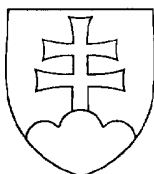


SLOVENSKÁ REPUBLIKA

(19) SK



ÚRAD
PRIEMYSELNÉHO
VLASTNÍCTVA
SLOVENSKEJ REPUBLIKY

PATENTOVÝ SPIS

- (21) Číslo prihlášky: 1737-91
(22) Dátum podania: 06.06.91
(31) Číslo prioritnej prihlášky: 534 794, 633 592
(32) Dátum priority: 07.06.90, 21.12.90
(33) Krajina priority: US, US
(40) Dátum zverejnenia: 15.01.92
(45) Dátum zverejnenia udelenia vo Vestníku: 04.02.98
(86) Číslo PCT:

(11) Číslo dokumentu:

278 746

(13) Druh dokumentu: B6

(51) Int. Cl.⁶ :

C 07D 405/04
C 07D 239/52
C 07D 401/06
C 07D 403/04
C 07D 413/10
C 07D 491/04
A 01N 43/72

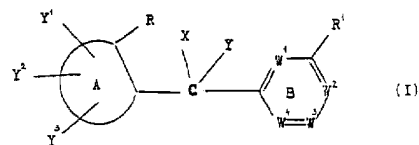
(73) Majiteľ patentu: NOVARTIS AG, Basel, CH;

(72) Pôvodca vynálezu: Anderson Richard James, Palo Alto, CA, US;
Cloudsdale Ian Stuart, Boulder Creek, CA, US;
Hokama Takeo, Sunnyvale, CA, US;

(54) Názov vynálezu: **Substituované ftalidy a heterocyklické ftalidy, spôsob ich výroby a ich použitie ako herbicídov**

(57) Anotácia:

Opisujú sa zlúčeniny vzorca (I), v ktorom A znamená fenyyl, naftyyl, pyridyl s prípadne anelovaným benzénovým kruhom, pyridyl-N-oxid alebo pyrazinyl-N-oxid, pyrimidinyl, pyrazinyl, 3- alebo 4-cinolinyl alebo 2-chinoxalínyl alebo 5-členný heteroaromatický zvyšok, R znamená CN, formyl, karboxy skupinu funkčne obmenenú karboxy skupinu a pod., pričom ďalšie substituenty sú bližšie špecifikované v opisnej časti. Ďalej sa opisuje spôsob výroby zlúčenín vzorca (I) a ich použitie ako herbicídov.



Oblasť techniky

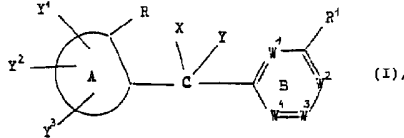
Predložený vynález sa týka substituovaných ftalidov a heterocyklických ftalidov a ich derivátov, spôsobu ich výroby, prostriedkov, ktoré obsahujú tieto zlúčeniny a ich použitie v poľnohospodárstve.

Doterajší stav techniky

Substituované deriváty benzylpyrimidínov a benzyltriazínov sú užitočné ako herbicidy. Typické herbicídne vlastnosti takýchto zlúčenín sú opísané v EP-A-0 410 590.

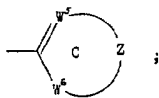
Podstata vynálezu

Nájdené boli substituované ftalidy a heterocyklické ftalidy všeobecného vzorca (I),



v ktorom kruhový systém A je zvolený zo súboru, ktorý je tvorený:

- fenylovou alebo naftylovou skupinou,
 - pyridylovou skupinou, ktorá môže byť nakondenzovaná stranou (b) alebo (c) na benzénový kruh,
 - pyridyl-N-oxidom alebo pyrazinyl-N-oxidom,
 - pyrimidinylovou skupinou,
 - pyrazinylovou skupinou,
 - 3- alebo 4-cinolinyllovou skupinou alebo 2-chinoxalinylovou skupinou, a
 - 5-členným heteroaromatickým kruhom, ktorý obsahuje ako heteroatóm či heteroatómy kyslík, síru alebo dusík a ktorý môže byť nakondenzovaný na benzénový kruh alebo môže obsahovať dusík ako ďalší heteroatóm;
- R znamená kyanoskupinu, formylovú skupinu, skupinu $CX^1X^2X^3$, skupinu tvoriacu ketón, karboxylovú skupinu, ktorá môže byť prítomná vo forme voľnej kyseliny alebo vo forme esteru alebo soli, tiokarboxylovú skupinu, ktorá môže byť prítomná vo forme voľnej kyseliny alebo vo forme esteru, karbamoylovú skupinu alebo mono- alebo disubstituovanú karbamoylovú skupinu, hydroxyalkylovú skupinu, hydroxybenzyllovú skupinu, skupinu $-CH=NOH$, $-CH=NO$ (nižšiu)alkylovú skupinu, skupinu $-CH_2-O-C(O)-$, ktorá spája susedné atómy uhlíka v kruhu A, alebo znamená kruh C

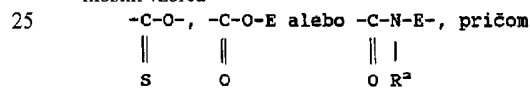


Y^1 , Y^2 a Y^3 sú viazané na atómy uhlíka a znamenajú nezávisle od seba atóm vodíka, atóm halogénu, hydroxy-skupinu, alkylovú skupinu, alkenylovú skupinu, alkinylovú skupinu, alkoxykupinu, alkenyloxyskupinu, alkinyloxyskupinu, alkylsulfonyloxyskupinu, dialkylsulfamoyloxyskupinu, alkylsulfonylovú skupinu, alkylsulfinylovú skupinu, dialkylkarbamoyloxyskupinu, alkyltioskupinu, alkenyltioskupinu alebo alkinyltioskupinu, pričom každá z týchto skupín môže byť substituovaná 1 až 6 atómami halogénu; dialkoxymetylovú skupinu, konjugo-

vanú alkoxykupinu, hydroxyalkylovú skupinu, karboxylovú skupinu, acylovú skupinu, acylalkylovú skupinu, acyloxyskupinu, acyloxyalkylovú skupinu, trialkylsilyloxyskupinu, trialkylsilylovú skupinu, kyanoskupinu, nitroskupinu, aminoskupinu alebo substituovanú aminoskupinu, aminosulfonylovú skupinu; cykloalkylovú skupinu, arylovú skupinu, aralkylovú skupinu, aralkenylovú skupinu, aralkinylovú skupinu, aryloxy-skupinu, aralkoxykupinu, arylsulfonylovú skupinu, arylsulfinylovú skupinu, aryltioskupinu alebo aralkyl-tioskupinu, pričom každá z týchto skupín môže byť substituovaná jedným až tromi substituentmi zvolenými zo súboru, ktorý je vytvorený atómom halogénu, alkylovou skupinou, halogénalkylovou skupinou, alkoxykupinou, halogénalkoxykupinou, nitroskupinou, kyanoskupinou, alkyltioskupinou, acylovou skupinou, aminoskupinou alebo substituovanou aminoskupinou; skupinu



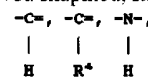
kde R^1 znamená vodík, nižšiu alkylovú skupinu alebo nižšiu alkoxykupinu; alebo Y^1 a R na susedných atómoch uhlíka tvoria spoločne mostík vzorca



E znamená priamu väzbu alebo znamená skupinu 1 až 3 spojených členov zvolených zo súboru tvoreného metylénovou skupinou, substituovanou metylénovou skupinou, skupinou



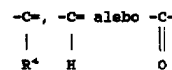
a kyslíkom; alebo Y^1 a Y^2 na susedných atómoch uhlíka tvoria spoločne 3- až 5-členný mostík pozostávajúci z prvkov zvolených zo súboru, ktorý je tvorený metylénovou skupinou, substituovanou metylénovou skupinou, skupinou



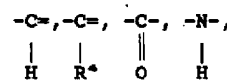
kyslíkom a



každý zo symbolov W^1 , W^2 , W^3 , W^4 a W^5 znamená nezávisle od seba skupinu CH, CR^2 alebo dusík; W^6 znamená skupinu NH, kyslík, síru, skupinu



Z znamená 2- alebo 3-členný mostík pozostávajúci z členov zvolených zo súboru, ktorý je tvorený metylénovou skupinou, substituovanou metylénovou skupinou, skupinou



-N=, kyslíkom a



R¹ a R³ znamenajú nezávisle od seba atóm vodíka, atóm halogénu, alkylovú skupinu, alkenylovú skupinu, alkinyllovú skupinu, alkoxykupinu, alkenyloxykupinu, alkinylloxykupinu, alkyltioskupinu, alkenyltioskupinu alebo alkinyltioskupinu, pričom každá z týchto skupín môže byť substituovaná 1 až 6 atómami halogénu; ďalej znamenajú cykloalkylovú skupinu, heterocykloalkoxykupinu, aryloxykupinu, aralkoxykupinu alebo aralkyltioskupinu, pričom každá z týchto skupín môže byť substituovaná 1 až 3 substituentmi zvolenými zo súboru, ktorý je tvorený atómom halogénu, alkylovou skupinou, halogénalkylovou skupinou, alkoxykupinou, halogénalkoxykupinou, nitroskupinou, kyanoskupinou, alkyltioskupinou, acylovou skupinou, aminoskupinou alebo substituovanú aminoskupinu; aminoxykupinu; substituovanú aminoxykupinu; iminoxykupinu; substituovanú iminoxykupinu; aminoskupinu; substituovanú aminoskupinu; amidoskupinu; substituovanú amidoskupinu; alkylsulfonyletylovú skupinu; kyanoskupinu; nitroskupinu; alebo skupinu



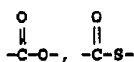
kde

Y₄ znamená vodík, nižšiu alkylovú skupinu, nižšiu alkoxykupinu, hydroxykupinu alebo prípadne substituovanú fenyllovú skupinu;

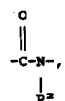
R⁴ má rovnaký význam ako Y¹ s výnimkou atómu vodíka;

X a Y znamenajú nezávisle od seba atóm vodíka, hydroxykupinu, halogén, kyanoskupinu, alkylovú skupinu, alkoxykupinu, alkoxykarbonylovú skupinu, alkoxykarbonyloxykupinu, hydroxyalkylovú skupinu, halogénalkylovú skupinu, acylovú skupinu, acyloxykupinu, karbamoylovú skupinu, karbamoyloxykupinu, alkyltioskupinu, alkylsulfinylovú skupinu, alkylsulfonylovú skupinu alebo alkylsulfonyloxykupinu; arylovú skupinu, aryloxykupinu, skupinu aryl-S(O)_p, aralkylovú skupinu, aralkoxykupinu, skupinu aralk-S(O)_p, arylsulfonyloxykupinu, pričom každá z týchto skupín môže byť substituovaná 1 až 3 substituentmi zvolenými zo súboru, ktorý je tvorený atómom halogénu, alkylovou skupinou, halogénalkylovou skupinou, alkoxykupinou, halogénalkoxykupinou, nitroskupinou, kyanoskupinou, alkyltioskupinou, acylovou skupinou; ďalej znamenajú aminoskupinu, substituovanú aminoskupinu alebo spoločne znamenajú =O, =S, =NH, =NOR¹² alebo =CR¹³R¹⁴; alebo

X a R môžu spoločne vytvárať mostík vzorca



alebo



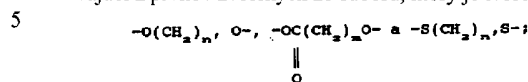
príчем karbonylová skupina je viazaná na A a R² znamená vodík, alkylovú skupinu, halogénalkylovú skupinu, alkoxyalkylovú skupinu, alkoxykupinu, aralkoxykupinu, prípadne substituovanú arylovú skupinu alebo prípadne substituovanú aralkylovú skupinu; p znamená číslo 0, 1 alebo 2;

X¹, X² a X³ znamenajú nezávisle od seba atóm vodíka, hydroxykupinu, alkoxykupinu, alkyltioskupinu, hydroxyalkylovú skupinu alebo hydroxybenzylovú skupinu, pričom aspoň jeden zo substituentov X¹, X² a X³ má iný

význam ako atóm vodíka; alebo

X³ znamená atóm vodíka a

X¹ a X² spoločne tvoria 4- až 5-členný mostík pozostávajúci z prvkov zvolených zo súboru, ktorý je tvorený



R¹² znamená atóm vodíka alebo alkylovú skupinu,

R¹³ a R¹⁴ znamenajú nezávisle od seba vodík, alkylovú skupinu alebo atóm halogénu,

m znamená číslo 1 alebo 2,

n' znamená číslo 2 alebo 3, s tým, že keď R znamená karboxylovú skupinu vo voľnej forme, vo forme esteru alebo soli a X a Y znamenajú spoločne =O, potom jeden z kruhov A a B obsahuje heteroatóm.

15 Ak R znamená skupinu tvoriacu ketón, potom takouto skupinou je výhodne skupina



20

príчем

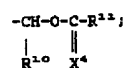
R¹¹ znamená alkylovú skupinu, halogénalkylovú skupinu, alkoxyalkylovú skupinu, alkenylovú skupinu, alkinyllovú skupinu, prípadne substituovanú arylovú skupinu alebo prípadne substituovanú aralkylovú skupinu.

25

30 Ak R znamená karboxylovú skupinu alebo tiokarboxylovú skupinu vo forme esteru, potom takouto skupinou je výhodne skupina vzorca -COOR⁵ alebo -COSR⁵, kde R⁵ znamená alkylovú skupinu, halogénalkylovú skupinu, alkoxyalkylovú skupinu, alkenylovú skupinu, halogénalkenylovú skupinu, alkinyllovú skupinu, halogénalkinylovú skupinu, prípadne substituovanú arylovú skupinu, prípadne substituovanú aralkylovú skupinu, hydroxyalkylovú skupinu, cykloalkylovú skupinu, kvanoalkylovú skupinu, aralkoxyalkylovú skupinu; skupinu vzorca -N=C(R¹⁵)(R¹⁶); skupinu vzorca -(CH₂)_nCH-(R¹⁷)(R¹⁸); skupinu vzorca

30

35



40

R¹⁵ a R¹⁶ znamenajú nezávisle od seba atóm vodíka alebo alkylovú skupinu;

R¹⁷ a R¹⁸ znamenajú nezávisle od seba S(O)_n-alkylovú skupinu, skupinu COOR⁹, alkoxykupinu, aminoskupinu, substituovanú aminoskupinu, benzyloxykupinu, trimetylsilylovú skupinu, kyanoskupinu, skupinu -C(R¹⁹)SR²⁰ alebo navyše jeden z nich môže znamenať atóm vodíka;

45

R¹⁹ znamená atóm vodíka alebo alkylovú skupinu;

R²⁰ znamená alkylovú skupinu alebo arylovú skupinu;

R⁹, R¹⁰ a R¹¹ znamenajú nezávisle od seba atóm vodíka, alkylovú skupinu, halogénalkylovú skupinu, alkoxyalkylovú skupinu, prípadne substituovanú arylovú skupinu alebo prípadne substituovanú aralkylovú skupinu;

55

n a n' znamenajú nezávisle od seba nulu, 1 alebo 2 a

X⁴ znamená atóm kyslíka alebo atóm síry.

60 Ak R znamená karbamoylovú skupinu alebo mono- alebo disubstituovanú karbamoylovú skupinu, potom touto skupinou je výhodne skupina vzorca CONR⁷R⁸, kde R⁷ a R⁸ znamenajú nezávisle od seba atóm vodíka alebo alifatickú alebo nasýtenú alebo nenasýtenú cyklickú alebo heterocyklickú skupinu, pričom každá z týchto skupín môže byť nesubstituovaná alebo substituovaná.

65

R⁷ a R⁸ znamenajú výhodne nezávisle od seba

(a) atóm vodíka, atóm halogénu;

(b) alkylovú skupinu, alkenylovú skupinu, alkinylovú skupinu, alkoxy skupinu, alkoxyalkoxy skupinu, alkenyloxy skupinu, alkinyloxy skupinu, skupinu alkenyl-S(O)_p, skupinu alkyl-S(O)_p alebo alkynyl-S(O)_p, alkyl-S(O)_p-alkyl, alkenyl-S(O)_p-alkyl, alkynyl-S(O)_p-alkyl, pričom každá z týchto skupín môže byť substituovaná 1 až 6 atómami halogénu a každá z nich môže byť viazaná na susedný atóm dusíka cez alkylovú skupinu;

(c) acylovú skupinu, acylalkylovú skupinu, acyloxy skupinu, acyloxyalkylovú skupinu;

(d) cykloalkylovú skupinu, cykloalkylalkylovú skupinu, heterocyklylovú skupinu, heterocykloalkylovú skupinu, heterocykloalkoxy skupinu, arylovú skupinu, aralkylovú skupinu, aryloxy skupinu, aralkoxy skupinu, aryl-S(O)_p, aralkyl-S(O)_p alebo aryl-S(O)_p-alkyl, pričom každá z týchto skupín nie je substituovaná alebo môže byť substituovaná 1 až 3 substituentmi zvolenými zo súboru, ktorý je tvorený (i) atómom halogénu; (ii) alkylovou skupinou, alkenylovou skupinou, alkinylovou skupinou, alkoxy skupinou, alkoxyalkoxy skupinou, alkenyloxy skupinou, alkinyloxy skupinou, skupinou alkyl-S(O)_p, alkenyl-S(O)_p alebo skupinou alkynyl-S(O)_p, alkyl-S(O)_p-alkyl, alkenyl-S(O)_p-alkyl alebo alkynyl-S(O)_p-alkyl skupinou, pričom každá z týchto skupín môže byť substituovaná 1 až 6 atómami halogénu; a (iii) nitroskupinou, kyanoskupinou, acylovou skupinou, aminoskupinou, substituovanou aminoskupinou, aminosulfonylovou skupinou, aminoalkylovou skupinou alebo substituovanou aminoalkylovou skupinou;

(e) aminoskupinu, substituovanú aminoskupinu, amidoskupinu, substituovanú amidoskupinu, aminosulfonylovú skupinu, kyanoskupinu, nitroskupinu alebo skupinu -(CHR⁴)_n-C(O)Y₄, pričom Y₄ znamená vodík, nižšiu alkylovú skupinu, nižšiu alkoxy skupinu alebo hydroxy skupinu a n^m znamená číslo 0, 1, 2 alebo 3 a p znamená číslo 0, 1 alebo 2; R⁴ má význam definovaný pre Y¹.

Ak R znamená karboxylovú skupinu vo forme soli, potom soľ je výhodne tvorená kationom alkalického kovu, kationom kovu alkalickéj zeminy, prípadne substituovaným amóniovým kationom, trialkylsulfóniovým kationom, trialkylsulfoxóniovým kationom alebo fosfóniovým kationom, zvlášť kationom alkalického kovu (napríklad kationom lítia alebo sodíka) alebo kationom kovu alkalickéj zeminy (napríklad kationom vápnika alebo horčíka); amóniovým kationom; substituovaným amóniovým kationom (ako napríklad alkylamóniovým kationom s 1 až 5 atómami uhlíka v alkyloch, dialkylamóniovým kationom s 1 až 5 atómami uhlíka v alkylových častiach, trialkylamóniovým kationom s 1 až 5 atómami uhlíka v alkylových častiach, tetraalkylamóniovým kationom s 1 až 5 atómami uhlíka v alkylových častiach, alkoxyalkylamóniovým kationom s 1 až 5 atómami uhlíka v alkoxylovej aj alkylovej časti, hydroxyalkylamóniovým kationom s 1 až 5 atómami uhlíka v alkyloch); fosfóniovým kationom; trialkylsulfóniovým kationom s 1 až 8 atómami uhlíka v alkylových častiach alebo trialkylsulfoxóniovým kationom s 1 až 8 atómami uhlíka v alkylových častiach.

Ak Y¹, Y² a/alebo Y³ znamenajú karboxylovú skupinu, potom táto skupina môže byť vo forme esteru alebo vo forme soli alebo vo forme amidu (t. j. karbamoylová skupina) a vo svojej podstate je opísaná pre substituent R v týchto formách. Ak A má význam g), potom obsahuje jeden až tri heteroatómy a je predstavovaný napríklad tienylovou skupinou, furanylovou skupinou, pyrolylovou

skupinou, oxazolylovou skupinou, tiazolylovou skupinou, izoxazolylovou skupinou, izotiazolylovou skupinou, imidazolylovou skupinou, pyrazolylovou skupinou, oxadiazolylovou skupinou alebo tiadiazolylovou skupinou.

Ak A má niektorý z definovaných významov pre heteroaromatický zvyšok b) až g), potom substituovaný heterocyklický kruh je najmä zvolený zo súboru, ktorý tvorí pyridyl, chinolyl, pyridyl-N-oxid, pyrimidinyl, pyrazinyl, tienyl alebo furyl, zvlášť potom zo súboru, ktorý tvorí pyridyl alebo tienyl.

Alkylové časti, pokiaľ nie je uvedené inak, obsahujú 1 až 8 atómov uhlíka, výhodne 1 až 5 atómov uhlíka, zvlášť 1 až 4 atómy uhlíka, napríklad 1 alebo 2 atómy uhlíka. Nižšie alkylové skupiny obsahujú 1 až 4 atómy uhlíka, napríklad 1 alebo 2 atómy uhlíka. Alkylové skupiny vo význame symbolov R⁵, R⁷ alebo R⁸ alebo prítomné ako súčasť symbolov R⁵, R⁷ alebo R⁸ obsahujú 1 až 24, výhodne 1 až 12 atómov uhlíka, a zvlášť 1 až 6 atómov uhlíka, pričom jeden zo substituentov R⁷ a R⁸ znamená prednostne atóm vodíka, ak druhý z nich znamená alkylovú skupinu.

Alkylové časti vo význame mostíkových skupín môžu mať reťazec priamy alebo rozvetvený a prednostne obsahujú 1 až 4 atómy uhlíka, napríklad 1 alebo 2 atómy uhlíka. Môžu byť prípadne substituované arylovou skupinou alebo substituovanou arylovou skupinou a prípadne môžu byť prerušené atómom kyslíka alebo atómom síry alebo môžu byť viazané cez atóm kyslíka alebo atóm síry.

Výrazom "konjugovaná alkoxy skupina" sa rozumie alkoxy skupina, ktorá je vo svojej alkylovej časti prerušená jedným alebo niekoľkými atómami kyslíka, ako je napríklad alkoxyalkoxy skupina, alkoxyalkoxyalkoxy skupina atď..

Alkenylové a alkinylové skupiny obsahujú 2 až 8 atómov uhlíka, prednostne 2 až 4 atómy uhlíka a zvlášť potom 2 alebo 3 atómy uhlíka.

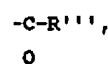
Atómom halogénu je prednostne atóm fluóru, atóm chlóru alebo atóm brómu, zvlášť potom atóm chlóru.

Arylové skupiny sú výhodné z významov definovaných pre kruhový systém A ad a) až g) alebo pre kruh B a predstavujú výhodné významy oboch týchto kruhov. Zvlášť výhodnou je fenylová skupina. Tieto arylové skupiny buď nie sú substituované alebo môžu byť substituované a v takom prípade obsahujú 1 až 3 substituenty tak, ako sú definované pre symbol Y¹, pokiaľ nie je uvedené inak.

Substituované aminoskupiny, amidoskupiny, aminoxy skupiny, aminoalkylové skupiny, iminoxy skupiny alebo karbamoylové skupiny (iné ako R) sú výhodne substituované jedným alebo dvoma substituentmi zvolenými zo súboru, ktorý je tvorený alkyloxy skupinou, halogénalkylovou skupinou, acylovou skupinou, alkoxyalkylovou skupinou, prípadne substituovanou arylovou skupinou alebo prípadne substituovanou aralkylovou skupinou.

Substituovaná metylénová skupina je prednostne substituovaná jednou alebo dvoma skupinami tak, ako sú definované pre Y¹.

Acylová skupina samotná alebo ako súčasť substituentu je obvykle predstavovaná skupinou



65 pričom R^{'''} má význam definovaný pre Y¹ (a znamená

napríklad alkylovú skupinu, halogénalkylovú skupinu, cykloalkylovú skupinu, alkoxyalkylovú skupinu, nesubstituovanú alebo substituovanú arylovú skupinu (zvlášť fenylovú skupinu)). Ako príklady acylových skupín môžeme uviesť acetylovú skupinu, propionylovú skupinu, butyrylovú skupinu, nesubstituovanú alebo substituovanú benzoylovú skupinu, pivaloylovú skupinu alebo chlór-acetylovú skupinu, zvlášť potom acetylovú skupinu alebo nesubstituovanú alebo substituovanú benzoylovú skupinu.

Cykloalkylovou skupinou je prednostne cykloalkylová skupina s 3 až 6 atómami uhlíka, zvlášť cyklopropylová skupina, cyklopentylová skupina alebo cyklohexylová skupina; heterocyklickou skupinou je výhodne 5- alebo 6-členná heterocyklická skupina tak, ako je definovaná pre kruh A vo významoch b) až g) a výhodných významoch alebo nasýtená heterocyklická skupina a obsahujúca O, S alebo N ako heteroatóm, ako je napríklad tetrahydrofurylová skupina, piperidinylová skupina a morfolinylová skupina.

Mostíkové členy, ako



sa pre účelovosť píšú uvedeným spôsobom, rozumejú sa však aj obrátene



Karbamoylové skupiny alebo substituované karbamoylové skupiny sú viazané na molekulu, ktorou substituujú cez svoju karbonylovú skupinu. Amidoskupiny alebo substituované amidoskupiny sú viazané na molekulu, ktorých substituentmi sú cez svoj atóm dusíka.

Zvláštnu skupinu zlúčenín vzorca (I) (t. j. zlúčeniny vzorca (Ia)) predstavujú tie zlúčeniny, v ktorých je kruhový systém A zvolený zo súboru zahŕňajúceho fenyly, pyridyl alebo pyridyl-N-oxid;

R znamená karboxylovú skupinu, ktorá môže byť prítomná vo forme voľnej kyseliny alebo vo forme esteru alebo vo forme soli, tiokarboxylovú skupinu, ktorá môže byť prítomná vo forme voľnej kyseliny alebo vo forme esteru, karbamoylovú skupinu alebo mono- alebo disubstituovanú karbamoylovú skupinu;

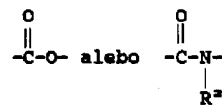
Y^1 , Y^2 a Y^3 sú viazané na atómy uhlíka a znamenajú nezávisle od seba atóm vodíka, atóm halogénu, alkylovú skupinu alebo alkoxykupinu; každý zo symbolov W^1 , W^2 , W^3 , W^4 a W^5 znamená nezávisle od iného skupinu CH, CR^3 alebo atóm dusíka; W^6 znamená skupinu NH alebo atóm kyslíka; Z znamená 2- alebo 3-členný mostík pozostávajúci z členov zvolených zo súboru vytvoreného metylénovou skupinou, substituovanou metylénovou skupinou a skupiny



R^1 a R^3 znamenajú nezávisle od seba atóm vodíka, atóm halogénu, alkylovú skupinu, alkoxykupinu, aryloxyskupinu alebo aralkoxykupinu;

X a Y znamenajú nezávisle od seba atóm vodíka, hydroxykupinu, kyanoskupinu, alkoxykupinu, acyloxyskupinu alebo spoločne =O; alebo

X a R tvoria spoločne mostík vzorca



pričom karbonyl je viazaný na kruhový systém A.

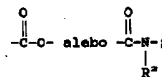
Ak R znamená karboxylovú skupinu alebo tiokarboxylovú skupinu vo forme esteru, potom touto skupinou je výhodne skupina vzorca $-\text{COOR}^5$ alebo $-\text{COSR}^5$;

Pričom každý zo symbolov R^5 znamená nezávisle alkylovú skupinu, alkoxyalkylovú skupinu, alkenylovú skupinu, alkylovú skupinu, substituovanú arylovú skupinu alebo nesubstituovanú alebo substituovanú aralkylovú skupinu.

Ak R znamená karboxyskupinu alebo tiokarboxylovú skupinu vo forme soli, potom táto soľ je tvorená kationom alkalického kovu, kovu alkalickéj zeminy, prípadne substituovaným amóniovým kationom, zvlášť potom kationom alkalického kovu (napríklad kationom lítia alebo sodíka) alebo kationom kovu alkalickéj zeminy (napríklad kationom vápnika alebo horčíka); amóniovým kationom; substituovaným amóniovým kationom; ako alkylamóniovým kationom s 1 až 5 atómami uhlíka v alkylovej časti, dialkylamóniovým kationom s 1 až 5 atómami uhlíka v alkylových častiach, trialkylamóniovým kationom s 1 až 5 atómami uhlíka v alkylových častiach alebo tetraalkylamóniovým kationom s 1 až 5 atómami uhlíka v alkylových častiach.

Ak R znamená karbamoylovú skupinu alebo mono- alebo disubstituovanú karbamoylovú skupinu, potom takouto skupinou je prednostne skupina vzorca $-\text{CONR}^7\text{R}^8$, kde R^7 znamená atóm vodíka, alkylovú skupinu, halogénalkylovú skupinu, alkoxyalkylovú skupinu, nesubstituovanú alebo substituovanú arylovú skupinu alebo nesubstituovanú alebo substituovanú aralkylovú skupinu a R^8 znamená atóm vodíka, alkylovú skupinu, aminoskupinu, skupinu NHR^6 alebo OR^6 , kde R^6 má význam definovaný pre R^7 .

Zvláštna skupina zlúčenín (t. j. zlúčeniny vzorca (Ib)) zahŕňa tie zlúčeniny vzorca (I), v ktorom je kruhový systém A fenyly, pyridyl alebo tienyl; B znamená pyrimidinyly alebo triazinyly; R znamená kruh C, zvlášť oxazol, oxazolón, oxazolidín alebo oxazolidinón; karboxylovú skupinu prítomnú vo forme voľnej kyseliny alebo vo forme esteru alebo vo forme soli; substituovanú karbamoylovú skupinu, kyanoskupinu alebo spoločne s X znamená skupinu



Y^1 , Y^2 a Y^3 znamenajú nezávisle od seba atóm vodíka, atóm halogénu, alkylovú skupinu, alkoxykupinu, alkyltioskupinu alebo aryltioskupinu;

X a Y znamenajú nezávisle od seba atóm vodíka, hydroxykupinu, alkoxykupinu, acyloxyskupinu, kruh B, atóm halogénu, alkyltioskupinu alebo aryltioskupinu alebo spoločne znamenajú =O alebo =NH a

R^1 a R^3 znamenajú nezávisle od seba atóm halogénu, alkoxykupinu, alkylovú skupinu, halogénalkoxykupinu, prípadne substituovanú aryloxyskupinu, aralkoxykupinu, alkyloxyskupinu a alkenyloxyskupinu.

Ďalšia skupina zlúčenín zahŕňa zlúčeniny vzorca (Ib), v ktorom Y^1 , Y^2 a Y^3 môžu každý nezávisle od seba znamenať navyše aralkoxykupinu, alkenyloxyskupinu alebo alkyloxyskupinu.

B znamená najmä pyrimidinyly, zvlášť potom 4,6-di-

metoxy-2-pyrimidinyľ.

A znamená zvlášť fenyľ alebo pyridyľ substituovaný, ako je definované.

X a Y znamenajú prednostne atóm vodíka, atóm halogénu, kyanoskupinu, hydroxyskupinu, alkoxyskupinu alebo spoločne =O, zvlášť potom atóm vodíka, hydroxyskupinu alebo spoločne =O.

Ďalšia skupina zlúčenín podľa vynálezu (zlúčeniny Ic) zahŕňa tie zlúčeniny vzorca I, v ktorom je kruhovým systémom A pyridyľ,

R znamená skupinu -CONR⁷R⁸, kde R⁷ a R⁸ znamenajú nezávisle od seba vodík, alkoxyskupinu alebo alkylovú skupinu;

alebo arylovú skupinu alebo aralkylovú skupinu, pričom každá z týchto skupín môže byť prípadne substituovaná; X znamená vodík,

Y znamená skupinu OR³, SR³ alebo OCOR³, pričom R³ znamená alkylovú skupinu; alebo arylovú skupinu; alebo aralkylovú skupinu, pričom každá z týchto skupín môže byť nesubstituovaná alebo substituovaná; alebo X a Y znamenajú spoločne =O alebo =S a kruhovým systémom B je m-CF₃-fenyľ.

V rámci tejto skupiny Ic sú výhodné tie zlúčeniny, v ktorých X znamená hydroxyskupinu a Y znamená vodík alebo X a Y znamenajú spoločne =O, A znamená 2- alebo 3-pyridyľ, R⁷ znamená vodík alebo alkylovú skupinu, zvlášť metylovú skupinu, R⁸ znamená fenylovú skupinu alebo benzoylovú skupinu, ktoré môžu byť nesubstituované alebo substituované, napríklad raz až trikrát atómom halogénu, alkylovou skupinou alebo/a alkoxyskupinou.

Nezávisle od seba sú pre každý substituent výhodné ďalej uvedené významy:

A a) významy a) a b)

b) fenyľ

c) pyridyľ

R a) karboxyl vo forme voľnej kyseliny alebo vo forme soli alebo esteru alebo karbamoylová skupina alebo mono- alebo disubstituovaná karbamoylová skupina;

b) COOR⁵, kde R⁵ znamená vodík, alkyl; COO⁺Ma⁻, kde Ma znamená katión alkalického kovu alebo CONR⁷R⁸, kde R⁷ znamená vodík alebo alkylovú skupinu a R⁸ znamená alkylovú skupinu, arylovú skupinu alebo substituovanú arylovú skupinu;

c) COO⁻Na⁺, COOCH₃, CONHC₆H₁₃, CONH(CH₃)-fenyľ;

Y¹ a) vodík, halogén, alkylová skupina alebo alkoxyskupina,

b) halogén, zvlášť fluór alebo chlór;

Y², Y³ a) vodík alebo halogén, alkylová skupina alebo alkoxyskupina,

b) vodík alebo halogén,

c) vodík;

W¹ N

W² a) CH alebo N

b) CH

W³ CR³

W⁴ N

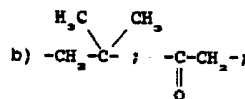
W⁵ a) CH alebo N

b) N

W⁶ a) O

b) NH

Z a) prvky zvolené zo súboru tvoreného metyľénovou skupinou, substituovanou metyľénovou skupinou a



- 5 X¹, X² a) alkoxyskupina, zvlášť metoxyskupina
b) hydroxyskupina
X³ a) vodík
b) alkoxyskupina, zvlášť metoxyskupina
R¹, R³ a) alkoxyskupina, zvlášť metoxyskupina
10 R⁴ a) halogén, zvlášť chlór
b) alkylová skupina, zvlášť metylová skupina
R² a) alkylová skupina, zvlášť metylová skupina
b) atóm vodíka
R⁵ a) alkylová skupina, alkenylová skupina alebo alki-
15 nylová skupina
b) alkylová skupina s 1 až 4 atómami uhlíka, zvlášť metylová skupina alebo etylová skupina
c) alkenylová skupina s 2 až 4 atómami uhlíka
d) alkinylová skupina s 2 až 4 atómami uhlíka, zvlášť
20 propargylová skupina
R⁶, R⁷ a) alkylová skupina
b) metylová skupina, etylová skupina
R⁸ a) vodík
b) alkylová skupina, zvlášť metylová skupina alebo
25 etylová skupina
c) arylová skupina, zvlášť fenylová skupina
R⁹, R¹⁰ a) vodík alebo alkylová skupina
R¹², R¹⁵, R¹⁹ b) vodík alebo metylová skupina
R¹¹ a) alkylová skupina
b) propylová skupina (n- alebo izopropylová skupi-
30 na)
Y⁴ a) alkylová skupina alebo alkoxyskupina
b) CH₃ alebo CH₃O
R¹³, R¹⁴ a) vodík alebo halogén
b) vodík alebo fluór
35 R¹⁶ a) alkylová skupina
b) alkylová skupina s 1 až 4 atómami uhlíka, zvlášť metylová skupina alebo etylová skupina
R¹⁷ a) S(O)_nalkyl alebo COOR⁹
b) SO₂CH₃ alebo COOCH₃
40 R¹⁸ a) vodík
R²⁰ a) alkylovú skupinu alebo fenylovú skupinu
b) metylovú skupinu alebo fenylovú skupinu
n a) 2
b) 0
n' a) 2
b) 3
n'' a) 1
b) 0
50 m a) 1
b) 2
X a) hydroxyskupina
b) vodík
c) spolu s Y, =O
55 d) acyloxyskupina
e) alkoxykarbonyloxyskupina
f) karbamoyloxyskupina
g) sulfonyloxyskupina
Y a) spolu s X, =O
60 b) vodík
O
X + R -C-O-
R' a) alkylová skupina
b) alkoxyskupina
65 R'' a) alkylová skupina
b) metylová skupina

R^m a) alkylová skupina

b) arylová skupina, zvlášť fenylová skupina

kruh A, kruh B a) aspoň jeden obsahuje heteroatóm

b) kruh A = fenylový alebo pyridín

kruh B = pyrimidín, zvlášť 3,5-dimetoxyypyrimidín

Kombinácie uvedených výhodných významov sú zvlášť výhodné. Jedna z takýchto kombinácií zahŕňa zlúčeniny vzorca (I), v ktorom

A znamená fenylovú alebo pyridylovú skupinu ;

R znamená karboxylovú skupinu vo forme voľnej kyseliny alebo vo forme soli; karbamoylovú skupinu; skupinu COORⁿ, kde Rⁿ znamená alkylovú skupinu s 1 až 5 atómami uhlíka alebo alkenylovú skupinu s 2 až 5 atómami uhlíka alebo skupinu COONRⁿR^m, pričom

Rⁿ znamená alkylovú skupinu s 1 až 12 atómami uhlíka, aminoskupinu, alkylaminoskupinu s 1 až 4 atómami uhlíka, anilinoskupinu, halogénanilinoskupinu, benzylovú skupinu, halogénbenzylovú skupinu, alkylbenzylovú skupinu s 1 až 4 atómami uhlíka v alkylovej časti, alkoxybenzylovú skupinu s 1 až 4 atómami uhlíka v alkoxylovej časti, fenylovú skupinu, halogénfenylovú skupinu, alkylfenylovú skupinu s 1 až 4 atómami uhlíka v alkylovej časti alebo alkoxyfenylovú skupinu s 1 až 4 atómami uhlíka v alkoxylovej časti;

R^m znamená vodík alebo alkylovú skupinu s 1 až 4 atómami uhlíka;

Y¹, Y² a Y³ znamenajú nezávisle od seba atóm vodíka alebo atóm halogénu;

W¹ a W⁴ znamenajú atóm dusíka;

W² znamená skupinu CH;

W³ znamená skupinu CR³, kde R³ znamená alkoxykupinu s 1 až 5 atómami uhlíka;

R¹ znamená alkoxykupinu s 1 až 5 atómami uhlíka;

X znamená hydroxylovú skupinu alebo alkoxykarbonyloxyskupinu s 1 až 4 atómami uhlíka v alkoxylovej časti alebo spolu s Y skupinou =O; alebo

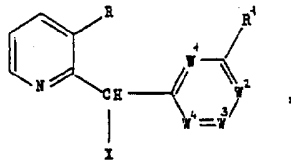
Y znamená atóm vodíka alebo spolu s Y skupinou =O; alebo

X a R spoločne tvoria mostík vzorca -C(O)O-, pričom karbonyl je viazaný na kruhový systém A, a

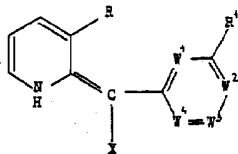
Y znamená vodík alebo acyloxyskupinu s 2 až 8 atómami uhlíka.

Príklady výhodných zlúčenín podľa vynálezu sú zlúčeniny č. 13, 40, 53, 55, 58, 64, 77, 78, 82, 91, 103, 111, 124, 125, 130, 143, 149, 163, 170, 175, 183, 199, 204, 205, 211, 219, 220, 224, 247, 249, 258, 262, 263, 265, 266, 267, 273 a 277.

Zlúčeniny všeobecného vzorca



zvlášť tie, v ktorých X znamená skupinu CN, môžu existovať v alternatívnej tautomernej forme zodpovedajúcej vzorc

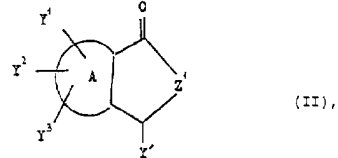


Zlúčeniny vzorca (I) podľa predloženého vynálezu sa môžu pripravovať tým, že sa

a) v prípade, že X a R tvoria spoločne definovanú mostíkovú skupinu a Y znamená atóm vodíka, kyano-

skupinu, aryltioskupinu, arylsulfonylovú skupinu alebo arylsulfonylovú skupinu, nechá reagovať zlúčenina vše-

obecného vzorca (II)



10

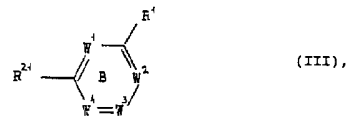
v ktorom

A má uvedený význam,

Y¹ znamená atóm vodíka, kyanoskupinu, aryltioskupinu, arylsulfonylovú skupinu alebo arylsulfonylovú skupinu a

Z₁ znamená atóm kyslíka, síry alebo skupinu NR², kde R² má uvedený význam s výnimkou vodíka, so zlúčeninou všeobecného vzorca (III)

20



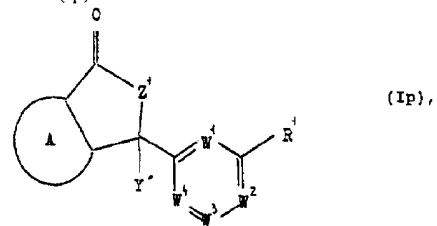
25

v ktorom

W¹, W², W³, W⁴ majú definované významy a

R²¹ znamená metylsulfonylovú skupinu alebo atóm halogénu, pri vzniku zodpovedajúcej zlúčeniny všeobecného vzorca (Ip)

30



35

b) zlúčenina všeobecného vzorca (Ip), v ktorom Y¹ znamená kyanoskupinu alebo arylsulfonylovú skupinu a Z₁ znamená atóm kyslíka a ostatné symboly majú definovaný význam, sa

(i) hydrolyzuje a vzniká zodpovedajúca zlúčenina vzorca (I), v ktorom R a X tvoria mostík a Y znamená hydroxykupinu, alebo zlúčeniny vzorca I, v ktorom X a Y tvoria spoločne =O;

(ii) nechá reagovať s amínom a vzniká zodpovedajúca zlúčenina vzorca (I), v ktorom R znamená prípadne substituovanú karbamoylovú skupinu a X a Y tvoria spoločne =O;

(iii) nechá reagovať so zlúčeninou vzorca

45

MOR²²,

50

MOR²²,

55

v ktorom M znamená alkalický kov a R²² znamená atóm vodíka alebo alkylovú skupinu, a vzniká zodpovedajúca zlúčenina, v ktorom R a X tvoria mostík a Y znamená hydroxykupinu alebo alkoxykupinu; alebo sa

60 c) hydrolyzuje zlúčenina vzorca (Ip), v ktorom Y¹ znamená atóm vodíka a Z₁ znamená atóm kyslíka, a vzniká zlúčenina vzorca (I), v ktorom R znamená karboxylovú skupinu, prípadne vo forme soli, X znamená vodík a Y znamená hydroxykupinu; alebo sa

65 d) zlúčenina vzorca (Ip), v ktorom Y¹ znamená hydroxykupinu a Z₁ znamená kyslík, podrobí otvoreniu kru-

hu a vzniká zlúčenina vzorca (I), v ktorom R znamená karboxylovú skupinu prípadne prítomnú vo forme soli a X a Y tvoria spoločne =O; alebo sa

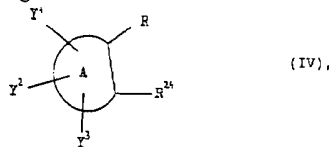
e) zlúčenina vzorca (I), v ktorom R znamená karboxylovú skupinu, prípadne prítomnú vo forme soli a X a Y znamenajú =O, esterifikuje a vzniká zodpovedajúca zlúčenina, v ktorej R znamená karboxylovú skupinu prítomnú vo forme esteru; alebo sa

f) zlúčenina vzorca (Ip), v ktorom Y' znamená hydroxykupinu, halogenuje a vzniká zlúčenina vzorca (I), v ktorom X a R spoločne tvoria mostíkovú skupinu a Y' znamená halogén; alebo sa

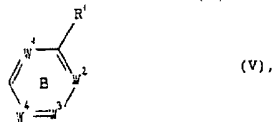
g) zlúčenina všeobecného vzorca (Ip), v ktorom Z₁ znamená atóm kyslíka a Y' znamená halogén, nechá reagovať so zlúčeninou všeobecného vzorca R²NH₂ a zlúčeninou všeobecného vzorca HOR²³, pričom R²³ znamená alkylovú skupinu, acylovú skupinu alebo arylovú skupinu a R² má definovaný význam, a vzniká zodpovedajúca zlúčenina, v ktorej Z₁ znamená skupinu NR² a Y' znamená alkoxykupinu, aryloxykupinu alebo acyloxykupinu; alebo sa

h) zlúčenina všeobecného vzorca (Ip), v ktorom Y' znamená atóm vodíka, oxiduje a vzniká zodpovedajúca zlúčenina, v ktorej Y' znamená hydroxykupinu; alebo sa

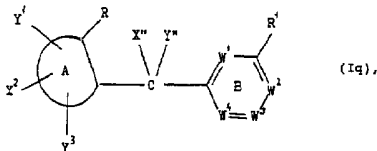
i) nechá reagovať zlúčenina všeobecného vzorca (IV)



v ktorom R²⁴ znamená alkylovú skupinu, zvlášť metylovú skupinu, so zlúčeninou všeobecného vzorca (V)



a vzniká zlúčenina všeobecného vzorca (Iq)



v ktorom A, R, R¹, W¹, W², W³, W⁴, Y¹, Y² a Y³ majú definované významy a

X'' a Y'' znamenajú vodík; alebo sa

j) zlúčenina vzorca (Iq), v ktorom X'' a Y'' znamenajú atómy vodíka, mono- alebo dihalogenuje a vzniká zodpovedajúca zlúčenina vzorca Iq, v ktorom jeden alebo obidva substituenty X'' a Y'' znamená alebo znamenajú atóm halogénu; alebo sa

k) zlúčenina všeobecného vzorca (Iq), v ktorom X'' a Y'' znamenajú obidva atómy vodíka alebo X'' znamená halogén a Y'' znamená vodík, oxiduje a vzniká zodpovedajúca zlúčenina, v ktorej X'' a Y'' spoločne znamenajú =O alebo jeden z nich znamená vodík a druhý znamená hydroxykupinu; alebo sa

l) zlúčenina vzorca (Iq), v ktorom X'' znamená vodík a Y'' znamená vodík, alkyluje a vzniká zodpovedajúca zlúčenina, v ktorej X'' znamená alkylovú skupinu a Y'' znamená atóm vodíka; alebo sa

m) do zlúčeniny vzorca (Iq), v ktorom X'' znamená atóm

halogénu a Y'' znamená atóm vodíka, zavedie alkoxykupinu alebo alkyltiokupinu, a vzniká zodpovedajúca zlúčenina, v ktorej X'' znamená alkoxykupinu alebo alkyltiokupinu a Y'' znamená atóm vodíka; alebo sa

n) zlúčenina vzorca (Iq), v ktorom X'' znamená hydroxykupinu a Y'' znamená atóm vodíka, acyluje a vzniká zodpovedajúca zlúčenina, v ktorej X'' znamená acyloxykupinu a Y'' znamená vodík; alebo sa

o) zlúčenina vzorca (Ip), v ktorom Z₁ znamená kyslík a Y' znamená vodík, nechá reagovať so zlúčeninou všeobecného vzorca R⁷NH₂, v ktorom R⁷ má definovaný význam, a vzniká zlúčenina vzorca (I), v ktorom R znamená monosubstituovanú karbamoylovú skupinu, X znamená vodík a Y znamená hydroxykupinu; alebo sa

p) zlúčenina vzorca (Ip), v ktorom Z₁ znamená kyslík a Y' znamená hydroxykupinu, sulfonyluje, karbamoyluje, acyluje alebo alkoxykarbonyluje a vzniká zodpovedajúca zlúčenina vzorca (I), v ktorom R a X tvoria mostík



a Y znamená sulfonyloxykupinu, karbamoyloxykupinu, acyloxykupinu alebo alkoxykarbonyloxykupinu; alebo sa

q) zlúčenina vzorca (Ip), v ktorom Z₁ znamená kyslík a Y' znamená atóm halogénu, nechá reagovať so zlúčeninou vzorca R⁷R⁸NH, kde R⁷ a R⁸ majú definovaný význam (R⁷ a R⁸ = H), a vzniká zlúčenina vzorca (I), v ktorom R znamená disubstituovanú karbamoylovú skupinu a X a Y znamenajú spoločne =O;

a izoluje sa ktorákoľvek zlúčenina, v ktorej R znamená karboxylovú skupinu alebo tiokarboxylovú skupinu vo voľnej forme alebo vo forme esteru a ktorákoľvek zlúčenina, v ktorej R znamená karboxylovú skupinu vo voľnej forme alebo vo forme soli.

Vhodné reakčné podmienky bližšie ilustruje nasledujúca tabuľka.

Tabuľka. Reakčné podmienky

Reakčné činidlá	rozpuštidlá	teplota	časť
a) 1) a) zásada, napríklad LDA alebo b) zásada, napríklad NaH 2) III	1) a 2) inertné, napríklad DMF éter, cyklické étery, napríklad THF	a) znížená, napríklad -70 °C b) R.T.	
b) 1) I) zásada, napríklad NaOH 2) oxidant	inertné, napríklad éter, cyklické étery, ako THF, alebo alkoholy, napríklad metanol	R.T.	
b) 1) I) acín	inertné, ako éter, cyklické étery, napríklad THF		
b) ii) MOR ₂	alkoholy, napríklad metanol, cyklické étery, napríklad THF		
c) zásada, napríklad LiOH	voľná prípadne s alkoholom alebo cyklické étery, napríklad THF alebo c)	R.T.	
d) zásada, napríklad NaOH		R.T.	
e) halogén, napríklad Br ₂ zásada, napríklad K ₂ CO ₃ , NaH 2) halogenoformálne činidlo, napríklad SOCl ₂ , DMF	inertné, napríklad DMF, 2-butanón (MEK)	zvýšená, napríklad 50 až 80 °C	
g) 1) RNH ₂ , R ₂ OH	inertné, napríklad chlórform, uhľovodík, ako CCl ₄ , CH ₂ Cl ₂	zvýšená, napríklad 50 až 80 °C	
h) 1) oxidizačné činidlo, napríklad NaOCl 2) zásada, napríklad NaOH 3) kyselina, napríklad HCl	1), 2) a 3) inertné, napríklad voľná prípadne s alkoholom, ako s metanolom	zvýšená, napríklad 50 °C R.T. R.T.	
i) 1) zásada, napríklad LDA 2) AcOH 3) DCC 4) vodný NaOH	1) bezvodé inertné, napríklad éter, ako cyklické étery, napríklad THF 2), 3) a 4) éter, H ₂ O	znížená, napríklad -30 °C R.T. znížená, napríklad 0 °C zvýšená, napríklad 75 °C	
j) NBS, benzoylperoxid	inertné, napríklad halogenovaný uhľovodík, ako CCl ₄	zvýšená, napríklad 75 °C	
k) DMSO, Na ₂ CO ₃	DMSO	zvýšená, napríklad 50 až 60 °C	
l) zásada, napríklad NaH, alkylhalogenid	inertné, napríklad éter, THF	0 °C → R.T.	
m) MOR ₂ , MSR ₂ , napríklad MeCOCH ₃	inertné, napríklad DMF, alkohol	R.T. → 50 °C	

Reakčné činidlá	rozpíšťadlá	teplota	ďalšie
n) acylchlorid, napríklad CH_3COCl alebo anhydrid, napríklad Ac_2O , amin, napríklad trietylamin	inertné, napríklad éter, THF, pyridín	R.T. → 30 °C	
o) amin, napríklad α -metylbenzyl-amin alebo	alkohol, napríklad metanol	R.T. → 80 °C	
amin, napríklad azido $\text{CH}_3\text{SO}_2\text{NH}_2$; Me_3Al (katalyzátor)	inertné, napríklad toluén CH_2Cl_2	R.T.	
p) acylchlorid, napríklad acetylchlorid, etylchlorid, mravenčan alebo anhydrid; amin, ako DMAF, trietylamin alebo izokyanát, napríklad metylizokyanát, amin, napr. trietylamin alebo sulfonylchlorid, napríklad metylsulfonylchlorid; amin, napr. trietylamin	inertné, napríklad éter THF, pyridín	R.T.	
q) R_2RNH , trietylamin, DMAF	inertné, napríklad CH_2Cl_2	R.T.	

Poznámka: vysvetlivky skratiek sú uvedené pred príkladmi uskutočnenia

Potup a) až p) rovnako tvorí súčasť predloženého vynálezu.

Východiskové látky vzorca (II) alebo (III) sú buď známe alebo sa môžu pripravovať analogicky podľa známych metód.

Zlúčeniny vzorca (I) majú herbicídnu účinnosť, ako bolo pozorované po ich preemergentnej alebo postemergentnej aplikácii na buriny alebo na miesto výskytu burín.

Výraz "herbicíd" (alebo "herbicídny") označuje účinnú zložku (alebo účinok), modifikujúci rast rastlín pokiaľ ide o reguláciu rastu rastlín alebo fyto toxické vlastnosti pôsobiace retardáciu rastlín alebo poškodzujúce rastlinu do takej miery, že dôjde k jej úplnému zničeniu.

Aplikácia zlúčeniny vzorca (I) sa uskutočňuje obvyklým spôsobom na burine alebo na mieste jej výskytu s použitím herbicídne účinného množstva zlúčeniny, obvykle od 10 g do 10 kg/ha.

Zlúčeniny podľa vynálezu sa môžu používať tak pri ničení širokolistých burín a tráv, a to tak pri preemergentnej ako aj pri postemergentnej aplikácii. Zlúčeniny podľa vynálezu môžu rovnako vykazovať selektívne účinky v rôznych poľnohospodárskych plodinách a sú teda vhodné na ničenie buriny v úžitkových plodinách, ako je kukurica, bavlník, pšenica a sójové bôby.

Optimálne používané množstvo zlúčeniny vzorca (I) sa dá ľahko zistiť postupmi, ktoré sú pre odborníka bežné, s použitím testov, ako sú testy v skleníku a testov na malých parcelách. Toto množstvo závisí od použitej zlúčeniny, od požadovaného účinku (fyto toxický účinok vyžaduje vyššie množstvo ako účinok prejavujúci sa reguláciou rastu), od podmienok ošetrovania a pod. Všeobecne sa uspokojivé fyto toxické účinky dosiahnu, ak sa zlúčenina vzorca (I) aplikuje v množstve v rozsahu od 0,01 do 5,0 kg, ešte výhodnejšie v množstve od 0,05 do 2,5 kg/ha, napríklad v množstve od 0,05 do 5,0 kg/ha, najmä v množstve od 0,1 do 2,5 kg/ha.

Zlúčeniny vzorca (I) sa môžu výhodne kombinovať s ďalšími herbicídmi, ktoré sú účinné proti burinám. Ako príklady herbicídov, ktoré sa môžu kombinovať so zlúčeninou podľa predloženého vynálezu, môžeme uviesť herbicidy zvolené zo súboru, ktorý je tvorený karbamátmi, tiokarbamátmi, chlóracetamidmi, dinitroanilínmi, benzoovými kyselinami, pyridazínónmi, semikarbazónmi, uracilmi a močovínami, ktoré sú vhodné na kontrolu širokého spektra burín.

Zlúčeniny vzorca (I) sa obvykle používajú vo forme herbicídnych prostriedkov spolu s riedidlami použiteľnými na poľnohospodárske účely. Takéto prostriedky

rovnako tvoria súčasť predloženého vynálezu. Uvedené prostriedky môžu obsahovať, ak sa nehľadí na zlúčeninu vzorca (I) ako na účinnú zložku, ďalšie účinné zložky, ako sú herbicidy alebo zlúčeniny, ktoré sú účinné ako antidotá, fungicidy, insekticidy alebo atraktanty na hmyz. Môžu sa používať buď v pevných alebo v kvapalných formách, napríklad vo forme zmáčateľného prášku alebo vo forme emulgovateľného koncentráту s použitím obvyklých riedidiel. Takéto prostriedky sa môžu pripravovať obvyklým spôsobom, napríklad zmiešaním účinnej zložky s riedidlom a prípadne s ďalšími zložkami, ako sú povrchovo aktívne prostriedky.

Na zlepšenie účinnosti aktívnej zložky a napríklad na zníženie penivosti, spckania a korozívnych vlastností, je možné k herbicídny prostriedkom podľa vynálezu pridávať rôzne poľnohospodársky použiteľné aditíva.

Výrazom "riedidlo" sa tu rozumie ktorýkoľvek kvapalný alebo pevný poľnohospodársky použiteľný materiál používaný na riedenie koncentrovanej zmesi na žiadanú aplikovateľnú koncentráciu. Môže ním byť napríklad mastenec, kaolín, kremelina, xylén alebo voda.

Výrazom "povrchovo aktívny prostriedok" sa v danom prípade rozumie poľnohospodársky použiteľný materiál, ktorý uľahčuje emulgovateľnosť, zmáčavosť, dispergovateľnosť alebo iným vhodným spôsobom modifikuje povrchové vlastnosti. Ako príklady povrchovo aktívnych prostriedkov môžeme uviesť lignínsulfonát sodný a laurylsulfát sodný.

Prípravky zvlášť vhodné na aplikáciu formou postreku, ako sú koncentráty dispergovateľné vo vode alebo zmáčateľné prášky, môžu obsahovať povrchovo aktívne prostriedky, ako sú zmáčadlá a dispergátory, napríklad kondenzačné produkty formaldehydu s naftalénsulfonátom, etoxylovaný alkylfenol a etoxylovaný mastný alkohol.

Prípravky podľa vynálezu obsahujú všeobecne 0,01 až 90 % hmotnostných účinnej látky a 0 až 20 % hmotnostných poľnohospodársky použiteľného povrchovo aktívneho prostriedku. Účinná zložka pozostáva buď z aspoň jednej zlúčeniny vzorca I alebo z ich zmesi s ďalšími účinnými látkami. Koncentrované formy prostriedkov podľa vynálezu obsahujú všeobecne medzi asi 2 a 90 % hmotnostnými, výhodne medzi asi 5 a 70 % hmotnostnými účinnej látky. Aplikované formy týchto prostriedkov môžu obsahovať napríklad od 0,01 do 20 % hmotnostných účinnej látky.

Typické herbicídne prostriedky podľa tohto vynálezu bližšie ilustrujú nasledujúce príklady A, B a C, v ktorých sú množstvá udávané v dieloch hmotnostných.

Príklad A

Príprava popraše

10 dielov zlúčeniny podľa tohto vynálezu a 90 dielov práškoveho mastenca sa zmieša v mechanickom miešači a zmes sa rozomelie na homogénnu popraš až do získania požadovanej veľkosti častíc. Takáto popraš je vhodná na priamu aplikáciu v miestach zamorených burinou.

Príklad B

Príprava zmáčateľného prášku

25 dielov zlúčeniny podľa vynálezu sa zmieša a zmes sa rozomelie s 25 dielmi syntetického oxidu kremičitého, 2 dielmi nátriumlaurylsulfátu, 3 dielmi sodnej soli lignínsulfónovej kyseliny a 45 dielmi jemne dispergovaného kaolínu až do získania veľkosti častíc zhruba

5 µm. Získaný zmáčateľný prášok sa pred použitím riedi vodou na požadovanú koncentráciu postrekovej suspenzie.

Príklad C

Príprava emulgovateľného koncentrátu

13,37 dielov zlučieniny podľa tohto vynálezu sa zmieša v miešači s 1,43 dielmi povrchovo aktívneho prostriedku (Toximul 360A; zmes aniónových a neionogénnych povrchovo aktívnych látok, ktorá obsahuje prevažné množstvo aniónových povrchovo aktívnych látok), 5,61 dielmi povrchovo aktívneho prostriedku (Toximul 360A; zmes aniónových a neionogénnych povrchovo aktívnych látok, ktorá obsahuje hlavne neionogénne povrchovo aktívne látky), 23,79 dielmi dimetylformamidu a 55,8 dielmi Tenneco 500-100 (prevažne zmes alkylovaných arómatov, ako je xylén a etylbenzén) až do rozpustenia. Výsledný emulgovateľný koncentrát sa pred použitím riedi vodou.

Nasledujúce príklady slúžia na praktickú ilustráciu predloženej vynálezu. Teploty sú udávané v stupňoch Celzia. Skratky používané v tomto opise majú nasledujúci význam:

THF = tetrahydrofurán

LDA = lítiumdiizopropylamid

RT = laboratórna teplota

DMF = dimetylformamid

DDQ = 2,3-dichlór-5,6-dikyanobenzochinón

NBS = N-brómsukcínimid

DMSO = dimetylsulfoxid

MEK = metyletylketón

DMAP = dimetylaminoimid

Jednotlivé alkylové skupiny (substituenty) uvádzané v nasledujúcich tabuľkách A až F sú - pokiaľ nie je uvedené inak - v "n" izomérskej forme.

Príklady uskutočnenia vynálezu

Príklad 1

7-Chlór-3-(4,6-dimetoxy-2-pyrimidinyl)ftalid (tabuľka A, zlučienina č. 6)

1,68 g (0,01 mol) 7-chlórftalidu sa pridá ku 100 ml absolútneho tetrahydrofuránu a zmes sa ochladí na -70 °C. Potom sa v priebehu 3 minút pridá 6,8 ml (0,01 mol) 1,5M roztoku lítiumdiizopropylamidu a reakčná zmes sa mieša pri teplote -70 °C počas 15 minút. Potom sa pridá 2,18 g (0,01 mol) 2-metylsulfonyl-4,6-dimetoxy-pyrimidinu v 50 ml tetrahydrofuránu a zmes sa mieša počas 4 hodín a teplota sa udržiava na -75 až -70 °C. Potom sa reakčná zmes zneutralizuje pridaním 1,5 g NH₄Cl v 5 ml vody, zohreje sa a zahustí sa na rotačnej odparke. Zvyšok sa po zahutnení rozdelí medzi metylénchlorid a vodu (vždy 50 ml), vodná fáza sa oddelí a pridá sa k nej znova ďalších 30 ml metylénchloridu. Spojené metylénchloridové fázy sa premyjú 30 ml vody, oddelia sa a zahustia. Zvyšok po zahutnení sa chromatografuje metódou veľmi rýchlej chromatografie na silikagéli s použitím 500 ml zmesi hexánu a etylacetátu v pomere 80:20, 500 ml zmesi hexánu a etylacetátu v pomere 50:50 a 500 ml zmesi acetónu a metanolu v pomere 80:20 ako elučného činidla (30 frakcií á 50 ml). Zlučienina uvedená v názve (frakcie 9 až 23) sa po prekryštalizovaní zo zmesi hexánu a metylénchloridu získa vo forme bielej pevnej látky s teplotou topenia 148 až 149 °C.

Príklad 2

5-(4,6-Dimetoxy-2-pyrimidinyl)furo[3,4-b]pyridín-7(5H)-ón (tabuľka B, zlučienina č. 40)

5 Roztok 1,3 g (0,0096 mol) furo[3,4-b]pyridín-7(5H)-ónu v 50 ml absolútneho tetrahydrofuránu sa ochladí na -75 °C a k takto ochladenému roztoku sa v priebehu 5 minút prikvapká 8 ml (0,0192 mol) 2,5M roztoku lítiumdiizopropylamidu. Zmes sa nechá reagovať 1 hodinu pri teplote -75 °C, a potom sa k nej v priebehu 10 minút prikvapká 2,1 g (0,0096 mol) 2-metylsulfonyl-4,6-dimetoxy-pyrimidinu v 30 ml absolútneho tetrahydrofuránu. Zmes sa nechá zohriať na laboratórnu teplotu, pridá sa 1,6 ml kyseliny chlorovodíkovej a tetrahydrofurán sa odparí. Odparok sa rozpustí v 75 ml metylénchloridu, metylénchloridový roztok sa dvakrát premyje vždy 50 ml vody a organická fáza sa zahustí. Získa sa nažltlo biela gumovitá pevná látka. Táto sa chromatografuje na stĺpci silikagélu s použitím 500 ml zmesi hexánu a etylacetátu v pomere 50:50, 500 ml etylacetátu a 1000 ml zmesi acetónu a metanolu v pomere 80:20 ako elučného činidla (30 frakcií). Kryštalický zvyšok (frakcie 18 až 21) zlučieniny uvedenej v názve má teplotu topenia 167 až 168 °C.

Príklad 3

7-Chlór-3-metoxy-3-(4,6-dimetoxy-2-pyrimidinyl)-2-metylizoindol-1(3H)-ón (tabuľka C, zlučienina č. 54)

35 Zmes 0,5 g 7-chlór-3-hydroxy-3-(4,6-dimetoxy-2-pyrimidinyl)ftalidu, 50 ml tetrachlórmetánu, 2 ml SOCl₂ a 4 kvapky dimetylformamidu sa zohrieva 1 1/2 hodiny na teplotu 65 °C, potom sa ochladí a nadbytok SOCl₂ a CCl₄ sa odstráni na rotačnej odparke. Zvyšok sa zriedi 20 ml metylénchloridu a pridá sa ku zmesi 5 ml 40 % vodného metylamínu a 10 ml metanolu za miešania v priebehu 30 minút. Zmes sa potom odparí na rotačnej odparke a zvyšok sa rozdelí medzi 50 ml metylénchloridu a 50 ml vody. Organická fáza sa zahutí a zvyšok sa podrobí chromatografii metódou veľmi rýchlej chromatografie na silikagéli s použitím 800 ml zmesi hexánu a etylacetátu v pomere 50 : 50, 500 ml etylacetátu a 200 ml zmesi acetónu a metanolu v pomere 80:20 ako elučného činidla (30 frakcií á 50 ml). Produkt (frakcie 19 až 21) sa získa vo forme žltej gumovitej látky.

Príklad 4

7-Chlór-3-hydroxy-3-(4,6-dimetoxy-2-pyrimidinyl)ftalid (tabuľka A, zlučienina č. 13)

55 Zmes 1,8 g 7-chlór-3-kyano-3-(4,6-dimetoxy-2-pyrimidinyl)ftalidu, 50 ml 1 % roztoku hydroxidu sodného a 50 ml tetrahydrofuránu sa mieša 3 hodiny pri laboratórnej teplote. Tetrahydrofurán sa odstráni odparením a zvyšok sa zriedi vodou a zmes sa dvakrát extrahuje etylacetátom. Vodný roztok sa okyslí 2N roztokom kyseliny sírovej. Výsledný kyslý roztok sa trikrát extrahuje vždy 100 ml etylacetátu a organické fázy sa spoja, vysušia sa síranom sodným a zahustia sa a vzniká svetložltá pevná látka. Takto získaný zvyšok sa vyberie etylacetátom, k etylacetátovému roztoku sa pridá aktívne uhlie na odstránenie materiálu spôsobujúceho žlté zafarbenie, pričom sa vo forme bielej pevnej látky s teplotou topenia 188 až 190 °C získa zlučienina uvedená v názve.

Príklad 5

7-Chlór-3-metoxo-3-(4,6-dimetoxy-2-pyrimidinyl)ftalid (tabuľka A, zlúčenina č. 30)

1,0 g 7-chlór-3-kyano-3-(4,6-dimetoxy-2-pyrimidinyl)ftalidu sa suspenduje v 20 ml metanolu, roztok sa ochladí ľadom a prikvapká sa k nemu 0,6 ml metoxidu sodného. Potom sa zmes mieša 10 minút a pridá sa ďalší 1 ml metoxidu sodného a v miešaní sa pokračuje 10 minút. Reakcia sa ukončí prídavkom 2N roztoku kyseliny sírovej. Metanol sa odstráni na rotačnej odparke a zvyšok sa rozdelí medzi vodu a etylacetát. Organická fáza sa vysuší síranom sodným a zahustí sa. Chromatografovaním zvyšku metódou veľmi rýchlej chromatografie na silikagéli s použitím zmesi vytvorenej 25 % etylacetátu a hexánom ako elučného činidla. Získa sa biela pevná látka s teplotou topenia 180 až 183 °C.

Príklad 6

a) Metyl-2-chlór-6-(4,6-dimetoxy-2-pyrimidinylkarbonyl)benzoát

(tabuľka C, zlúčenina č. 55) a

b) 7-chlór-3-chlór-(4,6-dimetoxy-2-pyrimidinyl)ftalid (tabuľka A, zlúčenina č. 21)

Zmes 0,7 g 7-chlór-3-hydroxy-3-(4,6-dimetoxy-2-pyrimidinyl)ftalidu, 30 ml tetrachlórmetánu, 2 ml tionylchloridu a 4 kvapky dimetylformamidu sa zohrieva na teplotu 60 °C pod spätným chladičom počas 1 1/2 hodiny. Zmes sa ochladí, nadbytok tionylchloridu a tetrachlórmetán sa odstráni odparením na rotačnej odparke. Zvyšok sa zriedi 20 ml metylénchloridu a k miešanej zmesi sa pridá 10 ml metanolu a 2 ml dietylaminu. Po 2 1/2 hodine sa zmes odparí na rotačnej odparke na odstránenie nadbytku metylénchloridu a metanolu a zvyšok sa rozdelí medzi 50 ml metylénchloridu a 50 ml vody. Organická fáza sa oddelí, zahustí sa a gumovitý zvyšok sa chromatografuje metódou veľmi rýchlej chromatografie na silikagéli s použitím 500 ml zmesi hexánu a etylacetátu v pomere 80 : 20, 500 ml zmesi hexánu a etylacetátu v pomere 60 : 40 ako elučného činidla (28 frakcií á 50 ml). Frakcie 18 až 20 poskytujú titulnú zlúčeninu a) a frakcie 11 až 16 poskytujú titulnú zlúčeninu b).

Príklad 7

7-Chlór-3-kyano-3-(4,6-dimetoxy-2-pyrimidinyl)ftalid (tabuľka A, zlúčenina č. 27)

600 mg 7-chlór-3-kyanoftalidu sa pridá k ľadom ochladenej suspenzii 160 mg hydridu sodného (60 %, premytý hexánom) v 20 ml dimetylformamidu. Po 15 minútach sa pridá 710 mg 2-metylsulfonyl-4,6-dimetoxy-pyrimidinu. Po 1 1/2 hodine miešania pri laboratórnej teplote sa zmes vyleje na 200 ml zmesi ľadu a vody okyslenej 2N roztokom kyseliny sírovej a zmes sa mieša. Zrazenina sa odfiltruje a vysuší pri zníženom tlaku. Získa sa zlúčenina uvedená v názve s teplotou topenia 159 až 161 °C.

Príklad 8

7-Chlór-3,3-bis(4,6-dimetoxy-1,3,5-triazín-2-yl)ftalid (tabuľka A, zlúčenina č. 36)

1,48 g 7-chlórftalidu sa rozpustí v 80 ml tetrahydrofuránu. Získaný roztok sa ochladí na -70 °C a pomocou injekčnej striekačky sa k nemu v priebehu 3 minút pri teplote -70 °C pridá 6 ml 1,5M roztoku lítiumdiizopropylamidu. V miešaní sa pokračuje počas 15 minút pri teplote -70 °C, potom sa prikvapká 1,54 g 2-chlór-4,6-dimetoxy-1,3,5-triazínu v 50 ml tetrahydrofuránu a zmes

sa nechá zohriať na teplotu -20 °C. Zmes sa znova ochladí na -70 °C a pridá sa k nej 1 ml koncentrovanej kyseliny chlorovodíkovej v 10 ml vody. Zmes sa mieša 25 minút, a potom sa nechá zohriať na laboratórnu teplotu a tetrahydrofurán sa odparí. Odparok sa rozdelí medzi 50 ml metylénchloridu a 50 ml vody a vodná fáza sa extrahuje ďalšími 30 ml metylénchloridu. Spojené organické fázy sa premyjú 30 ml vody a zahustením sa získa žltý gumovitý produkt. Produkt sa chromatografuje metódou veľmi rýchlej chromatografie na silikagéli s použitím 1000 ml zmesi hexánu a etylacetátu v pomere 60:40, 400 ml etylacetátu a 500 ml zmesi acetónu a metanolu v pomere 80:20 ako elučného činidla (30 frakcií á 50 ml, 1 frakcia á 200 ml). Frakcie 21 a 22 poskytujú žltý gumovitý produkt, ktorý poskytuje prekryštalizovaním z hexánu zlúčeninu uvedenú v názve s teplotou topenia 126 až 127 °C vo forme žltej pevnej látky.

Príklad 9

Lítium-2-chlór-6-(4,6-dimetoxy- α -hydroxy-2-pyrimidinylmetyl)benzoát (tabuľka C, zlúčenina č. 53)

Zmes 1,0 g 7-chlór-3-(4,6-dimetoxy-2-pyrimidinyl)ftalidu, 0,136 g hydrátu hydroxidu lítneho, 2 ml vody a 10 ml metanolu sa mieša cez noc pri laboratórnej teplote, potom sa zmes odparí do sucha na rotačnej odparke a ďalším vysúšaním pomocou sušiacej pištole sa získa zlúčenina uvedená v názve vo forme bielej pevnej látky s teplotou topenia 153 až 157 °C.

Príklad 10

Lítium-3-[(4,6-dimetoxy- α -hydroxy-2-pyrimidinyl)metyl]pyridín-2-karboxylát (tabuľka D, zlúčenina č. 64)

Zmes 0,490 g 5-(4,6-dimetoxy-2-pyrimidinyl)furo[3,4-b]pyridín-7(5H)-ónu, 0,0768 g hydrátu hydroxidu lítneho, 10 ml metanolu a 2 ml vody sa mieša 24 hodín pod atmosférou dusíka pri laboratórnej teplote a potom sa rozpúšťa do odparí. Nazhltá pevná látka sa suší ďalšie 2 hodiny. Získa sa zlúčenina uvedená v názve s teplotou topenia nad 250 °C (rozklad).

Príklad 11

Nátrium-2-chlór-6-[(4,6-dimetoxy-2-pyrimidinyl)karbonyl]benzoát (tabuľka C, zlúčenina č. 58)

1,24 g 7-chlór-3-hydroxy-3-(4,6-dimetoxy-2-pyrimidinyl)ftalidu, 154 mg hydroxidu sodného, 25 ml tetrahydrofuránu a 25 ml vody sa mieša až do vzniknutia žltého homogénneho roztoku. Rozpúšťa sa odparia na rotačnej odparke a zvyšok sa destiluje v guľčikovom destilačnom prístroji pri 100 °C za vzniku zlúčeniny uvedenej v názve vo forme žltej pevnej látky s teplotou topenia 276 až 278 °C.

Príklad 12

3-[(4,6-Dimetoxy-2-pyrimidinyl)karbonyl]pyridín-2-karboxylová kyselina (tabuľka D, zlúčenina č. 63)

490 mg 5-(4,6-dimetoxy-2-pyrimidinyl)furo[3,4-b]pyridín-7(5H)-ónu sa rozpustí v 50 ml metanolu a roztok sa zohrieva za miešania na teplotu 50 °C až do vzniku homogénneho roztoku (asi 1/2 hodiny). Potom sa prikvapká 2,6 g chlórnanu sodného a roztok sa zohrieva ďalších 30 minút na teplotu 55 °C. Pridá sa 0,208 g

50 % roztoku hydroxidu sodného pri teplote 55 °C a zmes sa zahrieva ďalších 30 minút pri tejto teplote, potom sa ochladí na ľadovom kúpeli a okyslí sa 1 ml koncentrovanej kyseliny chlorovodíkovej. Rozpúšťadlo sa odparí a zvyšok sa rozdelí medzi 50 ml metylénchloridu a 50 ml vody. Organická fáza sa zahustí a vzniká biela pevná látka s teplotou topenia 71 až 73 °C.

Príklad 13

2-[(4,6-Dimetoxy-2-pyrimidinyl)- α -iminometyl]benzová kyselina
(tabuľka C, zlúčenina č. 51)

2,67 g izopropyl-2-brómbenzoátu sa rozpustí v 100 ml absolútneho dietyléru, roztok sa ochladí na -100 °C pridá sa 6,6 ml 1,6M roztoku n-butyllítia. V miešaní sa pokračuje počas 10 minút, a potom sa pri teplote -100 °C v priebehu 2 minút pridá 12 g 2-kyano-4,6-dimoxypyrimidínu v 60 ml dietyléru. Zmes sa mieša počas 30 minút pri teplote -80 °C, a potom sa nechá teplota zmesi vystúpiť na laboratórnu teplotu. K reakčnej zmesi chladenej ľadovým kúpeľom sa pridajú 3 g chloridu amónneho v 30 ml vody. Éterová vrstva sa oddelí, premyje sa dvakrát vždy 30 ml vody a zahustí sa. Gumovitý zvyšok sa rozpustí v 20 ml zmesi hexánu a etylacetátu v pomere 85:15 a v metylénchloride a zmes sa chromatografuje metódou veľmi rýchlej chromatografie na silikagéli s použitím 800 ml zmesi hexánu a etylacetátu v pomere 85:15, 500 ml 1 % metanolu v etylacetáte, 500 ml 5 % metanolu v etylacetáte a 500 ml zmesi acetónu a metanolu v pomere 80:20 ako elučného činidla (40 frakcií á 50 ml; 1 frakcia 200 ml). Frakcie 7 až 10 poskytujú zlúčeninu uvedenú v názve, ktorá po prekryštalizovaní z metylénchloridu má teplotu topenia 225 až 235 °C.

Príklad 14

5-Chlór-5-(4,6-dimetoxy-2-pyrimidinyl)furo[3,4-b]pyridín-7(5H)-ón
(tabuľka B, zlúčenina č. 68)

Zmes 490 mg 5-(4,6-dimetoxy-2-pyrimidinyl)furo[3,4-b]pyridín-7(5H)-ónu a 50 ml metanolu sa zahrieva 30 minút na teplotu 55 °C alebo až do vzniku homogénneho roztoku. Potom sa prikvapká 2,6 g chlórnanu sodného (obvyklý bieliaci prostriedok pre domácnosť). Zmes sa vyberie dichlórmetánom, organická fáza sa oddelí a odparí do sucha. Získa sa zlúčenina uvedená v názve.

Príklad 15

3-[(4,6-Dimetoxy-2-pyrimidinyl)karbonyl]pyridín-2-karboxylová kyselina
(tabuľka E, zlúčenina č. 63)

0,208 g 50 % roztoku hydroxidu sodného sa pridá pri teplote 55 °C k roztoku 0,551 g 5-chlór-5-(4,6-dimetoxy-2-pyrimidinyl)furo[3,4-b]pyridínu (porov. tabuľku B, zlúčenina č. 68) v 50 ml metanolu. Zmes sa mieša ďalších 30 minút pri teplote 55 °C, ochladí sa na ľadovom kúpeli, okyslí sa 1 ml koncentrovanej kyseliny chlorovodíkovej a rozpúšťadlo sa odparí. Odparok sa rozdelí medzi 50 ml metylénchloridu a 50 ml vody a metylénchloridová vrstva sa zahustí a vzniká 0,39 g zlúčeniny uvedenej v názve vo forme bielej pevnej látky s teplotou topenia 71 až 73 °C.

Príklad 16

2-[2-(4,4-Dimetyloxazolín-2-yl)benzyl]-4,6-dichlórpyrimidín

(tabuľka C, zlúčenina č. 61)

K zmesi 1,25 g 2-o-tolyl-4,4-dimetyloxazolínu v 20 ml éteru sa pod atmosférou dusíka za miešania pri teplote -30 °C pridá pomocou injekčnej striekačky 4,2 ml 1,6M roztoku n-butyllítia v hexáne a v miešaní sa pokračuje 1 hodinu pri -10 °C. K reakčnej zmesi sa pomaly pridá 0,98 g 4,6-dichlórpyrimidínu v 20 ml éteru a reakčná zmes sa mieša pri teplote -45 až -30 °C počas 30 minút a pri teplote 0 °C počas ďalších 30 minút. K reakčnej zmesi sa pridá na ukončenie reakcie 0,4 ml kyseliny octovej a 0,1 ml vody v 1,3 ml tetrahydrofuránu a potom sa pridá 1,5 g 2,3-dichlór-5,6-dikyanobenzochinónu v 6 ml tetrahydrofuránu. Teplota zmesi sa nechá vystúpiť na laboratórnu teplotu a zmes sa mieša po ochladení na 0 °C počas 5 minút. Potom sa pridá 7,6 ml ochladeného 1N roztoku hydroxidu sodného a zmes sa mieša ďalších 5 minút. Organická fáza sa oddelí a vysuší sa nad síranom sodným, sfiltruje sa a rozpúšťadlo sa odstráni. Nasledujúcou chromatografiou s použitím zmesi éteru a hexánu v pomere 10:90 sa získa zlúčenina uvedená v názve.

Príklad 17

2-[2-(4,4-Dimetyloxazolín-2-yl)benzyl]-4,6-dimetoxy-pyrimidín
(tabuľka C, zlúčenina č. 48)

K roztoku 1,7 g 2-(2-(4,4-dimetyloxazolín-2-yl)benzyl)-4,6-dichlórpyrimidínu v 100 ml metanolu sa pridá 2,18 g 25 % metanolickeho roztoku metoxidu sodného a zmes sa za miešania zahrieva 10 hodín na teplotu 65 °C. Teplota sa zníži na 60 °C a v miešaní sa pokračuje cez noc. Rozpúšťadlo sa odparí a zvyšok sa vyberie 80 ml toluénu a 50 ml vody. Toluénová vrstva sa oddelí a premyje sa 50 ml vody, oddelí sa a zahustí. Vo forme žltého oleja sa získa zlúčenina uvedená v názve.

Príklad 18

2-[2-(4,4-Dimetyloxazolín-2-yl)- α -brómbenzyl]-4,6-dimetoxy-pyrimidín
(tabuľka C, zlúčenina č. 62)

0,55 g 2-[2-(4,4-dimetyloxazolín-2-yl)benzyl]-4,6-dimetoxy-pyrimidínu, 0,30 g N-brómsukcinimidu, 0,03 g benzoylperoxidu sa rozpustí v 60 ml tetrachlórmetánu a zmes sa zahrieva na teplotu 75 °C pod spätným chladičom. Reakčná zmes sa potom sfiltruje a filtrát sa premyje 5 % roztokom hydrogenuhlitanu sodného (50 ml), 50 ml vody a organická fáza sa oddelí a zahustí sa a vzniká zlúčenina uvedená v názve.

Príklad 19

2-[2-(4,4-Dimetyloxazolín-2-yl)benzoyl]-4,6-dimetoxy-pyrimidín
(tabuľka C, zlúčenina č. 49)

Zmes 1,2 g 2-[2-(4,4-dimetyloxazolín-2-yl)- α -bróm-benzyl]-4,6-dimetoxy-pyrimidínu a 2 g uhlíitanu sodného v 30 ml dimetylsulfoxidu sa zahrieva za miešania počas 3 hodín na teplotu 50 až 60 °C. Potom sa zmes vyleje do 150 ml vody a extrahuje sa toluénom. Toluénový extrakt sa dvakrát premyje vždy 50 ml vody, organická fáza sa oddelí a zahustí. Takto získaný gumovitý produkt sa chromatografuje s použitím 800 ml zmesi hexánu a etylacetátu v pomere 80:20, 500 ml zmesi hexánu a etylacetátu v pomere 70:30 a zmesi hexánu a etylacetátu v pomere 60:40 (50 frakcií). Frakcie 29 až 34 poskytujú zlúčeninu uvedenú v názve.

Príklad 20

Dimetylamid 2-chlór-6-(4,6-dimetoxy-2-pyrimidinylkarbonyl)benzoovej kyseliny (tabuľka C, zlúčenina č. 57)

1,0 g 7-chlór-3-kyano-3-(4,6-dimetoxy-2-pyrimidinyl)ftalidu sa rozpustí v 15 ml tetrahydrofuránu. K získanému roztoku sa potom pomocou injekčnej striekačky pridá 0,7 ml 40 % vodného roztoku dimetylamínu v dôsledku čoho sa roztok zakalí. V miešaní sa pokračuje 15 minút pri laboratórnej teplote a zmes sa zriedi vodou a rozdelí sa medzi etylacetát a vodu. Organická fáza sa oddeľ, premyje sa 2N roztokom kyseliny sírovej, potom roztokom chloridu sodného, vysuší sa a zahustí. Zvyšok sa čistí na silikagéli s použitím 200 ml zmesi 50 % etylacetátu a hexánu a potom 100 % etylacetátu ako elučného činidla. Frakcie 12 až 15 poskytujú zlúčeninu uvedenú v názve s teplotou topenia 141 až 142 °C.

Príklad 21

3-Acetoxy-7-chlór-3-(4,6-dimetyloxy-2-pyrimidinyl)ftalid (tabuľka A, zlúčenina č. 125)

1,1 g 7-chlór-3-(4,6-dimetoxy-2-pyrimidinyl)-3-hydroxyftalidu sa rozpustí v 20 ml pyridínu a k získanému roztoku sa za miešania pridá 0,3 ml acetahydridu. Zmes sa mieša 20 minút, a potom sa vyleje do 2N roztoku kyseliny chlorovodíkovej a extrahuje sa dvoma dielmi etylacetátu. Spojené etylacetátové extrakty sa jedenkrát premyjú 2N roztokom kyseliny chlorovodíkovej, jedenkrát vodou a jedenkrát roztokom chloridu sodného a vysušia sa nad síranom horečnatým. Filtráciou a odparením sa získa zlúčenina uvedená v názve vo forme bielej pevnej látky s teplotou topenia 213 až 215 °C.

Príklad 22

3-[(4,6-Dimetoxy- α -hydroxy-2-pyrimidinyl)metyl]pyridín-2-karboxamid (tabuľka E, zlúčenina č. 82)

K roztoku 0,9 g amoniaku v 15 ml metanolu sa pridá 0,5 g 3-(4,6-dimetoxy-2-pyrimidinyl)-7-azaftalidu. Zmes sa mieša 2 hodiny pri laboratórnej teplote, metanol sa odstráni pri zníženom tlaku a zvyšok po zahutnení sa prekryštalizuje z toluénu, pričom sa vo forme bielej pevnej látky s teplotou topenia 135 až 137 °C získa zlúčenina uvedená v názve.

Príklad 23

(4-Izopropyl)anilid 3-[(4,6-dimetoxy-2-hydroxy-2-pyrimidinyl)-metyl]pyridín-2-karboxylovej kyseliny (tabuľka E, zlúčenina č. 183)

K roztoku 3 ml 4-izopropylanilínu v 50 ml toluénu sa pomocou injekčnej striekačky pridajú 4 ml 15,6 % roztoku trimetylhlinika v hexáne pri laboratórnej teplote. Zmes sa mieša 0,5 hodiny pri laboratórnej teplote, a potom sa k nej pridá 0,5 g 3-[(4,6-dimetoxy-2-pyrimidinyl)-7-azaftalidu. Zmes sa mieša 2 hodiny pri laboratórnej teplote a potom sa pri teplote 5 až 10 °C okyslí 30 ml 10 % kyseliny chlorovodíkovej. Toluénový roztok sa oddeľ, premyje sa 20 ml 10 % roztoku kyseliny chlorovodíkovej, 20 ml 5 % roztoku uhličitanu sodného a 20 ml vody, vysuší sa a zahustí. Zvyšok po zahutnení sa prekryštalizuje z hexánu. Zlúčenina uvedená v názve sa získa vo forme bielej pevnej látky s teplotou topenia 113 až 114 °C.

Príklad 24

3-[(4,6-Dimetoxy- α -(ctoxykarbonyloxy)-2-pyrimidinyl)-

metyl]pyridín-2-karboxamid

(tabuľka E, zlúčenina č. 129)

K roztoku 0,5 g 3-[(4,6-dimetoxy- α -hydroxy-2-pyrimidinyl)-metyl]pyridín-2-karboxamidu, 0,05 g 4-(dimetylamino)pyridínu a 1 ml trietylamínu v 20 ml toluénu a 10 ml dichlórmetánu sa pridá pri laboratórnej teplote 1 ml etylesteru chlórnavčej kyseliny. Zmes sa mieša 1 hodinu pri laboratórnej teplote, zmes sa dvakrát premyje vždy 30 ml vody, vysuší sa a zahustí na rotačnej odparke. Koncentrát sa digeruje so zmesou hexánu a toluénu v rovnakých objemových pomeroch (10 ml) pri teplote 50 °C, ochladí sa na laboratórnu teplotu a sfiltruje. Získa sa 0,45 g zlúčeniny uvedenej v názve vo forme žltej pevnej látky s teplotou topenia 112 až 114 °C.

Príklad 25

3-[(4,6-Dimetoxy- α -benzoyloxy-2-pyrimidinyl)metyl]pyrimidin-2-(N,N-dibenzoyl)karboxamid (tabuľka E, zlúčenina č. 159)

K roztoku 0,05 g 3-[(4,6-dimetoxy- α -hydroxy-2-pyrimidinyl)metyl]-2-karboxamidu, 0,5 g 4-(dimetylamino)pyridínu a 4 ml trietylamínu v 30 ml dichlórmetánu sa pridá 1,4 g benzoylchloridu v dvoch častiach pri laboratórnej teplote. Reakčná zmes sa mieša 17 hodín pri laboratórnej teplote a potom sa premyje 30 ml vody, 30 ml 5 % roztoku kyseliny chlorovodíkovej a 30 ml vody. Dichlórmetánový roztok sa zahustí a zvyšok sa chromatografuje metódou veľmi rýchlej chromatografie na 300 ml silikagélu (230 až 400 mesh) s použitím 1 litra zmesi hexánu a etylacetátu v pomere 70:30 a 500 ml zmesi hexánu a etylacetátu v pomere 50:50 ako elučného činidla. Frakcie 18 až 21 poskytujú po prekryštalizovaní zo zmesi hexánu a etylacetátu v pomere 70:30 zlúčeninu uvedenú v názve vo forme bielej pevnej látky s teplotou topenia 168 až 170 °C.

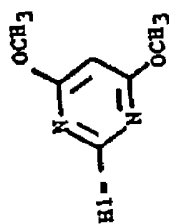
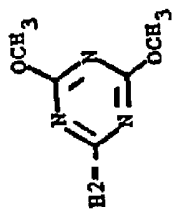
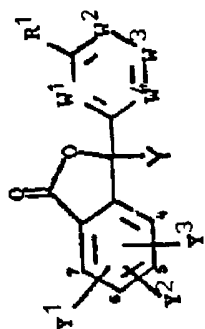
Príklad 26

N-alylamid 3-[(4,6-dimetoxy- α -(N-metylkarbamoyloxy)-2-pyrimidinyl)metyl]pyridín-2-karboxylovej kyseliny (tabuľka E, zlúčenina č. 133)

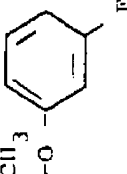


K roztoku 0,5 g alylamidu 3-[(4,6-dimetoxy- α -hydroxy-2-pyrimidinyl)metyl]pyridín-2-karboxylovej kyseliny a troch kvapiek trietylamínu v 20 ml dichlórmetánu sa pridajú 3 ml metylizokyanátu v troch častiach po 1 ml/deň za miešania pri laboratórnej teplote v priebehu 3 dní. Reakčná zmes sa dvakrát premyje vždy 50 ml vody, vysuší sa a zahustí. Zvyšok sa chromatografuje metódou veľmi rýchlej chromatografie na 300 ml silikagélu (230-400 mesh) s použitím 1 litra zmesi hexánu a etylacetátu v pomere 50:50, 500 ml etylacetátu, 500 ml zmesi etylacetátu a metanolu v pomere 80:20 ako elučného činidla (34 frakcií á 50 ml). Frakcie 21 až 25 poskytujú 0,4 g zlúčeniny uvedenej v názve vo forme žltej živice.



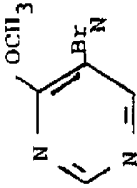
Nasledujúce zlúčeniny sa môžu pripraviť analogicky podľa predchádzajúcich príkladov alebo iným tu opísaným spôsobom.

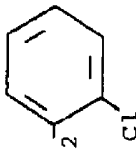

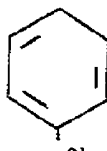
Tabulka A


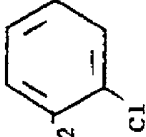


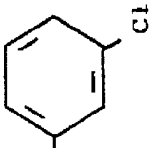
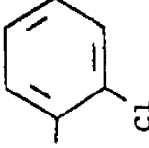
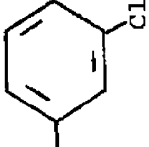
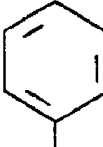
zložení náina č.	Y ¹	Y ²	Y ³	Y	W ¹	W ²	W ³	W ⁴	R ¹	teplota topenia °C
1	H	H	H	OH	N	CH	C-OCH ₃	N	OCH ₃	136-138
2	H	H	H	H	N	CH	C-OCH ₃	N	OCH ₃	102-104
3	H	H	H	-OCCH ₃	N	C-Br	C-OCH ₃	N	OCH ₃	215-225
4	H	H	H	H	N	C-Br	CH	N	OCH ₃	136-138
5	H	H	5-Cl	H	N	CH	C-OCH ₃	N	OCH ₃	151-153
6	7-Cl	H	H	H	N	CH	C-OCH ₃	N	OCH ₃	148-149
7	H	6-Cl	H	H	N	CH	C-OCH ₃	N	OCH ₃	138-139
8	H	H	H	H	N	CH	C-Cl	N	OCH ₃	152-153
9	7-Cl	H	H	H	N	CH	C-Cl	N	OCH ₃	128-130
10	H	H	4-Cl	H	N	CH	C-OCH ₃	N	OCH ₃	98-99


zlúčenina č.	Y ¹	Y ²	Y ³	Y	W ¹	W ²	W ³	W ⁴	R ¹	teplota topenia °C
11	7-CH ₃	H	H	H	N	CH	C-OCH ₃	N	OCH ₃	138-140
12	H	H	H	H	N	CH	C-Cl	N	CH ₃	133-135
13	7-Cl	H	H	OH	N	CH	C-OCH ₃	N	OCH ₃	188-190
14	7-Cl	H	H	H	N	CH	C-O(C ₃ H ₇)	N	OCH ₃	101-102
15	7-OCH ₃	H	4-Br	H	N	CH	C-OCH ₃	N	OCH ₃	126-128
16	7-Cl	H	H	H	N	CH	C-OCH ₂ CF ₃	N	OCH ₃	112-113
17	7-Cl	H	H	H	N	CH	C-OCH ₃	N		136-138
18	7-Cl	H	H	H	N	CH	C-O-CH ₂ 	N	OCH ₃	115-116
19	7-Cl	H	H	H	N	CH	C-OCH ₃	N	N-OCH ₂ 	85-88
20	7-Cl	H	H	H	N	CH	C-OCH ₃	N	-OC ₂ H ₅	98-100
21	7-Cl	H	H	Cl	N	CH	C-OCH ₃	N	-OCH ₃	163-165
22	7-Cl	H	H	H	N	CH	C-OCH ₂ C≡CCH ₃	N	-OCH ₃	131-133
23	7-Cl	H	H	SCH ₃	N	CH	C-OCH ₂ C≡CCH ₃	N	-OCH ₃	134-136
24	7-Cl	H	H	H	N	CH	C-OCH ₃	N	-OCH ₂ CH=CH ₂	72-75
25	7-Cl	H	H	H	N	N	C-OCH ₃	N	-OCH ₃	157-160
26	7-OCH ₃	H	H	H	N	CH	C-OCH ₃	N	-OCH ₃	152-154
27	7-Cl	H	H	CN	N	CH	C-OCH ₃	N	-OCH ₃	159-161

zlučee- nina č.	Y ¹	Y ²	Y ³	Y	W ¹	W ²	W ³	W ⁴	R ¹	teplota topenia °C
28	7-Cl	H	H	CN	N	N	C-OCH ₃	N	-OCH ₃	184-186
29	7-Cl	6-Cl	H	H	N	CH	C-OCH ₃	N	-OCH ₃	194-195
30	7-Cl	H	H	OCH ₃	N	CH	C-OCH ₃	N	-OCH ₃	180-183
31		H	H	CN	N	CH	C-OCH ₃	N	-OCH ₃	169-171
32	7-OCH ₃	6-OCH ₃	H		N	N	C-OCH ₃	N	-OCH ₃	134-136
33	7-Cl	H	H	H	N	CH	C-CH ₃	N	-CH ₃	164-166
34	H	H	H		CH	CH	C-OCH ₃	N	-OCH ₃	163-176
35	H	5-Cl	H	"H1"	N	CH	C-OCH ₃	N	-OCH ₃	151-153
36	7-Cl	H	H	"H2"	N	N	C-OCH ₃	N	-OCH ₃	126-127

zlučena č.	Y ¹	Y ²	Y ³	Y	W ¹	W ²	W ³	W ⁴	R ¹	teplota topenia °C
37	H	H	H	OH	N	C-Cl	C-OCH ₃	N	OCH ₃	162-165
38	7-F	H	H	CN	N	XII	C-OCH ₃	N	OCH ₃	132-134
69	7-Cl	H	H	OC ₂ H ₅	N	CH	C-OCH ₃	N	OCH ₃	148-151
72	7-OCH ₃	H	H	CN	N	CH	C-OCH ₃	N	OCH ₃	159-163
73	H	H	H	CH ₃	N	CH	C-OCH ₃	N	OCH ₃	87-89
75	H	H	H	"H1"	N	CH	C-OCH ₃	N	OCH ₃	168-170
88	7-Cl	H	H	H	N	CH	C-OCH ₂ 	N	-OCH ₃	živica NMR
98	7-Cl	H	H	H	N	CH	C-OCH ₂ 	N	-OCH ₃	97-98
101	7-Cl	H	H	H	N	CH	C-OCH ₂ 	N	-OCH ₃	125-127
102	7-Cl	H	H	H	N	CH	C-OCH ₂	N	-OCH ₃	83-85

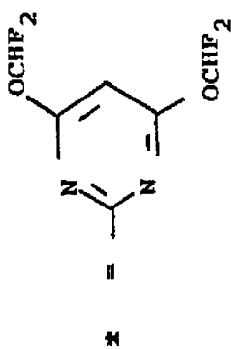
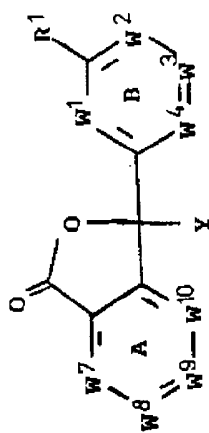
zlúče- nina č.	Y ¹	Y ²	Y ³	Y	W ¹	W ²	W ³	W ⁴	R ¹	teplota topenia °C
104	7-CH ₃ OC ₂ H ₄ -OCH ₂ O-	H	H	CN	N	CH	C-OCH ₃	N	-OCH ₃	105-108
105	7-CH ₃ OC ₂ H ₄ -OCH ₂ O-	H	H	OH	N	CN	C-OCH ₃	N	-OCH ₃	109-110
109	7-F	H	H	OCH ₃	N	CH	C-OCH ₃	N	-OCH ₃	171-173,5
113	7-F	H	H	H	N	CH	C-OCH ₃	N	-OCH ₃	138-140
117	7-F	H	H	OH	N	CH	C-OCH ₃	N	-OCH ₃	183,5-185,5
118	7-OH	H	H	OH	N	CH	C-OCH ₃	N	-OCH ₃	121-122
120	7-O-CH ₂ - 	H	H	CN	N	CH	C-OCH ₃	N	-OCH ₃	174-176
125	7-Cl	H	H	acetoxy	N	CH	C-OCH ₃	N	-OCH ₃	213-215
134	7-OH	H	H	OH	N	CH	C-OCH ₃	N	-OCH ₃	138-141 (rozklad)
135	7-CH ₃ SO ₂ O	H	H	CN	N	CH	C-OCH ₃	N	-OCH ₃	159-161
137	7-OCN(C ₂ H ₅) ₂	H	H	CN	N	CH	C-OCH ₃	N	-OCH ₃	123-125
138	7-propargyloxy	H	H	CN	N	CH	C-OCH ₃	N	-OCH ₃	174-175
139	7-OCH ₂ - 	H	H	CN	N	CH	C-OCH ₃	N	-OCH ₃	170-171

zlučeni- nina č.	Y ¹	Y ²	Y ³	Y	W ¹	W ²	W ³	W ⁴	R ¹	teplota topenia °C
140		H	H	CN	N	CH	C-OCH ₃	N	-OCH ₃	169-172
145		H	H	H	N	CH	C-OCH ₃	N	-OCH ₃	108-110
146		H	H	H	N	CH	C-OCH ₃	N	-OCH ₃	115-118
147	7-OCH ₃	H	H	OH	N	CH	C-OCH ₃	N	-OCH ₃	174-176
153	7-propargyloxy	H	H	H	N	CH	C-OCH ₃	N	-OCH ₃	130-131
154		H	H	CN	N	CH	C-OCH ₃	N	-OCH ₃	181-185 (rozklad)

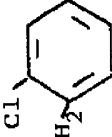
zlúče- nina č.	Y ¹	Y ²	Y ³	Y	W ¹	W ²	W ³	W ⁴	R ¹	teplota topenia °C
166	7-OCF ₃	H	H	OH	N	CH	C-OCH ₃	N	-OCH ₃	131-132
167	7-OCH ₃	H	H	acetoxý	N	CH	C-OCH ₃	N	-OCH ₃	201-202
180	7-OCH ₂ - 	H	H	H	N	CH	C-OCH ₃	N	-OCH ₃	133-136
190	7-O-allyl	H	H	H	N	CH	C-OCH ₃	N	-OCH ₃	109-110
195	7-CF ₃ O	H	H	acetoxý	N	CH	C-OCH ₃	N	-OCH ₃	165-166
203	7-Cl	H	H	propionyl- oxy	N	CH	C-OCH ₃	N	-OCH ₃	178-180
204	7-Cl	H	H	hexanoyl- oxy	N	CH	C-OCH ₃	N	-OCH ₃	131-133
205	7-Cl	H	H	cyklopro- pylkarbo- nyloxy	N	CH	C-OCH ₃	N	-OCH ₃	177-179
208	7-Cl	H	H	benzoyl- oxy	N	CH	C-OCH ₃	N	-OCH ₃	192-194
240	7-Cl	H	H	krotonyloxy	N	CH	C-OCH ₃	N	-OCH ₃	158-160
250	7-Cl	H	4-Cl	OH	N	CH	C-OCH ₃	N	-OCH ₃	171-175
253	7-Cl	H	H	cinnamoyloxy	N	CH	C-OCH ₃	N	-OCH ₃	221-224
256	7-Cl	H	H	OCC 7H ₃₅ " O	N	CH	C-OCH ₃	N	-OCH ₃	102-103

zlučeni- na č.	Y ¹	Y ²	Y ³	Y	W ¹	W ²	W ³	W ⁴	R ¹	teplota topenia °C
258	7-Cl	H	H	2-butenyl- oxy	N	CH	C-OCH ₃	N	-OCH ₃	102-103
263	7-Cl	H	4-Cl	OCCH ₃ O	N	CH	C-OCH ₃	N	-OCH ₃	163-164
265	7-Cl	H	4-Cl	OCC ₅ H ₁₁ O	N	CH	C-OCH ₃	N	-OCH ₃	87-91
266	7-Cl	H	4-Cl	OC O	N	CH	C-OCH ₃	N	-OCH ₃	137-138
267	7-Cl	H	4-Cl	OCC=CHCH ₃ O	N	CH	C-OCH ₃	N	-OCH ₃	128-131
268	7-F	H	4-F	CN	N	CH	C-OCH ₃	N	-OCH ₃	135-136
269	7-Cl	H	4-Cl	CN	N	CH	C-OCH ₃	N	-OCH ₃	123-126
270	7-Cl	H	4-Cl	H	N	CH	C-OCH ₃	N	-OCH ₃	156-161
307	4-Cl	H	H	OH	N	CH	C-OCH ₃	N	-OCH ₃	146-150
319	4-Cl	H	H	CN	N	CH	C-OCH ₃	N	-OCH ₃	132-133
320	4-Cl	H	H	OCH ₃	N	CH	C-OCH ₃	N	-OCH ₃	168-168,5
326	7-Cl	H	H	OC ₁ C ₃ H ₇ O	N	CH	C-OCH ₃	N	-OCH ₃	142-143
409	7-Cl	H	H	OC ₁ C ₄ H ₉ O	N	CH	C-OCH ₃	N	-OCH ₃	162-163

Tabuľka B

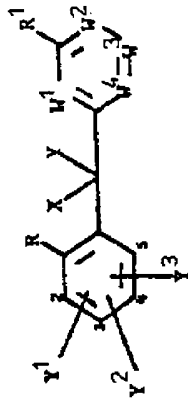


zlučenie- nina č.	W ⁷	W ⁶	W ⁵	W ¹⁰	Y	W ¹	W ²	W ³	W ⁴	R ¹	teplota topenia °C
39	CH	CH	CH	N	H	N	CH	C-OCH ₃	N	-OCH ₃	149-151
40	N	CH	CH	CH	H	N	CH	C-OCH ₃	N	-OCH ₃	167-168
41	CH	CH	N	CH	H	N	CH	C-OCH ₃	N	-OCH ₃	olej, NMR
42	CH	N	CH	CH	H	N	CH	C-OCH ₃	N	-OCH ₃	120-126
43	N	C-Cl	CH	CH	H	N	CH	C-OCH ₃	N	-OCH ₃	166-169
44	N	CH	C-C ₂ H ₅	CH	H	N	N	C-OCH ₃	N	-OCH ₃	olej, NMR
45	N	CH	CH	CH	H	N	N	C-OCH ₃	N	-OCH ₃	75-80
46	CH	C-C ₂ H ₅	CH	N	H	N	CH	C-OCH ₃	N	OCH ₃	olej, NMR
47	CH	CH	CH	N	CH ₃	N	CH	C-OCH ₃	N	OCH ₃	98-101


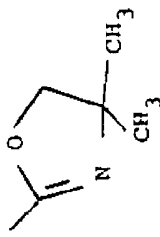
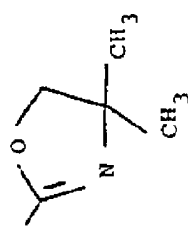
zložení ná č.	W ⁷	W ⁸	W ⁹	W ¹⁰	Y	W ¹	W ²	W ³	W ⁴	R ¹	teplota topenia °C
68	N	CH	CH	CH	Cl	N	CH	C-OCH ₃	N	OCH ₃	173-176
70	N	CH	CH	CH	"H1"	N	CH	C-OCH ₃	N	OCH ₃	129-131
89	C-CH ₃	CH	CH	N	H	N	CH	C-OCH ₃	N	-OCH ₃	116-119
92	N	CH	CH	CH	H	N	CH	C-OCH ₂ CF ₃	N	-OCH ₃	193-195
93	N	CH	CH	CH	H	N	CH	C-CH ₃	N	-CH ₃	147-149
94	N	CH	CH	CH	H	N	CH	C-Cl	N	-OCH ₃	
95	N	CH	CH	CH	H	N	CH	 C-OCH ₂	N	-OCH ₃	olej, NMR
99	N	CH	CH	CH	H	N	CH	C-OC ₃ H ₇	N	-OCH ₃	140-142
100	N	CH	CH	CH	H	N	CH	C-OC ₂ H ₅	N	-OCH ₃	133-135
106	N	CH	CH	CH	H	N	CH	C-O-allyl	N	-OCH ₃	112-114
107	N	CH	CH	CH	H	N	CH	-COCH ₂ -CH=CHCH ₃	N	-OCH ₃	olej, NMR
114	C-Cl	N	CH	CH	H	N	CH	C-OCH ₃	N	-OCH ₃	168-170
121	C-OCH ₃	N	CH	CH	H	N	CH	C-OCH ₃	N	-OCH ₃	150-153
136	N	CH	CH	CH	H	N	CH	C-OCH ₃	N	H	158-160
141	N	CH	CH	CH	*	N	CH	C-OCHF ₂	N	OCHF ₂	145-147
148	CH	CH	CH	N	"H1"	N	CH	C-OCH ₃	N	OCH ₃	212-213
175	CH	CH	CH	N	OH	N	CH	C-OCH ₃	N	OCH ₃	172-178

zlúče- nina č.	W ⁷	W ⁸	W ⁹	W ¹⁰	Y	W ¹	W ²	W ³	W ⁴	R ²	teplota topenia °C
260	C-CH ₃	N	CH	CH	OH	N	CH	C-OCH ₃	N	OCH ₃	203-204
261	C-COOH	N	CH	CH	OH	N	CH	C-OCH ₃	N	OCH ₃	130-132 (rozklad)
317	N	CH	CH	CH	H	N	CH	C-OCH ₃	N	CH ₃	138-140
408	N	CH	CH	CH	-N(CH ₃)OCH ₃	N	CH	C-OCH ₃	N	OCH ₃	168-170

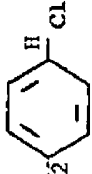
Tabuľka C

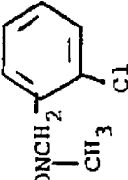
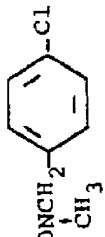
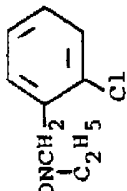


zlučovnína č.	Y ¹	Y ²	Y ³	R	X	Y	W ¹	W ²	W ³	W ⁴	R ¹	teplota topenia °C
48	H	H	H		H	H	N	CH	C-OCH ₃	N	-OCH ₃	olej, NMR
49	H	H	H		=O	H	N	CH	C-OCH ₃	N	-OCH ₃	olej, NMR
50	H	H	H		H	H	N	CH	C-OCH ₃	N	-OCH ₃	150-152

zlúče- nina č.	Y ¹	Y ²	Y ³	R	X	Y	W ¹	W ²	W ³	W ⁴	R ¹	teplota topenia °C
51	H	H	H	COOH	=NH	N	CH	C-OCH ₃	N	-OCH ₃		225-235 (voľná kyselina) 94-95
52	2-Cl	H	H	CN	H	N	CH	C-OCH ₃	N	-OCH ₃		153-157 (litna soľ) olej, NMR
53	2-Cl	H	H	COOH	OH	N	CH	C-OCH ₃	N	-OCH ₃		
54	2-Cl	H	H	-CO-N- CH ₃	OCH ₃	N	CH	C-OCH ₃	N	-OCH ₃		
55	2-Cl	H	H	-COOCH ₃	=O	N	CH	C-OCH ₃	N	-OCH ₃		110-111
56	2-Cl	H	H	-CONHCH ₃	OH	N	CH	C-OCH ₃	N	-OCH ₃		130-132
57	2-Cl	H	H	-CON(CH ₃) ₂	=O	N	CH	C-OCH ₃	N	-OCH ₃		141-142
58	2-Cl	H	H	COOH	=O	N	CH	C-OCH ₃	N	-OCH ₃		276-278 (soľná soľ)
59	2-Cl	H	H	CONH- 	OCH ₃	H	CH	C-OCH ₃	N	-OCH ₃		148-150
60	H	H	H	COOH	OH	N	CH	C-OCH ₃	N	-OCH ₃		185 (rozklad) (litna soľ)
61	H	H	H		H	H	CH	C-Cl	N	Cl		NMR
62	H	H	H		Br	H	CH	C-OCH ₃	N	OCH ₃		

zlúče- nina č.	Y ¹	Y ²	Y ³	R	X	Y	W ¹	W ²	W ³	W ⁴	R ⁵	teplota topenia °C
71	H	H	H	COOH	OH	H ₁	N	CH	C-OCH ₃	N	OCH ₃	158-160 (lítna sol')
74	H	H	H	COOH	OH	CH ₃	N	CH	C-OCH ₃	N	OCH ₃	> 250
76	2-Cl	H	H	COOC ₂ H ₅	=O		N	CH	C-OCH ₃	N	OCH ₃	66-67
77	2-Cl	H	H	COOallyl	=O		N	CH	C-OCH ₃	N	OCH ₃	81-83
78	2-Cl	H	H	COObuten-3-yl	=O		N	CH	C-OCH ₃	N	OCH ₃	48-50
79	2-Cl	H	H	COObenzyl	=O		N	CH	C-OCH ₃	N	OCH ₃	99-101
80	2-Cl	H	H	-CO-N- iC ₃ H ₇		OH	N	CH	C-OCH ₃	N	OCH ₃	99-101
81	2-Cl	H	H	-CO-N- CH ₃		OH	N	CH	C-OCH ₃	N	OCH ₃	153-154
85	2-Cl	H	H	-CO-N(C ₂ H ₅) ₂	=O		N	CH	C-OCH ₃	N	OCH ₃	110-111
86	H	H	H	COObenzyl	OH	H	N	CH	C-OCH ₃	N	OCH ₃	olej, NMR
87	H	H	H	-CO-N- feryl.	OH	OH	N	CH	C-OCH ₃	N	OCH ₃	161-163
96	2-Cl	H	H	-CO-N(C ₂ H ₅) ₂	OH	H	N	CH	C-OCH ₃	N	OCH ₃	74-80
103	2-Cl	H	H	-CONCH ₃ (benzyl)	=O		N	CH	C-OCH ₃	N	OCH ₃	105-107
115	2-F	H	H	-COOCH ₃	=O		N	CH	C-OCH ₃	N	OCH ₃	101-104
116	2-F	H	H	-COOallyl	=O		N	CH	C-OCH ₃	N	OCH ₃	97-99
122	H	H	H	-COOallyl	=O		N	CH	C-OCH ₃	N	OCH ₃	92-93

zlúče- nina č.	Y ¹	Y ²	Y ³	R	X	Y	W ¹	W ²	W ³	W ⁴	R ²	teplota topenia °C
123	2-Cl	H	H	-COO-2-metyl -alyl	=O	N	CH	C-OCH ₃	N	OCH ₃		137-139
124	2-Cl	H	H	-COO-3-metyl- -but-2-enyl	=O	N	CH	C-OCH ₃	N	OCH ₃		54-57
126	2-Cl	H	H	-COOpropargyl	=O	N	CH	C-OCH ₃	N	OCH ₃		138-140
143	2-Cl	H	H	-COObut-2-enyl	=O	N	CH	C-OCH ₃	N	OCH ₃		61-65
156	2-OCH ₃	H	H	-COOCH ₃	=O	N	CH	C-OCH ₃	N	OCH ₃		142-143
163	2-F	H	H	-COOH	OH	H	CH	C-OCH ₃	N	OCH ₃		220-240 (rozklad) (litna soľ)
165	2-OCH ₃	H	H	-COOalyl	=O	N	CH	C-OCH ₃	N	OCH ₃		100-101
181	2-OCH ₂		H	COOH	OH	H	CH	C-OCH ₃	N	OCH ₃		158-159 (litna soľ)
191	2-CF ₃	H	H	COOCH ₃	=O	N	CH	C-OCH ₃	N	OCH ₃		80-82 (rozklad)
192	3-Cl	H	H	COOH	OH	H	CH	C-OCH ₃	N	OCH ₃		170-174 (rozklad) (litna soľ)
194	5-Cl	H	H	COOH	OH	H	CH	C-OCH ₃	N	OCH ₃		225-227 (rozklad) (litna soľ)
197	4-Cl	H	H	COOH	OH	H	CH	C-OCH ₃	N	OCH ₃		195-198 (rozklad) (litna soľ)
202	2-pro-H paryloxy	H	H	COOH	OH	H	CH	C-OCH ₃	N	OCH ₃		>200 (rozklad) (litna soľ)

zlúče- nina č.	Y ¹	Y ²	Y ³	R	X	Y	W ¹	W ²	W ³	W ⁴	R ¹	teplota topenia °C
218	2-Cl	H	H		=O		N	CH	C-OCH ₃	N	OCH ₃	olej, NMR
219	2-Cl	H	H		=O		N	CH	C-OCH ₃	N	OCH ₃	127-128
220	2-Cl	H	H		=O		N	CH	C-OCH ₃	N	OCH ₃	154-155
222	2-OC ₃ H ₇	H	H	COOH	OH	H	N	CH	C-OCH ₃	N	OCH ₃	>273 (rozklad) (lítna soľ)
228	2-Cl	5-Cl	H	COOH	=O		N	CH	C-OCH ₃	N	OCH ₃	>210 (rozklad) (sodná soľ)
235	2-Cl	5-Cl	H	COOH	OH	H	N	CH	C-OCH ₃	N	OCH ₃	>205 (rozklad) (sodná soľ)
239	2-Cl	H	H	COOCH ₂ -CH=CH-Cl	=O		N	CH	C-OCH ₃	N	OCH ₃	86-87
242	2-Cl	H	H	CON-"H1" CH ₃	OCH ₃	H	N	CH	C-OCH ₃	N	OCH ₃	112-113

zlúče- nina č.	Y ²	Y ³	Y ⁴	R	X	Y	W ¹	W ²	W ³	W ⁴	R ¹	teplota topenia °C
243	H	H	H	COOH	=O		N	CH	C-OCH ₃	N	OCH ₃	> 295 (rozklad) (sodná soľ)
244	2-F	H	H	COOH	=O		N	CH	C-OCH ₃	N	OCH ₃	276 (rozklad (lítina soľ)
247	2-Cl	H	H	COOC ₃ H ₇	=O		N	CH	C-OCH ₃	N	OCH ₃	63-65
249	2-Cl	5-Cl	H	COOCH ₃	=O		N	CH	C-OCH ₃	N	OCH ₃	130-132
251	2-Cl	H	H	COOCH ₂ CH=CHCl	=O		N	CH	C-OCH ₃	N	OCH ₃	107-108
262	2-Cl	5-Cl	H	COOa _{1.1} Y ₁	=O		N	CH	C-OCH ₃	N	OCH ₃	89-90
264	2-Cl	5-Cl	H	COOC ₁₂ H ₂₅	=O		N	CH	C-OCH ₃	N	OCH ₃	olej, NMR
274	2-F	5-F	H	COOH	=O		N	CH	C-OCH ₃	N	OCH ₃	> 295 (rozklad) (sodná soľ)
277	2-Cl	H	H	COOC ₄ H ₉	=O		N	CH	C-OCH ₃	N	OCH ₃	NMR
281	2-Cl	H	H	COOC ₅ H ₁₁	=O		N	CH	C-OCH ₃	N	OCH ₃	NMR
287	2-Cl	H	H	COOC ₆ H ₁₃	=O		N	CH	C-OCH ₃	N	OCH ₃	70-71
299	2-Cl	H	H	COOC ₇ H ₁₅	=O		N	CH	C-OCH ₃	N	OCH ₃	NMR
300	2-Cl	H	H	COOC ₈ H ₁₇	=O		N	CH	C-OCH ₃	N	OCH ₃	NMR
306	5-Cl	H	H	COOH	=O		N	CH	C-OCH ₃	N	OCH ₃	266-276 (rozklad) (sodná soľ)
308	2-Cl	H	H	COOC ₁₂ H ₂₅	=O		N	CH	C-OCH ₃	N	OCH ₃	NMR
314	2-Cl	H	H	COOCHC ₂ H ₅ CH ₃	=O		N	CH	C-OCH ₃	N	OCH ₃	92-94
315	2-Cl	H	H	CH ₂ OH	OH	H	N	CH	C-OCH ₃	N	OCH ₃	115-116

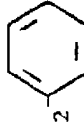
zlúče- nina č.	Y ¹	Y ²	Y ³	R	X	Y	W ¹	W ²	W ³	W ⁴	R ¹	teplota topenia °C
316	2-Cl	H	H	COOC ₃ H ₇	=O		N	CH	C-OCH ₃	N	OCH ₃	109-110
321	5-Cl	H	H	COOC ₃ H ₇	=O		N	CH	C-OCH ₃	N	OCH ₃	115-116

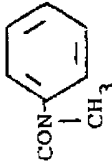
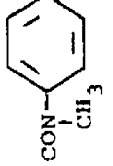
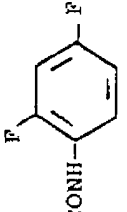
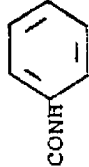
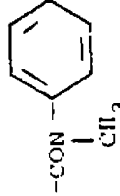
Tabuľka D

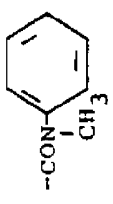
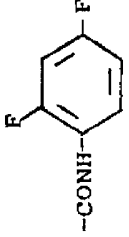
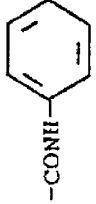


zloženie ná č.	A *	R	X	Y	W ¹	W ²	W ³	W ⁴	R ²	teplota topenia °C
65	-S-CH=CH-	-C-O- " O		H	N	CH	C-OCH ₃	N	OCH ₃	125-127
66	-S-CH=CH-	-C-O- " O		H	N	N	C-OCH ₃	N	OCH ₃	olej, NMR
67	-CH=CH-CH=N-	COOH	OH	CH ₃	N	CH	C-OCH ₃	N	OCH ₃	>283 (rozklad) (litna soľ)
119	=C-N=CH-CH= Cl	CONHCH ₃	OH	H	N	CH	C-OCH ₃	N	OCH ₃	olej, NMR
142	=CH-CH=CH-N=	COOC ₂ H ₅	CN	H	N	CH	C-OCH ₃	N	OCH ₃	109-111
149	=CH-CH=CH-N=	COOH	OH	H	N	CH	C-OCH ₃	N	OCH ₃	160-165 (rozklad) (litna soľ)
150	=CH-CH=CH-N=	CONHC ₃ H ₇	OH	H	N	CH	C-OCH ₃	N	OCH ₃	olej, NMR
173	=CH-CH=CH-N=	COOH	OH	H	N	CH	C-OCH ₃	N	OCH ₃	142-145 (rozklad)

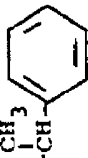
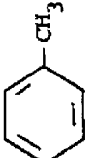
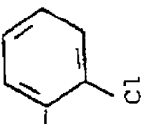
zlučovnína č.	A*	R	X	Y	W ¹	W ²	W ³	W ⁴	R ²	teplota topenia °C
174	=CH-CH=CH-N=	COOCH ₃	OH	H	N	CH	C-OCH ₃	N	OCH ₃	olej, NMR
176	=CH-CH=CH-N=	COOCH ₃	=O		N	CH	C-OCH ₃	N	OCH ₃	129-131
178	=C-N=CH-CH= OCH ₃	COOCH ₃	H	H	N	CH	C-OCH ₃	N	OCH ₃	olej, NMR
179	=C-N=CH-CH= OCH ₃	COOH	H	H	N	CH	C-OCH ₃	N	OCH ₃	> 240 (rozklad) (litna soľ)
186	=C-N=CH-CH= OCH ₃	COOCH ₃	=O		N	CH	C-OCH ₃	N	OCH ₃	147-149
187	=C-N=CH-CH= OCH ₃	COOH	=O		N	CH	C-OCH ₃	N	OCH ₃	235 (sodná soľ)
198	=C-N=CH-CH= OCH ₃	COOCH ₃	Br	H	N	CH	C-OCH ₃	N	OCH ₃	125-126
199	=CH-CH=CH-N=	COOH	OH	H	N	CH	C-OCH ₃	N	OCH ₃	242 (rozklad) (sodná soľ)
206	=C-N=CH-CH= OCH ₃	COOCH ₃	acetoxy	H	N	CH	C-OCH ₃	N	OCH ₃	olej, NMR
216	=C-N=CH-CH= OCH ₃	COOC ₂ H ₅	H	H	N	CH	C-OCH ₃	N	OCH ₃	olej, NMR

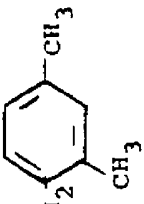


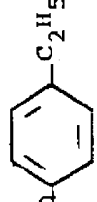
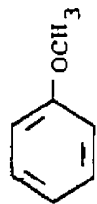
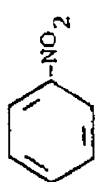
zlúče- nina č.	A*	R	X	Y	W ¹	W ²	W ³	W*	R ¹	teplota topenia °C
236	$\begin{array}{c} \text{=C-N=CH-CH=} \\ \\ \text{CH}_3 \end{array}$	COOC ₂ H ₅	Br	H	N	CH	C-OC H ₃	N	OCH ₃	olej, NMR
237	$\begin{array}{c} \text{=C-N=CH-CH=} \\ \\ \text{CH}_2\text{Br} \end{array}$	COOC ₂ H ₅	Br*	H	N	CH	C-OC H ₃	N	OCH ₃	olej, NMR
238	$\begin{array}{c} \text{=C-N=CH-CH=} \\ \\ \text{CH}_2\text{OCOCH}_3 \end{array}$	COOC ₂ H ₅	Br	H	N	CH	C-OC H ₃	N	OCH ₃	olej, NMR
248	$\begin{array}{c} \text{=C-N=CH-CH=} \\ \\ \text{CH}_3 \end{array}$	COOC ₂ H ₅	=O		N	CH	C-OC H ₃	N	OCH ₃	103-104
254	$\begin{array}{c} \text{=C-N=CH-CH=} \\ \\ \text{CH}_3 \end{array}$	COOH	=O		N	CH	C-OC H ₃	N	OCH ₃	180-185 (rozklad)
301	=CH-CH=CH-N=	CON(C ₂ H ₅) ₂	H	H	N	CH	C-OC H ₃	N	OCH ₃	69-72
302	=CH-CH=CH-N=	COOH	OH	H	N	CH	C-OC H ₃	N	OCH ₃	220-230 (rozklad) (draselná soľ)
330	=CH-CH=CH-N=	CON(C ₂ H ₅) ₂	O=C ₄ H ₉	H	N	CH	C-OC H ₃	N	OCH ₃	olej, NMR
414	-N=CH-CH=CH-	$\begin{array}{c} \text{-C-N-} \\ \\ \text{O O} \end{array}$ -CH ₂ - 		OH	N	CH	l-OC H ₃	N	OCH ₃	136-138

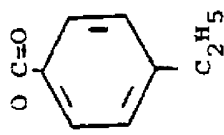

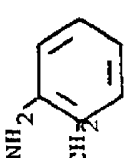
zlože- nina č.	A*	R	X	Y	W ¹	W ²	W ³	W ⁴	R ¹	teplota topenia °C
415	=CH-CH=CH-N=		=O		CH	CH	CH	CH	CF ₃	
416	=CH-CH=CH-N-		OH	H	CH	CH	CH	CH	CF ₃	
417	=CH-CH=CH-N=		OH	H	CH	CH	CH	CH	CF ₃	
418	=CH-CH=CH-N=		OH	H	CH	CH	CH	CH	CF ₃	
419	-N=CH-CH=CH-		=O		CH	CH	CH	CH	CF ₃	

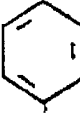

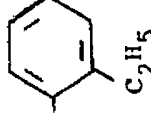

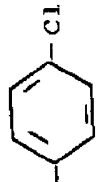
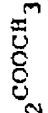

zlúče- nina č.	A*	R	X	Y	W ¹	W ²	W ³	W ⁴	R ¹	teplota topenia °C
420	-N=CH-CH=CH-		OH	H	CH	CH	CH	CH	CF ₃	
421	-N=CH-CH=CH-		OH	H	CH	CH	CH	CH	CF ₃	
422	-N=CH-CH=CH-		OH	H	CH	CH	CH	CH	CF ₃	


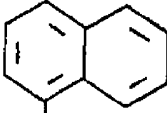

Legenda: *) proti smeru hodinových ručičiek-
- atóm na ľavej strane naviazaný
na uhlík nesúci zvyšok R

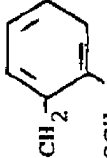
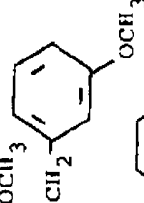
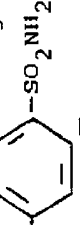
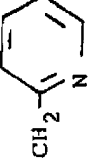
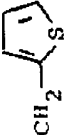

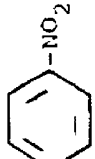
zlúče- nina č.	Y ¹	Y ²	Y ³	R	X	Y	W ¹	W ²	W ³	W ⁴	R ¹	teplota topenia °C
129	H	H	H	CONH ₂	etoxykarbo- nyloxy	H	N	CH	C-OCH ₃	N	OCH ₃	112-114
130	H	H	H	CONHC ₁₂ H ₂₅	O	H	N	CH	C-OCH ₃	N	OCH ₃	olej, NMR
131	H	H	H	CONHC ₂ H ₄ OCH ₃	OH	H	N	CH	C-OCH ₃	N	OCH ₃	79-80
132	H	H	H	CONH ₂ NH ₂	OH	H	N	CH	C-OCH ₃	N	OCH ₃	75-78
133	H	H	H	CONHallyl	OCONHCH ₃	H	N	CH	C-OCH ₃	N	OCH ₃	NMR
144	H	H	H	CONHpropargyl	OH	H	N	CH	C-OCH ₃	N	OCH ₃	102-104
151	H	H	H		OH	H	N	CH	C-OCH ₃	N	OCH ₃	olej, NMR
152	H	H	H		CH ₃ OH	H	N	CH	C-OCH ₃	N	OCH ₃	olej, NMR
155	H	H	H	CONHC ₁₀ H ₃₇	OH	H	N	CH	C-OCH ₃	n	OCH ₃	64-66
157	H	H	H		OH	H	N	CH	C-OCH ₃	N	OCH ₃	102-104


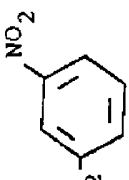
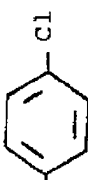
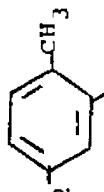

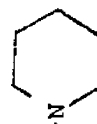
zlúče- nina č.	Y ¹	Y ²	Y ³	R	X	Y	W ¹	W ²	W ³	W ⁴	R ¹	teplota topenia °C
158	H	H	H	CONH ₂	benzyloxy	H	N	CH	C-OCH ₃	N	OCH ₃	115-116
159	H	H	H	CON(benzoyl) ₂	benzyloxy	H	N	CH	C-OCH ₃	N	OCH ₃	168-170
160	H	H	H	CONH-CH ₂ - 	OH	H	N	CH	C-OCH ₃	N	OCH ₃	88-90
161	H	H	H	CONH ₂		H	N	CH	C-OCH ₃	N	OCH ₃	138-140
162	H	H	H	CON(CO-C ₂ H ₅) 		H	N	CH	C-OCH ₃	N	OCH ₃	198-200
164	H	H	H	CONHCH ₂ - 	OH	H	N	CH	C-OCH ₃	N	OCH ₃	91-94
168	H	H	H	CONHCH ₂ - 	OH	H	N	CH	C-OCH ₃	N	OCH ₃	103-106

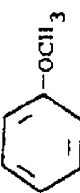
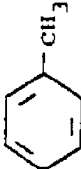
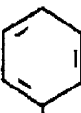
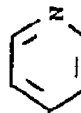

zložení ná č.	Y ¹	Y ²	Y ³	R	X	Y	W ¹	W ²	W ³	W ⁴	R ¹	teplota topenia °C
169	H	H	H	$\begin{array}{c} \text{-C-N-} \\ \\ \text{O} \end{array} \text{C=O}$ 		H	H	CH	C-OCH ₃	N	OCH ₃	135-137
170	H	H	H	CONH(t)C ₄ H ₉	OH	H	N	CH	C-OCH ₃	N	OCH ₃	109-110
171	H	H	H		OH	H	N	CH	C-OCH ₃	N	OCH ₃	NMR
172	H	H	H		OH	H	N	CH	C-OCH ₃	N	OCH ₃	140-142
177	H	H	H	CONHC ₂ H ₄ N(CH ₃) ₂	OH	H	N	CH	C-OCH ₃	N	OCH ₃	NMR

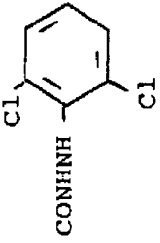

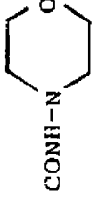
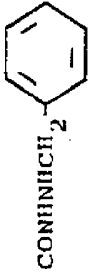

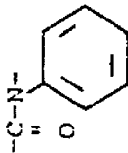
zlúče- nina č.	Y ¹	Y ²	Y ³	R	X	Y	W ¹	W ²	W ³	W ⁴	R ¹	teplota topenia °C
182	H	H	H	CONHNH		OH	H	N	C-OCH ₃	N	OCH ₃	117-120
183	H	H	H	CONH-		iC ₃ H ₇ OH	H	N	C-OCH ₃	N	OCH ₃	132-133
184	H	H	H	CONH-		OH	H	N	C-OCH ₃	N	OCH ₃	113-114
185	H	H	H	CONHSO ₂ CH ₃		OH	H	N	C-OCH ₃	N	OCH ₃	133-135
188	H	H	H	CONH-		OH	H	N	C-OCH ₃	N	OCH ₃	115-117
189	H	H	H	CONHCH ₂ COOCH ₃		OH	H	N	C-OCH ₃	N	OCH ₃	97-99
193	H	H	H	CONHCHCOOCH ₃ iC ₃ H ₇		OH	H	N	C-OCH ₃	N	OCH ₃	olej, NMR

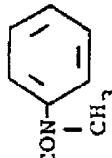
zlúče- nina č.	Y ¹	Y ²	Y ³	R	X	Y	W ¹	W ²	W ³	W ⁴	P ¹	teplota topenia °C
196	H	H	H	CONHCH ₂ 	OH	H	N	CH	C-OCH ₃	N	OCH ₃	olej, NMR
199	H	H	H	COOH	OH	H	N	CH	C-OCH ₃	N	OCH ₃	89-91 (sodná soľ)
200	H	H	H	CONHCH ₂ 	OH	H	N	CH	C-OCH ₃	N	OCH ₃	144-146
201	H	H	H	CONHCH ₂ 	OH	H	N	CH	C-OCH ₃	N	OCH ₃	olej, NMR
207	H	H	H	CONH ₂	dichlóracetoxy	H	N	CH	C-OCH ₃	N	OCH ₃	118-119
209	H	H	H	CONHCH ₂ -fenylo COOCH ₃	OH	H	N	CH	C-OCH ₃	N	OCH ₃	NMR

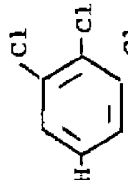
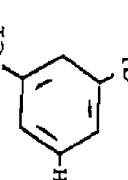
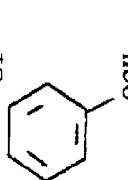
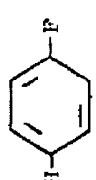
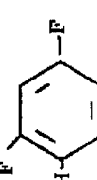
zlúče- nina č.	Y ¹	Y ²	Y ³	R	X	Y	W ¹	W ²	W ³	W ⁴	R ¹	teplota topenia °C	
210	H	H	H	CONHCH ₂		OH	H	N	CH	C-OCH ₃	N	OCH ₃	119-121
211	H	H	H	CONHCH ₂		OH	H	N	CH	C-OCH ₃	N	OCH ₃	125-127
212	H	H	H	CONCH ₂		OH	H	N	CH	C-OCH ₃	N	OCH ₃	olej, NMR
213	H	H	H	CONHCH ₂		OH	H	N	CH	C-OCH ₃	N	OCH ₃	olej, NMR
214	H	H	H	CONHCH ₂		OH	H	N	CH	C-OCH ₃	N	OCH ₃	olej NMR
215	H	H	H	CONH		OH	H	N	CH	C-OCH ₃	N	OCH ₃	119-120
217	H	H	H	CONH		OH	H	N	CH	C-OCH ₃	N	OCH ₃	182-193

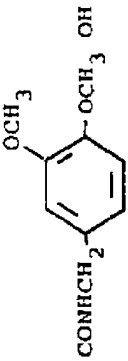
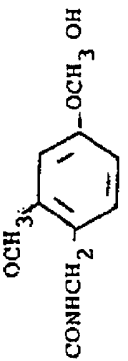
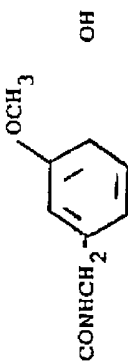
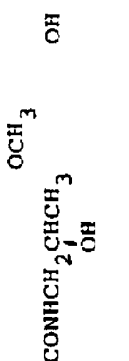
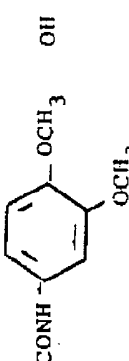
zlúče- nina č.	Y ¹	Y ²	Y ³	R	X	Y	W ¹	W ²	W ³	W ⁴	R ¹	teplota topenia °C
221	H	H	H	CONHCH ₂ - 	OH	H	N	CH	C-OCH ₃	N	OCH ₃	105-106
223	H	H	H	CONHCH ₂ - 	OH	H	N	CH	C-OCH ₃	N	OCH ₃	130-131
224	H	H	H	CONHCH ₂ - 	OH	H	N	CH	C-OCH ₃	N	OCH ₃	149-150
225	H	H	H	CONHCH ₂ - 	OH	H	N	CH	C-OCH ₃	N	OCH ₃	98-100
226	H	H	H	CONH-N- 	OH	H	N	CH	C-OCH ₃	N	OCH ₃	40-42
227	H	H	H	CONHC ₂ H ₄ -N- 	OH	H	N	CH	C-OCH ₃	N	OCH ₃	NMR

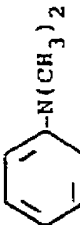


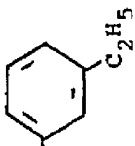

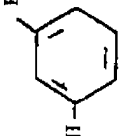
zlúče- nina č.	Y ¹	Y ²	Y ³	R	X	Y	W ¹	W ²	W ³	W ⁴	R ¹	teplota topenia °C
229	H	H	H	CONHII		OH	H	CH	C-OCH ₃	N	OCH ₃	121-123
230	H	H	H	CONHII		OH	H	CH	C-OCH ₃	N	OCH ₃	130-132
231	H	H	H	CONH		OH	H	CH	C-OCH ₃	N	OCH ₃	138-140
232	H	H	H	CONH		OH	H	CH	C-OCH ₃	N	OCH ₃	152-154
233	H	H	H	CONHC ₃ H ₆ (CH ₃) ₂	OH	H	H	CH	C-OCH ₃	N	OCH ₃	NMR
234	H	H	H	CONHC ₂ H ₄ N(C ₂ H ₅) ₂	OH	H	H	CH	C-OCH ₃	N	OCH ₃	NMR
241	H	H	H	COOH	OH	H	H	CH	C-OCH ₃	N	OCH ₃	158-160 (litna soľ)
245	H	H	H	CONHII		OH	H	CH	C-OCH ₃	N	OCH ₃	NMR




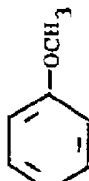

zlúče- nina č.	Y ¹	Y ²	Y ³	R	X	Y	W ¹	W ²	W ³	W ⁴	R ¹	teplota topenia °C
246	H	H	H	 <chem>Clc1cc(Cl)ccc1C(=O)NN</chem>	OH	H	N	CH	C-OCH ₃	N	OCH ₃	133-134
252	H	H	H	 <chem>Brc1ccc(NC(=O)N)cc1</chem>	OH	H	N	CH	C-OCH ₃	N	OCH ₃	150-151
255	H	H	H	 <chem>C1CCN(C1)C(=O)N</chem>	OH	H	N	CH	C-OCH ₃	N	OCH ₃	52-54
257	H	H	H	 <chem>Nc1ccccc1C(=O)N</chem>	OH	H	N	CH	C-OCH ₃	N	OCH ₃	NMR
259	H	H	H	 <chem>Nc1ccccc1C(=O)N</chem>	OH	H	N	CH	C-OCH ₃	N	OCH ₃	54-56
271	H	H	H	 <chem>Nc1ccccc1C(=O)N</chem>	OH	H	N	CH	C-OCH ₃	N	OCH ₃	137-138

zlúčenina č.	Y ¹	Y ²	Y ³	R	X	Y	W ₁	W ₂	W ₃	W ₄	R ¹	teplota topenia °C
272	H	H	H	COOH	=O	N	N	CH	C-OCH ₃	N	OCH ₃	210 (rozklad) (litna soľ)
273	H	H	H		=O	N	CH	C-OCH ₃				147-149
275	H	H	H	CONHNH	OH	H	N	CH	C-OCH ₃	N	OCH ₃	158-160
276	H	H	H	COOH	=O	N	N	CH	C-OCH ₃	N	OCH ₃	195 (rozklad) (sodná soľ) 255 (rozklad) (draselná soľ)
278	H	H	H	CONHC ₉ H ₁₉	OH	H	N	CH	C-OCH ₃	N	OCH ₃	45-47
279	H	H	H	CONHC ₁₀ H ₂₁	OH	H	N	CH	C-OCH ₃	N	OCH ₃	49-51
280	H	H	H	CONHNH	OH	H	N	CH	C-OCH ₃	N	OCH ₃	58-62
282	H	H	H	CONHC ₂ iPr	OH	H	N	CH	C-OCH ₃	N	OCH ₃	103-105
283	H	H	H	CONHC ₂ CH(OCH ₃) ₂	OH	H	N	CH	C-OCH ₃	N	OCH ₃	NMR
284	H	H	H	CONH-C(CH ₃) ₂ -C≡CH	OH	H	N	CH	C-OCH ₃	N	OCH ₃	NMR
285	H	H	H	CONHC ₄ H ₉	OH	H	N	CH	C-OCH ₃	N	OCH ₃	NMR
286	H	H	H	CONHC(CH ₂) ₂ OCH ₃ CH ₃	OH	H	N	CH	C-OCH ₃	N	OCH ₃	NMR



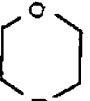
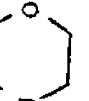

zloženie- nina č.	Y ¹	Y ²	Y ³	R	X	Y	W ¹	W ²	W ³	W ⁴	R ¹	teplota topenia °C	
288	H	H	H	CONHNH-		OH	H	N	CII	C-OCH ₃	N	OCH ₃	182-184
289	H	H	H	CONHNH-		OH	H	N	CH	C-OCH ₃	N	OCH ₃	181-183
290	H	H	H	CONH-		OH	H	N	CH	C-OCH ₃	N	OCH ₃	NMR
291	H	H	H	CONHC ₆ H ₁₂ N(CH ₃) ₂	OH	H	N	N	CII	C-OCH ₃	N	OCH ₃	NMR
292	H	H	H	CONHC ₄ H ₈ N(CH ₃) ₂	OH	H	N	N	CII	C-OCH ₃	N	OCH ₃	NMR
293	H	H	H	CONHNH-		OH	H	N	CH	C-OCH ₃	N	OCH ₃	131-132
294	H	H	H	CONHNH-		OH	H	N	CH	C-OCH ₃	N	OCH ₃	124-126

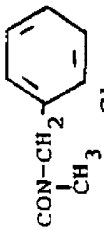
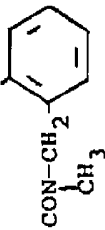
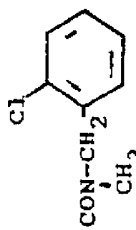
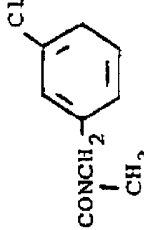
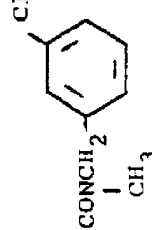
Zlúčenina č.	Y ¹	Y ²	Y ³	R	X	Y	W ¹	W ²	W ³	W ⁴	R ²	teplota topenia °C
295	H	H	H	CONHCH ₂		H	N	CH	C-OCH ₃	N	OCH ₃	NMR
296	H	H	H	CONHCH ₂		H	N	CH	C-OCH ₃	N	OCH ₃	88-90
297	H	H	H	CONHCH ₂		H	N	CH	C-OCH ₃	N	OCH ₃	NMR
298	H	H	H	CONHCH ₂ CH(OH)CH ₃		H	N	CH	C-OCH ₃	N	OCH ₃	NMR
303	H	H	H	CONH		H	N	CH	C-OCH ₃	N	OCH ₃	NMR



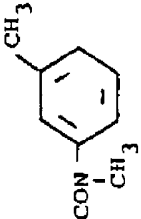
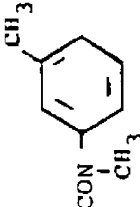
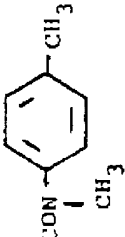
zlúče- nina č.	y ¹	y ²	y ³	R	X	Y	W ¹	W ²	W ³	W ⁴	R ¹	teplota topenia °C
304	H	H	H	CONH		H	N	CH	C-OCH ₃	N	OCH ₃	54-56
305	H	H	H	CONHC CH ₃		H	N	CH	C-OCH ₃	N	OCH ₃	D(+) 64-68 L(-) NMR
309	H	H	H	CONH		H	N	CH	C-OCH ₃	N	OCH ₃	133-134
310	H	H	H	CONH		H	N	CH	C-OCH ₃	N	OCH ₃	102-104
311	H	H	H	CONH		H	N	CH	C-OCH ₃	N	OCH ₃	122-123
312	H	H	H	CONH		H	N	CH	C-OCH ₃	N	OCH ₃	126-128


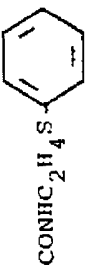
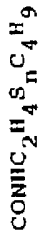
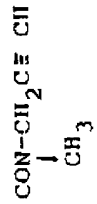
zloženie náina č.	Y ¹	Y ²	Y ³	R	X	Y	W ¹	W ²	W ³	W ⁴	R ¹	teplota topenia °C
313	H	H	H	CONHCH ₂ 	 -N(CH ₃) ₂ OH	H	N	CH	C-OCH ₃	N	OCH ₃	106-108
318	H	H	H	COOH	OH	H	N	CH	C-OCH ₃	N	OCH ₃	185-188 (rozklad) (lítna soľ)
322	H	H	H	COOH	OH	H	N	CH	C-OCH ₃	N	OCH ₃	>195 (rozklad) (lítna soľ)
323	H	H	H	COOH	OH	H	N	CH	C-OCH ₃	N	OCH ₃	>225 (rozklad) (lítna soľ)
324	H	H	H	COOH	OH	H	N	CH	C-OCH ₃	N	OCH ₃	195 (rozklad) (lítna soľ)
325	H	H	H	COOH	OH	H	N	CH	C-OCH ₃	N	OCH ₃	225 (rozklad) (lítna soľ)
327	H	H	H	CONH- 	H	H	N	CH	C-OCH ₃	N	OCH ₃	96-98
328	H	H	H	CON-  -OCH ₃ CH ₃	=O	N	CH	C-OCH ₃	N	OCH ₃	OCH ₃	114-116
329	H	H	H	CON-  -Cl CH ₃	=O	N	CH	C-OCH ₃	N	OCH ₃	OCH ₃	146-148

zlúče- nina č.	Y ¹	Y ²	Y ³	R	X	=O	Y	W ¹	W ²	W ³	W ⁴	R ¹	teplota topenia °C
379	H	H	H	CON(C ₂ H ₅) ₂		=O	N	CH	C-OCH ₃	N	OCH ₃		
380	H	H	H	CON(C ₂ H ₅) ₂	OH		H	CH	C-OCH ₃	N	OCH ₃		
381	H	H	H	CON(C ₃ H ₇) ₂		=O	N	CH	C-OCH ₃	N	OCH ₃		
382	H	H	H	CON(C ₃ H ₇) ₂	OH		H	CH	C-OCH ₃	N	OCH ₃		
383	H	H	H	CON-OCH ₃ CH ₃		=O	N	CH	C-OCH ₃	N	OCH ₃		
384	H	H	H	CON-OCH ₃ CH ₃	OH		H	CH	C-OCH ₃	N	OCH ₃		
385	H	H	H	CON(CH ₃) ₂		=O	N	CH	C-OCH ₃	N	OCH ₃		
386	H	H	H	CON(CH ₃) ₂	OH		H	CH	C-OCH ₃	N	OCH ₃		
387	H	H	H	CON-N(CH ₃) ₂ C ₆ H ₅		=O	N	CH	X-OCH ₃	N	OCH ₃		
388	H	H	H	CON-N(CH ₃) ₂ C ₆ H ₅	OH		H	CH	C-OCH ₃	N	OCH ₃		

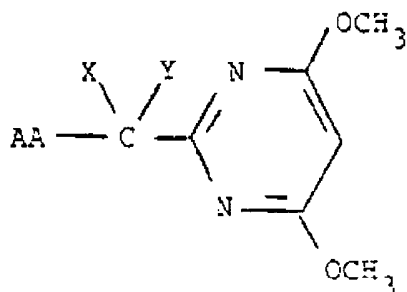
zlúče- nina č.	Y ¹	Y ²	Y ³	R	X	=O	Y	W ¹	W ²	W ³	W ⁴	R ¹	teplota topenia °C
389	H	H	H	CON 		=O	N	CII	C-OCH ₃	N	OCH ₃		
390	H	H	H	CON 	OH		H	CII	C-OCH ₃	N	OCH ₃		
391	H	H	H	CON 		=O	N	CII	C-OCH ₃	N	OCH ₃		
392	H	H	H	CON 	OH		H	CII	C-OCH ₃	N	OCH ₃		
393	H	H	H	CONC ₆ H ₁₃ CH ₃		=O	N	CII	C-OCH ₃	N	OCH ₃		
394	H	H	H	CONC ₆ H ₁₃ CH ₃	OH		H	CII	C-OCH ₃	N	OCH ₃		
395	H	H	H	CON-CH ₂ - CH ₃ 		=O	N	CII	C-OCH ₃	N	OCH ₃		

zložení ná č.	Y ¹	Y ²	Y ³	Y ⁴	R	X	=O	Y	W ¹	W ²	W ³	W ⁴	R ¹	teplota topenia °C
396	H	H	H	H		OH		H	N	CH	C-OCH ₃	N	OCH ₃	
397	H	H	H	H			=O		N	CH	C-OCH ₃	N	OCH ₃	
398	H	H	H	H		OH		H	N	CH	C-OCH ₃	N	OCH ₃	
399	H	H	H	H			=O		N	CH	C-OCH ₃	N	OCH ₃	
400	H	H	H	H		OH		H	N	CH	C-OCH ₃	N	OCH ₃	

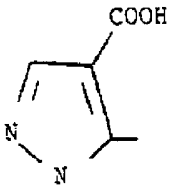
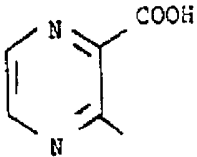
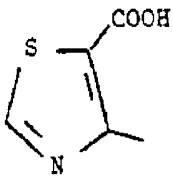
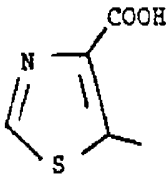
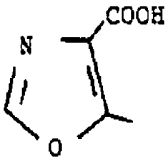
zlúče- nina Ć.	Y ¹	Y ²	Y ³	R	X	Y	W ¹	W ²	W ³	W ⁴	R ¹	teplota topenia °C
401	H	H	H		=O	H	N	CH	C-OCH ₃	N	OCH ₃	
402	H	H	H		OH	H	N	CH	C-OCH ₃	N	OCH ₃	
403	H	H	H		=O	H	N	CH	C-OCH ₃	N	OCH ₃	
404	H	H	H		OH	H	N	CH	C-OCH ₃	N	OCH ₃	
405	H	H	H		=O	H	N	CH	C-OCH ₃	N	OCH ₃	

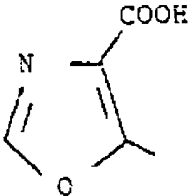
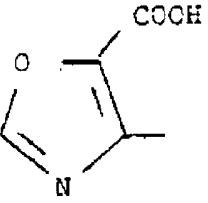
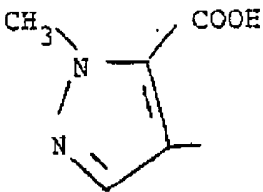
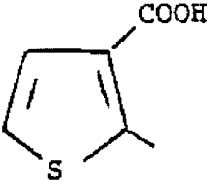
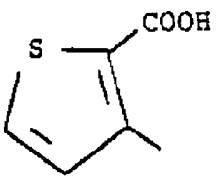
zlúče- nina č.	γ^1	γ^2	γ^3	R	X	Y	W^1	W^2	W^3	W^4	R^1	teplota topenia °C	
406	H	H	H		OH	H	N	CH	C-OCH ₃	N	OCH ₃		
407	H	H	H		OH	H	N	CH	C-OCH ₃	N	OCH ₃	živica	NMR
411	H	H	H		OH	H	N	CH	C-OCH ₃	N	OCH ₃	živica	NMR
413	H	H	H		=O		N	CH	C-OCH ₃	N	OCH ₃	živica	NMR

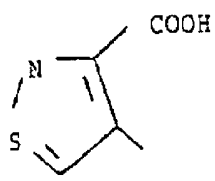
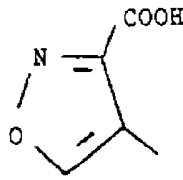
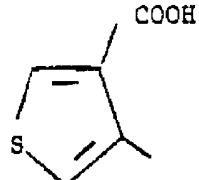
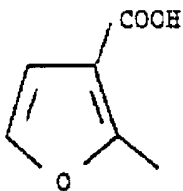
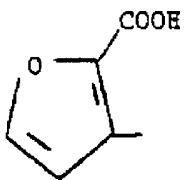
Tabulka F

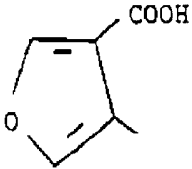
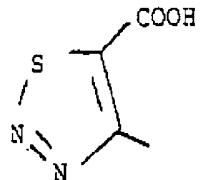
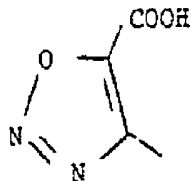
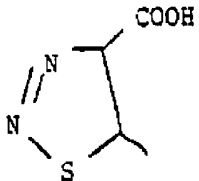


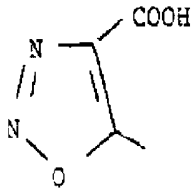
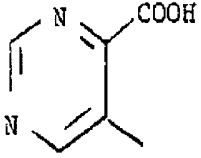
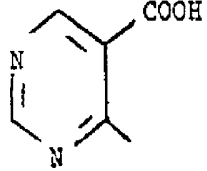
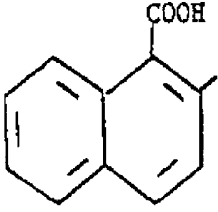
zlúče- nina č.	AA	X	Y	teplota topenia °C
90		H	H	123-125
331		=O		
332	- " -	OH	H	
333		=O		
334	- " -	OH	H	

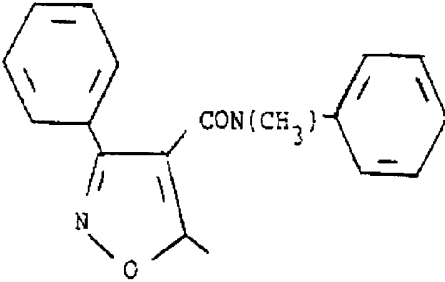
zlúče- nina č.	AA	X	Y	teplota topenia °C
335			=O	
336	- " -	OH	H	
337			=O	
338	- " -	OH	H	
339			=O	
340	- " -	OH	H	
341			=O	
342	- " -	OH	H	
343			=O	

zlúče- nina č.	AA	X	Y	teplota topenia °C
344		OH	H	
345			=O	
346	- " -	OH	H	
347			=O	
348	- " -	OH	H	
349			=O	
350	- " -	OH	H	
351			=O	
352	- " -		=O	

zlúče- nina č.	AA	X	Y	teplota topenia °C
353			=O	
354	- " -	OH	H	
355			=O	
356	- " -	OH	H	
357			=O	
358	- " -	OH	H	
359			=O	
360	- " -	OH	H	
361			=O	
362	- " -	OH	H	

slouče- nina č.	AA	X	Y	teplota topenia °C
363				=0
364	- " -	OH	H	
365				=0
366	- " -	OH	H	
367				=0
368	- " -	OH	H	
369				=0
370	- " -	OH	H	

zlúče- nina č.	AA	X	Y	teplota topenia °C
371			=O	
372	- " -	OH	H	
373			=O	
374	- " -	OH	H	
375			=O	
376	- " -	OH	H	
377			=O	
378	- " -	OH	H	

zlúče- nina č.	AA	X	Y	teplota topenia °C
410		H	H	122-123
412	- " -	H	OC ₄ H ₉	živica , NMR

Zlúčeniny z tabuľky F, kde COOH je nahradené inými významami R, tak ako sú uvedené v tabuľkách C, D a E hore, sa môžu pripravovať analogickým spôsobom.

SK 278746 B6

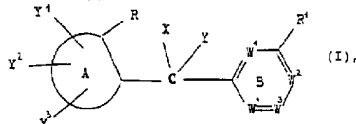
Hodnoty ³ H-NMR spektrá (deuteriochloroform):			
zlúče- nina č.	hodnoty δ		
41	3,95 (s, 6H, OCH ₃), 5,95 (s, 1H, H-pyrimidín), 6,45 (s, 1H, OCH), 7,7 - 9,1 (m, 3H, H-pyridín).	5	119 3,05 (d, 3H, NCH ₃), 3,94 (s, 6H, OCH ₃), 5,20 (s, 1H, OH), 5,75 (s, 1H, OCH), 5,98 (s, 1H, H-pyrimidín), 7,26 (d, 1H, H-pyridín), 7,82 (q, 1H, NH), 8,28 (d, 1H, H-pyridín).
44	1,32 (t, 3H, CH ₃), 2,87 (q, 2H, CH ₂), 4,05 (s, 6H, OCH ₃), 6,3 (s, 1H, OCH), 7,82 (d, 1H, aromatika), 8,72 (d, 1H, aromatika).	10	127 3,75 (s, 6H, OCH ₃), 4,05 (t, 2H, NCH ₃), 5,05 - 5,5 (m, 3H, CH-CH ₂), 5,85 (s, 1H, pyrimidín), 7,2 - 8,6 (m, 9H, aromatika + OCH).
46	1,32 (t, 3H, CH ₃), 2,85 (q, 2H, CH ₂), 3,87 (s, 6H, OCH ₃), 5,97 (s, 1H, H-pyrimidín), 6,32 (s, 1H, OCH), 8,08 (d, 1H, H-pyridín), 8,71 (d, 1H, H-pyridín).	15	128 2,20 (s, 3H, CH ₃), 3,75 (s, 6H, OCH ₃), 4,10 (t, 2H, NCH ₃), 5,0 - 6,6 (m, 3H, CH-CH ₂), 5,85 (s, 1H, pyrimidín), 7,2 - 8,6 (m, 5H, pyridín + NH, OCH).
48	1,25 (s, 6H, CH ₃), 3,85 (s, 6H, OCH ₃), 3,95 (2H, OCH ₂), 4,65 (s, 2H, CH ₂), 5,85 (s, 1H, H-pyrimidín), 7,2 - 8,0 (4H, aromatika).	20	130 0,75 - 1,61 (m, 15H, alifatika), 1,61 - 3,02 (m, 8H, alifatika), 3,15 - 3,61 (m, 2H, NCH ₃), 3,81 (s, 6H, OCH ₃), 5,82 (s, 1H, OCH), 6,81 (s, 1H, pyrimidín), 7,21 - 7,52 (q, 1H, pyridín), 7,92 - 8,15 (d, 1H, pyridín), 8,17 - 8,32 (m, 1H, NH), 8,35 - 8,52 (d, 1H, pyridín).
49	1,00 (s, 6H, CH ₃), 3,65 a 3,75 (dvojité dublet, 2H, OCH ₃), 6,05 (s, 1H, H-pyrimidín), 7,2-8,1 (4H, H-aromatika).	25	133 2,85 (d, 3H, NCH ₃), 3,85 (s, 6H, OCH ₃), 4,10 (t, 2H, NCH ₃), 5,0 - 6,0 (m, 3H, CH-CH ₂), 5,85 (s, 1H, pyrimidín), 7,2 - 8,6 (m, 4H, pyridín + OCH).
54	2,9 (s, 3H, CH ₃ N), 3,10 (s, 3H, CH ₃ O), 3,90 (s, 6H, OCH ₃ -aromatika), 6,10 (s, 1H, H-pyrimidín), 7,2 - 7,9 (3H, H-aromatika).	30	150 0,96 (t, 3H, CH ₃), 1,68 (m, 2H, CH ₂ CH ₂ CH ₃), 3,50 (m, 2H, NCH ₃), 3,93 (s, 6H, OCH ₃), 5,92 (s, 1H, H-pyrimidín), 6,17 (d, 1H, OCH), 7,21 (dvojité dublet, 1H, H-pyridín), 8,07 (dvojité dublet, 1H, H-pyridín), 8,57 (dvojité dublet, 1H, H-pyridín), 8,66 (t, 1H, NH).
61	1,24 (s, 6H, CH ₃), 3,98 (s, 2H, CH ₂ O), 4,74 (s, 2H, CH ₂), 7,16 (s, 1H, H-pyrimidín).	35	151 1,41 - 1,61 (d, 3H, CH ₃), 3,82 (s, 6H, OCH ₃), 4,92 - 5,35 (m, 2H, NCH ₃ , OH), 5,81 (s, 1H, OCH), 6,85 (s, 1H, pyrimidín), 7,12 - 7,51 (m, 6H, aromatika a pyridín), 7,82 - 8,10 (d, 1H, pyridín), 8,38 - 8,50 (d, 1H, pyridín), 8,51 - 8,82 (m, 1H, NH).
65	3,96 (s, 6H, OCH ₃), 5,96 (s, 1H, H-pyrimidín), 6,32 (s, 1H, OCH), 7,27 (d, 1H, H-tienyl), 7,85 (d, 1H, H-tienyl).	40	152 2,25 (s, 3H, CH ₃), 3,89 (s, 6H, OCH ₃), 3,42 - 3,61 (d, 2H, NCH ₃), 5,81 (s, 1H, OCH), 6,85 (s, 1H, pyrimidín), 7,03 (s, 4H, aromatika), 7,12 - 7,52 (q, 1H, pyridín), 7,85 - 8,12 (d, 1H, pyridín), 8,40 - 8,51 (d, 1H, pyridín), 8,58 - 8,72 (m, 1H, NH).
66	4,08 (s, 6H, OCH ₃), 6,27 (s, 1H, OCH), 7,18 (d, 1H, H-tienyl), 7,95 (d, 1H, H-tienyl).	45	171 1,24 (t, 3H, CH ₃), 2,60 (q, 2H, CH ₂), 3,86 (s, 6H, OCH ₃), 4,62 (d, 2H, NCH ₃), 5,86 (s, 1H, pyrimidín H), 6,90 (d, 1H, OCH), 7,0 - 8,54 (m, 7H, H-aromatika), 8,60 (bs, 1H, NH).
76	1,63 (t, 3H, CH ₂ CH ₃), 3,91 (s, 6H, OCH ₃), 4,1 (q, 2H, OCH ₂), 6,08 (s, 1H, H-pyrimidín), 7,2 - 7,8 (m, 3H, H-aromatika).	50	174 3,83 (s, 3H, OCH ₃), 3,90 (s, 6H, OCH ₃), 5,83 (s, 1H, H-pyrimidín), 6,60 (d, 1H, OCH), 7,30 (dvojité dublet, 1H, H-pyridín), 8,23 (dvojité dublet, 1H, H-pyridín), 8,70 (dvojité dublet, 1H, H-pyridín).
83	3,85 (s, 6H, OCH ₃), 4,52 - 4,63 (d, 2H, NCH ₃), 5,21 - 5,42 (s, 1H, OH), 5,80 (s, 1H, OCH), 6,82 (s, 1H, pyrimidín), 7,25 (s, 5H, aromatika), 7,31 - 7,52 (m, 1H, pyridín), 7,80 - 8,12 (d, 1H, pyridín), 7,80 - 8,12 (d, 1H, pyridín), 8,35 - 8,55 (d, 1H, pyridín), 8,56 - 8,88 (s, 1H, NH).	55	177 2,20 (s, 6H, CH ₃), 2,31 - 2,60 (m, 2H, CH ₂ N), 3,31 - 3,75 (q, 2H, NCH ₃), 3,78 (s, 6H, OCH ₃), 5,75 (s, 1H, OCH), 6,61 (s, 1H, pyrimidín), 7,13 - 7,42 (q, 1H, pyridín), 7,71 - 7,91 (d, 1H, pyridín), 8,31 - 8,51 (d, 1H, pyridín).
84	3,85 (s, 6H, OCH ₃), 4,05 (t, 2H, NCH ₃), 5,0 - 5,45 (m, 3H, CH-CH ₂), 5,85 (s, 1H, pyrimidín), 6,80 (s, 1H, OCH), 7,2 - 8,6 (m, 3H, pyridín).	60	178 3,85 (s, 9H, OCH ₃), 3,95 (s, 3H, OCH ₃), 4,14 (s, 2H, CH ₂), 5,82 (s, 1H, H-pyrimidín), 6,90 (d, 1H, H-pyridín), 8,12 (d, 1H, H-pyridín).
86	3,85 (s, OCH ₃), 5,37 (s, OCH ₃ Ar), 5,85 (s, pyrimidín), 6,80 (d, OCH), 7,2 - 8,2 (m, aromatika), zmes so zlúčeninou č. 40.		187 3,70 (s, 9H, OCH ₃), 5,82 (s, 1H, H-pyrimidín), 6,80 (d, 1H, H-pyridín), 8,10 (d, 1H, H-pyridín).
88	4,00 (s, 3H, OCH ₃), 5,50 (s, 2H, OCH ₃), 6,05 (s, 1H, H-pyrimidín), 6,27 (s, 1H, O-CH), 7,1 - 7,7 (m, 8H, H-aromatika).		193 0,85 - 1,05 (d, 6H, CH ₃), 3,85 (s, 6H, OCH ₃), 4,53 - 4,82 (q, 1H, CH), 5,25 - 5,55 (m, 2H, OH a NCH ₃), 5,82 (s, 1H, OCH), 6,88 (s, 1H, pyrimidín), 7,25 - 7,51 (q, 1H, pyridín), 7,83 - 8,05 (d, 1H, pyridín), 8,41 - 8,60 (d, 1H, pyridín), 8,72 - 8,85 (d, 1H, NH).
95	3,85 (s, 6H, OCH ₃), 5,42 (m, 2H, OCH ₃), 6,05 (s, 1H, OCH), 6,42 (s, 1H, pyrimidín), 7,05 - 7,35 (s, 5H, aromatika), 7,35 - 7,768 (m, 11H, pyridín), 7,78 - 8,1 (d, 1H, pyridín), 8,81 - 9,01 (d, 1H, pyridín).		196 3,78 (s, 6H, OCH ₃), 4,51 - 4,78 (d, 2H, NCH ₃), 5,35 (s, 1H, OH), 5,81 (s, 1H, OCH), 6,28 (s, 2H, furfuryl), 6,81 (s, 1H, pyrimidín), 7,12 - 7,43 (m, 2H, furfuryl), 7,82 - 8,05 (d, 1H, pyridín), 8,31 - 8,43 (d, 1H, pyridín), 8,52 - 8,71 (m, 1H, NH).
97	3,80 (s, 6H, OCH ₃), 5,35 (s, 2H, OCH ₃ Ar), 6,85 (s, 1H, pyrimidín), 6,65 (s, 1H, OCH), 7,15 - 8,6 (m, 8H, aromatika), zmes so zlúčeninou č. 40.		201 1,87 - 2,04 (m, 4H, CH ₂ a tetrahydrofuran), 3,71 - 3,92 (m, 9H, OCH ₃ a tetrahydrofuran), 5,86 - 5,87 (m, 2H, OCH a OH), 6,71 (d, 1H, pyrimidín), 7,31 - 7,42 (d, 1H, pyridín), 7,81 - 7,92 (d, 1H, pyridín), 8,41 - 8,50 (d, 2H, NH a pyridín).
107	1,92 (s, 3H, O=CCH ₃), 3,98 (s, 6H, OCH ₃), 4,92 (s, 2H, OCH ₂), 6,07 (s, 1H, OCH), 6,58 (s, 1H, pyrimidín), 7,52 - 7,88 (m, 1H, pyridín), 8,10 - 8,32 (d, 1H, pyridín), 8,90 - 8,91 (d, 1H, pyridín).		206 2,22 (s, 1H, CH ₃), 3,85 (s, 6H, OCH ₃), 3,92 (s, 3H, OCH ₃), 3,97 (s, 3H, OCH ₃), 5,86 (s, 1H, H-pyrimidín), 6,80 (s, 1H, OCH), 7,10 (d, 1H, H-pyridín), 8,16 (d, 1H, H-pyridín).
110	0,75 - 1,12 (t, 3H, CH ₃), 3,18 - 3,48 (m, 2H, CH ₂), 3,81 (s, 6H, OCH ₃), 4,42 - 4,91 (m, 3H, OH a NCH ₃), 5,82 (s, 1H, OCH), 6,72 (s, 1H, pyrimidín), 7,21 - 7,52 (m, 1H, pyridín), 7,82 - 8,08 (d, 1H, pyridín), 8,32 - 8,61 (d, 1H, pyridín).		
112	1,12 - 1,31 (d, 6H, CH ₃), 3,81 (s, 6H, OCH ₃), 4,12 - 4,32 (m, 1H, NCH ₃), 5,85 (s, 1H, OCH), 6,71 (s, 1H, pyrimidín), 7,21 - 7,52 (q, 1H, pyridín), 7,81 - 8,09 (d, 1H, pyridín), 8,12 - 8,31 (m, 1H, NH), 8,39 - 8,55 (d, 1H, pyridín).		

209	3,63 - 3,74 (t, 9H, OCH ₃), 5,48 - 5,81 (m, 4H, CHO, OH, COCH), 6,88 - 7,42 (m, 8H, fenyl, pyrimidin, pyridin), 7,94 - 7,97 (d, 1H, pyridin), 8,45 - 8,47 (d, 1H, pyridin), 9,24 - 9,26 (d, 1H, NH).	284	1,71 - 1,76 (s, 6H, CH ₃), 2,31 (s, 1H, C=CH), 3,82 (s, 6H, OCH ₃), 5,61 - 5,63 (d, 1H, OH), 5,85 (s, 1H, OCH), 6,86 - 6,96 (d, 1H, pyrimidin), 7,44 - 7,48 (m, 1H, pyridin), 7,94 - 7,98 (d, 1H, pyridin), 8,44 - 8,45 (d, 2H, NH).	
212	3,85 (s, 6H, OCH ₃), 4,41 - 4,52 (m, 2H, NCH ₃), 5,21 - 5,72 (d, s, 4H, NH ₂ , OCH, OH), 6,61 (s, 1H, pyrimidin), 7,12 - 7,32 (m, 3H, pyridin, benzylsulfon), 7,71 - 7,80 (m, 3H, pyridin, benzylsulfon), 8,3 (d, 1H, pyridin), 8,71 (m, 1H, NH).	5	285	0,75 - 1,13 (m, 4H, alifatika), 1,28 - 1,77 (m, 3H, alifatika), 3,23 - 3,52 (m, 2H, NCH ₃), 3,82 (s, 6H, OCH ₃), 5,73 - 5,88 (m, 2H, OH, OCH), 6,60 - 6,81 (d, 1H, pyrimidin), 7,21 - 7,45 (q, 1H, pyridin), 7,78-8,01 (d, 1H, pyridin), 8,32 - 8,55 (d, 2H, pyridin, NH).
213	3,61 (s, 6H, OCH ₃), 4,60 - 5,18 (m, 3H, Arch ₂ , OH), 5,72 (s, 1H, OCH), 6,72 (s, 1H, pyrimidin), 7,15 - 7,17 (t, 5H, pyridin), 7,84 - 7,86 (d, 1H, pyridin), 8,38 - 8,44 (d, 2H, pyridin), 9,12 (s, 1H, NH).	10	286	1,21 - 1,32 (d, 2H, CH ₂ O), 3,38 - 3,58 (d, 6H, CH ₃), 3,85 (s, 6H, OCH ₃), 4,18 - 4,48 (m, 2H, NCH, OH), 5,88 (s, 1H, OCH), 6,73 (s, 1H, pyrimidin), 7,28 - 7,52 (q, 1H, pyridin), 7,81 - 8,08 (d, 1H, pyridin), 8,43 - 8,62 (d, 2H, pyridin, NH).
214	3,75 (s, 6H, OCH ₃), 4,72 - 4,74 (d, 2H, NCH ₃), 5,84 (s, 1H, OCH), 6,86 - 6,96 (d, 3H, pyrimidin, tienofenyl), 7,14 - 7,16 (d, 1H, pyridin), 7,32 - 7,36 (d, 1H, pyridin), 7,94 - 7,97 (d, pyridin), 8,39 - 8,40 (d, 1H, pyridin), 8,71 (d, 1H, NH).	15	290	3,74 (s, 9H, OCH ₃), 5,44 (bs, 1H, OH), 5,73 (s, 1H, pyrimidin), 6,62 (bs, 1H, OCH), 6,9 - 8,6 (m, aromatiká, 7H), 10,22 (s, 1H, NH).
216	1,31 (t, 3H, CH ₃), 2,62 (s, 3H, CH ₃), 3,87 (s, 6H, OCH ₃), 4,21 (s, 2H, CH ₂), 4,40 (q, 2H, OCH ₃), 5,83 (s, 1H, H-pyrimidin), 7,13 (d, 1H, H-pyridin), 8,44 (d, 1H, H-pyridin).	20	291	1,40 (s, 6H, CH ₃), 2,28 (s, 6H, NCH ₃), 2,68 (m, 2H, NCH ₃), 3,40 (m, 2H, NCH ₃), 3,80 (s, 6H, OCH ₃), 5,80 (s, 1H, pyrimidin), 6,70 (s, 1H, OCH), 7,2 - 8,6 (m, 4H, H-pyridin + OH).
218	284 (3,08) (s, 3H, NCH ₃), 3,92 (s, 6H, OCH ₃), 4,50-5,03 (m, 2H, NCH ₃), 6,10 (s, 1H, H-pyrimidin), 7,10 - 7,80 (m, 7H, H-aromatika).	25	292	1,60 (m, 4H, CH ₂), 2,25 (s, 6H, NCH ₃), 2,25 (m, 2H, NCH ₃), 3,48 (m, 2H, NCH ₃), 3,65 (s, 6H, OCH ₃), 5,80 (s, 1H, pyrimidin), 6,65 (s, 1H, OCH), 7,2 - 8,6 (m, 4H, pyridin + OH).
227	1,50 (m, 6H, CH ₃), 2,40 (m, 6H, NCH ₃), 3,55 (q, 2H, NCH ₃), 3,80 (s, 6H, OCH ₃), 5,85 (s, 1H, H-pyrimidin), 6,70 (s, 1H, OCH), 7,15 - 8,60 (m, 1H, 3 H-pyridin + NH).	25	295	3,74 (s, 6H, OCH ₃), 3,80 (s, 6H, OCH ₃), 4,50 (d, 2H, NCH ₃), 5,84 (s, 1H, pyrimidin), 6,5 - 8,6 (m, 8H, aromatika, OCH, NH).
233	1,80 (q, 2H, CH ₂), 2,25 (s, 6H, NCH ₃), 2,35 (q, 2H, NCH ₃), 3,45 (q, 2H, NCH ₃), 3,80 (s, 6H, CH ₃), 5,80 (s, 1H, pyridin), 6,65 (s, 1H, OCH), 7,15 - 8,50 (m, 3H, pyridin).	30	297	3,65 (s, 6H, OCH ₃), 3,77 (s, 6H, OCH ₃), 4,50 (d, 2H, NCH ₃), 5,64 (d, 1H, OH), 5,80 (s, 1H, pyrimidin), 6,25 - 6,60 (m, 3H, aromatika), 6,8 (d, 1H, OCH), 7,2 - 8,6 (m, 3H, pyridin).
234	1,00 (t, 6H, CH ₃), 2,60 (m, 6H, NCH ₃), 3,50 (q, 2H, NCH ₃), 3,92 (s, 6H, OCH ₃), 5,80 (s, 1H, H-pyrimidin), 6,80 (s, 1H, OCH), 7,15 - 8,7 (m, 3H, pyridin).	35	298	3,82 (s, 6H, OCH ₃), 5,81 (s, 1H, OCH), 6,29 - 7,58 (m, 8H, OH, NH, pyrimidin, aromatika, pyridin), 7,80 - 8,25 (d, 1H, pyridin), 8,48 - 8,62 (d, 1H, pyridin), 9,74 - 9,93 (br, 1HNH).
236	1,37 (t, 3H, CH ₃), 2,56 (s, 3H, CH ₃), 3,87 (s, 6H, OCH ₃), 4,43 (q, 2H, OCH ₃), 5,87 (s, 1H, H-pyrimidin), 6,12 (s, 1H, CHBr), 7,90 (d, 1H, H-pyridin), 8,56 (d, 1H, H-pyridin).	40	299	0,85 (t, 3H, CH ₃), 1,2 (m, 8H, alifatika), 1,6 (m, 2H, alifatika), 3,95 (s, 6H, OCH ₃), 4,08 (t, 2H, OCH ₃), 6,15 (s, 1H, H-pyrimidin), 7,4 - 7,7 (m, 3H, aromatiká).
237	1,40 (t, 3H, CH ₃), 3,87 (s, 6H, OCH ₃), 4,43 (q, 2H, OCH ₃), 4,70 (s, 2H, CH ₂ Br), 5,88 (s, 1H, H-pyrimidin), 6,23 (s, 1H, CHBr), 8,07 (d, 1H, H-pyridin), 8,65 (d, 1H, H-pyridin).	40	300	0,90 (t, 3H, CH ₃), 1,2 (m, 10H, alifatika), 1,6 (m, 2H, alifatika), 3,95 (s, 6H, OCH ₃), 4,08 (t, 2H, OCH ₃), 4,08 (t, 2H, OCH ₃), 6,15 (s, 1H, H-pyrimidin), 7,4 - 7,7 (m, 3H, aromatika).
238	1,37 (t, 3H, CH ₃), 2,06 (s, 3H, CH ₃), 3,88 (s, 6H, OCH ₃), 4,40 (q, 2H, OCH ₃), 5,28 (s, 2H, OCH ₃), 5,87 (s, 1H, H-pyrimidin), 6,23 (s, 1H, CHBr), 8,04 (d, 1H, H-pyridin), 8,64 (d, 1H, H-pyridin).	45	303	3,80 (s, 6H, OCH ₃), 3,90 (d, 6H, OCH ₃), 5,45 (d, 1H, OH), 5,80 (s, 1H, pyrimidin), 6,85 (s, 1H, OCH), 7,0 - 8,6 (m, 6H, aromatika), 10,2 (s, 1H, NH).
257	3,82 (s, 6H, OCH ₃), 4,06 (s, 2H, NCH ₃), 5,05 - 5,10 (s, 1H, OH), 5,42 - 5,45 (s, 1H, NH), 5,87 (s, 1H, OCH), 6,76 - 6,86 (s, 1H, pyrimidin), 7,32 - 7,38 (m, 6H, pyridin, aromatika), 7,94 - 7,98 (d, pyridin), 8,45 - 8,49 (d, 1H, pyridin), 9,55 (s, 1H, NH).	50	305L(-)	1,60 (d, 3H, CH ₃), 3,75 (2s, 6H, OCH ₃), 5,25 (m, 1H, OH), 5,75 (s, 1H, pyrimidin), 6,75 (d, 1H, OCH), 7,2 - 8,6 (m, 8H, aromatika).
264	0,8 - 1,9 (br s, 25H, alifatika), 3,85 - 3,90 (s, 6H, 2XOMe), 6,15 (s, 1H, ArH, pyrimidin), 7,4 (s, 2H, ArH).	50	308	0,88 (t, 3H, CH ₃), 1,25 (bs, 18H, alifatika), 1,6 (m, 2H, alifatika), 3,95 (s, 6H, OCH ₃), 4,07 (t, 2H, O-CH ₃), 6,15 (s, 1H, H-pyrimidin), 7,55 - 7,7 (m, 3H, aromatika).
277	0,90 (t, 3H, CH ₃), 1,2 - 1,7 (m, 4H, alifatika), 3,95 (s, 6H, OCH ₃), 4,08 (t, 2H, OCH ₃), 6,15 (s, 1H, H-pyrimidin), 7,5 - 7,7 (m, 3H, aromatika).	55	330	1,05 (m, 6H, NCH ₂ CH ₃), 1,27 (s, 9H, C(CH ₃) ₃), 2,3 (m, 4H, NCH ₂), 3,8 (s, 6H, OCH ₃), 5,8 (s, 1H, H-pyrimidin), 5,9 (s, 1H, CH-Ot-Bu), 7,18 (dvojitý dublet, 1H, H-pyridin), 7,45 (dvojitý dublet, 1H, H-pyridin), 8,6 (dvojitý dublet, 1H, H-pyridin).
281	0,90 (t, 3H, CH ₃), 1,3 (m, 4H, alifatika), 1,6 (m, 2H, alifatika), 3,95 (s, 6H, OCH ₃), 4,08 (t, 2H, OCH ₃), 6,15 (s, 1H, H-pyrimidin), 7,4 - 7,7 (m, 3H, aromatika).	60	407	3,18 (m, 2H, CH ₂ S), 3,65 (m, 2H, CH ₂ N), 3,95 (s, 6H, OCH ₃), 5,85 (s, 1H, pyrimidin), 6,80 (s, 1H, OCH), 7,0 - 8,7 (m, 8H, aromatika).
283	3,40 (s, 6H, OCH ₃), 3,43 (m, 2H, NCH ₃), 3,82 (s, 6H, OCH ₃), 4,47 (t, 1H, CH), 5,86 (s, 2H, OCH, OH), 6,77 (s, 1H, pyrimidin), 7,41 - 7,43 (m, 1H, pyridin), 7,94 - 7,98 (d, 1H, pyridin), 8,47 - 8,49 (d, 1H, NH).	60	411	1,90 (t, 3H, CH ₃), 1,55 (m, 4H, CH ₂), 2,65 (m, 4H, CH ₂ S), 3,62 (m, 2H, CH ₂ N), 3,82 (s, 6H, CH ₂ O), 5,90 (s, 1H, pyrimidin), 6,75 (s, OCH), 7,2 - 8,65 (m, 3H, pyridin).

- 412 1,37 (s, 9H, tBuC), 3,30 (s, 3H, CH₃N), 3,90 (s, 6H, CH₃), 5,95 (s, 1H, pyrimidín), 5,97 (s, 1H, OCH), 6,5 - 7,6 (m, 10H, aromatika).
- 413 2,23 (s, 1H, C=CH), 3,12 - 3,23 (d, 3H, N-CH₃), 3,93 (s, 8H, OCH₃, N-CH₃=), 6,155 (s, 1H, pyrimidín), 7,47 - 7,52 (m, 1H, pyridín), 8,142 - 8,168 (m, 1H, pyridín), 8,69 - 8,709 (t, 1H, pyridín).

PATENTOVÉ NÁROKY

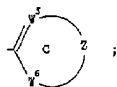
1. Substituované štalidy a heterocyklické štalidy všeobecného vzorca (I)



v ktorom kruhový systém A je zvolený zo súboru, ktorý je tvorený

- a) fenylovou alebo naftylovou skupinou,
 b) pyridylovou skupinou, ktorá môže byť nakondenzovaná stranou (b) alebo (c) na benzénový kruh,
 c) pyridyl-N-oxidom alebo pyrazinyl-N-oxidom,
 d) pyrimidinylovou skupinou,
 e) pyrazinylovou skupinou,
 f) 3- alebo 4-cinolinyllovou skupinou alebo 2-chinoxalinylovou skupinou, a
 g) 5-členným heteroaromatickým kruhom, ktorý obsahuje ako heteroatóm či heteroatómy kyslík, síru alebo dusík a ktorý môže byť nakondenzovaný na benzénový kruh alebo môže obsahovať dusík ako ďalší heteroatóm;

R znamená kyanoskupinu, formylovú skupinu, skupinu CX¹X²X³, skupinu tvoriacu ketón, karboxylovú skupinu, ktorá môže byť prítomná vo forme voľnej kyseliny alebo vo forme esteru alebo soli, tiokarboxylovú skupinu, ktorá môže byť prítomná vo forme voľnej kyseliny alebo vo forme esteru, karbamoylovú skupinu alebo mono- alebo disubstituovanú karbamoylovú skupinu, hydroxyalkylovú skupinu s 1 až 8 atómami uhlíka v alkylovej časti, hydroxybenzylovú skupinu, skupinu -CH=NOH, -CH=NO-alkylovú skupinu s 1 až 8 atómami uhlíka v alkyle, skupinu -CH₂-O-C(O)-, ktorá spája susedné atómy uhlíka v kruhu A, alebo znamená kruh C



Y¹, Y² a Y³ sú viazané na atómy uhlíka a znamenajú nezávisle od seba atóm vodíka, atóm halogénu, hydroxy-skupinu, alkylovú skupinu s 1 až 8 atómami uhlíka, alkenylovú skupinu s 2 až 8 atómami uhlíka, alkinyllovú skupinu s 2 až 8 atómami uhlíka, alkoxy-skupinu s 1 až 8 atómami uhlíka, alkenyloxyskupinu s 2 až 8 atómami uhlíka, alkinylloxyskupinu s 2 až 8 atómami uhlíka, alkylsulfonyloxyskupinu s 1 až 8 atómami uhlíka, dialkylsulfonyloxyskupinu s 1 až 8 atómami uhlíka v alkylových častiach, alkylsulfonylovú skupinu s 1 až 8 atómami uhlíka, alkylsulfinylovú skupinu s 1 až 8 atómami uhlíka, dialkylkarbamoyloxyskupinu s 1 až 8 atómami uhlíka v alkylových častiach, alkyltioskupinu s 1 až 8 atómami uhlíka, alkenyltioskupinu s 2 až 8 atómami uhlíka alebo alkinyltioskupinu s 2 až 8 atómami uhlíka, pričom každá z týchto skupín môže byť substituovaná 1 až 6 atómami halogénu; dialkoxymetylovú skupinu s 1 až 8 atómami uhlíka v alkoxylových častiach, konjugovanú alkoxy-skupinu s 1 až 8 atómami uhlíka, hydroxyalkylovú skupinu s

1 až 8 atómami uhlíka, karboxylovú skupinu, acylovú skupinu s 2 až 8 atómami uhlíka, acylalkylovú skupinu s 2 až 8 atómami uhlíka v acylovej časti a s 1 až 8 atómami uhlíka v alkyle, acyloxyskupinu s 2 až 8 atómami uhlíka, acyloxyalkylovú skupinu s 2 až 8 atómami uhlíka v acyle a s 1 až 8 atómami uhlíka v alkylovej časti, trialkylsilyloxyskupinu s 1 až 8 atómami uhlíka v alkylových častiach, trialkylsilylovú skupinu s 1 až 8 atómami uhlíka v alkylových častiach, kyanoskupinu, nitroskupinu, aminoskupinu alebo substituovanú aminoskupinu, aminosulfonylovú skupinu; cykloalkylovú skupinu s 3 až 6 atómami uhlíka, arylovú skupinu, arylalkylovú skupinu s 1 až 8 atómami uhlíka v alkylovej časti, arylalkenylovú skupinu s 2 až 8 atómami uhlíka v alkenylovej časti, arylalkinylovú skupinu s 2 až 8 atómami uhlíka v alkinylovej časti, aryloxyskupinu s 1 až 8 atómami uhlíka, arylalkoxy-skupinu s 1 až 8 atómami uhlíka v alkoxylovej časti, arylsulfonylovú skupinu, arylsulfinylovú skupinu, aryltioskupinu alebo arylalkyltioskupinu s 1 až 8 atómami uhlíka v alkylovej časti, pričom každá z týchto skupín môže byť substituovaná jedným až tromi substituentmi zvolenými zo súboru, ktorý je vytvorený atómom halogénu, alkylovou skupinou s 1 až 8 atómami uhlíka, halogénalkylovou skupinou s 1 až 8 atómami uhlíka, alkoxy-skupinou s 1 až 8 atómami uhlíka, halogénalkoxy-skupinou s 1 až 8 atómami uhlíka, nitroskupinu, kyanoskupinou, alkyltioskupinou s 1 až 8 atómami uhlíka, acylovou skupinou s 2 až 8 atómami uhlíka, aminoskupinou alebo substituovanou aminoskupinou; skupinu -C(O)-R', kde R' znamená atóm vodíka, alkylovú skupinu s 1 až 8 atómami uhlíka alebo alkoxy-skupinu s 1 až 8 atómami uhlíka; alebo

Y¹ a R tvoria spoločne na susedných atómoch uhlíka mostík vzorca -C(S)-O-, -C(O)-O-E alebo -C(O)-N(R²)-E-, kde E znamená priamu väzbu alebo znamená skupinu spojenú z 1 až 3 členov zvolených zo súboru tvoreného metylénovou skupinou, substituovanou metylénovou skupinou, skupinou -N(R²)- a atómom kyslíka; alebo

Y¹ a Y² tvoria spoločne na susedných atómoch uhlíka 3- až 5-členný mostík pozostávajúci z prvkov zvolených zo súboru, ktorý je tvorený metylénovou skupinou, substituovanou metylénovou skupinou, skupinou -CH=, -C(R⁴)=, -NH-, atómom kyslíka a skupinou -S(O)_n-; každý zo symbolov W¹, W², W³, W⁴ a W⁵ znamená nezávisle od iného skupinu CH, CR³ alebo atóm dusíka; W⁶ znamená skupinu NH, kyslík, síru, skupinu -CR⁴=, -CH= alebo -C(O)-;

Z znamená 2- alebo 3-členný mostík pozostávajúci z prvkov zvolených zo súboru, ktorý je tvorený metylénovou skupinou, substituovanou metylénovou skupinou, skupinou -CH=, skupinou -C(R⁴)=, skupinou -C(O)-, -NH-,

-N=, kyslíkom a skupinou -S(O)_n-;

R¹ a R³ znamenajú nezávisle od seba atóm vodíka, atóm halogénu, alkylovú skupinu s 1 až 8 atómami uhlíka, alkenylovú skupinu s 2 až 8 atómami uhlíka, alkinyllovú skupinu s 2 až 8 atómami uhlíka, alkoxy-skupinu s 1 až 8 atómami uhlíka, alkenyloxyskupinu s 2 až 8 atómami uhlíka, alkinylloxyskupinu s 2 až 8 atómami uhlíka, alkyltioskupinu s 1 až 8 atómami uhlíka, alkenyltioskupinu s 2 až 8 atómami uhlíka alebo alkinyltioskupinu s 2 až 8 atómami uhlíka, pričom každá z týchto skupín môže byť substituovaná 1 až 6 atómami halogénu; ďalej znamenajú cykloalkylovú skupinu s 3 až 6 atómami uhlíka, 5- alebo 6-člennú heterocykloalkoxy-skupinu s 1 až 8

atómami uhlíka v alkoxylovej časti, aryloxyskupinu, arylalkoxykupinu s 1 až 8 atómami uhlíka v alkoxylovej časti alebo arylalkyltioskupinu s 1 až 8 atómami uhlíka v alkylovej časti, pričom každá z týchto skupín môže byť substituovaná 1 až 3 substituentami zvolenými zo skupiny, ktorá je tvorená atómom halogénu, alkylovou skupinou s 1 až 8 atómami uhlíka, halogénalkylovou skupinou s 1 až 8 atómami uhlíka, alkoxykupinou s 1 až 8 atómami uhlíka, halogénalkoxykupinou s 1 až 8 atómami uhlíka, nitroskupinou, kyanoskupinou, alkyltioskupinou s 1 až 8 atómami uhlíka, acylovou skupinou s 2 až 8 atómami uhlíka, aminoskupinou alebo substituovanou aminoskupinou; ďalej znamenajú aminoxykupinu, substituovanú aminoxykupinu; iminoxykupinu; substituovanú iminoxykupinu; amidoskupinu; substituovanú amidoskupinu; alkylsulfonylmetyllovú skupinu s 1 až 8 atómami uhlíka v alkylovej časti; kyanoskupinu; nitroskupinu; alebo skupinu $-C(O)-Y_4$, v ktorej Y_4 znamená atóm vodíka, alkylovú skupinu s 1 až 8 atómami uhlíka, alkoxykupinu s 1 až 8 atómami uhlíka, hydroxykupinu alebo substituovanú alebo nesubstituovanú fenyllovú skupinu;

R^2 znamená atóm vodíka, alkylovú skupinu s 1 až 8 atómami uhlíka, halogénalkylovú skupinu s 1 až 8 atómami uhlíka, alkoxyalkylovú skupinu s 1 až 8 atómami uhlíka v alkoxylovej aj alkylovej časti, alkoxykupinu s 1 až 8 atómami uhlíka, arylalkoxykupinu s 1 až 8 atómami uhlíka v alkoxylovej časti, nesubstituovanú alebo substituovanú aryllovú skupinu, nesubstituovanú alebo substituovanú arylalkylovú skupinu s 1 až 8 atómami uhlíka v alkylovej časti;

R^4 má význam definovaný pre Y^1 s výnimkou atómu vodíka;

X a Y znamenajú nezávisle od seba atóm vodíka, hydroxykupinu, atóm halogénu, kyanoskupinu, alkylovú skupinu s 1 až 8 atómami uhlíka, alkoxykupinu s 1 až 8 atómami uhlíka, alkoxykarbonylovú skupinu s 1 až 8 atómami uhlíka v alkoxylovej časti, alkoxykarbonyloxyskupinu s 1 až 8 atómami uhlíka v alkoxylovej časti, hydroxyalkylovú skupinu s 1 až 8 atómami uhlíka, halogénalkylovú skupinu s 1 až 8 atómami uhlíka, acylovú skupinu s 2 až 8 atómami uhlíka, acyloxyskupinu s 2 až 8 atómami uhlíka, karbamoylovú skupinu, karbamoyloxyskupinu, alkyltioskupinu s 1 až 8 atómami uhlíka, alkylsulfonylovú skupinu s 1 až 8 atómami uhlíka, alkylsulfonyloxyskupinu s 1 až 8 atómami uhlíka alebo alkylsulfonyloxyskupinu s 1 až 8 atómami uhlíka; arylovú skupinu, aryloxyskupinu, skupinu aryl- $S(O)_p$, arylalkylovú skupinu s 1 až 8 atómami uhlíka v alkylovej časti, arylalkoxykupinu s 1 až 8 atómami uhlíka v alkoxylovej časti, skupinu arylalkyl- $S(O)_p$ s 1 až 8 atómami uhlíka v alkyle, arylsulfonyloxyskupinu, pričom každá z týchto skupín môže byť substituovaná 1 až 3 substituentmi zvolenými zo súboru, ktorý je tvorený atómom halogénu, alkylovou skupinou s 1 až 8 atómami uhlíka, halogénalkylovou skupinou s 1 až 8 atómami uhlíka, alkoxykupinou s 1 až 8 atómami uhlíka, halogénalkoxykupinou s 1 až 8 atómami uhlíka, nitroskupinou, kyanoskupinou, alkyltioskupinou s 1 až 8 atómami uhlíka, acylovou skupinou s 2 až 8 atómami uhlíka; ďalej znamenajú aminoskupinu, substituovanú aminoskupinu alebo spoločne $=O$, $=S$, $=NH$, $=NOR^{12}$ alebo $=CR^{13}R^{14}$; alebo

X a R tvoria spoločne mostík vzorca $-C(O)-O-$, $-C(O)-S-$ alebo $-C(O)-NR^2$, kde karbonylová skupina je viazaná na kruh A;

p znamená číslo 0, 1 alebo 2;

X^1 , X^2 a X^3 znamenajú nezávisle od seba atóm vodíka,

hydroxykupinu, alkoxykupinu s 1 až 8 atómami uhlíka, alkyltioskupinu s 1 až 8 atómami uhlíka, hydroxyalkylovú skupinu s 1 až 8 atómami uhlíka v alkylovej časti alebo hydroxybenzyllovú skupinu pričom najmenej jeden zo substituentov X^1 , X^2 a X^3 má iný význam ako atóm vodíka; alebo

X^3 znamená atóm vodíka a

X^1 a X^2 tvoria spoločne 4- alebo 5-členný mostík pozostávajúci z členov zvolených zo súboru, ktorý je tvorený skupinami $-O(CH_2)_n$, $-O-$, $-OC(O)(CH_2)_m-O-$ a $-S(CH_2)_n$, $S-$;

R^{12} znamená atóm vodíka alebo alkylovú skupinu s 1 až 8 atómami uhlíka;

R^{13} a R^{14} znamenajú nezávisle od seba atóm vodíka, atóm halogénu alebo alkylovú skupinu s 1 až 8 atómami uhlíka;

m znamená číslo 1 alebo 2;

n znamená číslo 0, 1 alebo 2; a

n' znamená číslo 2 alebo 3;

s tým obmedzením, že keď R znamená karboxylovú skupinu vo voľnej forme, vo forme esteru alebo vo forme soli a X a Y znamenajú spoločne skupinu $=O$, potom jeden z kruhov A a B obsahuje heteroatóm.

2. Zlúčeniny podľa nároku 1 všeobecného vzorca (I), v ktorom R znamená karboxylovú skupinu, ktorá môže byť prítomná vo forme voľnej kyseliny alebo vo forme esteru alebo vo forme soli, karbamoylovú skupinu alebo mono- alebo disubstituovanú karbamoylovú skupinu; alebo

X a R tvoria spoločne mostík vzorca $-C(O)-O-$, kde karbonyl je viazaný na A; a

Y^1 , Y^2 a Y^3 sú viazané na atómy uhlíka a znamenajú nezávisle od seba atóm vodíka, alkylovú skupinu s 1 až 8 atómami uhlíka, alkoxykupinu s 1 až 8 atómami uhlíka, atóm halogénu, alkyltioskupinu s 1 až 8 atómami uhlíka, aryltioskupinu alebo arylalkoxykupinu s 1 až 8 atómami uhlíka v alkoxylovej časti, pričom arylová časť je prípadne substituovaná atómom halogénu, alkenyloxyskupinou s 2 až 8 atómami uhlíka alebo alkenyloxyskupinou s 2 až 8 atómami uhlíka.

3. Zlúčeniny podľa nároku 1 až 2 všeobecného vzorca (I), v ktorom X a Y znamenajú nezávisle od seba atóm vodíka, hydroxykupinu, kyanoskupinu, alkoxykupinu s 1 až 8 atómami uhlíka, acyloxyskupinu s 2 až 8 atómami uhlíka, atóm halogénu, alkyltioskupinu s 1 až 8 atómami uhlíka, alkoxykarbonyloxyskupinu s 1 až 4 atómami uhlíka v alkoxylovej časti, arylovú skupinu alebo aryltioskupinu, ktoré skupiny sú prípadne substituované jedným alebo niekoľkými atómami halogénu, alkoxykupinami s 1 až 4 atómami uhlíka alebo halogénalkoxykupinami s 1 až 4 atómami uhlíka; alebo znamenajú spoločne skupinu $=O$ alebo $=NH$; a

R^1 a R^2 znamenajú nezávisle od seba atóm halogénu, alkoxykupinu s 1 až 8 atómami uhlíka, alkylovú skupinu s 1 až 8 atómami uhlíka, halogénalkylovú skupinu s 1 až 8 atómami uhlíka, halogénalkoxykupinu s 1 až 8 atómami uhlíka, aryloxyskupinu alebo arylalkoxykupinu s 1 až 8 atómami uhlíka v alkoxylovej časti, pričom arylová časť je prípadne substituovaná atómom halogénu alebo alkylovou skupinou s 1 až 4 atómami uhlíka, alkenyloxyskupinou s 2 až 8 atómami uhlíka alebo alkenyloxyskupinou s 2 až 8 atómami uhlíka.

4. Zlúčeniny podľa nároku 1 až 3 všeobecného vzorca (I), v ktorom A znamená pyridylovú skupinu, fenyllovú skupinu, pyridyl-N-oxidovú skupinu alebo tienylovú skupinu.

5. Zlúčeniny podľa nároku 1 až 4 všeobecného vzorca (I), v ktorom W^1 a W^4 znamenajú N;

W^2 znamená N alebo CH; a

W^3 znamená skupinu CR^3 .

6. Zlúčeniny podľa nároku 1 všeobecného vzorca (I), v ktorom kruhový systém A je predstavovaný fenylovou skupinou alebo pyridylovou skupinou;

R znamená karboxylovú skupinu vo forme voľnej kyseliny alebo vo forme soli; karbamoylovú skupinu; skupinu $COOR^{5m}$ v ktorej R^{5m} znamená alkylovú skupinu s 1 až 5 atómami uhlíka alebo alkenylovú skupinu s 2 až 5 atómami uhlíka; alebo znamená skupinu $CONR^{7m}R^{8m}$, pričom

R^{7m} znamená alkylovú skupinu s 1 až 12 atómami uhlíka, aminoskupinu, alkylaminoskupinu s 1 až 4 atómami uhlíka, anilinoskupinu, halogénanilinoskupinu, benzylovú skupinu, halogénbenzylovú skupinu, alkylbenzylovú skupinu s 1 až 4 atómami uhlíka v alkylovej časti, alkoxybenzylovú skupinu s 1 až 4 atómami uhlíka v alkoxylovej časti, fenylovú skupinu, halogénfenylovú skupinu, alkylfenylovú skupinu s 1 až 4 atómami uhlíka v alkylovej časti alebo alkoxyfenylovú skupinu s 1 až 4 atómami uhlíka v alkoxylovej časti;

R^{8m} znamená atóm vodíka alebo alkylovú skupinu s 1 až 4 atómami uhlíka;

Y^1 , Y^2 a Y^3 znamenajú nezávisle od seba atóm vodíka alebo atóm halogénu;

W^1 a W^4 znamenajú N;

W^2 znamená skupinu CH;

W^3 znamená CR^3 , kde R^3 znamená alkoxyskupinu s 1 až 5 atómami uhlíka;

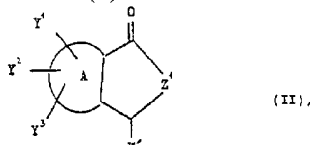
R^1 znamená alkoxyskupinu s 1 až 5 atómami uhlíka;

X znamená hydroxyskupinu alebo alkoxykarbonyloxyskupinu s 1 až 4 atómami uhlíka v alkoxylovej časti alebo spolu s Y znamená skupinu =O;

Y znamená atóm vodíka alebo spolu s X tvoria skupinu =O; alebo

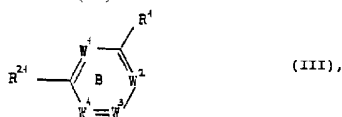
X a R spoločne tvoria mostík vzorca -C(O)O-, kde karboxylová skupina je viazaná na A a Y znamená vodík alebo acyloxyskupinu s 2 až 8 atómami uhlíka.

7. Spôsob výroby zlúčenín všeobecného vzorca (I) podľa nároku 1, v y z n a ě u j ú c i s a t ý m , že sa a) v prípade, že X a R tvoria spoločne mostíkovú skupinu definovanú v nároku 1 a Y znamená atóm vodíka, kyanoskupinu, aryltioskupinu, arylsulfínylovú skupinu alebo arylsulfonylovú skupinu, nechá reagovať zlúčenina všeobecného vzorca (II)



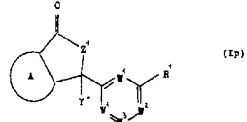
v ktorom kruh A, Y^1 , Y^2 a Y^3 majú významy definované v nároku 1,

Y^1 znamená atóm vodíka, kyanoskupinu, aryltioskupinu, arylsulfínylovú skupinu alebo arylsulfonylovú skupinu a Z_1 znamená atóm kyslíka, síry alebo skupinu NR^2 , kde R^2 má význam definovaný v nároku 1, so zlúčeninou všeobecného vzorca (III)



v ktorom W^1 , W^2 , W^3 , W^4 a R^1 majú významy definované v nároku 1 a

R^{21} znamená metylsulfonylovú skupinu alebo atóm halogénu, a vzniká zodpovedajúca zlúčenina všeobecného vzorca (Ip)



alebo sa

b) zlúčenina všeobecného vzorca (Ip), v ktorom Y^1 znamená kyanoskupinu alebo arylsulfonylovú skupinu a Z_1 znamená atóm kyslíka a ostatné substituenty majú význam definovaný v nároku 1,

(i) hydrolyzuje a vzniká zodpovedajúca zlúčenina vzorca I, v ktorom R a X tvoria mostík a Y znamená hydroxyskupinu, alebo zlúčeniny vzorca (I), v ktorom X a Y tvoria spoločne skupinu =O;

(ii) nechá reagovať s aminom a vzniká zodpovedajúca zlúčenina vzorca (I), v ktorom R znamená prípadne substituovanú karbamoylovú skupinu a X a Y tvoria spoločne =O;

(iii) nechá reagovať so zlúčeninou vzorca



v ktorom M znamená alkalický kov a R^{22} znamená atóm vodíka alebo alkylovú skupinu s 1 až 8 atómami uhlíka, a vzniká zodpovedajúca zlúčenina, v ktorej R a X tvoria mostík a Y znamená hydroxyskupinu alebo alkoxyskupinu s 1 až 8 atómami uhlíka; alebo sa

c) hydrolyzuje zlúčenina vzorca (Ip), v ktorom Y^1 znamená atóm vodíka, Z_1 znamená kyslík a ostatné symboly majú významy definované v nároku 1, a vzniká zlúčenina vzorca (I), v ktorom R znamená karboxylovú skupinu, ktorá je prípadne prítomná vo forme soli, X znamená vodík a Y znamená hydroxyskupinu; alebo sa

d) otvorí kruh v zlúčenine vzorca (Ip), v ktorom Y^1 znamená hydroxyskupinu, Z_1 znamená atóm kyslíka a ostatné symboly majú významy definované v nároku 1, a vzniká zlúčenina vzorca (I), v ktorom R znamená karboxylovú skupinu, ktorá je prípadne prítomná vo forme soli a X a Y tvoria spoločne skupinu =O; alebo sa

e) zlúčenina vzorca (I), v ktorom R znamená karboxylovú skupinu, ktorá je prípadne prítomná vo forme soli a X a Y tvoria spoločne skupinu =O a ostatné symboly majú význam definovaný v nároku 1, esterifikuje a vzniká zodpovedajúca zlúčenina, v ktorej R znamená karboxylovú skupinu prítomnú vo forme esteru; alebo sa

f) zlúčenina vzorca (Ip), v ktorom Y^1 znamená hydroxyskupinu, Z_1 má význam definovaný v odstavci a) a ostatné symboly majú význam definovaný v nároku 1, halogenuje a vzniká zlúčenina vzorca (I), v ktorom X a R spoločne tvoria mostík a Y^1 znamená atóm halogénu; alebo sa

g) zlúčenina vzorca (Ip), v ktorom Z_1 znamená kyslík, Y^1 znamená atóm halogénu a ostatné symboly majú význam definovaný v nároku 1, nechá reagovať so zlúčeninou všeobecného vzorca R^2NH_2 a HOR^{23} , v ktorých

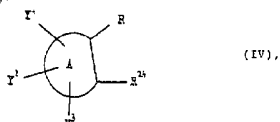
R^{23} znamená alkylovú skupinu s 1 až 8 atómami uhlíka, acylovú skupinu s 2 až 8 atómami uhlíka alebo aryllovú skupinu a

R^2 má význam definovaný v nároku 1, a vzniká zodpovedajúca zlúčenina, v ktorej Z_1 znamená skupinu

aryloxyskupinu alebo acyloxyskupinu s 2 až 8 atómami uhlíka; alebo sa

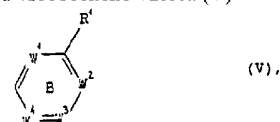
h) zlúčenina vzorca (Ip), v ktorom Y' znamená atóm vodíka, Z₁ má význam definovaný v časti a) a ostatné symboly majú významy definované v nároku 1, oxiduje a vzniká zodpovedajúca zlúčenina, v ktorej Y' znamená hydroxyskupinu; alebo sa

i) nechá reagovať zlúčenina všeobecného vzorca (IV)



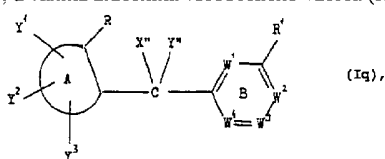
v ktorom R, Y¹, Y², Y³ a A majú významy definované v nároku 1 a

R²⁴ znamená alkylovú skupinu s 1 až 8 atómami uhlíka, so zlúčeninou všeobecného vzorca (V)



v ktorom

B, R¹, W¹, W², W³ a W⁴ majú významy definované v nároku 1, a vzniká zlúčenina všeobecného vzorca (Iq)



v ktorom

A, R, R¹, W¹, W², W³, W⁴, Y¹, Y² a Y³ majú významy definované v nároku 1 a

X'' a Y'' znamenajú atómy vodíka, alebo sa

j) zlúčenina vzorca (Iq), v ktorom X'' a Y'' znamenajú atómy vodíka a ostatné symboly majú významy definované v odstavci i), monohalogenuje alebo dihalogenuje a vzniká zodpovedajúca zlúčenina vzorca Iq, v ktorom jeden alebo obidva symboly X'' a Y'' znamenajú atóm halogénu; alebo sa

k) oxiduje zlúčenina všeobecného vzorca (Iq), v ktorom X'' a Y'' znamenajú obidva atóm vodíka alebo X'' znamená atóm halogénu a Y'' znamená atóm vodíka a ostatné symboly majú významy definované v nároku 1, a vzniká zodpovedajúca zlúčenina, v ktorej X'' a Y'' znamenajú spoločne skupinu =O alebo jeden z týchto symbolov znamená vodík a druhý znamená hydroxyskupinu; alebo sa

l) zlúčenina všeobecného vzorca (Iq), v ktorom X'' znamená atóm vodíka a Y'' znamená atóm vodíka a ostatné symboly majú významy definované v nároku 1, alkyluje a vzniká zodpovedajúca zlúčenina, v ktorej X'' znamená alkylovú skupinu s 1 až 8 atómami uhlíka a Y'' znamená atóm vodíka;

m) do zlúčeniny všeobecného vzorca (Iq), v ktorom X'' znamená atóm halogénu, Y'' znamená vodík a ostatné symboly majú významy definované v nároku 1, zavedie alkoxyskupinu s 1 až 8 atómami uhlíka alebo alkyltioskupinu s 1 až 8 atómami uhlíka, a vzniká zodpovedajúca

zlúčenina, v ktorej X'' znamená alkoxyskupinu s 1 až 8 atómami uhlíka alebo alkyltioskupinu s 1 až 8 atómami uhlíka a Y'' znamená atóm vodíka; alebo sa

NR² a Y' znamená alkoxyskupinu s 1 až 8 atómami uhlíka,

zodpovedajúca zlúčenina, v ktorej X'' znamená acyloxyskupinu a Y'' znamená atóm vodíka; alebo sa

o) zlúčenina všeobecného vzorca (Ip), v ktorom Z₁ znamená kyslík, Y' znamená vodík a ostatné symboly majú významy definované v nároku 1, nechá reagovať so zlúčeninou všeobecného vzorca R⁷NH₂, pričom R⁷ znamená a) atóm vodíka, atóm halogénu; b) alkylovú skupinu, alkenylovú skupinu, alkinyllovú skupinu, alkoxyskupinu, alkoxyalkoxykupinu,

alkenyloxyskupinu, alkinylloxyskupinu, skupinu alkyl-S(O)_p, alkenyl-S(O)_p alebo alkinyl-S(O)_p, alkyl-S(O)_p-alkyl, alkenyl-S(O)_p-alkyl, alkinyl-S(O)_p-alkyl, pričom každá z týchto skupín môže byť substituovaná 1 až 6 atómami halogénu a každá z nich môže byť viazaná na susedný atóm dusíka cez alkylovú skupinu; c) acylovú skupinu, acylalkylovú skupinu, acyloxyskupinu, acyloxyalkylovú skupinu; d) cykloalkylovú skupinu, cykloalkylalkylovú skupinu, heterocyklylovú skupinu, heterocyklylalkylovú skupinu,

heterocyklylalkoxykupinu, arylovú skupinu, aralkoxykupinu, skupinu aryl-S(O)_p, aralkyl-S(O)_p alebo aryl-S(O)_p-alkyl, pričom každá z týchto skupín alebo nie je substituovaná alebo môže byť substituovaná 1 až 3 substituentami zvolenými zo súboru, ktorý je tvorený (i) halogénom; (ii) alkylovou skupinou, alkenylovou skupinou, alkinyllovou skupinou, alkoxykupinou, alkoxyalkoxykupinou,

alkenyloxyskupinou, alkinylloxyskupinou, skupinou alkyl-S(O)_p, alkenyl-S(O)_p alebo alkinyl-S(O)_p, alkyl-S(O)_p-alkyl, alkenyl-S(O)_p-alkyl alebo alkinyl-S(O)_p-alkyl, pričom každá z týchto skupín môže byť substituovaná 1 až 6 atómami halogénu; a (iii) nitroskupinou, kyanoskupinou, acylovou skupinou, aminoskupinou, substituovanou aminoskupinou, aminosulfonylovou skupinou, aminoalkylovou skupinou alebo substituovanou aminoalkylovou skupinou; e) aminoskupinu, substituovanú aminoskupinu, amidoskupinu, substituovanú amidoskupinu, aminosulfonylovú skupinu, kyanoskupinu, nitroskupinu alebo skupinu -(CHR⁴)_n-C(O)Y⁴ pričom Y⁴ znamená atóm vodíka, nižšiu alkylovú skupinu, nižšiu alkoxykupinu alebo hydroxyskupinu a n'' znamená číslo 0, 1, 2 alebo 3 a p znamená číslo 0, 1 alebo 2 a R⁴ má význam definovaný pre Y¹; a vzniká zlúčenina

vzorca (I), v ktorom R znamená monosubstituovanú karbamoylovú skupinu, X znamená vodík a Y znamená hydroxyskupinu; alebo sa

p) zlúčenina všeobecného vzorca (Ip), v ktorom Z₁ znamená kyslík, Y' znamená hydroxyskupinu a ostatné symboly majú významy definované v nároku 1, sulfonyluje, karbamoyluje, acyluje alebo alkoxykarbonyluje a vzniká zodpovedajúca zlúčenina vzorca (I), v ktorom R a X tvoria mostík -C(O)-O- a Y znamená sulfonyloxy-

skupinu, karbamoyloxyskupinu, acyloxyskupinu s 2 až 8 atómami uhlíka alebo alkoxykarbonyloxyskupinu s 1 až 8 atómami uhlíka v alkoxylovej časti; alebo sa

q) zlúčenina všeobecného vzorca (Ip), v ktorom Z₁ znamená atóm kyslíka, Y' znamená atóm halogénu a ostatné symboly majú významy definované v nároku 1, nechá reagovať so zlúčeninou všeobecného vzorca R⁷R⁸NH, v ktorom R⁷ má význam definovaný v odstavci o) a R⁸ má význam definovaný pre R⁷, a vzniká zlúčenina všeobecného vzorca (I), v ktorom R znamená

n) zlúčenina vzorca (Iq), v ktorom X" znamená hydroxyskupinu, Y znamená atóm vodíka a ostatné symboly majú význam definovaný v nároku 1, acyluje a vzniká

skupinu vo voľnej forme alebo vo forme esteru a ktorákoľvek zlúčenina, v ktorej R znamená karboxylovú skupinu vo voľnej forme alebo vo forme soli.

8. Herbicídny prostriedok, **v y z n a č u j ú c i s a t ý m**, že obsahuje herbicídne účinné množstvo zlúčeniny vzorca (I) podľa nárokov 1 až 6.

9. Použitie zlúčeniny všeobecného vzorca (I) podľa nárokov 1 až 6 na ničenie burín.

65 disubstituovanú karbamoylovú skupinu a X a Z znamenajú spoločne skupinu =O; a izoluje sa ktorákoľvek zlúčenina, v ktorej R znamená karboxylovú skupinu alebo tiokarboxylovú

5

10

Koniec dokumentu