldatához. A reakcióelegyet 30 percen át keverjük, majd tört jégre öntjük. A kicsapódott kristályokat leszűrjük és megszáritjuk. Így 106 g metil-4-klór-6-metoxipirimidin-5-il-acetátot kapunk 64 °C olvadásponttal.

d) Metil-4-(3-metil-fenoxi)-6-metoxipirimidin-5-il-acetát [(5) képletű vegyület]

21,7 g (100 mmol) metil-4-klór-6-metoxipirimidin-5-il-acetát, 10,8 g (100 mmol) m-krezol, 20,7 g (150 mmol) kálium-karbonát és katalitikus mennyiségű 18-korona-6 elegyét 50 ml dimetil-formamidban melegítjük 1 órán át 120 °C-on. Ezután tört jeget adunk hozzá, etil-éterrel extraháljuk és

megszárítjuk. Ilyen módon 4-(3-metil-fenoxi)-6-metoxi-pirimidin-5-il-acetátot kapunk olaj alakjában.

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3): 8,36 (s, 1H); 7,32-6,88 (m, 4H); 4,02 (s, 3H); 3,72 (s, 2H); 3,70 (s, 3H); 2,37 (s, 3H) ppm.

e) 12,1 g (42 mmol) metil-4-(3-metil-fenoxi)-6-metoxi-pirimidin-5-il-acetátot oldunk 120 ml 1,2-dimetoxi-etán és 50 ml metil-formiát elegyében. Egy részletben 2,5 g (84 mmol) nátrium-hidrid 80 %-os olajos szuszpenzióját adjuk hozzá, miközben a hőmérsékletet szobahőfokon tartjuk. 5 óra eltelte után hűtés közben 6,6 ml (70 mmol) dimetil-szulfátot adunk hozzá. További 5 óra eltelte után a reakcióelegyet dietil-éterrel hígítjuk és konyhasóoldattal mosuk. Szárítás után szilikagélen kromatografálunk; eluensként hexán és etil-acetát 1:1 térfogatarányú elegyét használjuk. Így kristályos, szilárd anyagként a metil- α -[4-(3-metil-fenoxi)-6-metoxi-pirimidin-5-il]- β -metoxi-akrilát E-izomerjét kapjuk 107 °C olvadásponttal.

2. példa

Metil- α -[4-(3-terc-butil-fenoxi)-6-dimetil-amino-pirimidin-5-il]- β -metoxi-akrilát [(6) képletű vegyület]

a) Metil-4-klór-6-dimetil-amino-pirimidin-5-il-acetát [(7) képletű vegyület]

Dimetil-amin 40 tömeg%-os vizes oldatából 50 ml-t hűtés közben, szobahőmérsékleten cseppenként hozzáadunk 80 g (0,36 mol) metil-4,6-diklór-pirimidin-5-il-acetát 300 ml 1,2-dimetoxi-etánnal és 56 ml (0,4 mol) trietil-aminnal készített oldatához. Egy órán át végzett keverés után az elegyet vízzel hígítjuk, majd a terméket dietil-éterrel

extraháljuk. Magnézium-szulfát fölött végzett szárítás után az oldószert lehajtjuk. Desztillálás után 74 g metil-4-klór-6-dimetil-amino-pirimidin-5-il-acetátot kapunk színtelen, szilárd anyagként; o.p.: 135-138 °C/194 Pa; o.p.: 30-32 °C.

b) Metil-4-(3-terc-butil-fenoxi)-6-dimetil-amino-pirimidin-5-il-acetát [(8) képletű vegyület]

22,9 g (100 mmol) metil-4-klór-6-dimetil-amino-pirimidin-5-il-acetát, 15,0 g (100 mmol) 3-terc-butil-fenol, 20,7 g (150 mmol) kálium-karbonát és katalitikus mennyiségű 18-korona-6 elegyét 50 ml dimetil-formamidban 130 °C-on melegítjük 6 órán át. A reakcióelegyet dietil-éterrel hígítjuk, 2 N nátrium-hidroxid-oldattal és konyhasóoldattal mossuk, majd magnézium-szulfát fölött szárítjuk. Bepárlás után sárga olajként 30 g metil-4-(3-terc-butil-fenoxi)-6-dimetil-amino-pirimidin-5-il-acetátot kapunk.

¹H-NMR (CDCl₃): 8,29 (s, 1H); 7,35-6,88 (m, 4H), 3,76 (s, 2H); 3,74 (s, 3H); 3,07 (s, 6H); 1,32 (s, 9H) ppm.

c) 10,0 g (29 mmol) metil-4-(3-terc-butil-fenoxi)-6-dimetil-amino-pirimidin-5-il-acetátot feloldunk 60 ml 1,2-dimetoxi-etán és 20 ml metil-formiát elegyében. Egy részletben 1,7 g (58 mmol) nátrium-hidrid 80 %-os olajos szuszpenzióját adjuk hozzá, miközben a hőmérsékletet szobahőfokon tartjuk. Öt óra eltelte után a reakcióelegyet sósavval gondosan meg-savanyítjuk. Egy órán át +5 °C-on végzett keverés után az elegyet szilárd nátrium-hidrogén-karbonáttal semlegesítjük. A közbensőterméket dietil-éterrel extraháljuk, majd a szokásos módon dolgozzuk föl. Az így kapott olajat 20 ml dime-

til-formamidban és 4,7 ml (50 mmol) dimetil-szulfátban 2 órán át szobahőmérsékleten keverjük, majd dietil-éterrel hígítjuk, konyhasóoldattal mossuk és szilikagélen kromatografáljuk. A kromatografáláshoz eluensként hexán és etil-acetát 1:1 térfogatarányú elegyét használjuk. Így egyetlen izomerként 5,5 g metil- α -[4-(3-terc-butyl-fenoxi)-6-dimetil-amino-pirimidin-5-il]- β -metoxi-akrilátot kapunk.

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3): 8,24 (s, 1H); 7,49 (s, 1H); 7,31-6,80 (m, 4H); 3,87 (s, 3H); 3,73 (s, 3H); 3,08 (s, 6H); 1,30 (s, 9H) ppm.

3. példa

Metil- α -[4-(3-(2-metil-dioxolán-2-il)-fenoxi)-6-metoxi-pirimidin-5-il]- β -metoxi-akrilát [(9) képletű vegyület]

a) Metil-4-(3-acetil-fenoxi)-6-metoxi-pirimidin-5-il-acetát [(10) képletű vegyület]

21,7 g (100 mmol) metil-4-klór-6-metoxi-pirimidin-5-il-acetát, 13,6 g (100 mmol) 3-hidroxi-acetofenon, 20,7 g (150 mmol) kálium-karbonát és katalitikus mennyiségű 18-korona-6 elegyét 50 ml dimetil-formamidban hevítjük egy órán át 120 °C hőmérsékleten. Tört jég hozzáadása, szűrés és szárítás után 28,5 g metil-4-(3-acetil-fenoxi)-6-metoxi-pirimidin-5-il-acetátot kapunk 65-67 °C olvadásponttal.

b) Metil-4-[3-(2-metil-dioxolán-2-il)-fenoxi]-6-metoxi-pirimidin-5-il-acetát [(11) képletű vegyület]

15,0 g (47 mmol) metil-4-(3-acetil-fenoxi)-6-metoxi-pirimidin-5-il-acetát, 7,9 ml (140 mmol) etilén-glikol és p-toluonszulfonsav elegyét visszafolyatós hűtő alatt forraljuk, miközben a vizet azeotrop desztillációval eltávolítjuk.

2 óra eltelte után a szerves fázist telített nátrium-karbo-
nát-oldattal mossuk, majd magnézium-szulfát fölött szárítjuk
és bepároljuk. Ilyen módon sárga olajként 16,2 metil-4-[3-
-(2-metil-dioxolán-2-il)-fenoxi]-6-metoxi-pirimidin-5-il-
acetátot kapunk.

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3): 8,36 (s, 1H); 7,40-7,02 (m, 4H); 4,08-4,00
(m, 4H); 4,02 (s, 3H); 3,82-3,74 (m, 4H); 3,74 (s,
2H); 3,72 (s, 3H); 1,67 (s, 3H) ppm.

c) 15,0 g (42 mmol) metil-4-[3-(2-metil-dioxolán-2-il)-
-fenoxi]-6-metoxi-pirimidin-5-il-acetátot oldunk 120 ml 1,2-
-dimetoxi-etán és metil-formiát elegyében. Egy részletben
2,5 g (84 mmol) nátrium-hidrid 80 %-os olajos szuszpenzióját
adjuk hozzá, miközben a hőmérsékletet szobahőfokon tarjuk.
5 óra eltelte után hűtés közben 6,6 ml (70 mmol) dimetil-
-szulfátot adunk hozzá, majd a reakcióelegyet további 5
óra eltelte után dietil-éterrel hígítjuk és konyhasóoldat-
tal mossuk. Szárítás után szilikagélen kromatografálunk,
eluensként hexán és etil-acetát 1:1 térfogatarányú elegyét
használva. Ilyen módon metil- α -[4-(3-(2-metil-dioxolán-2-
-il)-6-metoxi-5-pirimidin-5-il)- β -metoxi-akrilát E-izomer-
jét 5,5 g szilárd, kristályos anyagként kapjuk 91-93 °C
olvadásponttal. A Z-izomert 4,2 g mennyiségben olajként
kapjuk.

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3): 8,32 (s, 1H); 7,40-6,96 (m, 4H); 6,73 (s,
1H); 4,07-3,99 (m, 2H); 4,00 (s, 3H); 3,96 (s, 3H);
3,82-3,74 (m, 4H); 3,70 (s, 3H); 1,65 (s, 3H) ppm.

4. példa

Metil- α -[4-(3-(2-ciano-fenoxi-metil)-fenoxi)-6-metoxi-pirimidin-5-il]- β -metoxi-akrilát [(12) képletű vegyület]

a) Metil- α -[4-(3-bróm-metil-fenoxi)-6-metoxi-pirimidin-5-il]- β -metoxi-akrilát [(13) képletű vegyület]

2,7 g (8,4 mmol) metil- α -[4-(3-metil-fenoxi)-6-metoxi-pirimidin-5-il]- β -metoxi-akrilát, 1,6 g (6 mmol) N-bróm-szukcinimid és katalitikus mennyiségű AIBN elegyét széntetrakloridban 90 percen át visszafolyató hűtő alatt forraljuk. A szukcinimidet leszűrjük és az oldószert lepároljuk. Ilyen módon a metil- α -[4-(3-bróm-metil-fenoxi)-6-metoxi-pirimidin-5-il]- β -metoxi-akrilátot színtelen olajként kapjuk meg.

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3): 8,38 (s, 1H); 7,60 (s, 1H); 7,39-7,00 (m, 4H); 4,48 (s, 2H); 4,00 (s, 3H); 3,85 (s, 3H); 3,72 (s, 3H) ppm.

b) 3,2 g (7,8 mmol) metil- α -[4-(3-bróm-metil-fenoxi)-6-metoxi-5-pirimidinil]- β -metoxi-akrilát, 0,93 g (7,8 mmol) o-hidroxibenzonitril és 2,1 g (15 mmol) kálium-karbonát elegyét 20 ml dimetil-formamidban 4 órán át keverjük szobahőmérsékleten. Dietil-éterrel végzett hígítás után az elegyet konyhasóoldattal mossuk, majd magnézium-szulfát fölött szárítjuk. Ezután szilikagélen kromatografálunk, eluensként hexán és etil-acetát 1:1 térfogatarányú elegyét használva. Ilyen módon színtelen szilárd anyagként 3,0 g metil- α -[4-(3-(2-ciano-fenoxi-metil)-fenoxi)-6-metoxi-pirimidin-5-il]- β -metoxi-akrilátot kapunk 132-135 °C olvadásponttal.

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3): 8,35 (s, 1H); 7,58 (s, 1H); 7,55-6,93 (m, 8H); 5,19 (s, 2H); 3,97 (s, 3H); 3,85 (s, 3H); 3,70 (s, 3H) ppm.

5. példa

Metil- α -[4-(3-izopropil-fenoxi)-6-metoxi-2-metil-pirimidin-5-il]- β -metoxi-akrilát [(II) képletű vegyület]

a) Metil-4,6-dihidrox-2-metil-pirimidin-5-il-acetát
[(15) képletű vegyület]

204 g (1 mol) trimetil-etán-1,1,2-trikarboxilátot és 95 g (1 mol) acetamidin-hidrokloridot adunk 108 g (2 mol) nátrium-metilát 600 ml metanollal készített oldatához keverés közben. Az elegyet 16 órán át szobahőmérsékleten keverjük, majd tömény sósavval megsavanyítjuk, szűrjük, hideg vízzel mossuk és szárítjuk. Ilyen módon 210 g metil-4,6-dihidrox-2-metil-pirimidin-5-il-acetátot (vagy annak tautomer alakjait) kapjuk színtelen szilárd anyagként; op.: 200 °C fölött.

$^1\text{H-NMR}$ ($\text{d}^6\text{-DMSO}$): 11,95 (s, széles, 2H); 3,54 (s, 3H); 3,20 (s, 2H); 2,23 (s, 3H).

b) Metil-4,6-diklór-2-metil-pirimidin-5-il-acetát
[(16) képletű vegyület]

175 g (0,88 mol) metil-4,6-dihidrox-2-metil-pirimidin-5-il-acetát 230 ml (2,6 mol) foszfor-oxi-kloriddal és 280 ml (1,75 mol) N,N-dietyl-anilinnel készített szuszpenzióját 1 órán át 130 °C hőmérsékleten melegítjük. Ezután az elegyet aprított jég és víz elegyébe öntjük. A kristályos terméket szűrjük és vízzel mossuk. Szárítás után 180 g metil-4,6-diklór-2-metil-pirimidin-5-il-acetátot kapunk szürke kristá-

lyok alakjában; op.: 70-72 °C.

c) Metil-4-klór-6-metoxi-2-metil-pirimidin-5-il-acetát

[(17) képletű vegyület

Nátrium-metilát 5,4 mólos metanolos oldatából 33 ml-t szobahőmérsékleten 35,5 g (0,15 mol) metil-4,6-diklór-2-metil-pirimidin-5-il-acetát 60 ml 1,2-dimetoxi-etános oldatához adunk. 30 percen át végzett keverés után az elegyet dietil-éterrel hígítjuk és vízzel mossuk. Szárítás és desztillálás után 30 g metil-4-klór-6-metoxi-2-metil-pirimidin-5-il-acetátot kapunk színtelen olaj alakjában; forráspont: 108-110 °C/65 Pa.

d) Metil-4-(3-izopropil-fenoxi)-6-metoxi-2-metil-pirimidin-5-il-acetát [(18) képletű vegyület]

23 g (0,1 mol) 4-klór-6-metoxi-2-metil-pirimidin-5-il-acetátot, 13,6 g (0,1 mol) 3-izopropil-fenolt és 20,7 g (0,15 mol) kálium-karbonátot 2 órán át hevítünk 50 ml dimetil-formamidban 130 °C hőmérsékleten. Ezután a reakcióelegyet dietil-éterrel hígítjuk, vízzel mossuk, szárítjuk és szilikagélen kromatografáljuk, eluensként etil-acetát és hexán 1:3 térfogatarányú elegyét használva. Ilyen módon 21,5 g metil-H-(3-izopropil-fenoxi)-6-metoxi-2-metil-pirimidin-5-il-acetátot kapunk színtelen, szilárd anyag formájában. Egy másik eljárás mód szerint a kapcsolást 120 °C hőmérsékleten 10 mol% CuI katalizátorral folytathatjuk le, és így hasonló kitermeléssel kapjuk a végterméket.

¹H-NMR (CDCl₃): 7,28-6,82 (m, 4H); 4,02 (s, 3H); 3,72 (s, 2H); 3,70 (s, 3H); 2,88 (dq, 1H); 2,32 (s, 3H); 1,22 (d, 6H).

e) 8,6 g (26 mmol) metil-4-(3-izopropil-fenoxi)-6-metoxi-2-metil-pirimidin-5-il-acetát 20 ml 1,2-dimetoxi-etánnal és 8 ml N,N-diformil-metil-aminnal készített oldatát 5 °C hőmérsékleten hozzáadjuk 1,6 g (52 mmol) nátrium-hidrid 30 ml dimetil-formamiddal készített, 80 %-os olajos szuszpenziójához. A reakcióelegyet 4 órán át szobahőmérsékleten keverjük, majd 3,7 ml (39 mmol) dimetil-szulfátot adunk hozzá 0 °C hőmérsékleten és a keverést 3 órán át tovább folytatjuk. Ezután a reakcióelegyet dietil-éterrel hígítjuk, konyhasóoldattal mossuk és szilikagélen kromatografáljuk, eluensként hexán és etil-acetát 3:1 térfogatarányú elegyét használva. Így 7,2 g (74 %) metil- α -[4-(3-izopropil-fenoxi)-6-metoxi-2-metil-pirimidin-5-il]- β -metoxi-akrilátot kapunk színtelen olajként.

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3): a 2. táblázatban a 2.03. sorszámú vegyületnél adjuk meg.

6. példa

Metil-2-[4-(3-(1-(3-klór-benzil-oxi-imino)-etil)-fenoxi)-6-dimetil-amino-pirimidin-5-il]-2-metoxi-imino-acetát [(19) képletű vegyület]

a) Metil-4-(3-acetil-fenoxi)-6-dimetil-amino-pirimidin-5-il-acetát [(20) képletű vegyület]

221 g (1 mol) metil-4,6-diklór-pirimidin-5-il-acetát, 136 g (1 mol) 3-hidroxi-acetofenon és 207 g (1,5 mol) kálium-karbonát 150 ml dimetil-formamiddal készített oldatát 100 °C hőmérsékleten 90 percen át keverjük. A sötét reakcióelegyet 0 °C-ra hűtjük le és 450 ml 40 %-os vizes dimetil-amin-oldatot adunk hozzá. A keverést szobahőmérsékleten 16 órán

át folytatjuk, majd az elegyet vízzel hígítjuk és dietil-éterrel extraháljuk. Ilyen módon barna olajként metil-4-(3-acetil-fenoxi)-6-dimetil-amino-pirimidin-5-il-acetátot kapunk, amelynek tisztasága meghaladja a 95 %-ot.

b) Metil-4-[3-(1-hidroxi-imino-etil)-fenoxi]-6-dimetil-amino-pirimidin-5-il-acetát [(21) képletű vegyület]

A kapott metil-4-(3-acetil-fenoxi)-6-dimetil-amino-pirimidin-5-il-acetátot 500 ml metanolban oldjuk, majd 0 °C hőmérsékleten 76 g (1,1 mol) hidroxil-amin-hidrokloridot és 107 g (1,3 mol) nátrium-acetátot adunk hozzá. 2 órán át szobahőmérsékleten végzett keverés után a terméket víz hozzáadásával kikristályosítjuk. Szűrés és szárítás után 292 g metil-4-[3-(1-hidroximino-etil)-fenoxi]-6-dimetil-amino-pirimidin-5-il-acetátot kapunk sárgás kristályok alakjában, 113-115 °C olvadásponttal.

c) Metil-4-[3-(1-(3-klór-benzil-oxi-imino-etil)-fenoxi)-6-dimetil-amino-pirimidin-5-il-acetát [(22) képletű vegyület]

34,4 g (0,1 mol) metil-4-[3-(1-hidroximino-etil)-etil-fenoxi]-dimetil-amino-pirimidin-5-il-acetát, 16,1 g (0,1 mol) 3-klór-benzil-klorid és 20,7 g (0,15 mol) kálium-karbonát 30 ml dimetil-formamiddal készített elegyét keverés közben 110 °C hőmérsékleten melegítjük 3 órán át. Dietil-éterrel végzett hígítás és vizes mosás után 44 g metil-4-[3-(1-(3-klór-benzil-oximino)-etil)-fenoxi]-6-dimetil-amino-pirimidin-5-il-acetátot kapunk sárgás színű olaj alakjában.

d) Metil-2-[4-(3-(1-(3-klór-benzil-oxi-imino)-etil)-

-fenoxi)-6-dimetil-amino-pirimidin-5-il]-2-hidroxi-imino-acetát [(23) képletű vegyület]

44 g (0,094 mol) metil-4-[3-(1-(3-klór-benzil-oximino)-etil)-fenoxi]-6-dimetil-amino-pirimidin-6-il-acetát 50 ml 1,2-dimetoxi-etánnal és 20 ml terc-butyl-nitrittel készített oldatát lassan hozzáadjuk 16 g (0,14 mol) kálium-terc-butylát 100 ml 1,2-dimetoxi-etánnal készített oldatához -20 °C hőmérsékleten. Egy órán át szobahőmérsékleten végzett keverés után a reakciót telített vizes ammónium-klorid oldat hozzáadásával leállítjuk. A keverést 2 órán át folytatjuk, majd extrahálás után szilikagélen kromatografálunk, eluensként hexán és etil-acetát 2:1 térfogatarányú elegyét használva. Ilyen módon 33 g (71 %) E-alakú metil-2-[4-(3-(1-(3-klór-benzil-oximino)-etil)-fenoxi)-6-dimetil-amino-pirimidin-5-il]-2-hidroximino-acetátot kapunk szintelen olajként.

e) 2,4 g (80 mmol) nátrium-hidrid száraz dimetil-formamiddal készített 80 %-os szuszpenziójához 0 °C hőmérsékleten hozzáadjuk 33 g (66 mmol) metil-2-[4-(3-(1-(3-klór-benzil-oximino)-etil)-fenoxi)-6-dimetil-amino-pirimidin-5-il]-2-hidroximino-acetát és 7,6 g (80 mmol) dimetil-szulfát dimetil-formamiddal készített oldatát. A reakcióelegyet 4 órán át keverjük, majd dietil-éterrel hígítjuk, vízzel mossuk és szilikagélen kromatografáljuk, eluensként hexán és etil-acetát 3:1 térfogatarányú elegyét használva. Így 24 g (71 %) metil-2-[4-(3-(1-(3-klór-benzil-oximino)-etil)-fenoxi)-6-dimetil-amino-pirimidin-5-il]-2-metoximino-acetátot kapunk szintelen olaj alakjában.

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3): a 3. táblázatban a 3.03. sorszámú vegyület-nél adjuk meg.

7. példa

N-metil-2-[4-(3-izopropil-fenoxi)-6-dimetil-amino-2-metil-pirimidin-5-il]-2-metoxi-imino-acetamid [(24) képletű vegyület

a) Metil-4-(3-izopropil-fenoxi)-6-dimetil-amino-2-metil-pirimidin-5-il-acetát [(25) képletű vegyület]

23,5 g (0,1 mol) metil-4,6-diklór-2-metil-pirimidin-5-il-acetátot, 13,6 g (0,1 mol) 3-izopropil-fenolt és 20,7 g (0,15 mol) kálium-karbonátot melegítünk 30 ml dimetil-formamidban 100 °C hőmérsékleten 45 percen keresztül. A reakcióelegyet lehűtjük és 50 ml 40 térfogat%-os vizes dimetil-amin-oldatot adunk hozzá. A keverést szobahőmérsékleten 16 órán át folytatjuk, majd az elegyhez vizet adunk, leszűrjük és megszárítjuk. Így 28 g metil-1-dimetil-amino-2-metil-pirimidin-5-il-acetátot kapunk barnás színű szilárd anyagként.

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3): 7,28-6,82 (m, 4H); 3,84 (s, 3H); 3,78 (s, 2H); 3,02 (s, 6H); 2,89 (dq, 1H); 2,37 (s, 3H); 1,23 (d, 6H).

b) Metil-2-[4-(3-izopropil-fenoxi)-6-dimetil-amino-2-metil-pirimidin-5-il]-2-hidroxi-imino-acetát [(26) képletű vegyület]

28 g (0,08 mol) metil-4-(3-izopropil-fenoxi)-6-dimetil-amino-2-metil-pirimidin-5-il-acetát 40 ml terc-butyl-nitrittel és 40 ml 1,2-dimetoxi-etánnal készített oldatát -30 °C hőmérsékleten hozzáadjuk 14 g (0,12 mol) kálium-terc-butyl-

tilát 50 ml 1,2-dimetoxi-etánnal készített oldatához. A reakcióelegyet hagyjuk 0 °C-ra felmelegedni, majd a reakciót ammónium-klorid-oldat hozzáadásával leállítjuk. 2 órán át szobahőmérsékleten végzett keverés után a terméket dietil-éterrel extraháljuk, magnézium-szulfát fölött szárítjuk és az oldószert lehajtjuk. Így 30 g nyers metil-2-[4-(3-izopropil-fenoxi)-6-dimetil-amino-2-metil-pirimidin-5-il]-2-hidroximino-acetátot kapunk.

c) Metil-2-[4-(3-izopropil-fenoxi)-6-dimetil-amino-2-metil-pirimidin-5-il]-2-metoxi-imino-acetát [(27) képletű vegyület]

30 g (0,08 mol) metil-2-[4-(3-izopropil-fenoxi)-6-dimetil-amino-2-metil-pirimidin-5-il]-2-hidroximino-acetátot feloldunk 100 ml toluol és 50 ml 1,2-dimetoxi-etán elegyében, majd egymást követően 8,6 ml (0,09 mol) dimetil-szulfát és 2,7 g (0,09 mol) nátrium-hidrid 80 %-os olajos szuszpenzióját adjuk hozzá -10 °C hőmérsékleten. A reakcióelegyet hagyjuk szobahőmérsékletre felmelegedni, majd 4 órán át ezen a hőmérsékleten keverjük, dietil-éterrel hígítjuk, vízzel mossuk, szárítjuk és szilikagélen kromatografáljuk, eluensként etil-acetát és hexán 1:3 térfogatarányú elegyét használva. Így 16,2 g metil-2-[4-(3-izopropil-fenoxi)-6-dimetil-amino-2-metil-pirimidin-5-il]-2-metoximino-acetátot kapunk színtelen olajként.

¹H-NMR (CDCl₃): 7,28-6,82 (m, 4H); 4,07 (s, 3H); 3,83 (s, 3H); 3,02 (s, 6H); 2,89 (dq, 1H); 2,37 (s, 3H); 1,23 (d, 6H).

d) 6,0 g (15,5 mol) metil-2-[4-(3-izopropil-fenoxi)-6-

-dimetil-amino-2-metil-pirimidin-5-il]-2-metoximino-acetát és 10 ml vizes metil-amin-oldat 80 ml dimetil-formamiddal készített oldatát 48 órán át keverjük szobahőmérsékleten. A terméket víz hozzáadásával kikristályosítjuk. Szűrés és szárítás után 4,7 g (78 %) N-metil-2-[4-(3-izopropil-fenoxi)-6-dimetil-amino-2-metil-pirimidin-5-il]-2-metoximino-acetamidot kapunk színtelen kristályok alakjában, 128-129 °C olvadásponttal.

A következő táblázatok vegyületeit hasonló eljárással kapjuk. (A táblázatokban Ph fenilcsoportot jelöl; a TLC rövidítés jelentése "vékonyréteg-kromatográfia").

1. táblázat: (I) általános képletű vegyületek ($R^5 = H$; $X = CH$; $Y = OCH_3$)

A ve- gyület sorszáma	R^1	R^2	R^1	R^4	Ismer	Fizikai adatok 1H -NMR
1.01	OCH_3	C_3H_7-i	H	H	E	78-80°C
1.02	OCH_3	C_3H_7-i	H	H	Z	97-98°C
1.03	OCH_3	CF_3	H	H	E	109-110°C
1.04	$N(CH_3)_2$	Ph	H	H	E	8.28 (s, 1H); 7.60-7.00 (m, 10H); 3.89 (s, 3H); 3.74 (s, 3H), 3.10 (s, 6H)
1.05	$N(CH_3)_2$	Ph	H	H	Z	110-112°C
1.06	OCH_3	CH_3	H	H	E	107°C
1.07	$N(CH_3)_2$	CN	H	H	E	8.23 (s, 1H); 7.51 (s, 1H); 7.48-7.25 (m, 4H); 3.87 (s, 3H); 3.75 (s, 3H); 3.12 (s, 6H) ; 97-98°C

1.08	OCH ₃	Ph	H	H	E	8.42 (s, 1H); 7.65-7.04 (m, 10H); 4.02 (s, 3H); 3.89 (s, 3H); 3.73 (s, 3H)
1.09	OCH ₃	CH ₃	CH ₃	H	E	133-135°C
1.10	OCH ₃	CH ₃	CH ₃	H	Z	134-136°C
1.11	OCH ₃	C ₄ H ₉ -t	H	H	E	8.39 (s, 1H); 7.59 (s, 1H); 7.35-6.87 (m, 4H); 4.00 (s, 3H); 3.89 (s, 3H); 3.72 (s, 3H); 1.31 (s, 9H)
1.12	OCH ₃	C ₄ H ₉ -t	H	H	Z	8.35 (s, 1H); 7.35-6.87 (m, 4H); 6.77 (s, 1H); 4.00 (s, 3H); 3.96 (s, 3H); 3.72 (s, 3H); 1.32 (s, 9H)
1.13	N(CH ₃) ₂	C ₄ H ₉ -t	H	H	E	8.24 (s, 1H); 7.49 (s, 1H); 7.31-6.80 (m, 4H); 3.87 (s, 3H); 3.73 (s, 3H); 3.08 (s, 6H); 1.30 (s, 9H)
1.14	OCH ₃	2-CH ₃ -1,3-dioxolan-2-yl	H	H	E	8.38 (s, 1H); 7.59 (s, 1H); 7.40-6.98 (m, 4H); 4.05-3.97 (m, 2H); 4.00 (s, 3H); 3.88 (s, 3H); 3.82-3.74 (m, 2H); 3.72 (s, 3H); 1.65 (s, 3H)

1.15	OCH ₃	2-CH ₃ -1,3-dioxolan-2-yl	H	H	Z	8.32 (s, 1H); 7.40-6.96 (m, 4H); 6.73 (s, 1H); 4.07-3.99 (m, 2H); 4.00 (s, 3H); 3.96 (s, 3H); 3.82-3.74 (m, 2H); 3.70 (s, 3H); 1.65 (s, 3H)
1.16	N(CH ₃) ₂	-C(CH ₃) N-O-CH ₂ -CH=CH ₂	H	H	E	8.23 (s, 1H); 7.50 (s, 1H); 7.46-7.00 (m, 4H); 6.02 (ddd, 1H); 5.32 (d, 1H); 5.22 (d, 1H); 4.68 (d, 2H); 3.88 (s, 3H); 3.74 (s, 3H); 3.08 (s, 9H); 2.22 (s, 3H)
1.17	OCH ₃	-C(CH ₃)=N-benzyl-oxi	H	H	E	8.38 (s, 1H); 7.60 (s, 1H); 7.52-7.05 (m, 9H); 5.23 (s, 2H); 4.00 (s, 3H); 3.88 (s, 3H); 3.73 (s, 3H); 2.26 (s, 3H)
1.18	OCH ₃	1,3-dioxan-2-yl	H	H	E	8.38 (s, 1H); 7.57 (s, 1H); 7.40-7.02 (m, 4H); 5.50 (s, 1H); 4.30-4.20 (m, 4H); 4.02-3.90 (m, 4H); 3.95 (s, 3H); 3.88 (s, 3H); 3.72 (s, 3H); 2.30-2.10 (m, 1H); 1.48-1.37 (m, 1H)
1.19	-N-pyrrolidinyl	C ₃ H ₇ -i	H	H	E	8.24 (s, 1H); 7.52 (s, 1H); 7.30-6.82 (m, 4H); 3.87 (s, 3H); 3.73 (s, 3H); 3.54-2.94 (m, 8H); 2.88 (dq, 1H); 1.98-1.82 (m, 8H); 1.24 (d, 6H); 100-102°C

1.20	N(CH ₃) ₂	fenoxi	H	H	E	8.26 (s, 1H); 7.48 (s, 1H); 7.38-6.67 (m, 9H); 3.83 (s, 3H); 3.70 (s, 3H); 3.07 (6H)
1.21	N(CH ₃) ₂	Cl	H	H	E	
1.22	N(CH ₃) ₂	-O-CH ₂ -CH=CH ₂	H	H	E	
1.23	N(CH ₃) ₂	-O-CH ₂ -C≡CH	H	H	E	
1.24	N(CH ₃) ₂	-O-CH ₂ CH=CH-CH ₃	H	H	E	
1.25	N(CH ₃) ₂	-O-CH ₂ -CH=C(CH ₃) ₂	H	H	E	
1.26	N(CH ₃) ₂	benzil-oxi	H	H	E	
1.27	N(CH ₃) ₂	Cl	Cl	H	E	
1.28	N(CH ₃) ₂	CH ₃	CH ₃	H	E	
1.29	OCH ₃	-O-CH ₂ -CH=CH ₂	H	H	E	
1.30	OCH ₃	-O-CH ₂ -CH=CH-CH ₃	H	H	E	
1.31	OCH ₃	-O-CH ₂ -C≡CH	H	H	E	
1.32	OCH ₃	-O-CH ₂ -CH=C(CH ₃) ₂	H	H	E	

1.33	OCH ₃	1,3-dioxolan-2-yl	H	H	E	
1.34	N(CH ₃) ₂	1,3-dioxan-2-yl	H	H	E	
1.35	N(CH ₃) ₂	2-CH ₃ -dioxolan-2-yl	H	H	E	102-103°C
1.36	N(CH ₃) ₂	2,4,4-(CH ₃) ₃ dioxolan-2-yl	H	H	E	
1.37	N(CH ₃) ₂	CH ₃	H	H	E	134-135°C
1.38	N(CH ₃) ₂	CH ₃	H	H	Z	84-86°C
1.39	OCH ₃	C(CH ₃)=CH ₂	H	H	E	90-92°C
1.40	OCH ₃	C ₃ H ₇ -i	H	CH ₃	E	100-102°C
1.41	OCH ₃	fenoxi	H	H	E	103-105°C
1.42	OCH ₃	-O-CH ₂ -CH=CH-Ph	H	H		
1.43	OCH ₃	-O-(CH ₂) ₄ -Ph	H	H		
1.44	OCH ₃	-O-(CH ₂) ₂ -Ph	H	H		
1.45	OCH ₃	-O-(CH ₂) ₂ -O-Ph	H	H		
1.46	OCH ₃	2-CH ₃ -benzyl-oxi	H	H		

1.47	OCH ₃	2-CH ₃ -fenoxi	H	H		
1.48	OCH ₃	2-CN-fenoxi	H	H		
1.49	OCH ₃	2-Cl-fenoxi	H	H		
1.50	OCH ₃	2-Ph-tiazol-4-il	H	H		
1.51	OCH ₃	3-CH ₃ -izoxazol-5-il	H	H		
1.52	OCH ₃	3-CF ₃ -izoxazol-5-il	H	H		
1.53	OCH ₃	3-Ph-izoxazol-5-il	H	H		
1.54	OCH ₃	1-CH ₃ -3-Ph-pirazol-5-il	H	H		
1.55	OCH ₃	5-Ph-oxazol-2-il	H	H		
1.56	OCH ₃	3-CF ₃ -benzil-oxi	H	H		
1.57	OCH ₃	-O-(CH ₂) ₂ -O-C ₂ H ₅	H	H		
1.58	OCH ₃	-C(CH ₃)=N-O-C ₂ H ₅	H	H		
1.59	OCH ₃	-C(CH ₃)=N-3-Cl-benzil-oxi	H	H		

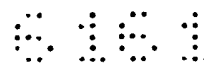
2. táblázat: (I) általános képletű vegyületek ($R^5 = CH_3$; $X = CH$; $Y = OCH_3$)

A ve- gyület sorszám	R^1	R^2	R^3	R^4	I omer	Fizikai adatok 1H -NMR és/vagy op.
2.01	OCH_3	C_3H_7-i	H	CH_3	E	100-102°C
2.02	$N(CH_3)_2$	C_3H_7-i	H	H	E	
2.03	OCH_3	C_3H_7-i	H	H	E	7.55 (s, 1H); 7.30-6.82 (m, 4H); 3.96 (s, 3H); 3.82 (s, 3H); 3.68 (s, 3H); 2.90 (dq, 1H); 2.42 (s, 3H); 1.20 (2d, 6H).
2.04	OCH_3	CF_3	H	H	E	7.57 (s, 1H); 7.50-7.23 (m, 4H); 3.98 (s, 3H); 3.83 (s, 3H); 3.70 (s, 3H); 2.45 (s, 3H).
2.05	$N(CH_3)_2$	Ph	H	H	E	110-112°C
2.06	OCH_3	$C(CH_3)=N-OCH_3$	H	H	E	78-80°C
2.07	$N(CH_3)_2$	C_3H_7-i	H	CH_3		
2.08	OCH_3	2- CH_3 -benzil-oxi	H	H		
2.09	OCH_3	-O-(CH_2) ₂ -Ph	H	H		

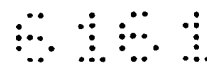
2.10	OCH ₃	2-Ph-tiazol-4-il	H	H		
2.11	OCH ₃	3-CF ₃ -izoxazol-5-il	H	H		
2.12	OCH ₃	3-CH ₃ -izoxazol-5-il	H	H		
2.13	N(CH ₃) ₂	3-CF ₃ -izoxazol-5-il	H	H	E	TLC: Rf 0.13 hexán/etilacetát (2:1)

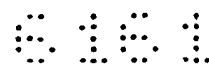
3. táblázat: (I) általános képletű vegyületek ($R^1 = N(CH_3)_2$; $X = N$; $Y = OCH_3$; E-forma)

A vegyület sorszáma	R^2	R^1	R^4	R^5	Fizikai adatok vagy 1H -NMR
3.01	$-C(CH_3)=N-4-Cl$ -benzil-oxi	H	H	H	8.23 (s, 1H); 7.50-7.02 (m, 3H); 5.18 (s, 2H); 4.05 (s, 3H); 3.90 (s, 3H); 3.14 (s, 6H); 2.22 (s, 3H).
3.02	$-C(CH_3)=N$ -benzil-oxi	H	H	H	8.23 (s, 1H); 7.52-7.02 (m, 9H); 5.21 (s, 2H); 4.05 (s, 3H); 3.90 (s, 3H); 3.15 (s, 6H); 2.23 (s, 3H).
3.03	$-C(CH_3)=N-3-Cl$ -benzil-oxi	H	H	H	8.22 (s, 1H); 7.52-7.02 (m, 8H); 5.18 (s, 2H); 4.05 (s, 3H); 3.81 (s, 3H); 7.15 (s, 6H); 2.23 (s, 3H).
3.04	$-C(CH_3)=N-O-C_2H_5$	H	H	H	8.22 (s, 1H); 7.52-7.02 (m, 4H); 4.22 (q, 2H); 4.05 (s, 3H); 3.82 (s, 3H); 3.14 (s, 6H); 2.20 (s, 3H); 1.30 (t, 3H).
3.05	CF_3	H	H	H	8.22 (s, 1H); 7.54-7.25 (m, 4H); 4.06 (s, 3H); 3.82 (s, 3H); 3.17 (s, 6H)
3.06	$-C(CH_3)=N-OCH_3$	H	H	H	109-110°C



3.07	$-\text{C}(\text{CH}_3)_2=\text{N}-\text{O}-\text{CH}_2-\text{C}(\text{CH}_3)=\text{CH}_2$	H	H	H	8.22 (s, 1H); 7.52-7.02 (m, 4H); 5.00 (s br, 1H); 4.92 (s br, 1H); 4.62 (s, 2H); 4.06 (s, 3H); 3.83 (s, 3H); 3.16 (s, 6H); 2.24 (s, 3H); 1.78 (s, 3H).
3.08	$-\text{C}(\text{CH}_3)_2=\text{N}-\text{OCH}_3$	H	H	CH_3	TLC: Rf 0.17 hexán/etil-acetát (7:3)
3.09	$\text{C}_3\text{H}_7\text{-i}$	H	H	CH_3	7.26-6.83 (m, 4H); 4.06 (s, 3H); 3.85 (s, 3H); 3.02 (s, 6H); 2.90 (dq, 1H); 2.37 (s, 3H); 1.22 (2xd, 6H).
3.10	$\text{C}_3\text{H}_7\text{-i}$	H	CH_3	CH_3	7.27-6.66 (m, 3H); 4.06 (s, 3H); 3.84 (s, 3H); 3.02 (s, 6H); 2.85 (dq, 1H); 2.38 (s, 3H); 2.32 (s, 3H); 1.23 (2xd, 6H).
3.11	$\text{C}_4\text{H}_9\text{-t}$	H	H	CH_3	7.29-6.83 (m, 4H); 4.08 (s, 3H); 3.85 (s, 3H); 3.02 (s, 6H); 2.37 (s, 3H); 1.30 (s, 9H).
3.12	$\text{C}_4\text{H}_9\text{-t}$	H	H	H	8.23 (s, 1H); 7.26-6.83 (m, 4H); 4.07 (s, 3H); 3.84 (s, 3H); 3.03 (s, 6H); 1.30 (s, 9H).
3.13	Ph	H	H	CH_3	7.60-7.00 (m, 9H); 4.05 (s, 3H); 3.86 (s, 3H); 3.02 (s, 6H); 2.38 (s, 3H).
3.14	$3,4-(\text{OCH}_3)_2\text{-Ph}$	H	H	CH_3	7.30-6.83 (m, 7H); 4.02 (s, 3H); 3.86 (s, 3H); 3.83 (s, 3H); 3.78 (s, 3H); 2.97 (s, 6H); 2.30 (s, 3H).





3.15	4-OCH ₃ -Ph	H	H	CH ₃	108-110°C
3.16	3,5-(CH ₃) ₂ -pirazol-1-il	H	H	CH ₃	7.53-7.00 (m, 4H); 5.98 (s, 1H); 4.08 (s, 1H); 3.85 (s, 3H); 3.02 (s, 6H); 2.38 (s, 3H); 2.32 (s, 3H); 2.29 (s, 3H).
3.17	3-CH ₃ -izoxazol-5-il	H	H	CH ₃	7.48-7.00 (m, 4H); 6.28 (s, 1H); 4.00 (s, 3H); 3.78 (s, 3H); 2.95 (s, 6H); 2.26 (s, 3H); 2.25 (s, 3H).
3.18	2-CH ₃ -fenoxi	H	H	CH ₃	7.30-6.60 (m, 8H); 4.03 (s, 3H); 3.82 (s, 3H); 3.02 (s, 6H); 2.38 (s, 3H); 2.24 (s, 3H).
3.19	2-Cl -fenoxi	H	H	CH ₃	7.48-6.68 (m, 8H); 4.03 (s, 3H); 3.82 (s, 3H); 3.02 (s, 6H); 2.37 (s, 3H).
3.20	2-CN -fenoxi	H	H	H	8.22 (s, 1H); 7.67-6.82 (m, 8H); 4.04 (s, 3H); 3.80 (s, 3H); 3.13 (s, 6H).
3.21	2-CH ₃ -benzil-oxi	H	H	CH ₃	7.45-6.64 (m, 8H); 5.00 (s, 2H); 4.06 (s, 3H); 3.85 (s, 3H); 3.02 (s, 6H); 2.38 (s, 3H); 2.37 (s, 3H).
3.22	2,4-Cl ₂ -benzil-oxi	H	H	CH ₃	7.52-6.65 (m, 7H); 5.08 (s, 2H); 4.05 (s, 3H); 3.85 (s, 3H); 3.02 (s, 6H); 2.38 (s, 3H).

3.23	$\text{-O}(\text{CH}_2)_2\text{-Ph}$	H	H	CH_3	
3.24	2-Ph-tiazol-4-il	H	H	CH_3	
3.25	3- CF_3 -izoxazol-5-il	H	H	CH_3	op. 97-99 °C
3.26	$\text{-C}(\text{CH}_3)=\text{N} \cdot \text{O} \cdot \text{C}_4\text{H}_9\text{-i}$	H	H	H	
3.27	$\text{-C}(\text{CH}_3)=\text{N} \cdot \text{O} \cdot \text{C}_4\text{H}_9\text{-i}$	H	H	CH_3	
3.28	$\text{-C}(\text{CH}_3)=\text{N} \cdot \text{O} \cdot \text{C}_4\text{H}_9\text{-n}$	H	H	H	
3.29	$\text{-C}(\text{CH}_3)=\text{N} \cdot \text{O} \cdot \text{C}_4\text{H}_9\text{-n}$	H	H	CH_3	
3.30	$\text{-C}(\text{CH}_3)=\text{N} \cdot \text{O} \cdot \text{CH}_2\text{-C}(\text{CH}_3)=\text{CH}_2$	H	H	H	
3.31	$\text{-C}(\text{CH}_3)=\text{N} \cdot \text{O} \cdot \text{CH}_2\text{-CH}=\text{CH}_2$	H	H	CH_3	
3.32	$\text{-C}(\text{CH}_3)=\text{N} \cdot \text{O} \cdot \text{CH}_2\text{-C}\equiv\text{CH}$	H	H	H	
3.33	$\text{-C}(\text{CH}_3)=\text{N} \cdot \text{O} \cdot \text{CH}_2\text{-C}\equiv\text{CH}$	H	H	CH_3	
3.34	$\text{-C}(\text{CH}_3)=\text{N} \cdot \text{O} \cdot \text{C}_4\text{H}_9$	H	H	CH_3	TLC: Rf 0.19 hexán/etil-acetát (7:3)
3.35	$\text{-C}(\text{CH}_3)=\text{N} \cdot \text{benzil-oxi}$	H	H	CH_3	
3.36	$\text{-C}(\text{CH}_3)=\text{N} \cdot 3\text{-Cl-benzil-oxi}$	H	H	CH_3	TLC: Rf 0.23 hexán/etil-acetát (2:1)

• • • •

3.37	-C(CH ₃)=N-4-Cl-benzil-oxi	H	H	CH ₃	
3.38	-C(CH ₃)=N-2-Cl-benzil-oxi	H	H	CH ₃	
3.39	-C(CH ₃)=N-2-CH ₃ -benzil-oxi	H	H	CH ₃	
3.40	-C(CH ₃)=N-2,5-(CH ₃) ₂ -benzil-oxi	H	H	CH ₃	
3.41	-C(CH ₃)=N-O-CH(CH ₃)-3-CF ₃ -Ph	H	H	CH ₃	
3.42	-C(CH ₃)=N-3-CF ₃ -benzil-oxi	H	H	CH ₃	
3.43	-C(CH ₃)=N-3-CF ₃ -benzil-oxi	H	H	H	
3.44	-C(CH ₃)=N-O-(CH ₃) ₂ -3-Cl-Ph	H	H	CH ₃	
3.45	-C(CH ₃)=N-O-(CH ₃) ₂ -4-Cl-Ph	H	H	CH ₃	
3.46	-C(CH ₃)=N-O-(CH ₃) ₂ -Ph	H	H	CH ₃	
3.47	CF ₃	H	H	CH ₃	
3.48	3-Ph-5-CH ₃ -pirazol-1-il	H	H	CH ₃	
3.49	3-Ph-izoxazol-5-il	H	H	CH ₃	
3.50	3-Ph-1-CH ₃ -pirazol-5-il	H	H	CH ₃	

3.51	3-CF ₃ -1-CH ₃ -pirazol-5-il	H	H	CH ₃	
3.52	5-CH ₃ -oxazol-2-oxazol-2-il	H	H	CH ₃	
3.53	5-Ph-oxazol-2-oxazol-2-il	H	H	CH ₃	
3.54	5-CF ₃ -oxazol-2-oxazol-2-il	H	H	CH ₃	
3.55	3-CF ₃ -benzil-oxi	H	H	CH ₃	
3.56	-O-CH(CH ₃)-3-CF ₃ -Ph	H	H	CH ₃	
3.57	-O-(CH ₂) ₂ -OCH ₃	H	H	CH ₃	
3.58	-O-(CH ₂) ₂ -O-C ₂ H ₅	H	H	CH ₃	
3.59	-O-(CH ₂) ₂ -O-C ₄ H ₉ -n	H	H	CH ₃	
3.60	-O-(CH ₂) ₂ -O-Ph	H	H	CH ₃	
3.61	-C(CH ₃)=N-NH-6-Cl-2-piridil	H	H	CH ₃	
3.62	-C(CH ₃)=N-NH-6-Cl-2-piridil	H	H	H	
3.63	-C(CH ₃)=N-O-6-Cl-2-piridil	H	H	H	
3.64	-C(CH ₃)=N-O-6-Cl-2-piridil	H	H	CH ₃	

3.65	-C(CH ₃)=N·O·6-Br-2-piridil	H	H	H	
3.66	-C(CH ₃)=N·O·6-Br-2-piridil	H	H	CH ₃	
3.67	-C(CH ₃)=N-NH-4,6-(CH ₃) ₂ -2-pirimidinil	H	H	CH ₃	

4. táblázat: (I) általános képletű vegyületek (X = N; Y = NHCH₃; E-forma)

A ve- gyület sorszáma	R ¹	R ²	R ¹	R ⁴	R ⁵	Op.
4.01	OCH ₃	-C(CH ₃)=N-OCH ₃	H	H	CH ₃	122-124°C
4.02	N(CH ₃) ₂	H	H	H	CH ₃	194°C
4.03	N(CH ₃) ₂	3-OCH ₃ -Ph	H	H	CH ₃	146-147°C
4.04	N(CH ₃) ₂	C ₃ H ₇ -i	H	H	CH ₃	128-129°C
4.05	N(CH ₃) ₂	C ₃ H ₇ -i	H	CH ₃	CH ₃	126°C
4.06	N(CH ₃) ₂	2-Cl-fenoxi	H	H	CH ₃	138-140°C
4.07	N(CH ₃) ₂	2-CH ₃ -fenoxi	H	H	CH ₃	142-143°C
4.08	N(CH ₃) ₂	3,4-(OCH ₃) ₂ -Ph	H	H	CH ₃	141-142°C
4.09	N(CH ₃) ₂	C ₄ H ₉ -t	H	H	H	138°C
4.10	N(CH ₃) ₂	C ₄ H ₉ -t	H	H	CH ₃	124-126°C
4.11	OCH ₃	-C(CH ₃)=N-3-Cl-benzil-oxi	H	H	H	
4.12	OCH ₃	-C(CH ₃)=N-3-Cl-benzil-oxi	H	H	CH ₃	

4.13	OCH ₃	C ₃ H ₇ -i	H	CH ₃	CH ₃	
4.14	OCH ₃	Ph	H	H	H	
4.15	OCH ₃	2-CH ₃ -fenoxi	H	H	CH ₃	
4.16	OCH ₃	2-CH ₃ -benzil-oxi	H	H	H	
4.17	OCH ₃	3-CF ₃ -izoxazol-5-il	H	H	H	
4.18	OCH ₃	3-CF ₃ -izoxazol-5-il	H	H	CH ₃	
4.19	N(CH ₃) ₂	-C(CH ₃)=N-3-Cl-benzil-oxi	H	H	H	
4.20	N(CH ₃) ₂	-C(CH ₃)=N-3-Cl-benzil-oxi	H	H	CH ₃	
4.21	N(CH ₃) ₂	CF ₃	H	H	CH ₃	
4.22	N(CH ₃) ₂	Ph	H	H	CH ₃	
4.23	N(CH ₃) ₂	3-CF ₃ -izoxazol-5-il	H	H	H	
4.24	N(CH ₃) ₂	3-CF ₃ -izoxazol-5-il	H	H	CH ₃	
4.25	N(CH ₃) ₂	2-Ph-tiazol-4-il	H	H	CH ₃	
4.26	N(CH ₃) ₂	-O-(CH ₂) ₂ -Ph	H	H	CH ₃	

5. táblázat: (I) képletű vegyületek ($R^1 = OCH_3$; $X = CH$; $Y = OCH_3$)

A vegyület sorszáma	R^2	R^1	R^4	R^4	Fizikai adatok vagy 1H -NMR
5.01	2- CH_3 -benzil-oxi	H	H	H	8.40 (s, 1H); 7.58 (s, 1H); 7.40-6.65 (m, 8H); 5.00 (s, 2H); 3.98 (s, 3H); 3.85 (s, 3H); 3.70 (s, 3H); 2.35 (s, 3H).
5.02	3- NO_2 -Ph	H	H	H	8.48-7.11 (m, 10H); 4.00 (s, 3H); 3.88 (s, 3H); 3.72 (s, 3H).
5.03	3-Cl-benzil-oxi	H	H	H	8.40 (s, 1H); 7.58 (s, 1H); 7.45-6.68 (m, 8H); 5.02 (s, 2H); 3.98 (s, 3H); 3.85 (s, 3H); 3.71 (s, 3H).
5.04	-O-(CH_2) $_2$ -Ph	H	H	H	8.40 (s, 1H); 7.58 (s, 1H); 7.32-6.61 (m, 9H); 3.95 (s, 3H); 3.85 (s, 3H); 3.70 (s, 3H).
5.05	2,5-(CH_3) $_2$ -Ph	H	H	H	8.40 (s, 1H); 7.60 (s, 1H); 7.48-7.00 (m, 7H); 3.98 (s, 3H); 3.85 (s, 3H); 3.75 (s, 3H); 2.35 (s, 3H); 2.25 (s, 3H).

5.06	3-C ₁ H ₅ -izoxazol-5-il	H	H	H	8.39 (s, 1H); 7.62-7.10 (m, 5H); 6.49 (s, 1H); 3.99 (s, 3H); 3.89 (s, 3H); 3.72 (s, 3H); 2.72 (q, 2H); 1.30 (t, 3H).
5.07	3-C ₄ H ₉ -izoxazol-5-il	H	H	H	8.39 (s, 1H); 7.62-7.10 (m, 5H); 6.45 (s, 1H); 4.00 (s, 3H); 3.89 (s, 3H); 3.72 (s, 3H); 3.70 (t, 2H); 2.75-2.25 (m, 4H); 0.95 (t, 3H).
5.08	2-CN-fenoxi	H	H	H	8.40 (s, 1H); 7.70-6.80 (m, 8H); 3.95 (s, 3H); 3.85 (s, 3H); 3.70 (s, 3H); 7.59 (s, 1H).
5.09	2-naphthyl-naftil	H	H	H	8.42 (s, 1H); 8.05-7.05 (s, 11H); 4.00 (s, 3H); 3.85 (s, 3H); 3.75 (s, 3H); 7.60 (s, 1H).
5.10	2-Ph-tiazol-4-il	H	H	H	8.40 (s, 1H); 8.05-7.05 (m, 10H); 3.95 (s, 3H); 3.90 (s, 5H); 3.75 (s, 3H); 7.60 (s, 1H).
5.11	-C(CH ₃)=N-3,4-Cl ₂ -benzil-oxi	H	H	H	8.39 (s, 1H); 7.50-7.01 (m, 7H); 5.18 (s, 2H); 3.98 (s, 3H); 3.85 (s, 3H); 3.71 (s, 3H); 2.25 (s, 3H); 7.59 (s, 1H).

5.12	-C(CH ₃)=N-3-Cl-benzyl-oxi	H	H	H	8.39 (s, 1H); 7.50-7.02 (m, 8H); 5.18 (s, 2H); 3.98 (s, 3H); 3.85 (s, 3H); 3.71 (s, 3H); 2.25 (s, 3H); 7.60 (s, 1H).
5.13	-C(CH ₃)=N-2-CH ₃ -benzyl-oxi	H	H	H	8.36 (s, 1H); 7.52-7.02 (m, 8H); 5.22 (s, 2H); 3.98 (s, 3H); 3.85 (s, 3H); 3.70 (s, 3H); 2.38 (s, 3H); 2.25 (s, 3H); 7.58 (s, 1H).
5.14	3-Cl-benzyl-oxi	H	H	H	8.40 (s, 1H); 7.45-6.68 (m, 8H); 5.02 (s, 2H); 3.95 (s, 3H); 3.85 (s, 3H); 3.70 (s, 3H); 7.58 (s, 1H).
5.15	-C(CH ₃)=N-OCH ₃	H	H	H	
5.16	-C(CH ₃)=N-OCH ₃	H	H	CH ₃	
5.17	-C(CH ₃)=N-O-C ₃ H ₇ -i	H	H	H	
5.18	-C(CH ₃)=N-O-C ₃ H ₇ -i	H	H	CH ₃	
5.19	-C(CH ₃)=N-O-C ₄ H ₉ -n	H	H	H	
5.20	-C(CH ₃)=N-O-C ₄ H ₉ -n	H	H	CH ₃	
5.21	-C(CH ₃)=N-3-CF ₃ -benzyl-oxi	H	H	H	

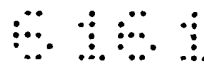
5.22	-C(CH ₃)=N-3-CF ₃ -benzil-oxi	H	H	CH ₃	
5.23	-C(CH ₃)=N-O-CH(CH ₃)-3-CF ₃ -Ph	H	H	H	
5.24	-C(CH ₃)=N-O-CH(CH ₃)-3-CF ₃ -Ph	H	H	CH ₃	
5.25	-C(CH ₃)=N-O-(CH ₂) ₂ -Ph	H	H	H	
5.26	-C(CH ₃)=N-O-(CH ₂) ₂ -Ph	H	H	CH ₃	
5.27	-C(CH ₃)=N-O-(CH ₂) ₂ -4-Cl-Ph	H	H	H	
5.28	-C(CH ₃)=N-O-(CH ₂) ₂ -4-Cl-Ph	H	H	CH ₃	
5.29	3-Ph-5-CH ₃ -pirazol-1-il	H	H	H	
5.30	3-Ph-5-CH ₃ -pirazol-1-il	H	H	CH ₃	
5.31	3-Ph-1-CH ₃ -pirazol-5-il	H	H	H	
5.32	3-Ph-1-CH ₃ -pirazol-5-il	H	H	CH ₃	
5.33	3-CH ₃ -izoxazol-5-il	H	H	CH ₃	
5.34	3-CF ₃ -izoxazol-5-il	H	H	H	8.40 (s, 1H); 7.70-7.20 (m, 4H); 6.98 (s, 1H); 6.75 (s, 1H); 4.02 (s, 3H); 3.92 (s, 3H); 3.74 (s, 3H).

5.35	3-CF ₃ -izoxazol-5-il	H	H	CH ₃	
5.36	3-Ph-izoxazol-5-il	H	H	CH ₃	
5.37	5-Ph-oxazol-2-il	H	H	CH ₃	
5.38	C ₃ H ₇ -i	H	H	CH ₃	
5.39	CF ₃	H	H	CH ₃	
5.40	C ₄ H ₉ -n	H	H	CH ₃	
5.41	C ₄ H ₉ -i	H	CH ₃	CH ₃	
5.42	fenoxi	H	H	CH ₃	
5.43	2-CH ₃ -fenoxi	H	H	CH ₃	
5.44	2-CN-fenoxi	H	H	CH ₃	
5.45	2-Cl-fenoxi	H	H	CH ₃	
5.46	2-CH ₃ -benzil-oxi	H	H	CH ₃	
5.47	2-Cl-benzil-oxi	H	H	CH ₃	
5.48	3-Cl-benzil-oxi	H	H	CH ₃	

5.49	3-CF ₃ -benzyl-oxi	H	H	CH ₃	
5.50	-O-CH(CH ₃)-3-CF ₃ -Ph	H	H	CH ₃	
5.51	-O-(CH ₂) ₂ -Ph	H	H	CH ₃	
5.52	-O-CH ₂ -CH=CH-Ph	H	H	CH ₃	
5.53	-O-(CH ₂) ₃ -Ph	H	H	CH ₃	
5.54	-O-(CH ₂) ₂ -O-C ₂ H ₅	H	H	CH ₃	
5.55	-O-(CH ₂) ₂ -O-Ph	H	H	CH ₃	
5.56	Ph	H	H	CH ₃	
5.57	-C(CH ₃)=N-NH-6-Cl-2-piridil	H	H	CH ₃	
5.58	-C(CH ₃)=N-O-6-Cl-2-piridil	H	H	CH ₃	
5.59	-C(CH ₃)=N-O-6-Br-2-piridil	H	H	CH ₃	
5.60	-C(CH ₃)=N-NH-4,6-(CH ₃) ₂ -2-pirimidinil	H	H	CH ₃	

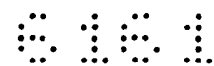
6. táblázat: (I) általános képletű vegyületek ($R^1 = OCH_3$; $X = N$; $Y = OCH_3$)

A ve- gyület sorszám	R^2	R^1	R'	R_s	Fizikai adatok vagy 1H -NMR
6.01	2- CH_2 -benzil-oxi	H	H	H	8.45 (s, 1H); 7.60-6.65 (m, 8H); 5.02 (s, 2H); 4.12 (s, 3H); 4.00 (s, 3H); 3.85 (s, 3H); 2.35 (s, 3H).
6.02	2-Ph-tiazol-4-il	H	H	H	8.41 (s, 1H); 8.05-7.05 (m, 10H); 4.12 and 4.05 (2s, 3H); 3.99 and 3.95 (2s, 3H); 3.85 and 3.40 (2s, 3H).
6.03	- $C(CH_3)=N$ -2- CH_2 -benzil-oxi	H	H	H	8.40 (s, 1H); 7.55-7.03 (m, 9H); 5.25 (s, 2H); 4.10 (s, 3H); 4.05 (s, 3H); 3.80 (s, 3H).
6.04	- $C(CH_3)=N$ -3-Cl-benzil-oxi	H	H	H	8.38 (s, 1H); 7.55-7.02 (m, 8H); 5.18 (s, 2H); 4.08 (s, 3H); 4.02 (s, 3H); 3.80 (s, 3H); 2.25 (s, 3H).
6.05	3-Ph-izoxazol-5-il	H	H	CH_3	
6.06	3-Ph-1- CH_3 -pirazol-5-il	H	H	CH_3	



6.07	-C(CH ₃)=N-3,4-Cl ₂ -benzil-oxi	H	H	H	8.38 (s, 1H); 7.55-7.05 (m, 7H); 5.15 (s, 2H); 4.08 (s, 3H); 4.04 (s, 3H); 3.81 (s, 3H); 2.24 (s, 3H).
6.08	2-Ph-tiazol-4-il	H	H	H	
6.09	2,5-(CH ₃) ₂ -Ph	H	H	H	8.40 (s, 1H); 7.50-7.00 (m, 7H); 4.09 (s, 3H); 4.05 (s, 3H); 3.81 (s, 3H); 3.32 (s, 3H); 3.24 (s, 3H).
6.10	2-Ph-tiazol-4-il	H	H	CH ₃	
6.11	3-C ₄ H ₉ -n-izoxazol-5-il	H	H	H	8.39 (s, 1H); 7.70-7.12 (m, 5H); 6.39 (s, 1H); 4.10 (s, 3H); 4.05 (s, 3H); 3.45 (s, 3H); 2.70 (t, 2H); 1.85-1.20 (m, 4H); 0.95 (t, 3H).
6.12	2-Ph-oxazol-2-il	H	H	CH ₃	
6.13	3-C ₂ H ₅ -izoxazol-5-il	H	H	H	8.40 (s, 1H); 7.69-7.12 (m, 4H); 6.40 (s, 1H); 4.10 (s, 1H); 4.04 (s, 3H); 2.75 (q, 2H); 1.30 (t, 3H).
6.14	3-C ₃ H ₇ -n-izoxazol-5-il	H	H	H	8.40 (s, 1H); 7.62-7.11 (m, 4H); 6.38 (s, 1H); 4.00 (s, 3H); 3.90 (s, 3H); 3.74 (s, 3H); 2.60 (t, 2H); 1.72 (q, 2H); 1.00 (t, 3H).

6.15	-C(CH ₃)=N-OC(H) ₃	H	H	H	
6.16	-C(CH ₃)=N-OCH ₃	H	H	CH ₃	7.52-7.04 (m, 4H); 4.06 (s, 3H); 3.99 (s, 3H); 3.80 (s, 3H); 2.40 (s, 3H); 2.20 (s, 3H).
6.17	-C(CH ₃)=N-OC ₂ H ₅	H	H	H	
6.18	-C(CH ₃)=N-OC ₂ H ₅	H	H	CH ₃	
6.19	-C(CH ₃)=N-3-Cl-benziloxi	H	H	CH ₃	
6.20	Ph	H	H	CH ₃	
6.21	CF ₃	H	H	H	
6.22	CF ₃	H	H	CH ₃	
6.23	C ₃ H ₇ -i	H	CH ₃	CH ₃	
6.24	2-CH ₃ -fenoxi	H	H	CH ₃	
6.25	2-CN -fenoxi	H	H	H	
6.26	2-CN -fenoxi	H	H	CH ₃	



6.27	2-CH ₃ -benzil-oxi	H	H	CH ₃	8.48 (s, 1H); 7.92-6.68 (m, 8H); 5.02 (s, 2H); 4.15 (s, 3H); 4.04 (s, 3H); 3.92 (s, 3H); 2.38 (s, 3H).
6.28	3-CF ₃ -benzil-oxi	H	H	CH ₃	
6.29	-O-(CH ₂) ₂ -Ph	H	H	H	
6.30	-O-(CH ₂) ₂ -Ph	H	H	CH ₃	
6.31	3-CF ₃ -i zoxazol-5-il	H	H	H	
6.32	3-CF ₃ -i zoxazol-5-il	H	H	CH ₃	
6.33	-C(CH ₃)=N-NH-6-Cl-2-piridil	H	H	H	
6.34	-C(CH ₃)=N-NH-6-Cl-2-piridil	H	H	CH ₃	
6.35	-C(CH ₃)=N-O-6-Cl-2-piridil	H	H	H	
6.36	-C(CH ₃)=N-O-6-Cl-2-piridil	H	H	CH ₃	
6.37	-C(CH ₃)=N-O-6-Br-2-piridil	H	H	H	
6.38	-C(CH ₃)=N-NH-4,6-(CH ₃) ₂ -2-pirimidinil	H	H	CH ₃	

A vegyületek biológiai aktivitását az alábbi példák szerint határozzuk meg.

A példa

Porüszög elleni aktivitás

Sphaerotheca fuliginea:

Hétnapos (sziklevél-stádiumú) *Cucumis sativus* (uborka) növényeket 100 mg/l hatóanyagot tartalmazó szuszpenzióval bepermetezünk olyan mértékben, hogy a szuszpenzió majdnem lefolyik a növények szárán, majd a lerakódott szuszpenziót száradni hagyjuk. Egy nappal később a kezelt növényeket beoltjuk *Sphaerotheca fuliginea* frissen gyűjtött konídiumaiból milliliterenként 1×10^5 darabot tartalmazó spóraszuszpenzióval, majd a növényeket melegházban 7 napon át inkubáljuk 24 °C hőmérsékleten, 60 % relatív nedvességtartalom mellett.

A kísérleti vegyületek hatékonyságát olyan módon határozzuk meg, hogy a gomba általi megtámadottság mértékét összehasonlítjuk hasonló módon inokulált, de hatóanyaggal nem kezelt kontrollnövények állapotával. Ebben a kísérletben az 1.03., 1.04., 1.11., 1.40., 2.04., 2.06., 3.02., 3.03., 3.04., 3.05., 3.06. és 3.13. sorszámú vegyületek 90 %-nál nagyobb hatékonyságot mutattak.

Hasonló módszereket használtunk a vegyületek kipróbálására az alábbi kártevők ellen:

Podosphaera leucotricha almán,

Erysiphe graminis búzán és árpán (száraz inokulálás),

Uncinula necator szőlőn.

B példa

Aktivitás rozsdával, himlővel, *Pyrenophora*-val és *Leptosphaeria*-val szemben

Uromyces appendiculatus:

14-napos (kétleveles állapotú) *Phaseolus vulgaris* (bab) növényeket literenként 100 ml hatóanyagot tartalmazó szuszpenzióval bepermetezünk lecsurgáshoz közeli állapotig. A lerakódott szuszpenziót ezután száradni hagyjuk, majd egy nap elteltével a kezelt növényeket *Uromyces appendiculatus* frissen gyűjtött spóráiból milliliterenként 1×10^5 darabot tartalmazó spóraszuszpenzióval inokuláljuk. Ezután 3 napon át inkubáljuk a növényeket $+23\text{ }^{\circ}\text{C}$ hőmérsékleten, magas nedvességtartalmú helyiségben, 95 %-nál nagyobb relatív nedvességtartalom mellett, majd 10 napon át $+24\text{ }^{\circ}\text{C}$ hőmérsékleten és 60 % relatív nedvességtartalom mellett.

A vegyületek hatékonyságát úgy határozzuk meg, hogy a gomba általi megtámadottság mértékét összehasonlítjuk a hasonló módon inokulált, de hatóanyaggal nem kezelt kontroll-növények megtámadottságának mértékével. Ebben a kísérletben az 1.3., 1.11., valamint az 1.40., 2.04., 2.06., 3.01., 3.02., 3.03., 3.04., 3.05., 3.06., 3.12., 3.13., 4.09. és 4.10. sorszámú vegyületek mutattak legalább 90 %-os hatékonyságot.

Hasonló módszereket használtunk a vegyületek kipróbálására az alábbi kártevők ellen:

Puccinia triticina búzán (tíznapos növények),
Pyrenophora graminea árpán,

Leptosphaeria nodorum búzán,
Venturia inaequalis almán (21-napos növények; a spóraszuszpenzió 1 % malátát is tartalmaz).

C példa

Downy Mildew elleni hatékonyság

Hat levéllel bíró *Lycopersicon esculentum* (paradicsom) növényeket literenként 500 mg hatóanyagot tartalmazó permetező szuszpenzióval közel lecsurgásig bepermetezünk, majd a szuszpenzió fennmaradó részét száradni hagyjuk. Egy nappal később a kezelt növényeket *Phytophthora infestans* összegyűjtött sporangiumaiból milliliterenként 1x10,5 darabot tartalmazó spóraszuszpenzióval inokuláljuk, majd 18 °C hőmérsékleten 95 %-nál nagyobb relatív nedvességtartalmú helyiségben 7 napon át inkubáljuk. A kísérleti vegyületek hatékonyságát olyan módon határozzuk meg, hogy a gomba általi megtámadottság mértékét összehasonlítjuk hasonló módon inokulált, de hatóanyaggal nem kezelt kontrollnövények megtámadottságának mértékével. Ebben a kísérletben az 1.40. és a 3.08. sorszámú vegyületek 90 %-nál nagyobb hatékonyságot mutattak.

Hasonló módszert használtunk a vegyületek kipróbálására *Plasmopara viticola* ellen szőlőn.

D példa

Hatékonyság magkezelés után

A találmány szerinti vegyületeket magok kezelésére is

fel lehet használni. A kedvező fungicid hatékonyságot *in vitro* kísérletekben az alábbi kórokozókkal szemben állapítottuk meg:

Pyrenophora graminea,
Ustilago nuda,
Gerlachia nivalis,
Leptosphaeria nodorum.

Autoklávban kezelt búzamagokat a patogének spóráival vagy micéliumával inokulálunk, majd a magokat a kísérleti vegyületek különböző koncentrációival vonjuk be olyan módon, hogy 100 kg magra 50 g hatóanyag jusson. Ezután a kezelt magokat agarlemezekre helyezzük, és a patogéneket 3-8 napon át hagyjuk fejlődni sötétben 24 °C hőmérsékleten.

A kísérleti vegyületek hatékonyságát olyan módon határozzuk meg, hogy a kezelt és a kezeletlen inokulált magokon összehasonlítjuk a gomba növekedésének mértékét.

Annak meghatározására, hogy a növények milyen mértékben tűrik a vegyületeket, búza és árpa egészséges magvait bevonjuk a kísérleti vegyületek fentebb említett dózisaival. Ezután a magvakat csírázni hagyjuk Petri-csészékben nedves szűrőpapíron 10 napon át 18 °C hőmérsékleten, magas nedveségtartalmú térben. Feljegyezzük a növények károsodását, összehasonlítva a kezelt és a kezeletlen magoncok növekedésének mértékét.

Ebben a kísérletben az 1.41. sorszámú vegyület legalább 90 %-os hatékonyságot mutatott *Pyrenophora graminea*-val szemben.

Szabadalmi igénypontok

1. (I) általános képletű 2-(4-fenoxi-pirimidin-5-il)-
-akrilsav-származékok - ahol a képletben

- R¹ jelentése C₁₋₄ alkoxicsoport vagy -NR⁸R⁹ általános képletű csoport,
- R² jelentése C₁₋₄ alkil-, C₁₋₄ haloalkil-, aril-, ariloxi-, C₃₋₅ alkenil-oxi-, C₃₋₅ alkinil-oxi-, halogén-, aril-C₁₋₄ alkoxi-, aril-oxi-C₁₋₄ alkil-, aril-oxi-C₁₋₄ alkoxi-, aril-C₃₋₅ alkenil-oxi-, heteroaril-, heteroaril-oxi-, C₁₋₄ alkoxi-, C₂₋₅ alkenil-, C₂₋₅ alkinil- vagy C₁₋₄ alkoxi-karbonil-csoport, -CONR¹⁰R¹¹, -O-CONR¹⁰R¹¹, -CR⁷=N-NR⁶R¹², -CR⁷=N-O-R⁶ vagy (a) általános képletű csoport,
- R³ jelentése hidrogén- vagy halogénatom vagy C₁₋₄ alkil-, C₁₋₄ alkoxi-, ciano- vagy nitrocsoport,
- R⁴ jelentése hidrogénatom, halogénatom, C₁₋₄ alkoxi- vagy C₁₋₄ alkilcsoport,
- R⁵ jelentése hidrogénatom vagy metilcsoport,
- R⁶ jelentése C₁₋₁₂ alkil-, C₃₋₁₂ alkenil-, C₃₋₁₂ alkinil-, aril-C₁₋₄ alkil-, aril- vagy heteroarilcsoport,
- R⁷ jelentése hidrogénatom vagy metilcsoport,
- R⁸ és R⁹ jelentése egymástól függetlenül C₁₋₄ alkilcsoport, vagy pedig jelentésük együtt C₃₋₆ alkiléncsoport,
- R¹⁰ és R¹¹ jelentése egymástól függetlenül C₁₋₄ alkilcsoport, vagy pedig együtt C₃₋₆ alkiléncsoportot vagy olyan C₃₋₆ alkiléncsoportot jelentenek, amely oxigén- vagy kénatommal van megszakítva,

R_{12} jelentése hidrogénatom vagy metilcsoport,

E jelentése C_{1-3} alkiléncsoport,

X jelentése CH vagy nitrogénatom és

Y jelentése OCH_3 , NH_2 , $NHCH_3$ vagy $N(CH_3)_2$ csoport.

2. Az 1. igénypont szerinti vegyületek, ahol R^1 jelentése metoxicsoport vagy dimetil-amino-csoport, míg a többi szubsztituens jelentése az 1. igénypontban adott meghatározás szerinti.

3. Az 1. igénypont szerinti vegyületek, ahol R^2 jelentése fenilcsoport, fenoxicsoport, C_{1-4} alkilcsoport, $-C(CH_3)=N-O-R^6$ csoport vagy trifluor-metil-csoport, vagy tiazolil- vagy izoxazolil-csoport, amely két utóbbi csoport adott esetben szubsztituálva lehet fenilcsoporttal, C_{1-4} alkilcsoporttal vagy trifluor-metil-csoporttal, ahol R^6 jelentése C_{1-6} alkilcsoport vagy allilcsoport vagy benzil- vagy 2-fenil-etil-csoport, ahol a két utóbbi csoport fenilgyűrűje adott esetben szubsztituálva lehet C_{1-4} alkilcsoporttal, C_{1-4} alkoxicsoporttal, halogénatommal vagy trifluor-metil-csoporttal, és a többi szubsztituens jelentése az 1. igénypontban adott meghatározás szerinti.

4. Az 1. igénypont szerinti vegyületek, ahol R^3 jelentése hidrogénatom, míg a többi szubsztituens jelentése az 1. igénypontban adott meghatározás szerinti.

5. Az 1. igénypont szerinti vegyületek, ahol R^4 jelentése hidrogénatom vagy metilcsoport, míg a többi szubsztituens jelentése az 1. igénypontban adott meghatározás szerinti.

6. Az 1. igénypont szerinti vegyületek, ahol R^5 jelentése hidrogénatom vagy metilcsoport, míg a többi szubsztituens jelentése az 1. igénypontban adott meghatározás szerinti.

7. Az 1. igénypont szerinti vegyületek, ahol R^1 jelentése metoxicsoport vagy dimetil-amino-csoport, R^2 jelentése fenilcsoport, fenoxicsoport, C_{1-4} alkilcsoport, $-C(CH_3)=N-O-R^6$ csoport vagy trifluor-metil-csoport, vagy tiazolil vagy izoxazolil-csoport, ahol a két utóbbi szubsztituens adott esetben szubsztituálva lehet fenilcsoporttal, C_{1-4} alkilcsoporttal, halogénatommal vagy trifluor-metil-csoporttal, R^3 jelentése hidrogénatom, R^4 jelentése hidrogénatom vagy metilcsoport és R^5 jelentése hidrogén vagy metilcsoport, R^6 jelentése C_{1-6} alkilcsoport vagy allilcsoport vagy benzil- vagy 2-feniletal-csoport, ahol a két utóbbi szubsztituens fenilgyűrűje adott esetben szubsztituálva lehet C_{1-4} alkilcsoporttal, C_{1-4} alkoxicsoporttal, halogénatommal vagy trifluor-metil-csoporttal.

8. Az 1. igénypont szerinti alábbi vegyületek:

metil- α -[4-(3-metil-5-izopropil-fenoxi)-6-metoxi-pirimidin-5-il]- β -metoxi-akrilát;

metil- α -[4-(3-terc-butil-fenoxi)-6-metoxi-pirimidin-5-il]- β -metoxi-akrilát;

metil- α -[4-(3-terc-butil-fenoxi)-6-dimetil-amino-pirimidin-5-il]- β -metoxi-akrilát;

metil- α -[4-(3-izopropil-fenoxi)-6-metoxi-pirimidin-5-il]- β -metoxi-akrilát;

metil- α -[4-(3-trifluor-metil-fenoxi)-6-metoxi-pirimidin-5-

-il]- β -metoxi-akrilát;
metil- α -[4-(3-fenoxi-fenoxi)-6-metoxi-pirimidin-5-il]- β -met-
-oxi-akrilát;
metil-2-[4-(3-(1-(3-klór-benzil-oxi-imino)-etil)-fenoxi)-6-
-dimetil-amino-pirimidin-5-il]-2-metoxi-imino-acetát;
metil-2-[4-(3-(1-etoxi-imino)-etil)-fenoxi)-6-dimetil-amino-
-pirimidin-5-il]-2-metoxi-imino-acetát;
metil- α -[4-(3-(1-metoxi-imino)-etil)-fenoxi)-6-metoxi-2-me-
til-pirimidin-5-il]- β -metoxi-akrilát;
metil- α -[4-(3-trifluor-metil-fenoxi)-6-metoxi-2-metil-piri-
midin-5-il]- β -metoxi-akrilát;
metil-2-[4-(3-(1-etoxi-imino)-etil)-fenoxi)-6-dimetil-amino-
-2-metil-pirimidin-5-il]-2-metoxi-imino-acetát;
metil-2-[4-(3-(1-(2,5-dimetil-benzil-oxi-imino)-etil)-fen-
oxi)-6-dimetil-amino-pirimidin-5-il]-2-metoxi-imino-ace-
tát;
metil-2-[4-(3-(1-(3-klór-benzil-oxi-imino)-etil)-fenoxi)-6-
-dimetil-amino-2-metil-pirimidin-5-il]-2-metoxi-imino-ace-
tát;
metil-2-[4-(3-(1-(2,5-dimetil-benzil-oxi-imino)-etil)-fen-
oxi)-6-dimetil-amino-2-metil-pirimidin-5-il]-2-metoxi-imino-
no-acetát;
metil-2-[4-(3-(1-(2,5-diklór-benzil-oxi-imino)-etil)-fen-
oxi)-6-dimetil-amino-2-metil-pirimidin-5-il]-2-metoxi-imino-
no-acetát;
metil- α -[4-(3-(1-(2,5-dimetil-benzil-oxi-imino)-etil)-fen-
oxi)-6-metoxi-2-metil-pirimidin-5-il]- β -metoxi-akrilát;
metil- α -[4-(3-(1-(3-klór-benzil-oxi-imino)-etil)-fenoxi)-6-

-metoxi-2-metil-pirimidin-5-il]- β -metoxi-akrilát;
 metil- α -[4-(3-(1-(2,5-dimetil-benzil-oxi-imino)-etil)-fen-
 oxi)-6-metoxi-pirimidin-5-il]- β -metoxi-akrilát;
 metil-2-[4-(3-(1-(3-klór-benzil-oxi-imino)-etil)-fenoxi)-6-
 -metoxi-pirimidin-5-il]-2-metoxi-imino-acetát;
 metil-2-[4-(3-(3-trifluor-metil-izoxazol-5-il)-fenoxi)-6-di-
 metil-amino-pirimidin-5-il]-2-metoxi-imino-acetát;
 metil-2-[4-(3-fenil-fenoxi)-6-dimetil-amino-pirimidin-5-il]-
 -2-metoxi-imino-acetát;
 metil-2-[4-(5-metil-3-izopropil-fenoxi)-6-dimetil-amino-pi-
 rimidin-5-il]-2-metoxi-imino-acetát;
 metil-2-[4-(5-metil-3-izopropil-fenoxi)-6-dimetil-amino-2-
 -metil-pirimidin-5-il]-2-metoxi-imino-acetát;
 metil-2-[4-(3-(2-metil-benzil-oxi)-fenoxi)-6-dimetil-amino-
 -pirimidin-5-il]-2-metoxi-imino-acetát;
 metil-2-[4-(3-(2-metil-benzil-oxi)-fenoxi)-6-dimetil-amino-
 -2-metil-pirimidin-5-il]-2-metoxi-imino-acetát;
 metil-2-[4-(3-fenil-etoxi)-fenoxi)-6-dimetil-amino-pirimi-
 din-5-il]-2-metoxi-imino-acetát;
 metil-2-[4-(3-fenil-etoxi)-fenoxi)-6-dimetil-amino-2-metil-
 -pirimidin-5-il]-2-metoxi-imino-acetát;
 metil-2-[4-(3-(2-fenil-tiazol-4-il)-fenoxi)-6-dimetil-ami-
 no-pirimidin-5-il]-2-metoxi-imino-acetát;
 metil-2-[4-(3-(2-fenil-tiazol-4-il)-fenoxi)-6-dimetil-amino-
 -2-metil-pirimidin-5-il]-2-metoxi-imino-acetát;
 metil-2-[4-(3-(3-trifluor-metil-izoxazol-5-il)-fenoxi)-6-di-
 metil-amino-2-metil-pirimidin-5-il]-2-metoxi-imino-acetát;
 metil-2-[4-(3-fenil-fenoxi)-6-dimetil-amino-2-metil-pirimi-

din-5-il]-2-metoxi-imino-acetát;
 N-metil-2-[4-(3-fenil-fenoxi)-6-dimetil-amino-2-metil-pirimi-
 din-5-il]-2-metoxi-imino-acetamid;
 metil- α -[4-(3-fenil-fenoxi)-6-dimetil-amino-2-metil-pirimi-
 din-5-il]- β -metoxi-akrilát;
 metil- α -[4-(3-(3-trifluor-metil-izoxazol-5-il)-fenoxi)-6-
 -metoxi-pirimidin-5-il]- β -metoxi-akrilát;
 metil- α -[4-(3-(3-trifluor-metil-izoxazol-5-il)-fenoxi)-6-
 -metoxi-2-metil-pirimidin-5-il]- β -metoxi-akrilát;
 metil- α -[4-(5-metil-3-izopropil-fenoxi)-6-metoxi-2-metil-pi-
 rimidin-5-il]- β -metoxi-akrilát; és
 metil- α -[4-(3-(2-metil-fenoxi)-fenoxi)-6-metoxi-2-metil-pi-
 rimidin-5-il]- β -metoxi-akrilát.

9. Eljárás fitopatogén gombák irtására, azzal j e l l e m e z v e, hogy a gombákra vagy azok környezetére az 1. igénypont szerinti (I) általános képletű vegyület fungicid szempontból hatásos mennyiségét visszük fel.

10. Fungicid kompozíció, amely az 1. igénypont szerinti (I) általános képletű vegyületet mezőgazdaságilag elfogadható hígítószerrel együtt tartalmazza.

11. Eljárás az 1. igénypont szerinti (I) általános képletű vegyületek előállítására, azzal j e l l e m e z v e, hogy egy (II) általános képletű vegyületet - amely képletben R^1 , R^2 , R^3 , R^4 , R^5 és X jelentése a fenti - O-metilezünk, és ilyen módon (Ia) általános képletű vegyületeket kapunk, amely képletben X, R^1 , R^2 , R^3 , R^4 , R^5 és X jelentése a fenti, és adott esetben a (Ia) általános képletű vegyületeket NH_3 -mal, NH_2CH_3 -mal vagy $-NH(CH_3)_2$ -vel végzett

amidálási reakcióval (Ib) általános képletű vegyületekké alakítjuk, amely képletben R^1 , R^2 , R^3 , R^4 , R^5 és X jelentése a fenti, míg Y' jelentése NH_2 , $NHCH_3$ vagy $N(CH_3)_2$ képletű csoport.

12. (II) általános képletű vegyületek, ahol a képletben R^1 , R^2 , R^3 , R^4 , R^5 és X jelentése az 1. igénypontban adott meghatározás szerinti.

13. (III) általános képletű vegyületek, ahol a képletben R^1 , R^2 , R^3 , R^4 és R^5 jelentése az 1. igénypontban adott meghatározás szerinti.

14. (IVa) általános képletű vegyületek, ahol a képletben R^1 jelentése C_{1-4} alkoxics csoport, míg R^5 jelentése az 1. igénypontban adott meghatározás szerinti.

15. (IVb) általános képletű vegyületek, ahol a képletben R^2 , R^3 , R^4 és R^5 jelentése az 1. igénypontban adott meghatározás szerinti.

16. (VI) általános képletű vegyületek, ahol a képletben R^5 jelentése az 1. igénypontban adott meghatározás szerinti.

17. (VIII) általános képletű vegyületek, ahol R^5 jelentése az 1. igénypontban adott meghatározás szerinti.

18. (X) általános képletű vegyületek, ahol R^1 , R^3 , R^4 , R^5 és R^7 jelentése az 1. igénypontban adott meghatározás szerinti.

Góldal rajzok

1995. 05. 26

PK.

SANDOZ A.G. helyett

a meghatalmazott:

63/95

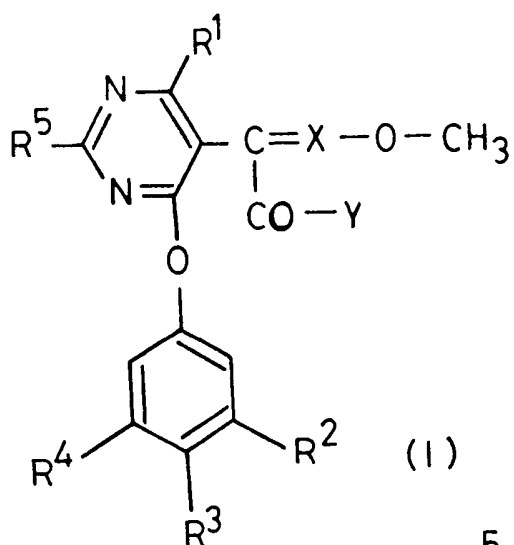
A

KÖZZÉTETELI
PÉLDÁNY

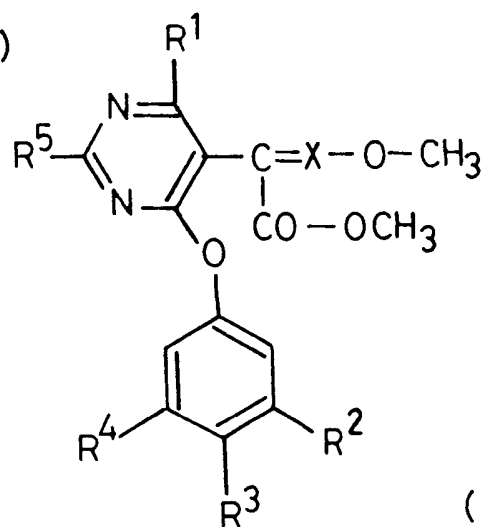
6181

9/1

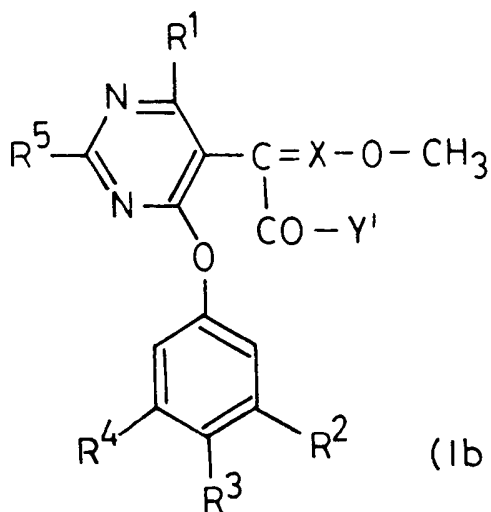
69054



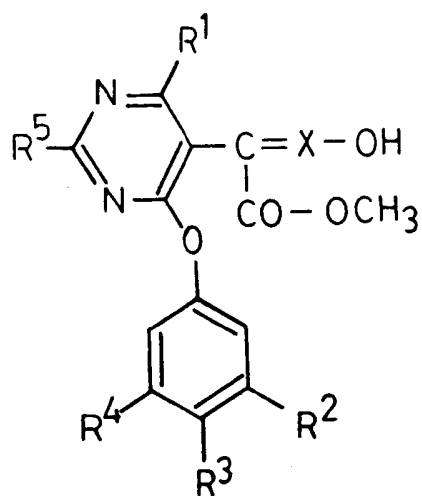
(I)



(Ia)

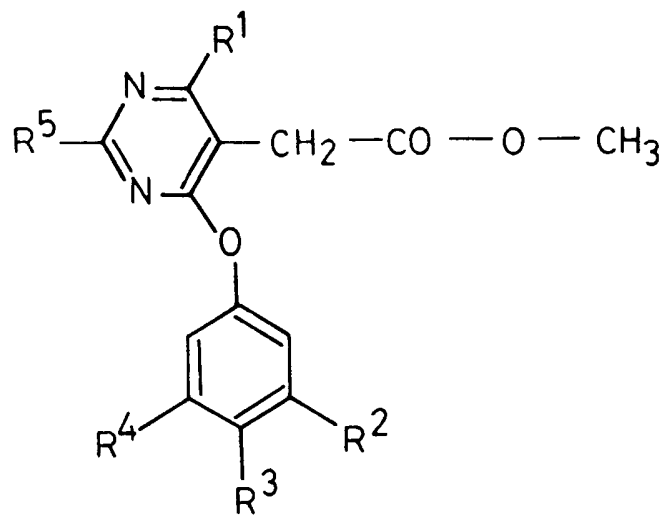


(Ib)

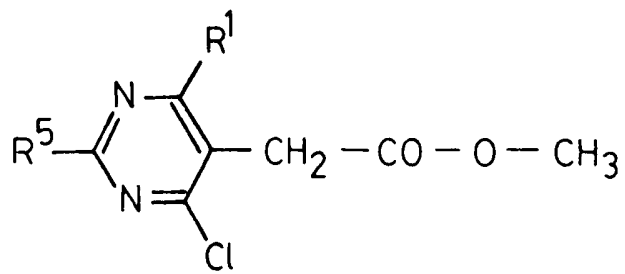


(II)

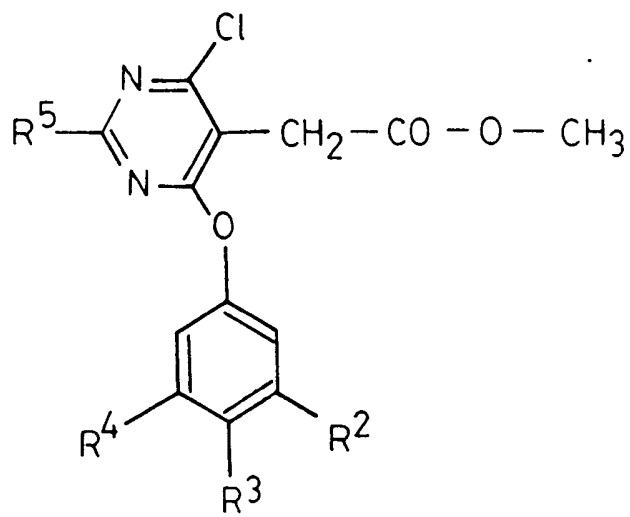
876



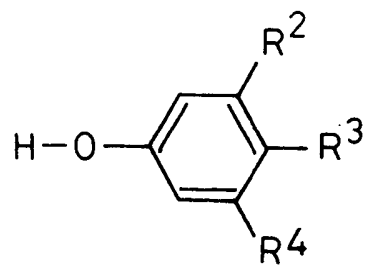
(III)



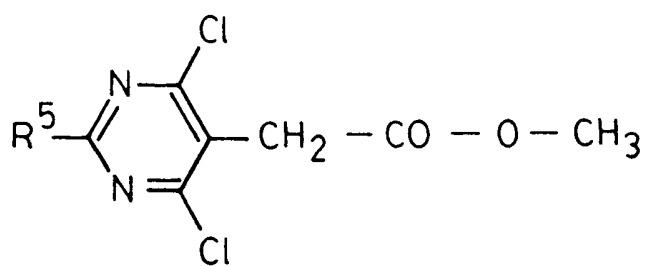
(IV a)



(IV b)



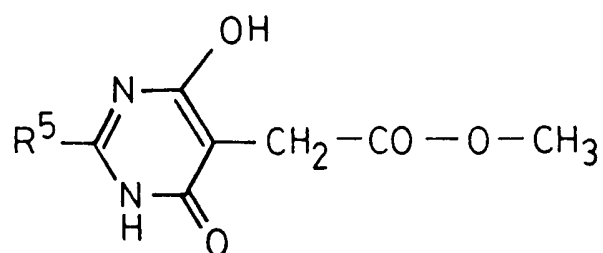
(V)



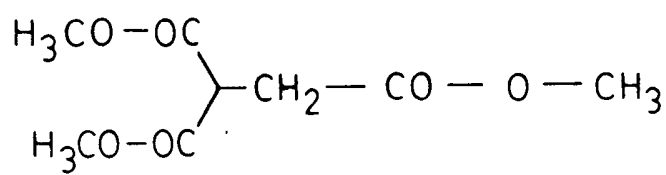
(VI)

 $\text{H} - \text{R}^1$

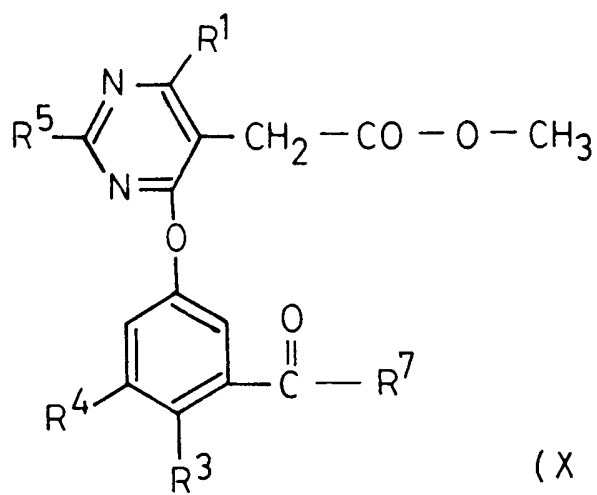
(VII)



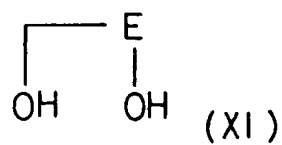
(VIII)



(IX)



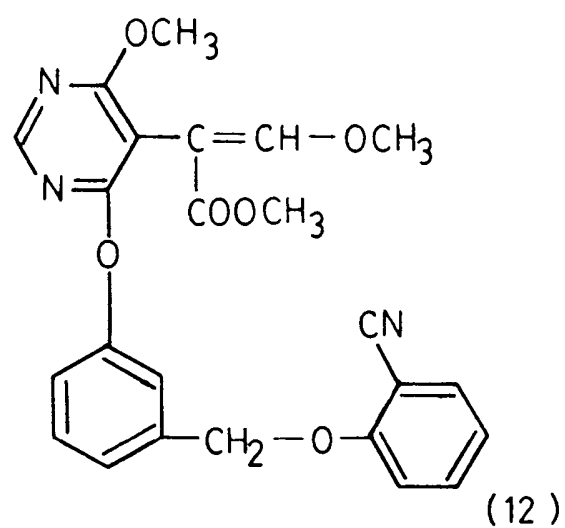
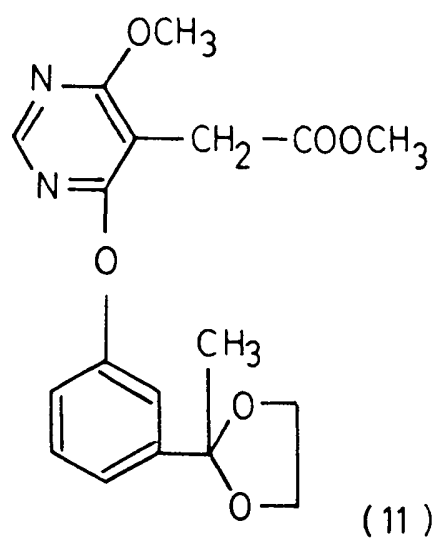
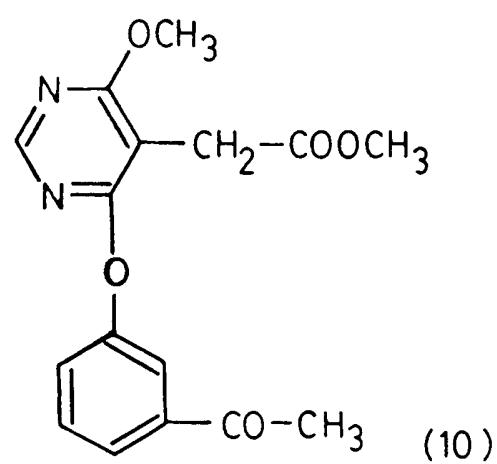
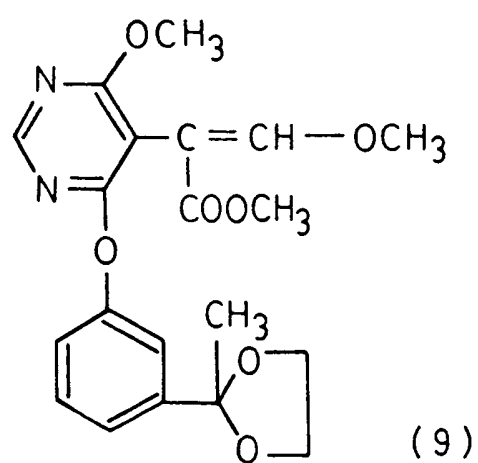
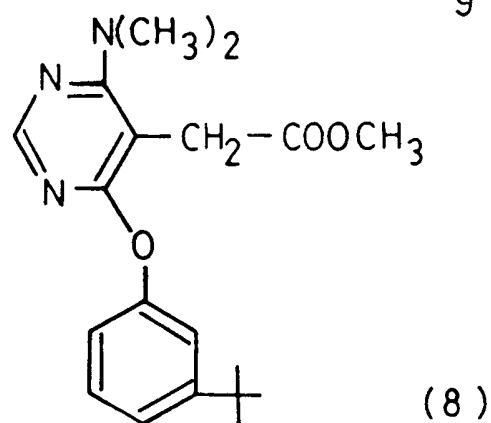
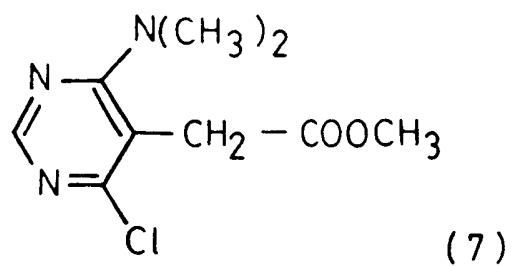
(X)

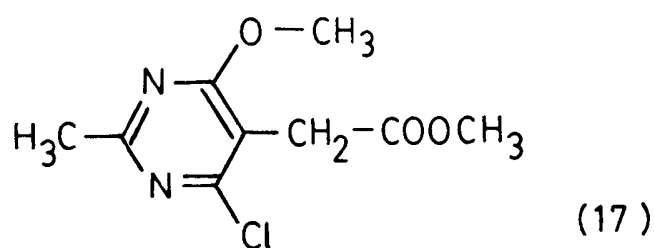
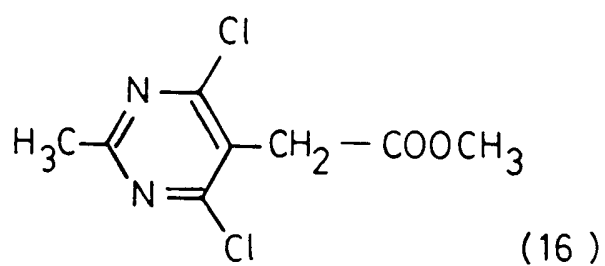
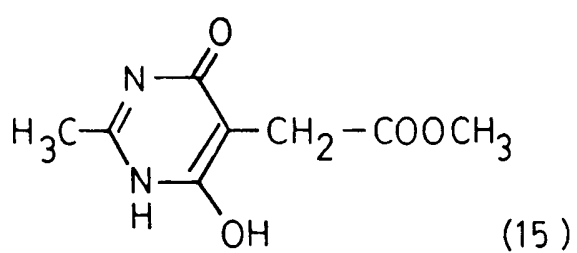
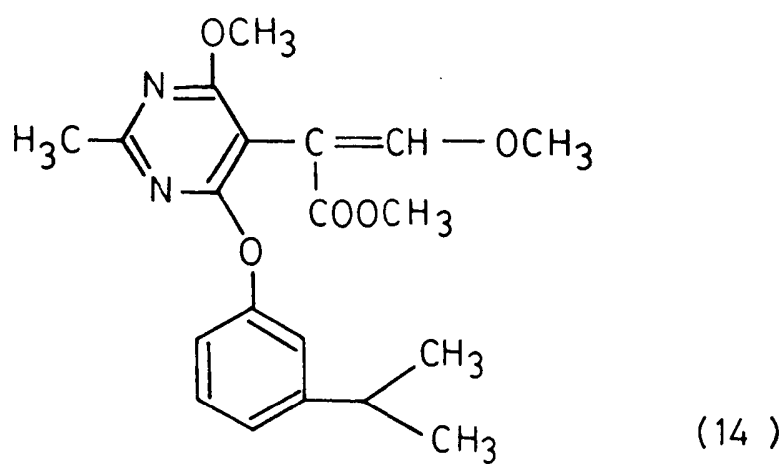
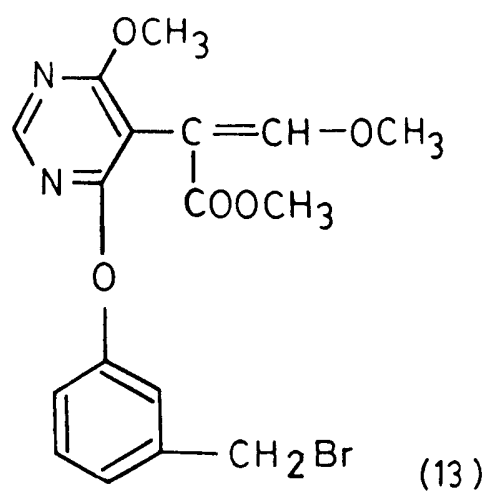


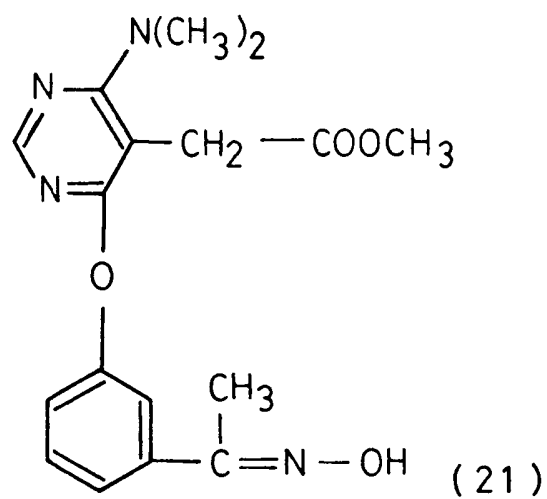
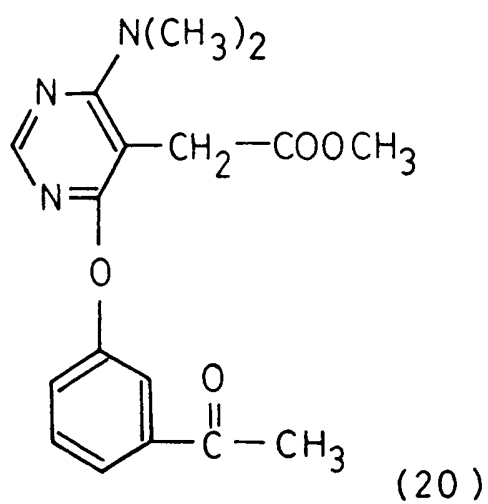
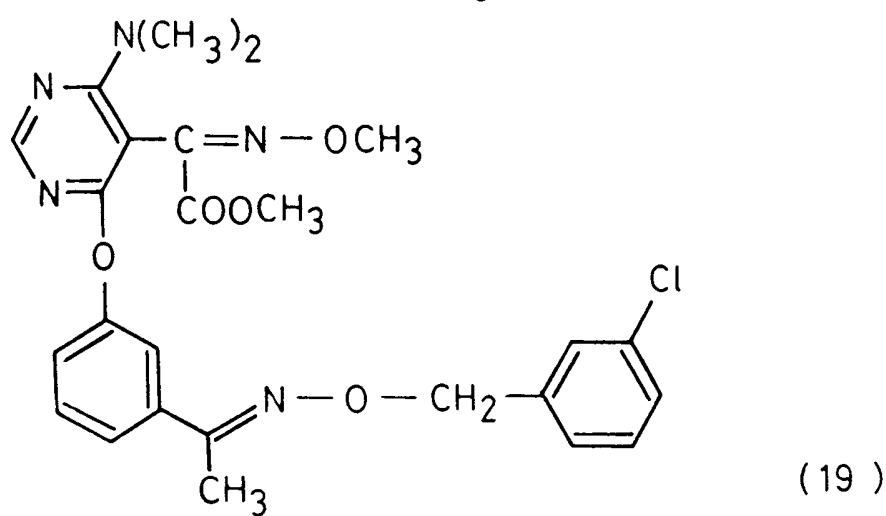
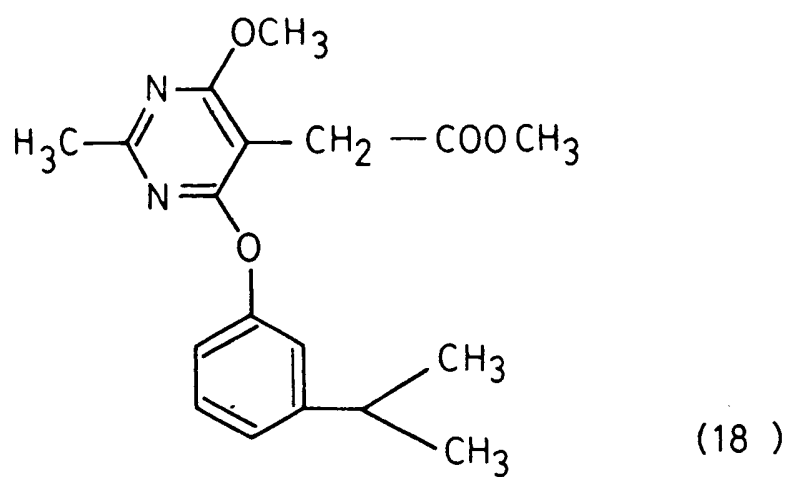
(XI)

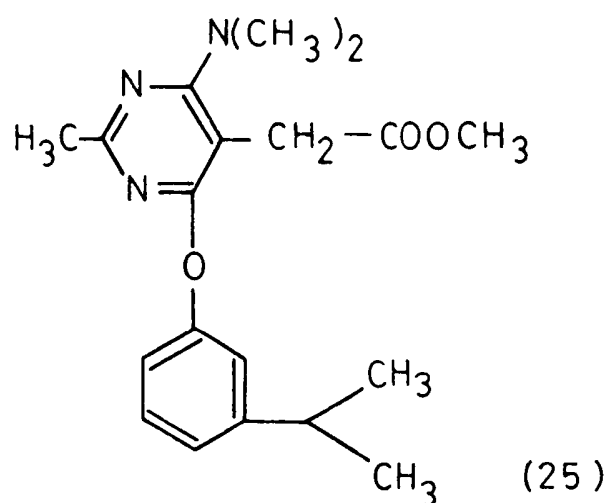
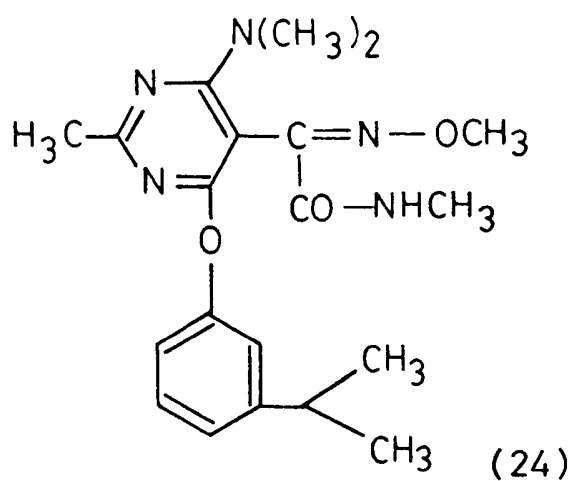
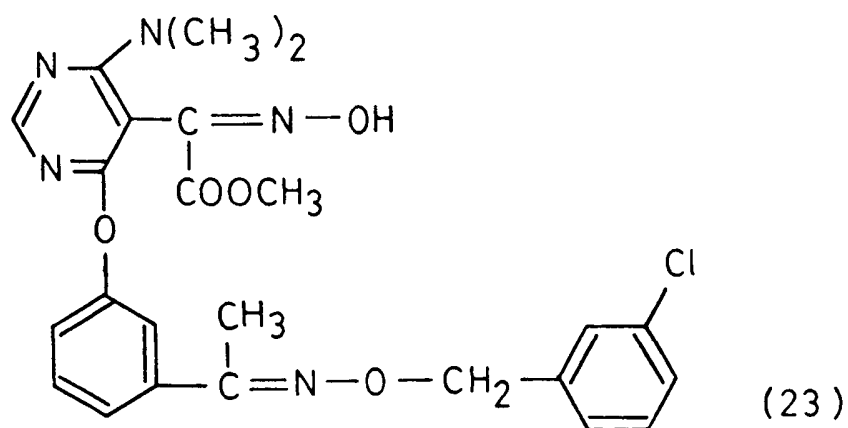
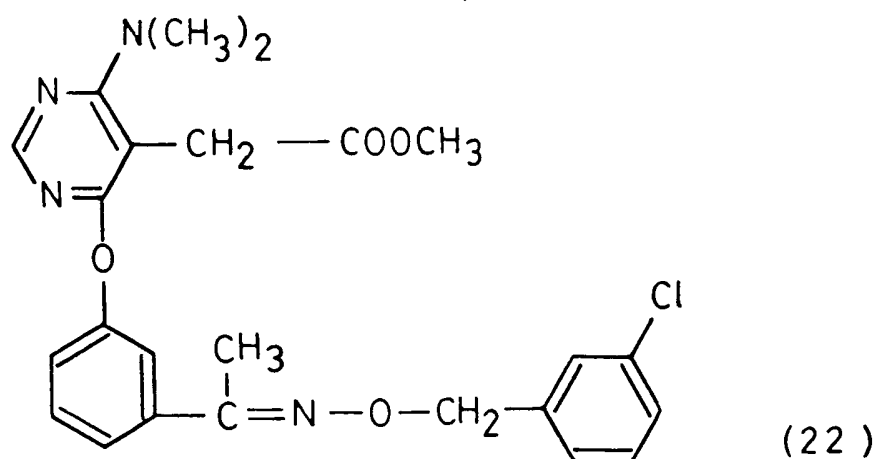
 $\text{H}_2\text{N} - \text{O} - \text{R}^6$

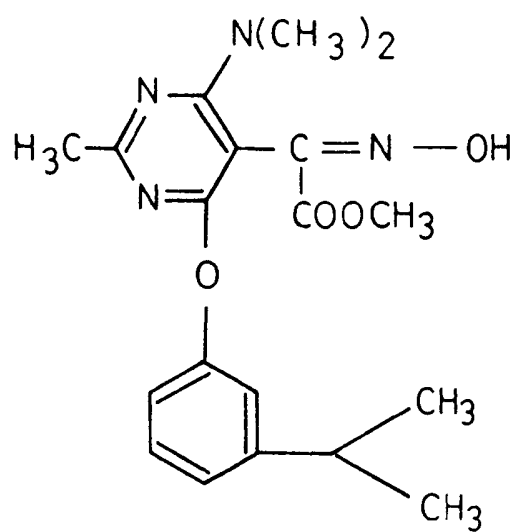
(XII)



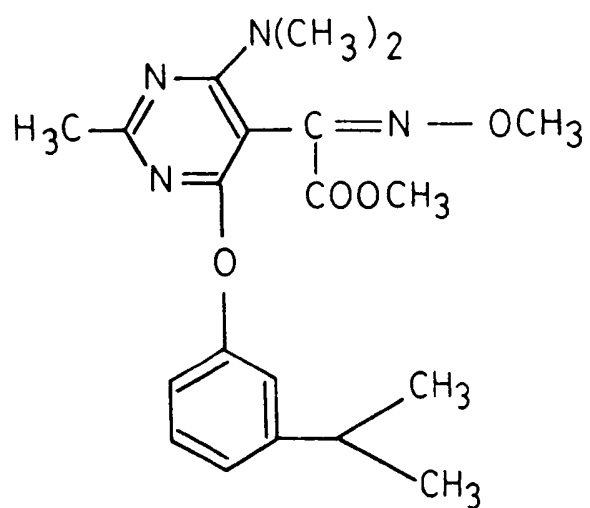




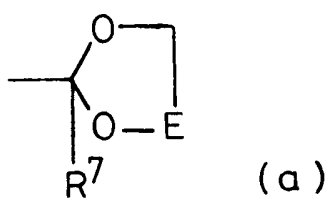




(26)



(27)



(a)