

(19)



Евразийское
патентное
ведомство

(21)

199800478

(13)

A1

(12)

ОПИСАНИЕ ИЗОБРЕТЕНИЯ К ЕВРАЗИЙСКОЙ ЗАЯВКЕ

(43)

Дата публикации заявки:
1998.12.24

(51)⁶

C 07D 47/04

A 01N 43/90

C 07D 487/04, 213/71, 471/04,

249/00, 221/00, 487/04, 239/00

(22)

Дата подачи заявки:
1997.09.23

(54)

N-([1,2,4]ТРИАЗОЛАЗИНИЛ)БЕНЗОЛСУЛЬФОНАМИДЫ И ПИРИДИНСУЛЬФОНАМИДЫ И ИХ ПРИМЕНЕНИЕ В КАЧЕСТВЕ ГЕРБИЦИДОВ

Приоритетные данные:

(31)

60/026,556

(32)

1996.09.24

(33)

US

(86)

PCT/US 97/16867

(87)

WO 98/13367 1998.04.02

(71)

Заявитель:

ДАУ АГРОСАЙЕНСЕСЗ ЛЛС
(US)

(72)

Изобретатель:

Джонсон Тимоти К., Эш Мэри Л., Эр Роберт Дж., Джонстон Ричард Д., Клещик Уильям Э., Мартин Тимоти П., Манн Ричард К., Побанц Марк Э., Ван Хиртум Джон К. (US),

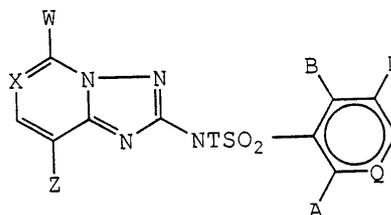
(74)

Представитель:

Медведев В.Н. (RU)

(57)

N-(триазазинил)арилсульфонамиды, такие как 2,6-диметокси-N-(8-хлор-5-метокси[1,2,4]триазол[1,5-с]пиримидин-2-ил)бензолсульфонамид; 2-метокси-4-(трифторметил)-N-(5,8-диметокси-[1,2,4]триазол[1,5-с]пиримидин-2-ил)пиридин-3-сульфонамид и 2-метокси-6-метоксикарбонил-N-(5,8-диметокси[1,2,4]триазол[1,5-а]пиридин-2-ил)бензолсульфонамид были получены из соответствующих замещенных 2-амино[1,2,4]триазол[1,5-с]пиримидинов и 2-амино[1,2,4]триазол[1,5-с]пиридинов и соответствующих замещенных бензолсульфонилхлоридов и пиридин-3-сульфонилхлоридов. Установлено, что эти соединения полезны для использования в качестве гербицидов.



Международная заявка была опубликована вместе с отчетом о международном поиске.

199800478

A1

A1

199800478

**N- ([1, 2, 4] ТРИАЗОЛАЗИНИЛ) БЕНЗОЛСУЛЬФОНАМИДЫ И
ПИРИДИНСУЛЬФОНАМИДЫ И ИХ ПРИМЕНЕНИЕ В КАЧЕСТВЕ
ГЕРБИЦИДОВ**

Описание

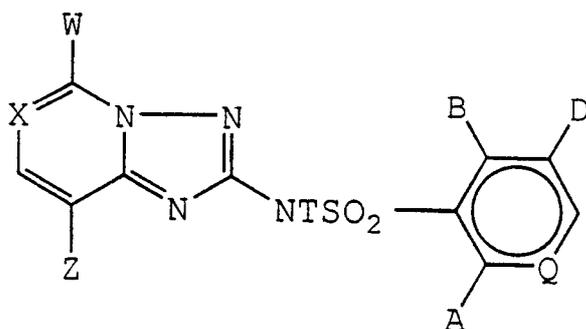
Изобретение относится к замещенным бензолсульфонамидам и пиридинсульфонамидам, к содержащим их гербицидным композициям и к использованию этих соединений для борьбы с нежелательной растительностью.

Борьба с нежелательной растительностью посредством химических средств, т.е. гербицидов, является важным аспектом современного сельского хозяйства и землепользования. Хотя известно большое количество химикатов, полезных для борьбы с нежелательной растительностью, новые соединения, которые как правило являются более эффективными, оказывают больший эффект для конкретного вида растений, наносят меньший ущерб культурам, более безопасны для человека и окружающей среды, приводят к меньшим затратам при использовании, либо имеют другие преимущества.

Известно большое количество замещенных бензолсульфонамидов и известно, что некоторые из них обладают гербицидной активностью. Например, некоторые N-([1, 2, 4] триазол[1, 5-а] пиримидин-2-ил)бензолсульфонамиды и их использование в качестве гербицидов были раскрыты в патенте США 4 638 075, а некоторые N-([1, 2, 4] триазол[1, 3, 5]-триазин-2-ил)бензолсульфонамиды были раскрыты в патенте США 4 685 958. Кроме того, известно, что некоторые известные N-фениларилсульфонамиды также обладают гербицидной активностью. Например, некоторые N-(фенилзамещенные) [1, 2, 4] триазол[1, 5-с] пиримидин-2-сульфонамиды были раскрыты в патенте США 5 163 995, а некоторые N-(фенилзамещенные)-[1, 2, 4] триазол[1, 5-а] пиридин-2-сульфонамиды были раскрыты в патенте США 5 571 775, выданном 5 ноября 1996 года.

Установлено, что класс новых N-(триазолазинил)арилсульфонамидов, включающих N-([1,2,4]триазол[1,5-с]пиримидин-2-ил)бензолсульфонамид, N-([1,2,4]триазол[1,5-с]пиримидин-2-ил)пиридинсульфонамид, N-([1,2,4]триазол[1,5-а]пиридин-2-ил)бензолсульфонамид и N-([1,2,4]триазол[1,5-а]пиридин-2-ил)пиридинсульфонамид, относится к потенциальным гербицидам, используемым для борьбы с нежелательной растительностью в условиях либо довсходовой, либо послевсходовой обработки. Многие из этих соединений обладают требуемой селективностью по отношению к ценным культурам и благоприятными токсикологическими свойствами и не оказывают отрицательного воздействия на окружающую среду.

Изобретение включает N-(триазолазинил)арилсульфонамиды формулы I



где

X представляет собой N или C-Y;

W представляет собой O(C₁-C₃алкил), Cl, Br, F или H;

Y представляет собой H, OCH₃, F, Cl, Br, I или CH₃, необязательно содержащий в качестве заместителей до трех атомов фтора;

Z представляет собой O(C₁-C₃алкил), H, F, Cl, Br, I, S(C₁-C₃алкил) или CH₃, необязательно содержащий в качестве заместителей до трех атомов фтора; при условии, что, по крайней мере, один из **W** и **Z** представляет собой O(C₁-C₃алкил);

Q представляет собой C-H или N;

A представляет собой F, Cl, Br, I или CO₂(C₁-C₄алкил), или представляет собой (C₁-C₃алкил), O(C₁-C₄алкил), O(C₃-C₄алкенил), O(C₃-C₄алкинил) или S(C₁-C₃алкил), каждый из которых необязательно замещен одним заместителем, представляющим собой O(C₁-C₃-

алкил), $S(C_1-C_3\text{алкил})$, хлор, бром или циано, или атомами фтора до максимально возможного их количества, или представляет собой фрагмент 2-метил-1,3-диоксолан-2-ила, и когда **Q** представляет собой N, H ;

B представляет собой $H, F, Cl, Br, I, NO_2, CN, CO_2(C_1-C_4\text{-алкил}), NH(C_1-C_3\text{алкил})$ или $N(C_1-C_3\text{алкил})_2$, или представляет собой $(C_1-C_3\text{алкил}), O(C_1-C_4\text{алкил}), O(C_3-C_4\text{алкенил}), O(C_3-C_4\text{алкинил})$ или $S(C_1-C_3\text{алкил}), SO(C_1-C_3\text{алкил}), SO_2(C_1-C_3\text{алкил}), S(C_3-C_4\text{алкенил}), SO(C_3-C_4\text{алкенил}), SO_2(C_3-C_4\text{алкенил}), S(C_3-C_4\text{алкинил}), SO(C_3-C_4\text{алкинил})$ или $SO_2(C_3-C_4\text{алкинил})$, каждый из которых необязательно замещен одним заместителем, представляющим собой $O(C_1-C_3\text{алкил}), S(C_1-C_3\text{алкил})$, хлор, бром или циано, или атомами фтора до максимально возможного их количества; при условии, что **A** и **B** одновременно не являются водородом;

D представляет собой $H, F, Cl, Br, I, (C_1-C_3\text{алкил}), OCH_3, OC_2H_5, CH_2F, CHF_2$, или CF_3 ; или **B** и **D**, взятые вместе, представляют фрагмент формулы $O-CH_2-O$, необязательно замещенный одним или двумя атомами F или CH_3 ;

T представляет собой $H, SO_2R, C(O)R, C(O)OR, C(O)NR'_2$ или $CH_2CH_2C(O)OR$;

R представляет собой $C_1-C_4\text{алкил}, C_3-C_4\text{алкенил}$ или $C_3-C_4\text{-алкинил}$, каждый из которых необязательно имеет до двух заместителей, представляющих собой хлор, бром, $O(C_1-C_4\text{алкил})$ или фенил, и необязательно замещен атомами фтора до максимально возможного их количества; и

R' представляет собой $H, C_1-C_4\text{алкил}, C_3-C_4\text{алкенил}$ или $C_3-C_4\text{-алкинил}$;

и когда **T** представляет собой H , их сельскохозяйственно приемлемые соли.

Соединения, где **X** представляет собой каждый из N и $C-H$, и соединения, где **Q** представляет собой каждый из N и $C-H$, находятся среди предпочтительных соединений настоящего изобретения. Многие из предпочтительных соединений настоящего изобретения имеют метокси-заместитель в положении 5 (**W**) и метокси или

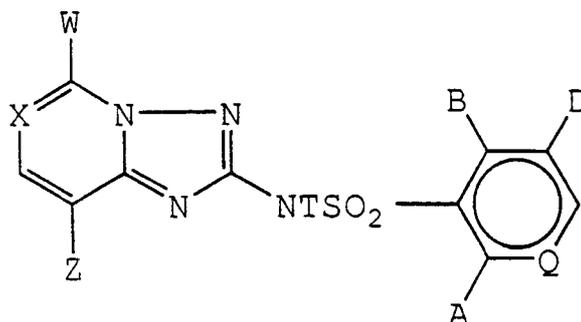
галоген в положении 8 (Z) триазазинового кольца. Некоторые из предпочтительных соединений дополнительно имеют орто-метокси-заместитель (A или B) в сочетании с множеством заместителей в другом орто-положении (A или B) и водородом в мета-положении; орто-метокси-заместитель (A) в сочетании с водородом или метаметилом или хлором (D) и не имеют заместителей в другом орто-положении (B); орто-трифторметильный заместитель (B) в сочетании с множеством заместителей в другом орто-положении (A) и водородом в мета-положении.

Изобретение дополнительно включает композиции, содержащие гербицидные количества соединений формулы I в сочетании с одним и более сельскохозяйственно приемлемыми наполнителями или носителями и применение соединений формулы I в качестве гербицидов. Применение подходящих соединений, заявленных в настоящем изобретении, для достижения полного или селективного уничтожения растительности или селективной борьбы с сорняками в посевах пшеницы, риса, рапсовых масличных культур, как правило, является предпочтительным. Уничтожению подвергаются как травянистые, так и широколиственные сорняки. Послевсходовая обработка нежелательной растительности этими соединениями, как правило, является предпочтительной.

Производные N-(триазазинил)арил-сульфонамидов, заявленные в настоящем изобретении, в общем виде могут быть представлены в виде соединений, включающих N-([1,2,4]триазол-[1,5-с]пиримидин-2-ил)бензолсульфонамид, N-([1,2,4]триазол[1,5-с]пиримидин-2-ил)пиридин-3-сульфонамид, N-([1,2,4]триазол[1,5-а]пиридин-2-ил)бензолсульфонамид и N-([1,2,4]триазол[1,5-а]пиридин-2-ил)пиридин-3-сульфонамид. Они могут быть определены как замещенные бензолсульфонамиды и пиридин-3-сульфонамиды, имеющие на амидном атоме азота фрагмент замещенного [1,2,4]триазол[1,5-с]пиримидин-2-ила или замещенного [1,2,4]триазол[1,5-а]пиридин-2-ила.

Гербицидные соединения, заявленные в настоящем изобретении, представляют собой N-(триазазинил)арилсульфонамиды

формулы I



Те соединения, у которых **X** представляет собой N, содержат фрагмент замещенного N-([1,2,4]триазол[1,5-с]пиримидин-2-ила), а те соединения, у которых **X** представляет собой C-Y, содержат фрагмент замещенного N-([1,2,4]триазол[1,5-а]пиримидин-2-ила). Соединения, у которых **Q** представляет собой N, относятся к пиридинсульфонамидам, а соединения, у которых **Q** представляет собой C-H, относятся к бензолсульфонамидам. Эти соединения дополнительно характеризуются наличием C₁-C₃алкокси-заместителя в одном или в обоих положениях 5 и 8 (соответственно, W и Z) триазолазинового кольца и наличием, по крайней мере, одного орто-заместителя (A) на фенильном или пиридиновом кольце.

Соединения, заявленные в настоящем изобретении, включают соединения формулы I, где **X** представляет собой N или C-Y (где Y представляет собой водород, галоген, метокси или метил, необязательно содержащий в качестве заместителей до трех атомов фтора). Соединения формулы I, где **X** представляет собой N, часто являются предпочтительными. Однако соединения, где **X** представляет собой C-H, иногда также являются предпочтительными. Заявленные соединения включают соединения формулы I, где **Q** представляет собой N или C-H. Каждый из этих двух вариантов является предпочтительным. Во многих случаях соединения, где **X** представляет собой N и **Q** представляет собой C-H, являются предпочтительными, в других случаях предпочтительными являются соединения, в которых **X** и **Q** оба представляют N. С другой стороны, в некоторых случаях предпочтительны соединения, где **X**

представляет С-У и Q представляет собой С-Н.

Триазолазиновое кольцо соединений формулы I является, по крайней мере, монозамещенным. Заявленные соединения включают и те, где W представляет собой метокси, этокси, пропокси, 1-метилэтокси, циклопропокси, фтор, хлор, бром или водород, и где Z представляет метокси, этокси, пропокси, 1-метилэтокси, циклопропокси, метилтио, этилтио, 1-метилэтилтио, циклопропилтио, водород, фтор, хлор, бром, иод или метил, необязательно содержащий в качестве заместителей до трех атомов фтора, при условии, что по крайней мере один из W и Z представляет собой один из указанных алкокси-заместителей. Соединения, где один из W и Z представляет собой алкокси, а другой представляет фтор, хлор, бром, метил, метокси или этокси, и X представляет собой N или С-Н, часто являются предпочтительными. Те соединения, где один или оба W и Z представляют собой метокси, часто являются более предпочтительными. Соединения формулы I, где W представляет собой метокси, и Z представляет метокси, хлор или бром, часто являются наиболее предпочтительными. Те соединения, где X представляет собой N, иногда представляют особый интерес, также как и те соединения, где X представляет собой С-Н и Z конкретно представляет метокси.

Соединения формулы I, где Q представляет собой С-Н, включают те соединения, где A представляет галоген или (C₁-C₄-алкокси)карбонил, или представляет C₁-C₃алкил, C₁-C₄алкокси, C₃-C₄алкенокси, C₃-C₄алкинокси или C₁-C₃алкилтио, каждый из которых необязательно замещен одним заместителем, представляющим собой C₁-C₃алкокси, C₁-C₃алкилтио, хлор, бром или циано, или атомами фтора до максимально возможного их количества. Кроме того, он может представлять собой фрагмент 2-метил-1,3-диоксолан-2-ила. В тех случаях, когда Q представляет собой N, соединения формулы I включают те соединения, где A представляет собой водород. Метокси, этокси, пропокси, 1-метилэтокси, метоксиметокси, 2-фторэтокси, 2-хлорэтокси, 2,2-дифторэтокси, 1-(фторметил)-2-фторэтокси, трифторметокси, хлор и фтор часто являются предпоч-

тительными. Метокси, этокси, пропокси или 1-метилэтокси, метоксиметокси, метоксиэтокси, 2-фторэтокси, 2-хлорэтокси, 2,2-дифторэтокси и 1-(фторметил)-2-фторэтокси часто являются более предпочтительными. Метокси-заместитель иногда представляет особый интерес.

Соединения формулы I дополнительно включают те соединения, где **В** представляет собой водород, галоген, нитро, циано, (C₁-C₄-алкокси) карбонил, C₁-C₃алкиламино, ди(C₁-C₃алкил)амино или представляет C₁-C₃алкил, C₁-C₄алкокси, C₃-C₄алкенокси, C₃-C₄алкинокси, C₁-C₃алкилтио, C₁-C₃алкансульфинил, C₁-C₃алкансульфонил, C₃-C₄-алкенилтио, C₃-C₄алкенсульфинил, C₃-C₄алкенсульфонил, C₃-C₄-алкин-илтио, C₃-C₄алкинсульфинил, C₃-C₄алкинсульфонил, каждый из которых необязательно замещен одним заместителем, представляющим собой C₁-C₃алкокси, C₁-C₃алкилтио, хлор, бром или циано, или атомами фтора до максимально возможного их количества. Те соединения, где **Q** представляет собой N, и **А** и **В** оба представляют водород, исключаются из заявляемых. Таким образом, независимо от того, представляет ли **Q** азот (N) или группу C-H, по крайней мере один из **А** и **В** представляет собой заместитель, отличный от водорода. Такие заместители, как водород, метокси, этокси, пропокси, 1-метилэтокси, метоксиметил, метилтио, метил, трифторметил, трифторметокси, хлор, фтор и метоксикарбонил часто являются предпочтительными заместителями для **В**. Водород, метокси, этокси, пропокси, 1-метилэтокси, метоксиметил, трифторметил, хлор, фтор или метоксикарбонил, как правило, являются более предпочтительными заместителями в тех случаях, когда **Q** представляет собой группу C-H и водород, а такие заместители, как метокси, этокси, пропокси, 1-метилэтокси, трифторметил и метоксикарбонил более предпочтительны в тех случаях, когда **Q** представляет собой N. Метокси и трифторметил часто являются, независимо друг от друга, заместителями для **В**, которые представляют особый интерес.

Соединения, заявленные в настоящем изобретении, дополнительно включают соединения, где **Д** представляет собой водород,

галоген, метил, этил, 1-метилэтил, пропил, метокси, этокси, фторметил, дифторметил или трифторметил. Они также дополнительно включают соединения, где **B** и **D** вместе представляют фрагмент метилendiокси, необязательно замещенный одним или двумя атомами фтора или метильными группами. Соединения, где **D** представляет водород, фтор, бром, хлор или метил, являются, как правило, предпочтительными. Соединения, где **D** представляет водород, хлор или метил, часто являются более предпочтительными в тех случаях, когда **Q** представляет собой группу C-N, тогда как те соединения, где **D** представляет водород или метил, обычно являются более предпочтительными в тех случаях, когда **Q** представляет собой N.

Соединения формулы I, где **A** представляет собой метокси, этокси, пропокси, 1-метилэтокси, метоксиметокси, метоксиэтокси, 2-фторэтокси, 2-хлорэтокси, 2,2-дифторэтокси, 1-(фторметил)-2-фторэтокси, трифторметокси, хлор или фтор; **B** представляет собой водород, метокси, этокси, пропокси, 1-метилэтокси, метоксиметил, метилтио, метил, трифторметил, трифторметокси, хлор, фтор или метоксикарбонил; и **D** представляет водород, хлор, фтор, бром или метил, часто являются предпочтительными. Такие соединения, где **B** представляет собой метокси и **D** представляет водород; где **A** представляет метокси и **D** представляет водород, метил или хлор; и где **B** представляет собой трифторметил и **D** представляет водород, часто представляют особый интерес.

Соединения формулы I, где **Q** представляет собой C-N и один или оба **B** и **D** представляют собой водород, часто являются предпочтительными. Соединения, где **Q** представляет собой C-N и **A** представляет собой метокси, этокси, пропокси или 1-метилэтокси, метоксиметокси, метоксиэтокси, 2-фторэтокси, 2-хлорэтокси, 2,2-дифторэтокси или 1-(фторметил)-2-фторэтокси; **B** представляет собой водород, метокси, этокси, пропокси, 1-метилэтокси, метоксиметил, трифторметил, фтор, хлор или метоксикарбонил; и **D** представляет водород, хлор или метил, часто являются более предпочтительными. Такие соединения, где **D** представляет водород

и либо **A** и **B** каждый представляет собой метокси, либо **A** представляет собой метокси, а **B** представляет трифторметил или метоксикарбонил, иногда представляют интерес независимо друг от друга. Соединения, где **Q** представляет собой C-N и **A** представляет собой метокси, этокси, пропокси или 1-метилэтокси, **B** представляет водород и **D** представляет собой хлор или метил, иногда являются предпочтительными.

Соединения формулы I, где **Q** представляет собой N и **A** представляет собой метокси, этокси, пропокси, 1-метилэтокси, метоксиметокси, метоксиэтокси, 2-фторэтокси, 2-хлорэтокси, 2,2-дифторэтокси или 1-(фторметил)-2-фторэтокси; **B** представляет собой водород, метокси, этокси, пропокси, 1-метилэтокси, трифторметил или метоксикарбонил; и **D** представляет водород или метил, как правило являются предпочтительными. Соединения, где **B** представляет собой трифторметил и **A** представляет собой метокси, этокси, пропокси, 1-метилэтокси, метоксиметокси, метоксиэтокси, 2-фторэтокси, 2-хлорэтокси, 2,2-дифторэтокси или

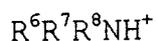
1-(фторметил)-2-фторэтокси и **D** представляет водород, обычно являются более предпочтительными.

Соединения формулы I включают те соединения, где **T** представляет водород, алкилсульфонил (SO_2R), ацил ($\text{C}(\text{O})\text{R}$), алкоксикарбонил ($\text{C}(\text{O})\text{OR}$), аминокарбонил ($\text{C}(\text{O})\text{NR}'_2$) или 2-(алкоксикарбонил)этил ($\text{CH}_2\text{CH}_2\text{C}(\text{O})\text{OR}$), где R представляет собой C_1 - C_4 -алкил, C_3 - C_4 -алкенил или C_3 - C_4 -алкинил, каждый из которых необязательно имеет до двух заместителей, представляющих собой хлор, бром, C_1 - C_4 -алкокси или фенил, и необязательно замещен атомами фтора до максимально возможного их количества, и R' представляет собой H, C_1 - C_4 -алкил, C_3 - C_4 -алкенил или C_3 - C_4 -алкинил. Соединения, где **T** представляет собой H, являются предпочтительными. Изобретение дополнительно включает сельскохозяйственно приемлемые соли соединений формулы I, где **T** представляет собой водород.

Соединения формулы I, которые обладают каждой из возможных комбинаций, включающих предпочтительные, более предпочтительные, наиболее предпочтительные, желательные и представляющие особый интерес заместители, рассматриваются как важные примеры осуществления настоящего изобретения.

Термины "алкил", "алкенил" и "алкинил" (включая их модификации в виде галогеналкила и алкокси) в том виде, как они используются в настоящем изобретении, включают прямые, разветвленные и циклические группы. Следовательно, к типичным алкильным группам относятся метил, этил, 1-метилэтил, пропил, 1,1-диметилэтил и циклопропил. Метил и этил часто являются предпочтительными. Алкильные группы иногда называют в описании нормальными, изо- или вторичными группами (соответственно, с приставкой "н-", "изо-" или "втор-"). Типичный алкил, содержащий в качестве заместителя атомы фтора до максимально возможного их количества, включает трифторметил, монофторметил, 2,2,2-трифторэтил, 2,3-дифторпропил и им подобные; трифторметил часто является предпочтительным. Термин "галоген" включает фтор, хлор, бром и иод.

Используемый в описании термин "сельскохозяйственно приемлемые соли" относится к соединениям, где кислый сульфонамидный протон соединения формулы I замещен на катион, который сам по себе не оказывает гербицидного действия на обрабатываемые культуры и не является заметно губительным для специалиста-обработчика, окружающей среды или конечного пользователя обработанной культуры. Подходящие катионы включают, например, катионы щелочных и щелочно-земельных металлов и катионы аммония и аминов. Предпочтительные катионы включают катионы натрия, калия, магния и аммония формулы



где R^6 , R^7 и R^8 независимо представляют водород или (C_1-C_{12}) алкил, (C_3-C_{12}) циклоалкил или (C_3-C_{12}) алкенил, каждый из которых необязательно замещен одним или более гидроксигруппами, (C_1-C_8) алкокси, (C_1-C_8) алкилтио или фенилом; при условии, что R^6 , R^7 и R^8 стерически совместимы. Кроме того, два из R^6 , R^7 и R^8 , взятые вместе, могут представлять собой алифатический бифункциональный фрагмент, содержащий от 1 до 12 атомов углерода и до двух атомов кислорода или серы. Соли соединений формулы I можно получить обработкой соединений формулы I, где V представляет собой водород, гидроксидом металла, например, гидроксидом натрия, калия или магния, или амином, например аммиаком, триметиламином, гидроксиэтиламином, бис-аллиламином, 2-бутоксипропиламином, морфолином, циклододециламином или бензиламином.

Соединения из Таблицы 1 являются представителями соединений, заявленных в настоящем изобретении. Некоторые из особо предпочтительных соединений формулы I, которые отличаются разнообразием в зависимости от вида сорных растений, подлежащих уничтожению, вида сельскохозяйственной культуры (если она присутствует) и других факторов, включают следующие соединения из Таблицы 1: 1, 2, 10, 13, 14, 15, 18, 21, 23, 26, 27, 28, 32, 34, 36, 37, 38, 39, 41, 43, 46, 50, 52, 53, 54, 55, 60, 63, 65, 77, 80, 81, 92, 95, 96, 98, 105, 106, 109, 120, 122, 126, 139, 142, 167, 177, 184, 185, 187, 188, 190, 194, 195, 203, 208, 210

и 220. Следующие соединения иногда являются более предпочтительными:

2-метокси-6-(трифторметил)-N-(8-хлор-5-метокси[1,2,4] триазол[1,5-с]-пиримидин-2-ил) бензолсульфонамид (соединение 34),

2,6-диметокси-N-(5,8-диметокси[1,2,4] триазол[1,5-с] пиримидин-2-ил) бензолсульфонамид (соединение 36),

2-метокси-6-метоксикарбонил-N-(5,8-диметокси[1,2,4] триазол[1,5-а] пиридин-2-ил) бензолсульфонамид (соединение 98),

2-метокси-5-метил-N-(5,8-диметокси[1,2,4] триазол[1,5-с] пиримидин-2-ил) бензолсульфонамид (соединение 105),

5-хлор-2-метокси-N-(5,8-диметокси[1,2,4] триазол[1,5-с] пиримидин-2-ил) бензолсульфонамид (соединение 106) и

2-метокси-6-(трифторметил)-N-(5,8-диметокси[1,2,4] триазол[1,5-с] пиримидин-2-ил) пиридин-3-сульфонамид (соединение 142),

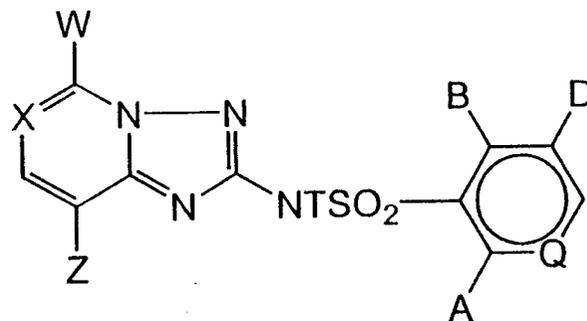
2-(2-фторэтоксид)-6-(трифторметил)-N-(5,8-диметокси[1,2,4]-триазол[1,5-с] пиримидин-2-ил) бензолсульфонамид (соединение 167)

2-(2-хлорэтоксид)-6-(трифторметил)-N-(5,8-диметокси[1,2,4]-триазол[1,5-с] пиримидин-2-ил) бензолсульфонамид (соединение 203)

2-(2,2-дифторэтоксид)-6-(трифторметил)-N-(5,8-диметокси[1,2,4] триазол[1,5-с] пиримидин-2-ил) бензолсульфонамид (соединение 190) и

2-(1-фторметил-2-фторэтоксид)-6-(трифторметил)-N-(5,8-диметокси[1,2,4] триазол[1,5-с] пиримидин-2-ил) бензолсульфонамид (соединение 187).

ТАБЛИЦА 1 ПРОИЗВОДНЫЕ СУЛЬФОНАМИДА



Соед. №	X	W	Z	T	Q	A	B	D	Форма	Темп. плавл. °C	Элем. анализ		
											Выч./найдено	%C	%H
1	N	OCH ₃	F	H	C-H	Cl	H	H	белый порошок	184-185	40.3 40.4	2.54 2.43	19.6 19.4
2	N	OCH ₃	F	H	C-H	F	H	H	белый порошок	226-228	42.2 42.4	2.66 2.43	20.5 20.2
3	N	OCH ₃	F	H	C-H	CO ₂ CH ₃	H	H	белый порошок	175-177	44.1 43.9	3.17 2.96	18.4 18.2
4	N	OCH ₃	F	H	C-H	CF ₃	H	H	белый порошок	185-187	39.9 40.2	2.32 2.19	17.9 17.7
5	N	OCH ₃	F	H	C-H	OCH ₃	H	H	рыж.-корич. пор.	197-198	44.2 43.9	3.42 3.67	19.8 19.8
6	N	OCH ₃	OCH ₃	H	C-H	Cl	H	H	белый порошок	211-214	42.2 42.0	3.27 3.23	18.9 18.4
7	N	OCH ₃	OCH ₃	H	C-H	F	H	H	белый порошок	240-241 (разл.)	44.2 43.7	3.42 3.30	19.8 19.2
8	N	OCH ₃	OCH ₃	H	C-H	CO ₂ CH ₃	H	H	белый порошок	189-191	45.8 46.0	3.84 3.75	17.8 17.0

9	N	OCH ₃	OCH ₃	H	C-H	CF ₃	H	H	белый порошок	189-191	39.9	3.09	17.9
											43.3	3.22	16.5
10	N	OCH ₃	OCH ₃	H	C-H	OCH ₃	H	H	рыж-кор порошок	231-233	46.0	4.14	19.2
											46.2	4.00	19.0
11	N	OCH ₃	OCH ₃	H	C-H	CH ₃	H	H	белый порошок	188-191	48.1	4.33	20.1
											49.0	4.28	19.3
12	N	OCH ₃	OCH ₃	H	C-H	OCF ₃	H	H	белый порошок	179-181	40.1	2.88	16.7
											39.8	2.65	16.7
13	N	OCH ₃	OCH ₃	H	C-H	OC ₂ H ₅	H	H	белый порошок	224-226	47.5	4.52	18.5
											47.1	4.67	18.5
14	N	OCH ₃	OCH ₃	H	C-H	OC ₃ H ₇ (n)	H	H	рыж-кор порошок	222-224	48.9	4.87	17.8
											48.8	4.93	17.6
15	N	OCH ₃	OCH ₃	H	C-H	OC ₃ H ₇ (i)	H	H	рыж-кор порошок	172-174	48.9	4.87	17.8
											48.9	5.09	17.6
16	N	OCH ₃	OCH ₃	H	C-H	OCF ₂ CF ₂ H	H	H	белый порошок	155-157	39.9	2.90	15.5
											39.8	2.73	15.2
17	N	OCH ₃	OCH ₃	H	C-H	SCH ₃	H	H	белый порошок	213-215	44.1	3.96	18.4
											43.8	4.17	18.1
18	N	OCH ₃	I	H	C-H	OCH ₃	H	H	белый порошок	219-220	33.9	2.62	15.2
									(разл)		33.9	2.71	14.6
19	N	OCH ₃	Br	H	C-H	OCH ₃	H	H	белый порошок	217-219	37.7	2.92	16.9
									(разл)		37.8	2.91	17.0
20	N	OCH ₃	H	H	C-H	Cl	Cl	H	рыж-кор порошок	225-226			
21	N	OCH ₃	F	H	C-H	Cl	Cl	H	рыж-кор порошок	211-212	36.7	2.06	17.9
									(разл)		34.8	2.08	17.2
22	N	OCH ₃	F	H	C-H	OCH ₃	CF ₃	H	рыж-кор порошок	220-223	39.9	2.63	16.6
											40.3	2.95	17.0
23	N	OCH ₃	OCH ₃	H	C-H	Cl	Cl	H	рыж-кор порошок	219-221	38.6	2.74	17.3
									(разл)		38.6	2.81	17.4
24	N	OCH ₃	OCH ₃	H	C-H	Cl	CH ₃	H	белый порошок	221-223	43.8	3.68	18.3
									(разл)		43.9	3.75	18.0

25	N	OCH ₃	OCH ₃	H	C-H	F	F	H	белый порошок	214-215 (разл)	42.1 42.2	2.99 3.08	18.9 18.6
26	N	OCH ₃	OCH ₃	H	C-H	OCH ₃	Cl	H	белый порошок	223-225	42.1 42.0	3.53 3.18	17.5 17.5
27	N	OCH ₃	OCH ₃	H	C-H	OCH ₃	F	H	белое тверд.	239-240 (разл)	43.9 43.4	3.68 4.05	18.3 16.4
28	N	OCH ₃	OCH ₃	H	C-H	OCH ₃	CF ₃	H	белый порошок	238-240 (разл)	41.6 41.5	3.26 3.20	16.2 16.3
29	N	OCH ₃	OC ₂ H ₅	H	C-H	Cl	Cl	H	белый порошок	217-218	40.2 40.1	3.13 3.13	16.7 16.8
30	N	OCH ₃	I	H	C-H	Cl	Cl	H	орж-кор порошок	210-212 (разл)	28.8 28.8	1.61 1.51	14.0 13.9
31	N	OCH ₃	Br	H	C-H	Cl	Cl	H	белый порошок	224-225 (разл)	31.8 32.0	1.78 1.74	15.5 15.3
32	N	OCH ₃	CH ₃	H	C-H	Cl	Cl	H	белый порошок	218-220	40.2 40.0	2.86 3.22	18.0 16.3
33	N	OCH ₃	Cl	H	C-H	Cl	Cl	H	белый порошок	214-216 (разл)	35.3 35.3	1.97 1.93	17.1 16.8
34	N	OCH ₃	Cl	H	C-H	OCH ₃	CF ₃	H	белый порошок	214-215	38.4 38.3	2.53 2.82	16.0 16.0
35	N	OC ₂ H ₅	OCH ₃	H	C-H	OCH ₃	H	H	розов. порошок	237-238	47.5 47.2	4.52 4.72	18.5 18.4
36	N	OCH ₃	OCH ₃	H	C-H	OCH ₃	OCH ₃	H	орж-кор. тверд.	239-241	45.6 45.7	4.33 4.19	17.7 16.6
37	N	OCH ₃	Cl	H	C-H	OCH ₃	OCH ₃	H	желтое тверд.	216-218	42.1 42.2	3.53 3.62	17.5 17.1
38	N	OCH ₃	OCH ₃	H	C-H	OCH ₃	SCH ₃	H	орж-кор. тверд.	232-234	43.8 43.0	4.16 4.11	17.0 16.4
39	N	OCH ₃	Br	H	C-H	OCH ₃	CF ₃	H	белый порошок	231-233 (разл)	34.9 34.6	14.5 14.3	2.30 2.17
40	N	OCH ₃	OCH ₃	H	C-H	Cl	CF ₃	H	орж-кор. тверд.	228-230	38.4 38.5	2.53 2.51	16.0 15.7

41	N	OCH ₃	OCH ₃	H	C-H	OCH ₃	CH ₃	H	фиол. тверд.	235-237	47.5 47.1	4.52 5.03	18.5 18.4
42	N	OCH ₃	Cl	H	C-H	OCH ₂ CH ₂ F	CF ₃	H	белый порошок	208-210	38.5 38.6	2.15 2.36	15.0 14.8
43	N	OCH ₃	Cl	H	C-H	OC ₃ H ₇ (i)	CF ₃	H	рыж-кор порошок	210-213	41.3 41.1	3.25 3.57	15.0 14.7
44	N	OCH ₃	Cl	H	C-H	OC ₂ H ₅	CF ₃	H	белый порошок	212-213	39.9 39.9	2.90 2.88	15.5 15.4
45	N	OCH ₃	Cl	H	C-H	OC ₃ H ₇ (n)	CF ₃	H	желтый порошок	182-184	41.3 40.7	3.25 3.25	15.0 14.8
46	N	OCH ₃	Cl	H	C-H	OCH ₂ CF ₃	CF ₃	H	рыж-кор порошок	202-203	35.6 35.7	1.99 1.94	13.9 13.1
47	N	OCH ₃	OCH ₃	H	C-H	F	CF ₃	H	рыж-кор тверд.	201-203	39.9 39.8	2.63 2.46	16.6 16.3
48	N	OCH ₃	OCH ₃	H	C-H	SCH ₃	CF ₃	H	белое тверд.	127-129	40.1 40.1	3.14 3.11	15.6 15.2
49	N	OCH ₃	OCH ₃	H	C-H	Cl	F	H	серое тверд.	111-113	40.3 40.1	2.86 2.96	18.1 17.9
50	N	OCH ₃	OCH ₃	H	C-H	OCH ₃	OC ₂ H ₅	H	розов. тверд.	233-234	46.9 46.5	4.68 4.87	17.1 15.9
51	N	OCH ₃	OCH ₃	H	C-H	OCH ₃	NO ₂	H	рыж-кор тверд.	225-228	41.0 38.8	3.33 3.60	20.5 19.1
52	N	OCH ₃	OCH ₃	H	C-H	OC ₂ H ₅	CF ₃	H	белый порошок	232-234	43.0 42.9	3.60 3.51	15.7 15.7
53	N	OCH ₃	OCH ₃	H	C-H	OCH ₃	CO ₂ CH ₃	H	белые иголки	215-217	45.4 44.7	4.05 3.96	16.5 16.2
54	N	OCH ₃	F	H	C-H	OCH ₃	OCH ₃	H	рыж-кор тверд.	219-220	43.9 44.1	3.68 3.92	18.3 18.0
55	N	OCH ₃	OCH ₃	H	C-H	OCH ₃	Br	H	рыж-кор тверд.	226-228	37.9 37.8	3.18 3.39	15.8 15.8
56	N	OCH ₃	Cl	H	C-H	OCH ₃	CO ₂ CH ₃	H	рыж-кор тверд.	220-222	42.1 42.1	3.30 3.28	16.4 15.9

57	N	OCH ₃	OCH ₃	H	C-H	OCH ₃	CO ₂ C ₃ H ₇ (i)	H	рыж/кор тверд.	228-230	47.9 47.9	4.69 4.89	15.5 15.8
58	N	OCH ₃	OCH ₃	H	C-H	OCH ₃	CO ₂ C ₂ H ₅	H	белое тверд	215-217	46.7 46.2	4.38 3.70	16.0 14.4
59	N	OCH ₃	OCH ₃	H	C-H	OC ₂ H ₅	OC ₂ H ₅	H	белое твердое	211-213 (разл)	48.2 48.2	5.00 4.87	16.5 16.7
60	N	OCH ₃	OCH ₃	H	C-H	OCH ₃	OC ₃ H ₇ (n)	H	белое твердое	197-199 (разл)	48.1 48.6	5.22 4.94	16.5 16.1
61	N	OCH ₃	OCH ₃	H	C-H	CF ₃	CF ₃	H	коричн. твердое	204-206 (разл)	38.2 38.2	2.35 2.03	14.9 14.7
62	N	OCH ₃	OCH ₃	H	C-H	OC ₂ H ₅	CO ₂ CH ₃	H	белое твердое	200-202 (разл)			
63	N	OCH ₃	OC ₂ H ₅	H	C-H	OCH ₃	OCH ₃	H	белое твердое	219-221	46.9 47.0	4.68 4.65	17.1 17.1
64	N	OCH ₃	OCH ₃	H	C-H	Cl	CO ₂ CH ₃	H	рыж-кор порошок	>270	42.1 42.2	3.30 3.20	16.4 16.2
65	N	OCH ₃	I	H	C-H	OCH ₃	OCH ₃	H	рыж-кор порошок	230-232 (разл)	34.2 34.6	2.87 2.92	14.3 14.2
66	N	OCH ₃	H	H	C-H	OCH ₃	OCH ₃	H	рыж-кор твердое	234-236	46.0 46.0	4.14 4.10	19.2 19.2
67	N	OCH ₃	OC ₂ H ₅	H	C-H	OCH ₃	CF ₃	H	белое твердое	222-224	43.0 42.4	3.60 3.60	15.7 15.1
68	N	OCH ₃	CH ₃	H	C-H	OCH ₃	OCH ₃	H	рыж-кор твердое	224-227	47.5 47.0	4.52 4.87	18.5 16.4
69	N	OCH ₃	OCH ₃	H	C-H	OCH ₃	SO ₂ CH ₃	H	белое твердое	267-269	40.6 41.0	3.86 3.90	15.8 15.5
70	N	OCH ₃	OCH ₃	H	C-H	OC ₃ H ₇ (i)	OC ₃ H ₇ (i)	H	беловат твердое	193-195 (разл)	50.6 50.7	5.58 5.48	15.5 15.4
71	N	OCH ₃	OCH ₃	H	C-H	OC ₃ H ₇ (n)	OC ₃ H ₇ (n)	H	персик. твердое	158-159 (разл)	50.6 50.3	5.58 5.51	15.5 15.5
72	N	OCH ₃	OCH ₃	H	C-H	OCH ₃	CH ₂ OCH ₃	H	рыж-кор тверд	211-213	46.9 46.8	4.68 4.68	17.1 16.9

73	N	OCH ₃	OCH ₃	H	C-H	CO ₂ CH ₃	CH ₃	H	белое твердое	188-190	47.2 47.2	4.21 3.95	17.2 17.1
74	N	OCH ₃	OCH ₃	H	C-H	OCH ₃	OC ₃ H ₇ (i)	H	белое твердое	204-205	48.2 47.7	5.00 5.01	16.5 16.3
75	N	OCH ₃	I	H	C-H	OCH ₃	CF ₃	H	рыж-кор порошок	235-236 (разл)	31.8 31.6	2.10 2.06	13.2 12.4
76	N	OCH ₃	I	H	C-H	OCH ₃	CO ₂ CH ₃	H	белое тверд.	215-217 (разл)			
77	N	OCH ₃	Br	H	C-H	OCH ₃	OCH ₃	H	белое тверд.	229-231 (разл)	37.9 37.8	3.18 3.38	15.8 15.5
78	N	OCH ₃	OCH ₃	H	C-H	OCH ₂ OCH ₃	OCH ₂ OCH ₃	H	рыж-кор тверд.	148-150 (разл)	44.8 44.3	4.65 4.58	15.4 15.0
79	N	OCH ₃	OCH ₃	H	C-H	F	CO ₂ CH ₃	H	белое тверд.	209-211	43.8 43.9	3.43 3.43	17.0 16.9
80	N	OCH ₃	OCH ₃	H	C-H	OCH ₃	OCF ₃	H	белое тверд.	213-215 (разл)	40.1 39.9	3.14 3.54	15.6 15.6
81	N	OCH ₃	OCH ₃	H	C-H	OCH ₃	OCH ₂ OCH ₃	H	белое тверд.	201-203 (разл)	45.2 45.3	4.50 4.49	16.5 16.0
82	N	OCH ₃	Cl	H	C-H	OCH ₃	OCH ₂ OCH ₃	H	рыж-кор тверд.	152-155 (разл)	41.9 41.7	3.75 3.80	16.3 15.7
83	N	OCH ₃	Cl	COCH ₃	C-H	OCH ₃	CF ₃	H	белый порошок	224-225	40.1 40.1	2.73 2.83	14.6 14.5
84	N	OCH ₃	Cl	SO ₂ CH ₃	C-H	OCH ₃	CF ₃	H	белый порошок	241-242 (разл)	34.9 35.4	2.54 2.74	13.6 12.9
85	N	OCH ₃	Cl	CO ₂ C ₂ H ₅	C-H	OCH ₃	CF ₃	H	белый порошок	230-232 (разл)	40.1 39.3	2.97 2.99	13.7 13.1
86	C-CH ₃	H	OCH ₃	H	C-H	OCH ₃	OCH ₃	H	белое тверд.	274-276 (разл)	50.8 50.3	4.79 4.90	14.8 14.9
87	C-H	H	OCH ₃	H	C-H	OCH ₃	OCH ₃	H	белое тверд.	279-281 (разл)	49.5 49.4	4.43 4.42	15.4 15.3
88	C-H	H	OCH ₃	H	C-H	OCH ₃	CF ₃	H	св. кор. тверд.	257-259 (разл)	44.8 44.5	3.26 3.27	13.9 14.0

89	C-CH ₃	H	OCH ₃	H	C-H	OCH ₃	CF ₃	H	беловат тверд.	261-263 (разл)	46.2 46.3	3.63 3.57	13.5 13.5
90	C-H	H	OCH ₃	H	C-H	OCH ₃	CO ₂ CH ₃	H	белое тверд.	278-280 (разл)	49.0 48.8	4.11 4.06	14.3 14.4
91	C-CH ₃	H	OCH ₃	H	C-H	OCH ₃	CO ₂ CH ₃	H	белое тверд.	255-257 (разл)	50.2 50.2	4.46 4.37	13.8 13.6
92	C-H	OCH ₃	OCH ₃	H	C-H	OCH ₃	OCH ₃	H	пурпурн тверд.	233-235 (разл)	48.7 48.8	4.60 4.57	14.2 14.2
93	C-H	OCH ₃	Cl	H	C-H	OCH ₃	OCH ₃	H	беловат тверд.	248-249 (разл)	45.2 44.3	3.79 3.58	14.1 13.7
94	C-H	Cl	OCH ₃	H	C-H	OCH ₃	OCH ₃	H	белое тверд.	252-254 (разл)	45.2 45.2	3.79 3.80	14.1 14.0
95	C-H	Cl	OCH ₃	H	C-H	OCH ₃	CF ₃	H	белое тверд.	263-264 (разл)	41.3 41.1	2.77 2.81	12.8 13.0
96	C-H	OCH ₃	OCH ₃	H	C-H	OCH ₃	CF ₃	H	беловат тверд.	256-258 (разл)	44.5 44.5	3.50 3.45	13.0 12.9
97	C-H	Cl	OCH ₃	H	C-H	OCH ₃	CO ₂ CH ₃	H	белое тверд.	218-219 (разл)	45.0 44.9	3.54 3.39	13.1 12.8
98	C-H	OCH ₃	OCH ₃	H	C-H	OCH ₃	CO ₂ CH ₃	H	беловат тверд.	274-276 (разл)	48.3 48.6	4.30 4.26	13.3 13.1
99	C-H	OCH ₃	OCH ₃	H	C-H	Cl	Cl	H	св. рыж- кор. пор.	235-236 (разл)			
100	C-H	OCH ₃	Cl	H	C-H	Cl	Cl	H	серое тверд.	>270	38.3 37.37	2.23 1.99	13.4 14.6
101	C-H	OCH ₃	H	H	C-H	Cl	Cl	H	фиол. тверд.	242-244 (разл)	41.8 41.5	2.70 2.58	15.0 14.7
102	C-H	H	OCH ₃	H	C-H	Cl	Cl	H	белое тверд.	278-280 (разл)	41.8 41.9	2.70 2.77	15.0 15.2
103	C-CF ₃	H	OCH ₃	H	C-H	Cl	Cl	H	белое тверд.	247-248 (разл)	38.1 38.2	2.06 2.05	7.27 7.30
104	C-Cl	H	OCH ₃	H	C-H	Cl	Cl	H	беловат тверд.	266-269 (разл)			

105	N	OCH ₃	OCH ₃	H	C-H	OCH ₃	H	CH ₃	белый порошок (разл)	217-219	47.5	4.52	18.5
											47.7	4.61	18.3
106	N	OCH ₃	OCH ₃	H	C-H	OCH ₃	H	Cl	белый порошок	205-207	42.1	3.53	17.5
											42.2	3.75	17.2
107	N	OCH ₃	OCH ₃	H	C-H	OCH ₃	H	OCH ₃	белый порошок (разл)	233-235	45.6	4.33	17.7
											45.7	4.57	17.5
108	N	OCH ₃	OCH ₃	H	C-H	OCH ₃	H	Br	белый порошок	225-227	37.9	3.18	15.8
											38.1	3.38	15.3
109	N	OCH ₃	OCH ₃	H	C-H	Cl	H	Cl	белый порошок (разл)	219-221	38.6	2.74	17.3
											38.6	2.85	16.6
110	N	OCH ₃	OCH ₃	H	C-H	CH ₃	H	F	белый порошок (разл)	184-186	45.8	3.84	19.1
											46.0	3.92	18.8
111	N	OCH ₃	OCH ₃	H	C-H	OC ₂ H ₅	H	CH ₃	белый порошок	197-200	48.9	4.87	17.8
											50.8	5.65	17.6
112	N	OCH ₃	OCH ₃	H	C-H	OCH ₃	H	C ₂ H ₅	белый порошок	200-202	48.9	4.87	17.8
											48.7	4.81	17.9
113	N	OCH ₃	OCH ₃	H	C-H	OCH ₃	H	C ₃ H ₇ (i)	белый порошок	199-201	50.1	5.20	17.2
											50.0	5.69	17.4
114	N	OCH ₃	OCH ₃	H	C-H	OC ₂ H ₅	H	F	белый порошок	217-219	45.3	4.06	17.6
											43.7	4.08	16.8
115	N	OCH ₃	OCH ₃	H	C-H	OCH ₃	H	CF ₃	белый порошок	215-216	41.6	3.26	16.2
											41.3	3.51	16.0
116	N	OCH ₃	OC ₂ H ₅	H	C-H	OCH ₃	H	CH ₃	белый порошок	211-213	48.9	4.87	17.8
											49.1	4.91	18.0
117	N	OCH ₃	Br	H	C-H	OCH ₃	H	Cl	розов. тверд.	204-205	34.8	2.47	15.6
											36.4	2.95	15.6
118	N	OCH ₃	Br	H	C-H	OCH ₃	H	F	белый порошок	221-223	36.1	2.57	16.2
											36.1	2.64	16.0
119	N	OCH ₃	I	H	C-H	OCH ₃	H	Cl	розов. порошок	223-225	31.5	2.24	14.1
											32.8	2.45	13.1
120	N	OCH ₃	Cl	H	C-H	OCH ₃	H	Cl	белый порошок	203-205	3836	2.74	17.3
											3838	2.85	16.7

121	N	OCH ₃	Cl	H	C-H	OCH ₃	H	F	белый порошок	217-219	40.3 39.7	2.86 2.54	18.1 17.9
122	N	OCH ₃	Cl	H	C-H	OCH ₃	H	CH ₃	белый порошок	195-196	43.8 43.0	3.68 4.61	18.3 18.0
123	N	OCH ₃	OCH ₃	H	C-H	OCH ₃	H	F	розов. порошок	205-207 (разл)	43.9 42.8	3.68 3.57	18.3 16.8
124	N	OCH ₃	OCH ₃	H	C-H	SCH ₃	H	CH ₃	рыж-кор порошок	217-219	45.6 46.0	4.33 5.12	17.7 17.8
125	N	OCH ₃	OCH ₃	H	C-H	SCH ₃	H	Cl	белый порошок	216-218	40.4 40.5	3.39 3.39	16.8 16.7
126	N	OCH ₃	OCH ₃	H	C-H	CH ₃	H	CH ₃	белый порошок	218-220	49.6 49.6	4.72 4.65	19.3 19.0
127	N	OCH ₃	OCH ₃	H	C-H	OCH ₂ CH ₂ F	H	CH ₃	белый порошок	117-119 (разл)	46.7 44.9	4.41 4.72	17.0 15.9
128	N	OCH ₃	OCH ₃	H	C-H	OCH ₂ CF ₃	H	CH ₃	белый порошок	202-204	43.0 43.0	3.60 3.86	15.7 15.5
129	N	OCH ₃	OCH ₃	H	C-H	OC ₂ H ₅	H	Cl	белый порошок	233-234 (разл)	43.5 43.5	3.90 4.51	16.9 16.5
130	N	OCH ₃	OCH ₃	H	C-H	CO ₂ CH ₃	H	F	белое тверд.	196-198	43.8 43.9	3.43 3.54	17.0 17.0
131	N	OCH ₃	I	H	C-H	OCH ₃	H	CH ₃	белое тверд.	230-232 (разл)	35.4 35.6	2.97 3.06	14.7 14.3
132	N	OCH ₃	OCH ₃	H	C-H	CO ₂ CH ₃	H	CH ₃	рыж-кор тверд.	193-195 (разл)	47.2 47.2	4.21 4.35	17.2 17.2
133	N	OCH ₃	OCH ₃	H	C-H	OCH ₂ OCH ₃	H	CH ₃	рыж-кор тверд.	163-165 (разл)	47.0 46.7	4.68 4.51	17.1 16.2
134	N	OCH ₃	OCH ₃	H	C-H	OCH ₃	OCH ₃	Cl	белый порошок	233-234	41.9 41.7	3.75 3.91	16.3 16.1
135	N	OCH ₃	OCH ₃	H	C-H	Cl	CH ₃	Cl	белый порошок	180-182	40.2 38.3	3.13 3.50	16.7 15.4
136	N	OCH ₃	OCH ₃	H	C-H	OCH ₃	Cl	Cl	белый порошок	227-228	38.7 38.6	3.02 3.25	16.1 15.9

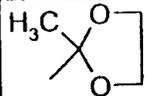
152	N	OCH ₃	SCH ₃	H	C-H	Cl	Cl	H	рыж-кор тверд.	207-209	37.2 37.2	2.64 2.56	16.7 16.5
153	N	OCH ₃	SCH ₃	H	C-H	OCH ₃	CF ₃	H	рыж-кор тверд.	215-217	40.1 40.0	3.14 3.18	15.5 15.4
154	N	OCH ₃	Cl	H	C-H	OCF ₃	H	CH ₃	рыж-кор тверд.	182-184	38.4 38.1	2.53 2.39	15.0 15.6
155	N	OCH ₃	OCH ₃	H	N	OCH ₃	Cl	H	белый порошок	227-228	39.0 38.7	3.27 3.14	21.0 20.9
156	N	OCH ₃	OCH ₃	H	N	OCH ₃	OCH ₃	H	рыж-кор порошок	223-225	42.4 41.8	4.07 3.96	21.2 20.5
157	C-H	OC ₂ H ₅	OCH ₃	H	C-H	OCH ₃	OCH ₃	H	белый тверд.	241-243 (разл)	50.0 49.9	4.94 4.80	13.7 13.6
158	C-H	Cl	OCH ₃	H	C-H	OCH ₃	Cl	H	белое тверд.	264-266 (разл)	41.7 41.7	3.00 2.97	13.9 13.9
159	C-H	OCH ₃	OCH ₃	H	C-H	OCH ₃	Cl	H	белое тверд.	246-248 (разл)	45.2 45.3	3.79 3.69	14.1 14.0
160	C-H	Cl	OCH ₃	H	C-H	OCH ₃	H	CH ₃	белое тверд.	245-247 (разл)	47.1 47.0	3.95 3.93	14.6 14.4
161	C-H	OCH ₃	OCH ₃	H	C-H	OCH ₃	H	CH ₃	белое тверд.	258-260 (разл)	50.8 49.9	4.79 4.48	14.8 14.2
162	C-H	Cl	OCH ₃	H	C-H	OCH ₃	H	Cl	белое тверд.	207-211 (разл)	41.7 41.8	3.00 2.90	13.9 13.7
163	C-H	OCH ₃	OCH ₃	H	C-H	OCH ₃	H	Cl	белое тверд.	228-230 (разл)	45.2 45.2	3.79 3.84	14.1 14.0
164	C-H	Br	OCH ₃	H	C-H	OCH ₃	OCH ₃	H	белое тверд.	243-245 (разл)	40.6 40.6	3.41 3.38	12.6 12.5
165	C-Cl	H	OCH ₃	H	C-H	OCH ₃	OCH ₃	H	белое тверд.	268-270 (разл)	45.2 45.1	3.79 3.82	14.1 14.0
166	N	OCH ₃	Cl	H	C-H	OCH ₃	Cl	Cl	рыж-кор порошок	217-219	35.6 35.5	2.30 2.44	16.0 15.6
167	N	OCH ₃	OCH ₃	H	C-H	OCH ₂ CH ₂ F	CF ₃	H	белый порошок	233-235	41.3 41.4	3.25 3.09	15.1 14.9

168	N	OCH ₃	OCH ₃	H	C-H	OCH ₂ OCH ₃	CF ₃	H	белое тверд.	181-183 (разл)	41.5 41.6	3.48 3.42	15.1 15.0
169	C-H	OCH ₃	OCH ₃	H	C-H	OCH ₃	CO ₂ CH ₃	H	белое тверд.	224-226	44.7 44.5	3.75 3.68	12.3 12.3
170	N	OCH ₃	Cl	H	C-H	CO ₂ CH ₃	H	CH ₃	беловат тверд.	174-176	43.8 43.5	3.43 3.33	17.0 16.8
171	N	OCH ₃	Cl	H	C-H	OCH ₂ OCH ₃	H	CH ₃	беловат тверд.	199-201	43.5 43.2	3.90 3.87	16.9 16.7
172	C-H	OCH ₃	OCH ₃	H	N	OCH ₃	CF ₃	H	белое тверд.	226-227	41.6 41.7	3.26 3.24	16.2 15.9
173	N	OCH ₃	Cl	H	N	OCH ₃	CF ₃	H	238-240 белый порошок		35.7 35.9	2.07 2.22	19.2 19.2
174	N	OCH ₃	OCH ₃	H	N	Cl	OCH ₃	H	228-229 (разл) белый порошок		39.0 38.8	3.26 3.13	21.0 21.7
175	C-H	OCH ₃	OCH ₃	H	C-H	OCH ₃	CO ₂ C ₂ H ₅	H	рыж-кор тверд.	204-206 (разл)	49.5 49.3	4.62 4.53	12.8 12.6
176	C-H	OCH ₃	OCH ₃	H	C-H	OC ₄ H ₉ (i)	OC ₄ H ₉ (i)	H	рыж-кор тверд.	145-147	52.6 52.5	6.10 6.08	14.6 14.4
177	N	OCH ₃	OCH ₃	H	C-H	OC ₃ H ₇ (n)	CF ₃	H	белое тверд.	202-204	44.3 44.1	3.93 3.81	15.2 15.0
178	N	OCH ₃	Cl	H	C-H	OCH ₃	Cl	H	рыж-кор порошок	>250			
179	N	OCH ₃	Cl	H	C-H	OC ₂ H ₅	H	CH ₃	рыж-кор порошок	214-216	45.3 45.0	4.05 3.86	17.6 17.3
180	C-H	Br	OCH ₃	H	C-H	OC ₂ H ₅	OC ₂ H ₅	H	белый тверд.	244-246	43.3 43.3	4.06 3.90	11.9 11.9
181	C-OCH ₃	H	OCH ₃	H	C-H	OCH ₃	OCH ₃	H	белый порошок	274-276	48.7 48.7	4.60 4.50	14.2 14.1
182	N	OCH ₃	Cl	H	C-H	OC ₃ H ₇ (i)	OC ₃ H ₇ (i)	H	рыж-кор тверд.	174-176	47.4 47.5	4.86 4.90	15.4 15.3
183	C-H	OCH ₃	OCH ₃	H	C-H	OC ₂ H ₅	OC ₂ H ₅	H	фиолет. тверд.	243-245	51.2 50.2	5.25 5.11	13.3 12.9

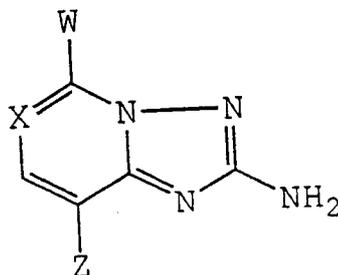
184	N	OCH ₃	OCH ₃	H	C-H	OCH ₂ CH ₂ - OCH ₃	CF ₃	H	беловат тверд.	233-235	42.8 42.7	3.80 3.69	14.7 14.7
185	N	OCH ₃	OCH ₃	H	C-H	OCH ₂ CF ₃	CF ₃	H	белое тверд.	211-213	38.3 38.3	2.61 2.59	14.0 13.9
186	N	OCH ₃	OCH ₃	H	C-H	OCH ₂ CN	CF ₃	H	беловат тверд.	211-213	41.9 41.6	2.86 2.88	18.3 17.6
187	N	OCH ₃	OCH ₃	H	C-H	OCH- (CH ₂ F) ₂	CF ₃	H	белое тверд.	229-231	40.1 41.0	3.24 3.12	14.1 14.0
188	N	OCH ₃	OCH ₃	H	C-H	OCH ₂ - OC ₂ H ₅	CF ₃	H	белое тверд.	152-157	42.8 42.6	3.80 3.70	14.7 13.4
189	N	OCH ₃	OCH ₃	H	C-H	OCH ₂ - CF ₂ CF ₃	CF ₃	H	белое тверд.	209-211	37.0 36.8	2.38 2.23	12.7 12.5
190	N	OCH ₃	OCH ₃	H	C-H	OCH ₂ CHF ₂	CF ₃	H	рыж-кор тверд.	223-224	39.8 39.5	2.92 2.74	14.5 14.3
191	N	OCH ₃	OCH ₃	H	C-H	OCH ₂ CH ₂ F	H	F	белое тверд.	195-199			
192	N	OCH ₃	OCH ₃	H	C-H	OCH ₂ OCH ₃	H	F	беловат тверд.	155-165			
193	N	OCH ₃	OCH ₃	H	C-H	OCH ₂ OCH ₃	H	Cl	беловат тверд.	185-190	41.9 41.9	3.72 3.70	16.3 15.9
194	N	OCH ₃	OCH ₃	H	C-H	OC ₃ H ₇ (i)	CF ₃	H	рыж-кор тверд.	232-234	44.3 44.2	3.93 3.93	15.2 15.0
195	N	OCH ₃	OCH ₃	H	C-H	OC ₄ H ₉ (n)	CF ₃	H	белое тверд.	185-187	45.5 45.2	4.24 4.27	14.7 14.6
196	N	OCH ₃	OCH ₃	H	C-H	OCH ₂ OCH ₃	H	H	рыж-кор тверд.	167-169	45.6 45.2	4.33 4.20	17.7 16.9
197	N	OCH ₃	OCH ₃	H	C-H	OCH ₂ CH ₂ F	H	H	белое тверд.	203-205	45.3 44.4	4.06 3.93	17.6 17.2
198	N	OCH ₃	OCH ₃	H	C-H	OCH ₂ CF ₃	H	H	белое тверд.	209-211	41.6 41.6	3.26 3.28	16.2 16.0

199	N	OCH ₃	OCH ₃	H	C-H	OC ₄ H ₉ (i)	CF ₃	H	рыж-кор тверд.	217-219	45.4 45.2	4.24 4.17	14.7 14.5
200	N	OCH ₃	OCH ₃	H	C-H	CF ₃	OCH ₂ O	H	белое тверд.	193-195	40.3 40.2	2.70 2.74	15.7 15.4
201	N	OCH ₃	OCH ₃	H	C-H	OCH- (CH ₂ F) ₂	H	H	белое тверд.	203-204	44.8 44.9	3.99 3.91	16.3 16.2
202	N	OCH ₃	OCH ₃	H	C-H	OC ₄ H ₉ (s)	CF ₃	H	рыж-кор тверд.	186-188	45.5 45.4	4.24 4.20	14.7 14.7
203	N	OCH ₃	OCH ₃	H	C-H	OCH ₂ - CH ₂ Cl	CF ₃	H	беловат тверд.	230-231	39.9 39.8	3.14 3.07	14.5 14.4
204	N	OCH ₃	CH ₃	H	C-H	OCH ₃	CF ₃	H	белый порошок	135-137	43.2 43.0	3.38 3.33	16.8 16.5
205	N	OCH ₃	Br	H	C-H	OCH ₂ OCH ₃	CF ₃	H	белый порошок	197-199	35.2 35.3	2.56 2.46	13.7 13.6
206	N	OCH ₃	OC ₂ H ₅	H	C-H	OCH ₂ OCH ₃	CF ₃	H	белый порошок	175-176	41.3 42.5	3.90 3.63	15.0 14.4
207	N	OCH ₃	OCH ₃	H	C-H	OCH ₂ OCH ₃	CF ₃	H	белое тверд.	181-183 (разл)	41.5 41.6	3.48 3.42	15.1 15.0
208	N	OCH ₃	OCH ₃	H	N	OC ₂ H ₅	CF ₃	H	беловат тверд.	211-213	40.2 40.4	3.37 3.33	18.7 18.5
209	N	OCH ₃	OCH ₃	H	N	OCH ₂ CH ₂ F	CF ₃	H	рыж-кор тверд.	226-228	38.6 38.5	3.03 2.88	18.0 17.9
210	N	OCH ₃	OCH ₃	H	N	OCH ₂ - CH=CH ₂	CF ₃	H	белое тверд.	166-168	41.7 41.6	3.28 3.22	18.3 18.0
211	N	OCH ₃	OCH ₃	H	N	OC ₃ H ₇ (i)	CF ₃	H	белое тверд.	219-221	41.6 41.6	3.71 3.66	18.2 18.1
212	N	OCH ₃	OCH ₃	H	N	OCH ₃	H	CH ₃	белый порошок	141-142	44.2 43.5	4.24 4.07	22.1 21.0
213	N	OCH ₃	Br	H	N	OCH ₃	CF ₃	H	рыж-кор порошок (разл)	235-237 (разл)	32.3 32.3	2.06 2.06	17.4 17.2

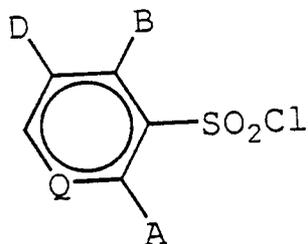
214	C-H	Br	OCH ₃	H	N	OCH ₃	CF ₃	H	белое тверд.	241-243	34.9 35.0	2.30 2.20	14.5 14.3
215	C-H	OCH ₃	OCH ₃	H	C-H	OC ₂ H ₅	CO ₂ CH ₃	H	желтое тверд.	197-198	49.5 50.0	4.62 4.83	12.8 12.2
216	N	OCH ₃	OCH ₃	SO ₂ CH ₃	C-H	OCH ₃	CO ₂ CH ₃	H	рыж-кор порошок	230-231	39.3 40.3	3.91 3.76	14.3 13.3
217	C-H	OCH ₃	OCH ₃	SO ₂ CH ₃	C-H	OCH ₃	CO ₂ CH ₃	H	рыж-кор порошок	248-249 (разл)			
218	N	OCH ₃	Cl	H	C-H	F	CF ₃	H	рыж-кор тверд.	191-193	36.7 36.7	1.89 1.80	16.5 16.3
219	N	OCH ₃	Cl	H	C-H	OCH ₂ OCH ₃	CF ₃	H	св. рыж- кор. тв.	161-163 (разл)	38.5 38.0	2.80 2.67	15.0 13.8
220	N	OCH ₃	OCH ₃	COCH ₃	C-H	OCH ₂ CH ₂ F	CF ₃	H	рыж-кор порошок	217-220	42.6 42.2	3.38 3.33	15.0 13.6
221	N	OCH ₃	OCH ₃	H	C-H	CO ₂ CH ₃	CF ₃	H					
222	N	OCH ₃	OCH ₃	H	C-H	OCF ₃	CF ₃	H					
223	N	OCH ₃	OCH ₃	H	C-H	Br	CF ₃	H					
224	N	OCH ₃	OCH ₃	H	C-H	OCH ₂ - CH=CH ₂	CF ₃	H					
225	N	OCH ₃	OCH ₃	H	C-H	OCH ₂ SCH ₃	CF ₃	H					
226	N	OCH ₃	OCH ₃	H	C-H	CH ₂ OCH ₃	CF ₃	H					
227	N	OCH ₃	OCH ₃	H	C-H	OC ₃ H ₇ (i)	CH ₂ CF ₃	H					
228	N	OCH ₃	OCH ₃	H	C-H	OCH ₃	OCF ₂ OCH ₃	H					
229	N	OCH ₃	OCH ₃	H	C-H	O(CH ₂) ₃ F	CF ₃	H					
230	N	OCH ₃	OCH ₃	H	C-H	OCH ₂ CH ₂ F	CO ₂ CH ₃	H					
231	N	OCH ₃	OCH ₃	H	C-H	OCF ₃	OCH ₂ CH ₂ F	H					
232	N	OCH ₃	OCH ₃	H	C-H	OCF ₃	OCH- (CH ₂ F) ₂	H					

233	N	OCH ₃	OCH ₃	H	C-H	OCH-(CH ₂ Cl) ₂	CF ₃	H						
234	N	OCH ₃	OCH ₃	H	C-H	OCH ₂ -CHCl ₂	CF ₃	H						
235	N	OCH ₃	OCH ₃	H	C-H		CF ₃	H						
236	N	OCH ₃	OCH ₃	SO ₂ CH ₃	C-H	OCH ₂ CH ₂ F	CF ₃	H						
237	N	OCH ₃	OCH ₃	COCH ₃	C-H	OCH ₂ CH ₂ F	CF ₃	H						
238	N	OCH ₃	OCH ₃	CH ₂ CH ₂ -CO ₂ CH ₃	C-H	OCH ₂ CH ₂ F	CF ₃	H						
239	N	OCH ₃	OCH ₃	H	C-H	OCH ₂ CH ₂ F	H	Cl						
240	N	OCH ₃	OCH ₃	H	C-H	OCH ₂ CF ₃	H	Cl						
241	N	OCH ₃	OCH ₃	H	C-H	OCH ₃	H	CH ₂ F						
242	N	OCH ₃	OCH ₃	H	C-H	OCH ₃	CF ₃	Cl						
243	N	OCH ₃	OCH ₃	H	C-H	Cl	CF ₃	OCH ₃						
244	N	OCH ₃	OCH ₃	H	N	CF ₃	OCH ₃	H						
245	N	OCH ₃	OCH ₃	H	N	OCH ₃	CO ₂ CH ₃	H						
246	N	OCH ₃	OCH ₃	H	N	OCH ₃	H	Cl						
247	N	OCH ₃	OCH ₃	H	N	OCH ₂ OCH ₃	CF ₃	H						
248	N	OCH ₃	OCH ₃	H	C-H	OCH ₃	CH ₂ F	H						
249	N	OCH ₃	OCH ₃	H	C-H	OCH ₃	SCF ₃	H						

Соединения формулы I, где T представляет собой водород, получают путем взаимодействия замещенного 2-амино[1,2,4]триазазина формулы II



с бензолсульфонилхлоридом или пиридин-3-сульфонилхлоридом формулы III

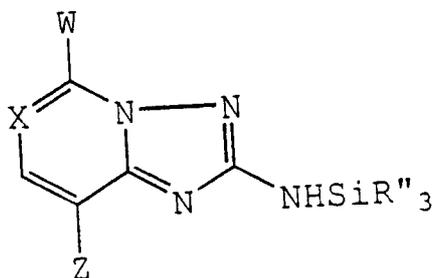


где A, B, D, Q, W, X и Z определены выше для соединений формулы I.

Реакцию осуществляют путем объединения приблизительно эквимолярных количеств обоих соединений в полярном апротонном растворителе, например ацетонитриле, добавления пиридина и каталитического количества (от 5 до 25 мольных процентов сульфонилхлорида) диметилсульфоксида при комнатной температуре. Для завершения реакции при необходимости вводят добавочное количество сульфонилхлорида, пиридина и диметилсульфоксида. Продолжительность реакции составляет от нескольких часов до нескольких суток до ее полного завершения. Для исключения влаги используют, в частности, атмосферу сухого азота. Полученные соединения формулы I, которые представляют собой твердые вещества с низкой растворимостью во многих общеизвестных органических растворителях и в воде, извлекают стандартными методами.

Реакцию конденсации сульфонилхлоридов формулы III и 2-амино[1,2,4]триазазинов формулы II с успехом осуществляют

сначала превращением 2-амино[1,2,4]триазазина формулы II в N-триалкилсилильное производное формулы IV



где W, X и Z определены выше для соединений формулы I и R'' представляет C₁-C₄алкил. Типичными представителями являются N-триметилсилильные и N-триэтилсилильные производные. Способ сродни со способами, которые раскрыты в патентах США 4910306 и 4666501, но отличается тем, что, обычно, требует использования фторид-ионного стимулятора.

Превращение 2-амино[1,2,4]триазазина формулы II в N-триалкилсилильное производное формулы IV осуществляют путем приготовления смеси хлортриалкилсилана с иодидом натрия или калия в растворителе, таком как ацетонитрил, в отсутствие воды и последующего добавления 2-амино[1,2,4]триазазина и триалкиламина, например триэтиламина, при температуре окружающей среды и при перемешивании. Обычно используют приблизительно эквимолярные количества хлортриалкилсилана и 2-амино[1,2,4]триазазина. Реакция продолжается от нескольких часов до суток в зависимости от конкретно вовлеченного в реакцию триалкиламина и 2-амино[1,2,4]триазазина. Полученные N-триалкилсилильные производные извлекают путем разбавления полученной смеси неполярным растворителем, таким как эфир или 1,2-дихлорэтан, удаления нерастворенных солей фильтрованием и последующего удаления летучих компонентов испарением при пониженном давлении. Соединения формулы IV неустойчивы в присутствии воды и должны храниться в сухом виде.

Производные 2-(триалкилсилиламино)[1,2,4]триазазина формулы IV, полученные по описанной выше методике и другим способом, можно конденсировать с дополнительной очисткой или без нее с сульфонилхлоридом формулы III. Конденсацию обычно

осуществляют в растворителе, таком как ацетонитрил, в присутствии приблизительно эквимолярного количества пиридинового или метилпиридинового основания, приблизительно эквимолярного количества фторид-ионного стимулятора, такого как фторид цезия или фторид тетраалкиламмония, и каталитического количества (от 3 до 20 процентов сульфонилхлорида) диметилсульфоксида. Конденсация, которую часто осуществляют при температуре от 10 до 60°C в безводной среде при перемешивании, обычно завершается в течение 2-18 часов. Полученный N-(триазолазинил)арилсульфонамид формулы I извлекают стандартными методами, такими как фильтрование для отделения твердых частиц и экстракция полученных твердых веществ для удаления водорастворимых солей и/или растворимых органических компонентов.

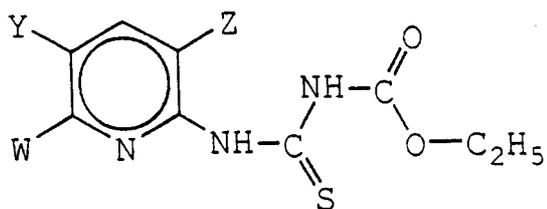
N-(триазолазинил)арилсульфонамиды формулы I, где **T** не является водородом, получают из соответствующих соединений формулы I, где **T** представляет собой водород, ацилированием в реакционных условиях, известных для родственных реакций ацилирования сульфонамида.

Подходящие ацилирующие агенты включают алканоилхлориды, такие как пропионилхлорид или трифторацетилхлорид; хлорформатные эфиры, такие как 2-метоксиэтилхлорформат; карбамоилхлориды, такие как N',N'-диаллилкарбамоилхлорид, и алкилизотиоцианаты, такие как 2-хлорэтилизотиоцианат.

Соединения формулы I, где **W** представляет собой хлор, превращают в соответствующие соединения формулы I, где **W** представляет фтор, бром, иод, O(C₁-C₃алкил) или S(C₁-C₃алкил), путем обработки соответствующим нуклеофильным соединением, используя известные стандартные методики проведения таких замещений. Атомы хлора в положении 5 (X) замещаются легче, чем атомы хлора в положении 6 (Y) или в положении 8 (Z), причем их замещение можно осуществлять селективно.

Многие 2-амино[1,2,4]триазоп[1,5-а]пиридины формулы II (X представляет собой C-Y) получают путем взаимодействия соответствующим образом замещенных N-(2-пиридинил)-N'-карбоэтокситио-

мочевин формулы



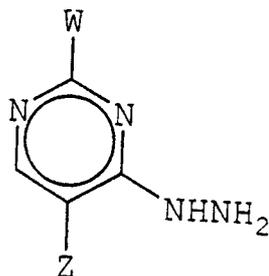
с гидроксиламином. Реакцию обычно осуществляют в растворителе, таком как этанол, и при нагревании в течение нескольких часов. Гидроксиламин, как правило, получают нейтрализацией гидрохлорида со стерически затрудненным третичным амином, таким как диизопропилэтиламин, или алкоголятом щелочного металла, таким как этилат натрия. Желаемые соединения формулы II извлекают стандартными методами, например удалением летучих компонентов реакционной смеси испарением, и очищают также стандартными методами, например водной экстракцией и/или экстракцией с использованием других растворителей, в которых они умеренно растворимы. N-(2-пиридинил)-N'-карбоэтокситиомочевины в качестве исходных соединений для предлагаемого способа получают путем обработки соответствующим образом замещенных 2-аминопиридинов этоксикарбонилзотиоцианатом. Реакцию обычно осуществляют в инертном органическом растворителе при температуре окружающей среды. Полностью способ описан в патенте США 5 571 775.

Замещенные 2-аминопиридины в качестве исходных веществ для описанного выше способа являются известными соединениями или могут быть получены по методикам, раскрытым в описании, или обычными способами, известными из литературы.

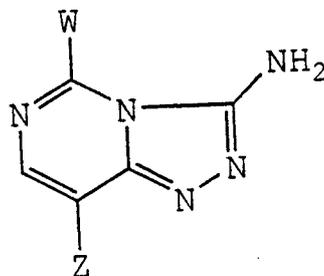
Соединения формулы II, где X представляет собой C-Y, кроме того, получают из соответствующим образом замещенных 2-цианоаминопиридинов по методике, описанной авторами B. Vercek et al. в Monatshefte für Chemie, 114, 789-798 (1983). Дополнительные методики получения этих соединений были раскрыты авторами K. T. Potts et al. в Journal of Organic Chemistry, 31, 265-273 (1966).

Соединения формулы I, где X представляет собой N, или (2-

амино[1,2,4]триазол[1,5-с]пиримидины), получают из 4-гидразин-пиримидинов формулы



где **W** представляет собой метилтио, водород или хлор, и **Z** представляет водород, галоген, алкокси или алкилтио. Гидразин-пиримидин сначала обрабатывают дицианбромидом для получения гидробромида 3-амино-8-замещенного-5-замещенного[1,2,4]триазол-[4,3-с]пиримидина формулы

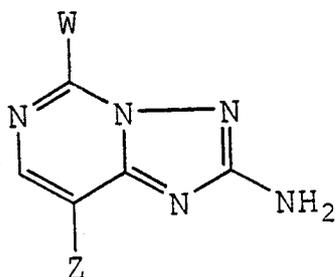


где **W** представляет собой метилтио, водород или хлор, и **Z** представляет водород, галоген, алкокси или алкилтио. Реакцию обычно осуществляют в органическом растворителе, таком как изопропиловый спирт, при температуре окружающей среды. Продукты извлекают стандартными методами, такими как добавление неполярного растворителя, например диэтилового эфира, и отделение твердого вещества фильтрованием. Указанные выше промежуточные соединения, где **W** представляет собой метилтио, затем превращают в желаемые соединения формулы II, где **W** представляет собой алкокси, путем обработки алкоголятом щелочного металла, например метилатом натрия или этилатом калия, и этилакрилатом в соответствующем спирте, используемом в качестве растворителя. Соединение подвергают перегруппировке и метилтио-фрагмент замещают на алкокси, получаемый от спирта, входящего в состав среды. Реакцию обычно осуществляют при температуре ниже 25°C.

Желаемые соединения формулы II извлекают нейтрализацией с помощью уксусной кислоты и отделением твердого остатка, получаемого путем фильтрования или другого стандартного метода. Соединения формулы II, где **X** представляет собой N и **W** представляет собой водород или хлор, получают из соответствующего [4,3-с]-промежуточного соединения, где **W** представляет водород или хлор, путем изомеризации с помощью триалкиламинового основания. Исходные 4-гидразинпиримидины для этих способов получают из соответствующих 4-хлорпиримидинов, которые хорошо известны из уровня техники, путем взаимодействия с гидразином.

Другие методы получения соединений формулы II, где **X** представляет собой N, описаны в статье G.W.Miller et al., J. Chemical Society, 1965, p.3357; 1963, p.5642.

Соединения формулы II, где **X** представляет собой N, составляет еще один аспект настоящего изобретения. Таким образом изобретение включает 2-амино[1,2,4] триазол[1,5-с] пиримидины формулы

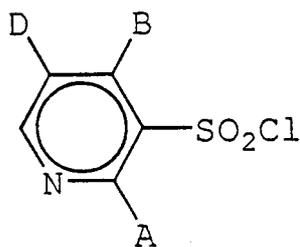


где **W** представляет O(C₁-C₃алкил), хлор, бром, фтор или водород, и **Z** представляет O(C₁-C₃алкил), водород, фтор, хлор, бром, иод, S(C₁-C₃алкил) или метил, необязательно содержащий до трех атомов фтора в качестве заместителей; при условии, что, по крайней мере, один из **W** и **Z** представляет собой O(C₁-C₃алкил). Соединения этого типа, где один из **W** и **Z** представляет метокси, а другой представляет фтор, хлор, бром, метил, метокси или этокси, часто являются предпочтительным, а такие соединения, где **W** представляет метокси и **Z** представляет метокси, фтор, хлор или бром, часто являются более предпочтительными.

Исходные замещенные бензолсульфонилхлорид и пиридинсульфо-

нилхлорид формулы III получают либо методами, раскрытыми в настоящем описании, либо по общим или конкретным методикам, известным из уровня техники. Многие соединения такого типа, в частности 2-метокси-6-(трифторметил)бензолсульфонилхлорид и 2-метокси-4-(трифторметил)-3-пиридинсульфонилхлорид, получают "литоированием" соответствующего бензола или пиридина (например 3-трифторметиланизола или 2-метокси-4-трифторметилпиридина) с помощью бутиллития, реакцией полученного фенил- или пиридиниллитиевого производного с дипропилдисульфидом и последующим хлорокислорокислением полученного пропилтиопроизводного. Используемые условия реакции на каждой из этих реакционных стадий являются общеизвестными для таких процессов такого рода. Многие пропил- и бензилтиобензолы и пиридины получают путем алкилирования соответствующего тиофенола или 3-пиридинтиола с помощью стандартных методик и последующего хлорокислорокисления. Фенил- и пиридиниллитиевые производные, например те, что получают из 1,3-диметоксибензола, превращают непосредственно в соответствующие целевые сульфонилхлориды путем взаимодействия с двуокисью серы и сульфурилхлоридом в присутствии N,N,N',N'-тетраметилэтилендиамина. Другие целевые сульфонилхлориды, например 2-(1,1,2,2-тетрафторэтокси)бензолсульфонилхлорид, получают путем диазотирования соответствующего анилина или 3-аминопиридина в присутствии двуокиси серы, хлоридов меди и концентрированного водного раствора соляной кислоты. Бензолсульфонилхлориды, такие как 2-метокси-5-метил-бензолсульфонилхлорид, получают прямым хлорсульфированием соответствующих бензольных производных. Производные 3-алкилтиопиридина, имеющие атомы хлора в качестве заместителей в положениях 2 и/или 4, превращают до хлорокислорокисления в соответствующие соединения, имеющие другие гало- или алкокси-заместители, путем стандартных реакций нуклеофильного замещения для получения других пиридин-3-сульфонилхлоридов.

Соединения формулы III, где Q представляет собой N, включающие замещенные пиридин-3-сульфонилхлориды формулы



где **A** представляет собой H, F, Cl, Br, I или $\text{CO}_2(\text{C}_1\text{-C}_4\text{-алкил})$, или представляет собой $(\text{C}_1\text{-C}_3\text{алкил})$, $\text{O}(\text{C}_1\text{-C}_4\text{алкил})$, $\text{O}(\text{C}_3\text{-C}_4\text{алкенил})$, $\text{O}(\text{C}_3\text{-C}_4\text{алкинил})$ или $\text{S}(\text{C}_1\text{-C}_3\text{алкил})$, каждый из которых необязательно замещен одним заместителем, представляющим собой $\text{O}(\text{C}_1\text{-C}_3\text{алкил})$, $\text{S}(\text{C}_1\text{-C}_3\text{алкил})$, хлор, бром или циано, или атомами фтора до максимально возможного их количества, или представляет собой фрагмент 2-метил-1,3-диоксолан-2-ила;

B представляет собой H, F, Cl, Br, I, NO_2 , CN, $\text{CO}_2(\text{C}_1\text{-C}_4\text{алкил})$, $\text{NH}(\text{C}_1\text{-C}_3\text{алкил})$ или $\text{N}(\text{C}_1\text{-C}_3\text{алкил})_2$, или представляет собой $(\text{C}_1\text{-C}_3\text{алкил})$, $\text{O}(\text{C}_1\text{-C}_4\text{алкил})$, $\text{O}(\text{C}_3\text{-C}_4\text{алкенил})$, $\text{O}(\text{C}_3\text{-C}_4\text{алкинил})$ или $\text{S}(\text{C}_1\text{-C}_3\text{алкил})$, $\text{SO}(\text{C}_1\text{-C}_3\text{алкил})$, $\text{SO}_2(\text{C}_1\text{-C}_3\text{алкил})$, $\text{S}(\text{C}_3\text{-C}_4\text{алкенил})$, $\text{SO}(\text{C}_3\text{-C}_4\text{алкенил})$, $\text{SO}_2(\text{C}_3\text{-C}_4\text{алкенил})$, $\text{S}(\text{C}_3\text{-C}_4\text{алкинил})$, $\text{SO}(\text{C}_3\text{-C}_4\text{алкинил})$ или $\text{SO}_2(\text{C}_3\text{-C}_4\text{алкинил})$, каждый из которых необязательно замещен одним заместителем, представляющим собой $\text{O}(\text{C}_1\text{-C}_3\text{алкил})$, $\text{S}(\text{C}_1\text{-C}_3\text{алкил})$, хлор, бром или циано, или атомами фтора до максимально возможного их количества; при условии, что, по крайней мере, один **A** и **B** представляет собой $\text{O}(\text{C}_1\text{-C}_4\text{алкил})$, $\text{O}(\text{C}_3\text{-C}_4\text{алкенил})$, $\text{O}(\text{C}_3\text{-C}_4\text{алкинил})$, каждый из которых необязательно замещен одним заместителем, представляющим собой $\text{O}(\text{C}_1\text{-C}_3\text{алкил})$, $\text{S}(\text{C}_1\text{-C}_3\text{алкил})$, хлор, бром, или атомами фтора до максимально возможного их количества; при условии, что **A** и **B** одновременно не являются водородом; и

D представляет собой H, F, Cl, Br, I, $\text{C}_1\text{-C}_3\text{алкил}$, OCH_3 , OC_2H_5 или CF_3 ; или **B** и **D**, взятые вместе, представляют фрагмент формулы $\text{O-CH}_2\text{-O}$, необязательно замещенный одним или двумя атомами F или CH_3 , составляют дополнительные аспекты настоящего изобретения. Пиридин-3-сульфонилхлориды формулы III, где **A** представляет собой метокси, этокси, пропокси, 1-метилэтокси,

метоксиметокси, метоксиэтокси, 2-фторэтокси, 2-хлорэтокси, 2,2-дифторэтокси, 1-(фторметил)-2-фторэтокси, трифторметокси, хлор или фтор; **B** представляет водород, метокси, этокси, пропокси, 1-метилэтокси, метоксиметил, метилтио, метил, трифторметил, трифторметокси, хлор, фтор или метоксикарбонил; и **D** представляет водород, фтор, хлор, бром или метил, обычно являются предпочтительными. Такие соединения, где **B** представляет метокси и **D** представляет водород; **A** представляет собой метокси и **D** представляет водород, метил или хлор; или где **B** представляет собой трифторметил и **D** представляет водород, часто являются более предпочтительными. Соединения формулы III, где **Q** представляет собой N и **A** представляет метокси, этокси, пропокси, 1-метилэтокси, метоксиметокси, метоксиэтокси, 2-фторэтокси, 2-хлорэтокси, 2,2-дифторэтокси и 1-(фторметил)-2-фторэтокси; **B** представляет водород, метокси, этокси, пропокси, 1-метилэтокси, трифторметил или метоксикарбонил; и **D** представляет водород или метил, обычно являются наиболее предпочтительными.

Хотя N-(триазазинил)арилсульфонамиды формулы I можно использовать непосредственно в качестве гербицидов, предпочтительно все же осуществлять их применение в виде смесей, содержащих гербицидно-эффективное количество этого соединения, вместе, по крайней мере, с одним сельскохозяйственно приемлемым наполнителем или носителем. Подходящие наполнители или носители не должны быть фитотоксичными по отношению к ценным культурам, в особенности в концентрациях, используемых при применении композиций для селективного уничтожения сорняков в присутствии культурных растений, и не должны химически реагировать с соединениями формулы I или другими ингредиентами композиции. Такие смеси составляют для непосредственного применения на сорняках или в их локусе или готовят на их основе концентраты или препаративные формы, которые обычно разбавляют дополнительным количеством наполнителей или носителей перед применением. Формы могут быть твердыми, такими как, например, дусты, гранулы, вододиспергируемые гранулы или смачивающиеся порошки,

или жидкими, такими как, например, концентраты эмульсий, растворы или суспензии. Подходящие сельскохозяйственно приемлемые наполнители или носители, используемые при приготовлении гербицидных смесей, заявленных в настоящем изобретении, хорошо известны специалистам.

Применяемые жидкие носители включают воду, толуол, ксилол, петролейный эфир, масло сельскохозяйственных культур, ацетон, метилэтилкетон, циклогексанон, трихлорэтилен, перхлорэтилен, этилацетат, амилацетат, бутилацетат, монометиловый эфир пропиленгликоля и диэтиленгликоля, метанол, этанол, изопропанол, амиловый спирт, этиленгликоль, пропиленгликоль, глицерин, N-метил-2-пирролидон и им подобные. В качестве носителя, используемого для разбавления концентратов, обычно выбирают воду.

Подходящие твердые носители включают тальк, пирофиллитовую глину, двуокись кремния, кизельгур, мел, диатомит, известь, карбонат кальция, бентонит, фуллерову землю, шелуху хлопкового семени, пшеничную муку, соевую муку, пемзу, древесную муку, муку из ореховой скорлупы, лигнин и им подобные.

В композиции часто желательно включать одно или более поверхностно-активных веществ (ПАВ). Такие ПАВ успешно применяют как в твердых, так и жидких композициях, в особенности такие, которые разбавляют носителями перед использованием. ПАВ по своей природе могут быть анионными, катионными или неионными и использоваться в качестве эмульгаторов, смачивающих и суспендирующих агентов или применяться для других целей. Типичными ПАВ являются соли алкилсульфатов, такие как диэтаноламинлаурилсульфат; алкиларилсульфонаты, такие как додецилбензолсульфонат кальция; продукты реакции присоединения алкилфенола и алкиленоксида, такие как нонилфенол- C_{18} этоксилат; продукты реакции присоединения спирта и алкиленоксида, такие как тридециловый спирт- C_{16} этоксилат; мыла, такие как стеарат натрия; алкилнафталинсульфонатные соли, такие как дибутилнафталинсульфонат натрия; сульфосукцинатные соли диалкиловых эфиров, такие как ди(2-этилгексил)сульфосукцинат натрия; сложные эфиры сорбита,

такие как сорбитолеат; четвертичные амины, такие как хлорид лаурилтриметиламмония; полиэтиленгликолевые сложные эфиры жирных кислот, такие как полиэтиленгликольстеарат; блоксополимеры этиленоксида и пропиленоксида; и соли моно- и диалкилфосфатных эфиров.

Другие наполнители, используемые в композициях сельскохозяйственного назначения, включают агенты для улучшения совместимости компонентов, противопенные добавки, секвестрирующие агенты, нейтрализующие и буферизирующие агенты, ингибиторы коррозии, красители, одоранты, растекатели, смачиватели, адгезивы, диспергаторы, загустители, вещества, понижающие точку замерзания, противомикробные агенты и им подобные. Композиции могут включать и другие совместимые компоненты, например другие гербициды, гербицидные антидоты, регуляторы роста растений, фунгициды, инсектициды и им подобные продукты, и могут являться компонентами препаративных форм совместно с жидкими или твердыми сыпучими удобрениями, такими как нитрат аммония, мочевины, и им подобными.

Концентрация активных ингредиентов в гербицидных композициях, заявленных настоящим изобретением, составляет обычно от 0,001 до 98% вес. Часто используют концентрации приблизительно от 0,01 до 90% вес. В композициях, используемых в виде концентратов, активный ингредиент, как правило, присутствует в количестве приблизительно от 5 до 98%, предпочтительно от 10 до 90% вес. Такие композиции перед использованием обычно разбавляют инертным носителем, например водой. Такие композиции, обычно применяемые на сорняках или в их локусе, как правило, содержат примерно от 0,001 до 5% вес. активного ингредиента и предпочтительно - от 0,01 до 0,5% вес.

Композиции применяют на сорняках или в их локусе с помощью стандартных наземных или воздушных приспособлений для распыления, опрыскивателей, аппликаторов для гранул, внесением ирригационной воды или другими способами, известными специалистам.

Было установлено, что соединения формулы I являются

полезными в качестве гербицидов для проведения довсходовой (включая предпосевную/предпосадочную) и послевсходовой обработки. Послевсходовая обработка обычно является предпочтительной. Соединения эффективны для борьбы как с широколиственными, так и травянистыми сорняками. Хотя каждый из N-(триазазинил)арилсульфонамидов формулы I находится в объеме настоящего изобретения, степень гербицидной активности, селективность по отношению к культурам и спектр достигаемого действия изменяются в зависимости от присутствующих заместителей и других характеристик. Соединения применяют в высоких неселективных дозах для уничтожения сплошной растительности в зоне. Соединения 10, 13, 14, 15, 18, 23, 26, 27, 28, 36, 37, 38, 39, 41, 50, 53, 54, 60, 63, 65, 77, 80, 81, 92, 105, 106 и 139 находятся среди соединений, которые представляют особый интерес для этой цепи. Во многих случаях соединения можно также использовать при более низких селективных дозах для борьбы с нежелательной растительностью в травяных культурах, таких как кукуруза, сорго, пшеница, ячмень и рис, а также в широколиственных культурах, таких как масличные рапсовые, соя и хлопок. Их использование для селективного уничтожения травянистых сорняков, таких как ковыль овсоподобный и овсюг, и некоторых широколиственных сорняков в небольших зерновых культурах, таких как пшеница и ячмень, представляет особый интерес. Соединения 28, 34, 53, 96, 98, 105 и 142 находятся среди лучших соединений, используемых для этой цели. Многие соединения применяют для удаления широколиственных сорняков из небольших зерновых культур, таких как пшеница. Соединения, представляющие особый интерес для этой цепи, включают соединения 1, 2, 21, 32, 43, 46, 52, 95, 109, 120, 122 и 126. Многие соединения применяют для уничтожения широколиственных и травянистых сорняков в рисе. Соединения, представляющие особый интерес для этой цели, включают соединения 167, 177, 184, 185, 187, 188, 190, 194, 195, 203, 209, 210, 220, 229 и 233. Нежелательную растительность можно удалить из риса, который непосредственно засеян или пересажен, и выращен либо на

затопляемом рисовом поле, либо на возвышенности. Селекцию риса часто улучшают путем применения антидотов. Некоторые соединения, такие как 155 и 106, используют для удаления широколистных и травянистых сорняков из масличных рапсовых культур.

Термин "гербицид" используют здесь для обозначения активного ингредиента, который уничтожает или отрицательным образом модифицирует рост растительности. Гербицидно-эффективное или губительное для растительности количество представляет собой такое количество активного ингредиента, которое вызывает отрицательный модифицирующий эффект и обуславливает отклонение растения от естественного развития, его уничтожение, регулирование роста, десикацию, замедление и им подобные процессы. Термин "растения и растительность" включает проростки семян, всходы и устойчивую растительность.

Гербицидная активность у заявленных соединений обнаруживается при их применении непосредственно на растении или в его локусе на любой стадии роста, либо до посадки или появления всходов. Наблюдаемый эффект зависит от вида уничтожаемого растения, стадии его роста, разведения при применении, размера капель раствора для опрыскивания, размера частиц твердых компонентов, состояния окружающей среды в момент применения, конкретного соединения, природы используемых наполнителей и носителей и других факторов, а также от количества химического вещества. Эти и другие факторы можно подобрать на основе известных знаний в этой области с тем, чтобы способствовать неселективному или селективному гербицидному действию. Вообще, предпочтительно применять соединения формулы I в условиях послевсходовой обработки по отношению к еще неразвитым растениям для того, чтобы достигнуть максимального уничтожения сорняков.

Нормы расхода, используемые при послевсходовой обработке, обычно составляют приблизительно от 0,001 до 1 кг/га, а при довсходовой обработке - приблизительно от 0,01 до 2 кг/г. Более высокие нормы расхода обычно назначают для неселективного

уничтожения широкого ряда представителей нежелательной растительности. Более низкие дозы обычно дают селективное уничтожение, поэтому благодаря разумному выбору соединений, рациональным времени обработки и норм расхода их можно применять в локусе культурных растений.

Соединения формулы I часто применяют в сочетании с одним и более другими гербицидами для того, чтобы достигнуть уничтожения еще более широкого ряда сорняков. При использовании с другими гербицидами применение заявленных соединений осуществляют путем приготовления препаративных форм с другим гербицидом или гербицидами, смешивания в смешительном резервуаре с другим гербицидом или гербицидами или путем последовательного применения их с другим гербицидом или гербицидами. Некоторые гербициды, которые можно с выгодой использовать в сочетании с заявленными соединениями, включают замещенные триазолпиримидинсульфонамиды, такие как N-(2,6-дихлорфенил)-5-этокси-7-фтор-[1,2,4]триазол[1,5-с]пиримидин-2-сульфонамид (диклосулам), N-(2-метоксикарбонил-6-хлорфенил)-5-этокси-7-фтор[1,2,4]триазол[1,5-с]пиримидин-2-сульфонамид (клорансулам-метил) и N-(2,6-дифторфенил)-5-метил-[1,2,4]триазол[1,5-а]пиримидин-2-сульфонамид (флуметсулам). Можно использовать и другие гербициды, такие как ацифлуфен, бентазон, хлоримурон, кломазон, лактофен, карфентразон-метил, фумиклорак, флуметурон, фомезафен, имазакин, имазетапир, линурон, метрибузин, флуазифоп, галоксифоп, глифосат, глуфозинат, 2,4-Д, ацетохлор, метолахлор, сетоксидим, никосульфурон, клопиралид, флуроксипир, метсульфуронметил, амидосульфурон, трибенурон и другие. Как правило, предпочтительно использовать соединения в сочетании с другими гербицидами, которые обладают аналогичной селективностью по отношению к культурам. Кроме того, как правило предпочтительно применять гербициды в одно и тоже время, либо в виде комбинированной препаративной формы, либо в виде смеси, приготовленной в смешительном резервуаре.

Для усиления селективности соединения, заявленные в настоящем изобретении, обычно применяют в комбинации с широким рядом

гербицидных антидотов, такими как клокинтокет, мефенпир, фурил-азол, диклормид, беноксакор, флуразол, флуксофеним, даймурон, димепиперат, тиобенкарб и фенклорим. Гербицидные антидоты, действие которых основано на изменении метаболизма гербицидов в растениях благодаря усилению активности цитохром Р-450 оксидаз, являются особенно эффективными. Часто это является предпочтительным предметом осуществления изобретения. Соединения можно дополнительно использовать для уничтожения нежелательной растительности во многих культурах, которые толерантны или устойчивы к гербицидам благодаря проведенной генетической манипуляции или мутации и селекции. Например, ими могут быть обработаны кукуруза, пшеница, рис, соя, сахарная свекла, хлопок, канола и другие культуры, которых сделали толерантными или устойчивыми к гербицидам вообще или к гербицидам, ингибирующим фермент ацетолактат синтазу в чувствительных растениях.

ПРИМЕРЫ.

Примеры представлены для иллюстрации различных аспектов настоящего изобретения и не служат каким-либо ограничением формулы изобретения.

Принятые условные обозначения в спектрах ЯМР: s - синглет; m - мультиплет; t - триплет; d - дублет; dd - двойной дублет; brs - широкий синглет; ddd - тройной дублет; q - квадруплет;

1. Получение 2-пропилтио-3-(трифторметил)анизола

Раствор, содержащий 30 мл (208 ммоль) 3-(трифторметил)-анизола в 500 мл сухого тетрагидрофурана охлаждают до -70°C под азотной подушкой и к нему медленно добавляют при перемешивании и охлаждении 100 мл (250 ммоль) 2,5М бутиллития в гексане. Красноватый раствор перемешивают при -70°C в течение 1 часа и затем медленно при перемешивании и охлаждении добавляют 42 мл (270 ммоль) дипропилдисульфида. Полученную смесь оставляют на 18 часов до достижения температуры окружающей среды и гасят 250 мл насыщенного водного раствора хлористого аммония. Органическую фазу извлекают, сушат над сульфатом магния и концентрируют

испарением при пониженном давлении. Остаток в виде желтого масла подвергают фракционной перегонке на колонке Vigreux при 0,2 мм Hg (мм рт.ст.) (27 Па), получая 37 г (71% от теоретического) фракции чистого жидкого продукта, кипящей при 92°C. Эта фракция, как установлено, представляет собой 82% целевого соединения, 10% 2-пропилтио-5-(трифторметил)анизола в виде изомера.

Элементный анализ $C_{11}H_{13}F_3OS$

Вычислено: С 52.8%, Н 5.24%, S 12.8%

Найдено: С 52.7%, Н 5.11%, S 11.9%

ЯМР: 1H ($CDCl_3$): 7.02 (m, 3H), 3.96 (s, 3H), 2.83 (t, 2H, $J=7.4$), 1.54-1.04 (m, 2H), 0.93 (t, 3H, $J=7.4$).

2. Получение 2-(бензилтио)анизола

Раствор, содержащий 25,0 г (178 ммоль) 2-метокситиофенола в 50 мл сухого тетрагидрофурана, по каплям прибавляют к смеси из 22,0 г (196 ммоль) трет-бутоксиды калия и 100 мл тетрагидрофурана при 0°C и при перемешивании. К смеси при охлаждении и перемешивании добавляют раствор, содержащий 25 мл (214 ммоль) бензилхлорида в 50 мл тетрагидрофурана и полученную смесь оставляют при перемешивании на 18 часов до достижения температуры окружающей среды. Полученную смесь концентрируют испарением при пониженном давлении и остаток разбавляют 300 мл дихлорметана. Полученный раствор промывают водой, сушат над сульфатом магния и концентрируют испарением при пониженном давлении. Остаток представляет собой целевое соединение в виде твердого вещества белого цвета с т.пл. 69-70°C.

Элементный анализ $C_{14}H_{14}OS$

Вычислено: С 73.0%, Н 6.13%, S 13.9%

Найдено: С 73.0%, Н 6.13%, S 13.7%

ЯМР: 1H ($CDCl_3$): 7.2 (m, 7H), 6.8 (m, 2H), 4.1 (s, 2H), 3.90 (s, 3H).

3. Получение метил-2-пропилтио-3-метоксибензоата

Раствор, содержащий 65,3 г (318 ммоль) 3-(4,4-диметил-оксазолин-2-ил)анизола в 400 мл сухого тетрагидрофурана, охлаж-

дают до -70°C и к нему добавляют при перемешивании и охлаждении 165,5 мл (414 ммоль) 2,5М бутиллития. Темно-красный раствор нагревают до -40°C в течение 90 мин при перемешивании, и после этого снова охлаждают до -70°C и добавляют по каплям при перемешивании и охлаждении 62,2 г (414 ммоль) дипропилдисульфида в 100 мл сухого тетрагидрофурана. Смесь оставляют на 90 минут до достижения температуры окружающей среды и полученную молочную суспензию розового цвета нейтрализуют 300 мл насыщенного водного раствора хлористого аммония. Фазы разделяют, органический слой сушат над сульфатом магния, фильтруют и концентрируют испарением при пониженном давлении. Полученное масло золотистого цвета подвергают фракционной перегонке при 0,6 мм Hg (80 Па) на колонке Vigreux (2×10 см), получая 76,0 г (86% от теоретического) 2-пропилтио-3-(4,4-диметилпиперазин-2-ил)анизола в виде светло-желтого масла с т.кип. $155-157^{\circ}\text{C}$ (0,6 мм Hg).

ЯМР: ^1H (CDCl_3): 7.25(t, 1H, J=7.8), 7.06(dd, 1H, J=7.6, 1.3), 6.90(dd, 1H, J=8.3, 1.2), 4.09(s, 2H), 3.87(s, 3H), 2.76(t, 2H, J=7.2), 1.44(m, 2H), 1.37(s, 6H), 0.89(t, 3H, J=7.4).

Суспензию, содержащую 58,2 г (209 ммоль) 2-пропилтио-3-(4,4-диметилпиперазин-2-ил)анизола в 6л водном растворе соляной кислоты, нагревают при температуре образования флегмы при перемешивании в течение 18 часов. Полученный гомогенный раствор экстрагируют диэтиловым эфиром (3×100 мл), объединенные экстракты сушат над сульфатом магния, фильтруют и концентрируют испарением при пониженном давлении. Полученное масло янтарного цвета подвергают флэш-хроматографии на колонке с силикагелем, элюируя смесями гексана и этилацетата. Фракции, содержащие продукт, объединяют и концентрируют испарением при пониженном давлении, получая 38,7 г (82% от теоретического) 2-пропилтио-3-метоксибензойной кислоты в виде вязкого масла золотистого цвета.

ЯМР: ^1H (CDCl_3): 12.3(brs, 1H), 7.55(dd, 1H, J=7.8, 1.1), 7.33(t, 1H, J=8.1), 7.01(dd, 1H, J=8.3, 0.9), 3.88(s, 3H), 2.80

(t, 2H, J=7.5), 1.49(m, 2H), 0.90(t, 3H, J=7.3).

Готовят суспензию, содержащую 38,1 г (169 ммоль) 2-пропилтио-3-метоксибензойной кислоты в 100 г (843 ммоль) тионилхлорида, и перемешивают при температуре окружающей среды в течение 18 часов. Полученный раствор концентрируют испарением при пониженном давлении, получая 39,7 г сырого хлорангидрида. Порцию последнего в 8,7 г (36 ммоль) растворяют в 100 мл сухого метанола, раствор охлаждают до 0°C и добавляют к нему при перемешивании и охлаждении 4,7 г (46 ммоль) триэтиламина. Смеси дают нагреться до температуры окружающей среды в течение 18 часов при перемешивании. Полученную смесь концентрируют испарением при пониженном давлении и темный маслянистый остаток растворяют в 250 мл диэтилового эфира. Эфирный раствор промывают водой (2×200 мл), сушат над сульфатом магния, фильтруют и концентрируют испарением при пониженном давлении, получая 8,4 г (99% от теоретического) целевого соединения в виде темного масла.

ЯМР: ^1H (CDCl_3): 7.26(t, 1H, J=8.2), 7.03(d, 1H, J=8.4), 6.92(d, 1H, J=8.2), 3.87(s, 3H), 2.77(t, 2H, J=7.4), 1.45(m, 2H), 0.89(t, 3H, J=7.4).

4. Получение 2-метокси-3-пропилтио-4-(трифторметил) пиридина

Раствор, полученный добавлением 110 мл (154 ммоль) 1,4M раствора метиллития в диэтиловом эфире к 70 мл сухого тетрагидрофурана под азотной подушкой, охлаждают на бане, заполненной смесью ацетона со льдом, и к нему добавляют при охлаждении и перемешивании 12,4 г (70 ммоль) 2-метокси-4-(трифторметил)-пиридина и 0,92 мл (7 ммоль) диизопропиламина. Смеси дают нагреться до -40°C и повторно охлаждают на ацетоно-ледяной бане и после этого по каплям и при перемешивании и охлаждении прибавляют дипропилдисульфид (33 мл, 210 ммоль). Полученной смеси дают нагреться до температуры окружающей среды, разбавляют 150 мл воды и экстрагируют диэтиловым эфиром. Эфирный раствор сушат над сульфатом магния и концентрируют испарением при пониженном давлении. Коричневый маслянистый остаток очищают

хроматографией на колонке с силикагелем, элюируя смесью гексана и этилацетата, получая 14,1 г (80% от теоретического) целевого соединения в виде светло-желтого масла.

Элементный анализ $C_{10}H_{12}NF_3OS$

Вычислено: С 47.8%, Н 4.81%, N 5.57%, S 12.8%

Найдено: С 48.1%, Н 5.33%, N 5.33%, S 12.7%

ЯМР: 1H ($CDCl_3$): 8.18(d, 1H, J=5.7), 7.12(d, 1H, J=5.7), 4.00(s, 3H), 2.85(t, 2H, J=7.4), 1.47-1.46(m, 2H), 0.93(t, 3H, J=7.2).

Аналогичным путем получают следующие 3-пропилтиопиридины:

2-метокси-3-пропилтиопиридин - бесцветное масло, кипящее при 80°C при 0,3 мм Hg (40 Па).

Элементный анализ $C_9H_{13}OS$

Вычислено: С 59.0%, Н 7.15%

Найдено: С 59.1%, Н 7.12%

2-хлор-4-метокси-3-пропилтиопиридин - прозрачное масло.

ЯМР: 1H ($CDCl_3$): 8.21(d, 1H, J=5.6), 6.77(d, 1H, J=5.6), 3.97(s, 3H), 2.85(t, 2H, J=7.5), 1.57-1.50(m, 2H), 0.99(t, 3H, J=7.3); и

4-хлор-2-метокси-3-пропилтиопиридин - желтое масло.

ЯМР: 1H ($CDCl_3$): 7.96(d, 1H, J=5.2), 6.98(d, 1H, J=5.6), 4.02(s, 3H), 2.88(t, 2H, J=7.3), 1.54-1.51(m, 2H), 0.96(t, 3H, J=7.8).

5. Получение 2-метокси-6-(трифторметил)бензолсульфонилхлорида

Смесь, содержащая 20,0 г (80 ммоль) смеси, включающей 2-пропилтио-3-(трифторметил)анизол, 2-пропилтио-5-(трифторметил)-анизол и неизвестное соединение в соотношении 82:10:8, 250 мл хлороформа и 125 мл воды охлаждают до 0°C на ледяной бане и медленно при перемешивании добавляют газообразный хлор в количестве 21,6 г (305 ммоль). Через 2,5 часа органический слой отделяют, сушат над сульфатом магния и концентрируют испарением при пониженном давлении. Остаточное прозрачное масло смешивают с 100 мл пентана и оставляют при температуре окружающей среды на 18 часов и далее помещают в холодильник на 3 часа для

кристаллизации масла. Твердые кристаллы отфильтровывают, получая 11,9 г (54% от теоретического) целевого соединения в виде белых кристаллов с т.пл. 86-88°C.

ЯМР: ^1H (CDCl_3): 7.8(dd, 1H, J=7.9, 8.6), 7.53(d, 1H, J=7.9), 7.46(d, 1H, J=8.6), 4.1(s, 3H).

6. Получение 2-метоксибензолсульфонилхлорида

Раствор, содержащий 34,1 г (149 ммоль) 2-(бензилтио)-анизола в 300 мл хлороформа, объединяют с 150 мл воды и полученную смесь охлаждают на ледяной бане. К смеси при охлаждении и перемешивании добавляют газообразный хлор в количестве 39 г (550 ммоль) с такой скоростью, чтобы температура оставалась ниже 5°C. После этого ледяную баню удаляют и полученную смесь желтого цвета оставляют при температуре окружающей среды при перемешивании в течение 18 часов. Образовавшиеся слои отделяют, хлороформный слой сушат над сульфатом магния и концентрируют испарением при пониженном давлении. Остаток представляет собой масло, которое при стоянии образует 21,3 г (69% от теоретического) кристаллов белого цвета целевого соединения с т.пл. 52-53°C.

ЯМР: ^1H (CDCl_3): 7.93-7.76(m, 1H), 7.70-7.65(m, 1H), 7.13-7.06(m, 1H), 4.0(s, 3H).

7. Получение метил-2-хлорсульфонил-3-метоксибензоата

Готовят смесь из 7,8 г (32 ммоль) метил-3-метокси-2-пропилтиобензоата, 2,3 г (130 ммоль) воды и 30 мл ледяной уксусной кислоты и нагревают до 45°C, после чего при перемешивании вводят газообразный хлор (7,6 г, 107 ммоль). Наблюдают переход цвета смеси от темного до светло-оранжевого и повышение температуры до 75°C. Через час смесь выливают в 600 мл водно-ледяной смеси и перемешивают до тех пор, пока весь лед не расплавится. Присутствующие твердые остатки удаляют фильтрованием и растворяют в 500 мл диэтилового эфира. Эфирный раствор сушат над сульфатом магния, фильтруют и концентрируют испарением при пониженном давлении. Твердый коричневый остаток подвергают флеш-хроматографии на силикагеле, элюируя смесью

гексана и этилацетата. Фракции, содержащие продукт, объединяют и концентрируют испарением при пониженном давлении, получая 5,32 г (62% от теоретического) целевого соединения в виде твердого вещества светло-розового цвета с т.пл. 106,5-108,5°C.

Элементный анализ $C_9H_9ClO_5S$

Вычислено: С 40.8%, Н 3.43%, S 12.1%

Найдено: С 40.7%, Н 3.62%, S 11.8%

ЯМР: 1H ($CDCl_3$): 7.68(t, 1H, J=8.0), 7.21(d, 1H, J=8.7), 7.03(d, 1H, J=7.5), 4.05(s, 3H), 3.90(s, 3H),

8. Получение 2,6-диметоксибензолсульфонилхлорида

Готовят раствор, содержащий 15,0 г (108 ммоль) 1,3-диметоксибензола и 13,8 г (119 ммоль) N,N,N',N'-тетраметилэтилендиамина в 225 мл сухого петролейного эфира, охлаждают его до 0°C и затем при охлаждении и перемешивании прибавляют 47,5 мл (119 ммоль) 2,5М раствора бутиллития в гексане. Через час смесь охлаждают примерно до -72°C и при перемешивании добавляют около 70 г (1 моль) двуокиси серы в виде насыщенного раствора в 100 мл сухого диэтилового эфира. Полученную смесь светло-желтого цвета нагревают до 10°C в течение 2 часов, а затем присутствующий клейкий твердый остаток желтого цвета отделяют фильтрованием и промывают несколькими порциями сухого диэтилового эфира. Твердые частицы суспендируют в 400 мл сухого гексана, суспензию охлаждают до 0°C и далее при перемешивании и охлаждении прибавляют 14,6 г (108 ммоль) сульфурилхлорида в виде раствора в 200 мл сухого гексана. Через 45 мин при 0°C полученное твердое вещество розового цвета отделяют фильтрованием, промывают холодным гексаном и растворяют в диэтиловом эфире. Полученный раствор промывают холодной водой (3×150 мл), сушат над сульфатом магния, фильтруют и концентрируют испарением при пониженном давлении, получая 19,4 г (76% от теоретического) целевого соединения в виде кристаллического твердого вещества светло-желтого цвета с т.пл. 89-91°C.

ЯМР: 1H ($CDCl_3$): 7.51(t, 1H, J=8.5), 6.64(d, 2H, J=8.5),

3.92 (s, 6H).

Аналогичным путем были получены следующие соединения:

2,4-диметоксипиридин-3-сульфонилхлорид - твердое вещество коричневого цвета, плавящееся при температуре 118-120°C.

ЯМР: ^1H (CDCl_3): 8.26(d, 1H, J=5.9), 6.66(d, 1H, J=5.9), 4.11(s, 3H), 4.05 (с, 3H).

9. Получение 2-этокси-5-метилбензолсульфонилхлорида

Раствор, содержащий 6,8 г (50 ммоль) 4-этокситолуола в 20 мл дихлорметана, добавляют к раствору из 10 мл (150 ммоль) хлорсульфокислоты в 10 мл дихлорметана при 0°C в условиях охлаждения и перемешивания. Смесь перемешивают при 0°C в течение 1 часа и затем нагревают до температуры окружающей среды и перемешивают еще час. Полученный коричневый раствор выливают в 200 мл смеси воды со льдом и смесь экстрагируют дихлорметаном. Экстракт сушат над сульфатом магния, фильтруют и концентрируют испарением при пониженном давлении. Остаток в количестве 7,9 г (68% от теоретического) в виде твердого вещества светло-коричневого цвета с т.пл. 59-61°C соответствует целевому соединению.

ЯМР: ^1H (CDCl_3): 7.71(d, 1H, J=2.2), 7.4(dd, 1H, J=8.5, 2.2), 6.95(d, 1H, J=8.5), 4.23(q, 2H, J=7.0), 1.49(t, 3H, J=7.0).

10. Получение 2-метокси-4-(трифторметил)пиридин-3-сульфонилхлорида

50 мл воды соединяют с раствором, содержащим 7,0 г (28 ммоль) 2-метокси-3-пропилтио-4-(трифторметил)пиридина в 100 мл дихлорметана, полученную смесь охлаждают на ледяной бане и медленно в условиях охлаждения и перемешивания прибавляют газообразный хлор (5,1 мл, 112 ммоль). Смесь оставляют для нагревания до температуры окружающей среды и перемешивают в течение 3 часов. Слои отделяют, органический слой сушат над сульфатом магния, фильтруют и концентрируют испарением при пониженном давлении. Остаток в виде желтого масла очищают хроматографией на силикагеле, элюируя смесью гексана и этилацетата. Фракции, содержащие продукт, объединяют и концентрируют испарением при пониженном давлении, получая 4,9 г (64% от

теоретического) целевого соединения в виде светло-желтого масла.

ЯМР: ^1H (CDCl_3): 8.6(d, 1H, $J=5.4$), 7.4(d, 1H, $J=5.4$), 4.2(s, 3H).

Масс-спектр имеет молекулярный пик M^+ 275.

Аналогичным путем были получены следующие производные пиридин-3-сульфонилхлорида:

4-хлор-2-метоксипиридин-3-сульфонилхлорид;

ЯМР: ^1H (CDCl_3): 8.23(d, 1H, $J=5.6$), 7.11(d, 1H, $J=5.2$), 4.17(s, 3H);

Масс-спектр имеет молекулярный пик M^+ 275.

2-хлор-4-метоксипиридин-3-сульфонилхлорид - твердое кристаллическое вещество коричневого цвета;

ЯМР: ^1H (CDCl_3): 8.47(d, 1H, $J=5.9$), 7.03(d, 1H, $J=5.9$), 4.13(s, 3H);

и

2-метоксипиридин-3-сульфонилхлорид - прозрачное масло;

ЯМР: ^1H (CDCl_3) 8.46-8.44(dd, 1H, $J=1.9$, 4.9), 8.22-8.19(dd, 1H, $J=1.9$, 7.8), 7.08-7.04(dd, 1H, $J=4.9$, 7.8), 4.16(s, 3H).

11. Получение 2-(1,1,2,2-тетрафторэтокси)бензолсульфонил-хлорида

Раствор, содержащий 3,8 г (55 ммоль) нитрата натрия в 6 мл воды, медленно добавляют в условиях охлаждения и перемешивания к смеси из 12,3 г (50 ммоль) 2-(1,1,2,2-тетрафторэтокси)анилина, 18 мл концентрированной водной соляной кислоты и 5 мл уксусной кислоты, которую предварительно охлаждают до -10°C . Через 45 мин полученную смесь порциями прибавляют при -10°C к раствору, содержащему 1,3 г (18 ммоль) хлорида меди(I) и 0,5 г (4 ммоль) хлорида меди(II) в 50 мл уксусной кислоты, насыщенной двуокисью серы (более 12 г).

Смесь оставляют для нагревания до температуры окружающей среды и перемешивают в течение 90 минут, после чего выливают на лед. Полученную смесь экстрагируют диэтиловым эфиром, экстракт промывают водой, сушат над сульфатом магния и концентрируют испарением при пониженном давлении. Остаток очищают хроматогра-

фией на силикагеле, элюируя смесью гексана и этилацетата. Фракции, содержащие продукт, объединяют и концентрируют испарением при пониженном давлении, получая 11,0 г (75% от теоретического) целевого соединения в виде желтого масла.

ЯМР: ^1H (CDCl_3): 8.07 (dd, 1H, $J=1.7$, 8.0), 7.76 (ddd, 1H, $J=1.7$, 7.8, 8.1), 7.59 (dd, 1H, $J=1.2$, 8.1), 7.45 (ddd, 1H, $J=1.2$, 7.8, 8.0), 6.05 (tt, 1H, $J=4.0$, 53.0).

Масс-спектр имеет молекулярный пик M^+ 292.

12. Получение 3-амино-8-хлор-5-метилтио[1.2.4]триазол-[4.3-с]пиримидингидробромида

Раствор, состоящий из 40 мл (120 ммоль) 3-молярного дицианбромида в дихлорметане, объединяют с 19,0 г (100 ммоль) 5-хлор-4-гидразин-2-метилтиопиримидина и 200 мл сухого изопропилового спирта при температуре окружающей среды в условиях перемешивания. Полученную смесь перемешивают в течение 18 часов и затем разбавляют 500 мл диэтилового эфира. Образовавшиеся твердые частицы отделяют фильтрованием и сушат, получая теоретическое количество целевого соединения в виде твердого вещества желтого цвета, плавящегося при температуре более 250°C.

Элементный анализ $\text{C}_6\text{H}_7\text{N}_5\text{BrClS}$

Вычислено: С 24.3%, Н 2.38%, N 23.6%, S 10.8%.

Найдено: С 26.1%, Н 2.69%, N 24.0%, S 12.2%.

ЯМР: ^1H (DMSO-d_6): 7.80 (s, 1H), 2.67 (s, 3H), ;

^{13}C : 150.96, 147.90, 143.10, 138.38, 113.16, 14.22.

Аналогичным путем были получены следующие производные 3-амино-[1,2,4]триазол[4,3-с]пиримидина:

3-амино-8-фтор-5-метилтио[1,2,4]триазол[4,3-с]пиримидина гидробромид - твердое вещество желтого цвета, плавящееся при температуре 168-170°C;

Элементный анализ $\text{C}_6\text{H}_7\text{N}_5\text{BrFS}$

Вычислено: С 25.7%, Н 2.51%, N 25.0%, S 11.4%

Найдено: С 25.7%, Н 2.52%, N 25.0%, S 11.5%

3-амино-8-метокси-5-метилтио[1,2,4]триазол[4,3-с]пиримиди-

на гидробромид - твердое вещество коричневого цвета, плавящееся при температуре 180-182°C;

Элементный анализ $C_7H_{10}N_5BrOS$

Вычислено: С 28.8%, Н 3.45%, N 24.0%, S 11.0%

Найдено: С 29.0%, Н 3.44%, N 23.9%, S 11.1%

3-амино-8-иод-5-метилтио[1,2,4]триазол[4,3-с]пиримидина гидробромид - твердое вещество желтого цвета, плавящееся при температуре 197-199°C;

Элементный анализ $C_6H_7N_5BrIS$

Вычислено: С 18.6%, Н 1.82%, N 18.1%, S 8.26%

Найдено: С 19.0%, Н 2.28%, N 18.0%, S 8.54%

3-амино-8-бром-5-метилтио[1,2,4]триазол[4,3-с]пиримидина гидробромид - твердое вещество желтого цвета, плавящееся при температуре 193-195°C;

Элементный анализ $C_6H_7N_5Br_2S$

Вычислено: С 21.1%, Н 2.07%, N 20.5%, S 9.40%

Найдено: С 21.3%, Н 2.14%, N 20.6%, S 9.33%

3-амино-8-метил-5-метилтио[1,2,4]триазол[4,3-с]пиримидина гидробромид - твердое вещество желтого цвета, плавящееся при температуре 234-236°C;

Элементный анализ $C_7H_{10}N_5BrS$

Вычислено: С 30.6%, Н 3.30%, N 25.5%, S 11.7%

Найдено: С 30.7%, Н 3.52%, N 25.3%, S 11.5%

3-амино-8-этокси-5-метилтио[1,2,4]триазол[4,3-с]пиримидина гидробромид - порошок желтого цвета, плавящийся при температуре 160-163°C; и

3-амино-5-метилтио[1,2,4]триазол[4,3-с]пиримидина гидробромид - твердое вещество коричневого цвета;

ЯМР: 1H (DMSO-d₆): 7.52 (d, 1H, J=6.6), 7.13 (d, 1H, J=6.7), 6.08 (s, 2H), 2.61 (s, 3H).

13. Получение 2-амино-8-хлор-5-метокси[1.2.4]триазол[1,5-с]-пиримидин

Готовят смесь из 15,0 г (51 ммоль) 3-амино-8-хлор-5-метилтио[1,2,4]триазол[4,3-с]пиримидингидробромида, 8,2 мл (76

ммоль) этилацетата и 150 мл метанола и охлаждают на ледяной бане. К смеси медленно добавляют при охлаждении и перемешивании раствор, содержащий 17 мл (76 ммоль) 4,5 молярного раствора метилата натрия в метаноле. По окончании добавления смесь оставляют для нагревания до температуры окружающей среды и перемешивают в течение 18 часов и затем нейтрализуют 2,0 мл уксусной кислоты. Образовавшиеся твердые частицы отделяют фильтрованием, промывают диэтиловым эфиром и сушат, получая 7,7 г (75% от теоретического) целевого соединения в виде порошка коричневого цвета, плавящегося при температуре более 250°C.

Элементный анализ $C_6H_6N_5ClO$

Вычислено: С 36.1%, Н 3.03%, N 35.1%

Найдено: С 36.1%, Н 3.19%, N 34.8%

ЯМР: 1H (DMSO- d_6): 8.0(s, 1H), 6.6(brs, 2H), 4.1(s, 3H);

^{13}C 166.40, 151.65, 147.73, 140.95, 108.57, 56.12.

Аналогичным путем были получены следующие производные 2-амино[1,2,4]триазол[1,5-с]пиримидина:

2-амино-8-фтор-5-метокси[1,2,4]триазол[1,5-с]пиримидин - иглы коричневого цвета, плавящиеся при температуре более 230°C;

Элементный анализ $C_6H_6N_5FO$

Вычислено: С 39.4%, Н 3.30%, N 38.2%

Найдено: С 39.5%, Н 3.28%, N 37.7%

2-амино-5,8-диметокси[1,2,4]триазол[1,5-с]пиримидин - порошок коричневого цвета, плавящийся при температуре 201-203°C;

Элементный анализ $C_7H_9N_5O_2$

Вычислено: С 43.1%, Н 4.65%, N 35.9%

Найдено: С 43.2%, Н 4.67%, N 35.6%

2-амино-7-фтор-5-метокси[1,2,4]триазол[1,5-с]пиримидин - порошок коричневого цвета, плавящийся при температуре более 250°C;

Элементный анализ $C_6H_6N_5FO$

Вычислено: С 39.4%, Н 3.30%, N 38.2%

Найдено: С 39.6%, Н 3.31%, N 38.2%

2-амино-8-иод-5-метокси[1,2,4]триазол[1,5-с]пиримидин - твердое вещество коричневого цвета, плавящееся при температуре более 250°C;

Элементный анализ C₆H₆N₅IO

Вычислено: С 24.8%, Н 2.08%, N 24.1%

Найдено: С 25.0%, Н 1.96%, N 23.8%

2-амино-8-метил-5-метокси[1,2,4]триазол[1,5-с]пиримидин - твердое вещество коричневого цвета, плавящееся при температуре более 250°C;

Элементный анализ C₇H₉N₅O

Вычислено: С 46.9%, Н 5.06%, N 39.1%

Найдено: С 46.7%, Н 4.84%, N 39.1%

2-амино-8-этоксид-5-метокси[1,2,4]триазол[1,5-с]пиримидин - твердое вещество светло-коричневого цвета, плавящееся при температуре 190-191°C; и

2-амино-5-метокси[1,2,4]триазол[1,5-с]пиримидин - твердое вещество коричневого цвета, плавящееся при температуре более 250°C;

ЯМР: ¹H (DMSO-d₆): 7.82(d, 1H, J=6.3), 7.03(d, 1H, J=6.1), 6.31(s, 2H) и 4.12(s, 3H).

14. Получение 2-(N-триметилсилиламино)-8-хлор-5-метокси-[1,2,4]триазол[1,5-с]пиримидина

В предварительно высушенной колбе в атмосфере азота готовят смесь из 12,7 г (85 ммоль) иодида натрия в 425 мл сухого ацетонитрила и к полученной смеси при перемешивании с помощью шприца при температуре окружающей среды прибавляют 9,25 г (10,8 мл, 85 ммоль) хлортриметилсилана. Через 10 минут при перемешивании добавляют 17,0 г (85 ммоль) 2-амино-8-хлор-5-метокси-[1,2,4]триазол[1,5-с]пиримидина и 8,62 г (11,9 мл, 85 ммоль) триэтиламина. Смесь оставляют на 12 часов при температуре окружающей среды при перемешивании и затем разбавляют 500 мл сухого диэтилового эфира. Осажденные соли отделяют фильтрованием на сухом стеклянном фильтре и фильтрат концентрируют испарением при пониженном давлении. Остаток разбавляют дополни-

тельными 500 мл сухого диэтилового эфира и повторяют процедуру удаления осажденной соли, получая целевое соединение в виде твердого остатка в количестве 19,5 г (84% от теоретического).

15. Получение N-8-хлор-5-метокси[1,2,4]триазол[1,5-с]пиримидин-2-ил)-2-метокси-6-(трифторметил)бензолсульфонамида

Готовят раствор 19,5 г (72 ммоль) 2-(N-триметилсилил-амино)-8-хлор-5-метокси[1,2,4]триазол[1,5-с]пиримидина в 150 мл сухого ацетонитрила и при перемешивании в атмосфере азота при температуре окружающей среды прибавляют 27,5 г (100 ммоль) 2-метокси-6-(трифторметил)бензолсульфонилхлорида. К полученной смеси последовательно при перемешивании добавляют 6,7 г (6,9 мл, 85 ммоль) сухого пиридина, 0,66 г (0,60 мл, 8,5 ммоль) сухого диметилсульфоксида и 13,7 г (85 ммоль) фторида цезия. Смесь оставляют для реакции на 8 часов и присутствующие твердые вещества отделяют фильтрованием. Далее их суспендируют в 100 мл 0,38%-го раствора соляной кислоты, отделяют фильтрованием, повторно суспендируют в 100 мл метанола и снова фильтруют. Полученное твердое вещество белого цвета сушат, получая в итоге 21,3 г (68% от теоретического) целевого соединения с т.пл. 216-217°C.

Элементный анализ $C_{14}H_{11}N_5ClF_3O_4S$

Вычислено: С 38.4%, Н 2.53%, N 16.0%

Найдено: С 38.6%, Н 2.50%, N 16.1%.

16. Получение N-(8-хлор-5-метокси[1,2,4]триазол[1,5-с]-пиримидин-2-ил)-2,6-диметоксибензолсульфонамида

Готовят суспензию 0,80 г (4,0 ммоль) 2-амино-8-хлор-5-метокси[1,2,4]триазол[1,5-с]пиримидина в 15 мл сухого ацетонитрила и затем при перемешивании при температуре окружающей среды и при сохранении сухой реакционной системы прибавляют 1,9 г (8,0 ммоль) 2,6-диметоксибензолсульфонилхлорида, 0,63 г (8 ммоль) сухого пиридина и 0,08 г (1 ммоль) сухого диметилсульфоксида. Через 18 часов добавляют 0,32 г сухого пиридина и еще через 18 часов - 0,08 г сухого диметилсульфоксида. Еще через час смесь разбавляют 350 мл дихлорметана, промывают водой

(3×150 мл), сушат над сульфатом магния, фильтруют и концентрируют испарением при пониженном давлении. Остаток в виде оранжевого масла растирают с диэтиловым эфиром, получая после высушивания 1,41 г (88% от теоретического) целевого соединения в виде твердого вещества светло-желтого цвета с т.пл. 215,5-217,5°C.

Элементный анализ $C_{14}H_{14}N_5ClO_5S$

Вычислено: С 42.1%, Н 3.53%, N 17.5%, S 8.02%

Найдено: С 42.2%, Н 3.62%, N 17.1%. S 7.70%

ЯМР: 1H (DMSO- d_6): 11.74(s, 1H), 8.10(s, 1H), 7.44(t, 1H, J=8.5), 6.75(d, 2H, J=8.4), 4.11(s, 3H), 3.88(s, 3H), 3.77(s, 6H).

17. Получение 2-карбометокси-6-метокси-N-(5,8-диметокси-[1,2,4]триазол[1,5-с]пиримидин-2-ил)бензолсульфонамида

Готовят суспензию 0,70 г (3,5 ммоль) 2-амино-5,8-диметокси[1,2,4]триазол[1,5-с]пиримидина в 15 мл сухого ацетонитрила и затем при перемешивании при температуре окружающей среды и сохранении сухой реакционной системы прибавляют 1,84 г (7,0 ммоль) метил-2-хлорсульфонил-3-метоксибензоата, 0,55 г (7 ммоль) сухого пиридина и 0,07 г (0,9 ммоль) сухого диметилсульфоксида. Через 18 часов добавляют 0,92 г сухого пиридина и 0,07 г сухого диметилсульфоксида, а еще через 36 часов добавляют другие 0,92 г сухого пиридина и еще через 18 часов - другие 0,92 г сухого пиридина и другие 0,07 г сухого диметилсульфоксида. Еще через 18 часов смесь разбавляют 300 мл дихлорметана, органическую фазу извлекают, промывают водой (2×200 мл) и раствором 2н водной соляной кислоты (2×200 мл), сушат над сульфатом магния, фильтруют и концентрируют испарением при пониженном давлении. Твердый коричневый остаток растирают с диэтиловым эфиром, получая целевое соединение в виде белого твердого вещества 80%-ой чистоты. Полученное вещество дважды хроматографируют на колонке с силикагелем, элюируя кислой подвижной фазой (смесь дихлорметан/этанол/уксусная кислота), что по большей части не было успешным, и затем перекристаллизовывают из горячего метанола. Выход полученного продукта в виде блестящих белых игл составляет 0,274 г (19% от теоретического) с т.пл. 215-217°C.

Элементный анализ $C_{16}H_{17}N_5O_7S$

Вычислено: С 45.4%, Н 4.05%, N 16.5%, S 7.57%

Найдено: С 44.7%, Н 3.96%, N 16.2%, S 7.93%

ЯМР: 1H (DMSO- d_6): 11.76(s, 1H), 7.60(t, 1H, J=8.3), 7.28(d, 1H, J=8.3), 7.05(d, 1H, J=7.6), 4.07(s, 3H), 3.88(s, 3H), 3.81(s, 3H), 3.78(s, 3H).

18. Получение 2,6-диметокси-N-(5,8-диметокси[1,2,4]триазол[1,5-с]пиримидин-2-ил)бензолсульфонамида

Готовят суспензию 0,80 г (4,1 ммоль) 2-амино-5,8-диметокси[1,2,4]триазол[1,5-с]пиримидина в 15 мл сухого ацетонитрила и затем при перемешивании при температуре окружающей среды в условиях сохранения сухой реакционной системы прибавляют 1,94 г (8,2 ммоль) 2,6-диметоксибензолсульфонилхлорида, 0,65 г (8,2 ммоль) сухого пиридина и 0,08 г (1 ммоль) сухого диметилсульфоксида. Через 24 часа смесь разбавляют 200 мл дихлорметана, органическую фазу извлекают, промывают водой (2×200 мл) и раствором 2N водной соляной кислоты (2×200 мл), сушат над сульфатом магния, фильтруют и концентрируют испарением при пониженном давлении. Твердый оранжевый остаток растворяют в 5 мл дихлорметана и затем по каплям при перемешивании добавляют диэтиловый эфир. Образовавшийся твердый остаток серого цвета отделяют фильтрованием, промывают эфиром и сушат при 50°C при пониженном давлении, получая 1,11 г (68% от теоретического) целевого соединения в виде твердого вещества грязно-белого цвета с т.пл. 239–240,5°C.

Элементный анализ $C_{15}H_{17}N_5O_6S$

Вычислено: С 45.6%, Н 4.33%, N 17.7%

Найдено: С 45.7%, Н 4.19%, N 17.6%

ЯМР: 1H (DMSO- d_6): 11.54(s, 1H), 7.55(s, 1H), 7.44(t, 1H, J=8.4), 6.74(d, 2H, J=8.4), 4.06(s, 3H), 3.88(s, 3H), 3.76(s, 6H).

19. Получение 2-метокси-5-метил-N-(5,8-диметокси[1,2,4]триазол[1,5-с]пиримидин-2-ил)бензолсульфонамида

Готовят смесь из 1,0 г (5,1 ммоль) 2-амино-5,8-диметокси[1,2,4]триазол[1,5-с]пиримидина, 2,1 г (10,0 ммоль) 2-метокси-

5-метилбензолсульфонилхлорида и 15 мл сухого ацетонитрила и затем при перемешивании при температуре окружающей среды и в присутствии средства для сохранения сухой реакционной системы прибавляют 0,8 мл (10 ммоль) сухого пиридина и 71 микролитр (1,0 ммоль) сухого диметилсульфоксида. Смесь оставляют при перемешивании в течение 18 часов и затем добавляют еще 1,0 г (5,0 ммоль) 2-метокси-5-метил-бензолсульфонилхлорида. Перемешивание продолжают еще 24 часа, в течение которых добавляют еще 0,4 мл сухого пиридина и 35 микролитров сухого диметилсульфоксида. После перемешивания в течение 9 суток летучие удаляют испарением при пониженном давлении. Темный остаток разбавляют 50 мл воды и 50 мл диэтилового эфира и образовавшиеся твердые вещества отделяют фильтрованием. После этого их суспендируют в дихлорметане и после 2-часового перемешивания отделяют фильтрованием, получая 1,2 г (63% от теоретического) целевого соединения в виде белого порошка с т.пл. 217-219°C.

Элементный анализ $C_{15}H_{17}N_5O_5S$
 Вычислено: С 47.5%, Н 4.52%, N 18.5%, S 8.45%
 Найдено: С 47.7%, Н 4.61%, N 18.3%, S 8.80%
 ЯМР: 1H (DMSO- D_6): 12.0(brs, 1H), 8.1(s, 1H), 7.7(t, 1H, J=8.2), 7.56-7.52(m, 2H), 4.06(s, 3H), 4.1(s, 3H), 3.9(s, 3H).

20. Получение N-(5,8-диметокси[1,2,4]триазол[1,5-с]пиримидин-2-ил)-2-метокси-4-(трифторметил)пиридин-3-сульфонамида

Готовят смесь из 0,75 г (93,8 ммоль) 2-амино-5,8-диметокси[1,2,4]триазол[1,5-с]пиримидина, 2,1 г (7,6 ммоль) 2-метокси-4-(трифторметил)пиридин-3-сульфонилхлорида и 10 мл сухого ацетонитрила и к полученной смеси при температуре окружающей среды при перемешивании и в присутствии средства для исключения влаги из реакционной системы прибавляют 0,61 мл (7,6 ммоль) сухого пиридина, 43 микролитра (0,6 ммоль) сухого диметилсульфоксида и небольшое количество сухих молекулярных сит 4А. Полученную смесь перемешивают в течение 5 суток. Затем к смеси прибавляют еще 1,0 г (3,4 ммоль) 2-метокси-4-(трифторметил)пиридин-3-сульфонилхлорида и 0,30 мл (3,5 ммоль) сухого пиридина и смесь перемешивают еще 2 суток. Далее добавляют другие 0,30 мл (3,5 ммоль) сухого пиридина и продолжают перемешивание

еще 4 суток. Смесь разбавляют 100 мл дихлорметана, промывают водным раствором 2н соляной кислоты (2×100 мл), сушат над сульфатом магния, фильтруют и концентрируют испарением при пониженном давлении. Полученный твердый коричневый остаток хроматографируют на колонке с силикагелем, элюируя смесью дихлорметана и этанола, получая 0,90 г (54% от теоретического) целевого соединения в виде твердого вещества белого цвета с т.пл. 214-216°C.

Элементный анализ $C_{14}H_{13}N_6F_3O_5S$

Вычислено: С 38.7%, Н 3.02%, N 19.4%, S 7.38%

Найдено: С 38.5%, Н 3.15%, N 19.4%, S 7.43%

ЯМР: 1H (DMSO- d_6): 12.3 (brs, 1H), 8.64 (d, 1H, J=5.3), 7.60-7.58 (m, 2H), 4.06 (s, 3H), 3.95 (s, 3H), 3.86 (s, 3H).

21. Получение 2-метоксикарбонил-6-метокси-N-(5-хлор-8-метокси[1,2,4]триазол[1,5-а]пиридин-2-ил)бензолсульфонамида

Готовят смесь 0,90 г (4,5 ммоль) 2-амино-5-хлор-8-метокси-[1,2,4]триазол[1,5-а]пиридина и 35 мл сухого ацетонитрила и затем при перемешивании при температуре окружающей среды и сохранении сухой реакционной системы прибавляют 2,39 г (9,06 ммоль) метил-2-хлорсульфонил-3-метоксибензоата, 0,72 г (9,1 ммоль) сухого пиридина и 0,071 г (0,91 ммоль) сухого диметилсульфоксида. Через 16 часов добавляют еще 0,35 г (4,5 ммоль) сухого пиридина и после дополнительного 48-часового перемешивания летучие компоненты системы удаляют испарением при пониженном давлении. Полученный остаток разбавляют 50 мл дихлорметана и 50 мл водного раствора 2н соляной кислоты и смесь энергично перемешивают в течение 72 часов. Присутствующий твердый остаток отделяют фильтрованием и промывают водой (3×25 мл), дихлорметаном (3×10 мл) и диэтиловым эфиром (3×10 мл), получая целевое соединение в виде твердого вещества белого цвета. Суммарный фильтрат и промывные воды объединяют и разбавляют 25 мл дихлорметана и 25 мл водного раствора 2н соляной кислоты в делительной воронке. Фазы разделяют, органический слой промыва-

ют 3×50 мл водного раствора 2н соляной кислоты, сушат над сульфатом натрия, фильтруют и концентрируют испарением при пониженном давлении, получая твердое вещество желтого цвета. Последнее суспендируют в 5,0 мл дихлорметана, твердые остатки отделяют фильтрованием и быстро промывают дихлорметаном (2×5 мл) и диэтиловым эфиром (2×15 мл), получая дополнительное количество целевого соединения в виде белого твердого вещества. Суммарное количество целевого соединения составляет 1,09 г (56% от теоретического) с т.пл. (с разложением), равной 290–292°C.

Элементный анализ $C_{16}H_{15}N_4ClO_6S$

Вычислено: С 45.0%, Н 3.45%, N 13.1%, S 7.51%

Найдено: С 44.9%, Н 3.39%, N 12.8%, S 7.79%

ЯМР: 1H (DMSO- d_6): 11.60 (s, 1H), 7.62 (t, 1H, $J=7.69$), 7.24 (m, 2H), 7.05 (m, 2H), 3.92 (s, 3H), 3.83 (s, 3H), 3.77 (s, 3H).

22. Получение 2-метоксикарбонил-6-метокси-N-(5,8-диметокси[1,2,4] триазол[1,5-а] пиридин-2-ил) бензолсульфонамида

0,871 г (2,04 ммоль) 2-метоксикарбонил-6-метокси-N-(5-хлор-8-метокси[1,2,4] триазол[1,5-а] пиридин-2-ил) бензолсульфонамида помещают в сухую колбу, снабженную резиновой и стеклянной пробками. Вещество растворяют в 20 мл сухого диметилсульфоксида, добавляемого посредством трубочки, и 1,39 мл 6,12М раствора метилата натрия в метаноле, добавляемого с помощью шприца, при температуре окружающей среды и при перемешивании. Через 16 часов прибавляют еще 0,050 мл раствора метилата натрия и смесь оставляют для реакции на 18 часов. Далее смесь подкисляют достаточным количеством ледяной уксусной кислоты и выливают в 250 мл дихлорметана. Смесь промывают водой (6×200 мл), сушат над сульфатом натрия, фильтруют и концентрируют испарением при пониженном давлении. Полученный твердый белый остаток растворяют в 600 мл дихлорметана и очищают хроматографией на колонке с силикагелем, элюируя смесями дихлорметана и этанола со стартовой смесью 99:1 (объемн.), увеличивая количество этанола со временем. Фракции, содержащие продукт, объединяют и концентрируют испарением при пониженном давлении, получая 496 мг (57% от

теоретического) целевого соединения в виде грязно-белого твердого вещества с т.пл. (с разложением), равной 274-276°C.

Элементный анализ $C_{17}H_{18}N_4O_7S$

Вычислено: С 48/3%, Н 4.30%, N 13.3%, S 7.59%

Найдено: С 48.6%, Н 4.26%, N 13.1%, S 7.83%

ЯМР: 1H (DMSO-d₆): 11.33 (s, 1H), 7.61 (t, 1H, J=8.06), 7.28 (d, 1H, J=8.51), 7.02 (d, 2H, J=7.94), 6.42 (d, 1H, J=8.55), 3.98 (s, 3H), 3.85 (s, 3H), 3.82 (s, 3H), 3.75 (s, 3H).

23. Оценка послевсходовой гербицидной активности

Семена желаемых видов тестируемых растений засевают в растительной смеси Grace-Sierra MetroMix 306 с pH 6,0-6,8 и содержанием органического вещества около 30% в пластмассовые горшочки с площадью поверхности 64 кв.см. Чтобы обеспечить хорошие ростки и в дальнейшем получить здоровые растения, при необходимости производят обработку гербицидом и/или другим химическим средством, либо осуществляют природную обработку. Растения вырастают в течение 7-21 суток в теплице в условиях фотопериода около 15 часов, который поддерживают при температуре 23-29°C в течение дня и 22-28°C в течение ночи. Удобрения и воду добавляют на регулярной основе, а дополнительное освещение обеспечивают с помощью галогенных ламп верхнего освещения мощностью 1000 ватт. Растения используют для испытаний по достижении ими первой или второй фазы распускания листьев.

Для получения стандартного раствора взвешенное количество каждого тестового соединения, исходя из определяемой наивысшей концентрации, помещают в стеклянный сосуд вместимостью 20 мл и растворяют в 4 мл смеси ацетона и диметилсульфоксида (97:3 по объему). Если соединение в смеси легко не растворяется, смесь нагревают и/или на нее воздействуют ультразвуком. Полученные концентрированные стандартные растворы разбавляют водной смесью, содержащей ацетон, воду, изопропиловый спирт, диметилсульфоксид, концентрат растительного масла Atplus 411F, поверхностно-активное вещество (ПАВ) Тритон X-155 (Triton X-155), взятыми в соотношении 48,5:39:10:1,5:1,0:0,02 (по объему), для

получения распылительных растворов известной концентрации. Растворы, содержащие наивысшую определяемую концентрацию, получают разведением аликвот в 2 мл стандартного раствора 13 мл смеси, а наименьшие концентрации получают разведением соответствующих меньших по объему порций стандартного раствора. Далее аликвоты, составляющие около 1,5 мл каждого раствора известной концентрации, равномерно распыляют на каждый из горшочков с тестовым растением с помощью пульверизатора Де Вилбисса (DeVilbiss), приводимого в движение сжатым воздухом под давлением от 140-280 кПа (2-4 фунта/кв.дюйм), для того, чтобы получить хорошее покрытие на каждом растении. Контрольные растения опрыскивают аналогично, используя водную смесь. В настоящем опыте наносимая концентрация в 1 мг/л (1 ppm) соответствует норме расхода в I г/га.

Обработанные и контрольные растения помещают в теплицу, как описано выше, и проводят подпочвенное орошение для предотвращения вымывания тестовых соединений. Через две недели производят визуальное сравнение состояния тестируемых и необработанных растений и оценивают его по шкале от 0 до 100%, где 0 соответствует отсутствию какого-либо повреждения растения и 100 соответствует его полной гибели. Некоторые из тестовых соединений, применяемых норм расхода, видов тестируемых растений и полученных результатов приведены в Таблице 2.

ТАБЛИЦА 2

ГЕРБИЦИДНАЯ АКТИВНОСТЬ ПРИ ПОСЛЕВСХОДОВОЙ ОБРАБОТКЕ

№	норма Соед. расхода, ррт	BWCHK	BWCKB	BWMQ	BWMGL	BWPIG	BWVEL	BWVIO	BWWBK	GWBLG	GWGFT	GWROX	GWWOT
1	125	--	100	99	100	95	99	--	83	50	85	--	55
2	62.5	--	100	95	100	95	75	--	83	80	93	--	70
3	125	--	90	85	99	95	70	--	80	20	70	--	0
4	125	--	97	97	83	90	80	--	70	10	93	--	0
5	31.3	90	85	80	85	100	80	80	80	60	75	--	75
6	15.6	--	98	98	85	100	90	--	90	70	50	--	70
7	62.5	--	100	98	90	80	95	--	--	75	50	--	99
8	125	--	98	95	98	80	95	--	80	85	78	--	90
9	125	--	100	90	90	90	85	--	--	60	75	--	75
10	1.95	100	98	95	70	100	85	80	--	80	75	90	98
11	31.3	80	95	88	90	90	90	75	85	30	75	78	50
12	31.3	90	100	90	80	85	90	85	85	85	85	85	85
13	3.9	85	100	65	88	80	90	80	85	75	85	90	90
14	15.6	100	90	85	90	95	75	85	90	90	90	90	90
15	7.8	75	100	75	88	100	55	85	80	75	75	90	90
16	125	98	98	--	98	100	98	60	88	15	0	78	0
17	15.6	90	100	100	75	98	--	75	65	95	80	93	78
18	3.9	85	100	85	88	95	85	85	90	75	85	90	88
19	7.8	100	100	65	80	100	65	75	80	70	60	85	98
20	250	--	90	95	75	85	100	--	80	30	0	--	20
21	31.3	--	100	99	75	97	75	--	99	50	70	--	60
22	7.8	90	90	--	98	100	95	90	80	50	40	90	78
23	15.6	--	100	99	97	97	99	--	90	75	95	--	95
24	31.3	98	100	70	90	90	90	85	90	50	90	60	80
25	31.3	75	100	85	80	90	75	75	85	65	75	90	80

26	2.0	90	98	100	78	100	80	78	75	75	50	95	90
27	7.8	88	100	100	80	95	95	70	93	85	78	98	90
28	1.0	80	100	100	78	98	80	80	80	93	--	70	75
29	125	85	98	--	80	100	90	75	20	50	40	85	50
30	7.8	70	100	80	95	90	85	58	80	40	80	85	80
31	15.6	100	100	80	95	80	90	85	80	75	40	80	98
32	31.3	95	98	--	85	95	90	95	60	0	0	30	0
33	7.8	90	95	95	90	95	88	85	85	60	80	85	78
34	7.8	100	100	65	75	95	90	85	100	90	50	80	95
35	125	90	100	95	98	95	98	70	100	60	30	80	95
36	3.9	90	90	100	78	100	70	78	75	60	95	90	90
37	15.6	95	78	100	95	100	90	95	80	78	98	95	90
38	3.9	98	95	100	80	100	90	78	90	85	60	98	98
39	3.9	95	100	100	90	90	70	80	80	70	60	80	78
40	15.6	95	100	100	90	95	90	78	78	65	80	78	78
41	7.8	98	90	95	85	95	90	90	90	85	90	98	80
42	15.6	100	100	78	90	95	90	50	78	75	40	20	75
43	31.3	95	100	30	95	95	95	95	90	50	75	30	55
44	3.9	95	100	55	90	90	78	60	78	45	20	35	60
45	7.8	90	100	55	95	98	60	75	80	35	50	30	0
46	62.5	100	100	75	90	100	100	95	95	70	70	45	55
47	7.8	85	95	100	80	95	80	60	85	55	90	80	80
48	62.5	95	100	78	90	95	98	95	50	90	20	90	30
49	15.6	95	95	100	80	90	90	90	90	65	30	70	90
50	2.0	100	90	70	90	100	70	90	85	--	40	95	85
51	62.5	95	90	70	78	95	50	85	90	90	100	95	100
52	7.8	100	100	65	75	95	95	78	95	78	45	0	70
53	31.3	--	95	60	85	100	90	90	78	90	95	95	95
54	15.6	100	90	80	78	100	55	90	90	100	80	95	95
55	0.5	85	100	100	75	98	75	70	80	45	60	75	80
56	62.5	90	100	80	85	95	90	85	90	80	78	95	90

57	125	95	90	65	80	85	80	45	80	85	50	80	55
58	62.5	95	85	78	85	100	90	90	80	95	78	95	95
59	7.8	100	100	78	80	100	90	95	95	95	25	95	90
60	2.0	95	100	65	60	90	90	60	78	70	80	80	70
61	250	80	95	90	78	70	85	85	85	70	20	30	20
62	31.3	80	90	95	90	100	95	80	85	78	90	90	90
63	31.3	95	90	95	90	100	78	90	90	90	90	95	90
64	31.3	65	85	95	80	90	65	80	80	70	85	70	80
65	15.6	95	95	100	90	100	95	90	90	90	90	95	100
66	62.5	95	60	85	78	90	90	85	90	90	80	90	90
67	31.3	100	70	95	90	85	90	90	80	85	70	90	85
68	62.5	90	70	100	90	100	85	85	78	80	90	90	85
69	31.3	65	55	60	55	85	70	40	90	65	60	65	60
70	7.8	80	100	78	90	95	95	90	70	95	70	90	80
71	7.8	75	95	95	90	90	90	80	70	80	60	90	60
72	15.6	90	95	95	50	90	78	75	90	90	80	95	78
73	15.6	95	80	100	70	70	80	75	90	70	65	90	75
74	2.0	90	80	95	85	100	80	70	78	78	75	85	78
75	2.0	75	100	100	90	90	95	75	90	70	50	70	75
76	31.3	78	90	95	90	100	90	85	85	85	50	100	90
77	15.6	95	90	70	78	95	85	95	95	95	95	95	95
78	15.6	90	78	80	90	100	95	90	95	78	30	80	90
79	250	65	80	80	78	95	75	80	90	80	100	85	90
80	1.0	95	95	100	85	100	80	78	90	70	90	60	70
81	3.9	90	90	95	95	100	90	75	90	78	80	80	95
82	31.3	95	85	75	90	100	90	90	80	80	0	78	78
83	15.6	90	98	80	80	50	35	20	80	0	20	10	0
84	7.8	80	95	95	85	100	85	78	90	70	45	60	78
85	7.8	95	95	60	75	80	90	70	80	78	30	30	80
86	31.3	90	80	95	80	85	70	85	90	65	0	78	78
87	31.3	95	85	80	78	90	90	80	90	80	70	75	90

88	125	95	70	60	90	95	80	80	95	75	40	60	40
89	125	85	90	80	90	90	85	90	90	85	80	80	70
90	62.5	90	90	95	65	90	80	78	90	75	20	80	75
91	125	90	78	70	78	95	80	90	90	80	65	90	90
92	3.9	90	85	90	90	90	75	70	80	70	70	90	78
93	31.3	95	85	95	90	95	65	70	85	60	80	85	78
94	15.6	85	85	95	90	95	85	78	90	78	90	90	75
95	31.3	90	100	30	95	95	95	80	90	78	40	30	45
96	31.3	95	95	60	90	100	90	78	90	90	90	95	95
98	62.5	95	70	60	85	95	90	90	90	90	90	95	95
99	62.5	100	100	100	80	100	80	80	85	78	90	80	78
100	15.6	98	100	100	90	78	60	70	78	50	60	50	40
101	250	90	20	70	78	90	70	50	85	0	0	0	0
102	62.5	85	90	90	90	98	80	60	78	0	50	55	20
103	125	45	75	85	78	78	65	60	90	0	50	75	25
104	125	95	100	95	78	90	95	60	95	0	30	40	20
105	15.6	90	100	100	88	100	90	88	85	88	90	90	90
106	15.6	90	95	80	70	90	75	85	80	90	85	90	90
107	250	80	95	88	60	95	40	75	80	70	50	88	85
108	62.5	90	100	90	65	85	85	80	80	85	70	88	90
109	31.3	90	100	75	85	90	85	70	75	10	20	85	0
110	31.3	95	98	40	90	70	80	55	70	20	0	55	30
111	15.6	85	100	--	40	100	80	90	85	90	50	90	83
112	250	83	100	--	50	100	88	88	80	90	50	90	90
113	250	78	100	90	70	95	60	83	50	70	30	80	75
114	15.6	80	100	--	75	100	50	75	95	88	85	85	88
115	250	88	100	--	50	100	83	88	88	88	20	90	88
116	250	78	90	--	85	100	75	90	70	65	25	90	60
117	7.8	90	100	98	80	95	75	88	80	80	25	88	90
118	15.6	90	100	100	78	98	93	65	95	85	15	85	80
119	125	90	100	--	70	80	80	90	90	60	20	90	90

120	31.3	85	95	95	80	100	85	85	90	80	50	85	80
121	7.8	99	100	100	70	95	78	70	78	55	40	78	75
122	15.6	85	100	--	70	100	80	95	80	50	0	85	25
123	15.6	95	100	--	70	95	85	90	85	75	95	90	95
124	250	78	--	90	50	90	50	60	70	50	30	85	65
125	125	85	100	80	50	90	20	50	80	30	30	85	40
126	15.6	95	100	100	80	100	75	70	78	0	0	55	10
127	7.8	100	90	95	35	95	55	75	90	80	60	90	75
128	15.6	100	90	95	0	95	25	50	70	78	0	70	30
129	7.8	95	95	65	0	95	50	50	80	78	50	65	78
130	62.5	95	90	100	80	95	85	80	85	78	55	85	75
131	15.6	80	95	95	75	95	95	75	90	75	20	90	60
132	31.3	95	100	100	78	95	95	90	95	90	50	85	90
133	15.6	95	85	95	70	100	80	75	78	78	30	90	90
134	7.8	98	100	98	78	90	99	85	90	95	50	95	95
135	31.3	100	90	--	100	100	--	88	75	0	0	70	0
136	3.9	85	100	--	90	100	70	78	90	35	20	78	60
137	125	90	80	60	75	95	65	85	85	95	55	95	80
138	15.6	95	90	90	90	95	90	85	80	55	75	90	65
139	3.9	100	70	100	90	95	90	95	90	80	50	90	90
140	125	95	90	80	95	100	95	85	90	85	40	80	90
141	31.3	85	88	95	90	100	78	85	78	78	88	90	85
142	3.9	95	95	100	80	95	95	95	80	75	50	50	75
143	62.5	90	90	90	90	100	95	78	90	85	90	80	80
144	62.5	90	40	95	78	100	78	60	75	80	80	80	75
145	250	60	50	80	90	100	80	--	80	78	75	78	70
146	7.8	95	40	40	78	80	90	90	85	20	10	70	0
147	31.3	90	85	50	85	70	90	85	80	0	40	90	60
148	31.3	90	90	50	80	70	90	90	70	0	0	0	0
149	31.3	70	90	20	80	30	90	85	85	50	0	50	15
150	3.9	100	80	60	85	90	90	90	75	90	90	70	78

151	62.5	90	80	20	55	65	70	55	75	78	60	78	60
152	125	80	60	20	20	60	20	0	20	10	20	0	20
153	250	--	45	--	80	80	85	0	80	40	70	50	0
154	125	80	90	45	70	80	65	50	80	0	0	30	0
155	31.3	95	85	90	78	95	90	95	100	70	100	90	95
156	7.8	80	90	75	78	95	80	80	90	95	100	100	95
157	31.3	50	80	50	70	80	20	70	60	50	70	80	60
158	15.6	95	90	60	80	80	85	75	95	55	40	55	60
159	15.6	95	90	75	78	100	90	70	90	78	100	95	85
160	62.5	85	90	50	40	90	90	70	90	60	50	80	20
161	31.3	85	70	80	30	60	50	90	80	70	30	90	80
162	62.5	90	85	60	20	80	65	78	95	50	20	70	0
163	62.5	95	80	90	20	95	70	70	80	90	78	90	90
164	31.3	90	80	85	80	100	75	85	80	75	70	90	90
165	31.3	90	95	60	60	90	78	75	85	70	30	95	80
168	15.6	85	90	60	70	85	90	80	95	60	30	0	10
169	125	30	70	60	40	90	70	70	70	80	30	90	80
172	15.6	98	85	90	75	85	80	80	90	90	80	70	45
175	15.6	--	85	85	75	85	55	80	90	95	30	70	90
177	15.6	98	100	--	90	100	90	95	100	75	--	50	25
181	31.3	70	85	85	75	95	70	75	75	70	80	75	20
182	16.5	70	95	0	85	30	85	70	40	65	0	65	75
183	31.3	90	95	85	85	100	90	40	85	80	70	95	75
184	7.8	95	100	95	90	100	100	95	90	70	--	0	0
185	2.0	85	100	95	75	90	75	80	80	30	0	0	0
186	125	75	85	70	75	75	45	70	55	90	45	70	30
187	1.0	95	100	90	80	75	--	0	75	0	65	0	0
188	31.3	80	100	55	75	95	100	80	75	30	30	40	20
189	31.3	--	100	95	75	78	70	75	100	0	20	0	0
190	31.3	70	90	85	60	85	85	75	90	40	80	10	30
191	7.8	80	95	80	80	95	20	75	90	90	75	90	90

192	31.3	--	95	78	55	100	15	20	90	60	30	45	78
193	62.5	--	95	100	25	95	25	20	80	45	30	75	75
194	2.0	80	100	80	80	85	65	75	75	30	25	0	0
195	7.8	75	100	90	90	100	85	80	90	0	75	30	0
196	7.8	100	95	75	75	100	70	85	95	80	70	95	90
197	2.0	90	95	75	80	100	65	75	95	95	100	95	95
198	3.9	90	100	95	70	100	0	60	80	85	30	80	80
199	2.0	75	100	80	80	100	70	80	80	20	20	0	0
200	3.9	100	95	100	90	100	80	95	90	60	80	95	90
201	15.6	--	95	100	60	100	45	75	85	90	75	95	90
202	15.6	95	100	100	100	95	90	85	90	25	40	0	35
203	3.9	95	95	75	55	95	60	25	100	25	0	0	0
204	7.8	100	100	95	80	75	100	80	65	90	55	45	45
205	15.6	95	95	95	95	100	95	80	100	40	20	15	0
206	62.5	95	100	40	85	100	100	85	85	50	0	60	15
208	15.6	100	100	100	85	100	90	100	100	70	70	25	15
209	31.3	100	90	--	70	95	80	85	90	40	--	0	0
210	62.5	95	95	100	90	100	95	100	90	70	--	55	55
211	7.8	95	90	90	80	90	70	90	90	0	--	0	0
212	3.9	100	85	100	40	90	70	90	85	100	70	100	90
215	31.3	80	95	--	95	100	80	75	85	70	80	100	95
216	250	60	40	40	70	70	70	75	80	90	85	90	85
218	31.3	95	95	95	80	95	85	45	85	60	98	85	80

BWCHK - звездчатка (*Stellaria media*)

BWLMQ - марь белая (*Chenopodium album*)

BWPIG - щирица колосистая (*Amaranthus retroflexus*)

BWVIO - фиалка (*Viola tricolor*)

GMBLG - лисохвост мышехвостиковидный (*Alopecurus myosuroides*)

GWROX - оранжевое сорго (*Sorghum bicolor*)

BWSCB - дурнишник (*Xanthium strumarium*)

BWMGL - ипомея (*Ipomoea hederacea*)

BWVEL - канатник Теофраста (*Adutilon theophrasti*)

BWWBK - горец вьющийся (*Polygonum convolvulus*)

GWGFT - щетинник гигантский (*Setaria faberi*)

GWWOT - овес пустой (овсюг) (*Avena fatua*)

24. Оценка довсходовой гербицидной активности

Семена желаемых видов тестируемых растений засевают в почвенной матрице, приготовленной смешиванием суглинистой почвы, которая включает около 43% ила, около 19% глины и около 38% песка и имеет рН около 8.1, и 1,5% органического вещества и песка в соотношении 70:30. Почвенная матрица находится в пластмассовых горшочках с площадью поверхности 161 см². Чтобы обеспечить хорошие ростки и в дальнейшем получить здоровые растения, при необходимости производят обработку гербицидом и/или другим химическим средством, либо осуществляют природную обработку.

Для получения стандартного раствора взвешенное количество каждого тестового соединения, исходя из определяемой наивысшей концентрации, помещают в стеклянный сосуд вместимостью 20 мл и растворяют в 8 мл смеси ацетона и диметилсульфоксида (97:3 по объему). Если соединение в смеси легко не растворяется, смесь нагревают и/или на нее воздействуют ультразвуком. Полученные стандартные растворы разводят смесью воды и ПАВ Твина 155 (Tween 155) для получения растворов известной концентрации. Растворы, содержащие наивысшую тестируемую концентрацию, получают разведением аликвот в 4 мл стандартного раствора 8 мл смеси, а наименьшие концентрации получают разведением соответствующих меньших по объему порций стандартного раствора. Далее, аликвоты, составляющие около 2,5 мл каждого раствора известной концентрации, равномерно распыляют на каждый из засеянных горшочков с помощью стеклянного шприца Корнуэлла (Cornwall) на 5 мл, снабженного полым коническим соплом Тиджет NN-3 (TeeJet) для того, чтобы получить хорошее покрытие на почве в каждом горшочке. Контрольные горшочки опрыскивают аналогично, используя водную смесь. Наивысшей концентрации в 4,48 кг/га достигают при использовании 50 мг тестируемого соединения. Обработанные и контрольные горшочки помещают в теплицу приблизительно с 15-часовым фотопериодом, который поддерживают при температуре 23-29°C в течение дня и 22-28°C в течение ночи. Удобрения и воду

добавляют на регулярной основе, а дополнительное освещение обеспечивают с помощью галогенных ламп верхнего освещения мощностью 1000 ватт. Воду добавляют надпочвенным орошением. Через три недели производят визуальное сравнение состояния тестируемых ростков и выросших растений по сравнению с необработанными и оценивают его по шкале от 0 до 100%, где 0 соответствует отсутствию какого-либо повреждения растения и 100 соответствует его полной гибели или отсутствию прорастания. Некоторые из тестовых соединений, применяемых норм расхода, видов тестируемых растений и полученных результатов приведены в Таблице 3.

ТАБЛИЦА 3

ГЕРБИЦИДНАЯ АКТИВНОСТЬ ПРИ ДОВСХОДОВОЙ ОБРАБОТКЕ

норма													
Соед. расхода, №	ррт	BWCKB	BWLMQ	BWMGL	BWPIG	BWVEL	BWWPT	GWBLG	GWBRN	GWCRB	GWGFT	GWROX	GWWOT
1	0.28	--	--	70	100	50	--	60	40	--	95	--	70
2	0.28	--	--	60	95	40	--	70	100	--	95	--	60
3	0.28	--	--	30	100	0	--	0	70	--	50	--	30
4	0.28	--	--	40	95	40	--	0	60	--	90	--	0
5	0.14	95	98	90	98	90	--	75	90	85	95	95	80
6	0.14	--	--	80	98	95	--	90	90	--	90	--	60
7	0.14	--	--	80	98	85	--	80	70	--	60	--	50
8	0.14	--	--	60	90	60	--	40	70	--	30	--	50
9	0.14	--	--	90	95	85	--	70	90	--	80	--	50
10	0.018	90	90	90	95	90	--	100	100	100	95	100	85
11	0.070	--	95	90	95	90	--	70	90	95	80	98	50
12	0.035	80	100	70	100	80	--	90	90	90	98	95	70
13	0.018	85	98	85	98	80	--	95	98	100	98	100	90
14	0.018	90	98	85	95	80	--	98	98	95	95	98	98
15	0.035	88	98	80	99	80	--	98	95	95	95	95	95
16	0.28	90	--	80	90	80	--	75	80	50	75	90	50
17	0.28	80	--	75	100	85	--	80	98	98	95	100	85
18	0.035	85	99	90	90	90	--	95	99	95	90	98	75
19	0.009	70	--	70	95	85	--	95	78	90	85	95	80
21	0.28	--	--	95	98	90	--	90	95	--	95	--	90
22	0.14	90	90	90	95	98	--	95	90	98	90	100	80
23	0.035	--	--	90	99	85	--	95	98	--	95	--	98
24	0.035	75	98	90	90	85	--	85	90	85	85	99	80
25	0.14	80	98	85	98	70	--	85	80	80	90	100	90
26	0.018	75	95	80	85	85	--	90	95	95	90	100	90

27	0.070	85	100	80	95	90	--	90	98	95	95	100	80
28	0.009	60	100	75	80	80	--	90	90	90	78	90	85
29	0.28	78	90	90	85	85	--	78	78	55	55	90	55
30	0.070	30	95	90	98	90	--	90	80	95	85	95	80
31	0.14	65	100	75	100	85	--	100	95	100	95	100	95
32	0.28	70	--	95	95	80	--	--	70	60	80	95	80
33	0.14	70	100	85	95	78	--	--	90	95	85	95	90
34	0.018	75	78	90	80	85	--	90	70	98	78	90	80
35	0.28	95	98	80	90	90	--	80	85	70	75	95	80
36	0.14	50	100	90	90	80	--	90	90	100	90	100	80
37	0.035	65	90	80	75	85	--	90	98	78	98	100	90
38	0.14	75	85	90	85	90	80	95	65	70	70	100	90
39	0.009	78	95	80	80	78	--	95	65	55	65	70	98
40	0.14	85	98	90	95	95	--	95	100	80	90	100	90
41	0.070	75	100	90	90	90	--	85	100	100	95	100	98
42	0.035	80	90	90	90	90	--	90	95	65	80	70	78
43	0.14	90	100	90	95	95	--	65	78	55	90	78	70
44	0.14	90	90	90	100	95	--	80	80	65	90	85	80
45	0.28	95	100	90	100	90	--	80	95	70	95	85	80
46	0.14	70	85	90	75	90	--	78	98	70	80	70	78
47	0.035	70	80	90	90	78	--	85	90	95	90	98	90
48	0.28	80	80	75	75	85	--	75	75	65	78	98	80
50	0.005	75	95	80	65	78	78	95	85	78	65	85	90
51	0.070	70	78	75	70	78	--	100	85	70	90	100	90
52	0.070	90	--	80	95	100	80	95	95	60	60	78	78
53	0.070	55	75	50	65	55	--	100	95	45	75	100	95
54	0.070	75	100	90	90	90	--	100	100	90	95	95	85
56	0.14	70	90	90	95	75	80	95	95	65	60	100	80
57	0.28	20	85	50	30	50	75	70	40	0	55	60	60
58	0.28	65	100	75	65	85	80	100	95	50	75	100	95
59	0.035	90	100	85	100	95	85	90	90	78	90	100	90

60	0.035	85	100	78	90	80	90	90	100	65	80	100	85
61	0.28	45	78	85	65	90	20	65	20	35	35	90	50
62	0.070	85	100	80	85	85	95	80	100	55	85	100	90
63	0.070	50	78	90	85	75	85	90	70	65	85	95	80
64	0.14	100	60	95	60	65	78	60	55	20	55	95	70
65	0.035	70	90	70	98	85	80	95	98	100	90	99	80
66	0.14	10	99	50	100	90	70	85	90	100	70	95	90
67	0.28	80	100	90	100	90	90	95	95	65	90	100	80
68	0.070	10	95	85	95	85	80	95	75	100	95	95	80
69	0.14	100	50	20	60	65	50	20	45	40	55	60	20
70	0.035	70	80	85	80	75	78	95	100	70	75	90	75
71	0.14	80	90	90	95	90	85	90	80	60	65	90	85
72	0.070	60	90	60	90	80	90	95	85	100	90	100	90
74	0.018	75	95	80	98	80	88	95	95	75	78	95	85
83	0.070	100	100	90	95	90	--	85	95	95	90	100	85
84	0.070	78	85	90	100	90	--	98	95	80	90	95	90
85	0.070	75	80	85	95	90	85	90	85	80	55	95	80
99	0.14	78	95	90	85	80	--	95	95	78	85	90	85
100	0.28	80	100	90	85	78	--	78	80	80	80	90	70
101	0.28	0	90	0	65	40	--	40	0	0	20	0	0
102	0.28	45	95	78	95	75	--	75	55	70	90	80	50
104	0.28	65	--	70	--	80	85	45	65	60	--	75	75
105	0.070	90	99	85	98	95	--	95	90	95	95	98	90
106	0.018	75	95	65	98	65	--	98	93	90	60	90	88
107	0.28	70	90	75	95	20	--	90	80	50	75	85	85
108	0.070	75	100	75	100	75	--	90	95	85	70	95	85
109	0.28	85	98	85	95	85	--	75	95	70	60	95	70
110	0.28	75	98	85	98	90	--	75	85	75	78	90	80
111	0.035	90	98	65	95	78	--	90	90	70	78	98	85
112	0.070	70	100	50	95	50	--	85	90	20	40	90	80
113	0.28	0	50	0	70	20	--	50	0	0	20	60	0

114	0.070	90	95	80	95	80	--	90	95	95	95	95	80
115	0.28	55	100	0	95	50	--	85	70	20	50	90	40
116	0.28	70	90	70	90	78	--	95	78	40	78	95	85
117	0.28	80	--	80	95	90	--	--	90	78	85	95	80
118	0.070	30	100	75	100	90	--	90	90	95	85	98	90
119	0.28	78	--	50	90	60	--	--	78	45	40	95	80
120	0.28	80	100	80	95	100	--	--	85	80	78	95	85
121	0.14	70	100	90	95	85	--	90	90	95	90	98	85
122	0.28	80	100	90	100	85	--	90	98	90	80	100	80
123	0.070	80	--	85	95	90	--	--	98	95	90	98	90
124	0.29	70	100	65	100	70	--	80	90	30	60	100	50
125	0.28	75	80	50	95	80	--	85	65	60	20	100	78
126	0.28	78	100	90	100	85	--	78	95	80	70	100	50
127	0.14	90	100	90	90	85	90	100	95	95	90	100	80
129	0.035	78	--	78	95	70	80	100	95	70	55	100	90
130	0.28	65	95	75	90	80	80	90	78	30	60	95	70
134	0.035	65	100	78	98	78	--	90	90	85	90	95	85
135	0.28	85	--	90	100	90	--	50	95	65	78	100	65
136	0.14	80	99	85	95	90	--	90	90	95	95	95	80
137	0.28	55	55	20	78	75	--	95	75	30	80	100	80
141	0.14	78	90	40	90	80	80	90	95	95	90	95	95
143	0.28	90	--	90	95	90	--	90	85	95	98	100	90
144	0.28	30	--	35	90	78	--	60	65	80	78	85	70
145	0.28	20	70	50	78	75	--	55	65	20	60	80	70
151	0.28	55	90	45	70	70	65	95	65	80	98	95	60
158	0.14	85	100	80	100	85	85	100	100	95	100	100	75
159	0.14	80	98	80	95	85	90	100	85	98	100	100	85
162	0.28	90	90	50	100	80	55	75	75	55	40	70	55
163	0.070	100	100	50	100	65	85	85	80	75	85	90	75
164	0.14	80	95	80	100	85	85	100	100	85	100	100	85
165	0.14	90	85	75	90	758	5	95	75	75	90	100	85

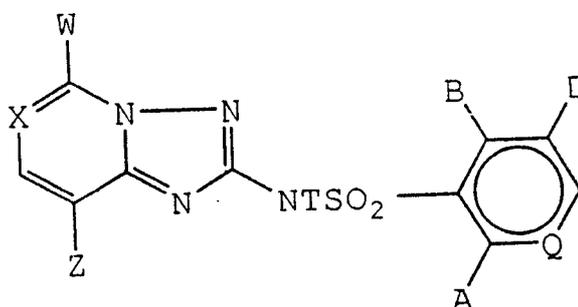
168	0.070	95	98	75	100	100	95	95	90	20	85	75	55
172	0.070	80	85	75	90	80	80	85	85	75	100	75	--
175	0.14	70	45	60	100	70	78	100	60	40	50	100	70
177	0.070	95	100	80	100	90	80	75	100	80	90	70	70
181	0.14	80	80	70	35	65	75	85	40	60	60	85	--
182	0.070	90	85	90	90	80	80	95	85	50	65	85	--
183	0.14	80	100	30	98	75	40	100	100	100	100	100	--
184	0.035	80	98	80	95	85	85	70	90	65	85	65	75
185	0.035	90	100	75	100	95	80	75	75	70	100	70	55
186	0.14	75	90	75	100	80	75	85	75	65	100	100	70
187	0.035	80	90	75	100	80	80	70	90	65	85	70	30
188	0.028	95	100	75	100	95	80	80	75	65	60	85	45
189	0.14	75	85	70	100	75	50	60	55	30	65	60	50
191	0.07	85	100	85	98	75	85	100	100	95	100	100	100
192	0.14	75	60	45	100	65	60	85	70	30	35	90	80
193	0.14	75	85	55	100	70	78	100	70	45	60	100	95
194	0.070	95	95	80	100	90	85	45	80	60	75	80	45
195	0.070	80	90	70	95	75	70	70	100	70	100	60	70
196	0.018	80	75	45	80	75	75	100	75	70	100	85	95
197	0.009	78	80	75	90	80	80	100	98	100	100	100	100
198	0.035	75	100	80	100	80	90	100	85	75	100	100	90
199	0.070	80	90	80	100	90	80	75	75	60	75	70	55
200	0.035	75	95	78	95	80	80	90	85	95	80	98	98
201	0.070	75	80	70	100	80	78	100	100	75	100	100	95
202	0.14	90	100	70	100	90	70	90	90	60	50	50	70
203	0.070	70	100	70	100	70	60	95	90	70	85	90	80
204	0.14	95	100	90	95	70	90	--	95	--	100	95	100
205	0.14	98	95	85	98	85	80	80	75	0	70	75	70
206	0.14	80	95	70	80	80	75	75	60	0	55	80	70
208	0.070	100	100	75	100	85	95	80	100	70	75	70	65
210	0.14	90	90	80	80	75	80	45	70	50	45	70	55

211	0.14	75	95	80	100	80	75	60	80	50	85	60	30
212	0.035	75	100	65	100	75	80	--	75	98	100	100	75
216	0.035	75	85	65	75	70	80	100	85	80	100	100	95
218	0.070	80	90	90	100	75	85	95	70	98	100	100	--

- BWCKB - дурнишник (*Xanthium strumarium*)
 BWMGL - ипомея (*Ipomoea hederacea*)
 BWVEL - канатник Теофраста (*Abutilion theophrasti*)
 GWBLG - лисохвост мышехвостиковидный (*Alopecurus myosuroides*)
 GBCRB - росичка кровавая (*Digitaria sanguinalis*)
 GWROX - оранжевое сорго (*Sorghum bicolor*)
 BWLMQ - марь белая (*Chenopodium album*)
 BWPIG - щирица колосистая (*Amaranthus retroflexus*)
 BWWPT - пойнсеттия дикая (*Euphorbia heterophylla*)
 GWBRN - куриное просо (*Echinochloa crus-galli*)
 GWGFT - щетинник гигантский (*Setaria faberi*)
 GWWOT - овес пустой (овсюг) (*Avena fatua*)

ФОРМУЛА ИЗОБРЕТЕНИЯ

1. N-(триазолазинил)арилсульфонамид формулы I



где **X** представляет собой N или C-Y;

W представляет собой O(C₁-C₃алкил), Cl, Br, F или H;

Y представляет собой H, OCH₃, F, Cl, Br, I или CH₃, необязательно содержащий в качестве заместителей до трех атомов фтора;

Z представляет собой O(C₁-C₃алкил), H, F, Cl, Br, I, S(C₁-C₃алкил) или CH₃, необязательно содержащий в качестве заместителей до трех атомов фтора; при условии, что, по крайней мере, один из **W** и **Z** представляет собой O(C₁-C₃алкил);

Q представляет собой C-H или N;

A представляет собой F, Cl, Br, I или CO₂(C₁-C₄алкил), или представляет собой (C₁-C₃алкил), O(C₁-C₄алкил), O(C₃-C₄алкенил), O(C₃-C₄алкинил) или S(C₁-C₃алкил), каждый из которых необязательно замещен одним заместителем, представляющим собой O(C₁-C₃-алкил), S(C₁-C₃алкил), хлор, бром или циано, или атомами фтора до максимально возможного их количества, или представляет собой фрагмент 2-метил-1,3-диоксолан-2-ила, и когда **Q** представляет собой N, H;

B представляет собой H, F, Cl, Br, I, NO₂, CN, CO₂(C₁-C₄-алкил), NH(C₁-C₃алкил) или N(C₁-C₃алкил)₂, или представляет собой (C₁-C₃алкил), O(C₁-C₄алкил), O(C₃-C₄алкенил), O(C₃-C₄алкинил) или S(C₁-C₃алкил), SO(C₁-C₃алкил), SO₂(C₁-C₃алкил), S(C₃-C₄алкенил), SO(C₃-C₄алкенил), SO₂(C₃-C₄алкенил), S(C₃-C₄алкинил), SO(C₃-C₄-алкинил) или SO₂(C₃-C₄алкинил), каждый из которых необязательно замещен одним заместителем, представляющим собой O(C₁-C₃алкил),

S(C₁-C₃алкил), хлор, бром или циано, или атомами фтора до максимально возможного их количества; при условии, что **A** и **B** одновременно не являются водородом;

D представляет собой H, F, Cl, Br, I, (C₁-C₃алкил), OCH₃, OC₂H₅, CH₂F, CHF₂ или CF₃; или **B** и **D**, взятые вместе, представляют фрагмент формулы O-CH₂-O, необязательно замещенный одним или двумя атомами F или CH₃;

T представляет собой H, SO₂R, C(O)R, C(O)OR, C(O)NR'₂ или CH₂CH₂C(O)OR;

R представляет собой C₁-C₄алкил, C₃-C₄алкенил или C₃-C₄алкинил, каждый из которых необязательно имеет до двух заместителей, представляющих собой хлор, бром, O(C₁-C₄алкил) или фенил, и необязательно замещен атомами фтора до максимально возможного их количества; и **R'** представляет собой H, C₁-C₄алкил, C₃-C₄алкенил или C₃-C₄алкинил; и

когда **T** представляет собой H, их сельскохозяйственно приемлемые соли.

2. Соединение по п.1, где **T** представляет собой водород.

3. Соединение по п.1, где **X** представляет собой N и **Q** представляет собой C-H.

4. Соединение по п.1, где **W** представляет собой метокси и **Z** представляет собой метокси, фтор, хлор или бром.

5. Соединение по п.1, где **A** представляет собой метокси, этокси, пропокси, 1-метилэтокси, метоксиметокси, метоксиэтокси, 2-фторэтокси, 2-хлорэтокси, 2,2-дифторэтокси, 1-(фторметил)-2-фторэтокси, трифторметокси, хлор или фтор; **B** представляет собой водород, метокси, этокси, пропокси, 1-метилэтокси, метоксиметил, метилтио, метил, трифторметил, трифторметокси, фтор, хлор или метоксикарбонил; и **D** представляет водород, фтор, хлор, бром или метил.

6. Соединение по п.5, где **B** представляет собой метокси и **D** представляет водород; **A** представляет собой метокси и **D** представляет водород, метил или хлор; или **B** представляет собой трифторметил и **D** представляет водород.

7. Соединение по п.1, где **Q** представляет собой С-Н и **A** представляет собой метокси, этокси, пропокси или 1-метилэтокси, метоксиметокси, метоксиэтокси, 2-фторэтокси, 2-хлорэтокси, 2,2-дифторэтокси или 1-(фторметил)-2-фторэтокси; **B** представляет собой водород, метокси, этокси, пропокси, 1-метилэтокси, метоксиметил, трифторметил, фтор, хлор или метоксикарбонил; и **D** представляет водород, хлор или метил; или где **Q** представляет собой N и **A** представляет собой метокси, этокси, пропокси, 1-метилэтокси, метоксиметокси, метоксиэтокси, 2-фторэтокси, 2-хлорэтокси, 2,2-дифторэтокси или 1-(фторметил)-2-фторэтокси; **B** представляет собой водород, метокси, этокси, пропокси, 1-метилэтокси, трифторметил или метоксикарбонил; и **D** представляет водород или метил.

8. Соединение по п.1, которое выбирают из группы, включающей следующие соединения:

2-метокси-6-(трифторметил)-N-(8-хлор-5-метокси[1,2,4] триазол[1,5-с] пиридин-2-ил) бензолсульфонамид;

2,6-диметокси-N-(5,8-диметокси[1,2,4] триазол[1,5-с] пиридин-2-ил) бензолсульфонамид;

2-метокси-6-метоксикарбонил-N-(5,8-диметокси[1,2,4] триазол[1,5-а] пиридин-2-ил) бензолсульфонамид;

2-метокси-5-метил-N-(5,8-диметокси[1,2,4] триазол[1,5-с]-пиридин-2-ил) бензолсульфонамид;

5-хлор-2-метокси-N-(5,8-диметокси[1,2,4] триазол[1,5-с]-пиридин-2-ил) бензолсульфонамид;

2-метокси-4-(трифторметил)-N-(5,8-диметокси[1,2,4] триазол[1,5-с] пиридин-2-ил) пиридин-3-сульфонамид;

2-(2-фторэтокси)-6-(трифторметил)-N-(5,8-диметокси[1,2,4]-триазол[1,5-с] пиридин-2-ил) бензолсульфонамид;

2-(2-хлорэтокси)-6-(трифторметил)-N-(5,8-диметокси[1,2,4]-триазол[1,5-с] пиридин-2-ил) бензолсульфонамид;

2-(2,2-дифторэтокси)-6-(трифторметил)-N-(5,8-диметокси[1,2,4] триазол[1,5-с] пиридин-2-ил) бензолсульфонамид; и

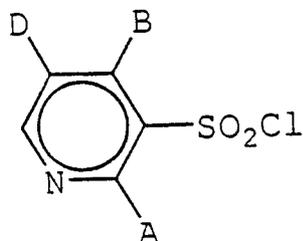
2-(1-фторметил-2-фторэтокси)-6-(трифторметил)-N-(5,8-ди-

метокси[1,2,4]триазол[1,5-с]пиримидин-2-ил)бензолсульфонамид.

9. Композиция, **отличающаяся тем**, что включает гербицидно-эффективное количество N-(триазазинил)арилсульфонамида по любому из пп.1-8 в смеси с сельскохозяйственно приемлемым наполнителем или носителем.

10. Способ борьбы с нежелательной растительностью, **отличающийся тем**, что включает применение на растительности или в ее локусе гербицидно-эффективного количества N-(триазазинил)-арилсульфонамида по любому из пп.1-8.

11. Пиримидин-3-сульфонилхлорид формулы



где **A** представляет собой F, Cl, Br, I или CO₂(C₁-C₄алкил), или представляет собой (C₁-C₃алкил), O(C₁-C₄алкил), O(C₃-C₄алкенил), O(C₃-C₄алкинил) или S(C₁-C₃алкил), каждый из которых необязательно замещен одним заместителем, представляющим собой O(C₁-C₃-алкил), S(C₁-C₃алкил), хлор, бром или циано, или атомами фтора до максимально возможного их количества, или представляет собой фрагмент 2-метил-1,3-диоксолан-2-ила, и, когда **Q** = N, представляет H;

B представляет собой H, F, Cl, Br, I, NO₂, CN, CO₂(C₁-C₄-алкил), NH(C₁-C₃алкил) или N(C₁-C₃алкил)₂, или представляет собой (C₁-C₃алкил), O(C₁-C₄алкил), O(C₃-C₄алкенил), O(C₃-C₄алкинил) или S(C₁-C₃алкил), SO(C₁-C₃алкил), SO₂(C₁-C₃алкил), S(C₃-C₄алкенил), SO(C₃-C₄алкенил), SO₂(C₃-C₄алкенил), S(C₃-C₄алкинил), SO(C₃-C₄-алкинил) или SO₂(C₃-C₄алкинил), каждый из которых необязательно замещен одним заместителем, представляющим собой O(C₁-C₃алкил), S(C₁-C₃алкил), хлор, бром или циано, или атомами фтора до максимально возможного их количества; при условии, что **A** и **B**

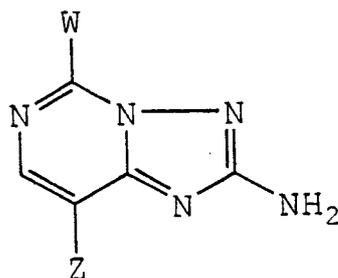
одновременно не являются водородом; и

D представляет собой H, F, Cl, Br, I, C₁-C₃алкил, OCH₃, OC₂H₅, CH₂F, CHF₂ или CF₃; или **B** и **D**, взятые вместе, представляют фрагмент формулы O-CH₂-O, необязательно замещенный одним или двумя атомами F или CH₃.

12. Соединение по п.11, где **A** представляет собой метокси, этокси, пропокси, 1-метилэтокси, метоксиметокси, метоксиэтокси, 2-фторэтокси, 2-хлорэтокси, 2,2-дифторэтокси, 1-(фторметил)-2-фторэтокси, трифторметокси, хлор или фтор; **B** представляет собой водород, метокси, этокси, пропокси, 1-метилэтокси, метоксиметил, метилтио, метил, трифторметил, трифторметокси, фтор, хлор или метоксикарбонил; и **D** представляет водород, фтор, хлор, бром или метил.

13. Соединение по п.12, где **A** представляет собой метокси, этокси, пропокси, 1-метилэтокси, метоксиметокси, метоксиэтокси, 2-фторэтокси, 2-хлорэтокси, 2,2-дифторэтокси или 1-(фторметил)-2-фторэтокси; **B** представляет собой водород, метокси, этокси, пропокси, 1-метилэтокси, трифторметил или метоксикарбонил; и **D** представляет водород или метил.

14. 2-амино[1,2,4]триазол[1,5-с]пиримидин формулы



где **W** представляет O(C₁-C₃алкил), хлор, бром, фтор или водород,
и

Z представляет O(C₁-C₃алкил), водород, фтор, хлор, бром, иод, S(C₁-C₃алкил) или CH₃, необязательно содержащий до трех атомов фтора в качестве заместителей;

при условии, что, по крайней мере, один из **W** и **Z** представляет собой O(C₁-C₃алкил).

15. Соединение по п.14, где **W** представляет собой метокси и **Z** представляет собой метокси, фтор, хлор или бром.

По доверенности