

(19) **KG** (11) **336** (13) **C2**(51)<sup>7</sup> C07D 239/38, 239/34, 239/52, 213/643, 213/70, 403/12;  
A01N 43/40, 43/54// (C07D 403/12, 239:00, 233:70)ГОСУДАРСТВЕННОЕ АГЕНТСТВО ПО НАУКЕ И  
ИНТЕЛЛЕКТУАЛЬНОЙ СОБСТВЕННОСТИ  
ПРИ ПРАВИТЕЛЬСТВЕ КЫРГЫЗСКОЙ РЕСПУБЛИКИ (КЫРГЫЗПАТЕНТ)**(12) ОПИСАНИЕ ИЗОБРЕТЕНИЯ**  
к патенту Кыргызской Республики

(21) 960320.1

(22) 23.01.1996

(31) 95101057.8

(32) 26.01.1995

(33) EP

(46) 03.09.2001, Бюл. №8

(71)(73) Американ Цианамид Компани (US)

(72) Аксель Клееман, Хельмут Зигфрид Бальтрушат, Текла Хюльсен, Томас Майер, Штефан Шайблих

(56) SU 1452457 A 3, 1989

SU 1598872 A, 1990

EP 0468695 A 1, 1992

EP 382375 A 1, 1990

EP 354766 A, 1990

EP 425247 A, 1991

GB 1585950 A, 1981

EP 263958 A, 1988.

**(54) 2,6-дизамещенные пиридины или 2,4-дизамещенные пиримидины, способы их получения, гербицидная композиция на их основе и способ борьбы с нежелательной растительностью**

(57) Описываются новые 2,6-дизамещенные пиридины или 2,4-ди-замещенные пиримидины общей формулы I, где X - атом кислорода; Z - NH, CH; A - фенил, замещенный атомом фтора или трифторметильной группой, пиридил, замещенный атомом хлора, пирозолил, замещенный трифторметильной и метильной группой или метильной и трет-бутильной группой, дифторбензодиоксилил, каждый из R<sup>1</sup>, независимо, является группой, выбранной из атома водорода, атома галогена, низшего алкила, низшего алкилтио, низшего алкоксила; R<sup>2</sup> - каждый, независимо, является группой, выбранной из атома водорода, трифторметила, низшего алкила, трифторметоксила, атом галогена; m = 1 - 2, n = 0 - 2, при условии, что, если A представляет 1-метил-3-трифторметилпирозол-5-ильную группу, n = 0, X - атом кислорода, Z - группа CH, тогда R<sup>2</sup> не является водородом, 3-трифторметилом или 2,4-дихлором или 2,4-диметилом. Соединения проявляют гербицидную активность. Описывается способ получения соединений формулы I, гербицидная активность на основе вышеуказанных соединений и способ борьбы с нежелательной раститель-

ностью. 8 с. и 1 з.п. ф-лы, 13 табл. 205 пр.

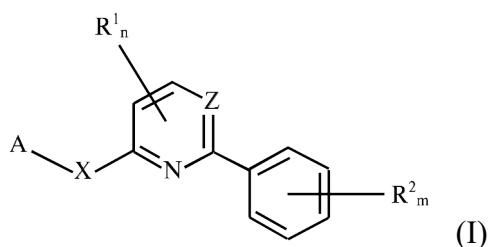
Изобретение относится к некоторым 2,6-дизамещенным пиридинам и 2,4-дизамещенным пиримидинам, способу их получения, к гербицидной композиции на их основе и к способу борьбы с ростом нежелательной растительности.

Пиридины, пиримидины и их производные широко применяются в фармацевтической области, а также в сельском хозяйстве (гербициды, фунгициды, акарициды, противоглистны́е средства, репелленты для отпугивания птиц), в качестве реагентов, промежуточных соединений и химикатов для полимерной и текстильной промышленности.

Например, 2-арилпиримидины и 2-пиримидинил-6-арилпиридины описаны в качестве фунгицидов (DE 4029654 и JO 2131-480 соответственно). EP 263958 касается имеющих гербицидные свойства 2,6-дифенилпиридинов, а структурно родственные 2,4-дифенил-пиримидины, которые, как утверждается, также являются гербицидами, раскрыты в EP 354766 и 425547 соответственно. Другим примером являются 2,6-дифеноксипиридины, которые представлены в EP 572093 как гербициды. В DE 2935578 описано, что 4-фенокси-2-пиразол-1-ил-пиримидины проявляют фунгицидную активность. В работе Huelsen (Diplomarbeit, Konstanz, 1993) описаны четыре различных 2-(1-метил-3-трифторметил-пиразол-5-илокси)-6-фенилпиридина, однако их биологическая активность не раскрывается.

В настоящее время обнаружено, что хорошую гербицидную активность проявляют близкие по структуре новые производные пиридина и пиримидина, имеющие как арильные группы, так и арилокси- или гетероарилоксигруппы. Эти соединения проявляют отличную активность и хорошую избирательность в отношении культур при до- и послевсходовом нанесении как по отношению к широколиственным, так и к травянистым видам сорняков.

Таким образом, настоящее изобретение относится к 2,6-замещенным пиридинам и 2,4-замещенным пиримидинам общей формулы I



где X - атом кислорода,

Z - NH, CH,

A - фенил, замещенный атомом фтора или трифторметильной группой, пиридил, замещенный атомом хлора, пиразолил, замещенный трифторметильной и метильной группой или метильной и трет-бутильной группой, дифторбензодиоксилил,

каждый из R<sup>1</sup>, независимо, является группой, выбранной из атома водорода, атома галогена, низшего алкила, низшего алкилтио, низшего алкоксила,

R<sup>2</sup> - каждый, независимо, является группой, выбранной из атома водорода, трифторметила, низшего алкила, трифторметоксила, атома галогена,

m = 1 - 2,

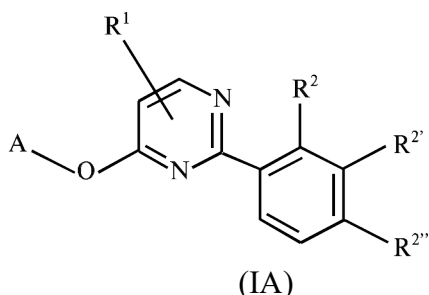
n = 0 - 2,

при условии, что, если A представляет 1-метил-3-трифторметилпиразол-5-ильную группу, n = 0, X - атом кислорода,

Z - группа CH, тогда R<sup>2</sup> не является водородом, 3-трифторметилом или 2,4-дихлором или 2,4-диметилом.

Предпочтительными соединениями являются замещенные 2-фенил-6-оксипири-

мидины формулы IA



где А представляет 3-трифтор-метилфенил, 2-хлорпирид-4-ил или 1-метил-3-трифторметилпиразол-5-ил,

R<sup>1</sup> имеет значения, указанные выше;

R<sup>2</sup>, R<sup>2'</sup> и R<sup>2''</sup>, независимо, представляют атом водорода, атом фтора, хлора или брома, один или два из них также представляют трифторметил, трифторметокси, R<sup>2''</sup>, кроме того, может быть C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-алкильной группой, в частности третбутильной, за исключением соединений, где А - 1-метил-3-трифторметилпиразол-5-ил, R<sup>1</sup> - водород, R<sup>2</sup>, R<sup>2''</sup> - водород, R<sup>2'</sup> - трифторметил; R<sup>2</sup> - водород; R<sup>2'</sup> = R<sup>2''</sup> - хлор или метил; R<sup>2</sup>, R<sup>2'</sup>, R<sup>2''</sup> - водород.

Представительными соединениями являются следующие:

2-(1'-метил-3'-трифторметил-пиразол-5'-илокси)-6-(4''-трифторметилфенил) пиридин,

2-(2',4'-дифторфенил)-6-метил-4-(1''-метил-3''-трифторметилпиразол-5''-илокси) пиримидин,

2-(2',4'-дифторфенил)-6-метил-4-(3''-трифторметилфенокси)пиримидин,

2-(2'-хлорпирид-4'-илокси)-(4''-трифторметилфенил)пиридин,

2-(2'-хлорпирид-4'-илокси)-6-(3''-трифторметилфенил) пиридин,

2-(3'-хлорфенил)-5-метил-4-(1''-метил-3''-трифторметилпиразол-5''-илокси) пиридин,

2-(3'-хлорфенил)-5-метил-4-(3''-трифторметилфенокси)пиримидин,

2-(4'-фторфенил)-6-метил-4-(3''-трифторметилфенокси)пиримидин,

2-(4'-фторфенил)-4-(1''-метил-3''-трифторметилпиразол-5''-илокси)-5-метилпиридин,

2-(4'-фторфенил)-(1''-метил-3''-трифторметилпиразол-5''-илокси)-6-метилпиридин,

4-(2''-хлорпирид-4''-илокси)-2-(2',4'-дифторфенил)-5-метилпиримидин,

4-(2''-хлорпирид-4''-илокси)-5,6-диметил-2-(4'-трифторметоксифенил) пиримидин,

4-(2''-хлорпирид-4''-илокси)-5,6-диметил-2-(4'-трифторметилфенил)пиримидин,

4-(2''-хлорпирид-4''-илокси)-5-метил-2-(4'-трифторметоксифенил)пиримидин,

4-(2''-хлорпирид-4''-илокси)-5-метил-2-(4'-трифторметилфенил)пиримидин,

4-(2''-хлорпирид-4''-илокси)-6-метил-2-(4'-трифторметоксифенил)

пиримидин,

4-(2''-хлорпирид-4''-илокси)-6-метил-2-(4'-трифторметилфенил)пиримидин,

5-этил-6-(4''-трифторметил-фенил)-2-(3'-трифторметил-фенил)пиридин,

4-метил-6-(4''-трифторметокси-фенил)-2-(1'-метил-3'-трифторметил-пиразол-5'-илокси)пиридин,

4-метил-6-(4''-трифтор-метоксифенил)-2-(2'-хлорпирид-4'-илокси)пиридин,

4-метил-6-(4''-трифторметил-фенил)-2-(1'-метил-3'-трифторметил-пиразол-5'-илокси)пиридин,

4-метил-6-(4''-трифторметил-фенил)-2-(2'-хлорпирид-4'-илокси)пиридин,

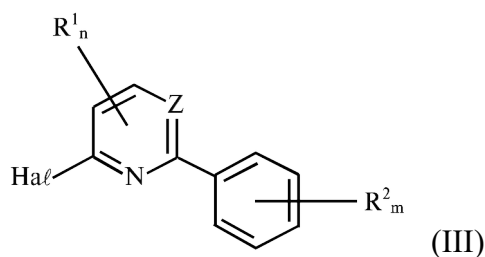
4-метил-6-(4''-трифторметил-фенил)-2-(2''-хлорпирид-4'-илокси)пиридин,

4-метил-6-(4''-фторфенил)-2-(1'-метил-3'-трифторметилпиразол-5'-илокси)пиридин,

5,6-диметил-2-(4'-трифтор-метоксифенил)-4-(1"-метил-3"-трифторметилпиразол-5"-илокси)пиримидин,  
 5,6-диметил-2-(4'-трифтор-метоксифенил)-4-(3"-трифторметилфеноксид) пиримидин,  
 5,6-диметил-2-(4'-трифтор-метилфенил)-4-(3"-трифторметил-феноксид)пиримидин,  
 5,6-диметил-4-(1"-метил-3"-трифторметилпиразол-5"-илокси)-2-(4'-трифторметил-фенил)пиримидин,  
 5-метил-2-(3'-метилфенил)-4-(1"-метил-3"-трифторметилпиразол-5"-илокси) пиримидин,  
 5-метил-2-(3'-метилфенил)-4-(3"-трифторметилфеноксид)пиримидин,  
 5-метил-2-(4'-трифтор-метоксифенил)-4-(1"-метил-3"-трифторметилпиразол-5"-илокси)пиримидин,  
 5-метил-2-(4'-трифтор-метоксифенил)-4-(3"-трифторметил-феноксид)пиримидин,  
 5-метил-2-(4'-трифторметил-фенил)-4-(1"-метил-3"-трифтор-метилпиразол-5"-илокси)пиримидин,  
 5-метил-4-(3"-трифторметил-феноксид)-2-(4'-трифторметил-фенил)пиримидин,  
 6-(4"-фторфенил)-2-(1'-метил-3'-трифторметилпиразол-5'-илокси)пиридин,  
 6-метил-2-(4'-трифторметоксид-фенил)-4-(1"-метил-3"-трифторметил-пиразол-5"-илокси)пиримидин,  
 6-метил-2-(4'-трифторметоксид-фенил)-4-(3"-трифторметил-феноксид)пиримидин,  
 6-метил-4-(3"-трифторметил-феноксид)-2-(4'-трифторметил-фенил)пиримидин,  
 6-этил-2-(4'-трифторметилфенил)-4-(1"-метил-3"-трифторметилпиразол-5"-илокси)пиримидин,  
 6-этил-2-(4'-трифторметилфенил)-4-(3-трифторметилфеноксид)пиримидин,  
 6-этил-2-(4'-трифторметилфенил)-4-(2'-хлорпирид-4'-илокси)пиримидин,  
 6-метоксиметил-2-(4'-хлорфенил)-4-(1"-метил-3"-трифторметилпиразол-5"-илокси)пиримидин,  
 4-(3"-трифторметилфеноксид)-2-(4'-трифторметилфенил)пиримидин,  
 4-(1"-метил-3"-трифторметил-пиразол-5"-илокси)-2-(4'-трифтор-метилфенил)пиримидин,  
 6-хлор-2-(4'-трифторметилфенил)-4-(1"-метил-3"-трифторметилпиразол-5"-илокси)пиримидин,  
 6-бром-2-(4'-трифторметил-фенил)-4-(1"-метил-3"-трифторметил-пиразол-5"-илокси)пиримидин,  
 6-фтор-2-(4'-трифторметил-фенил)-4-(1"-метил-3"-трифтор-метилпиразол-5"-илокси)пиримидин,  
 6-метокси-2-(4'-трифторметилфенил)-4-(3"-трифторметил-феноксид)пиримидин,  
 6-метокси-2-(4'-трифторметил-фенил)-4-(1"-метил-3"-трифтор-метилпиразол-5"-илокси)пиримидин,  
 6-метокси-2-(4'-трифторметил-фенил)-4-(2'-хлорпирид-4'-илокси)пиримидин,  
 5-метокси-2-(4'-трифторметил-фенил)-4-(3"-трифторметил-феноксид)пиримидин,  
 5-метокси-2-(4'-трифторметил-фенил)-4-(1"-метил-3"-трифторметил-пиразол-5"-илокси)пиримидин,  
 5-метокси-2-(4'-трифторметил-фенил)-4-(2'-хлорпирид-4'-илокси)пиримидин.

Соединения по изобретению могут быть получены обычными способами.

Приемлемым является способ получения 2,6-дизамещенных пиридинов или 2,4-дизамещенных пиримидинов общей формулы I по п.1, заключающийся в том, что соединение общей формулы III



подвергают взаимодействию с соединением общей формулы IV

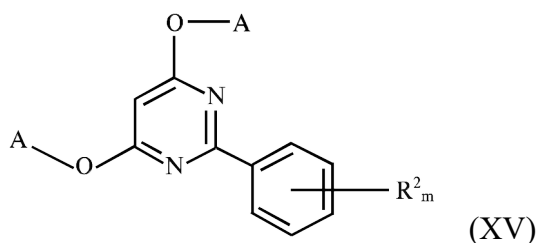
### A-XM

где Z, A, R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup>, m, n и X определены в п. 1;

Ha представляет атом галогена;

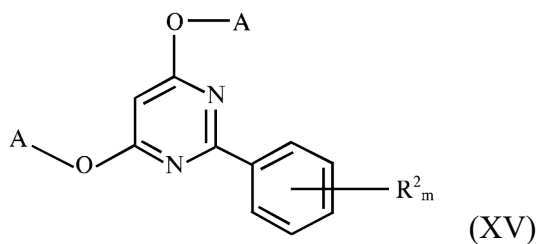
M представляет атом металла.

Способ получения соединения общей формулы I, где R<sup>1</sup> является низшим алкоксилем или низшим алкилтио, заключается во взаимодействии соединения общей формулы XV

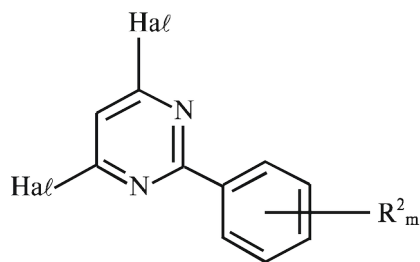


с соединением общей формулы R<sup>1</sup>-H или его солью с металлом, где A, m и R<sup>2</sup> определены в п.1 и R<sup>1</sup> указан выше.

Альтернативно, способ получения замещенных 2-фенил-4,6-диоксипиримидинов формулы XV



где A, R<sup>2</sup> и m указаны в п. 1, заключается в том, что соединение формулы

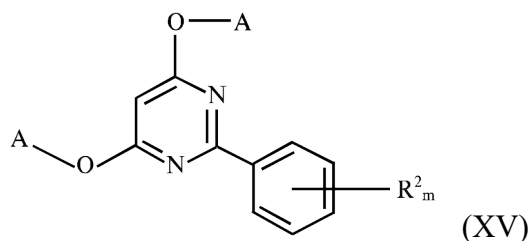


где R<sup>2</sup> и m указаны выше, Ha - атом галогена, подвергают взаимодействию с соединением формулы

### A-OM,

где А имеет значения, указанные выше, и М - атом металла.

Предложены также замещенные 2-фенил-4,6-диоксипиримидины общей формулы XV



где А,  $R^2$  и m определены выше, в качестве промежуточных соединений для синтеза соединений общей формулы I.

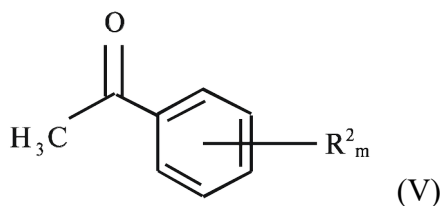
Соединение общей формулы I, если желательно, может быть выделено и очищено с использованием обычных методов.

Предлагаемые соединения в области применяемых доз нетоксичны.

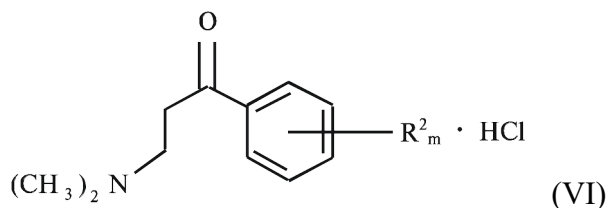
Соединения XV могут быть получены из III, где  $R^1$  представляет Na, Z представляет азот, Na,  $R^2$  и m определены выше, путем взаимодействия с IV, описанным выше, X обозначает кислород, с использованием приблизительно 2 эквивалентов IV.

На практике взаимодействие можно проводить в отсутствии или в присутствии растворителя, который способствует взаимодействию, или, по крайней мере, не мешает ее протеканию. Предпочтительны полярные, апротонные либо протонные растворители, обычно таковыми являются N,N-диметилформамид или диметилсульфоксид, или сульфолан, или эфир, такой как тетрагидрофуран либо диоксан, или спирты, или вода, или их смеси. Взаимодействие проводят при температуре между комнатной температурой и температурой кипения реакционной смеси, предпочтительно при повышенной температуре, особенно при температуре перегонки.

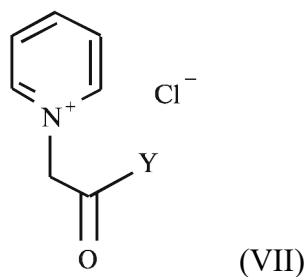
Соединения формулы III, в которых Z представляет собой C-H-группу и n равно 0, могут быть получены путем взаимодействия соединений с общей формулой V



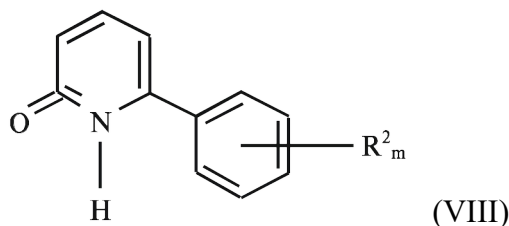
где  $R^2$  и m определены выше, с альдегидом, подходящим является обычно формальдегид, и диалкиламин, подходящим является диметиламин, в соответствии с Org. Synthesis Col. Vol. III. 305f, в растворителе, обычно в спирте, предпочтительно в этаноле, с получением соединения общей формулы VI



которые, согласно DBP 2147288 (1971), последовательно взаимодействуют с солью аммония, подходящим является ацетат аммония, и соединением общей формулы VII

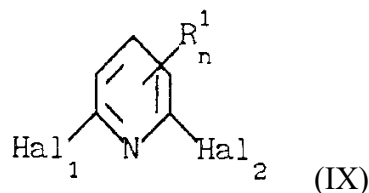


где Y является алкоксигруппой или NH<sub>2</sub>-группой, предпочтительно этоксигруппой, в растворителе, подходящим является спирт, предпочтительно этанол, с получением соединения общей формулы VIII

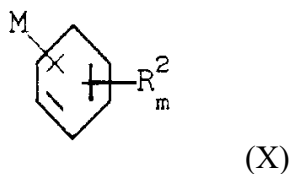


которые далее преобразуют путем взаимодействия VIII с фосфорил-галогенидами (Muller. E., Chem.Ber. 42, 423 (1909), Katritzky et al., J.Chem.Soc., Perkin Trans. Part 1, 1980, 2743 - 2754), предпочтительно, фосфорилбромидом или фосфорилхлоридом, при повышенных температурах, в идеале при температуре кипения, с получением соединения общей формулы III.

Альтернативный и предпочтительный способ получения соединений общей формулы III, в которых Z представляет собой C-H-группу, включает взаимодействие 2,6-дигалоидпиридинов общей формулы IX



где R<sup>1</sup> и n определены выше, и каждый из Hal<sub>1</sub> и Hal<sub>2</sub>, независимо, представляет собой атом галогена, с металлоорганическим производным бензола общей формулы (X), при приблизительно эквимольном отношении,

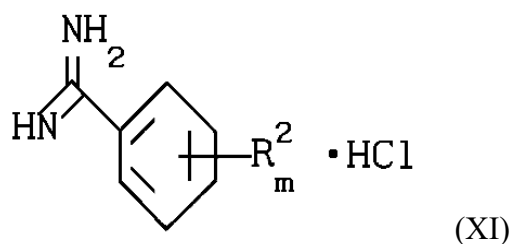


где R<sup>2</sup> и m определены выше и M представляет собой атом щелочного металла, или бора, или олова, или магния, или цинка, или меди, необязательно в присутствии катализатора на основе переходных металлов.

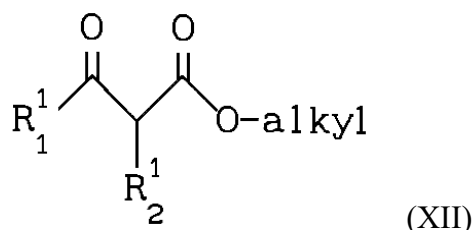
Щелочным металлом может быть любой щелочной металл, предпочтительно литий, и реакцию можно проводить в апротонном полярном растворителе, предпочтительно эфире, с получением соединения общей формулы III, особенно как это показано в Cook and Wakefield, J.Chem.Soc., 1969, 2376, или в неполярных растворителях, или воде, например, как описано в Ali, N.M. et al. Tetrahedron, 1992, 8117.

Соединения формулы III, где Z обозначает CH, Hal обозначает фтор, R<sup>1</sup> представляет водород, R<sup>2</sup> и m определены выше, могут быть далее превращены в соединения формулы III, в которых n=1, Z обозначает CH, Hal обозначает фтор, R<sup>2</sup> и m определены выше и R<sup>1</sup> находится в положении 3 и является метилтиогруппой (или другой группой из описанной выше совокупности, которая вводится в виде электрофильного реагента) аналогично методу, описанному в Gingor, T., Marsais, F. and Queguiner, G., J. Organometallic Chem., 1981, 139-150.

Способ получения соединений формулы III, в которых Z представляет собой атом азота, включает взаимодействие гидрохлорида бензамидина общей формулы XI

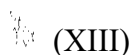


где R<sup>2</sup> и m указаны выше, с соединениями формулы XII или его солью



где R<sup>1</sup> и R<sup>2</sup>, независимо, определены выше;

О-алкильная группа обычно представляет собой метокси или этокси, с получением пиримидинона общей формулы XIII, в которой R<sup>1</sup> может также быть гидроксилем



Соединения общей формулы XI известны либо могут быть получены в соответствии с описанными в литературе способами, например, в Tetrahedron, 33, 1675f (1979) и J.Org.Chem., 26, 412f (1960).

Взаимодействие соединений с формулами XI и XII может быть проведено в соответствии с Liebigs Ann. 1980, 1392F в органических растворителях, обычно спиртах, предпочтительно в этаноле, и в присутствии основания, обычно алкоксидов металлов, предпочтительно, этоксида натрия.

Соединения формулы XIII могут быть последовательно преобразованы в соединения формулы III, в основном так, как описано в Davies and Pigott, J.Chem.Soc. 1945, 347, путем взаимодействия с фосфорилгалогенидом, или тионилгалогенидом, или фосгеном, предпочтительно с фосфорилхлоридом, фосфорилбромидом, лучше всего в отсутствие растворителя, при повышенных температурах, с получением соединений формулы III.

Соединения формулы III при значениях, указанных выше для R<sup>1</sup> = F, могут быть получены из соединения III, когда R<sup>1</sup> является хлором или амином, в соответствии с известными в литературе способами, подобными описанным в Tullock C.W. et al., J.Am.Chem.Soc. 1960, 5197 или Kiburis J., Klister J., J. Chem. Soc. Chem. Com. 1969, 381.

Соединения общей формулы IV известны или могут быть получены известными способами. Они могут быть получены и выделены отдельно либо могут быть приготовлены in situ. Обычно соединение общей формулы XIV



## А-ХН (XIV)

где А и Х определены выше, подвергают взаимодействию с подходящим металлосодержащим основанием, например, карбонатом и гидридом металла. Предпочтительной солью металла является соль натрия или калия.

В настоящем изобретении также предусматривается использование соединения общей формулы I в качестве гербицида. Далее, в соответствии с изобретением предусматривается способ борьбы с ростом нежелательной растительности в каком-либо локусе путем обработки этого локуса композицией по изобретению, или соединением формулы I. Так как полезное воздействие достигается применением опрыскивания листьев, то локус наиболее предпочтительно представляет собой растения, находящиеся на площади роста сельскохозяйственных культур, типичными культурами являются злаки, маис, соевые бобы, подсолнечник или хлопок. Однако для указанных соединений, обладающих довсходовым гербицидным действием, возможно также нанесение на почву. Доза используемого активного ингредиента может, например, находиться в диапазоне от 0.01 до 10 кг/га, предпочтительно от 0.05 до 1 кг/га.

Настоящее изобретение включает также способ получения гербицидной композиции согласно изобретению, который включает смешивание соединения формулы I с, по меньшей мере, одним носителем.

Предпочтительно в составе должны иметься, по меньшей мере, два носителя, хотя бы один из которых является поверхностно-активным агентом.

Носителем в составах согласно изобретению может являться любое вещество, с которым сочетается активный ингредиент с целью облегчения применения на локусе, который необходимо обработать, которым могут являться растения, семена или почва, либо для того, чтобы облегчить их хранение, транспортировку или обращение с ними. Носитель может быть твердым или жидким, включая вещества, которые обычно находятся в газообразном состоянии, но могут быть сжаты так, что образуется жидкость, а также могут быть использованы любые носители, обычно применяемые при приготовлении гербицидных составов. Предпочтительно композиции по изобретению содержат от 0.5 до 95 % по весу активного ингредиента.

Подходящие твердые носители включают натуральные и синтетические глины и силикаты, к примеру, натуральные силикаты, такие как диатомовые земли; силикаты магния; например, тальки; силикаты алюминия-магния, например, аттапульгиты и вермикулиты; силикаты алюминия, к примеру, каолиниты, монтмориллониты и слюды; карбонат кальция; сульфат кальция; сульфат аммония; синтетические гидратированные оксиды кремния и синтетические силикаты кальция или алюминия; элементы, например, углерод и серу; натуральные и синтетические смолы, например, кумароновые смолы, поливинилхлорид и стирольные полимеры и сополимеры; твердые полихлорфенолы; битум; воски; твердые удобрения, например, суперфосфаты.

Подходящие жидкие носители включают воду; спирты, например, изопропанол и гликоли; кетоны, к примеру, ацетон, метилэтилкетон, метилизобутилкетон и циклогексанон; эфиры; ароматические или арилифатические углеводороды, например, бензол, толуол и ксилол; фракции нефти, к примеру, керосин и легкие минеральные масла; хлорированные углеводороды, например, тетрахлоруглерод, перхлорэтилен и трихлорэтан. Часто являются пригодными смеси различных жидкостей.

Сельскохозяйственные композиции часто получают и транспортируют в концентрированной форме, которая впоследствии разбавляется пользователем перед применением. Присутствие малых количеств носителя, который является поверхностно-активным агентом, облегчает этот процесс разбавления. Таким образом, предпочтительно, чтобы, по крайней мере, один носитель в композиции согласно изобретению являлся поверхностно-активным агентом. К примеру, композиция может содержать не менее двух носителей, по меньшей мере, один из которых является поверхностно-активным агентом.

Поверхностно-активный агент может быть эмульгатором, диспергатором или смазывающим агентом; он может быть неионным или ионным. Примеры подходящих поверхностно-активных агентов включают натриевые или кальциевые соли полиакриловых кислот и лигнинсульфоновых кислот; продукты конденсации жирных кислот либо алифатических аминов или амидов, содержащих не менее 12 атомов углерода в молекуле, с этиленоксидом и/или пропиленоксидом; эфиры жирных кислот и глицерина, сорбитола, сахарозы или пентаэритрола; их конденсаты с этиленоксидом и/или пропилен оксидом; продукты конденсации жирных спиртов или алкилфенолов, например, п-октилфенола или п-октилкрезола, с этиленоксидом и/или пропиленоксидом; сульфаты или сульфонаты этих продуктов конденсации; соли щелочных или щелочно-земельных металлов, предпочтительно соли натрия, и эфиров серной или сульфоновой кислоты, содержащих не менее 10 атомов углерода в молекуле, например, лаурилсульфат натрия, вторичные алкилсульфаты натрия, натриевые соли сульфонируемого касторового масла, и алкиларилсульфонаты натрия, такие как додецилбензолсульфонат; и полимеры этиленоксида и сополимеры этиленоксида и пропиленоксида.

Гербицидные составы, согласно изобретению, могут также содержать другие активные ингредиенты, к примеру, соединения, обладающие инсектицидными или фунгицидными свойствами, или другие гербициды.

Готовый к использованию состав, содержащий соединения в соответствии с изобретением, может содержать 100 г активного ингредиента (соединение формулы I), 30 г диспергатора, 3 г пеногасителя, 2 г структурного агента, 50 г антифриза (добавки, снижающей температуру замерзания), 0.5 г биоцидного агента и воду до 1000 мл. Перед началом использования состав разводится водой для получения требуемой концентрации активного ингредиента.

Следующие примеры иллюстрируют изобретение. Структура соединений, полученных в следующих примерах, дополнительно подтверждена с помощью ЯМР и масс-спектрометрии.

#### Пример 1

##### Гидрохлорид β-диметиламинопропиофенона

Ацетофенон (29.1 мл, 0.25 моль), параформальдегид (12.0 г, 0.40 моль) и гидрохлорид диметиламина (28.5 г, 0.35 моль) суспендировали в этаноле (50 мл). Добавляли концентрированную соляную кислоту (0.5 мл) и смесь нагревали с обратным холодильником в течение 4 ч. Затем добавляли ацетон (200 мл) и образовавшемуся прозрачному раствору давали остыть до комнатной температуры. Осадок собирали путем фильтрации и кристаллизовали из этанола с получением указанного в заголовке соединения (40.7 г, 76.0 % от теоретического выхода) в виде бесцветных кристаллов с т. пл. 158°C.

#### Примеры 2-4

Дополнительные примеры соединений общей формулы VI получены, как описано в примере 1. Подробности даны в таблице 1.

#### Пример 5

##### 6-Фенил-2-пиридон

Этил-2-хлорацетат (10.6 мл, 0.1 моль) медленно добавляли к горячему (105°C) пиридину (8.9 мл, 0.11 моль), при этом температура поддерживалась в диапазоне от 100 до 110°C. Полученное коричневое масло растворяли в этаноле (60 мл), добавляли гидрохлорид β-диметиламинопропиофенона (17.7 г, 0.1 моль; получен в соответствии с примером 1) и ацетат аммония (60 г) и кипятили смесь с обратным холодильником в течение 4 ч. После охлаждения смесь фильтровали и растворитель выпаривали в вакууме. Остаток кристаллизовали из воды, собирали при помощи фильтрации и очищали посредством рекристаллизации из толуола. Указанное в заголовке соединение получали в виде бесцветных кристаллов (4.71 г, выход 28 %) с т. пл. 200°C.

#### Примеры 6-8

Дополнительные примеры соединений получены аналогично примеру 5. Подроб-

ности даны в таблице 2.

#### Пример 9

##### 2-Бром-6-фенилпиридин

Смесь 6-фенилпиридола (3 г, 17.5 ммоль, получен согласно примеру 5) и фосфорилбромида (7.2 г, 25.0 ммоль) нагревали до 100 °С в течение 5 ч. Охлажденную смесь выливали в воду (40 мл) и доводили pH до 9 путем добавления насыщенного раствора карбоната натрия. Затем слои разделяли и экстрагировали водный слой этилацетатом (50 мл). Объединенные органические слои сушили над безводным сульфатом магния и выпаривали растворитель в вакууме. Сырой (неочищенный) продукт кристаллизовали из водного этанола. Последующая очистка с помощью тонкослойной хроматографии (силикагель, гексан/этилацетат 9/1 об./об.) давала 2-бром-6-фенилпиридин (3.1 г, выход 76 %) в виде светло-коричневых кристаллов с т. пл. 50°C.

#### Примеры 10-12

Дополнительные соединения общей формулы III получены по методикам, аналогичным приведенной в примере 9. Подробности даны в таблице 3.

#### Пример 13

##### 2-(1'-Метил-3'-трифторметил-пиразол-5'-илокси)-6-фенилпиридин

Смесь 2-бром-6-фенилпиридина (0.5 г, 2.1 ммоль; получен согласно примеру 9), 1-метил-3-трифторметил-5-гидроксипиразола (0.65 г, 3.9 ммоль), карбоната калия (0.6 г, 4.3 ммоль) и N,N-диметилформамида (2 мл) нагревали с обратным холодильником в течение 12 ч. Затем реакционную смесь помещали непосредственно в колонку для тонкослойной хроматографии (силикагель). Элюирование смесью гексан/этилацетат (9/1 об./об.) давало указанное в заголовке соединение (0.35 г, выход 52 %) в виде светло-желтого масла.

#### Примеры 14-16

Соединения, описанные в таблице 4, получены по методикам, аналогичным приведенной в примере 13.

#### Пример 17

##### 2-фтор-6-(4'-фторфенил) пиридин

Бутиллитий (105.0 мл, 0.26 моль, 2.5 М раствор в гексане) добавляли к раствору 1-бром-4-фторбензола (34.3 мл, 0.31 моль) в безводном диэтиловом эфире (200 мл) при -20°C. Смесь перемешивали в течение 60 мин и затем охлаждали до -40°C. Добавляли 2,6-ди-фторпиридин (22.7 мл, 0.25 моль) и давали реакционной смеси нагреться до комнатной температуры. В дальнейшем смесь промывали насыщенным водным раствором хлорида аммония (300 мл). Слои разделяли, и водный слой промывали диэтиловым эфиром 3 раза (по 100 мл). После сушки объединенных органических слоев над безводным сульфатом магния растворитель удаляли в вакууме. Сырой продукт очищали с помощью колонки тонкослойной хроматографии (силикагель, гексан/АсОEt 8/2), получая бесцветные кристаллы 2-фтор-6-(4'-фторфенил)пиридина (19.8 г, выход 41.0 %) с т. пл. 34°C.

#### Пример 18

##### 2-фтор-6-(4'-фторфенил)-4-метилпиридин

Смесь 2-бром-6-фтор-4-метил-пиридина (9.5 г, 50 ммоль), 4-фтор-бензолбороновой кислоты (7.8 г, 56 ммоль), бикарбоната натрия (12.6 г, 150 ммоль), воды (200 мл) и каталитических количеств тетраис(трифенил-фосфин) палладия (0) в диметиловом эфире в атмосфере азота нагревали с обратным холодильником в течение целой ночи. После фильтрации реакционной смеси растворители удалялись при пониженном давлении. Остаток распределялся между водой и этилацетатом. Слои разделяли, и водный слой промывали этилацетатом. После высушивания объединенных органических слоев над безводным сульфатом магния растворитель удаляли в вакууме. Сырой продукт очищали с помощью тонкослойной колоночной хроматографии (силикагель, пентан/этилацетат 9/1) с получением бесцветных кристаллов 2-фтор-6-(4'-фтор-фенил)-4-метилпиридина (3.7 г, выход 36.1 %) с т. пл. 49°C.

#### Пример 19

### 2-фтор-6-(4'-трифторфенил)-3-метилтиопиридин

К раствору 2-фтор-6-(4'-трифтор-фенил)пиридина (2.4 г, 10 ммоль, получен согласно способу примера 17), используя 1-бром-4-трифторметилбензол в качестве исходного продукта, в безводном ТГФ (тетрагидрофуране; 35 мл) добавляли по каплям 2 М раствор LDA в ТГФ (7.5 мл, 15 ммоль) при  $-70^{\circ}\text{C}$ . После 2 ч выдерживания при  $-70^{\circ}\text{C}$  добавляли диметилдисульфид (1.41 г, 15 ммоль) и давали реакционной смеси нагреться до  $-20^{\circ}\text{C}$ . Смесь гидролизовали и экстрагировали диэтиловым эфиром. После разделения органический слой сушили над безводным сульфатом магния. Растворители удаляли, и сырой продукт очищали с помощью тонкослойной колоночной хроматографии (силикагель). Элюирование смесью гексан/этилацетат (20/1 об./об.) приводило к получению указанного в заголовке соединения (1.2 г, выход 42 %) с т. пл.  $70-73^{\circ}\text{C}$ .

### Примеры 20-23

Аналогично примеру 17 были получены образцы соединений, описанные в таблице 5.

### Пример 24

### 2-(3'-Хлорпирид-5'-илокси)-6-(4''-фторфенилокси)пиридин

Смесь 2-фтор-6-(4'-фторфенил) пиридина (1.9 г, 10 ммоль, получен в соответствии с примером 17), 3-хлор-5-гидроксипиридина (1.4 г, 11.0 ммоль) и карбоната калия (1.5 г, 11.0 ммоль) в сульфолане нагревали с обратным холодильником в течение 8 ч. Смеси давали охладиться до комнатной температуры и затем фильтровали через слой силикагеля, который далее промывали этилацетатом. Полученные слои органического раствора объединяли и выпаривали растворитель в вакууме. Оставшееся вещество помещали в верхнюю часть колонки для тонкослойной хроматографии (силикагель) и элюировали смесью гексан/этилацетат (8/2 об./об.). Элюирование давало 2-(3'-хлорпирид-5'-илокси)-6-(4''-фторфенилокси)пиридин (1.4 г, выход 46 %) в виде светло-коричневых кристаллов с т. пл.  $139^{\circ}\text{C}$ .

### Примеры 25-39

Дополнительные соединения получены аналогично примеру 24. Подробности представлены в таблице 6.

### Пример 40

### Гидрохлорид 4-фторбензамидина

4-Фторбензонитрил (10 г, 83 ммоль) растворяли в смеси безводного этанола (5 мл) и диэтилового эфира (70 мл). Реакционную смесь охлаждали до температуры ледяной бани и насыщали газообразным хлороводородом в течение 90 мин. Смеси давали нагреться до комнатной температуры и перемешивали ее в течение ночи.

Бесцветный осадок отфильтровывали, промывали диэтиловым эфиром и растворяли в безводном этаноле (20 мл). Добавляли диэтиловый эфир (100 мл), насыщенный газообразным аммиаком, и раствор перемешивали в течение 3 ч.

Образовавшуюся суспензию фильтровали, и растворитель из фильтрата удаляли под вакуумом. Остаток промывали диизопропиловым эфиром. После высушивания получали бесцветные кристаллы (5.15 г, 35.5 %) с т. пл.  $210^{\circ}\text{C}$ .

### Примеры 41-50

Следующие соединения общей формулы XI получены при помощи методов, аналогичных приведенному в примере 40. Подробности даны в таблице 7.

### Пример 51

### 2-(4'-Фторфенил)-5-метил-4-пиримидинон

Гидрид натрия (0.52 г, 13 ммоль) добавляли к 20 мл безводного этанола и перемешивали в течение 30 мин при комнатной температуре. Далее туда же добавляли гидрохлорид 4-фтор-бензамидина (1.47 г, 8.5 ммоль) (из примера 40) и смесь перемешивали в течение еще 30 мин. Добавляли по каплям метил-2-формилпропионат (1 г, 10.6 ммоль) и реакционную смесь оставляли перемешиваться при комнатной температуре на 4 дня.

После охлаждения растворитель удаляли в вакууме, и остаток растворяли в водном гидроксиде натрия (10 мл, 1 М). Затем pH смеси приводили к 5 при помощи 2 М соляной

кислоты. Осадок отфильтровывали и промывали диизопропиловым эфиром. После высушивания получали бесцветные кристаллы (0.44 г, 10.3 %) с т. пл. > 250°C.

#### Пример 52

##### 6-Гидрокси-2-(4'-трифторметилфенил)-4-пиримидинон

Гидрохлорид 4-трифтор-бензамидина (22.4 г, 0.1 моль, из примера 41) добавляли к раствору метилата калия (0.22 моль) в безводном метиловом спирте (65 мл) и перемешивали в течение 15 мин при комнатной температуре. Добавляли диметилмалонат (12.6 мл, 0.11 моль) и смесь нагревали с обратным холодильником в течение 4 ч. После охлаждения образовавшуюся суспензию разбавляли метиловым спиртом (50 мл). Растворитель удаляли в вакууме, и остаток растворяли в воде (50 мл). Затем pH смеси приводили к 1 при помощи концентрированной соляной кислоты. Осадок отфильтровывали и промывали водой. После высушивания получали бледно-желтые кристаллы (15.1 г, 59 %) с т. пл. > 200°C.

#### Пример 53

##### 5-метокси-2-(4'-трифторметилфенил)-4-пиримидинон

К суспензии гидроксида натрия (60 %, 6 г, 0.15 моль) в безводном ТГФ (225 мл) добавляли в течение 30 мин раствор метилметоксиацетата (14.9 мл, 0.15 моль) в метилформиате (11.1 мл, 0.18 моль). Смесь перемешивали в течение 2 ч при комнатной температуре. После добавления диэтилового эфира (300 мл) образовавшаяся натриевая соль моноальдегида метилметоксималоната может быть выделена посредством отсасывания. Далее эту натриевую соль (0.075 моль) добавляли к гидрохлориду 4-трифторметил-бензамидина (16.8 г, 0.075 ммоль, из примера 41) в безводном этиловом спирте (150 мл) и смесь перемешивали в течение 48 ч при комнатной температуре. После нагревания с обратным холодильником в течение 1 ч к смеси добавляли воду (100 мл) и раствор фильтровали.

pH фильтрата доводили до 5 уксусной кислотой и удаляли этиловый спирт в вакууме. Осадок отфильтровывали и промывали этиловым спиртом. После высушивания получали кристаллы (13.7 г, 68 %) с т. пл. > 200°C.

#### Примеры 54-78

Способом, продемонстрированным в примере 51, получены следующие соединения общей формулы III. Подробности даны в таблице 8.

#### Пример 79

##### 2-(4'-фторфенил)-4-хлор-5-метилпиримидин

Смесь 2-(4'-фторфенил)-5-метил-4-пиримидинона (0.79 г, 3.9 ммоль) (из примера 51) и оксихлорида фосфора (3 мл) нагревали с обратным холодильником в течение 1 ч.

Основную часть избытка оксихлорида фосфора удаляли в вакууме и гасили остаток водой (10 мл), чтобы гидролизовать еще оставшийся реагент. Смесь нейтрализовали и затем экстрагировали этилацетатом (50 мл). После высушивания органического слоя безводным сульфатом магния растворитель удаляли в вакууме. Указанное в заголовке соединения (0.63 г, 72.6 %) получали в виде бесцветных кристаллов с т. пл. 133°C.

#### Пример 80

##### 2-(4'-Хлорфенил)-4,5-дихлор-6-метоксипиримидин

К раствору 2-(4'-хлорфенил)-4,5,6-трихлорпиримидина (1.85 г, 6.3 ммоль) в метиловом спирте (30 мл) ТГФ (60 мл) добавляли раствор натрия (0.145 г, 6.3 ммоль) в метиловом спирте (10 мл) и смесь перемешивали при комнатной температуре в течение ночи. После удаления растворителя в вакууме к остатку добавляли дихлорметан и образовавшуюся смесь промывали водой. После высушивания органического слоя безводным сульфатом магния растворитель удаляли. Обработка остатка пентаном давала указанное в заголовке соединения (1.75 г, 96 %) в виде бесцветных кристаллов с т. пл. 157-159°C.

#### Примеры 81-108

Соединения общей формулы XIII, перечисленные в таблице 9, получены аналогич-

но методу, описанному в примере 79.

#### Пример 109

2-(4'-фторфенил)-4-(3''-фторметилфеноксид)-6-метилпиримидин

Смесь 2-(4'-фторфенил)-4-хлор-6-метилпиридина (0.6 г, 2.7 ммоль) (из примера 81),  $\alpha,\alpha,\alpha$ -3-гидрокси-бензотрифторида (0.49 г, 3 ммоль) и карбоната калия (0.41 г, 3 ммоль) в N,N-диметилформамиде (3 мл) нагревали с обратным холодильником в течение 2 ч.

После охлаждения добавляли этилацетат (10 мл) и суспензию фильтровали через слой силикагеля, используя этилацетат. Растворитель из фильтрата удаляли под вакуумом, и остаток очищали при помощи тонкослойной хроматографии на колонке с силикагелем, используя смесь гексан/этилацетат 7/2. Удаление растворителя давало бесцветные кристаллы (0.53 г, 56.4 %) с т. пл. 58°C.

#### Примеры 110-183

Следующие соединения общей формулы I получены согласно методике из примера 109. Подробности даны в таблице 10.

#### Пример 184

4,6-бис(2''-хлорпирид-4''-илокси)-2-(4'-трифторметилфенил)пиримидин

Смесь 4,6-дихлор-2-(4'-трифтор-метилфенил)пиримидина (2.93 г, 10 ммоль) (из примера 107), 2-хлор-4-гидрокси-4-хлорпиридина (2.85 г, 22 ммоль) и карбоната калия (3.04 г, 22 ммоль) в безводном N,N-диметилформамиде (20 мл) нагревали при 80°C в течение 1 ч.

После охлаждения растворитель удаляли в вакууме, добавляли этилацетат и суспензию фильтровали через слой силикагеля. Получившийся в результате этого раствор трижды промывали водой. После высушивания органического слоя над безводным сульфатом магния растворитель удаляли, и остаток очищали при помощи тонкослойной хроматографии на силикагеле с использованием смеси гексан/этилацетат 8/2. Удаление растворителя давало бесцветные кристаллы (4.1 г, 86 %) с т. пл. 141°C.

#### Примеры 185-187

Соединения общей формулы XVa, перечисленные в табл. 11, приготовлены аналогично методу из примера 184. Подробности приведены в таблице 11.

#### Пример 188

6-метокси-4-(2''-хлорпирид-4''-илокси)-2-(4'-трифторметилфенил)пиримидин

4,6-бис(2''-хлорпирид-4''-илокси)-2-(4'-трифторметилфенил)пиримидин (2.0 г, 4.2 ммоль) (из примера 184) растворяли в безводном метиловом спирте (5 мл), к этому раствору добавляли по каплям раствор метилата калия (4.2 ммоль) в метиловом спирте (1.2 мл) и смесь нагревали с обратным холодильником в течение 30 мин.

Растворитель удаляли в вакууме, и остаток очищали при помощи тонкослойной хроматографии на силикагеле с использованием смеси гексан/этилацетат 9/1. Удаление растворителя давало бесцветные кристаллы (1.0 г, 62 %) с т. пл. 128°C.

#### Пример 189

4,6-дибром-2-(4'-трифторметилфенил)пиримидин

Смесь 4,6-дигидрокси-2-(4'-трифторметилфенил)пиримидина (5.12 г, 20 ммоль) и оксидбромид фосфора (10 мл) нагревали в течение 3 ч при 100°C. К образовавшейся горячей суспензии добавляли лед, и далее продукт можно было выделить отсасыванием. После высушивания получали почти бесцветные кристаллы (6.5 г, 86 %) с т. пл. 87°C.

#### Примеры 190-203

Соединения общей формулы I получены при помощи методик из примеров 188 или 189. Подробности даны в таблице 12.

#### Пример 204

6-винил-4-(1''-метил-3''-трифторметилпиразол-5''-ил)-2-(4'-трифторметилфенил)пиримидин

Смесь 6-бром-4-(1''-метил-3''-трифторметилпиразол-5''-ил)-2-(4'-трифторметилфе-

нил)пиримидина (2 г, 4.3 ммоль из примера 201), винилтрибутилстанната (1.4 мл, 4.7 ммоль), тетракис (трифенилфосфин)-палладия (0) (0.1 г, 0.09 ммоль), толуола (20 мл) и трех кристаллов ди-(трет-бутил)-4-метилфенола нагревали с обратным холодильником в течение 90 мин. После охлаждения добавляли 1.2 н. раствор фторида пиридиния в ТГФ/пиридине (4 мл) и пиридин (2 мл). Раствор перемешивали в течение 17 ч при комнатной температуре. К образовавшейся смеси добавляли этилацетат (100 мл) и раствор дважды промывали водой и насыщенным раствором бикарбоната натрия. После высушивания органического слоя безводным сульфатом магния растворитель удаляли, и остаток очищали при помощи тонкослойной хроматографии на силикагеле с использованием смеси гексан/этилацетат 7/3. Удаление растворителя давало почти бесцветные кристаллы (1.45 г, 82 %) с т. пл. 112°C.

#### Пример 205

##### Гербицидная активность

С целью оценки их гербицидной активности соединения согласно изобретению испытывались с использованием репрезентативного ряда растений:

TRZAS *Triticum aestivum*  
 HORVW *Hordeum vulgare*  
 GOSHI *Gossypium hirsutum*  
 HELAN *Helianthus annuus*  
 ORYSA *Oryza sativa*  
 GLXMA *Glycine max*  
 BEAVA *Beta vulgaris*  
 ZEAMX *Zea mays*  
 ALOMY *Alopecurus myosuroides*  
 AVEFA *Avena fatua*  
 ECHCG *Echinochloa crus-galli*  
 SETVI *Setaria viridis*  
 GALAP *Galium aparine*  
 STEME *Stellaria media*  
 CHEAL *Chenopodium album*  
 VERPE *Veronica persica*  
 LAMPU *Lamium purpureum*  
 VIOAR *Viola arvensis*  
 SIDSP *Sida spinosa*  
 AMBAR *Ambrosia artemisiifolia*  
 ABUTH *Abutilon theophrasti*  
 IPOPU *Ipomoea purpurea*  
 SINAL *Sinapis alba*  
 AMARE *Amaranthus retroflexus*

Испытания подразделялись на две категории - довсходовые и послевсходовые. Довсходовые испытания включали разбрызгивание жидких композиций на основе соединений на почву, в которую недавно посеяны семена вышеупомянутых видов растений. Послевсходовые испытания включали опрыскивание взойшедших сеянцев вышеуказанных видов такими составами.

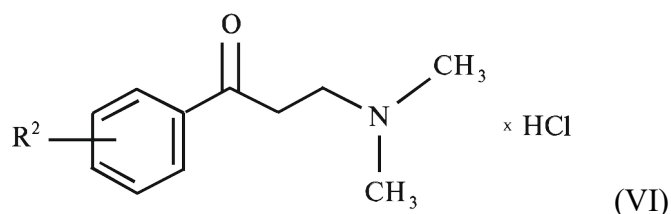
Почва, используемая в испытаниях, представляла собой приготовленную садовую плодородную землю. Используемые в тестах готовые составы получали из растворов испытуемых соединений в ацетоне, содержащих 0.4 % (вес.) поверхностно-активной добавки типа конденсата алкилфенила с этиленоксидом, имеющейся под торговой маркой TRITON X 55. Раствор в ацетоне разбавляли водой, и полученные составы содержали 1000 или 300 г активного вещества на гектар в объемах, эквивалентных 400 л/га. В качестве контрольных в довсходовых испытаниях использовались образцы необработанной засеянной почвы, а в послевсходовых испытаниях - образцы необработанных сеянцев рас-

тений, взошедших на необработанной почве.

Гербицидное воздействие испытуемых соединений определяли визуально через двадцать дней после опрыскивания листвы и почвы (в случае примеров 13-16 через тринадцать дней после обработки) и фиксировали по десятибалльной шкале (0-9). Оценка 0 обозначает такой же рост, как на необработанном контрольном объекте, оценка 9 обозначает полную гибель. Повышение на 1 единицу линейной шкалы соответствует росту степени воздействия приблизительно на 10 %. Звездочки обозначают, что данные виды растений не обрабатывались в этом испытании.

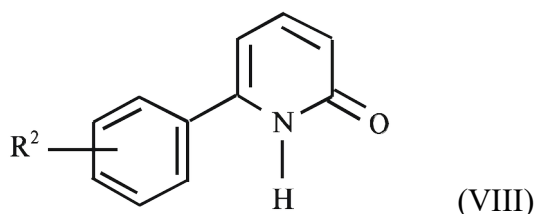
Результаты испытаний представлены в приведенной ниже таблице 13, в которой соединения определяются посредством ссылок на предшествующие примеры. Звездочки обозначают, что данные виды растений не обрабатывались в этом испытании. Обозначения "pre-" и "post-" в графе "Способ применения" соответствуют довсходовому и послевсходовому применению данного соединения.

Таблица 1



Пример №	R <sup>2</sup>	Т. пл. (°C)	выход (%)
2	3-трифторметил	157	63
3	2,4-дихлор	136	51
4	2,4-диметил	134	72

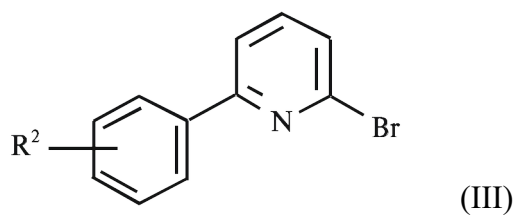
Таблица 2



Пример №	R <sup>2</sup>	Т. пл. (°C)	выход (%)
6	3-трифторметил	174	36
7	2,4-дихлор	255	56
8	2,4-диметил	209	23

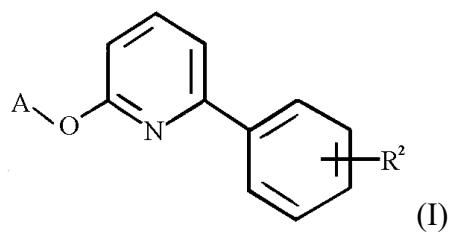


Таблица 3



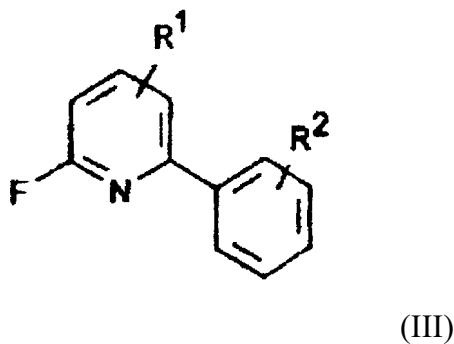
Пример №	R <sup>2</sup>	Т. пл. (°C)	выход (%)
10	3-трифторметил	масло	82
11	2,4-дихлор	123	88
12	2,4-диметил	масло	68

Таблица 4



Пример №	A	R <sup>2</sup>	Т. пл. (°C)	выход (%)
14	1'-CH <sub>3</sub> -3'-CF <sub>3</sub> -пиразол-5'-ил	3''- CF <sub>3</sub>	113	93
15	1'-CH <sub>3</sub> -3'-CF <sub>3</sub> -пиразол-5'-ил	2'',4''-дихлор	91	78
16	1'-CH <sub>3</sub> -3'-CF <sub>3</sub> -пиразол-5'-ил	2'',4''-диметил	масло	95

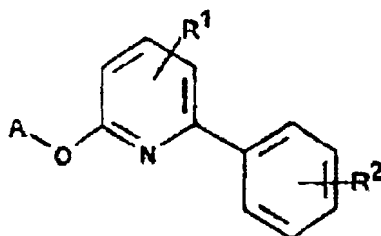
Таблица 5



Пример №	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	Т. пл. (°C)	выход (%)
20	-	-	масло	47

21	-	4'-трифторметил	113	75
22	-	3'-трифторметил	91	72
23	-	3,4-дифтор	масло	24

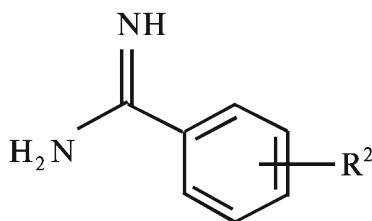
Таблица 6



(I)

При- мер №	R <sup>1</sup>	A	R <sup>2</sup>	Т. пл. (°C)	выход (%)
25	-	3'-CF <sub>3</sub> -фенил	4''-фтор	масло	48
26	-	2'-хлорпирид-4'-ил	4''-фтор	137	37
27	-	2'-хлорпирид-4'-ил	-	109	35
28	-	2'-хлорпирид-4'-ил	4''-трифторметил	105	51
29	-	1'- CH <sub>3</sub> -3'CF <sub>3</sub> -пиразол-5'-ил	4''-фтор	87	44
30	-	1'- CH <sub>3</sub> -3'CF <sub>3</sub> -пиразол-5'-ил	4''-трифторметил	94	59
31	-	1'- CH <sub>3</sub> -3'CF <sub>3</sub> -пиразол-5'-ил	3''-трифторметил	112	44
32	-	2'-хлорпирид-4'-ил	3''-трифторметил	92	54
33	-	2',4'-дифторфенил	3''-трифторметил	масло	72
34	-	3'-CF <sub>3</sub> -фенил	4''-трифторметил	масло	44
35	4-CH <sub>3</sub>	1'- CH <sub>3</sub> -3'CF <sub>3</sub> -пиразол-5'-ил	4''-фтор	85	43
36	4-CH <sub>3</sub>	2'-хлорпирид-4'-ил	4''-фтор	115	35
37	3-CH <sub>3</sub> S	3'-CF <sub>3</sub> -фенил	4''-трифторметил	133-136	67
38	3-CH <sub>3</sub> S	1'- CH <sub>3</sub> -3'CF <sub>3</sub> -пиразол-5'-ил	4''-трифторметил	154-156	41
39	-	1'- CH <sub>3</sub> -3'CF <sub>3</sub> -пиразол-5'-ил	3'',4''-дифтор	масло	29

Таблица 7

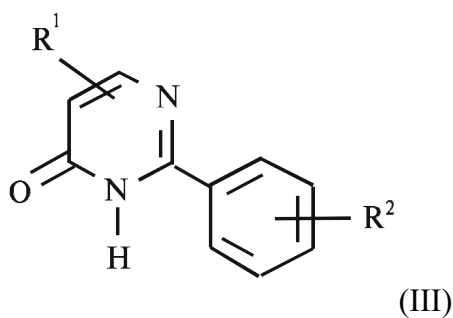


(XI)

Пример №	R <sup>2</sup>	Т. пл. (°C)	выход (%)
41	4-трифторметил	167	21.4
42	3-метил	243	29.7
43	3-хлор	148	17.5
44	3,4-дифтор	185	17.4

45	3-трифторметил	181	17.6
46	3-фтор	143	20.0
47	4-бром	245	39
48	4-хлор	>250	85
49	4-(трет-бутил)	153	92
50	4-трифторметокси	210	57

Таблица 8



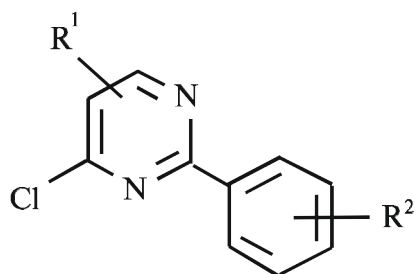
Пример №	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	Т. пл. (°C)	выход (%)
1	2	3	4	5
54	6-метил	4'-фтор	267	56.8
55	5-метил	4'-трифторметил	>250	58.7
56	6-метил	4'-трифторметил	209	82.2
57	5-метил	3'-метил	169	34.3
58	6-метил	3'-метил	185	41.6
59	5-метил	3'-хлор	260	61.4
60	6-метил	3'-хлор	218	51

Продолжение таблицы 8

1	2	3	4	5
61	5-метил	3',4'-дифтор	>250	59.4
62	6-метил	3',4'-дифтор	225	51.3
63	5-метил	3'-трифторметил	204	39.8
64	6-метил	3'-трифторметил	109	26.6
65	5,6-диметил	3'-трифторметил	215	70.4
66	5,6-диметил	4'-трифторметил	242	36.5
67	5-метил	4'-хлор	>250	27.2
68	6-метил	4'-хлор	227	6.8
69	5-метил	3'-фтор	238	56
70	6-метил	3'-фтор	194	48.4
71	6-этил	4'-трифторметил	181	87

72	5-метил	4'-бром	>250	20
73	6-метил	4'-бром	245	39
74	5-метил	4'-(трет-бутил)	218	81
75	6-метил	4'-(трет-бутил)	213	75
76	5,6-диметил	4'-хлор	276	44
77	5,6-диметил	4'-трифторметокси	228	70
78	6-метил	4'-трифторметокси	196	95

Таблица 9



(III)

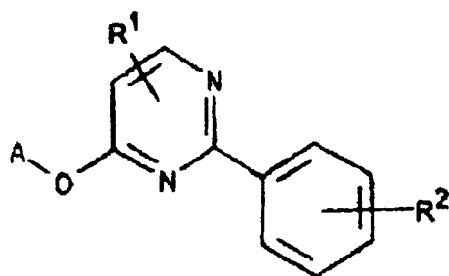
Пример №	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	Т. пл. (°C)	выход (%)
1	2	3	4	5
81	6-метил	4'-фтор	143	97
82	6-метил	4'-трифторметил	62	71.8
83	5-метил	4'-трифторметил	109	87.3
84	5-метил	3'-метил	154	98.8
85	6-метил	3'-метил	134	73.7
86	5-метил	3'-хлор	87	94.1
87	6-метил	3'-хлор	101	26.1
88	5-метил	3',4'-дифтор	114	92
89	6-метил	3',4'-дифтор	94	90.7
90	5,6-диметил	3'-трифторметил	83	81.6

Продолжение таблицы 9

1	2	3	4	5
91	5,6-диметил	4'-трифторметил	57	54.5
92	5-метил	3'-трифторметил	101	81.4
93	6-метил	3'-трифторметил	62	87.3
94	5-метил	4'-хлор	162	85.2
95	6-метил	4'-хлор	101	83.6
96	5-метил	3'-фтор	95	83.7
97	6-метил	3'-фтор	86	71.5
98	6-этил	4'-трифторметил	35	86
99	5-метил	4'-бром	156-158	94
100	6-метил	4'-бром	110-112	94
101	5-метил	4'-(трет-бутил)	103-105	98

102	6-метил	4'-(трет-бутил)	70-72	99
103	5,6-диметил	4'-хлор	87	71
104	5,6-диметил	4'-трифторметокси	76	81
105	5-метил	4'-трифторметокси	129	91
106	6-метил	4'-трифторметокси	64	94
107	6-хлор	4'-трифторметил	80	33
108	6-метокси	4'-трифторметил	108	31

Таблица 10



При- мер №	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	A	Т. пл. (°C)	выход (%)
1	2	3	4	5	6
110	5-метил	4'-фтор	1''-CH <sub>3</sub> -3''CF <sub>3</sub> -пиразол-5''-ил	133	54.7
111	6-метил	4'-фтор	1''-CH <sub>3</sub> -3''CF <sub>3</sub> -пиразол-5''-ил	123	21
112	6-метил	4'-CF <sub>3</sub>	1''-CH <sub>3</sub> -3''CF <sub>3</sub> -пиразол-5''-ил	98	39.5
113	6-метил	4'-CF <sub>3</sub>	3''-CF <sub>3</sub> -фенил	89	79.9
114	5-метил	4'-CF <sub>3</sub>	1''-CH <sub>3</sub> -3''CF <sub>3</sub> -пиразол-5''-ил	147	27.6
115	5-метил	4'-CF <sub>3</sub>	3''-CF <sub>3</sub> -фенил	95	97.6
116	5-метил	3'-CH <sub>3</sub>	1''-CH <sub>3</sub> -3''CF <sub>3</sub> -пиразол-5''-ил	121	74.9
117	5-метил	3'-CH <sub>3</sub>	3''-CF <sub>3</sub> -фенил	71	4.5
118	6-метил	3'-CH <sub>3</sub>	1''-CH <sub>3</sub> -3''CF <sub>3</sub> -пиразол-5''-ил	113	74.9

Продолжение таблицы 10

1	2	3	4	5	6
119	6-метил	3'-CH <sub>3</sub>	3''-CF <sub>3</sub> -фенил	60	73.2
120	5-метил	3'-хлор	1''-CH <sub>3</sub> -3''CF <sub>3</sub> -пиразол-5''-ил	116	35.4
121	5-метил	3'-хлор	3''-CF <sub>3</sub> -фенил	105	52.4
122	6-метил	3'-хлор	1''-CH <sub>3</sub> -3''CF <sub>3</sub> -пиразол-5''-ил	96	27.1
123	5-метил	2',4'-дифтор	3''-CF <sub>3</sub> -фенил	68	40.4
124	5-метил	2',4'-дифтор	2''-хлорпирид-4''-ил	146	58.8
125	6-метил	2',4'-дифтор	1''-CH <sub>3</sub> -3''CF <sub>3</sub> -пиразол-5''-ил	78	56.4
126	6-метил	2',4'-дифтор	3''-CF <sub>3</sub> -фенил	64	65.3
127	6-метил	2',4'-дифтор	2''-хлорпирид-4''-ил	162	31.7
128	5-метил	4'-CF <sub>3</sub>	2''-хлорпирид-4''-ил	99	44.1
129	5,6-диметил	4'-CF <sub>3</sub>	1''-CH <sub>3</sub> -3''CF <sub>3</sub> -пиразол-5''-ил	136	13.2
130	5,6-диметил	4'-CF <sub>3</sub>	3''-CF <sub>3</sub> -фенил	73	65.6

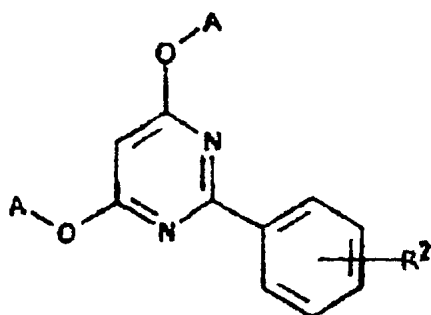
131	5,6-диметил	3'-CF <sub>3</sub>	1"-CH <sub>3</sub> -3"CF <sub>3</sub> -пиразол-5"-ил	132	30.3
132	5,6-диметил	3'-CF <sub>3</sub>	3"-CF <sub>3</sub> -фенил	105	67.5
133	6-метил	4'-CF <sub>3</sub>	1"-CH <sub>3</sub> -3"C <sub>2</sub> F <sub>5</sub> -пиразол-5"-ил	128	41
134	6-метил	4'-CF <sub>3</sub>	2",2"-дифторо-1",3"-бензоди- оксол-4"-ил	86	85
135	6-этил	4'-CF <sub>3</sub>	1"-CH <sub>3</sub> -3"CF <sub>3</sub> -пиразол-5"-ил	75	46
136	6-этил	4'-CF <sub>3</sub>	2"хлорпирид-4"-ил	97	41
137	6-метил	3'-CF <sub>3</sub>	4"-фторфенил	78	92
138	6-этил	4'-CF <sub>3</sub>	3"-CF <sub>3</sub> -фенил	65	38
139	5-метил	3'-CF <sub>3</sub>	4"-фторфенил	109-111	86
140	5-метил	4'-Br	3"-CF <sub>3</sub> -фенил	110	100
141	6-метил	4'-Br	3"-CF <sub>3</sub> -фенил	86-88	89
142	5-метил	4'-(трет- бутил)	1"-CH <sub>3</sub> -3"CF <sub>3</sub> -пиразол-5"-ил	149-151	92
143	6-метил	4'-(трет- бутил)	1"-CH <sub>3</sub> -3"CF <sub>3</sub> -пиразол-5"-ил	119-121	78
144	5-метил	4'-(трет- бутил)	3"-CF <sub>3</sub> -фенил	123-124	91
145	6-метил	4'-(трет- бутил)	3"-CF <sub>3</sub> -фенил	масло	99
146	6-метил	4'-Cl	3"-CF <sub>3</sub> -фенил	68	29
147	5,6-диметил	4'-Cl	1"-CH <sub>3</sub> -3"CF <sub>3</sub> -пиразол-5"-ил	142	49
148	5,6-диметил	4'-Cl	2"хлорпирид-4"-ил	150	36
149	5,6-диметил	4'-Cl	3"-CF <sub>3</sub> -фенил	102	66
150	5-метил		1"-CH <sub>3</sub> -3"CF <sub>3</sub> -пиразол-5"-ил	140-150	75
151	5,6-диметил	4'-F	1"-CH <sub>3</sub> -3"CF <sub>3</sub> -пиразол-5"-ил	117	70
152	5-метил	4'-Cl	1"-CH <sub>3</sub> -3"CF <sub>3</sub> -пиразол-5"-ил	141	58
153	5-метил	4'-Cl	2"хлорпирид-4"-ил	125	31
154	5-метил	4'-Cl	3"-CF <sub>3</sub> -фенил	101	52
155	6-метил	4'-Cl	1"-CH <sub>3</sub> -3"CF <sub>3</sub> -пиразол-5"-ил	99	37
156	6-метил	4'-Cl	2"хлорпирид-4"-ил	151	8
157	5-метил	3',4'-дифтор	2"хлорпирид-4"-ил	146	59
158	6-метил	3',4'-дифтор	1"-CH <sub>3</sub> -3"CF <sub>3</sub> -пиразол-5"-ил	78	56

Продолжение таблицы 10

159	6-метил	3',4'-дифтор	3"-CF <sub>3</sub> -фенил	64	65
160	6-метил	3',4'-дифтор	2"хлорпирид-4"-ил	162	32
161	5-метил	4'-CF <sub>3</sub> O	1"-CH <sub>3</sub> -3"CF <sub>3</sub> -пиразол-5"-ил	117-121	58
162	6-метил	4'-CF <sub>3</sub> O	1"-CH <sub>3</sub> -3"CF <sub>3</sub> -пиразол-5"-ил	102-104	46
163	5-метил	4'-CF <sub>3</sub> O	1"-CH <sub>3</sub> -3"(трет-бутил)-пи- разол-5"-ил	96-98	58
164	6-метил	4'-CF <sub>3</sub> O	1"-CH <sub>3</sub> -3"(трет-бутил)-пи- разол-5"-ил	88-89	78
165	6-метил	4'-CF <sub>3</sub>	1"-CH <sub>3</sub> -3"(трет-бутил)-пи- разол-5"-ил	87-90	83
166	6-метил	4'-CF <sub>3</sub> O	3"-CF <sub>3</sub> -фенил	52	73
167	6-метил	4'-CF <sub>3</sub> O	2"хлорпирид-4"-ил	72	32
168	5-метил	4'-CF <sub>3</sub> O	3"-CF <sub>3</sub> -фенил	83	80
169	5-метил	4'-CF <sub>3</sub> O	2"хлорпирид-4"-ил	82	43

170	5,6-диметил	4'-CF <sub>3</sub> O	3''-CF <sub>3</sub> -фенил	75	66
171	5,6-диметил	4'-CF <sub>3</sub> O	2''хлорпирид-4''-ил	107	54
172	5-метил	3',4'-дифтор	3''-CF <sub>3</sub> -фенил	68	40
173	6-метил	4'-CF <sub>3</sub> O	1''-CH <sub>3</sub> -3''CF <sub>3</sub> -пиразол-5''-ил	116	43
174	5-метил	4'-CF <sub>3</sub> O	1''-CH <sub>3</sub> -3''CF <sub>3</sub> -пиразол-5''-ил	98	67
175	5,6-диметил	4'-CF <sub>3</sub> O	1''-CH <sub>3</sub> -3''CF <sub>3</sub> -пиразол-5''-ил	128	45
176	6-метокси-метил	4'-Cl	2''хлорпирид-4''-ил	89-91	100
177	6-метокси-метил	4'-Cl	1''-CH <sub>3</sub> -3''CF <sub>3</sub> -пиразол-5''-ил	113-115	94
178	6-метокси-метил	4'-Cl	3''-CF <sub>3</sub> -фенил	140-142	92
179	5-метокси	4'-CF <sub>3</sub>	2''хлорпирид-4''-ил	96	92
180	5-метокси	4'-CF <sub>3</sub>	3''-CF <sub>3</sub> -фенил	80	95
181	5-хлор-6-метокси	4'-Cl	1''-CH <sub>3</sub> -3''CF <sub>3</sub> -пиразол-5''-ил	173-176	95
182	5-хлор-6-метокси	4'-Cl	3''-CF <sub>3</sub> -фенил	95-98	100
183	5-метокси	4'-CF <sub>3</sub>	1''-CH <sub>3</sub> -3''CF <sub>3</sub> -пиразол-5''-ил	80	100

Таблица 11

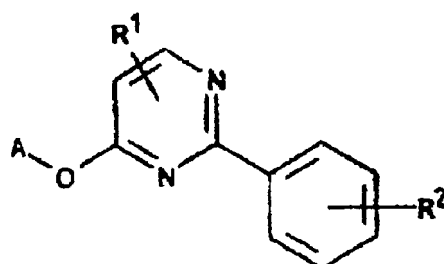


(XVa)

Пример №	R <sup>2</sup>	A	Т. пл. (°C)	выход (%)
185	4'-трифторметил	1''-CH <sub>3</sub> -3''CF <sub>3</sub> -пиразол-5''-ил	168	86
186	4'-трифторметил	1''-CH <sub>3</sub> -3''CF <sub>3</sub> -пиразол-5''-ил	92	88

187	4'-хлор	1''-CH <sub>3</sub> -3''CF <sub>3</sub> -пиразол-5''-ил	156	93
-----	---------	---	-----	----

Таблица 12



(I)

При- мер №	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	A	Т. пл. (°C)	выход (%)
190	6-метокси	4'-CF <sub>3</sub>	1''-CH <sub>3</sub> -3''CF <sub>3</sub> -пиразол-5''-ил	130	64
191	6-метокси	4'-CF <sub>3</sub>	3''-CF <sub>3</sub> -фенил	94	94
192	6-метилтио	4'-CF <sub>3</sub>	1''-CH <sub>3</sub> -3''CF <sub>3</sub> -пиразол-5''-ил	127	55
193	6-метилтио	4'-CF <sub>3</sub>	2''хлорпирид-4''-ил	106	41
194	6-диметиламино	4'-CF <sub>3</sub>	1''-CH <sub>3</sub> -3''CF <sub>3</sub> -пиразол-5''-ил	148	90
195	6-этиламино	4'-CF <sub>3</sub>	1''-CH <sub>3</sub> -3''CF <sub>3</sub> -пиразол-5''-ил	102	23
196	6-метокси	4'-Cl	1''-CH <sub>3</sub> -3''CF <sub>3</sub> -пиразол-5''-ил	144	80
197	6-метоксиамино	4'-Cl	1''-CH <sub>3</sub> -3''CF <sub>3</sub> -пиразол-5''-ил	178	16
198	6-диметиламино	4'-Cl	1''-CH <sub>3</sub> -3''CF <sub>3</sub> -пиразол-5''-ил	143	13
199	6-амино	4'-Cl	1''-CH <sub>3</sub> -3''CF <sub>3</sub> -пиразол-5''-ил	149	80
200	6-метиламино	4'-Cl	1''-CH <sub>3</sub> -3''CF <sub>3</sub> -пиразол-5''-ил	114	97
201	6-бром	4'-CF <sub>3</sub>	1''-CH <sub>3</sub> -3''CF <sub>3</sub> -пиразол-5''-ил	110	57
202	6-хлор	4'-Cl	1''-CH <sub>3</sub> -3''CF <sub>3</sub> -пиразол-5''-ил	122	26
203	6-хлор	4'-CF <sub>3</sub>	1''-CH <sub>3</sub> -3''CF <sub>3</sub> -пиразол-5''-ил	113	69

Таблица 13

При- мер №	Доза	Спо- соб при- мене- ния	таблица 13																									
			T R A W	H O R W	G O S H I	H E L A N	O R Y S A	G L X M A	B E A A X	Z E A M Y	A L O M F A	A V E H C V G	S E T V I	G A L A P E	S T E M E	C H E A L	V E R P E	L A M P U	V I O P R	S I D S P	A M B A R	A B U T H	I P O P U	S I N A L	A M A R E			
13	100 0	pre post	* *	* *	* *	* *	0 2	0 5	4 8	2 4	* *	2 2	4 5	* *	* *	* *	* *	* *	* *	* *	* *	* *	* *	* *	5 8	* *		
14	100 0	pre post	* *	* *	* *	* *	3 4	4 6	9 9	9 6	* *	6 6	8 7	* *	* *	* *	* *	* *	* *	* *	* *	* *	* *	* *	8 8	* *		
15	100 0	pre post	* *	* *	* *	* *	0 2	2 6	8 9	2 5	* *	2 2	5 7	* *	* *	* *	* *	* *	* *	* *	* *	* *	* *	* *	6 6	* *		
16	100 0	pre post	* *	* *	* *	* *	0 0	0 2	2 7	0 4	* *	0 2	2 2	* *	* *	* *	* *	* *	* *	* *	* *	* *	* *	* *	2 5	* *		
24	300	pre post	1 0	0 0	0 1	0 1	* *	* *	* *	0 1	0 0	* *	* *	0 0	0 0	0 0	* *	0 0	* 0	* 0	0 0	* *	* *	* 0	* *	* *		
25	300	pre post	0 0	0 0	0 1	0 2	* *	* *	* *	0 2	0 0	* *	* *	1 0	0 0	0 0	* *	0 1	* *	0 1	* *	* *	* *	0 1	* *	* *		
26	300	pre	1	0	*	1	*	*	*	1	*	*	*	0	2	0	0	0	*	*	*	*	0	0	*	0		



		post	1	2	*	3	*	*	*	2	*	*	*	0	2	4	0	4	*	*	*	*	4	1	*	5
27	300	pre	0	0	*	0	*	*	*	0	*	*	*	0	0	0	0	0	*	*	*	*	0	0	*	0
		post	2	2	*	3	*	*	*	3	*	*	*	1	1	2	0	3	*	*	*	*	3	2	*	4
28	300	pre	0	3	0	0	*	*	*	3	5	*	6	9	2	7	*	9	8	8	4	4	4	2	*	9
		post	3	3	4	5	*	*	*	4	5	*	4	6	5	4	*	6	*	6	6	5	4	4	*	6
29	300	pre	0	1	*	0	*	*	*	0	*	*	*	8	0	7	8	8	*	*	*	*	0	0	*	9
		post	4	3	*	4	*	*	*	3	*	*	*	3	3	5	6	8	*	*	*	*	5	4	*	7
30	300	pre	4	6	3	3	*	*	*	4	9	*	8	9	6	9	*	9	9	8	8	8	6	6	*	9
		post	4	5	6	6	*	*	*	4	6	*	6	7	5	6	*	6	*	7	8	5	6	6	*	5
31	300	pre	1	4	2	0	*	3	*	1	8	*	5	9	7	9	*	9	9	8	*	*	8	5	*	9
		post	3	5	8	5	*	5	*	8	7	*	4	7	6	7	*	9	7	8	*	*	8	6	*	7
32	300	pre	1	0	0	0	*	0	*	0	3	*	2	8	1	6	*	8	3	8	*	*	3	1	*	9
		post	2	2	5	4	*	3	*	3	3	*	2	4	4	5	*	9	5	7	*	*	4	5	*	5
33	300	pre	2	0	0	0	*	2	*	0	0	*	0	0	0	0	*	0	0	0	*	*	0	5	*	0
		post	0	0	0	0	*	0	*	0	0	*	0	2	0	0	*	0	0	0	*	*	0	1	*	0
34	300	pre	1	3	3	*	3	1	*	2	7	*	8	8	2	8	*	9	8	9	*	8	3	5	*	8
		post	2	2	5	*	2	7	*	2	4	*	4	5	6	6	*	9	6	6	*	5	6	6	*	7
39	300	pre	1	3	0	*	*	0	*	0	5	*	4	9	2	9	*	9	8	9	*	3	3	3	*	9
		post	1	2	4	*	*	3	*	3	3	*	2	7	5	5	*	9	5	7	*	3	3	5	*	5
109	300	pre	0	0	0	0	*	*	*	0	0	*	0	0	0	0	6	0	0	0	0	*	0	0	*	6
		post	0	0	2	0	*	*	*	0	0	*	0	1	0	0	0	7	0	0	1	*	0	2	*	1
110	300	pre	3	4	2	1	*	*	*	2	8	*	6	9	2	9	*	9	9	9	9	*	5	3	*	9
		post	4	5	6	6	*	*	*	4	7	*	7	6	8	7	*	9	7	8	6	*	6	4	*	6
111	300	pre	1	3	0	0	*	*	*	0	8	*	*	9	5	9	8	9	8	*	6	*	5	3	*	9
		post	3	3	5	5	*	*	*	4	4	*	*	6	6	8	9	9	8	*	6	*	6	4	*	6
112	300	pre	3	5	6	3	*	5	*	4	9	*	8	9	8	9	*	9	9	8	*	*	8	9	*	9
		post	4	5	8	8	*	8	*	5	7	*	6	8	7	8	*	9	8	9	*	*	8	7	*	8
113	300	pre	3	6	6	2	*	3	*	3	9	*	8	9	8	9	*	9	8	8	*	*	9	9	*	9
		post	4	5	8	8	*	8	*	5	6	*	7	9	7	8	*	9	8	8	*	*	8	8	*	7
114	300	pre	4	5	8	3	*	4	*	3	8	*	8	9	8	9	*	9	8	8	*	*	9	9	*	9
		post	4	5	8	6	*	6	*	6	8	*	5	8	7	8	*	9	8	8	*	*	8	8	*	7
115	300	pre	4	7	8	3	*	5	*	4	8	*	8	9	8	9	*	9	9	8	*	*	9	9	*	9
		post	4	6	9	8	*	8	*	6	7	*	6	8	7	8	*	8	8	8	*	*	8	8	*	8

Продолжение таблицы 13

116	300	pre	0	3	0	0	*	0	*	0	6	*	4	9	0	6	*	9	8	7	*	*	2	4	*	8
		post	2	3	4	4	*	5	*	3	3	*	2	8	3	4	*	9	7	5	*	*	4	5	*	5
117	300	pre	0	2	0	0	*	0	*	2	7	*	5	9	1	5	*	9	6	8	*	*	4	4	*	9
		post	3	3	4	4	*	4	*	4	4	*	3	4	4	4	*	9	5	7	*	*	4	5	*	7
118	300	pre	0	0	0	0	*	0	*	0	3	*	4	7	1	2	*	8	3	7	*	*	1	2	*	9
		post	0	2	4	4	*	3	*	2	3	*	3	4	3	3	*	9	4	5	*	*	2	4	*	5
119	300	pre	0	0	0	0	*	0	*	0	0	*	1	0	0	0	*	0	0	2	*	*	0	0	*	0
		post	0	2	0	2	*	1	*	1	1	*	0	1	2	2	*	3	1	5	*	*	1	3	*	4
120	300	pre	1	3	2	0	*	0	*	2	8	*	6	9	6	9	*	8	8	8	*	*	5	5	*	8
		post	2	4	5	4	*	5	*	3	5	*	4	5	6	4	*	9	8	7	*	*	5	4	*	5
121	300	pre	2	3	2	0	*	1	*	3	8	*	7	9	3	8	*	9	7	8	*	*	5	4	*	9
		post	3	4	8	4	*	5	*	5	5	*	6	7	6	5	*	9	7	8	*	*	4	5	*	6
122	300	pre	*	*	*	*	*	*	*	*	*	*	*	*	*	*	*	*	*	*	*	*	*	*	*	*
		post	*	*	*	*	*	*	*	*	*	*	*	*	*	*	*	*	*	*	*	*	*	*	*	*
123	300	pre	0	0	0	0	*	0	*	0	0	*	0	0	0	0	*	2	2	4	*	*	0	0	*	4
		post	1	1	2	3	*	2	*	1	1	*	2	2	3	4	*	5	3	5	*	*	2	6	*	4
124	300	pre	1	3	2	1	*	5	*	5	5	*	6	8	3	9	*	9	8	9	*	*	7	9	*	9
		post	4	4	6	5	*	5	*	5	5	*	6	7	4	5	*	9	6	8	*	*	6	7	*	6
125	300	pre	3	4	3	2	*	3	*	5	8	*	7	9	4	9	*	9	9	9	*	*	9	7	*	9

		post	4	5	5	5	*	6	*	5	5	*	6	7	5	6	*	9	6	8	*	*	5	7	*	6
126	300	pre	0	0	0	0	*	0	*	0	3	*	0	9	1	7	*	8	4	8	*	*	2	3	*	9
		post	2	2	5	4	*	3	*	3	3	*	3	3	4	4	*	9	5	8	*	*	4	6	*	5
127	300	pre	0	0	1	0	*	0	*	2	2	*	0	8	0	7	*	7	3	8	*	*	2	4	*	8
		post	0	1	4	3	*	2	*	2	3	*	2	4	3	5	*	6	4	8	*	*	4	6	*	6
128	300	pre	4	5	7	2	*	3	*	5	8	*	7	9	5	9	*	9	9	9	*	*	9	9	*	9
		post	5	5	6	5	*	5	*	6	6	*	7	7	6	6	*	9	6	8	*	*	6	8	*	7
129	300	pre	3	3	5	4	*	3	*	3	8	*	6	9	5	9	*	9	9	9	*	*	9	9	*	9
		post	2	4	7	5	*	5	*	3	5	*	5	6	5	5	*	9	6	8	*	*	6	9	*	6
130	300	pre	2	5	3	2	*	3	*	3	7	*	6	9	4	9	*	9	6	9	*	*	7	6	*	8
		post	2	4	6	5	*	5	*	4	5	*	5	7	5	6	*	8	6	8	*	*	5	9	*	6
131	300	pre	0	0	2	2	*	0	*	2	1	*	0	8	0	4	*	7	0	8	*	*	0	5	*	8
		post	1	1	3	4	*	2	*	1	2	*	2	2	4	4	*	7	4	7	*	*	4	5	*	4
132	300	pre	0	0	0	0	*	3	*	0	0	*	0	3	0	0	*	0	0	3	*	*	0	3	*	5
		post	0	1	3	2	*	2	*	1	0	*	1	2	3	3	*	4	3	5	*	*	2	5	*	5
133	400	pre	5	5	*	*	5	7	*	4	8	*	*	9	7	*	*	9	9	*	*	*	9	9	*	**
		post	3	4	*	*	5	6	*	4	8	*	*	8	9	*	*	8	8	*	*	*	9	9	*	*
134	400	pre	3	4	*	*	3	4	*	4	8	*	*	9	3	*	*	9	7	*	*	*	6	4	*	*
		post	2	3	*	*	2	6	*	3	4	*	*	8	7	*	*	9	8	*	*	*	9	9	*	*
135	300	pre	6	7	*	*	5	4	*	3	8	*	8	9	3	8	*	9	8	*	*	*	8	9	*	*
		post	4	6	*	*	4	6	*	3	7	*	6	7	6	7	8	9	9	*	*	*	7	9	*	*
136	300	pre	6	8	*	*	5	4	*	4	8	*	8	8	1	9	*	9	8	*	*	*	6	9	*	*
		post	5	6	*	*	5	6	*	4	6	*	7	7	6	8	6	9	7	*	*	*	8	8	*	*
137	300	pre	0	0	*	*	0	0	*	0	0	*	0	0	0	0	5	0	0	*	*	*	0	0	*	*
		post	0	1	*	*	1	1	*	0	1	*	0	0	1	1	*	2	2	*	*	*	1	2	*	*
138	300	pre	6	7	*	*	4	4	*	3	8	*	8	9	4	4	*	9	9	*	*	*	7	9	*	*
		post	4	7	*	*	4	7	*	3	6	*	6	7	5	5	7	9	8	*	*	*	7	8	*	*
139	300	pre	0	0	*	*	0	0	*	0	0	*	0	0	0	0	*	0	0	*	*	*	0	0	*	*
		post	1	2	*	*	1	2	*	0	1	*	1	1	1	1	4	3	2	*	*	*	2	4	*	*
140	300	pre	4	5	5	*	3	2	*	2	8	*	8	8	4	9	*	9	9	9	*	8	4	6	*	8
		post	3	4	5	*	5	5	*	3	7	*	4	8	7	6	*	9	8	6	*	6	8	9	*	9

Продолжение таблицы 13

141	300	pre	1	4	2	*	2	1	*	2	7	*	8	9	1	9	*	9	8	8	*	5	2	4	*	5
		post	2	3	9	*	2	4	*	3	4	*	3	5	5	5	*	8	7	6	*	6	5	9	*	9
142	300	pre	0	0	1	*	0	1	*	0	0	*	1	5	1	4	*	5	1	7	*	0	0	1	*	0
		post	0	1	5	*	0	4	*	2	0	*	1	1	2	3	*	5	4	6	*	5	3	5	*	5
143	300	pre	0	1	4	*	0	2	*	2	6	*	5	8	3	9	*	9	8	9	*	8	4	5	*	8
		post	1	2	8	*	2	3	*	3	1	*	2	3	6	5	*	8	5	6	*	7	6	7	*	8
144	300	pre	0	0	0	*	0	2	*	0	0	*	0	3	0	*	*	4	4	4	*	0	0	4	*	3
		post	1	1	6	*	0	3	*	2	0	*	1	1	4	*	*	6	3	5	*	5	3	4	*	6
145	300	pre	0	0	2	*	0	1	*	1	2	*	2	5	0	3	*	6	3	6	*	2	0	2	*	5
		post	1	2	8	*	0	4	*	3	1	*	2	2	5	5	*	7	5	6	*	6	5	5	*	8
146	300	pre	0	0	0	0	*	1	*	0	7	*	3	8	0	8	*	9	4	8	*	4	3	1	*	9
		post	0	0	4	5	*	1	*	4	5	*	4	9	4	6	*	7	4	7	*	4	3	4	*	4
147	300	pre	0	1	0	0	*	1	*	0	5	*	3	7	0	6	*	9	3	7	*	3	3	3	*	9
		post	0	0	4	5	*	4	*	1	4	*	3	5	4	5	*	6	4	5	*	4	4	5	*	4
148	300	pre	0	0	0	0	*	0	*	0	1	*	0	2	0	0	*	8	0	8	*	0	1	0	*	9
		post	0	0	3	4	*	2	*	2	1	*	1	3	4	3	*	4	3	6	*	3	2	4	*	4
149	300	pre	0	0	3	0	*	0	*	0	0	*	0	0	0	0	*	2	1	5	*	0	0	0	*	8
		post	0	0	0	4	*	2	*	2	0	*	0	2	4	3	*	5	4	4	*	4	1	4	*	4
150	300	pre	2	4	4	2	*	3	*	4	8	*	7	9	2	9	*	9	9	9	*	7	4	6	*	9
		post	2	4	6	5	*	4	*	4	6	*	6	8	5	5	*	7	7	7	*	6	6	6	*	7

151	300	pre	0	0	0	2	*	0	*	0	4	*	0	0	0	6	*	8	2	9	*	4	1	1	*	9
		post	0	1	4	5	*	3	*	3	2	*	2	4	4	5	*	6	4	7	*	4	2	4	*	6
152	300	pre	3	4	5	4	*	3	*	4	8	*	7	7	4	9	*	9	8	9	*	8	7	9	*	8
		post	2	4	6	6	*	5	*	5	8	*	6	9	7	7	*	7	7	7	*	7	6	5	*	7
153	300	pre	1	3	3	0	*	1	*	3	8	*	7	7	1	9	*	9	8	9	*	4	5	5	*	9
		post	4	4	5	6	*	4	*	4	6	*	5	8	5	6	*	8	5	6	*	4	5	5	*	5
154	300	pre	4	5	4	2	*	2	*	4	8	*	8	9	3	9	*	9	9	9	*	8	7	7	*	9
		post	5	6	*	*	*	5	*	7	*	*	*	*	*	*	*	*	*	*	*	*	*	*	*	*
155	300	pre	3	4	4	1	*	1	*	3	8	*	8	9	4	9	*	9	8	9	*	8	8	6	*	9
		post	1	5	6	6	*	5	*	6	6	*	7	8	6	7	*	7	5	7	*	5	6	5	*	5
156	300	pre	2	2	0	0	*	*	*	0	6	*	4	9	0	8	*	9	4	9	*	4	4	3	*	9
		post	0	1	4	5	*	4	*	4	5	*	4	9	5	7	*	7	4	6	*	4	4	4	*	5
157	300	pre	1	3	2	1	*	5	*	5	5	*	6	8	3	9	*	9	8	9	*	7	7	9	*	9
		post	4	4	6	5	*	5	*	5	5	*	6	7	4	5	*	9	6	8	*	5	6	7	*	6
158	300	pre	3	4	3	2	*	3	*	5	8	*	7	9	4	9	*	9	9	9	*	7	9	7	*	9
		post	4	5	5	5	*	6	*	5	5	*	6	7	5	6	*	9	6	8	*	5	5	7	*	6
159	300	pre	0	0	0	0	*	0	*	0	3	*	0	9	1	7	*	8	4	8	*	4	2	3	*	9
		post	2	2	5	4	*	3	*	3	3	*	3	3	4	4	*	9	5	8	*	4	4	6	*	5
160	300	pre	0	0	1	0	*	0	*	2	2	*	0	8	0	7	*	7	3	8	*	2	2	4	*	2
		post	0	1	4	3	*	2	*	2	3	*	2	4	3	5	*	6	4	2	*	5	4	6	*	6
161	300	pre	0	0	0	*	0	1	*	0	0	*	0	0	0	0	*	1	0	0	*	0	0	0	*	0
		post	0	1	3	*	0	2	*	0	0	*	0	1	0	1	*	1	1	5	*	1	1	3	*	2
162	300	pre	0	0	0	*	0	0	*	0	0	*	0	0	0	0	*	0	0	0	*	0	0	0	*	0
		post	0	0	3	*	0	2	*	0	0	*	0	0	1	1	*	1	5	5	*	0	0	2	*	0
163	300	pre	0	0	0	*	0	0	*	0	0	*	0	3	1	0	*	3	0	2	*	0	0	2	*	0
		post	1	1	5	*	0	4	*	2	0	*	0	2	2	3	*	6	4	5	*	3	2	4	*	5
164	300	pre	0	0	0	*	2	0	*	0	0	*	0	5	0	6	*	4	1	7	*	1	0	1	*	3
		post	0	1	6	*	0	4	*	3	1	*	1	1	2	4	*	6	5	6	*	3	3	5	*	8
165	300	pre	0	3	5	*	2	2	*	2	8	*	8	9	4	9	*	9	9	9	*	8	4	6	*	8
		post	2	3	9	*	0	6	*	3	3	*	2	5	8	6	*	9	7	6	*	6	7	9	*	8

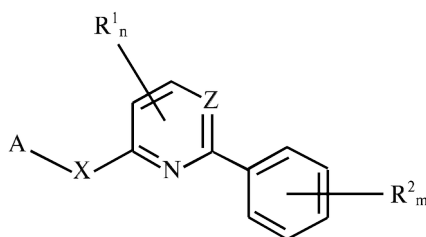
Продолжение таблицы 13

166	300	pre	0	1	4	*	2	1	*	1	5	*	7	5	2	5	*	8	7	8	*	6	2	4	*	8
		post	1	2	5	*	2	7	*	2	3	*	3	4	6	5	*	8	5	7	*	4	6	5	*	8
167	300	pre	2	3	5	*	4	2	*	3	8	*	8	9	2	8	*	9	8	8	*	8	4	9	*	8
		post	2	3	6	*	5	6	*	3	6	*	6	8	5	7	*	8	6	6	*	4	6	5	*	8
168	300	pre	2	3	4	*	0	3	*	1	7	*	5	8	1	5	*	9	6	9	*	5	4	3	*	9
		post	2	3	8	*	2	7	*	2	4	*	4	5	5	5	*	9	8	8	*	6	5	8	*	7
169	300	pre	3	3	5	*	5	2	*	3	8	*	6	9	1	9	*	9	8	9	*	5	4	6	*	9
		post	3	3	9	*	5	6	*	3	5	*	5	6	5	4	*	8	7	7	*	5	6	6	*	7
170	300	pre	0	0	0	*	0	0	*	0	0	*	0	2	0	0	*	0	1	5	*	0	0	2	*	6
		post	0	1	4	*	0	5	*	1	0	*	0	0	2	1	*	3	3	5	*	3	2	4	*	5
171	300	pre	0	0	1	*	0	0	*	0	3	*	2	6	0	0	*	3	2	8	*	0	0	1	*	7
		post	1	2	4	*	0	4	*	1	2	*	2	3	4	2	*	5	5	7	*	4	4	4	*	5
172	300	pre	0	0	0	*	*	0	*	0	0	*	0	0	0	0	*	2	2	4	*	1	0	0	*	4
		post	1	1	2	*	*	2	*	1	1	*	2	2	3	4	*	5	3	5	*	2	2	6	*	4
173	300	pre	1	3	6	*	*	2	*	2	8	*	8	9	6	8	*	9	9	9	*	8	5	8	*	8
		post	2	3	6	*	*	7	*	3	6	*	6	7	6	7	*	9	6	7	*	6	6	8	*	8
174	300	pre	3	3	5	*	0	3	*	2	8	*	5	8	4	8	*	9	8	9	*	6	4	6	*	9
		post	2	3	6	*	4	7	*	3	5	*	5	5	5	4	*	9	7	8	*	6	5	8	*	7
175	300	pre	0	0	2	*	0	1	*	0	4	*	1	7	0	2	*	7	4	8	*	1	0	0	*	8
		post	1	1	6	*	1	7	*	1	5	*	5	5	5	4	*	9	7	8	*	6	5	8	*	7

176	400	pre	3	2	*	*	2	3	*	2	7	*	*	8	3	*	*	9	8	*	*	*	2	8	*	*
		post	3	4	*	*	2	2	*	2	4	*	*	6	8	*	*	8	7	*	*	*	8	9	*	*
177	400	pre	7	5	*	*	5	4	*	4	8	*	*	9	5	*	*	9	*	*	*	*	6	9	*	*
		post	3	5	*	*	4	6	*	4	6	*	*	7	7	*	*	9	*	*	*	*	7	6	*	*
178	400	pre	2	2	*	*	2	1	*	1	6	*	*	8	4	*	*	8	*	*	*	*	2	3	*	*
		post	1	3	*	*	4	4	*	3	3	*	*	4	5	*	*	9	*	*	*	*	5	4	*	*
188	400	pre	4	5	*	*	6	4	*	5	9	*	*	9	8	*	*	9	9	*	*	*	9	9	*	*
		post	3	4	*	*	3	5	*	3	7	*	*	8	9	*	*	9	8	*	*	*	8	9	*	*
190	400	pre	5	6	*	*	5	5	*	5	9	*	*	9	9	*	*	9	9	*	*	*	9	9	*	*
		post	4	5	*	*	4	7	*	3	8	*	*	9	9	*	*	9	8	*	*	*	9	9	*	*
191	400	pre	4	4	*	*	5	5	*	4	9	*	*	9	8	*	*	9	9	*	*	*	9	9	*	*
		post	4	4	*	*	4	7	*	3	8	*	*	8	9	*	*	9	8	*	*	*	9	9	*	*
192	400	pre	4	4	*	*	3	5	*	4	8	*	*	9	7	*	*	9	8	*	*	*	9	9	*	*
		post	3	4	*	*	3	6	*	2	7	*	*	8	9	*	*	9	8	*	*	*	9	9	*	*
193	400	pre	4	5	*	*	3	4	*	4	8	*	*	9	7	*	*	9	8	*	*	*	8	9	*	*
		post	4	4	*	*	4	5	*	3	8	*	*	9	8	*	*	8	7	*	*	*	8	9	*	*

### Формула изобретения

1. 2,6-дизамещенные пиридины или 2,4-дизамещенные пиримидины общей формулы 1



где X - атом кислорода;

Z - NH, CH,

A - фенил, замещенный атомом фтора или трифторметильной группой, пиридил, замещенный атомом хлора, пиазолил, замещенный трифторметильной и метильной группой или метильной и трет-бутильной группой, дифторбензодиоксолил;

R<sup>1</sup>, каждый независимо, является группой, выбранной из атома водорода, атома галогена, низшего алкила, низшего алкилтио, низшего алкоксила,

R<sup>2</sup>, каждый независимо, является группой, выбранной из атома водорода, трифторметила, низшего алкила, трифторметоксила, атома галогена,

m = 1 - 2, n = 0 - 2;

при условии, что, если A представляет 1-метил-3-трифторметилпиазол-5-ильную группу, n = 0, X - атом кислорода, Z - группа CH, тогда R<sup>2</sup> не является водородом, 3-трифторметилом или 2,4-дихлором или 2,4-диметилом.

2. Соединение по п. 1, выбранное из группы, содержащей соединения:

2-(1'-метил-3'-трифторметилпиазол-5'-илокси)-6-(4''-трифторметилфенил) пиридин,

2-(2',4'-дифторфенил)-6-метил-4-(1''-метил-3''-трифторметилпиазол-5''-илокси)пиримидин,

2-(2',4'-дифторфенил)-6-метил-4-(3''-трифторметилфенокси)пиримидин,

2-(2'-хлорпиазид-4'-илокси)-(4''-трифторметилфенил)пиридин,

2-(2'-хлорпиазид-4'-илокси)-6-(3''-трифторметилфенил)пиридин,

2-(3'-хлорфенил)-5-метил-4-(1''-метил-3''-трифторметилпиазол-5''-илокси) пиримидин,

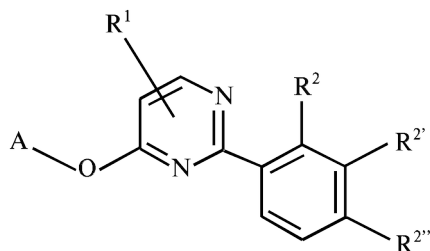
2-(3'-хлорфенил)-5-метил-4-(3''-трифторметилфенокси)пиримидин,

2-(4'-фторфенил)-6-метил-4-(3''-трифторметилфенокси)пиримидин,

[illegible]

6-метокси-2-(4'-трифторметилфенил)-4-(1''-метил-3''-трифторметилпиразол-5''-илокси)пири-  
 имидин,  
 6-метокси-2-(4'-трифторметилфенил)-4-(2'-хлорпирид-4'-илокси)пири-  
 имидин,  
 5-метокси-2-(4'-трифторметилфенил)-4-(3''-трифторметилфенокси)пири-  
 имидин,  
 5-метокси-2-(4'-трифторметилфенил)-4-(1''-метил-3''-трифторметилпиразол-5''-илокси)пи-  
 имидин,  
 5-метокси-2-(4'-трифторметилфенил)-4-(2'-хлорпирид-4'-илокси)пири-  
 имидин.

### 3. Замещенные 2-фенил-6-оксипири- имидины формулы 1А



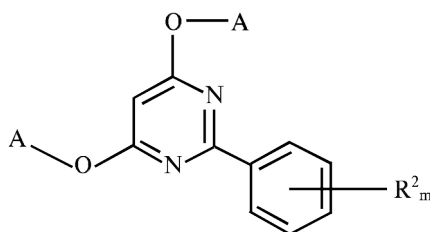
где А представляет 3-трифторметилфенил, 2-хлорпирид-4-ил или 1-метил-3-три-  
 фторметилпиразол-5-ил,

R¹ имеет значения, указанные в п. 1;

R², R²' и R²'', независимо, представляют атом водорода, атом фтора, хлора или брома, один  
 или два из них также представляют трифторметил, трифторметокси, R²'', кроме того,  
 может быть C₁-C₄-алкильной группой, в частности, трет-бутильной, за исключением соеди-  
 нений, где А - 1-метил-3-трифторметилпиразол- 5-ил, R¹ - водород, R², R²'' - водород, R²' -  
 трифторметил;

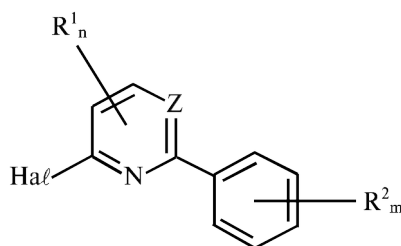
R² - водород, R²' = R²'' - хлор или метил; R², R²', R²'' - водород.

### 4. Замещенные 2-фенил-4,6-диоксипири- имидины общей формулы 15



где А, R² и m определены в п.1.

5. Способ получения 2,6-дизамещенных пиридинов или 2,4-дизамещенных пири-  
 мидинов общей формулы 1 по п. 1, о т л и ч а ю щ и й с я тем, что соединение общей  
 формулы 3



взаимодействует с соединением общей формулы 4

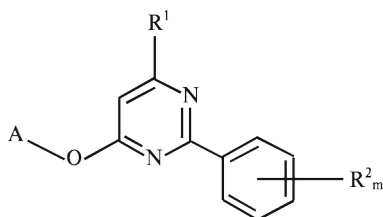
**А - ХМ**

где Z, A, R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup>, m, n и X определены в п. 1;

Hal представляет атом галогена;

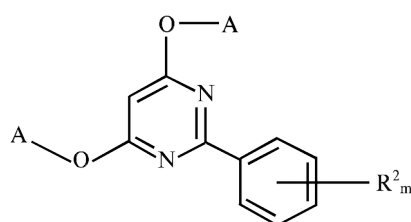
M представляет атом металла.

#### 6. Способ получения 2,4-дизамещенных пиримидинов общей формулы 1



где R<sup>1</sup> означает низший алкоксил, низший алкилтио;

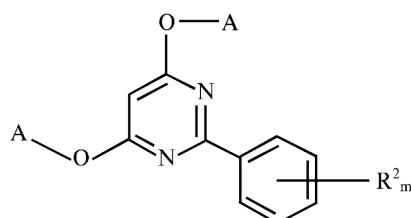
A, R<sup>2</sup>, m имеют значения, указанные в п.1 формулы, о т л и ч а ю щ и й с я тем, что соединение общей формулы 15



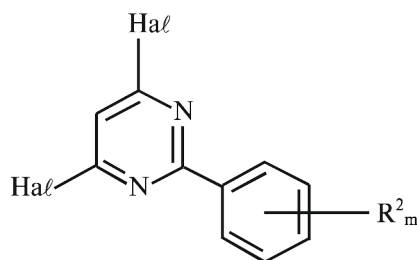
где A, R<sup>2</sup> и m указаны выше,

подвергают взаимодействию с соединением общей формулы R<sup>1</sup> - H или его солью с металлом, где R<sup>1</sup> указан выше.

#### 7. Способ получения замещенных 2-фенил-4,6-диоксипиримидинов формулы 15



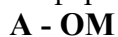
где A, R<sup>2</sup> и m указаны в п. 1, о т л и ч а ю щ и й с я тем, что соединение формулы



где R<sup>2</sup> и m указаны выше,

Hal - атом галогена,

подвергают взаимодействию с соединением формулы



где A имеет значения, указанные выше, и M - атом металла.

8. Гербицидная композиция, о т л и ч а ю щ а я с я тем, что содержит эффективное количество соединения по пп.1-3 и носитель и/или поверхностно-активный агент.

9. Способ борьбы с ростом нежелательной растительности на локусе, отличающийся тем, что включает обработку этого локуса эффективным количеством соединения по пп. 1-3.

Составитель описания  
Ответственный за выпуск

Суртаева Э.Р.  
Арипов С.К.

---

Кыргызпатент, 720021, г. Бишкек, ул. Московская, 62, тел. (312) 68 08 19, 68 16 41, факс (312) 68 17 03