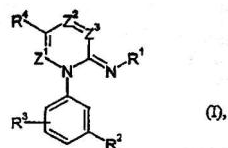


Винахід стосується нових заміщених іміноазинів, способів їх одержання і їх застосуванню як засобів обробки рослин, особливо, як гербіциди.

Відомо, що деякі заміщені імінопіридини мають гербіцидні властивості (див. заявку на Європейський патент 432600). Активність цих сполук, однак, не у всіх відношеннях є задовільною.

В даний час знайдені нові заміщені іміноазини загальної формули (I):



в якій

R¹ означає нітрогрупу, ціаногрупу або одну з груп -R⁵, -CQ¹-Q²-R⁵, -NH-CQ¹-Q²-R⁵ або -SO₂-R⁶;

R² означає нітрогрупу, ціаногрупу, SF₅, атом галогену або, відповідно, незаміщений(ну) або заміщений(ну) алкіл, алкоксил, алкілтіогрупу, алкілсульфініл, алкілсульфоніл або алкілсульфонілоксигрупу;

R³ означає атом водню або атом галогену або разом з R² означає незаміщену або заміщену алкілендіоксигрупу;

R⁴ означає атом водню, ціаногрупу, карбоксил, карбамоїл, атом галогену або незаміщений або заміщений алкіл;

Q¹ означає атом кисню, атом сірки або N-R⁵;

Q² означає простий зв'язок або атом кисню, атом сірки або N-R⁵;

R⁵ означає атом водню, аміногрупу або, відповідно, незаміщений(ну) або заміщений(ну) алкіл, алкоксил, алкіламіногрупу, діалкіламіногрупу, алкіліденаміногрупу, алкеніл, алкенілоксигрупу, алкініл, циклоалкіл, циклоалкіламіногрупу, циклоалкілалкіл, арил, ариламіногрупу, арилалкіл, гетероцикліалкіл або гетероцикліалкіл;

R⁶ означає, відповідно, незаміщений або заміщений алкіл, алкеніл, циклоалкіл, циклоалкілалкіл, арил, арилалкіл, гетероцикліалкіл;

Z¹ означає атом азоту або C-R⁴;

Z² означає атом азоту або C-R⁴;

Z³ означає атом азоту або C-R⁴.

У визначеннях вуглеводневі ланцюги, як алкіл, алкеніл або алкініл, а також у сполученні з гетероатомами, як в алкіламіногрупи, відповідно, є лінійними або розгалуженими. R³ переважно знаходиться в м- або п- положенні фенільного кільця.

Нижче вказуються переважні замісники, відповідно, переважні області значень наявних у вищезагаданих і нищеприведених формулах залишків:

R¹ переважно означає ціаногрупу або одну з груп -R⁵, -CQ¹-Q²-R⁵, -NH-CQ¹-Q²-R⁵ або -SO₂-R⁶;

R² переважно означає нітрогрупу, ціаногрупу, SF₅, атом галогену або, відповідно, незаміщений(ну) або заміщений(ну) ціаногрупою, галогеном або алкоксилем з 1-4 атомами вуглецю алкіл, алкоксил, алкілтіогрупу, алкілсульфініл, алкілсульфоніл або алкілсульфонілокси-групу, відповідно, з 1-5 атомами вуглецю;

R³ переважно означає атом водню або атом галогену або разом з R² означає незаміщену або заміщену галогеном алкілендіоксигрупу з 1-3 атомами вуглецю;

R⁴ переважно означає атом водню, ціаногрупу, карбоксил, карбамоїл, атом галогену або незаміщений або заміщений ціаногрупою, галогеном або алкоксилем з 1-4 атомами вуглецю алкіл з 1-5 атомами вуглецю;

Q¹ переважно означає атом кисню або атом сірки;

R⁵ переважно означає атом водню або аміногрупу; відповідно, незаміщений або заміщений ціаногрупою, галогеном або алкоксилем з 1-4 атомами вуглецю алкіл або алкоксил, відповідно, з 1-6 атомами вуглецю; алкіламіногрупу з 1-6 атомами вуглецю; діалкіламіногрупу, відповідно, з 1-6 атомами вуглецю в алкільних групах; алкіліденаміногрупу з кількістю атомів вуглецю аж до шести; відповідно, незаміщений(ну) або заміщений(ну) ціаногрупою або галогеном алкеніл, алкенілоксигрупу або алкініл, відповідно, з 2-6 атомами вуглецю; відповідно, незаміщений(ну) або заміщений(ну) ціаногрупою, галогеном або алкілом з 1-4 атомами вуглецю циклоалкіл, циклоалкіламіногрупу або циклоалкілалкіл, відповідно, з 3-6 атомами вуглецю в циклоалкілній групі і, за даних умов, з 1-4 атомами вуглецю в алкілній частині; відповідно, незаміщений(ну) або заміщений(ну) нітрогрупою, ціаногрупою, фенілом, феноксигрупою, фенілтіогрупою, галогеном, алкілом з 1-4 атомами вуглецю, галогеналкілом з 1-4 атомами вуглецю, алкоксилем з 1-4 атомами вуглецю, галогеналкоксилем з 1-4 атомами вуглецю, алкілтіогрупою з 1-4 атомами вуглецю, галогеналкілтіогрупою з 1-4 атомами вуглецю, алкілсульфінілом з 1-4 атомами вуглецю, галогеналкілсульфінілом з 1-4 атомами вуглецю, алкілсульфонілом з 1-4 атомами вуглецю, галогеналкілсульфонілом з 1-4 атомами вуглецю або діалкіламіносульфонілом з 1-4 атомами вуглецю в кожній алкілній частині арил, ариламіногрупу або арилалкіл, відповідно, з 6 або 10 атомами вуглецю в арилній групі і, за даних умов, з 1-4 атомами вуглецю в алкілній частині; або, відповідно, незаміщений або заміщений нітрогрупою, ціаногрупою, фенілом, феноксигрупою, фенілтіогрупою, галогеном, алкілом з 1-4 атомами вуглецю, галогеналкілом з 1-4 атомами вуглецю, алкоксилем з 1-4 атомами вуглецю, галогеналкоксилем з 1-4 атомами вуглецю, алкілтіогрупою з 1-4 атомами вуглецю, галогеналкілтіогрупою з 1-4 атомами вуглецю, алкілсульфінілом з 1-4 атомами вуглецю, галогеналкілсульфінілом з 1-4 атомами вуглецю, алкілсульфонілом з 1-4 атомами вуглецю, галогеналкілсульфонілом з 1-4 атомами вуглецю або діалкіламіносульфонілом з 1-4 атомами вуглецю в кожній алкілній частині моноциклічний або біциклічний гетероцикліалкіл або гетероцикліалкіл, відповідно, з кількістю атомів вуглецю аж до десяти і з кількістю атомів азоту аж до чотирьох і/або з одним або двома атомами кисню або сірки в гетероциклічній групі і, за даних умов, з 1-4 атомами вуглецю в алкілній частині;

R⁶ переважно означає незаміщений або заміщений галогеном алкіл з 1-6 атомами вуглецю; незаміщений або заміщений галогеном алкеніл з 2-6 атомами вуглецю; незаміщений або заміщений галогеном або алкілом з 1-4 атомами вуглецю циклоалкіл або циклоалкілалкіл, відповідно, з 3-6 атомами вуглецю в циклоалкільній групі i, за даних умов, з 1-4 атомами вуглецю в алкільній частині; відповідно, незаміщений або заміщений нітрогрупою, ціаногрупою, галогеном, алкілом з 1-4 атомами вуглецю, галогеналкілом з 1-4 атомами вуглецю, алкоксилем з 1-4 атомами вуглецю, галогеналкоксилем з 1-4 атомами вуглецю, алкілтіогрупою з 1-4 атомами вуглецю, галогеналкілтіогрупою з 1-4 атомами вуглецю, алкілсульфонілом з 1-4 атомами вуглецю, галогеналкілсульфонілом з 1-4 атомами вуглецю, алкілсульфонілом з 1-4 атомами вуглецю, галогеналкілсульфонілом з 1-4 атомами вуглецю або діалкіламіносудфонілом з 1-4 атомами вуглецю в кожній алкільній частині арил або арилалкіл, відповідно, з 6 або 10 атомами вуглецю в арилній групі i, за даних умов, з 1-4 атомами вуглецю в алкільній частині; або, відповідно, незаміщений або заміщений нітрогрупою, ціаногрупою, галогеном, алкілом з 1-4 атомами вуглецю, галогеналкілом з 1-4 атомами вуглецю, алкоксилем з 1-4 атомами вуглецю, галогеналкоксилем з 1-4 атомами вуглецю, алкілтіогрупою з 1-4 атомами вуглецю, галогеналкілтіогрупою з 1-4 атомами вуглецю, алкілсульфонілом з 1-4 атомами вуглецю, галогеналкілсульфонілом з 1-4 атомами вуглецю, алкілсульфонілом з 1-4 атомами вуглецю, галогеналкілсульфонілом з 1-4 атомами вуглецю або діалкіламіносудфонілом з 1-4 атомами вуглецю в кожній алкільній частині моноциклічний або біциклічний гетероцикліл або гетероциклілалкіл, відповідно, з кількістю атомів вуглецю аж до десяти і з кількістю атомів азоту аж до чотирьох і/або з одним або двома атомами кисню або сірки в гетероциклічній групі i, за даних умов, з 1-4 атомами вуглецю в алкільній частині;

Z¹ переважно означає C-R⁴;

Z² переважно означає C-R⁴;

Z³ переважно означає C-R⁴;

далі,

R² особливо переважно означає нітрогрупу, ціаногрупу, SF₅, атом фтору, хлору або броду, або, відповідно, незаміщений(ну) або заміщений(ну) ціаногрупою, фтором, хлором, метоксигрупою або етоксигрупою метил, етил, н- або ізопропіл, метоксигрупу, етоксигрупу, н- або ізопропоксигрупу, метилтіогрупу, етилтіогрупу, н- або ізопропілтіогрупу, метилсульфініл, етилсульфініл, н- або ізопропілсульфініл, метилсульфоніл, етилсульфоніл, н- або ізопропілсульфоніл, метилсульфонілоксигрупу, етилсульфонілоксигрупу, н- або ізопропілсульфонілоксигрупу;

R³ особливо переважно означає атом водню, атом фтору, хлору або броду, або разом з R² означає, відповідно, незаміщену або заміщену фтором і/або хлором метилендіоксигрупу або етилендіоксигрупу;

R⁴ особливо переважно означає атом водню, ціаногрупу, карбоксил, карбамоїл, атом фтору, хлору, броду, або незаміщений або заміщений ціаногрупою, фтором, хлором, метоксигрупою або етоксигрупою метил, етил, н- або ізопропіл;

Q¹ особливо переважно означає атом кисню;

R⁵ особливо переважно означає атом водню або аміногрупу; відповідно, незаміщений(ну) або заміщений(ну) ціаногрупою, фтором, хлором, метоксигрупою або етоксигрупою метил, етил, н- або ізопропіл, н-, ізо-, втор- або трет-бутил, метиламіногрупу, етиламіногрупу, н- або ізопропіламіногрупу, н-, ізо-, втор- або трет-бутиламіногрупу; диметиламіногрупу або диетиламіногрупу; пропіліденаміногрупу або бутіліденаміногрупу; відповідно, незаміщений або заміщений ціаногрупою, фтором, хлором і/або бродом пропеніл, бутеніл, пропініл або бутініл; відповідно, незаміщений(ну) або заміщений(ну) ціаногрупою, фтором, хлором, бродом, метилом, етилом, н- або ізопропілом циклопропіл, циклобутил, циклопентил, циклогексил, циклопропіламіногрупу, циклобутиламіногрупу, циклопентиламіногрупу, циклогексиламіногрупу, циклопропілметил, циклобутилметил, циклопентилметил або циклогексил метил; відповідно, незаміщений(ну) або заміщений(ну) нітрогрупою, ціаногрупою, фенілом, феноксигрупою, фенілтіогрупою, фтором, хлором, бродом, метилом, етилом, н- або ізопропілом, н-, ізо-, втор- або трет-бутилом, дихлорметилом, дифторметилом, трихлорметилом, трифторметилом, хлордифторметилом, фтордихлорметилом, метоксигрупою, етоксигрупою, н- або ізопропоксигрупою, дифторметоксигрупою, трифторметоксигрупою, метилтіогрупою, етилтіогрупою, н- або ізопропілтіогрупою, дифторметилтіогрупою, трифторметилтіогрупою, метилсульфінілом, етил-сульфінілом, трифторметилсульфінілом, метилсульфонілом, етилсульфонілом, трифторметилсульфонілом або диметиламіносудфонілом феніл, нафтил, феніламіногрупу, бензил або фенілетил; або, відповідно, незаміщений або заміщений ціаногрупою, фенілом, феноксигрупою, фенілтіогрупою, фтором, хлором, бродом, метилом, етилом, н- або ізопропілом, н-, ізо-, втор- або трет-бутилом, дихлорметилом, дифторметилом, трихлорметилом, трифторметилом, хлордифторметилом, фтордихлорметилом, метоксигрупою, етоксигрупою, н- або ізопропоксигрупою, дифторметоксигрупою, трифторметоксигрупою, метилтіогрупою, етилтіогрупою, н- або ізопропілтіогрупою, дифторметилтіогрупою, трифторметилтіогрупою, метилсульфінілом, етилсульфінілом, трифторметилсульфінілом, метилсульфонілом, етилсульфонілом, трифторметилсульфонілом або диметиламіносудфонілом гетероцикліл або гетероциклілалкіл з ряду: фурил, тетрагідрофурил, бензофурил, тіеніл, бензотіеніл, піроліл, бензопіроліл, піразоліл, бензопіразоліл, оксазоліл, бензоксазоліл, ізоксазоліл, тіазоліл, бензтіазоліл, оксадіазоліл, тіадіазоліл, піридиніл, хінолініл, піримідиніл, фурилметил, тіенілметил, піролілметил, піразолілметил, оксазолілметил, тіазолілметил, піридинілметил, піримідинілметил;

R⁶ особливо переважно означає, відповідно, незаміщений або заміщений фтором і/або хлором метил, етил, н- або ізопропіл, н-, ізо-, втор- або трет-бутил; відповідно, незаміщений або заміщений фтором, хлором і/або бродом пропеніл або бутеніл; відповідно, незаміщений або заміщений фтором, хлором, бродом, метилом, етилом, н- або ізопропілом циклопропіл, циклобутил, циклопентил, циклогексил, циклопропілметил, циклобутилметил, циклопентилметил або циклогексилметил; відповідно, незаміщений або заміщений нітрогрупою, ціаногрупою, фтором, хлором, бродом, метилом, етилом, н- або ізопропілом, н-, ізо-, втор- або трет-бутилом, дихлорметилом, дифторметилом, трихлорметилом, трифторметилом, хлордифторметилом, фтордихлорметилом, метоксигрупою, етоксигрупою, н- або ізопропоксигрупою, дифторметоксигрупою, трифторметоксигрупою, метилтіогрупою, етилтіогрупою, н- або ізопропілтіогрупою,

дифторметилтіогрупою, трифторметилтіогрупою, метилсульфінілом, етилсульфінілом, трифторметилсульфінілом, метилсульфонілом, етилсульфонілом, трифторметилсульфонілом або диметиламіносульфонілом феніл або нафтил; або, відповідно, незаміщений або заміщений ціаногрупою, фтором, хлором, бромом, метилом, етилом, н- або ізопропілом, н-, ізо-, втор- або трет-бутилом, дихлорметилом, диформметилом, трихлорметилом, трифторметилом, хлордифторметилом, фтордихлорметилом, метоксигрупою, етоксигрупою, н- або ізопропоксигрупою, диформметоксигрупою, трифторметоксигрупою, метилтіогрупою, етилтіогрупою, н- або ізопропілтіогрупою, диформметилтіогрупою, трифторметилтіогрупою, метилсульфінілом, етилсульфінілом, трифторметилсульфінілом, метилсульфонілом, етилсульфонілом, трифторметилсульфонілом або диметиламіносульфонілом гетероцикліал або гетероцикліалкіл з ряду: фурил, бензофурил, тієніл, бензотієніл, піроліл, бензопіроліл, піразоліл, бензопіразоліл, оксазоліл, бензоксазоліл, ізоксазоліл, тiazоліл, бензтіазоліл, піридиніл, хінолініл, піримідиніл, фурилметил, тієнілметил, піролілметил, піразолілметил, оксазолілметил, тiazолілметил, піридинілметил, піримідинілметил;

Z^1 особливо переважно означає метинову групу;

Z^2 особливо переважно означає метинову групу;

Z^3 особливо переважно означає метинову групу;

далі,

R^2 найвищою мірою переважно означає ціаногрупу, атом фтору, хлору або бром, або, відповідно, незаміщений(ну) або заміщений(ну) фтором, хлором, метоксигрупою або етоксигрупою метил, етил, метоксигрупу, етоксигрупу, метилтіогрупу, етилтіогрупу, метилсульфініл, етилсульфініл, метилсульфоніл, етилсульфоніл, метилсульфонілоксигрупу або етилсульфонілоксигрупу;

R^4 найвищою мірою переважно означає атом водню, ціаногрупу, атом фтору, хлору, бром, або незаміщений або заміщений фтором, хлором, метоксигрупою або етоксигрупою метил або етил;

R^5 найвищою мірою переважно означає атом водню або аміногрупу; відповідно, незаміщений(ну) або заміщений(ну) ціаногрупою, фтором, хлором, метоксигрупою або етоксигрупою метил, етил, н- або ізопропіл, метиламіногрупу, етиламіногрупу, н- або ізопропіламіногрупу; диметиламіногрупу; відповідно, незаміщений або заміщений фтором, хлором і/або бромом пропеніл, бутеніл, пропініл або бутиніл; відповідно, незаміщений(ну) або заміщений(ну) фтором, хлором, бромом, метилом або етилом циклопропіл, циклопентил, циклогексил, циклопропіламіногрупу, циклопентиламіногрупу, циклогексиламіногрупу, циклопропілметил, циклопентилметил або циклогексилметил; або, відповідно, незаміщений(ну) або заміщений(ну) нітрогрупою, ціаногрупою, фтором, хлором, бромом, метилом, етилом, н- або ізопропілом, н-, ізо-, втор- або трет-бутилом, трифторметилом, метоксигрупою, етоксигрупою, н- або ізопропоксигрупою, диформметоксигрупою, трифторметоксигрупою, метилтіогрупою, етилтіо-групою, н- або ізопропілтіогрупою, диформметилтіогрупою, трифторметилтіогрупою, метилсульфінілом, етилсульфінілом, трифторметил-сульфінілом, метилсульфонілом, етилсульфонілом, трифторметилсульфонілом або диметиламіносульфонілом феніл, феніламіногрупу, бензил або фенілетил;

R^6 найвищою мірою переважно означає, відповідно, незаміщений або заміщений фтором і/або хлором метил, етил, н- або ізопропіл, н-, ізо-, втор- або трет-бутил; відповідно, незаміщений або заміщений фтором, хлором, бромом, метилом або етилом циклопропіл, циклопентил або циклогексил; або незаміщений або заміщений нітрогрупою, ціаногрупою, фтором, хлором, бромом, метилом, етилом, н- або ізопропілом, н-, ізо-, втор- або трет-бутилом, трифторметилом, метоксигрупою, етоксигрупою, н- або ізопропоксигрупою, диформметоксигрупою, трифторметоксигрупою, метилтіогрупою, етилтіо-групою, н- або ізопропілтіогрупою, диформметилтіогрупою, трифторметилтіогрупою, метилсульфінілом, етилсульфінілом, трифторметил-сульфінілом, метилсульфонілом, етилсульфонілом, трифторметилсульфонілом або диметиламіносульфонілом феніл; причому

R^2 найчастіше переважно означає трифторметил;

R^4 найчастіше переважно означає метил.

Найвищою мірою переважною групу являють собою ті сполуки формули (I), в якій

R^1 означає ціаногрупу або одну з груп $-CQ^1-Q^2-R^5$ або $-SO_2-R^6$;

R^2 означає трифторметил, диформметоксигрупу або трифторметоксигрупу;

R^3 означає атом водню, фтору або хлору, або разом з радикалом R^2 - в орто-положенні - означає диформметилендіоксигрупу або тетрафторетилендіоксигрупу;

R^4 означає атом водню, фтору, хлору, бром, або метил; Q^1 означає атом кисню або атом сірки;

Q^2 означає простий зв'язок або атом кисню, атом сірки або $N-R^5$;

R^5 означає атом водню; відповідно, незаміщений або заміщений ціаногрупою, фтором, хлором, метоксигрупою або етоксигрупою метил, етил, н- або ізопропіл; відповідно, незаміщений або заміщений фтором, хлором і/або бромом пропеніл, бутеніл, пропініл або бутиніл; відповідно, незаміщений або заміщений фтором, хлором або метилом циклопропіл, циклопентил, циклогексил, циклопропілметил, циклопентилметил або циклогексилметил; або, відповідно, незаміщений або заміщений нітрогрупою, ціаногрупою, фтором, хлором, бромом, метилом, етилом, н- або ізопропілом, н-, ізо-, втор- або трет-бутилом, трифторметилом, метоксигрупою, етоксигрупою, н- або ізопропоксигрупою, диформметоксигрупою, трифторметоксигрупою, метилтіогрупою, етилтіогрупою, н- або ізопропілтіогрупою, диформметилтіогрупою, трифторметилтіогрупою, метилсульфінілом, етилсульфінілом, трифторметил-сульфінілом, метилсульфонілом, етилсульфонілом, трифторметилсульфонілом або диметиламіносульфонілом феніл або бензил;

R^6 , відповідно, означає незаміщений або заміщений фтором і/або хлором метил, етил, н- або ізопропіл, н-, ізо-, втор- або трет-бутил; відповідно, незаміщений або заміщений фтором, хлором або метилом циклопропіл, циклопентил або циклогексил; або незаміщений або заміщений нітрогрупою, ціаногрупою, фтором, хлором, бромом, метилом, етилом, н- або ізопропілом, н-, ізо-, втор- або трет-бутилом, трифторметилом, метоксигрупою, етоксигрупою, н- або ізопропоксигрупою, диформметоксигрупою, трифторметоксигрупою, метилтіогрупою, етилтіогрупою, н- або ізопропілтіогрупою, диформметилтіогрупою, трифторметилтіогрупою, метилсульфінілом, етилсульфінілом, трифторметилсульфінілом, метилсульфонілом, етилсульфонілом, трифторметилсульфонілом або диметиламіносульфонілом феніл;

Z^1 означає метинову групу;
 Z^2 означає метинову групу; і
 Z^3 означає метинову групу.

Відповідно до винаходу, переважними є ті сполуки формули (I), в яких присутня комбінація зазначених вище як переважні значення залишків.

Відповідно до винаходу, особливо переважними є ті сполуки формули (I), у яких присутня комбінація зазначених вище як особливо переважні значень залишків.

Відповідно до винаходу, найвищою мірою кращими є ті сполуки формули (I), у яких присутня комбінація зазначених вище як найвищою мірою переважні значень залишків.

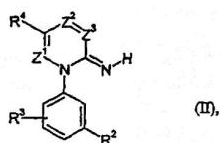
Вищевказані загальні або зазначені в переважних областях значення залишків відносяться як до кінцевих продуктів формули (I), так і також, відповідно, до необхідних в кожному випадку для їх одержання вихідних або проміжних продуктів.

Ці значення залишків можна будь-яким чином комбінувати один з одним, отже, також між зазначеними переважними областями.

Нові заміщені іміноазини загальної формули (I) мають біологічні властивості, що представляють інтерес. Вони відрізняються особливо сильною гербіцидною активністю.

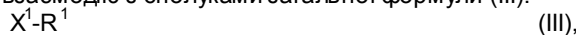
Нові заміщені іміноазини загальної формули (I) одержують таким чином:

(а) іміноазини загальної формули (II):



в якій
 R^2 , R^3 , R^4 , Z^1 , Z^2 і Z^3 мають вищевказані значення,

- або адукти з кислотою іміноазинів загальної формули (II), як, наприклад, гідрохлориди, - вводять у взаємодію з сполуками загальної формули (III):



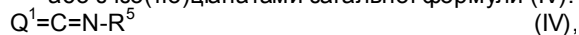
в якій

R^1 має вищевказане значення;

X^1 означає атом галогену, $-SO_2CH_3$, $-O-CO-R^5$ або $-O-SO_2-R^6$; і

R^5 і R^6 мають вищевказані значення;

або з ізо(тіо)ціанатами загальної формули (IV):



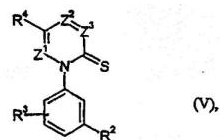
в якій

Q^1 і R^5 мають вищевказані значення,

у разі потреби, у присутності допоміжного для реакції засобу і, у разі потреби, у присутності розріджувача;

або

(б) азинтіони загальної формули (V):



в якій

R^2 , R^3 , R^4 , Z^1 , Z^2 і Z^3 мають вищевказані значення, вводять у взаємодію з сполуками загальної формули

(VI):



в якій

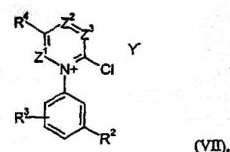
R^6 має вищевказане значення і

M означає еквівалент металу,

у разі потреби, у присутності одного або декількох розріджувачів;

або

(в) хлоразинієві сполуки загальної формули (VII):



в якій

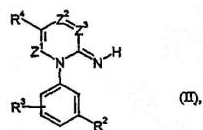
R^2 , R^3 , R^4 , Z^1 , Z^2 і Z^3 мають вищевказані значення, і

Y означає атом хлору, PCl_4 , $POCl_4$ або PCl_5 ,

вводять у взаємодію з аміносполуками загальної формули (VIII):

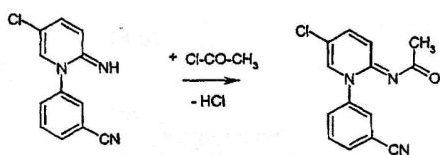


в якій
 R^1 має вищевказане значення,
у разі потреби, у присутності допоміжного для реакції засобу і, у разі потреби, у присутності розріджувача;
або
(г) іміноазини загальної формули (II):

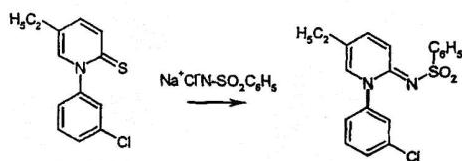


в якій
 R^2, R^3, R^4, Z^1, Z^2 і Z^3 мають вищевказані значення,
- або адукти з кислотою іміноазинів загальної формули (II), як, наприклад, гідрохлориди, - вводять у взаємодію з азотною кислотою, у разі потреби, у присутності допоміжного для реакції засобу і/або розріджувача.

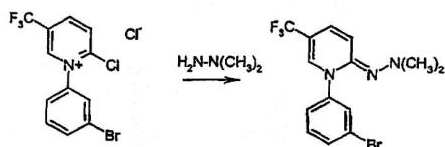
Якщо використовують, наприклад, 5-хлор-1-(3-ціанофеніл)-2(1H)-піридиній і ацетилхлорид як вихідні речовини, то протікання реакції у випадку запропонованого відповідно до винаходу способу (а) можна представити у виді наступної реакційної схеми:



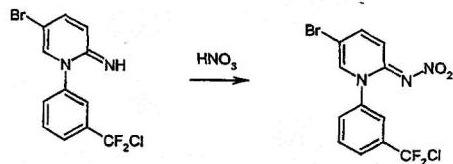
Якщо використовують, наприклад, 1-(3-хлорфеніл)-5-етил-2(1H)-піридиній і натрієву сіль аміду N-хлорбензолсульфокислоти як вихідні речовини, то протікання реакції у випадку запропонованого відповідно до винаходу способу (б) можна представити у виді наступної реакційної схеми:



Якщо використовують, наприклад, 1-(3-бромфеніл)-2-хлор-5-трифторметилпіридиній хлорид і диметилгідразин як вихідні речовини, то протікання реакції у випадку запропонованого відповідно до винаходу способу (в) можна представити у виді наступної реакційної схеми:



Якщо використовують, наприклад, 5-бром-1-(3-хлордифторметилфеніл)-2(1H)-піридиній і азотну кислоту як вихідні речовини, то протікання реакції у випадку запропонованого відповідно до винаходу способу (г) можна представити у виді наступної реакційної схеми:

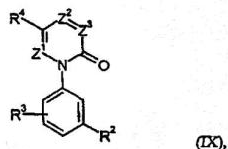


Використовувані у випадку пропонованих відповідно до винаходу способів (а) і (г) для одержання сполук загальної формули (I) як вихідні речовини іміноазини, загалом, відповідають формулі (II). У загальній формулі (II) R^2, R^3, R^4, Z^1, Z^2 і Z^3 переважно мають ті значення, що вже були зазначені вище в зв'язку з описом запропонованих відповідно до винаходу сполук загальної формули (I) як переважні, особливо переважні або найвищою мірою переважні для R^2, R^3, R^4, Z^1, Z^2 і Z^3 .

Вихідні речовини загальної формули (II) ще невідомі з літератури; як нові речовини вони є також об'єктом даної заявки.

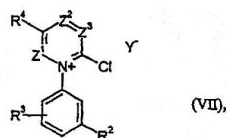
Нові іміноазини загальної формули (II) одержують наступним чином:

(α) азинони загальної формули (IX):



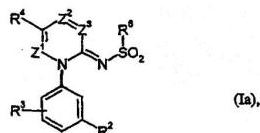
в якій R^2, R^3, R^4, Z^1, Z^2 і Z^3 мають вищевказані значення, на першій стадії, вводять у взаємодію з хлоруючими засобами, як, наприклад, фосген, дифосген, оксалілхлорид, тіонілхлорид, трихлорид фосфору, фосфорилхлорид або пентахлорид фосфору, у разі потреби, у присутності допоміжних для реакції засобів, як, наприклад, N,N-диметилформамід, і, у разі потреби, у присутності розріджувачів, як, наприклад, 1,2-дихлоретан, при температурах від 0°C до 150°C (див. приклади одержання),

і одержувані при цьому хлоразинієві сполуки загальної формули (VII):



в якій R^2, R^3, R^4, Z^1, Z^2 і Z^3 мають вищевказані значення, і Y означає атом хлору, PCl_4 , POCl_4 або PCl_5 ; на другій стадії, вводять у взаємодію з аміаком, у разі потреби, у присутності розріджувача, як, наприклад, метанол, і, у разі потреби, у присутності акцептора кислоти, як, наприклад, метилат натрію, при температурах від 0°C до 80°C (див. приклади одержання);

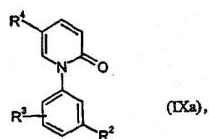
або
(β) заміщені іміноазини загальної формули (Ia):



в якій R^2, R^3, R^4, Z^1, Z^2 і Z^3 мають вищевказані значення, вводять у взаємодію із сильною кислотою, як, наприклад, сірчана кислота, що, у разі потреби, розведена водою, при температурах від 0°C до 100°C (див. приклади одержання).

Вихідні речовини загальної формули (IX) частково відомі і/або їх можна одержати відомими способами (див. Chem. Pharm. Bull., 45, 719-721 (1997); заявки на патенти ФРН 1900947, 2362958, 2555411; див. також приклади одержання).

Вихідні речовини загальної формули (IXa):



в якій R^2, R^3 і R^4 мають вищевказані значення, є новими сполуками згідно із даним винаходом для одержання сполук загальної формули (II). У загальній формулі (IXa) радикали R^2, R^3 і R^4 переважно мають ті значення, що вже були зазначені вище в зв'язку з описом пропонованих згідно винаходу сполук загальної формули (I) як переважні, особливо переважні або найвищою мірою переважні для R^2, R^3 і R^4 .

Вихідні речовини загальної формули (IXa) ще невідомі з літератури; як нові речовини вони є також об'єктом даної заявки.

Нові сполуки загальної формули (IXa) можна одержати відомими способами (див. Chem. Pharm. Bull., 45, 719-721 (1997); заявки на патенти ФРН 1900947, 2362958, 2555411; див. також приклади одержання).

Сполуки загальної формули (IX) також, як і сполуки загальної формули (IXa), мають біологічні властивості, що представляють інтерес. Особливо вони мають сильну гербіцидну дію.

Заміщені іміноазини загальної формули (Ia) являють собою пропоновані відповідно до винаходу нові сполуки; їх переважно одержують відповідно до запропонованого у винаході способі (б).

Використовувані, далі, у випадку запропонованого відповідно до винаходу способі (а) як вихідні речовини для одержання сполук загальної формули (I) сполуки, загалом, відповідають формулам (III), відповідно, (IV). У загальних формулах (III) і (IV) радикал R^1 переважно має те значення, що вже було зазначено вище в зв'язку з описом пропонованих відповідно до винаходу сполук загальної формули (I) як переважні, особливо переважні або найвищою мірою переважні для радикала R^1 ; X^1 означає переважно атом фтору, хлору, броду або групу $-\text{O}-\text{CO}-R^1$, особливо атом хлору або броду; Q^1 переважно означає атом

кисню або атом сірки.

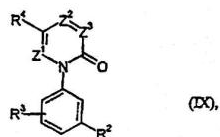
Вихідні речовини загальних формул (III) і (IV) є відомими органічними хімічними реагентами для синтезу.

Використовувані у випадку запропонованого відповідно до винаходу способу (б) як вихідні речовини для одержання сполук загальної формули (I) азинтіони, загалом, відповідають формулі (V). У загальній формулі (V) радикали R^2 , R^3 , R^4 , Z^1 , Z^2 і Z^3 переважно мають ті значення, що уже зазначені вище в зв'язку з описом пропонованих відповідно до винаходу сполук загальної формули (I) як переважні, особливо переважні або найвищою мірою переважні для R^2 , R^3 , R^4 , Z^1 , Z^2 і Z^3 .

Вихідні речовини загальної формули (V) ще невідомі з літератури; як нові речовини вони є також об'єктом даної заявки.

Нові азинтіони загальної формули (V) одержують наступним чином:

азиніони загальної формули (IX):



в якій

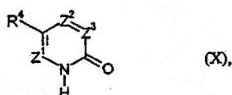
R^2 , R^3 , R^4 , Z^1 , Z^2 і Z^3 мають вищевказані значення,

вводять у взаємодію з реагентом що вводить сірку, як, наприклад, пентасульфід фосфору (P_2S_5 , відповідно, P_4S_{10}), у разі потреби, у присутності допоміжного для реакції засобу, як, наприклад, піридин, при температурах від 10°C до 150°C (див. приклади одержання).

Вихідні речовини загальної формули (IX) відомі і/або їх можна одержати відомими способами (див. Chem. Pharm. Bull., 45, 719-721 (1997); заявки на патенти ФРН 1900947, 2362958, 2555411; див. також приклади одержання).

Азиніони загальної формули (IX) одержують наступним чином:

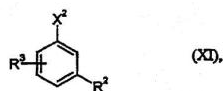
азиніони загальної формули (X):



в якій

R^4 , Z^1 , Z^2 і Z^3 мають вищевказані значення,

вводять у взаємодію з галогенаренами загальної формули (XI):



в якій

R^2 і R^3 мають вищевказані значення і

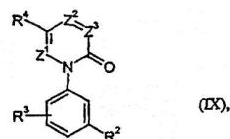
X^2 означає атом фтору, хлору, бромі або йоду,

у разі потреби, у присутності каталізатора, як, наприклад, йодид одновалентної міді, у разі потреби, у присутності акцептора кислоти, як, наприклад, карбонат калію, і, у разі потреби, у присутності розріджувача, як, наприклад, N,N-диметилформамід, при температурах від 20°C до 200°C (див. приклади одержання).

Використовувані у випадку запропонованого відповідно до винаходу способу (в) як вихідні речовини для одержання сполук загальної формули (I) хлоразинієві сполуки, загалом, відповідають формулі (VII). У загальній формулі (VII) радикали R^2 , R^3 , R^4 , Z^1 , Z^2 і Z^3 переважно мають ті значення, що уже зазначені вище в зв'язку з описом пропонованих відповідно до винаходу сполук загальної формули (I) як переважні, особливо переважні або найвищою мірою переважні для R^2 , R^3 , R^4 , Z^1 , Z^2 і Z^3 .

Вихідні речовини загальної формули (VII) ще невідомі з літератури; як нові речовини вони є також об'єктом даної заявки.

Нові хлоразинієві сполуки загальної формули (VII) одержують наступним чином: азиніони загальної формули (IX):



в якій

R^2 , R^3 , R^4 , Z^1 , Z^2 і Z^3 мають вищевказані значення,

вводять у взаємодію з хлоруючими засобами, як, наприклад, фосген, дифосген, оксалілхлорид, тіонілхлорид, трихлорид фосфору, фосфорилхлорид або пентахлорид фосфору, у разі потреби, у присутності допоміжних для реакції засобів, як, наприклад, N,N-диметилформамід, і, у разі потреби, у присутності розріджувачів, як, наприклад, 1,2-дихлоретан, при температурах від 0°C до 150°C (див. приклади одержання).

Використовувані, далі, у випадку запропонованого відповідно до винаходу способу (в) як вихідні речовини для одержання сполук загальної формули (I) аміносполуки, загалом, відповідають формулі (VIII). У загальній формулі (VIII) радикал R^1 переважно має те значення, що вже зазначено вище в зв'язку з описом пропонованих відповідно до винаходу сполук загальної формули (I) як переважні, особливо переважні або найвищою мірою переважні для радикала R^1 .

Вихідні речовини загальної формули (VII) є відомими хімічними реагентами для синтезу.

У якості допоміжних для реакції засобів у випадку пропонованих відповідно до винаходу способів (а) і (в) використовують, загалом, звичайні неорганічні або органічні основи або акцептори кислоти. До них переважно відносяться ацетати, аміди, карбонати, гідрокарбонати, гідриди, гідроксиди або алкоголяти лужних або лужноземельних металів, як, наприклад, ацетат натрію, калію або кальцію; амід літію, натрію, калію або кальцію; карбонат натрію, калію або кальцію; гідрокарбонат натрію, калію або кальцію; гідрид літію, натрію, калію або кальцію; гідроксид літію, натрію, калію або кальцію; метилат, етилат, н- або ізопропілат, н-, ізо-, втор- або трет-бутилат натрію або калію; далі, також основні органічні азотовмісні сполуки, як, наприклад, триметиламін, триетиламін, трипропіламін, трибутиламін, етилдіізопропіламін, N,N-диметилциклогексиламін, дициклогексиламін, етилдициклогексиламін, N,N-диметиланілін, N,N-диметилбензиламін, піридин, 2-метилпіридин, 3-метилпіридин, 4-метилпіридин, 2,4-диметилпіридин, 2,6-диметилпіридин, 3,4-диметилпіридин і 3,5-диметилпіридин, 5-етил-2-метилпіридин, 4-диметиламінопіридин, N-метилпіридин, 1,4-діазабіцикло[2.0.0]октан, 1,5-діазабіцикло[4.0.0]нон-5-ен або 1,8-діазабіцикло[5.0.0]ундец-7-ен.

У якості інших допоміжних для реакції засобів у випадку пропонованих відповідно до винаходу способів (а) і (в) використовують також міжфазні каталізатори. Як приклади таких каталізаторів варто назвати: тетрабутиламонійбромід, тетрабутиламонійхлорид, тетраоктиламонійхлорид, тетрабутиламонійгідросульфат, метилтриоктиламонійхлорид, гексадецилтриметиламонійхлорид, гексадецилтриметиламонійбромід, бензилтриметиламонійхлорид, бензилтриетиламонійхлорид, бензилтриметиламонійгідроксид, бензилтриетиламонійгідроксид, бензилтрибутиламонійхлорид, бензилтрибутиламонійбромід, тетрабутилфосфонійбромід, тетрабутилфосфонійхлорид, трибутилгексадецилфосфонійбромід, бутилтрифенілфосфонійхлорид, етилтриоктилфосфонійбромід, тетрафенілфосфонійбромід.

У якості допоміжних для реакції засобів і/або розріджувачів у випадку запропонованого відповідно до винаходу способу (г) використовують, загалом, застосовувані при реакціях нітрування речовини. До них переважно відносяться сірчана кислота, оцтова кислота і оцтовий ангідрид.

Пропоновані відповідно до винаходу способи (а), (б) і (в) одержання сполук загальної формули (I) переважно здійснюють при використанні одного або декількох розріджувачів. Як розріджувачі для здійснення пропонованих відповідно до винаходу способів (а), (б) і (в) використовують, поряд з водою, насамперед інертні органічні розчинники. До них особливо відносяться аліфатичні, аліциклічні або ароматичні, у разі потреби, галогеновані вуглеводні, як, наприклад, бензин, бензол, толуол, ксилол, хлорбензол, дихлорбензол, петролейний ефір, гексан, циклогексан, дихлорметан, хлороформ, тетрахлорвуглець; етери, такі як діетиловий етер, діізопропіловий етер, діоксан, тетрагідрофуран або етиленгліколь диметиловий або діетиловий етер; кетони, такі як ацетон, бутанон або метилізобутилкетон; нітрили, такі як ацетонітрил, пропіонітрил або бутиронітрил; аміди, як N,N-диметилформамід, N,N-диметилацетамід, N-метилформанілід, N-метилпіролідон або триамід гексаметилфосфornoї кислоти; естери, такі як метилацетат або етилацетат; сульфоксиди, як диметилсульфоксид; спирти, такі як метанол, етанол, н- або ізопропанол, етиленглікольмонометиловий етер, етиленглікольмоноетиловий етер, диетилглікольмонометиловий етер, диетилглікольмоноетиловий етер, їх суміші з водою або чиста вода.

При здійсненні пропонованих відповідно до винаходу способів (а), (б), (в) і (г) температури реакції можуть змінюватися в широких межах. Загалом, працюють при температурах від -30°C до 150°C , переважно від -10°C до 120°C .

Пропоновані відповідно до винаходу способи здійснюють, загалом, при нормальному тиску. Однак, пропоновані відповідно до винаходу способи також можна здійснювати при підвищеному або зниженому тиску, загалом, від 0,1 бар до 10 бар.

Для здійснення пропонованих відповідно до винаходу способів вихідні речовини використовують, загалом, приблизно в еквімолярних кількостях. Однак, компоненти також можна використовувати в більшому надлишку. Взаємодію здійснюють, загалом, у придатному розріджувачі, у разі потреби, у присутності допоміжного для реакції засобу і реакційну суміш перемішують, загалом, протягом декількох годин при необхідній температурі. Обробку здійснюють звичайними способами (див. приклади одержання).

Пропоновані відповідно до винаходу біологічно активні речовини можна застосовувати як дефоліанти, десиканти, засоби для передзбирального знищення бадилля і особливо як засоби знищення бур'янів. Під бур'яном у самому широкому змісті потрібно розуміти всі рослини, що виростають у місцях, де вони небажані. Чи діють пропоновані відповідно до винаходу речовини як гербіциди загальної дії або селективні гербіциди, залежить власне кажучи від використовуваної кількості.

Пропоновані відповідно до винаходу біологічно активні речовини можна застосовувати, наприклад, у випадку наступних рослин:

Дводольні бур'яни родів: *Abutilon*, *Amaranthus*, *Ambrosia*, *Anoda*, *Anthemis*, *Aphanes*, *Atriplex*, *Bellis*, *Bidens*, *Capsella*, *Carduus*, *Cassia*, *Centaurea*, *Chenopodium*, *Cirsium*, *Convolvulus*, *Datura*, *Desmodium*, *Emex*, *Erysimum*, *Euphorbia*, *Galeopsis*, *Galinsoga*, *Galium*, *Hibiscus*, *Ipomoea*, *Kochia*, *Lamium*, *Lepidium*, *Lindemia*, *Matricaria*, *Mentha*, *Mercurialis*, *Mullugo*, *Myosotis*, *Papaver*, *Pharbitis*, *Plantago*, *Polygonum*, *Porrulaca*, *Ranunculus*, *Raphanus*, *Rorippa*, *Rotala*, *Rumex*, *Salsola*, *Senecio*, *Sesbania*, *Sida*, *Sinapis*, *Solanum*, *Sonchus*, *Sphenoclea*, *Stellaria*, *Taraxacum*, *Thlaspi*, *Trifolium*, *Urtica*, *Veronica*, *Viola*, *Xanthium*.

Дводольні культури родів: *Arachis*, *Beta*, *Brassica*, *Cucumis*, *Cucurbita*, *Helianthus*, *Daucus*, *Glycine*, *Gossypium*, *Ipomoea*, *Lactuca*, *Linum*, *Lycopersicon*, *Nicotiana*, *Phaseolus*, *Pisum*, *Solanum*, *Vicia*.

Однодольні бур'яни родів: *Aegilops*, *Agropyron*, *Agrostis*, *Alopecurus*, *Apera*, *Avena*, *Brachiaria*, *Bromus*, *Cenchrus*, *Commelina*, *Cynodon*, *Cyperus*, *Dactyloctenium*, *Digitaria*, *Echinochloa*, *Eleocharis*, *Eleusine*,

Eragrostis, Eriochloa, Festuca, Fimbristylis, Heteranthera, Imperata, Ischaemum, Leptochloa, Lolium, Monochoria, Panicum, Paspalum, Phalaris, Phleum, Poa, Rottboellia, Sagittaria, Scirpus, Setaria, Sorghum.

Однодольні культури родів: Allium, Ananas, Asparagus, Avena, Hordeum, Oryza, Panicum, Saccharum, Secale, Sorghum, Triticale, Triticum, Zea,

Застосування біологічно активних речовин відповідно до винаходу, однак, ніяким чином не обмежується цими сімействами, а так само поширюється також на інші рослини.

У залежності від концентрації, біологічно активні речовини відповідно до винаходу придатні для загальної боротьби з бур'янами, наприклад, на промислових спорудженнях, на рейкових шляхах, на дорогах і на площах, що заросли і не заросли деревами. Біологічно активні речовини відповідно до винаходу також можуть бути використані для боротьби з бур'янами в багаторічних культурах, наприклад, у лісах, у насадженнях декоративних деревних порід, плодово-ягідних насадженнях, виноградниках, насадженнях цитрусових культур, горіхів, бананів, на кавових плантаціях, чайних плантаціях, насадженнях каучукових дерев, олійних пальм, какао, ягідних насадженнях і хмільниках, на декоративних газонах і спортивних площадках, сінокосно-пасовищних угіддях, а також для селективної боротьби з бур'янами в однолітніх культурах.

Пропоновані відповідно до винаходу сполуки формули (I), а також сполуки формул (IX) і (IXa) мають сильну гербіцидну активність і широкий спектр дії у випадку застосування в ґрунті і на надземних частинах рослин. У відомій мірі вони придатні також для селективної боротьби з однодольними і дводольними бур'янами в однодольних і дводольних культурах як при досходовій обробці, так і при післясходовій обробці.

Пропоновані відповідно до винаходу біологічно активні речовини у визначених концентраціях, відповідно, визначених нормах витрати можна застосовувати також для боротьби зі шкідливими тваринними і грибовими або бактеріальними хворобами рослин. У разі потреби, їх також можна використовувати як проміжні продукти або форпродукти для синтезу інших біологічно активних речовин.

Відповідно до винаходу, можна обробляти всі рослини або частини рослин. Під рослинами при цьому розуміють усі рослини і популяції рослин, як бажані і небажані дикоростучі рослини або культурні рослини (включаючи, природно, наявні культурні рослини). Культурними рослинами можуть бути рослини, які можна одержати звичайними методами культивування і оптимізації або біотехнологічними і генно-інженерними методами або комбінаціями цих методів, включаючи трансгенні рослини і включаючи сорти рослин, що захищаються або не захищаються законом про охорону нових сортів рослин. Під частинами рослин потрібно розуміти всі надземні і підземні частини і органи рослин, як парост, лист, квітка і корінь, причому потрібно назвати, наприклад, листи, голки, стебла, стовбури, квіти, плодові тіла, плоди і насіння, а також корені, бульби і ризоми. До частин рослин відноситься також зібраний врожай, а також вегетативний і генеративний матеріал для розмноження, наприклад, черешки, бульби, ризоми, відводки і насіння.

Пропоновану відповідно до винаходу обробку рослин і частин рослин за допомогою біологічно активних речовин здійснюють безпосередньо або шляхом впливу на середовище їх росту або закрите сховище відповідно до звичайних методів обробки, наприклад, шляхом занурення, мілкокрапельного обприскування, випару, створення штучного тумана, розкидання, намазування, і, далі, у випадку матеріалу для розмноження, особливо у випадку насіння, шляхом одношарового або багатшарового покриття.

Біологічно активні речовини можна переводити в звичайні препаративні форми, такі як розчини, емульсії, порошки, що змочуються, суспензії, дуети, пилоподібні препарати, пасти, розчинні порошки, грануляти, суспензійно-емульсійні концентрати, імпрегновані біологічно активними речовинами природні і синтетичні речовини, а також надтонке капсулювання в полімерних речовинах.

Ці препаративні форми одержують відомим чином, наприклад, шляхом змішування біологічно активних речовин з нейтральними наповнювачами, отже, з рідкими розчинниками і/або твердими носіями, у разі потреби, при використанні поверхнево-активних речовин, отже, емульгаторів, і/або диспергаторів, і/або пеноутворюючих речовин.

У випадку використання води в якості нейтрального наповнювача можна застосовувати також, наприклад, органічні розчинники як допоміжні розчинники. Як рідкі розчинники власне кажучи використовують ароматичні вуглеводні, такі як ксилол, толуол або алкілнафталіни, хлоровані ароматичні вуглеводні і хлоровані аліфатичні вуглеводні, такі як хлорбензоли, хлоретилени або дихлорметан, аліфатичні вуглеводні, такі як циклогексан або парафіни, наприклад, нафтові фракції, мінеральні і рослинні олії, спирти, такі як бутанол або гліколь, а також їх етери і естери, кетони, такі як ацетон, метилетилкетон, метилізобутилкетон або циклогексанон, сильно полярні розчинники, такі як диметилформамід і диметилсульфоксид, а також воду.

Як тверді носії використовують, наприклад, амонієві солі і природне кам'яне борошно, таке як каоліни, глини, тальк, крейда, кварц, атапульгіт, монтморилоніт або діатомові землі, і синтетичне кам'яне борошно, таке як високодистерсна кремнієва кислота, оксид алюмінію і силікати; як тверді носії для гранулятів використовують, наприклад, здрібнені і фракціоновані гірські породи, такі як кальцит, мармур, пемза, сепіоліт, доломіт, а також синтетичні грануляти з неорганічного і органічного борошна, а також грануляти з органічного матеріалу, такі як тирса, шкарлупа кокосових горіхів, кукурудзяні початки і стебла тютюну; в якості емульгаторів і/або ціноутворюючих речовин використовують, наприклад, неюнні й аніонні емульгатори, як поліоксietiленові естери жирних кислот, поліоксietiленові етери жирних спиртів, наприклад, алкіларилполігліколеві етери, алкілсульфонати, алкілсульфати, арилсульфонати, а також білкові гідролізати; в якості диспергаторів використовують, наприклад, лігнінсульфітні луги і метилцелюлозу.

У препаративних формах можна використовувати засоби, що поліпшують адгезію, такі як карбоксиметилцелюлозу, природні і синтетичні порошкоподібні, гранульовані або латексоподібні полімери, такі як гуміарабік, полівініловий спирт, полівінілацетат, а також природні фосфоліпіди, такі як кефаліни і лецитини, і синтетичні фосфоліпіди. Іншими добавками можуть бути мінеральні і рослинні олії.

Можна використовувати барвники, такі як неорганічні пігменти, наприклад, оксид заліза, діоксид титану, фероціановий синій, і органічні барвники, як алізаринові, азо- і металфталоціанінові барвники, і мікроелементи, як солі заліза, марганцю, бору, міді, кобальту, молібдену і цинку.

Препаративні форми містять, загалом, 0,1-95мас.%, переважно 0,5-90мас.%, біологічно активної речовини.

Пропоновані відповідно до винаходу біологічно активні речовини можуть знайти застосування як самостійно так і у вигляді їх препаративних форм у суміші з відомими гербіцидами і/або з речовинами, що підвищують сумісність з культурними рослинами ("антидоти"), для боротьби з бур'янами, причому можливі готові препаративні форми або резервуарні суміші. Отже, також можливі суміші з засобами боротьби з бур'янами, що містять один або кілька відомих гербіцидів і антидот.

Для сумішей використовують відомі гербіциди, наприклад, наступні: ацетохлор, ацифлуорфен(-натрій), аклоніфен, алахлор, алоксидим(-натрій), аметрин, амікарбазон, амідохлор, амідосульфурон, анілофос, асулам, атразин, азафенідин, азимсульфурон, бефлубетамід, беназолін(-етил), бенфурезат, бенсульфурон(-метил), бентазон, бензфендізон, бензобіциклон, бензофенап, бензоїлпроп(-етил), біалафос, біфенокс, біспірибак(-натрій), бромобутид, бромофеноксим, бромоксиніл, бутахлор, бугафенацил(-аліл), бутроксидим, бутилат, кафенстрол, калоксидим, карбетамід, карфентразон(-етил), хлومتоксифен, хлорамбен, хлоридазон, хлоримурон(-етил), хлорнітрофен, хлорсульфурон, хлортолурон, цинідон(-етил), цинметилін, ціноссульфурон, клефоксидим, клетодим, клодинафоп(-пропаргіл), кломазон, кломепроп, клопіралід, клопірасульфурон(-метил), клорансулам(-метил), кумілурун, ціаназин, цибуترین, циклоат, циклосульфамурон, циклоксидим, цигалофоп(-бутил), 2,4-D, 2,4-DB, десмедифам, диаллат, дикамба, дихлорпроп(-P), диклофоп(-метил), диклосулам, діетатил(-етил), дифензокват, дифлуфенікан, дифлуфензопір, димефурон, димепиперат, диметахлор, диметаметрин, диметенамід, димексифлам, динітрамін, дифенамід, дикват, дитіопір, діурон, димрон, епроподан, ЕРТС, еспрокарб, еталфлураліін, етаметсульфурон(-метил), етофумезат, етоксифен, етоксисульфурон, етобензанід, феноксапроп(-P-етил), фентразамід, флампроп(-ізопропіл, -ізопропіл-L, -метил), флазасульфурон, флорасулам, флуазифоп(-P-бутил), флуазолат, флукарбазон(-натрій), флуфенацет, флуметсулам, флуміклолак(-пентил), флуміоксазин, флуміпропін, флуметсулам, флуометурон, флуорохлоридон, флуороглікофен(-етил), флупоксам, флупропаціл, флупірсульфурон(-метил, -натрій), флуренол(-бутил), флуридон, флуороксіпір(-бутоксіпропіл, -метил), флурпримідол, флуртамон, флутиацет(-метил), флутіамід, фомесафен, форамсульфурон, глюфозинат(-амоній), гліфозат(-ізопропіламоній), галосафен, галоксифоп(-етоксietiл, -P-метил), гексазинон, імазаметабенз(-метил), імазаметаліп, імазамокс, імазапик, імазапір, імазахін, імазеталіп, імазосульфурон, йодосульфурон(-метил, -натрій), іоксиніл, ізопропалін, ізопротурон, ізоурон, ізоксабен, ізоксахлортол, ізоксафлутол, ізоксапірифоп, лактофен, ленаціл, лінурун, МСРА, мекопроп, мезофенацет, мезотрион, метамітрон, метазакхлор, метабензтіазурон, метобензурун, метобромурон, (альфа-)метолахлор, метосулам, метоксурон, метрибузин, метсульфурон(-метил), молінат, монолінурун, напроанілід, напропамід, небурон, нікосульфурон, норфлуразон, орбенкарб, оризалін, оксадіаргіл, оксадіазон, оксасульфурон, оксацикломефон, оксифлуорфен, паракват, пеларгонова кислота, пендиметалін, пендралін, пентоксазон, фенмедифам, піколінафен, піперофос, претилахлор, примісульфурон(-метил), профлуразол, прометрин, пропахлор, пропаніл, пропаквізафоп, пропізохлор, пропоксикарбазон(-натрій), пропізамід, просульфоккарб, просульфурон, пірафлуфен(-етил), піразогіл, піразолат, піразосульфурон(-етил), піразоксифен, пірибензоксим, пірибутикарб, піридат, піридатол, пірифталід, піримінобак(-метил), піритіобак(-натрій), хінхлорак, хінмерак, хінокламін, хінзалофоп(-P-етил, -P-тефурил), римсульфурон, сетоксидим, симазин, симетрин, сулькотріон, сульфентразон, сульфометурон(-метил), сульфозат, сульфосульфурон, тебутам, тебутіурон, тепралоксидим, тербутилазин, тербутрин, тенілхлор, тіафлуамід, тіазопір, тидіазимін, тифенсульфурон(-метил), тіобенкарб, тіокарбазил, тралкоксидим, триалат, триасульфурон, трибенурун(-метил), триклопір, тридифан, трифлураліін, трифлорисульфурон, трифлусульфурон(-метил), тритосульфурон.

Також можлива суміш з іншими відомими біологічно активними речовинами, як фунгіциди, інсектициди, акарициди, нематодици, речовини для захисту від птахів, речовини для підживлення рослин і засоби для поліпшення структури ґрунту.

Біологічно активні речовини можна застосовувати індивідуально, у виді їх препаративних форм або приготовлених з них шляхом подальшого розведення форм застосування, які готові до вживання розчини, суспензії, емульсії, порошки, пасти і грануляти. Застосування здійснюють звичайним чином, наприклад, шляхом поливання, обприскування, мілкокрапельного обприскування, розкидання.

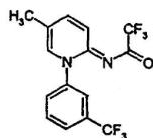
Пропоновані відповідно до винаходу біологічно активні речовини можна наносити як до, так і після появи сходів рослин. Їх можна також вносити перед посівом у ґрунт.

Використовувана кількість біологічно активної речовини може коливатися в широких межах. Воно залежить, власне кажучи, від роду бажаного ефекту. Загалом, норми витрати становлять від 1г до 10кг, переважно від 5г до 5кг, біологічно активної речовини на гектар поверхні ґрунту.

Одержання і застосування пропонованих відповідно до винаходу біологічно активних речовин впливає з нижче приведених прикладів.

Приклади одержання

Приклад 1



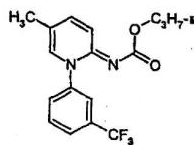
(спосіб (a))

Суміш з 2,3г (10ммоль) 5-метил-1-(3-трифторметилфеніл)-2(1Н)-піридинію, 2,1г (10ммоль) ангідриду трифтороцтової кислоти, 1,0г (10ммоль) триетиламіну і 50мл етилацетату перемішують протягом 60 хвилин при кімнатній температурі (приблизно 20°C). Потім реакційну суміш промивають водою, сушать над сульфатом натрію і фільтрують. Фільтрат концентрують у вакуумі водоструминного насоса, залишок

обробляють діізопропіловим етером і кристалічний продукт, що випав в осад, виділяють шляхом фільтрування під вакуумом.

Одержують 0,5г (14% від теоретично розрахованої кількості) 2,2,2-трихлор-N-[5-метил-1-(3-трифторметилфеніл)-2(1H)-піридиніліден]ацетаміду з температурою плавлення 115°C.

Приклад 2



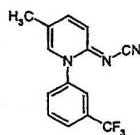
(спосіб (a))

Суміш з 1,1г (4ммоль) 5-метил-1-(3-трифторметилфеніл)-2(1H)-піридинію, 5мл (5ммоль) ізопропілового етеру хлормурашиної кислоти, 0,5г (5ммоль) триетиламіну і 50мл етилацетату перемішують протягом 60 хвилин при кімнатній температурі (приблизно 20°C). Потім реакційну суміш промивають водою, водну фазу додатково екстрагують дихлорметаном, об'єднані органічні фази сушать над сульфатом натрію і фільтрують. З фільтрату ретельно відганяють розчинники при зниженому тиску.

Одержують 0,6г (46% від теоретично розрахованої кількості) етеру N-[5-метил-1-(3-трифторметилфеніл)-2(1H)-піридиніліден]-О-метилкарбамінової кислоти у виді аморфного залишку.

log P=1,59 (у відношенні визначення значень log P див. с.39).

Приклад 3

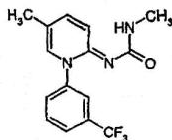


(спосіб (a))

Суміш з 1,1г (4ммоль) 5-метил-1-(3-трифторметилфеніл)-2(1H)-піридинію, 0,6г (5ммоль) бромціану, 0,5г (5ммоль) триетиламіну і 50мл етилацетату перемішують протягом 30 хвилин при кімнатній температурі (приблизно 20°C). Потім реакційну суміш промивають водою, водну фазу додатково екстрагують дихлорметаном, об'єднані органічні фази сушать над сульфатом натрію і фільтрують. З фільтрату ретельно відганяють розчинники при зниженому тиску.

Одержують 0,35г (32% від теоретично розрахованої кількості) 5-метил-1-(3-трифторметилфеніл)-2(1H)-піридиніліденціанаміду з температурою плавлення 165°C.

Приклад 4

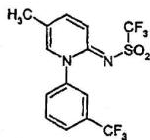


(спосіб (a))

Суміш з 2,6г (10ммоль) 5-метил-1-(3-трифторметилфеніл)-2(1H)-піридинію, 0,6г (10ммоль) метилизоціанату і 100мл ацетонітрилу витримують протягом двох годин при кімнатній температурі (приблизно 20°C). Потім концентрують у вакуумі водоструминного насоса, залишок обробляють діізопропіловим етером і кристалічний продукт, що випав в осад, виділяють шляхом фільтрування під вакуумом.

Одержують 2,1г (68% від теоретично розрахованої кількості) N-метил-N'-[5-метил-1-(3-трифторметилфеніл)-2(1H)-піридиніліден]сечовини з температурою плавлення 114°C.

Приклад 5

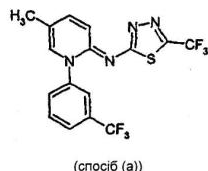


(спосіб (a))

2,9г (10ммоль) 5-метил-1-(3-трифторметилфеніл)-2(1H)-піридинію гідрохлориду, 3,1г (30ммоль) триетиламіну і 100мл ацетонітрилу, при кімнатній температурі (приблизно 20°C) і при перемішуванні, по краплях додають 2,9г (10ммоль) ангідриду трифторметансульфокислоти. Реакційну суміш перемішують протягом 60 хвилин при кімнатній температурі і потім концентрують у вакуумі водоструминного насоса. Отриманий у виді залишку сирий продукт очищають шляхом колоночної хроматографії (сілікагель; суміш етилацетату і гексану в співвідношенні 9:1).

Одержують 0,40г (10% від теоретично розрахованої кількості) аміду N-[5-метил-1-(3-трифторметилфеніл)-2(1H)-піридиніліден]трифторметансульфокислоти з температурою плавлення 206°C.

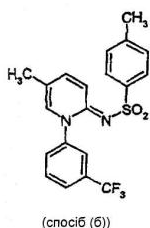
Приклад 6



Суміш з 2,9г (10ммоль) 5-метил-1-(3-трифторметилфеніл)-2(1H)-піридиній гідрохлориду, 2,3г (10ммоль) 2-метилсульфоніл-5-трифторметил-1,3,4-тіадіазолу, 4,2г (30ммоль) карбонату калію і 30мл диметилсульфоксиду перемішують протягом 60 хвилин при температурі 100°C и після охолодження виливають приблизно в рівний об'єм дихлорметану. Після промивання водою і насиченим водним розчином хлориду натрію, органічну фазу сушать над сульфатом натрію і фільтрують. Фільтрат концентрують у вакуумі водоструминного насоса, залишок обробляють діетиловим етером і кристалічний продукт, що випав в осад, виділяють шляхом фільтрування під вакуумом.

Одержують 2,3г (57% від теоретично розрахованої кількості) N-(5-трифторметил-1-,3,4-тіадіазол-2-іл)-5-метил-1-(3-трифторметилфеніл)-2(1H)-піридинію з температурою плавлення 179°C.

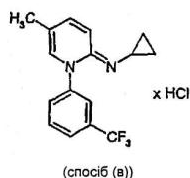
Приклад 7



2,7г (10ммоль) 5-метил-1-(3-трифторметилфеніл)-2(1H)-піридиніону вводять у 50мл хлороформу і, при кімнатній температурі (приблизно 20°C) і при перемішуванні, по краплях додають розчин 2,9г (10ммоль) гідрату натрієвої солі аміду N-хлор-п-толуолсульфокислоти (хлорамін-Т-гідрат) у 50мл етанолу. Реакційну суміш перемішують протягом 15 годин при кімнатній температурі, потім концентрують у вакуумі водоструминного насоса, залишок обробляють хлороформом, отриманий розчин промивають водою і потім насиченим водним розчином гідрокарбонату натрію, сушать над сульфатом натрію і фільтрують. Фільтрат концентрують у вакуумі водоструминного насоса і залишок витримують протягом 15 хвилин у високому вакуумі при температурі 180°C. Після охолодження і настоювання з діізопропіловим етером кристалічний продукт, що випав в осад, виділяють шляхом фільтрування під вакуумом.

Одержують 1,8г (49% від теоретично розрахованої кількості) 4-метил-N-[5-метил-1-(3-трифторметилфеніл)-2(1H)-піридиніліден]бензолсульфонаміду з температурою плавлення 174°C.

Приклад 8

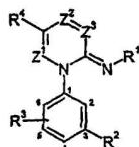


Суміш з 1,6г (5ммоль) 2-хлор-5-метил-1-(3-трифторметилфеніл)піридиній хлориду, 0,9г (15ммоль) циклопропіламіну і 50мл метанолу витримують протягом 15 годин при кімнатній температурі (приблизно 20°C) і потім концентрують у вакуумі водоструминного насоса. Залишок обробляють дихлорметаном, отриманий розчин промивають водою, сушать над сульфатом натрію і фільтрують. Фільтрат концентрують у вакуумі водоструминного насоса, залишок обробляють метанолом і соляною кислотою і летучі компоненти ретельно відганяють при зниженому тиску. Отриманий у виді залишку сирий продукт очищають шляхом колоночної хроматографії (силікагель; суміш етилацетату і гексану в співвідношенні 5:1).







Одержують 1,5г (91% від теоретично розрахованої кількості) 5-циклопропіл-5-метил-1-(3-трифторметилфеніл)-2(1H)-піридинію у виді маслянистого продукту.






log P=1,51 (у відношенні визначення значень log P див. с.39).








Аналогічно методикам прикладів 1-8, а також відповідно загальному опису пропонувані відповідно до винаходу способи одержання можна також одержати, наприклад, зазначені в приведеній далі таблиці 1 сполуки загальної формули (I).

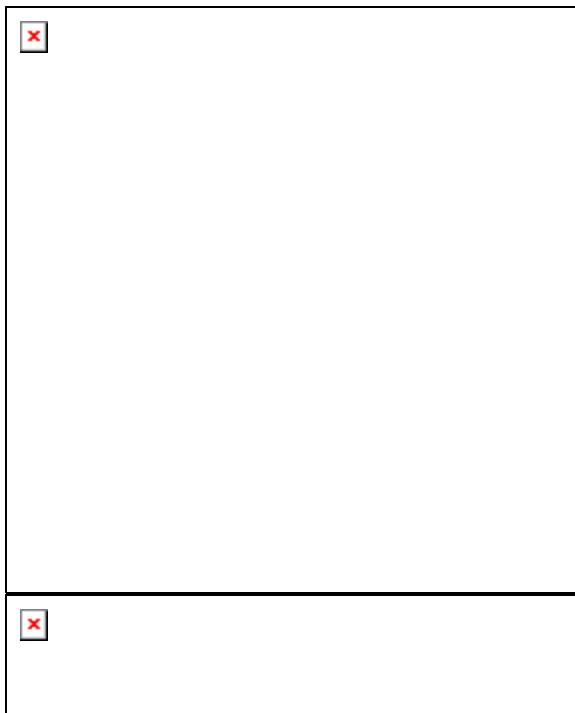


Таблиця 1
Приклади сполук формули (I)

Приклад №	R ¹	R ²	(Положення) R ³	R ⁴	Z ¹	Z ²	Z ³	Фізичні дані
9		CF ₃	-	CH ₃	CH	CH	CH	т. пл.:121°C
10		CF ₃	-	CH ₃	CH	CH	CH	т. пл.:175°C
11		CF ₃	-	CH ₃	CH	CH	CH	т. пл.:124°C
12		CF ₃	-	CH ₃	CH	CH	CH	т. пл.:156°C
13		CF ₃	-	CH ₃	CH	CH	CH	т. пл.:139°C
14		CF ₃	-	CH ₃	CH	CH	CH	т. пл.:140°C
15	-CO-CF ₃	CF ₃	-	CH ₃	N	CH	CH	т. пл.:128°C

Приклад №	R ¹	R ²	(Положення) R ³	R ⁴	Z ¹	Z ²	Z ³	Фізичні дані
16	-CH ₂ -C ₆ H ₅	CF ₃	-	CH ₃	CH	CH	CH	т. пл.:253°C
17	-CO-C ₃ H ₇₋₁₀₀	CF ₃	-	CH ₃	CH	CH	CH	т. пл.:93°C
18		CF ₃	-	CH ₃	CH	CH	CH	т. пл.:98°C
19	-CO-CHF ₂	CF ₃	-	CH ₃	CH	CH	CH	т. пл.:137°C
20		CF ₃	-	CH ₃	CH	CH	CH	т. пл.:165°C
21		CF ₃	-	CH ₃	CH	CH	CH	т. пл.:148°C
22		CF ₃	-	CH ₃	CH	CH	CH	logP = 1,58 ^h
23		CF ₃	-	CH ₃	CH	CH	CH	т. пл.:188°C
24	-CO-CF ₃	CF ₃	-	H	CH	CH	CH	т. пл.:150°C
25	-CO-CF ₃	CF ₃	(4) F	CH ₃	CH	CH	CH	т. пл.:180°C
26	-CO-CF ₃	CF ₃	(5) F	CH ₃	CH	CH	CH	т. пл.:158°C

Приклад №	R ¹	R ²	(Положення) R ³	R ⁴	Z ¹	Z ²	Z ³	Фізичні дані
27		CF ₃	-	CH ₃	CH	CH	CH	т. пл.:179°C
28		CF ₃	-	CH ₃	CH	CH	CH	т. пл.:201°C
29	-CN	CF ₃	-	CH ₃	N	CH	CH	т. пл.:148°C
30	-CO-CH ₃	CF ₃	-	CH ₃	CH	CH	CH	т. пл.:101°C
31	-CO-C ₂ H ₅	CF ₃	-	CH ₃	CH	CH	CH	т. пл.:113°C
32	-CO-C ₃ H ₇₋₁₁	CF ₃	-	CH ₃	CH	CH	CH	т. пл.:103°C
33		CF ₃	-	CH ₃	CH	CH	CH	т. пл.:133°C
34		CF ₃	-	CH ₃	CH	CH	CH	т. пл.:150°C
35		CF ₃	-	CH ₃	CH	CH	CH	т. пл.:85°C
36		CF ₃	-	CH ₃	CH	CH	CH	т. пл.:103°C
37		CF ₃	-	CH ₃	CH	CH	CH	т. пл.:181°C



Визначення зазначених у таблиці 1 значень $\log R$ здійснюють відповідно до методики БІС 79/831, Додаток V.A8, шляхом ВЕРХ (високоєфективна рідинна хроматографія) при використанні колонки з оберненою фазою (С 18). Температура: 43°C.

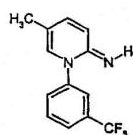
(а) Елюенти для визначення в кислій області значень рН: 0,1%-на водна фосфорна кислота, ацетонітрил; лінійний градієнт від 10% ацетонітрилу до 90% ацетонітрилу; відповідні результати виміру в таблиці 1 позначені індексом ^{a)}.

(б) Елюенти для визначення в нейтральній області значень рН: 0,01М водний розчин фосфатного буфера, ацетонітрил; лінійний градієнт від 10% ацетонітрилу до 90% ацетонітрилу; відповідні результати виміру в таблиці 1 позначені індексом ^{б)}.

Калібрування здійснюють за допомогою нерозгалужених алкан-2-онів (з 3-16 атомами вуглецю), значення $\log R$ яких відомі (визначення значень $\log R$ здійснюють на підставі часу утримання шляхом лінійної інтерполяції між двома послідовними алканонами).

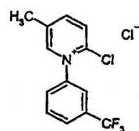
Значення λ_{\max} визначають за допомогою УФ-спектрів при довжинах хвиль від 200нм до 400нм для максимальних величин хроматографічних піків.

Вихідні речовини формули (II) Приклад (П-1)



(спосіб (а))

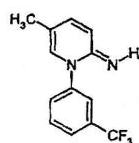
Стадія 1



Суміш з 2,5г (10ммоль) 5-метил-1-(3-трифторметилфеніл)-2(1Н)-піридону, 3,9г (30ммоль) оксалілхлориду, 40мл 1,2-дихлоретану і дві краплі N,N-диметилформаміду кип'ятять зі зворотним холодильником аж до припинення виділення газу. Після охолодження до кімнатної температури кристалічний продукт, що випав в осад, виділяють шляхом фільтрування під вакуумом.

Одержують 2,1г (65% від теоретично розрахованої кількості) 2-хлор-5-метил-1-(3-трифторметилфеніл)піридиній хлориду з температурою плавлення 194°C.

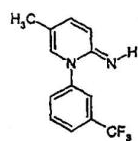
Стадія 2



3,1г (10ммоль) 2-хлор-5-метил-1-(3-трифторметилфеніл)піридиній хлориду вводять у 40мл метанолу і при температурі від 20°С до 30°С через цю суміш пропускають аміак аж до насичення розчину. Потім до цього розчину додають 3,6г (20ммоль) метиляту натрію у виді 30%-ного метанольного розчину і після цього суміш концентрують у вакуумі водоструминного насоса.

Одержаний у такий спосіб продукт (5-метил-1-(3-трифторметилфеніл)-2(1Н)-піридиній) без подальшого очищення можна вводити у взаємодію відповідно до запропонованого у винаході способу (а).

Приклад (II-I)

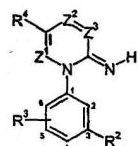


(спосіб ((β))

Суміш з 10г (24ммоль) 4-метил-N-[5-метил-1-(3-трифторметилфеніл)-2(1Н)-піридиніліден]бензолсульфонамідів і 50г 80%-ої сірчаної кислоти перемішують протягом 15 годин при температурі 50°С і потім по краплях додають до 1М водного розчину карбонату натрію. Потім екстрагують етилацетатом, органічну фазу сушать над сульфатом натрію і фільтрують. З фільтрату ретельно відганяють розчинник при зниженому тиску.

Одержують 2,3г (38% від теоретично розрахованої кількості) 5-метил-1-(3-трифторметилфеніл)-2(1Н)-піридинію, що без подальшого очищення можна вводити у взаємодію відповідно до запропонованого у винаході способу (а).

Аналогічно методикам приклада (II-1) можна також, наприклад, одержати зазначені в приведеній нижче таблиці 2 сполуки загальної формули (II).



(II)

Таблиця 2

Приклади сполук формули (II) (причому при цьому мова йде, відповідно, про гідрохлориди)

Приклад, №	R ²	(положення) R ³	R ⁴	Z ¹	Z ²	Z ³	Фізичні дані
II-2	CF ₃	-	H	CH	CH	CH	т.пл.: 269°С
II-3	CN	-	CH ₃	CH	CH	CH	
II-4	Cl	-	CH ₃	CH	CH	CH	
II-5	CF ₃	-	CH	CH	CH	CH	
II-6	Br	-	CH ₃	CH	CH	CH	
II-7	CF ₃	-	CN	CH	CH	CH	
II-8	OCF ₃	-	CH ₃	CH	CH	CH	
II-9	CF ₃	-	C ₂ H ₅	CH	CH	CH	
II-10	CF ₃	-	C ₃ H ₇ -н	CH	CH	CH	
II-11	CF ₃	-	C ₃ H ₇ -ізо	CH	CH	CH	
II-12	OCHF ₂	-	CH ₃	CH	CH	CH	
II-13	CF ₃	(2)F	CH ₃	CH	CH	CH	
II-14	CF ₃	(4)F	CH ₃	CH	CH	CH	т.пл.: 250°С
II-15	CF ₃	(5)F	CH ₃	CH	CH	CH	т.пл.: 250°С
II-16	CF ₃	(6)F	CH ₃	CH	CH	CH	
II-17	NO ₂	-	CH ₃	CH	CH	CH	
II-18	SO ₂ CH ₃	-	CH ₃	CH	CH	CH	
II-19	SO ₂ C ₂ H ₅	-	CH ₃	CH	CH	CH	
II-20	CF ₃	-	CH ₃	CH	N	CH	
II-21	CF ₃	-	CH ₃	CH	CH	N	
II-22	CF ₃	-	CH ₃	N	N	CH	
II-23	CF ₃	-	CH ₃	N	CH	N	
II-24	CF ₃	-	CH ₃	CH	N	N	
II-25	CF ₃	-	CH ₃	N	CH	CH	¹ Н-ЯМР (ДМСО-d ₆) δ: 2,43м.ч.

Приклад (II-26): 5-метил-1-(2,3-дифторметилендіоксифеніл)-2(1Н)-піридиній;

Приклад (II-27): 5-метил-1-(3,4-дифторметилендіоксифеніл)-2(1Н)-піридиній;

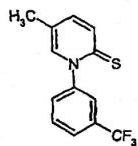
Приклад (II-28): 5-метил-1-(2,3-тетрафторетилендіоксифеніл)-2(1Н)-піридиній;

Приклад (II-29): 5-метил-1-(3,4-тетрафторетилендіоксифеніл)-2(1Н)-піридиній;

Приклад (II-30): 5-метил-1-(2,3-хлортрифторетилендіоксифеніл)-2(1Н)-піридиній;

Приклад (II-31): 5-метил-1-(3,4-хлортрифторетилендіоксифеніл)-2(1Н)-піридиній.

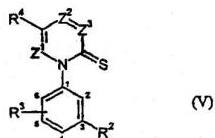
Вихідні речовини формули (V)



Суміш з 18,7г (74ммоль) 5-метил-1-(3-трифторметилфеніл)-2(1Н)-піридинону, 16,4г (74ммоль) пентасульфід фосфору і 75мл піридину кип'яють із зворотним холодильником протягом двох годин і після охолодження виливають у 300мл води. Після перемішування протягом ночі кристалічний продукт, що випав в осад виділяють шляхом фільтрування під вакуумом.

Одержують 12,8г (64% від теоретично розрахованої кількості) 5-метил-1-(3-трифторметилфеніл)-2(1Н)-піридинтіону з температурою плавлення 96°С.

Аналогічно методиці прикладу (V-1) можна також, наприклад, одержати зазначені в приведений далі таблиці 3 сполуки загальної формули (V).



Таблиця 3

Приклади сполук формули (V)

Приклад №	R ²	(положення) R ³	R ⁴	Z ¹	Z ²	Z ³
V-2	CF ₃	-	H	CH	CH	CH
V-3	CN	-	CH ₃	CH	CH	CH
V-4	Cl	-	CH ₃	CH	CH	CH
V-5	CF ₃	-	Cl	CH	CH	CH
V-6	Br	-	CH ₃	CH	CH	CH
V-7	CF ₃	-	CN	CH	CH	CH
V-8	CF ₃	-	C ₂ H ₅	CH	CH	CH
V-9	OCF ₃	-	CH ₃	CH	CH	CH
V-10	OCF ₃	-	C ₂ H ₅	CH	CH	CH
V-11	CF ₃	-	C ₃ H ₇ -ізо	CH	CH	CH
V-12	OCHF ₂	-	CH ₃	CH	CH	CH
V-13	CF ₃	(2)P	CH ₃	CH	CH	CH
V-14	CF ₃	(4)P	CH ₃	CH	CH	CH
V-15	CF ₃	(5)P	CH ₃	CH	CH	CH
V-16	CF ₃	(6)P	CH ₃	CH	CH	CH
V-17	NO ₂	-	CH ₃	CH	CH	CH
V-18	SO ₂ CH ₃	-	CH ₃	CH	CH	CH
V-19	SO ₂ C ₂ H ₅	-	CH ₃	CH	CH	CH
V-20	CF ₃	-	CH ₃	CH	N	CH
V-21	CF ₃	-	CH ₃	CH	CH	N
V-22	CF ₃	-	CH ₃	N	N	CH
V-23	CF ₃	-	CH ₃	N	CH	N
V-24	CF ₃	-	CH ₃	CH	N	N
V-25	CF ₃	-	CH ₃	N	CH	CH

Приклад (V-26): 5-метил-1-(2,3-дифторметилendioксифеніл)-2(1Н)-піридинтіон;

Приклад (V-27): 5-метил-1-(3,4-дифторметилendioксифеніл)-2(1Н)-піридинтіон;

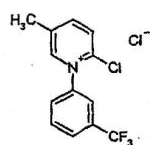
Приклад (V-28): 5-метил-1-(2,3-тетрафторетилendioксифеніл)-2(1Н)-піридинтіон;

Приклад (V-29): 5-метил-1-(3,4-тетрафторетилendioксифеніл)-2(1Н)-піридинтіон;

Приклад (V-30): 5-метил-1-(2,3-хлортрифторетилendioксифеніл)-2(1Н)-піридинтіон;

Приклад (V-31): 5-метил-1-(3,4-хлортрифторетилendioксифеніл)-2(1Н)-піридинтіон.

Форпродукти формули (VII) Приклад (VII-1)

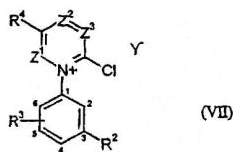


Суміш з 2,5г (10ммоль) 5-метил-1-(3-трифторметилфеніл)-2(1Н)-піридону, 3,9г (30ммоль) оксалілхлориду, 40мл 1,2-дихлоретану і дві краплі N,N-диметилформаміду кип'яють зі зворотним холодильником аж до припинення виділення газу. Після охолодження до кімнатної температури

кристалічний продукт, що випав в осад виділяють шляхом фільтрування під вакуумом.

Одержують 2,1г (65% від теоретично розрахованого виходу) 2-хлор-5-метил-1-(3-трифторметилфеніл)піридиній хлориду з температурою плавлення 194°C.

Аналогічно методиці прикладу (VII-1) можна також, наприклад, одержати зазначені в приведеній нижче таблиці 4 сполуки загальної формули (VII).



Таблиця 4

Приклади сполук формули (VII) (Y при цьому означає, відповідно, хлор)

Приклад, №	R ²	(положення) R ³	R ⁴	Z ¹	Z ²	Z ³	Фізичні дані
VII-2	CF ₃	-	H	CH	CH	CH	т.пл.: 74°C
VII-3	CN	-	CH ₃	CH	CH	CH	
VI-4	Cl	-	CH ₃	CH	CH	CH	
VI-5	CF ₃	-	Cl	CH	CH	CH	
VI-6	Br	-	CH ₃	CH	CH	CH	
VI-7	CF ₃	-	CN	CH	CH	CH	
VI-8	CF ₃	-	C ₂ H ₅	CH	CH	CH	
VI-9	OCF ₃	-	CH ₃	CH	CH	CH	
VI-10	OCF ₃	-	C ₂ H ₅	CH	CH	CH	
VI-11	CF ₃	-	C ₃ H ₇ -ізо	CH	CH	CH	
VI-12	OCHF ₂	-	CH ₃	CH	CH	CH	
VI-13	CF ₃	(2)F	CH ₃	CH	CH	CH	
VI-14	CF ₃	(4)F	CH ₃	CH	CH	CH	т.пл.: 250°C
VI-15	CF ₃	(5)F	CH ₃	CH	CH	CH	т.пл.: 265°C
VI-16	CF ₃	(6)F	CH ₃	CH	CH	CH	
VI-17	NO ₂	-	CH ₃	CH	CH	CH	
VI-18	SO ₂ CH ₃	-	CH ₃	CH	CH	CH	
VI-19	CF ₃	-	CH ₃	CH	N	CH	
VI-20	CF ₃	-	CH ₃	CH	CH	N	
VI-21	CF ₃	-	CH ₃	N	N	CH	
VI-22	CF ₃	-	CH ₃	N	CH	N	
VI-23	CF ₃	-	CH ₃	CH	N	N	
VI-24	CF ₃	-	CH ₃	N	CH	CH	log P=2,23 ^{а)}
VI-25	CF ₃	-	H	CH	CH	C-CH ₃	т.пл.: 218°C

Приклад (VII-26): 2-хлор-5-метил-1-(2,3-дифторметилendioксифеніл)піридиній хлорид;

Приклад (VII-27): 2-хлор-5-метил-1-(3,4-дифторметилendioксифеніл)піридиній хлорид;

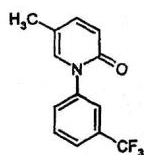
Приклад (VII-28): 2-хлор-5-метил-1-(2,3-тетрафторетилendioксифеніл)піридиній хлорид;

Приклад (VII-29): 2-хлор-5-метил-1-(3,4-тетрафторетилendioксифеніл)піридиній хлорид;

Приклад (VII-30): 2-хлор-5-метил-1-(2,3-хлортрифторетилendioксифеніл)піридиній хлорид;

Приклад (VII-31): 2-хлор-5-метил-1-(3,4-хлортрифторетилendioксифеніл)піридиній хлорид

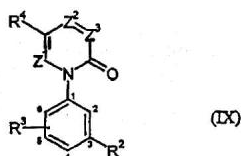
Вихідні речовини формули (IX) Приклад (IX-1)



Суміш з 21,8г (0,20моль) 5-метил-2-піридону, 54г (0,24моль) 3-бромбензотрифториде, 27,7г (0,20моль) карбонату калію, 2г (10ммоль) йодиду одновалентної міді і 300мл N,N-диметилформаміду перемішують протягом 15 годин при температурі 100°C и наступних 6 годин при температурі 140°C. Після охолодження до кімнатної температури змішують з 300мл етилацетату і потім розбавляють водою приблизно вдвічі. Органічну фазу відокремлюють, а водну фазу додатково екстрагують етилацетатом. Об'єднані органічні фази промивають водою, сушать над сульфатом натрію і фільтрують. З фільтрату ретельно відганяють розчинник при зниженому тиску.

Одержують 20,7г (41% від теоретично розрахованої кількості) 5-метил-1-(3-трифторметилфеніл)-2(1H)-піридинону з температурою плавлення 95°C.

Аналогічно методиці прикладу (IX-1) можна також, наприклад, одержати зазначені в приведеній нижче таблиці 5 сполуки загальної формули (IX).



Таблиця 5

Приклади сполук формули (IX)

Приклад, №		(положення) R ³	R ⁴	Z ¹	Z ²	I ¹	Фізичні дані
IX-2	CF ₃	-	H	CH	CH	CH	т.пл.: 63°C
IX-3	CN	-	CH ₃	CH	CH	CH	т.пл.: 188°C
IX-4	Cl	-	CH ₃	CH	CH	CH	
IX-5	CF ₃	-	Cl	CH	CH	CH	
IX-6	Br	-	CH ₃	CH	CH	CH	
IX-7	CF ₃	-	CN	CH	CH	CH	
IX-8	CF ₃	-	C ₂ H ₅	CH	CH	CH	
IX-9	CF ₃	-	CH ₃	N	CH	CH	т.пл.: 58°C
IX-10	CF ₃	(6)F	CH ₃	CH	CH	CH	
IX-11	OCF ₃	-	CH ₃	CH	CH	CH	т.пл.: 88°C
IX-12	OCF ₃	-	C ₂ H ₅	CH	CH	CH	
IX-13	CF ₃	-	C ₃ H ₇ -ізо	CH	CH	CH	
IX-14	OCHF ₂	-	CH ₃	CH	CH	CH	
IX-15	CF ₃	(2)F	CH ₃	CH	CH	CH	
IX-16	CF ₃	(4)F	CH ₃	CH	CH	CH	log P=2,19 ^{a)}
IX-17	CF ₃	(5)F	CH ₃	CH	CH	CH	т.пл.: 73°C
IX-18	CF ₃	(6)F	C ₂ H ₅	CH	CH	CH	
IX-19	NO ₂	-	CH ₃	CH	CH	CH	
IX-20	SO ₂ CH ₃	-	CH ₃	CH	CH	CH	
IX-21	CF ₃	-	CH ₃	CH	N	CH	
IX-22	CF ₃	-	CH ₃	CH	CH	N	
IX-23	CF ₃	-	CH ₃	N	N	CH	
IX-24	CF ₃	-	CH ₃	N	CH	N	
IX-25	CF ₃	-	CH ₃	CH	N	N	
IX-26	F	-	CH ₃	CH	CH	CH	т.пл.: 132°C
IX-27	CF ₃	-	CH ₃	CH	CH	C-CH ₃	log P=2,56 ^{a)}

Приклад (IX-28): 5-метил-1-(2,3-дифторметилендіоксифеніл)-2(1H)-піридинон (log P=3,95^{a)});

Приклад (IX-29): 5-метил-1-(3,4-дифторметилендіоксифеніл)-2(1H)-піридинон;

Приклад (IX-30): 5-метил-1-(2,3-тетрафторетилендіоксифеніл)-2(1H)-піридинон;

Приклад (IX-31): 5-метил-1-(3,4-тетрафторетилендіоксифеніл)-2(1H)-піридинон;

Приклад (IX-32): 5-метил-1-(2,3-хлортрифторетилендіоксифеніл)-2(1H)-піридинон;

Приклад (IX-33): 5-метил-1-(3,4-хлортрифторетилендіоксифеніл)-2(1H)-піридинон;

Приклад (IX-34): 3-метил-1-(3-трифторметилфеніл)-2(1H)-піридинон (т.пл.: 122°C);

Приклад (IX-35): 5-трифторметил-1-(3-трифторметилфеніл)-2(1H)-піридинон (log P=2,78^{a)}). (у відношенні визначення значень log P див. с.39).

Приклади застосування

Приклад А

Досходовий тест

Розчинник: 5 мас. частин ацетону

Емульгатор: 1мас. частин алкіларилполігліколевого етеру

Для одержання цільової композиції з біологічно активною речовиною, 1мас. частину біологічно активної речовини змішують із зазначеною кількістю розчинника, додають зазначену кількість емульгатора і концентрат розбавляють водою до бажаної концентрації.

Насіння тестуємих рослин висівають у звичайний ґрунт. Через 24 години ґрунт обприскують композицією з біологічно активною речовиною таким чином, що наносять, відповідно, бажану кількість біологічно активної речовини на одиницю площі. Концентрацію біологічно активної речовини в робочому розчині вибирають таким чином, що в 1000л води на гектар наносять, відповідно, бажану кількість біологічно активної речовини.

Через три тижні оцінюють ступінь ушкодження рослин у відсотках ушкодження в порівнянні з розвитком необроблених контрольних рослин. При цьому:

0% означає, що немає ніякої дії (як і необроблені контрольні рослини);

100% означає повне знищення.

У цьому тесті, наприклад, сполуки відповідно до прикладів одержання 1, 2, 3, IX-1, IX-3, IX-11 і IX-16, при частково гарній сумісності з культурними рослинами, як, наприклад, рис, мають сильну дію на бур'яни.

Приклад Б

Післясходовий тест

Розчинник: 5мас. частин ацетону.

Емульгатор: 1мас. частина алкіларилполігліколевого етеру

Для одержання цільової композиції з біологічно активною речовиною, 1мас. частину біологічно активної речовини змішують із зазначеною кількістю розчинника, додають зазначена кількість емульгатора і концентрат розбавляють водою до бажаної концентрації.

За допомогою композиції з біологічно активною речовиною обприскують рослини, що досліджуються, і мають висоту 5-15см, таким чином, що наносять, відповідно, бажані кількості біологічно активної речовини на одиницю площі. Концентрацію робочого розчину вибирають таким чином, що в 1000л води на гектар наносять, відповідно, бажані кількості біологічно активної речовини.

Через три тижні оцінюють ступінь ушкодження рослин у відсотках ушкодження в порівнянні з розвитком необроблених контрольних рослин.

При цьому:

0% означає, що немає ніякої дії (як і необроблені контрольні рослини);

100% означає повне знищення.

У цьому тесті, наприклад, сполуки відповідно до прикладів одержання 1, 3, IX-1 і IX-16 мають сильну дію на бур'яни