

(19) **KG** (11) **335** (13) **C1**

ГОСУДАРСТВЕННОЕ АГЕНТСТВО
ИНТЕЛЛЕКТУАЛЬНОЙ СОБСТВЕННОСТИ
ПРИ ПРАВИТЕЛЬСТВЕ КЫРГЫЗСКОЙ РЕСПУБЛИКИ (КЫРГЫЗПАТЕНТ)

(51)⁶ C07D 213/62, 239/32; A01N 57/10

(12) ОПИСАНИЕ ИЗОБРЕТЕНИЯ

к предварительному патенту Кыргызской Республики

(21) 960320.1

(22) 23.01.1996

(31) 95101057.8

(32) 26.01.1995

(33) EP

(46) 01.10.1999, Бюл. №3, 1999

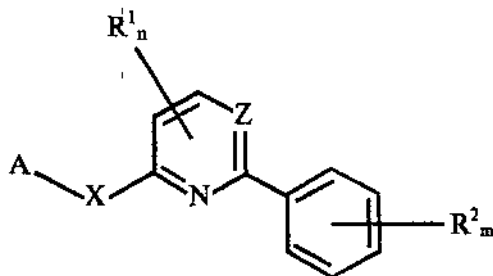
(71)(73) Американ Цианамид Компани (US)

(72) Аксель Клееман, Хельмут Зигфрид Балы рушат, Текла Хюльсен Томас Манер, Штефан Шайблих (DC)

(56) Патент US № 4493726, кл. A01N 57/10, 43/48, 1985

(54) **Дизамещенные азотсодержащие шестичленные гетероциклические соединения, обладающие гербицидной активностью и способ их получения гербицидная композиция и способ борьбы с нежелательной растительностью, промежуточные 2,4,6-тризамещенные пиримидины и способ их получения**

(57) Изобретение относится к области сельского хозяйства, а именно к области производства и применения гербицидов. Задачей изобретения является расширение арсенала средств борьбы с нежелательной растительностью, которая решается предложенными новыми дизамещенными азотсодержащими шестичленными гетероциклическими соединениями общей формулы 1:



где А представляет собой необязательно замещенные арильные группы, или 5- либо 6-членные, содержащие азот гетероароматические группы, или дифторбензодиоксилильные группы; m представляет собой целое число от 0 до 5; n представляет целое число от 0 до 2; R¹ (или каждый R¹) независимо являются атомами водорода, атомами галогена, необязательно замещенными алкил, алкенил, алкинил, алкокси, алкоксиалкил,

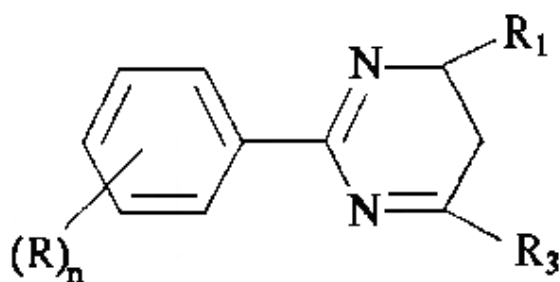
диалкоксиалкил, алкоксиалкокси, алкилнитро, amino, алкиламино, диалкиламино, алкоксиамино или формамидино группами; R^2 (или каждый R^2) независимо является атомами водорода, атомами галогена, необязательно замещенными алкил, алкенил, алкинил, алкокси, галоидалкил, галоидалкокси, алкокси, алкоксиалкокси, алкилтио группами или нитро, циано, SF_5 или алкилсульфонильными либо алкилсульфинильными группами; X представляет собой атом серы или кислорода; и Z представляет собой атом азота или CN группу; при условии, что если A представляет собой 1-метил-3-трифторметил-пиразол-5-ильную группу, n равно 0, X является атомом кислорода, а Z - группой CN, тогда R_m^2 не представляет собой водород или 3-трифторметил или 2,4-дихлоро или 2,4-диметил. Предложены также способ получения, промежуточные продукты для их синтеза, гербицидная композиция на их основе и способ борьбы с нежелательной растительностью путем нанесения гербицидной композиции, содержащей соединение 1 на locus. 8 с. и 2 з. п. ф-лы, 13 табл., 205 пр.

Изобретение относится к области сельского хозяйства, а именно к области производства и использования гербицидов.

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

Например, 2-арилпиримидины и 2-пиримидинил-6-арилпириды описаны в качестве фунгицидов (DE 40 29 654 и JO 2131-480, соответственно). В EP 263,958 рассмотрены гербицидные свойства 2,6-дифенилпириды, а близкие по структуре 2,4-дифенилпиримидины, которые, как утверждается, также являются гербицидами, описаны в EP 354,766 и в EP 425,547. Еще одним примером являются 2,6-дифеноксипиримидины, которые описываются в EP 572,093 в качестве гербицидов. В DE 29 35 578 описано, что 4-фенокси-2-пиразол-1-илпиримидины проявляют фунгицидную активность. В работе Huelsen (Diplomarbeit, Konstanz, 1993) описаны четыре различных 2-(1-метил-3-трифторметилпиразол-5-илокси)-6-фенилпиридина, но их биологическая активность не раскрывается.

Наиболее близким аналогом являются фенилпиримидины, описанные в патенте US 4493726, опубл. 15 января 1985 г., имеющие следующую общую структурную формулу:



где R_1 и R_3 обозначают хлор, бром, фтор, R обозначает водород, метил, хлор, бром, фтор, метокси, гидроксид, трифторметил, этил, амино, ацетамид, карбоксид, карбоксиметокси или ацетамидосульфонил, n равно 1 или 2.

В данном патенте описаны гербицидные композиции с указанными фенилпиримидинами, а также описан способ борьбы с нежелательной растительностью с использованием этих композиций.

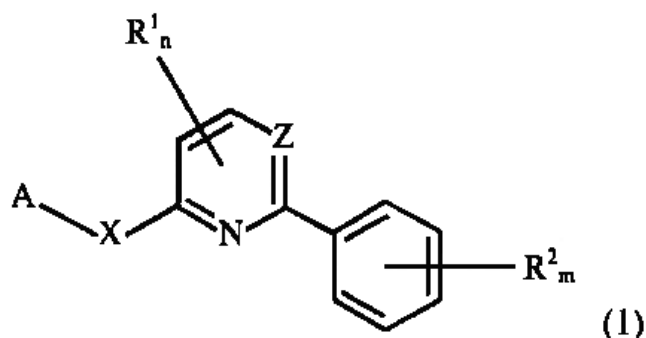
Таким образом, указанные известные соединения не позволяют признать, что имеется достаточно широкий ассортимент производных 2,6-дифенилпиридина и 2,4-дифенилпиримидина, обладающих гербицидной активностью. Таким образом, и известные гербицидные композиции на основе 2,6-дифенилпиридина и 2,4-дифенилпиримидина представлены в недостаточно широком ассортименте, что приводит

к отсутствию возможности достаточно широкого выбора способа борьбы с нежелательной растительностью. Таким образом, актуальной остается задача расширения ассортимента гербицидных средств.

Задача решается новыми дизамещенными азотсодержащими шестичленными гетероциклическими соединениями, в частности, 2,6-дизамещенными пиридинами и 2,4-ди замещенными пиримидинами, обладающими гербицидной активностью, способом получения указанных соединений, промежуточными 2,4,6-тризамещенными пиримидинами для осуществления этого способа и способом их получения, а также содержащими указанные производные гербицидными композициями и способом борьбы с нежелательной растительностью.

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

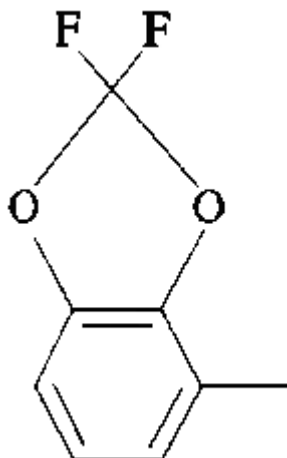
Таким образом, изобретение относится к обладающим гербицидной активностью новым 2,6-дизамещенным пиридинам и 2,4-дизамещенным пиримидинам общей формулы 1:



где А представляет необязательно замещенную арильную группу, или необязательно замещенную 5- или 6-членную азотсодержащую гетероароматическую группу, или дифторбензодиоксилильную группу; m представляет целое число от 0 до 5; n представляет целое число от 0 до 2; R¹ (или каждый R¹), независимо, является атомом водорода, атомом галогена, необязательно замещенной группой алкил, алкенил, алкинил, алкокси, алкоксиалкил, диалкоксиалкил, алкоксиалкокси, алкилтио, amino, алкиламино, диалкиламино, алкоксиамино или формамидино; R² (или каждый R²), независимо, является атомом водорода, атомом галогена, необязательно замещенными группами алкил, алкенил, алкинил, галоидалкил, галоидалкокси, алкокси, алкоксиалкокси, алкилтио группой или нитро, циано, SF₅ или алкилсульфонил или алкилсульфинил; X представляет атом кислорода или серы; и Z представляет атом азота или СН группу; при условии, что если А представляет 1-метил-3-трифторметил-пиразол-5-ильную группу, n равно 0, X является атомом кислорода, и Z - группой СН, тогда R²_m не представляет собой водород или 3-трифторметил или 2,4-дихлоро или 2,4-диметил.

Арильная группа в качестве заместителя или части других заместителей или в определении А являются подходящим образом необязательно замещенной фенильной или нафтильной группой. В определении А 5- или 6-членная гетероарильная группа включает необязательно замещенные 5- или 6-членные гетероциклы, содержащие один или более атомов азота и/или кислорода и/или серы, причем от 1 до 3 атомов азота является предпочтительным. Примерами таких групп являются группы пиразолил, имидазолил, триазолил, тетразолил, пиридил, пиразинил, пиримидил, пиридазинил, изоксазолил, изотиазолил и триазинил. Если речь идет об А, то определение "арил" включает также бициклические системы, которые состоят из бензольного кольца, конденсированного с 5- или 6-членным гетероциклическим кольцом, описанным выше, и, в свою очередь, 5- или

6-членные гетероциклы могут быть конденсированы с бензольным кольцом. Другим предпочтительным вариантом для А является дифторбензодиоксилильная группа формулы:



Обычно, если какой-нибудь из вышеупомянутых радикалов включает группу алкил, алкенил или алкинил, то такие группы, если не оговорено иное, могут быть линейными или разветвленными, и могут содержать от 1 до 12, предпочтительно, от 1 до 4 атомов углерода. Примерами таких групп являются группы метил, этил, пропил, винил, аллил, изопропил, бутил, изобутил и третбутил. Алкильная часть группы галоидалкил, галоидалкокси, алкилтио или алкокси обычно имеет от 1 до 4 атомов углерода, предпочтительно, от 1 до 2 атомов. Число атомов углерода в алкоксиалкильных, алкоксиалкокси или диалкоксиалкильных группах не превышает 6, предпочтительно, не более 4, например, метоксиметил, метоксиметокси, метоксиэтил, этоксиметил, этоксиэтокси, диметоксимтил.

"Галоген" обозначает атом фтора, хлора, брома или йода, предпочтительно, фтор, хлор или бром. Галоидалкил и галоидалкокси являются, предпочтительно, моно-, ди- или трифторалкилом и -алкокси, в особенности, трифторметилом и трифторметокси.

Когда какие-либо группы определяются как необязательно замещенные, группы заместителей, которые не обязательно присутствуют, могут быть любыми из обычно применяемых при модификации и/или разработке пестицидных соединений, и, в особенности, заместителями, которые сохраняют или повышают гербицидную активность, связанную с соединениями согласно изобретению, или влияние на продолжительность действия, глубину проникновения в почву или в растения, или какое-либо другое желаемое свойство таких гербицидных соединений. В каждой части молекулы может иметься один или несколько одинаковых или различных заместителей. В отношении радикалов, определенных выше как произвольно замещенные алкильные группы, включая алкильные части группы галоидалкил, алкокси, алкилтио, галоидалкокси, алкиламино и диалкиламино, характерные примеры таких заместителей включают группы фенил, атомы галогена, нитро, циано, гидроксил, C₁₋₄-алкокси, C₁₋₄-галоидалкокси и C₁₋₄-алкоксикарбонил.

В отношении радикалов, определенных выше как необязательно замещенные арильные или гетероарильные группы, необязательные заместители включают атомы галогена, в особенности, фтор, хлор и бром, и группы нитро, циано, amino, гидроксил, C₁₋₄-алкил, C₁₋₄-алкокси, C₁₋₄-галоидалкил, C₁₋₄-галоидалкокси, и галоидсульфанил, такой как SF₅. Подходящим образом может быть использовано от 1 до 5 заместителей, причем предпочтительно от 1 до 2 заместителей. Типичными группами галоидалкил, галоидалкокси и галоидалкилтио представляют собой группы трифторметил, трифторметокси и трифторметилтио.

Индекс m предпочтительно обозначает целое число от 1 до 3, n предпочтительно равно 1 (в этом случае R^1 не является водородом).

Соединения, соответствующие общей формуле I, являются маслами, смолами или, преимущественно, твердыми кристаллическими веществами. Они могут использоваться в сельском хозяйстве или связанных с ним областях для подавления нежелательной растительности, таких как *Alopecurus myosuroides*, *Echinochloa crus-galli*, *Setaria viridis*, *Galium aparine*, *Stellaria media*, *Veronica persica*, *Lamium purpureum*, *Viola arvensis*, *Abutilon theophrasti*, *Ipomoea purpurea* и *Amaranthus retroflexus* посредством до- и послевсходового нанесения. Соединения общей формулы 1, в соответствии с изобретением, обладают высокой гербицидной активностью в широком диапазоне концентраций и могут использоваться в сельском хозяйстве.

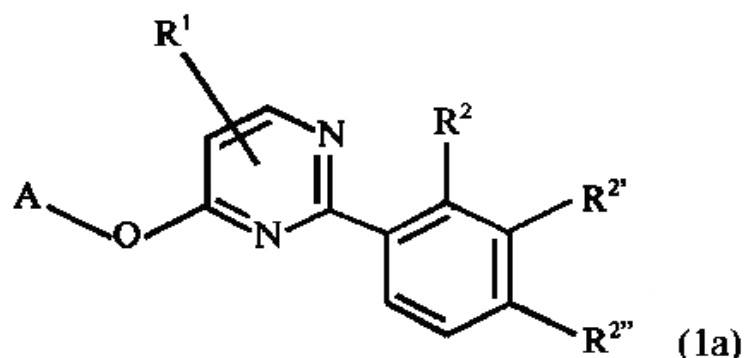
Предпочтительными являются те соединения, в которых А представляет фенильную, пиридинную или пиразолильную группу, замещенную одним или большим числом идентичных либо различных заместителей из числа атомов галогена, алкильных, алкокси, галоидалкильных, галоидалкокси и пентагалоидсульфанильных групп.

Особенно предпочтительны соединения, где заместитель в группе А находится в мета-положении по отношению к точке присоединения этой группы.

Хорошие результаты, с точки зрения подавления роста нежелательной растительности, получаются, когда А замещено в мета-положении атомом хлора или трифторметильной группой, в особенности, если А является группой 2-хлорпирид-4-ил, 1-метил-3-трифторметилпиразол-5-ил или 3-трифторметилфенил.

Особенно хорошие результаты подавления сорняков достигаются при помощи соединений, где Х представляет атом кислорода. Особенно хорошие результаты получаются при использовании соединений, в которых Z является атомом азота.

Следующая формула 1A представляет предпочтительное осуществление изобретения:



В этой формуле А представляет 3-трифторметилфенил, 2-хлорпирид-4-ил, 2-трифторметилпирид-4-ил, 2-дифторметоксипирид-4-ил или 1-метил-3-трифторметилпиразол-5-ил, R^1 имеет значения, указанные выше; R^2 , $R^{2'}$ и $R^{2''}$ представляют собой, независимо друг от друга, атом водорода, атом фтора, хлора или брома, а один или два из них также группу трифторметил, трифторметокси или циано, $R^{2''}$, далее, может быть C_{1-4} -алкильной группой, в частности, трет-бутил.

Изобретение подтверждено следующими примерами:

- 2-(1'-Метил-3'-трифторметилпиразол-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) пиримидин,
- 2-(3'-хлорфенил)-5-метил-4-(3"-трифторметилфенокси) пиримидин,

2-(4'-фторфенил)-6-метил-4-(3"-трифторметилфеноксипиримидин,
 2-(4'-фторфенил)-4-(1"-метил-3"-трифторметилпиразол-5"-илокси)-5-метил-
 пиримидин,
 2-(4'-фторфенил)-(1"-метил-3"-трифторметилпиразол-5"-илокси)-6-метил-
 пиримидин,
 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"-трифторметилфенил)-2-(3'-трифторметилфенил)пиридин,
 4-метил-6-(4"-трифторметоксифенил)-2-(1'-метил-3'-трифторметилпиразол-5'-
 илокси)пиридин,
 4-метил-6-(4"-трифторметоксифенил)-2-(2'-хлорпирид-4'-илокси)пиридин,
 4-метил-6-(4"-трифторметилфенил)-2-(1'-метил-3'-трифторметилпиразол-5'-
 илокси)пиридин,
 4-метил-6-(4"-трифторметилфенил)-2-(2'-хлорпирид-4'-илокси)пиридин,
 4-метил-6-(4"-трифторметилфенил)-2-(2'-хлорпирид-4'-илокси)пиридин,
 4-метил-6-(4"-фторфенил)-2-(1'-метил-3'-трифторметилпиразол-5'-
 илокси)пиридин,
 5,6-диметил-2-(4'-трифторметоксифенил)-4-(1"-метил-3"-трифторметилпиразол-5"-
 илокси)пиримидин,
 5,6-диметил-2-(4'-трифторметоксифенил)-4-(3"-трифторметилфеноксипи-
 римидин,
 5,6-диметил-2-(4'-трифторметилфенил)-4-(3"-трифторметилфеноксипи-
 римидин,
 5,6-диметил-4-(1"-метил-3"-трифторметилпиразол-5"-илокси)-2-(4'-
 трифторметилфенил)пиримидин,
 5-метил-2-(3'-метилфенил)-4-(1"-метил-3"-трифторметилпиразол-5"-илокси)
 пиримидин,
 5-метил-2-(3'-метилфенил)-4-(3"-трифторметилфеноксипиримидин,
 5-метил-2-(4'-трифторметоксифенил)-4-(1"-метил-3"-трифторметилпиразол-5"-
 илокси)пиримидин,
 5-метил-2-(4'-трифторметоксифенил)-4-(3"-трифторметилфеноксипи-
 римидин,
 5-метил-2-(4'-трифторметилфенил)-4-(1"-метил-3"-трифторметилпиразол-5"-
 илокси)пиримидин,
 5-метил-4-(3"-трифторметилфенил)-2-(4'-трифторметилфенил)-пиримидин,
 6-(4"-фторфенил)-2-(1»-метил-3'-трифторметилфенилпиразол-5'-илокси)пиридин,
 6-метил-2-(4'-трифторметилфенил)-4-(1"-метил-3"-трифторметилфенил-5"-
 илокси)-пиримидин,
 6-метил-2-(4'-трифторметилфенил)-4-(3"-трифторметилфенил)-пиримидин,
 6-метил-4-(3"-трифторметилфенил)-2-(4'-трифторметилфенил)-пиримидин,
 6-метил-2-(4'-трифторметилфенил)-4-(1"-метил-3"-пентафторэтилпиразол-5"-
 илокси)пиримидин,
 6-метил-2-(4'-цианофенил)-4-(1"-метил-3"-пентафторэтилпиразол-3"-илокси)
 пиримидин,
 6-метокси-2-(4'-цианофенил)-4-(1"-метил-3"-пентафторэтилпиразол-5"-илокси)
 пиримидин,
 6-метил-4-(2",2"-дифтор-1",3"-бензодиоксол-4"-ил)-2-(4'-трифторметилфенил)

пиримидин,

6-этил-2-(4'-трифторметилфенил)-4-(1"-метил-3"-трифторметилпиразол-5"-илокси)пиримидин,

6-этил-2-(4'-трифторметилфенил) -4-(3"-трифторметилфенокси) - пиримидин,
6-метил-2-(4'-метилсульфонилфенил)-4-(1"-метил-3"-пентафторэтилпиразол-5"-илокси)пиримидин,

6-этил-2-(4'-трифторметилфенил) -4-(2'-хлорпирид-4'-илокси)пиримидин,
6-пропаргил-2-(4'-трифторметилфенил)-4-(1"-метил-3"-трифторметилпиразол-5"-илокси)пиримидин,

6-метоксиметил-2-(4'-хлорфенил)-4-(1"-метил-3"- трифторметилпиразол -5"-илокси)пиримидин,

6-метоксиметил-2-(4'-хлорфенил)-4-(3"-трифторметилфенокси)-пиримидин,

6-метоксиметил-2-(4'-хлорфенил)-4-(3"-трифторметилфенокси)-пиримидин,

4-(3"-трифторметилфенокси)-2-(4'-трифторметилфенил)пиримидин,

4-(1"-метил-3"-трифторметилпиразол-5"-илокси)-2-(4'-трифторметилфенил)

пиримидин,

6-хлор-2-(4'-трифторметилфенил)-4-(1"-метил-3"-трифторметилпиразол-5"-илокси)пиримидин,

6-бром-2-(4'-трифторметилфенил)-4-(1"-метил-3"-трифторметилпиразол-5"-илокси) пиримидин,

6-хлор-2-(4'-хлорметилфенил)-4-(1"-метил-3"-трифторметилпиразол-5"-илокси) пиримидин,

6-фтор-2-(4'-трифторметилфенил)-4-(1"-метил-3"-трифторметилпиразол-5"-илокси) пиримидин,

6-метокси-2-(4'-трифторметилфенил)-4-(3"-трифторметилфенокси)пиримидин,

6-метокси-2-(4'-трифторметилфенил)-4-(1"-метил-3"-трифторметилпиразол-5"-илокси) пиримидин

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

5-метокси-2-(4'-трифторметилфенил) -4-(3" - трифторметилфенокси)пиримидин,

5-метокси-2-(4'-трифторметилфенил) -4- (1" -метил-3" -трифторметилпиразол-5" -илокси)пиримидин,

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

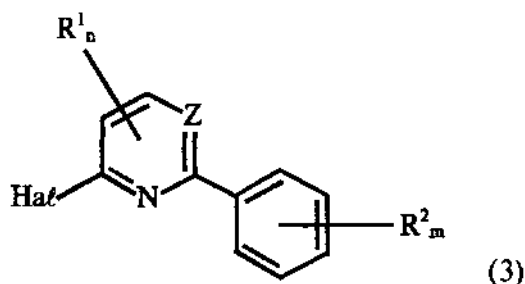
6-этиламино-2-(4'-трифторметилфенил) -4- (1"-метил-3"-трифторметилпиразол-5"-илокси)пиримидин,

6-метоксиамино-2-(4'-хлорфенил)-4-(1"-метил-3"-трифторметилпиразол-5"-илокси)пиримидин,

6-винил-2-(4'-трифторметилфенил)-4-(1"-метил-3"-трифторметилпиразол-5" -илокси) пиримидин.

Соединения согласно изобретению могут быть получены обычными способами.

Подходящий способ получения соединений общей формулы 1 включает взаимодействие соединения общей формулы 3



с соединением общей формулы 4

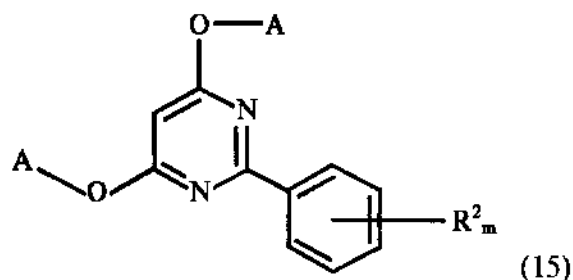


где Z, A, R¹, R², m, n и X определены выше; Ha представляет атом галогена; и M

представляет атомом металла.

Атомом галогена $\text{Na } \ell$ может являться любой атом галогена, подходящими являются фтор, хлор или бром. Атомом металла M может являться любой атом металла, подходящими являются щелочные металлы, причем предпочтительны натрий и калий.

Альтернативно соединение с общей формулой 15



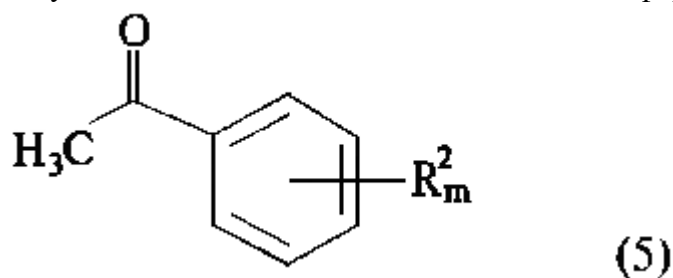
где A , R^2 и m определены выше, могут взаимодействовать с $R^1\text{-H}$, предпочтительно, в присутствии основания, если R^1 является необязательно замещенным алкокси, алкоксиалкокси, алкилтио, amino, алкиламино, диалкиламино или алкоксиамино, с получением соединения общей формулы 1.

Соединения 1, где R^1 представляет собой алкинил или алкенил, например, типа аллила или пропаргила, могут быть получены из соединений 1, где R^1 представляет атом галогена, предпочтительно, хлора или брома, путем взаимодействия с $R^1\text{-H}$ или их металлоорганическими производными, предпочтительно, в присутствии катализаторов на основе переходных металлов или оснований.

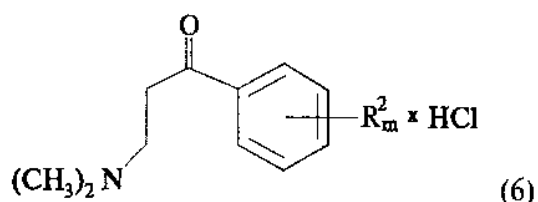
Соединения 15 могут быть получены из 3, где R^1 представляет $\text{Na } \ell$, Z представляет азот, $\text{Na } \ell$, R^2 и m определены выше, путем взаимодействия с 4, описанным выше, X обозначает кислород, с использованием приблизительно 2 эквивалентов 4.

На практике взаимодействие можно проводить в отсутствие 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.

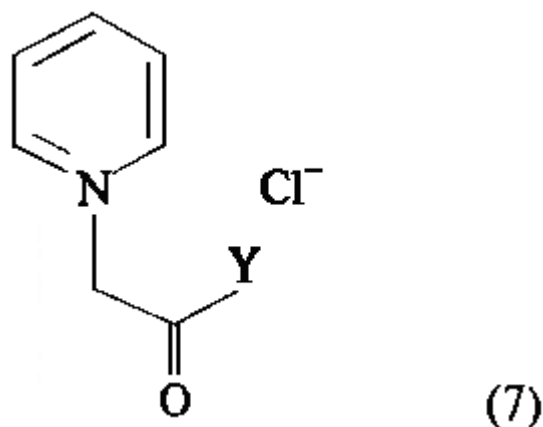
Соединения формулы 3, в которых Z , представляет собой C-H группу и n равно 0, могут быть получены путем взаимодействия соединений с общей формулой 5



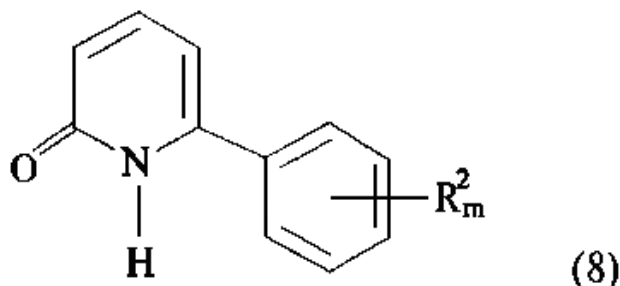
где R^2 и m определены выше, с альдегидом, подходящим является обычно формальдегид, и диалкиламин, подходящим является диметиламин, в соответствии с Org. Synthesis Col. Vol. III, 305f, в растворителе, обычно в спирте, предпочтительно в этаноле, с получением соединения общей формулы 6,



которые, согласно DBP 21 47 288 (1971), последовательно взаимодействуют с солью аммония, подходящим является ацетат аммония, и соединением общей формулы 7,

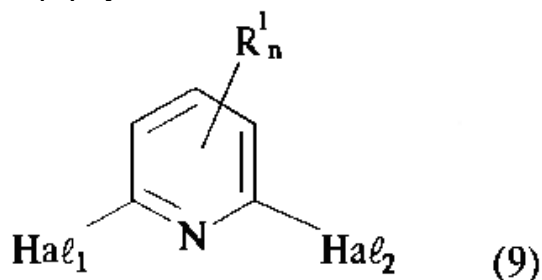


где Y является алкоксигруппой или NH₂-группой, предпочтительно этоксигруппой, в растворителе, подходящим является спирт, предпочтительно этанол, с получением соединения общей формулы 8,

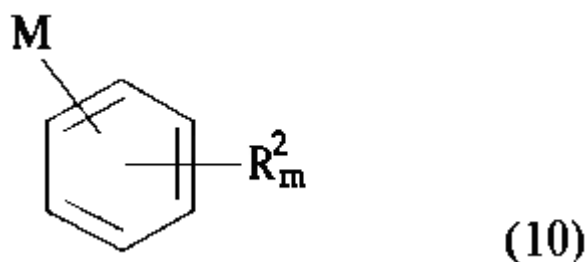


которые далее преобразуют путем взаимодействия 8 с фосфорил-галогенидами (Muller, E., Chem.Ber. 42, 423 (1909), Katritzky et al, J.Chem.Soc., Perkin Trans. Part 1, 1980, 2743-2754), предпочтительно, фосфорилбромидом или фосфорилхлоридом, при повышенных температурах, в идеале при температуре кипения, с получением соединения общей формулы 3.

Альтернативный и предпочтительный способ получения соединений общей формулы 3, в которых Z представляет собой C-H группу, включает взаимодействие 2,6-дигалогидпиридинов общей формулы 9



где R¹ и n определены выше, и каждый из Hal₁ и Hal₂, независимо, представляет собой атом галогена, с металлоорганическим производным бензола общей формулы (10), при приблизительно эквимольном отношении,

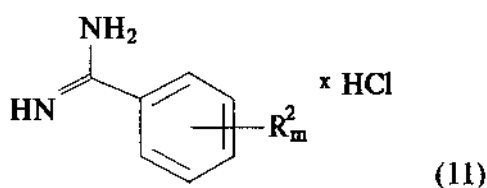


где R^2 и m определены выше, и M представляет собой атом щелочного металла, или бора, или олова, или магния, или цинка, или меди, необязательно в присутствии катализатора на основе переходных металлов.

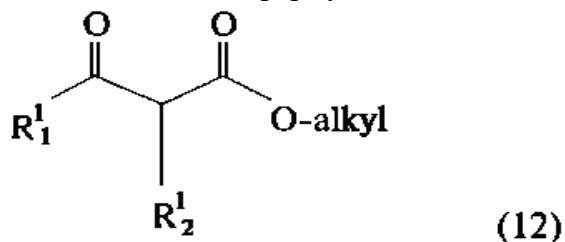
Щелочным металлом может быть любой щелочной металл, предпочтительно литий, и реакцию можно проводить в апротонном полярном растворителе, предпочтительно, эфире, с получением соединения общей формулы 3, особенно как это показано в Cook and Wakefield, J.Chem.Soc, 1969, 2376, или в неполярных растворителях, или воде, например, как описано в Ali, N.M. et al, Tetrahedron, 1992, 8117.

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

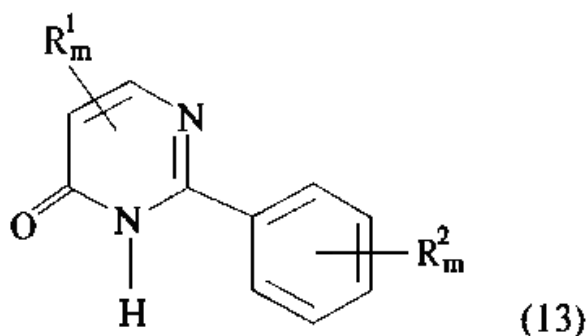
Способ получения соединений формулы 3, в которых Z представляет собой атом азота, включает взаимодействие гидрохлорида бензамидина общей формулы 11



где R^2 и m указаны выше, с соединениями формулы 12 или его солью,



где R_1^1 и R_2^1 , независимо, определены выше; и О-алкильная группа обычно представляет собой метокси или этокси, с получением пиримидинона общей формулы 13, в которой R^1 может также быть гидроксилом



Соединения общей формулы 11 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 11 и 12 может быть проведено в соответствии с *Liebigs Ann.* 1980. 1392f в органических растворителях, обычно спиртах, и предпочтительно, в этаноле, и в присутствии основания, обычно алкоксидов металлов, предпочтительно, этоксида натрия.

Соединения формулы 13 могут быть последовательно преобразованы в соединения формулы 3, 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 отсутствии растворителя, при повышенных температурах, с получением соединений формулы 3.

Соединения формулы 3, при значениях, указанных выше для $R^1=F$, могут быть получены из соединения 3, когда R^1 является хлором или амином, в соответствии с известными в литературе способами, подобными описанным в *Tullock C.W. et al., JAm.Chem.Soc.* 1960, 5197 или *Kiburis J., Klister J., J.Chem.Soc.Chem.Com.* 1969, 381.

Соединения общей формулы 4 известны или могут быть получены известными способами. Они могут быть получены и выделены отдельно либо могут быть приготовлены *in situ*. Обычно соединение общей формулы 14



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

Соединение общей формулы 1, если желательно, может быть выделено и очищено с использованием обычных методов.

В изобретении также предусматривается использование соединения общей формулы 1 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 1. 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 довосходовым 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.

Изобретение включает также способ получения гербицидной композиции согласно по изобретению, который включает смешивание соединения формулы 1 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 транспортируются 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 смачивающим 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 пропиленоксидом; продукты конденсации жирных спиртов или алкилфенолов, например, *n*-октилфенола или *n*-октилкрезола, с этиленоксидом и/или пропиленоксидом; сульфаты или сульфонаты этих продуктов конденсации; соли щелочных или щелочноземельных 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 сульфонированного 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 1), 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.

ПРИМЕРЫ

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 6 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. Подробности даны в таблице 2.

Пример 9: 2-Бром-6-фенилпиридин

Смесь 6-фенилпиридона (3 г, 17.5 ммоль; получен согласно примеру 5) и фосфорилбромида (7.2 г, 25.0 ммоль) нагревали до 100°C 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 3 получены по методикам, аналогичным приведенной в примере 9. Подробности даны в таблице 3.

Пример 13: 2-(1'-Метил-3'-трифторметилпиразол-5'-илокси) -6-фенилпиридин

Смесь 2-бром-6-фенилпиридина (0.5 г, 2.1 ммоль; получен согласно примеру 9), 1-метил-3-фторметил-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-дифторпиридин (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-метилпиридина (9.5 г, 50 ммоль), 4-фторбензолбороновой кислоты (7.8 г, 56 ммоль), бикарбоната натрия (12.6 г, 150 ммоль), воды (200 мл) и каталитических количеств тетраис (трифенилфосфин)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 этил ацетатом. 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'-фторфенил)-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'-трифторфенил)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 2М раствор LDA в ТГФ (7.5 мл, 15 ммоль) при -70°C. После 2 ч выдерживания при -70°C добавляли диметил-дисульфид (1.41 г, 15 ммоль) и давали реакционной смеси нагреться до -20°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°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°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°C.

Примеры 41-50:

Следующие соединения общей формулы 11 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-фторбензамидина (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, 1М). Затем pH смеси приводили к 5 при помощи 2М 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-трифторбензамидина (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-трифторметилбензамидина (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 3. 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 соединение (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) и 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 давало указанное в заголовке соединение (1.75 г, 96 %) в виде бесцветных кристаллов с т. пл. 157-159°C.

Примеры 81-108:

Соединения общей формулы 3, перечисленные в таблице 9, получены аналогично методу, описанному в примере 79.

Пример 109: 2-(4'-Фторфенил)-4-(3"-фторметилфенокси)-6-метилпиримидин

Смесь 2-(4'-фторфенил)-4-хлор-6-метилпиримидина (0.6 г, 2.7 ммоль) (из примера 81), α , α , α -3- гидроксibenзотрифторида (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 1 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'-трифторметилфенил)-пиримидина (2.93 г, 10 ммоль) (из примера 107), 2-хлор-4-гидрокси-пиримидина (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 (15a), перечисленные в табл. 11, приготовлены аналогично методу из примера 184.

Пример 188: 6-Метокси-4-(1'-метил- 3" -трифторметилпиразол-5" -ил) -2 -(4'-трифторметил фенил) -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 1 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'-трифторметилфенил) пиримидина (2 г, 4.3 ммоль, из примера 201), винилтрибутилстанната (1.4 мл, 4.7 ммоль), тетраakis(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 %) ст. ил. 112°C.

Пример 205: Гербицидная активность:

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

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

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 взойдящих сеянцев вышеуказанных видов такими составами.

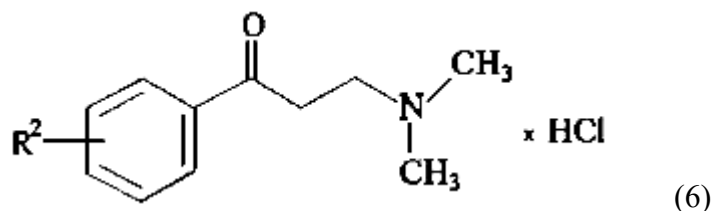
Почва, используемая в испытаниях, представляла собой приготовленную садовую плодородную землю. Используемые в тестах готовые составы получали из растворов испытуемых соединений в ацетоне, содержащих 0.4 % (вес.) поверхностно-активной добавки типа конденсата алкилфенила с этиленоксидом, имеющейся под торговой маркой

TRITON X 55. Раствор в ацетоне разбавляли водой, и полученные составы содержали 1000 г или 300 г активного вещества на гектар в объемах, эквивалентных 400 литрам на гектар. В качестве контрольных в довсходовых испытаниях использовались образцы необработанной засеянной почвы, а в послевсходовых испытаниях - образцы необработанных семян растений, взошедших на необработанной почве.

Гербицидное воздействие испытуемых соединений определяли визуально через двадцать дней после опрыскивания листы и почвы (в случае примеров 13-16 через тринадцать дней после обработки) и фиксировались 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.

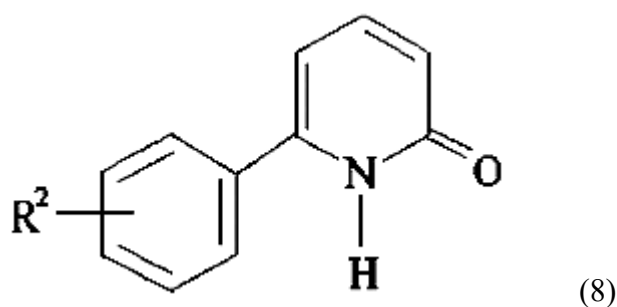
Результаты испытаний представлены в приведенной ниже таблице, в которой соединения определяются посредством ссылок на предшествующие примеры. Звездочки обозначают, что данные виды растений не обрабатывались в этом испытании. Обозначения "pre-" и "post" в графе "Способ применения" соответствуют довсходовому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

Таблица 1



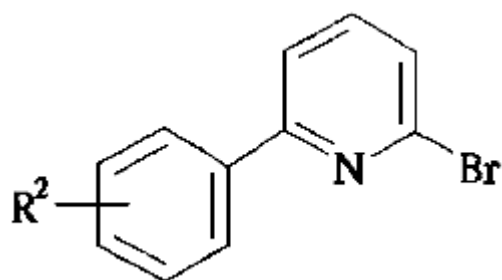
Пример №	R ²	Т. пл. (°C)	выход (%)
2	3 -трифторметил	157	63
3	2,4-дихлор	136	51
4	2,4-диметил	134	72

Таблица 2



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

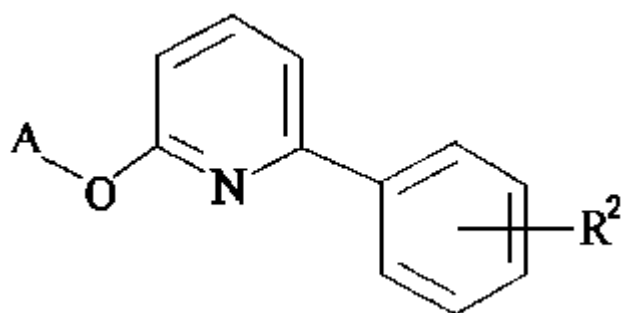
Таблица 3



(3)

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

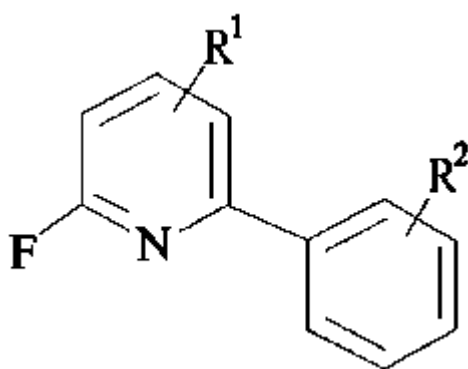
Таблица 4



(1)

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

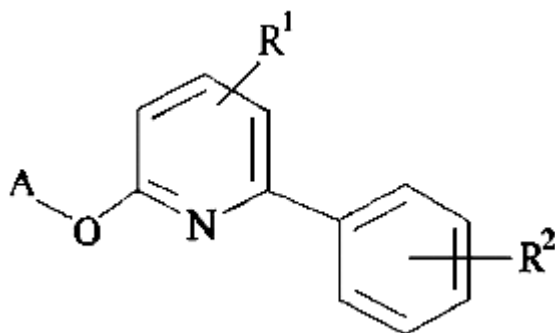
Таблица 5



(3)

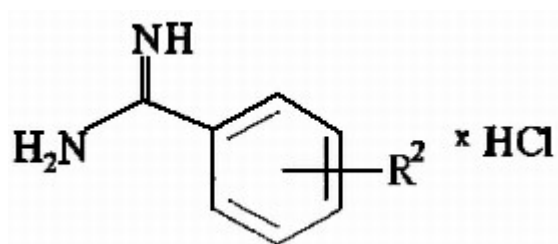
Пример №	R ¹	R ₂	Т. ил. (°C)	выход (%)
20	-	-	масло	47
21	-	4'-трифторметил	113	75
22	-	3'-трифторметил	91	72
23	-	3,4-дифтор	масло	24

Таблица 6



Пример №	R¹	A	R²	Т. пл. (°C)	выход (%)
25	-	3'-CF ₃ -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 ₃ -3'-CF ₃ -пиразол-5'-ил	4"-фтор	87	44
30	-	1'-CH ₃ -3'-CF ₃ -пиразол-5'-ил	4"-трифторметил	94	59
31	-	1'-CH ₃ -3'-CF ₃ -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 ₃ -фенил	4"-трифторметил	масло	44
35	4-CH ₃	1'-CH ₃ -3'-CF ₃ -пиразол-5'-ил	4"-фтор	85	43
36	4-CH ₃	2"-хлорпирид-4'-ил	4"-фтор	115	35
37	3-CH ₃ S	3'-CF ₃ -фенил	4"-трифторметил	133-136	67
38	3-CH ₃ S	1'-CH ₃ -3'-CF ₃ -пиразол-5'-ил	4"-трифторметил	154-156	41
39	-	1'-CH ₃ -3'-CF ₃ -пиразол-5'-ил	3",4"-дифтор	масло	29

Таблица 7

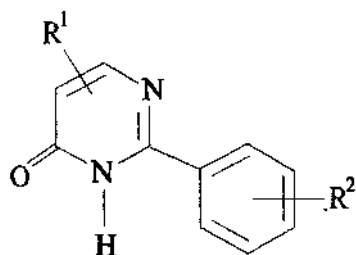


(11)

Пример №	R²	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
----	-------------------	-----	----

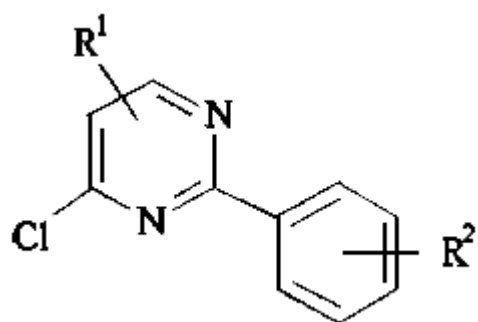
Таблица 8



(3)

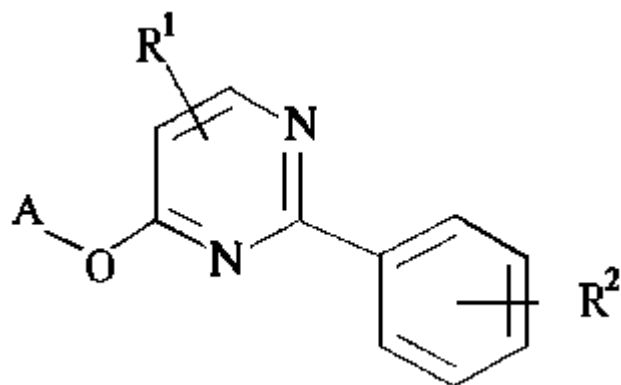
Пример №	R ¹	R ²	Т. пл. (°C)	выход (%)
1	2	3	4	5
54	6-метил	4'-фтор	267	56.8
55	5-метил	4'-трифторметил	>250	58.7
56	6-метил	4'-трифторметил	209	82.2
57	5-метил	3' -метил	169	34.3
58	6-метил	3' -метил	185	41.6
59	5-метил	3'-хлор	260	61.4
60	6-метил	3'-хлор	218	51
61	5-метил	3',4'-дифтор	>250	59.4
62	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	63.5
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



Пример №	R ¹	R ²	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
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



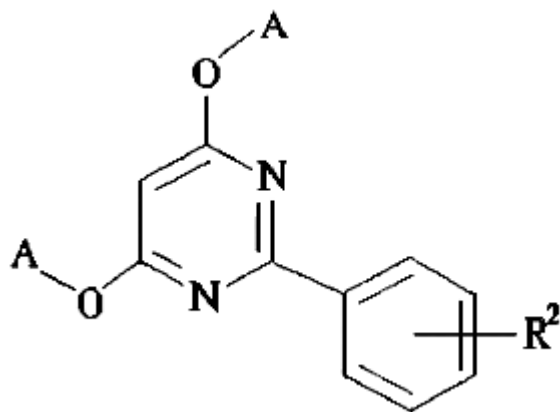
Прим ер №	R ¹	R ²	A	Т. пл. (°C)	выход (%)
1	2	3	4	5	6
110	5 -метил	4'-фтор	1''-CH ₃ -3''-CF ₃ -пиразол-5''-ил	133	54.7
111	6-мстил	4'-фтор	1''-CH ₃ -3''-CF ₃ -пиразол-5''-ил	123	21
112	6-метил	4'-CF ₃	1''-CH ₃ -3''-CF ₃ -пиразол-5''-ил	98	39.5
113	6-метил	4'-CF ₃	3''-CF ₃ -фенил	89	79.9
114	5 -метил	4'-CF ₃	1''-CH ₃ -3''-CF ₃ -пиразол-5''-ил	147	27.6
115	5 -метил	4'-CF ₃	3''-CF ₃ -фенил	95	97.6
116	5 -метил	3'-CH ₃	1''-CH ₃ -3''-CF ₃ -пиразол-5''-ил	121	74.9
117	5 -метил	3'-CH ₃	3''-CF ₃ -фенил	71	4.5
118	6-метил	3'-CH ₃	1''-CH ₃ -3''-CF ₃ -пиразол-5''-ил	113	74.9
119	6-метил	3'-CH ₃	3''-CF ₃ -фенил	60	73.2
120	5 -метил	3'-хлор	1''-CH ₃ -3''-CF ₃ -пиразол-5''-ил	116	35.4
121	5 -метил	3'-хлор	3''-CF ₃ -фенил	105	52.4
122	6-метил	3'-хлор	1''-CH ₃ -3''-CF ₃ -пиразол-5''-ил	96	27.1
123	5 -метил	2',4'-дифтор	3''-CF ₃ -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 ₃ -3''-CF ₃ -пиразол-5''-ил	78	56.4
126	6-метил	2',4'-дифтор	3''-CF ₃ -фенил	64	65.3
127	6-метил	2',4'-дифтор	2''-хлорпирид-4''-ил	162	31.7
128	5 -метил	4'-CF ₃	2''-хлорпирид-4''-ил;-	99	44.1
129	5,6-диметил	4'-CF ₃	1''-CH ₃ -3''-CF ₃ -пиразол-5''-ил	136	13.2
130	5,6-диметил	4'-CF ₃	3''-CF ₃ -фенил	73	65.6
131	5,6-диметил	3'-CF ₃	1''-CH ₃ -3''-CF ₃ -пиразол-5''-ил	132	30.3
132	5,6-диметил	3'-CF ₃	3''-CF ₃ -фенил	105	67.5

1	2	3	4	5	6
133	6-метил	4'-CF ₃	1''-CH ₃ -3''-CF ₃ -пираюл-5''-ил	128	41
134	6-метил	4'-CF ₃	2'',2''-дифторо-1'',3''-бензодиоксол-4''-ил	86	85
135	6-этил	4'-CF ₃	1''-CH ₃ -3''-CF ₃ -пиразол-5''-ил	75	46
136	6-этил	4'-CF ₃	2''-хлорпирид-4''-ил	97	41
137	6-метил	3'-CF ₃	4''-фторфенил	78	92
138	6-этил	4'-CF ₃	3''-CF ₃ -фенил	65	38
139	5-метил	3'-CF ₃	4''-фторфенил	109-	86
140	5-метил	4'-Br	3''-CF ₃ -фенил	110	100

141	6-метил	4'-Br	3"-CF ₃ -фенил	86-88	89
142	5-метил	4'-(трет-бутил)	1"-CH ₃ -3"-CF ₃ -пиразол-5"-ил	149-151	92
143	6-метил	4'-(трет-бутил)	1"-CH ₃ -3"-CF ₃ -пиразол-5"-ил	119-121	78
144	5-метил	4'-(трет-бутил)	3"-CF ₃ -фенил	123-124	91
145	6-метил	4'-(трет-бутил)	3"-CF ₃ -фенил	масло	99
146	6-метил	4'-Cl	3"-CF ₃ -фенил	68	29
147	5,6-диметил	4'-Cl	1"-CH ₃ -3"-CF ₃ -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 ₃ -фенил	102	66
150	5-метил		1"-CH ₃ -3"-CF ₃ -пиразол-5"-ил	140-	75
151	5,6-диметил	3'-F	1"-CH ₃ -3"-CF ₃ -пиразол-5"-ил	117	70
152	5-метил	4'-Cl	1"-CH ₃ -3"-CF ₃ -пиразол-5"-ил	141	58
153	5-метил	4'-Cl	2"-хлорпирид-4"-ил	125	31
154	5-метил	4'-Cl	3"-CF ₃ -фенил	101	52
155	6-метил	4'-Cl	1"-CH ₃ -3"-CF ₃ -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 ₃ -3"-CF ₃ -пиразол-5"-ил	78	56
159	6-метил	3',4'-дифтор	3"-CF ₃ -фенил	64	65
160	6-метил	3',4'-дифтор	2"-хлорпирид-4"-ил	162	32
161	5-метил	4'-CF ₃ O	1"-CH ₃ -3"-CH ₃ -пиразол-5"-ил	117-	58
162	6-метил	4'-CF ₃ O	1"-CH ₃ -3"-CH ₃ -пиразол-5"-ил	102-	46
163	5-метил	4'-CF ₃ O	1"-CH ₃ -3"-(трет-бутил)-пиразол-5"-ил	96-98	58
164	6-метил	4'-CF ₃ O	1"-CH ₃ -3"-(трет-бутил)-пиразол-5"-ил	88-89	78
165	6-метил	4'-CF ₃	1"-CH ₃ -3"-(трет-бутил)-пиразол-5"-ил	87-90	83
166	6-метил	4'-CF ₃ O	3"-CF ₃ -фенил	52	73
167	6-метил	4'-CF ₃ O	2"-хлорпирид-4"-ил	72	32
168	5-метил	4'-CF ₃ O	3"-CF ₃ -фенил	83	80
169	5-метил	4'-CF ₃ O	2"-хлорпирид-4"-ил	82	43
170	5,6-диметил	4'-CF ₃ O	3"-CF ₃ -фенил	75	66
171	5,6-диметил	4'-CF ₃ O	2"-хлорпирид-4"-ил	107	54
172	5-метил	3',4'-дифтор	3"-CF ₃ -фенил	68	40
173	6-метил	4'-CF ₃ O	1"-CH ₃ -3"-CF ₃ -пиразол-5"-ил	116	43
174	5-метил	4'-CF ₃ O	1"-CH ₃ -3"-CF ₃ -пиразол-5"-ил	98	67
175	5,6-диметил	4'-CF ₃ O	1"-CH ₃ -3"-CF ₃ -пиразол-5"-ил	128	45
176	6-метоксиметил	4'-Cl	2"-хлорпирид-4"-ил	89-91	100
177	6-метоксиметил	4'-Cl	1"-CH ₃ -3"-CF ₃ -пиразол-5"-ил	113-	94
178	6-метоксиметил	4'-Cl	3"-CF ₃ -фенил	140-	92
179	5-метокси	4'-CF ₃	2"-хлорпирид-4"-ил	96	92
180	5-метокси	4'-CF ₃	3"-CF ₃ -фенил	80	95
181	5-хлор-6-метокси	4'-Cl	1"-CH ₃ -3"-CF ₃ -пиразол-5"-ил	173-176	95

182	5-хлор-6-метокси	4'-Cl	3''-CF ₃ -фенил	95-98	100
183	5-метокси	4'-CF ₃	1''-CH ₃ -3''-CF ₃ -пиразол-5''-ил	80	80

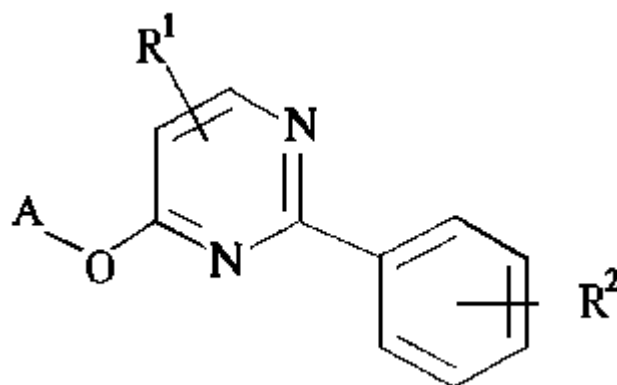
Таблица 11



(15a)

Пример №	R ²	A	Т. пл. (°C)	выход (%)
185	4'-трифторметил	1''-CH ₃ -3''-CF ₃ -пиразол-5''-ил	168	86
186	4'-трифторметил	1''-CH ₃ -3''-CF ₃ -пиразол-5''-ил	92	88
187	4'-хлор	1''-CH ₃ -3''-CF ₃ -пиразол-5''-ил	156	93

Таблица 12



(1)

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

202	6-хлор	4'-Cl	1''-CH ₃ -3''-CF ₃ -пиразол-5''-ил	122	26
203	6-хлор	4'-CF ₃	1''-CH ₃ -3''-CF ₃ -пиразол-5''-ил	113	69

При - мер №	доза г/га	Способ применен ия	TR ZA W	H OR V W	G OS HI	HE LA N	OR YS A	GL X MA	BE AV A	ZE AM X	AL OM Y	AV EF A	EC HC G	SE TV I	GA LA P	STE ME	C HE AL	VE RPE	LA M PU	VI OA R	SI DS P	AM BA R	AB UT H	IP OP U	ST NA L	AM AR E
1	2	3	4	5	6	7	8	9	10	11	12	13	14	15	16	17	18	19	20	21	22	23	24	25	26	27
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 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	* *	* 3k	0 0	0 0	0 0	* *	0 0	* *	0 0	* *	* *	* *	0 0	* *	* *
25	300	pre post	0 0	0 0	0 1	0 7	* *	* *	* *	0 2	0 0	* *	* *	1 0	0 0	0 0	* *	0 1	* *k	0 1	* *	* *	* *	0 1	* *	* *
26	300	pre post	1 1	0 2	* *	1 3	* *	* *	* *	1 2	* *	* *	* *	0 0	2 2	0 4	0 0	0 4	* *	* *	* *	* *	0 4	0 1	* *	0 5
27	300	pre post	0 2	0 2	* *	0 3	* *	* *	* *	0 3	* *	* *	* *	0 1	0 1	0 2	0 0	0 3	* *	* *	* *	* *	0 3	0 2	* *	0 4
28	300	pre post	0 3	3 3	0 4	0 5	* *	* *	* *	3 4	5 5	* *	6 4	9 6	2 5	7 4	* *sk	9 6	8 *	8 6	4 6	4 5	4 4	2 4	* *	9 6
29	300	pre post	0 4	1 3	* *	0 4	* *	* *	* *	0 3	* *	* *	* *	8 3	0 3	7 5	8 6	8 8	* *	* *	* *	* *	0 5	0 4	* *	9 7
30	300	pre post	4 4	6 5	3 6	3 6	* *	* *	* **	4 4	9 6	* *	8 6	9 7	6 5	9 6	* *	9 6	9 *	8 7	8 8	8 5	6 6	6 6	* *	9 5
31	300	pre post	1 3	4 5	2 8	0 5	* *	3 5	* *	1 8	8 7	* *	5 4	9 7	7 6	9 7	* *	9 9	9 7	8 8	* *	* *	8 8	5 6	* *	9 7
32	300	pre post	1 2	0 2	0 5	0 4	* *	0 3	* *	0 3	3 3	* *	2 2	8 4	1 4	6 5	* *sk	8 9	3 5	8 7	* *	* *	3 4	1 5	* *	9 5
33	300	pre post	2 0	0 0	0 0	0 0	* **	2 0	* *	0 0	0 0	* *	0 0	0 2	0 0	0 0	* *	0 0	0 0	0 0	* *	* *	0 0	5 1	* **k	0 0

1	2	3	4	5	6	7	8	9	10	11	12	13	14	15	16	17	18	19	20	21	22	23	24	25	26	27
34	300	pre post	1 2	3 2	3 5	* *	3 2	1 7	* *	2 2	7 4	* *	8 4	8 5	2 6	8 6	* *	9 9	8 6	9 6	* *	8 5	3 6	5 6	* *	8 7
39	300	pre post	1 1	3 2	0 4	* *	* *	0 3	* *	0 3	5 3	* *	4 2	9 7	2 5	9 5	* *	9 9	8 5	9 7	* *	3 3	3 3	3 5	* *	9 5
109	300	pre post	0 0	0 0	0 2	0 0	* *	* *	* *	0 0	0 0	* *	0 0	0 1	0 0	0 0	6 0	0 7	0 0	0 0	0 1	4c 4c	0 0	0 2	* *	6 1
ΠΟ	300	pre post	3 4	4 5	2 6	1 6	* *	* *	* *	2 4	8 7	* *	6 7	9 6	2 8	9 7	* *	9 9	9 7	9 8	9 6	* *	5 6	3 4	* *	9 6
111	300	pre post	1 3	3 3	0 5	0 5	* *	* *	* *	0 4	8 4	* *	* 4	9 6	5 6	9 8	8 9	9 9	8 8	* *	6 6	* *	5 6	3 4	* *	9 6
112	300	pre post	3 4	5 5	6 8	3 8	* *	5 8	* *	4 5	9 7	* *	8 6	9 8	8 7	9 8	* *	9 9	9 8	8 9	* *	* *	8 8	9 7	* *	9 8
113	300	pre post	3 4	6 5	6 8	2 8	* *	3 8	* *	3 5	9 6	* *	8 7	9 9	8 7	9 8	* *	9 9	8 8	8 8	* *	* *	9 8	9 8	* *	9 7
114	300	pre post	4 4	5 5	8 8	3 6	* *	4 6	* *	3 6	8 8	* *	8 5	9 8	8 7	9 8	* *	9 9	8 8	8 8	* *	* *	9 8	9 8	* *	9 7
115	300	pre post	4 4	7 6	8 9	3 8	* *	5 8	* *	4 6	8 7	* *	8 6	9 8	8 7	9 8	* *	9 8	9 8	8 8	* *	* *	9 8	9 8	* *	9 8
116	300	pre post	0 2	3 3	0 4	0 4	* *	0 5	* *	0 3	6 3	* *	4 2	9 8	0 3	6 4	* *	9 9	8 7	7 5	* *	* *	2 4	4 5	* *	8 5
117	300	pre post	0 3	2 3	0 4	0 4	* *	0 4	* *	2 4	7 4	* *	5 3	9 4	1 4	5 4	* *	9 9	6 5	8 7	* *	* *	4 4	4 5	* *	9 7
118	300	pre post	0 0	0 2	0 4	0 4	* *	0 3	* *	0 2	3 3	* *	4 3	7 4	1 3	2 3	* *	8 9	3 4	7 5	* *	* *	1 2	2 4	* *	9 5
119	300	pre post	0 0	0 2	0 0	0 2	* *	0 1	* *	0 1	0 1	* *	1 0	0 1	0 2	0 2	* *	0 3	0 1	2 5	* *	* *	0 1	0 3	* *	0 4
120	300	pre post	1 2	3 4	2 5	0 4	* *	0 5	* *	2 3	8 5	* *	6 4	9 5	6 6	9 4	* *	8 9	8 8	8 7	* *	* *	5 5	5 4	* *	9 5
121	300	pre post	2 3	3 4	2 8	0 4	* *	1 5	* *	3 5	8 5	* *	7 6	9 7	3 6	8 5	* *	9 9	7 7	8 8	* *	* *	5 4	4 5	* *	9 6
122	300	pre post	* *	* *	* *	* *	* *	* *	* *	* *	* *	* *	* *	* *	* *	* *	* *	* *	* *	* *	* *	* *	* *	* *	* *	* *

1	2	3	4	5	6	7	8	9	10	11	12	13	14	15	16	17	18	19	20	21	22	23	24	25	26	27
123	300	pre post	0 1	0 1	0 2	0 3	* *	0 2	* *	0 1	0 1	* *	0 2	0 2	0 3	0 4	* *	2 5	2 3	4 5	* *	* *	0 2	0 6	* *	4 4
124	300	pre post	1 4	3 4	2 6	1 5	* *	5 5	* *	5 5	5 5	* *	6 6	8 7	3 4	9 5	* *	9 9	8 6	9 8	* *	* *	7 6	9 7	* *	9 6
125	300	pre post	3 4	4 5	3 5	2 5	* *	3 6	* *	5 5	8 5	* *	7 6	9 7	4 5	9 6	* *	9 9	9 6	9 8	* *	* *	9 5	7 7	* *	9 6
126	300	pre post	0 2	0 2	0 5	0 4	* *	0 3	* *	0 3	3 3	* *	0 3	9 3	1 4	7 4	* *	8 9	4 5	8 8	* *	* *	2 4	3 6	* *	9 5
127	300	pre post	0 0	0 1	1 4	0 3	* *	0 2	* *	2 2	2 3	* *	0 2	8 4	0 3	7 5	* *	7 6	3 4	8 8	* *	* *	2 4	4 6	* *	8 6
128	300	pre post	4 5	5 5	7 6	2 5	* *	3 5	* *	5 6	8 6	* *	7 7	9 7	5 6	9 6	* *	9 9	9 6	9 8	* *	* *	9 6	9 8	* *	9 7
129	300	pre post	3 2	3 4	5 7	4 5	* *	3 5	* *	3 3	8 5	* *	6 5	9 6	5 5	9 5	* *	9 9	9 6	9 8	* *	* *	9 6	9 9	* *	9 6
130	300	pre post	2 2	5 4	3 6	2 5	* *	3 5	* *	3 4	7 5	* *	6 5	9 7	4 5	9 6	* *	9 8	6 6	9 8	* *	* *	7 5	6 9	* *	8 6
131	300	pre post	0 1	0 1	2 3	2 4	* *	0 2	* *	2 1	1 2	* *	0 2	8 2	0 4	4 4	* *	7 7	0 4	8 7	* *	* *	0 4	5 5	* *	8 4
132	300	pre post	0 0	0 1	0 3	0 2	* *	3 2	* *	0 1	0 0	* *	0 1	3 2	0 3	0 3	* *	0 4	0 3	3 S	* *	* *	0 2	3 5	* *	5 5
133	400	pre post	5 3	5 4	* *	* *	5 5	7 6	* *	4 4	8 8	* *	* *	9 8	7 9	* *	* *	9 8	9 8	* *	* *	* *	9 9	9 9	* *	* *
134	400	pre post	3 2	4 3	* *	* *	3 2	4 6	* *	4 3	8 4	* *	* *	9 8	3 7	* *	* *	9 9	7 8	* *	* *	* *	6 9	4 9	* *	* *
135	300	pre post	6 4	7 6	* *	* *	5 4	4 6	* *	3 3	8 7	* *	8 6	9 7	3 6	8 7	* *	9 9	8 9	* *	* *	* *	8 7	9 9	* *	* *
136	300	pre post	6 5	8 6	* *	* *	5 5	4 6	* *	4 4	8 6	* *	8 7	8 7	1 6	9 8	* *	9 9	8 7	* *	* *	* *	6 8	9 8	* *	* *
137	300	pre post	0 0	0 1	* *	* *	0 1	0 1	* *	0 0	0 1	* *	0 0	0 0	0 1	0 1	5 *	0 2	0 2	* *	* *	* *	0 *	0 *	* *	* *
138	300	pre post	6 4	7 7	* *	* *	4 4	4 7	* *	3 3	8 6	* *	8 6	9 7	4 5	9 7	* *	9 9	9 8	* *	* *	* *	7 *	9 8	* *	* *

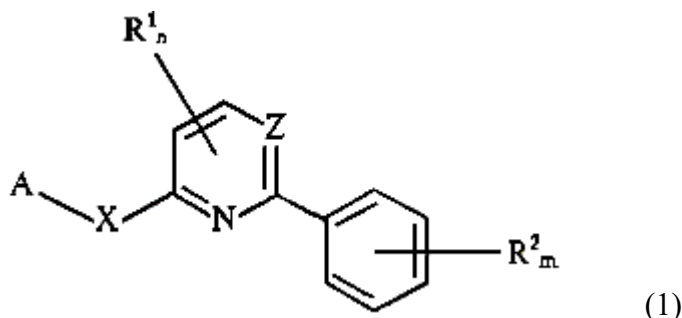
1	2	3	4	5	6	7	8	9	10	11	12	13	14	15	16	17	18	19	20	21	22	23	24	25	26	27
139	300	pre post	0 1	0 2	* *	* *	0 1	0 2	* *	0 0	0 1	* *	0 1	0 1	0 1	0 1	* 4	0 3	0 2	* *	* *	* *	0 2	0 4	* *	* *
140	300	pre post	4 3	5 4	5 5	* *	3 5	2 5	* *	2 3	8 7	* *	8 4	8 8	4 7	9 6	* *	9 9	9 8	9 6	* *	8 6	4 8	6 9	* *	8 9
141	300	pre post	1 2	4 3	2 9	* *	2 ?	1 4	* *	2 3	7 4	* *	8 3	9 5	1 5	9 5	* *	9 8	8 7	8 6	* *	5 6	2 5	4 9	* *	5 9
142	300	pre post	0 0	0 1	1 5	* *	0 0	1 4	* *	0 2	0 0	* *	1 1	5 1	1 2	4 3	* *	5 5	1 4	7 6	* *	0 5	0 3	1 5	* *	0 5
143	300	pre post	0 1	1 2	4 8	* *	2 0	2 3	* *	2 3	6 1	* *	5 2	8 3	3 6	9 5	* *	9 8	8 5	9 6	* *	8 7	4 6	5 7	* *	8 8
144	300	pre post	0 1	0 1	0 6	* *	0 0	2 3	* *	0 2	0 0	* *	0 1	3 1	0 4	* *	* *	4 6	4 3	4 5	* *	0 5	0 3	4 4	* *	3 6
145	300	pre post	0 1	0 2	2 8	* *	0 0	1 4	* *	1 3	2 1	* *	2 2	5 2	0 5	3 5	* *	6 7	3 5	6 6	* *	2 6	0 5	2 5	* *	5 8
146	300	pre post	0 0	0 0	0 4	0 5	* *	1 1	* *	0 4	7 5	* *	3 4	8 9	0 4	8 6	* *	9 7	4 4	8 7	* *	4 4	3 3	1 4	* *	9 4
147	300	pre post	0 0	1 0	0 4	0 5	* *	1 4	* *	0 1	5 4	* *	3 3	7 5	0 4	6 5	* *	9 6	3 4	7 5	* *	3 4	3 4	3 5	* *	9 4
148	300	pre post	0 0	0 0	0 3	0 4	* *	0 2	* *	0 2	1 1	* *	0 1	2 3	0 4	0 3	* *	8 4	0 3	8 6	* *	0 3	1 2	0 4	* *	9 4
149	300	pre post	0 0	0 0	3 0	0 4	* *	0 2	* *	0 2	0 0	* *	0 0	0 2	0 4	0 3	* *	2 5	1 4	5 4	* *	0 4	0 1	0 4	* *	8 4
150	300	pre post	2 2	4 4	4 6	2 5	* *	3 4	* *	4 4	8 6	* *	7 6	9 8	2 5	9 5	* *	9 7	9 7	9 7	* *	7 6	4 6	6 6	* *	9 7
151	300	pre post	0 0	0 1	0 4	2 5	* *	0 3	* *	0 3	4 2	* *	0 2	0 4	0 4	6 5	* *	8 6	2 4	9 7	* *	4 4	1 2	1 4	* *	9 6
152	300	pre post	3 2	4 4	5 6	4 6	* *	3 5	* *	4 5	8 8	* *	7 6	7 9	4 7	9 7	* *	9 7	8 7	9 7	* *	8 7	7 6	9 5	* *	8 7
153	300	pre post	1 4	3 4	3 5	0 6	* *	1 4	* *	3 4	8 6	* *	7 5	7 8	1 5	9 6	* *	9 8	8 5	9 6	* *	4 4	5 5	5 5	* *	9 5
154	300	pre post	4 5	5 6	4 *	2 *	* *	2 5	* *	4 7	8 *	* *	8 *	9 *	3 *	9 *	* *	9 *	9 *	9 *	* *	8 *	7 *	7 *	* *	9 *

1	2	3	4	5	6	7	8	9	10	11	12	13	14	15	16	17	18	19	20	21	22	23	24	25	26	27
155	300	pre post	3 1	4 5	4 6	1 6	* *	1 5	* *	3 6	8 6	* *	8 7	9 8	4 6	9 7	* *	9 7	8 5	9 7	* *	8 5	8 6	6 5	* *	9 5
156	300	pre post	2 0	2 1	0 4	0 5	* *	* 4	* *	0 4	6 5	* *	4 4	9 9	0 5	8 7	* *	9 7	4 4	9 6	* *	4 4	4 4	3 4	* *	9 5
157	300	pre post	1 4	3 4	2 6	1 5	* *	5 5	* *	5 5	5 5	* *	6 6	8 7	3 4	9 5	* *	9 9	8 6	9 8	* *	7 5	7 6	9 7	* *	9 6
158	300	pre post	3 4	4 5	3 5	2 5	* *	3 6	* *	5 5	5 8	* *	7 6	9 7	4 5	9 6	* *	9 9	9 6	9 8	* *	7 5	9 5	7 7	* *	9 6
159	300	pre post	0 2	0 2	0 5	0 4	* *	0 3	* *	0 3	3 3	* *	0 3	9 3	1 4	7 4	* *	8 9	4 5	8 8	* *	4 4	2 4	3 6	* *	9 5
160	300	pre post	0 0	0 1	1 4	0 3	* *	0 2	* *	2 2	2 3	* *	0 2	8 4	0 3	7 5	* 4	7 6	3 4	8 2	* *	2 5	2 4	4 6	* *	2 6
161	300	pre post	0 0	0 1	0 3	* *	0 0	1 2	* *	0 0	0 0	* *	0 0	0 1	0 0	0 1	* *	1 1	0 1	0 5	* *	0 1	0 1	0 3	* *	0 2
162	300	pre post	0 0	0 0	0 3	* *	0 0	0 2	* *	0 0	0 0	* *	0 0	0 0	0 1	0 1	* *	0 1	0 5	0 5	* *	0 0	0 0	0 2	* *	0 0
163	300	pre post	0 1	0 1	0 5	* *	0 0	0 4	* *	0 2	0 0	* *	0 0	3 2	1 2	0 3	* *	3 6	0 4	2 5	* *	0 3	0 2	2 4	* *	0 5
164	300	pre post	0 0	0 1	0 6	* *	2 0	0 4	* *	0 3	0 1	* *	0 1	5 1	0 2	6 4	* *	4 6	1 5	7 6	* *	1 3	0 3	1 5	* *	3 8
165	300	pre post	0 2	3 3	5 9	* *	2 0	2 6	* *	2 3	8 3	* *	8 2	9 5	4 8	9 6	* *	9 9	9 7	9 6	* *	8 6	4 7	6 9	* *	8 8
166	300	pre post	0 1	1 2	4 5	* *	2 2	1 7	* *	1 2	5 3	* *	7 3	5 4	2 6	5 5	* *	8 8	7 5	8 7	* *	6 4	2 6	4 5	* *	8 8
167	300	pre post	2 2	3 3	5 6	* *	4 5	2 6	* *	3 3	8 6	* *	8 6	9 8	2 5	8 7	* *	9 8	8 6	8 6	* *	8 4	4 6	9 5	* *	8 8
168	300	pre post	2 2	3 3	4 8	* *	0 2	3 7	* *	1 2	7 4	* *	5 4	8 5	1 5	5 5	* *	9 9	6 8	9 8	* *	5 6	4 5	3 8	* *	9 7
169	300	pre post	3 3	3 3	5 9	* *	5 5	2 6	* *	3 3	8 5	* *	6 5	9 6	1 5	9 4	* *	9 8	8 7	9 7	* *	5 5	4 6	6 6	* *	9 7

1	2	3	4	5	6	7	8	9	10	11	12	13	14	15	16	17	18	19	20	21	22	23	24	25	26	27
170	300	pre post	0 0	0 1	0 4	* *	0 0	0 5	* *	0 1	0 0	* *	0 0	2 0	0 1	0 1	* *	0 3	1 3	5 5	* *	0 3	0 9	2 4	* *	6 5
171	300	pre post	0 1	0 2	1 4	* *	0 0	0 4	* *	0 1	3 2	* *	2 2	6 3	0 4	0 2	* *	3 5	2 5	8 7	* *	0 4	0 4	1 4	* *	7 5
172	300	pre post	0 1	0 1	0 2	* *	* *	0 2	* *	0 1	0 1	* *	0 2	0 2	0 3	0 4	* *	2 5	2 3	4 5	* *	1 2	0 2	0 6	* *	4 4
173	300	pre post	1 2	3 3	6 6	* *	* *	2 7	* *	2 3	8 6	* *	8 6	9 7	6 6	8 7	* *	9 9	9 6	9 7	* *	8 6	5 6	8 8	* *	8 8
174	300	pre post	3 2	3 3	5 6	* *	0 4	3 7	* *	2 3	8 5	* *	5 5	8 5	4 5	8 4	* *	9 9	8 7	9 8	* *	6 6	4 5	6 8	* *	9 7
175	300	pre post	0 1	0 1	2 6	* *	0 1	1 7	* *	0 1	4 5	* *	1 5	7 5	0 5	2 4	* *	7 9	4 7	8 8	* *	1 6	0 5	0 8	* *	8 7
176	400	pre post	3 3	2 4	* *	* *	2 2	3 2	* *	2 2	7 4	* *	* *	8 6	3 8	* *	* *	9 8	8 7	* *	* *	* *	2 8	8 9	* *	* *
177	400	pre post	7 3	5 5	* *	* *	5 4	4 6	* *	4 4	8 6	* *	* *	9 7	5 7	* *	* *	9 9	* *	* *	* *	* *	6 7	9 6	* *	* *
178	400	pre post	2 1	2 3	* **	* *	2 4	1 4	* *	1 3	6 3	* *	* *	8 4	4 5	* *	* *	8 9	* *	* *	* *	* *	2 5	3 4	* *	* *
188	400	pre post	4 3	5 4	* *	* *	6 3	4 5	* *	5 3	9 7	* *	* *	9 8	8 9	* *	* *	9 9	9 8	* *	* *	* *	9 8	9 9	* *	* *
190	400	pre post	5 4	6 5	* *	* *	5 4	5 7	* *	5 3	9 8	* *	* *	9 9	9 9	* *	* *	9 9	9 8	* *	* *	* *	9 9	9 9	* *	* *
191	400	pre post	4 4	4 4	* *	* *	5 4	5 7	* *	4 3	9 8	* *	* *	9 8	8 9	* *	* *	9 9	9 8	* *	* *	* *	9 9	9 9	* *	* *
192	400	pre post	4 3	4 4	* *	* *	3 3	5 6	* *	4 2	8 7	* *	* *	9 8	7 9	* *	* *	9 9	8 8	* *	* *	* *	9 9	9 9	* *	* *
193	400	pre post	4 4	5 4	* *	* *	3 4	4 5	* *	4 3	8 8	* *	* *	9 9	7 8	* *	* *	9 8	8 7	* *	* *	* *	8 8	9 9	* *	* *

Формула изобретения

1. Дзамещенные азотсодержащие шестичленные гетероциклические соединения, в частности, 2,6-дзамещенные пиридины и 2,4-дзамещенные пиримидины общей формулы:



где А представляет необязательно замещенную арильную группу, или необязательно замещенную 5- либо 6-членную азотсодержащую гетероароматическую группу, или дифторбензодиоксилильную группу; m представляет собой целое число от 0 до 5; n представляет собой целое число от 0 до 2; R¹ (или каждый R¹), независимо, представляет атом водорода, атом галогена, необязательно замещенную группу алкил, алкенил, алкинил, алкокси, алкоксиалкокси, алкоксиалкил, диалкоксиалкил, алкилтио, amino, алкиламино, диалкиламино, алкоксиамино или формамидино; R² (или каждый R²), независимо, представляет атом водорода, галогена, необязательно замещенную группу алкил, алкенил, алкинил, алкокси, алкоксиалкил, алкоксиалкокси, алкилтио, алкилсульфинил, алкилсульфонил, или группу нитро, циано, галоидалкил, галоидалкокси, галоидалкилтио или пентагалоидсульфонил; X представляет собой атом кислорода или серы, и Z представляет атом азота или СН группу, при условии, что, если А представляет 1-метил-3-трифторметилпиразол-5-ильную группу, и равно 0, X представляет атом кислорода, и Z представляет группу СН, тогда R² не представляет водород или 3-трифторметил или 2,4-дхлор или 2,4-ди метил.

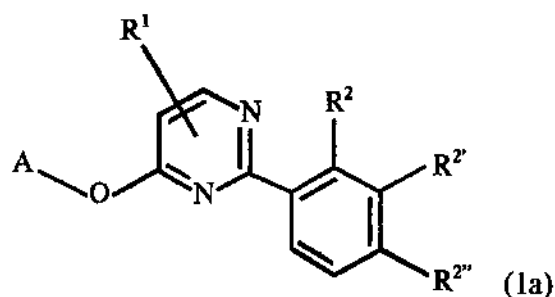
2. Соединение по п.1, выбранное из группы, содержащей соединения:

2 - (1' - метил- 3' -трифторметилпиразол-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)пиримидин,
 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 - метилпиримидин,
 2-(4' -фторфенил) -4 - (1'' - метил-3'' -трифторметилпиразол -5''- илокси)-6- метилпиримидин,
 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''- фторпирид-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''-трифторметилфенил.)-2-(3'-трифторметилфенил)пиридин,
 4-метил-6- (4''-трифторметоксифенил)-2-(1' -метил-3' - трифторметилпиразол-5' -илокси)пиридин,

4-метил-6-(4''-трифторметоксифенил)-2- (2'-хлорпирид-4'-илокси)пиридин,
 4- метил-6-(4''-трифторметилфенил) -2 - (1' - метил- 3' -трифторметилпиразол-5' - илокси)пиридин,
 4-метил-6-(4''-трифторметилфенил) -2 -(2' -хлорпирид-4' - илокси)пиридин,
 4-метил-6-(4''- фторфенил)-2-(1'-метил-3'-трифторметилпиразол-5'-илокси)пиридин,
 5,6-диметил-2 - (4' -трифторметоксифенил) - 4-(1''-метил-3''-трифторметилпиразол-5''-илокси)пиримидин,
 5,6-диметил-2-(4'- трифторметоксифенил) -4-(3'' - трифторметилфенокси)-пиримидин,
 5,6-диметил-2-(4'-трифторметилфенил)-4-(3''- трифторметилфенокси)пиримидин,
 5,6-диметил-4-(1''-метил-3''- трифторметилпиразол-5'' -илокси) -2 -(4' - трифторметилфенил)пиримидин,
 5-метил- 2-(3'-метилфенил)-4-(1''-метил-3''- трифторметилпиразол-5'' -илокси)пиримидин,
 5-метил-2-(3'-метилфенил)-4-(3''- трифторметилфенокси)пиримидин,
 5- метил-2-(4'-трифторметоксифенил)-4-(1''- метил-3''-трифторметилпиразол-5''-илокси)пиримидин,
 5-метил-2-(4' - трифторметоксифенил)-4-(3''- трифторметилфенокси)пиримидин,
 5- метил-2-(4'-трифторметилфенил)-4-(1''- метил-3'' - трифторметилпиразол-5''-илокси)пиримидин,
 5-метил-4-(3''- трифторметилфенокси)-2-(4' - трифторметилфенил)пиримидин,
 6-(4''- фторфенил)-2-(1'-метил-3' - трифторметилпиразол-5'-илокси)пиридин,
 6-метил-2 -(4' -трифторметоксифенил) -4- (1''-метил-3''-трифторметилпиразол-5''-илокси) пиримидин,
 6-метил-2-(4' - трифторметоксифенил) -4-(3'' - трифторметилфенокси)пиримидин, 6-метил-4-(3''-трифторметилфенокси)-2-(4' - трифторметилфенил)пиримидин, 6-метил- 2-(4'-трифторметилфенил)-4-(1''-метил- 3''-пентафторэтилпиразол-5'' - илокси)пиримидин,
 6-метил-2-(4' - цианофенил)-4-(1''-метил-3''- пентафторэтилпиразол-5''-илокси)пиримидин,
 6-метокси-2-(4' - цианофенил)-4-(1''-метил-3''- пентафторэтилпиразол-5'' - илокси)пиримидин,
 6-метил-4-(2'',2''- дифтор-1'',3''-бензодиоксол-4''-ил)-2-(4' - трифторметилфенил) пиримидин,
 6-этил-2- (4'-трифторметилфенил)-4-(1''-метил-3'' - трифторметилпиразол-5''-илокси) пиримидин,
 6-этил-2-(4' - трифторметилфенил)-4-(3''- трифторметилфенокси)пиримидин,
 6- метил-2 -(4' -метилсульфонилфенил) -4- (1'' - метил-3''-пентафторэтилпиразол-5''-илокси)пиримидин,
 6-этил-2-(4'-трифторметилфенил) -4-(2' -хлорпирид-4' - илокси))пиримидин,
 6-пропаргил-2-(4' - трифторметилфенил) -4-(1'' -метил-3'' - трифторметилпиразол-5''-илокси)пиримидин,
 6-метоксиметил-2-(4'-хлорфенил)- 4- (1'' -метил-3'' -трифторметилпиразол-5'' - илокси) пиримидин,
 6-метоксиметил-2- (4'-хлорфенил)-4-(3''- трифторметилфенокси) пиримидин,
 4-(3''- трифторметилфенокси)-2-(4' - трифторметилфенил)пиримидин,
 4-(1''- метил-3''-трифторметилпиразол-5''- илокси) -2 - (4' -трифторметилфенил) пиримидин,
 6-хлор-2-(4' - трифторметилфенил)-4-(1''-метил-3''- трифторметилпиразол-5''-илокси)пиримидин,
 6-бром-2-(4'-трифторметилфенил)-4-(1''-метил-3''- трифторметилпиразол-5''-илокси) пиримидин,
 6-хлор-2-(4''-хлорметилфенил)-4- (1''-метил-3''-трифторметилпиразол-5''-илокси) пиримидин,
 6-фтор-2-(4' - трифторметилфенил)-4-(1''-метил-3''-рифторметилпиразол-5''-илокси) пиримидин,

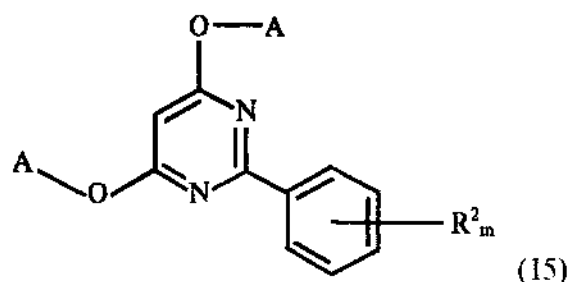
6-метокси-2-(4'-трифторметилфенил)-4-(3''-трифторметилфенокси) пиримидин,
 6-метокси-2-(4'-трифторметилфенил)-4-(1''-метил-3''-трифторметилпиразол-5''-илокси) пиримидин,
 6-метокси-2-(4'-трифторметилфенил)-4-(2'-хлорпирид-4'-илокси)пиримидин,
 5-метокси-2-(4'-трифторметилфенил)-4-(3''-трифторметилфенокси)пиримидин,
 5-метокси-2-(4'-трифторметилфенил)-4-(1''-метил-3''-трифторметилпиразол-5''-илокси) пиримидин,
 5-метокси-2-(4'-трифторметилфенил)-4-(2'-хлорпирид-4'-илокси)пиримидин,
 6-этиламино-2-(4'-трифторметилфенил)-4-(1''-метил-3''-трифторметилпиразол-5''-илокси)пиримидин,
 6-метоксиамино-2-(4'-хлорфенил)-4-(1''-метил-3''-трифторметилпиразол-5''-илокси)пиримидин и 6-винил-2-(4'-трифторметилфенил)-4-(1''-метил-3''-трифторметилпиразол-5''-илокси)пиримидин.

3. Соединения формулы:



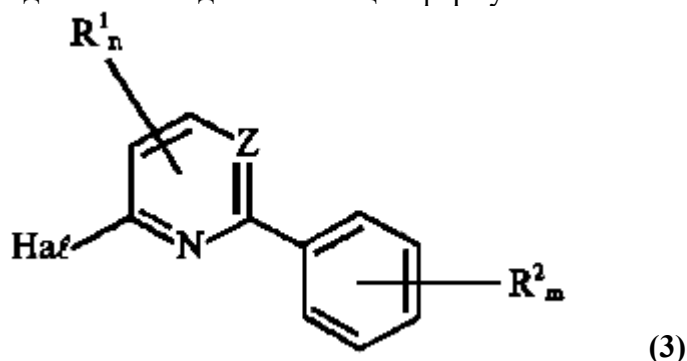
где А представляет 3-трифторметилфенил, 2-хлорпирид-4-ил, 2-трифторметилпирид-4-ил, 2-дифторметоксипирид-4-ил или 1-метил-3-трифторметилпиразол-5-ил, R¹ имеет значения, указанные выше; R², R^{2'} и R^{2''}, независимо, представляют атом водорода, атом фтора, хлора или брома, один или два из них также представляют трифторметил, трифторметокси или цианогруппу, R^{2''}, кроме того, может быть C₁-C₄-алкильной группой, в частности, третбутильной.

4. Соединения общей формулы:



где А, R² и m определены в п.1.

5. Способ получения дизамещенных азотсодержащих шестичленных гетероциклических соединений общей формулы 1, отличающийся тем, что осуществляют взаимодействие соединения общей формулы:

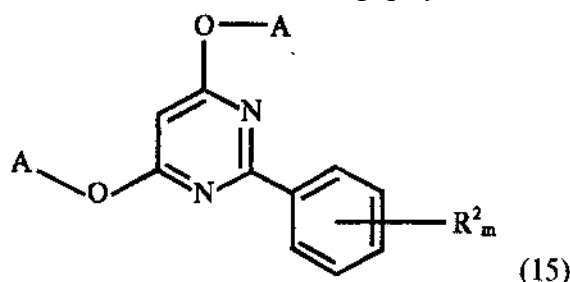


с соединением общей формулы:

$$A - XM \quad (4)$$

где Z, A, R¹, R², m, n и X определены в п.1, Na представляет атом галогена и M представляет атом металла.

6. Способ получения дизамещенных азотсодержащих шестичленных гетероциклических соединений общей формулы 1, отличающийся тем, что осуществляют взаимодействие соединения общей формулы:



с соединением общей формулы R¹ - H или его соли с металлом, где A, m и R² определены в и. 1, а R¹ является необязательно замещенным алкокси, алкоксиалкокси, алкилтио, amino, алкиламино, диалкиламино или алкоксиамино.

7. Способ получения 2,4,6-тризамещенных пиримидинов общей формулы 15, указанных в п.4, отличающийся тем, что осуществляют взаимодействие соединения общей формулы 3 с соединением общей формулы 4, где A, R², m и X определены в п. 1, Na представляет атом галогена, M представляет атом металла, R¹ представляет Na, n равно 1, Z является азотом и R¹ находится в 6 положении пиримидинового кольца.

8. Гербицидная композиция, содержащая активное соединение и носитель и/или поверхностно-активный агент, отличающаяся тем, что в качестве активного соединения используют эффективное количество, по меньшей мере, одного соединения, заявленного в пп.1-3.

9. Способ борьбы с нежелательной растительностью на локусе, включающий обработку этого локуса эффективным количеством активного соединения, отличающийся тем, что в качестве активного соединения используют эффективное количество, по меньшей мере, одного соединения, указанного в пп. 1-3.

10. Соединение формулы 1 и 1a по пп. 1-3, отличающееся тем, что они обладают гербицидной активностью.

Составитель описания
Ответственный за выпуск

Сыдыков Д.Д.
Арипов С.К.