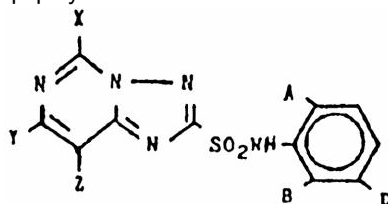


Изобретение относится к новым алкоксизамещенным 1,2,4-триазоло[1,5-с]пиримидин-2-сульфонамидным соединениям и использованию указанных соединений с целью борьбы с нежелательной растительностью.

Борьба с нежелательной растительностью при помощи химических средств, т.е. гербицидов, является важным аспектом современного сельского хозяйства и агротехники. И хотя в настоящее время имеется много различных химических средств, применяемых в целях борьбы с сорняками, новые соединения изобретения, обладающие более высокой общей или специфической к определенным видам растений активностью, являются при этом менее токсичными к возделываемым культурам, безопасными для человека и окружающей среды, менее дорогостоящими для использования или обладают другими ценными преимуществами.

Известно, что некоторые 1,2,4-триазоло[1,5-а]пиримидин-2-сульфонамиды обладают гербицидной активностью (Европейская заявка №0142152, опубли. 22 мая 1985г.). Указанные соединения являются эффективными при использовании их против сорняков в очагах их распространения путем дождевой или послежидовой обработки. Описаны также различные способы получения указанных гербицидов и необходимых промежуточных продуктов, 1,2,4-триазоло[1,5-а]-1,3,5-триазин-2-сульфонамиды, обладающие гербицидными свойствами, также являются известными такие, например, (патент США №4605433), как имидазоло[1,2-а]пиримидин-2-сульфонамиды (патент США №4731446) и пиразоло[1,5-а]пиримидин-2-сульфонамиды.

Было обнаружено, что алкокси/замещенные-1,2,4-триазоло[1,5-с]пиримидин-2-сульфонамиды формулы I



где X представляет  $\text{OCH}_3$  или  $\text{OC}_2\text{H}_5$ ;

Y и Z каждый независимо представляет  $\text{OCH}_3$ ,  $\text{OC}_2\text{H}_5$ , H,  $\text{CH}_3$ , Cl, Br или F;

A представляет F, Cl, Br,  $\text{CO}_2\text{R}$ ,  $\text{CF}_3$  или  $\text{NO}_2$ ;

B представляет H, F, Cl, Br,  $\text{CH}_3$ ,  $\text{SCH}_3$  или  $\text{OCH}_3$ ;

D представляет H или  $\text{CH}_3$ ;

R представляет  $\text{C}_1\text{-C}_3$  - алкил, обладают активностью против нежелательной растительности и могут быть использованы в борьбе против нежелательной растительности в присутствии кормовых культур и соевых культур. Соединения формулы I, используемые обычно в виде гербицидных композиций, содержащих указанные соединения в сочетании с агрономически приемлемыми адьювантами или носителем, проявляют гербицидные свойства при применении их непосредственно к очагам распространения нежелательной растительности или путем дождевой или послежидовой обработки.

Типичные соединения изобретения представлены в табл.1.

1,2,4-Триазоло[1,5-с]пиримидин-2-сульфонамиды формулы I могут быть использованы непосредственно в качестве гербицидов, однако предпочтительно использовать их в смесях, содержащих гербицидно эффективное количество указанного соединения в сочетании по крайней мере с одним агрономически приемлемым адьювантом или носителем. Соответствующими адьювантами или носителями должны быть нетоксичные к возделываемым культурам вещества, особенно в концентрациях, используемых при составлении композиций, предназначенных для применения в целях избирательного воздействия на сорняки в присутствии возделываемых культур; указанные адьюванты или носители также не должны вступать в химические реакции с соединениями формулы I или другими ингредиентами композиции. Эти смеси могут быть предназначены для применения непосредственно к сорнякам или к очагам их распространения, или же могут быть концентратами, или препаратами, которые перед употреблением обычно разбавляют с добавочными носителями или адьювантами. Они могут быть твердыми веществами, такими как порошки, гранулы, диспергируемые в воде гранулы или смачиваемые порошки; либо жидкими веществами, такими как эмульсионные концентраты, растворы, эмульсии или суспензии.

Соответствующие агрономически приемлемые адьюванты и носители, которые обычно применяются при изготовлении гербицидных смесей, хорошо известны специалистам.

Соединения формулы I являются ценными предвсходовыми и послежидовыми гербицидами. Некоторые из соединений формулы I обладают ценными свойствами в качестве избирательных гербицидов против широколистных сорняков и против оскообразных сорняков в злаках, таких как кукуруза, пшеница, ячмень и рис, и особенно в качестве избирательных гербицидов против широколистных сорняков, произрастающих в пшенице и кукурузе. Другие соединения могут быть использованы в борьбе против широколистных сорняков, произрастающих в сое культурной. Примерами таких широколистных сорняков могут служить различные виды грудинки колючей, вьюнок пурпурный, дурнушник, дурман обыкновенный, канатник Теофраста, лебеда белая и паслен черный. Указанные соединения можно также использовать против таких травянистых сорняков, как росичка и лисохвост. Однако, как известно любому специалисту, не все соединения можно применять против всех указанных сорняков и не все они являются избирательными для всех указанных возделываемых культур. Гербицидно эффективными или подавляющими растительность количеством является количество активного ингредиента, вызывающее неблагоприятное воздействие на естественный рост растения, включая его уничтожение, обезвоживание, замедление его роста и т.п. Термины "растения" и "растительность" означает проросшие семена, всходы и укоренившееся растение.

Соединения изобретения проявляют гербицидную активность при применении их непосредственно к растению или к очагу его распространения в стадии его роста или прорастания. Наблюдаемый эффект зависит от вида сорняков, стадии их роста, параметров разведения и размеров распыляемых капель, размеров частиц твердых компонентов, условий окружающей среды во время применения соединений, конкретно используемых соединений вида используемых адъювантов и носителей, типа почвы и т.п., а также количества применяемых химических веществ. Перечисленные выше и другие факторы могут быть подобраны специалистами для стимулирования избирательного гербицидного действия. Для получения максимального эффекта при применении к широколистным сорнякам, в основном предпочтительно использовать соединения изобретения в послевсходовый период к относительно незрелым растениям. Предпочтительно также использовать указанные соединения в условиях, при которых широколистные сорняки уничтожаются в присутствии пшеничной культуры.

Применяемые дозы при послевсходовой обработке в основном составляют 0,001 - 10кг/га, а при предвсходовой обработке эти дозы в основном составляют 0,01 - 10кг/га, предпочтительно от 5 до 313г/га.

Пример 1. Получение 4,5-дихлоро-6-метокси-2-метилпиримидина.

Раствор, содержащий 38г (0,17М) 2-метил-4,5,6-трихлоропиримидина в 200мл метанола охлаждают в ледяной бане до 10 - 15°C и медленно добавляют метоксид натрия в виде 25% - ного раствора в метаноле, при этом перемешивая до тех пор, пока исходный пиримидин не будет обнаруживаться посредством ГХ. Затем добавляют воду и полученную смесь экстрагируют метиленхлоридом. После удаления из экстракта растворителя и других летучих веществ путем выпаривания при пониженном давлении получают целевое соединение в виде белого порошка с точкой плавления 77 - 78°C.

Пример 2. Получение 4,6-дихлоро-2-метилтиопиримидина.

Суспензию, содержащую 21,9г (0,377М) фторида калия в 200мл N-метилпирролидона, получают в реакционной колбе, которую затем нагревают с целью удаления влаги. Когда температура достигает 200°C, смесь охлаждают приблизительно до 85°C и добавляют 24,5г (0,126М) 4,6-дихлоро-2-метилтиопиримидина, при этом перемешивая. Затем смесь нагревают, перемешивая при этом при температуре приблизительно 144°C и пониженном давлении около 150мм рт.ст., медленно удаляя растворитель и целевое соединение путем перегонки. Эту процедуру продолжают до тех пор, пока в колбе не остается очень небольшое количество жидкости. Дистиллят и остаток объединяют и разбавляют эфиром и полученную смесь экстрагируют водой несколько раз. Оставшийся эфирный раствор сушат сульфатом магния и концентрируют при пониженном давлении для получения остатка. После перегонки кипящую фракцию приблизительно при 127°C и при давлении 150мм рт.ст. собирают и получают целевое соединение (16,1г) в виде кристаллов белого цвета с точкой плавления 31 - 32°C.

Пример 3. Получение 4,6-дигидро-2-метилтиопиримидина.

Смесь, состоящую из 20,0г (0,126М) 4,6-дигидрокси-2-метилтиопиримидина, 150г (0,523М) оксидида фосфора и 600г эцетонитрила, нагревают в колбе с обратным холодильником в течение 3ч. Твердые вещества, которые сначала проявляют тенденцию к растворению, затем начинают формироваться в твердые частицы. Летучие вещества удаляют путем выпаривания при пониженном давлении, а остаток разбавляют метиленхлоридом, а затем осторожно водой. Водный слой удаляют, а органический слой несколько раз экстрагируют водой, сушат сульфатом магния и концентрируют при пониженном давлении. Остаток растворяют в гексане, а полученный раствор сушат сульфатом магния и концентрируют при пониженном давлении, в результате чего получают 26,8г целевого соединения в виде белого порошка с температурой плавления 82 - 84°C.

Пример 4. Получение 5-хлоро-4-метокси-2-метил-6-гидразинопиримидина.

Получают смесь, содержащую 21г 4,5-дихлоро-6-метокси-2-метилпиримидина (0,11М), 25мл гидразингидрата и 25мл воды, и нагревают ее в колбе с обратным холодильником в течение 25мин. Затем смесь охлаждают и экстрагируют метиленхлоридом. Экстракт промывают водой, сушат сульфатом магния и концентрируют при пониженном давлении. Твердый остаток экстрагируют гексаном и сушат, в результате чего получают 12,8г (теоретически 62%) целевого соединения в виде пемзообразного твердого вещества белого цвета с точкой плавления 158 - 159°C.

Приведенные ниже соединения получают аналогичным способом с использованием описанной выше методики и при соответствующем корректировании реакционной температуры:

4-бромо-2-метилтио-6-гидразинопиримидин в виде порошка не совсем белого цвета с точкой плавления 153 - 154°C;

4-метил-2-метилтио-6-гидразинопиримидин в виде белого порошка с точкой плавления 136 - 137°C;

5-хлоро-2-метилтио-4-гидразинопиримидин в виде белого порошка с температурой плавления 154 - 155°C;

2-метилтио-4-гидразинопиримидин в виде порошка желтовато-коричневого цвета с температурой плавления 138 - 139°C.

Пример 5. Получение 4-фторо-2-метилтио-6-гидразинопиримидина.

Раствор 15,8г (0,097М) 4,6-дифторо-2-метилтиопиримидина в 50мл этанола медленно добавляют, перемешивая, к раствору 11,6мл (12,0г 0,214М) гидразинмоногидрата в 100мл этанола, поддерживая температуру ниже 0°C путем внешнего охлаждения. Реакционную смесь подвергают взаимодействию еще 30мин, а затем летучие вещества удаляют путем выпаривания при пониженном давлении. Остаток разбавляют этилацетатом, а полученный раствор экстрагируют водой, сушат сульфатом магния и концентрируют при пониженном давлении, в результате чего получают 16,0г целевого соединения в виде белого порошка с температурой плавления 153 - 154°C.

Элементный анализ для  $C_5H_7FN_4S$

Вычислено, %: C 34,5, H 4,05, N 32,2

Найдено, %: C 34,5, H 3,94, N 32,2

Пример 6. Получение 4-хлоро-2-метилтио-5-метокси-6-гидразинопиримидина. Смесь, состоящую из

48,1г (0,21М) 4,6-дихлоро-2-метилтио-5-метоксипиримидина.

29,5г (0,21М) карбоната калия, 80мл гидразиномоногидрата и 80мл воды, нагревают в колбе с обратным холодильником, перемешивая в течение 30мин, так как за это время, как показывал анализ посредством ВЭЖХ, реакция завершается. Затем смесь охлаждают и экстрагируют метиленхлоридом. Экстракт сушат сульфатом магния и концентрируют при пониженном давлении. Затем остаток смешивают с гексаном, а твердые вещества удаляют фильтрацией и сушат, в результате чего получают 34,7г целевого соединения в виде твердого вещества желто-коричневого цвета с температурой плавления 118 - 119°C.

Пример 7. Получение 2-бензилтио-8-хлоро-7-метокси-5-метил-1,2,4-триазоло[1,5-с]пиримидина.

5-Хлоро-4-метокси-2-метил-6-гидразинопиримидин (11,3г 0,060М), 13,7г (0,18М) сероуглерода, 15,6г (0,072М) метоксида натрия в виде 25% - ного раствора в метаноле и 250мл этанола объединяют, перемешивают в течение 1ч при комнатной температуре, а затем нагревают в колбе с обратным холодильником в течение 2ч, так как за это время, как показывал анализ ВЭЖХ, реакция завершается. Затем добавляют бензилхлорид (9,1г, 0,072М), продолжая при этом нагревать с обратным холодильником и перемешивать. Твердые вещества тотчас же отделяют. Затем добавляют добавочные небольшие количества метоксида натрия и бензилхлорида до тех пор, пока ВЭЖХ-анализ не покажет, что реакция бензилирования завершилась. После чего смесь охлаждают и добавляют 10мл уксусной кислоты. Полученную смесь разбавляют водой до приблизительно 1л и экстрагируют метиленхлоридом. Экстракт промывают водой, сушат сульфатом магния и концентрируют при пониженном давлении. Остаток от выпаривания растирают с гексаном, фильтруют и сушат. Затем его перекристаллизуют из метанола и получают 16,3г (85% теоретически) целевого соединения в виде не совсем белого цвета порошка с температурой плавления 115 - 116°C.

Элементарный анализ для  $C_{14}H_{13}ClN_4OS$

Вычислено, %: С 52,4, Н 4,08, N 17,47

Найдено, %: С 52,3; Н 4,04, N 17,14

Пример 8. Получение 3-бензилтио-7-фторо-5-метилтио-1,2,4-триазоло[4,3-с]пиримидина.

4-Фторо-2-метилтио-6-гидразинопиримидин (15,0г, 0,086М), 15,5мл (19,7г, 0,258М), сероуглерода, 48мл (34,8г, 0,344М) триэтиламина и 400мл этанола объединяют, перемешивают и через 15мин нагревают в колбе с обратным холодильником, перемешивая при этом в течение 2,5ч. Полученную смесь охлаждают до комнатной температуры и, перемешивая, добавляют 16,4г (0,129М) бензилхлорида, после чего подвергают реакции в течение 3 часов. Летучие вещества удаляют выпариванием при пониженном давлении, а остаток растворяют в метиленхлориде. Полученный раствор экстрагируют водой, сушат сульфатом магния и концентрируют при пониженном давлении. Остаток растирают с гексаном и фильтруют, в результате чего получают 20,9г целевого соединения в виде порошка желто-оранжевого цвета с температурой плавления 74 - 77°C. Присутствует также небольшое количество 2-бензилтио-7-фторо-5-метилтио-1,2,4-триазоло[1,5-с]пиримидина.

ЯМР- и УФ-спектры показывают соответственно с предлагаемой структурой и наличие примеси.

Приведенные ниже соединения получают аналогичным способом, и полученные продукты имеют ЯМР- и УФ-спектры, соответствующие спектрам предлагаемых структур:

3-бензилтио-7-хлоро-5-метилтио-1,2,4-триазоло[4,3-с]пиримидин, в виде порошка светло-желтого цвета с точкой плавления 131 - 132°C;

3-бензилтио-7-метил-5-метилтио-1,2,4-триазоло[4,3-с]пиримидин, в виде светло-желтого порошка с точкой плавления 138 - 139°C;

3-бензилтио-7-бromo-5-метилтио-1,2,4-триазоло[4,3-с]пиримидин, в виде желтовато-коричневого порошка с температурой плавления 125 - 127°C;

3-бензилтио-7-бromo-5-метилтио-1,2,4-триазоло[4,3-с]пиримидин, в виде порошка не совсем белого цвета с температурой плавления 108 - 109°C; и

3-бензилтио-8-хлор-5-метилтио-1,2,4-триазоло[4,3-с]пиримидин в виде вязкого масла красного цвета, содержащего значительное количество 1,5-с изомера, т.пл. 103 - 106°C, выделенный независимо.

Пример 9. Получение 2-бензилтио-7-фторо-5-метокси-1,2,4-триазоло[1,5-с]пиримидина.

25% - ный раствор метоксида натрия в метаноле (1,9мл, 0,085М) добавляют в раствор 19,9г (0,065М) 3-бензилтио-7-фторо-5-метилтио-1,2,4-триазоло[4,3-с]пиримидина, содержащего небольшое количество 2-бензилтио-7-фторо-5-метилтио-1,2,4-триазоло[1,5-с]пиримидина и 11,2г (0,065М) диэтилмалеата в 250мл этанола, размешивая при комнатной температуре, а затем реакционную смесь оставляют для реакции приблизительно на 1ч. Затем добавляют уксусную кислоту (4мл), а летучие вещества удаляют путем выпаривания при пониженном давлении. Остаток растворяют в метиленхлориде, а полученный раствор экстрагируют водой, сушат сульфатом магния и концентрируют путем выпаривания при пониженном давлении. Остаток растирают с гексаном, фильтруют и сушат, в результате чего получают 10,7г целевого соединения в виде белого порошка с точкой плавления 121 - 122°C. ЯМР- и УФ-спектры полученного соединения показали соответствие с предлагаемой структурой.

Приведенные ниже соединения были получены аналогичным способом и имели их ЯМР- и УФ-спектры, соответствующие спектрам предлагаемых структур:

2-бензилтио-7-хлоро-5-метокси-1,2,4-триазоло[1,5-с]пиримидин, порошок не совсем белого цвета с температурой плавления 121 - 122°C, имеющий соответствующий СНН-анализ;

2-бензилтио-7-хлоро-5-этокси-1,2,4-триазоло[1,5-с]пиримидин, белый порошок с точкой плавления 85 - 86°C;

2-бензилтио-7-метил-5-метокси-1,2,4-триазоло[1,5-с]пиримидин, белый порошок с точкой плавления 93 - 94°C;

2-бензилтио-7-метил-5-этокси-1,2,4-триазоло[1,5-с]пиримидин, белый порошок с точкой плавления 77 - 78°C;

2-бензилтио-5-метокси-1,2,4-триазоло[1,5-с]пиримидин, порошок светло-желто-коричневого цвета с точкой плавления 96 - 97°C;

2-бензилтио-8-хлоро-5-метокси-1,2,4-триазоло[1,5-с]пиримидин, порошок бледно-желтого цвета с точкой плавления 109 - 110°C;

2-бензилтио-7-хлоро-5,8-диметокси-1,2,4-триазоло[1,5-с]пиримидин, порошок светло-желто-коричневого цвета с точкой плавления 94 - 95°C.

Пример 10. Получение 5-хлоро-7-метокси-2-бензилтио-1,2,4-триазоло[1,5-с]пиримидина.

2,4-Диметокси-6-гидразинопиримидин 48,4г (0,28М), 121,6г (1,6М) сероуглерода, 145,2г (1,44М) триэтиламина и 2л этанола объединяют, перемешивая, и через 30мин нагревают в колбе с обратным холодильником в течение 2ч. Затем добавляют бензилхлорид 40,4г (0,32М) и продолжают нагревание с обратным холодильником еще 1ч. Затем смесь концентрируют при пониженном давлении, а остаток объединяют с 800мл ацетонитрила и 250мл оксихлорида фосфора. Смесь нагревают с обратным холодильником, перемешивая, в течение 3ч. Затем ее концентрируют при пониженном давлении и остаток выливают в смесь льда и метиленхлорида. Органическую фазу отделяют, фильтруют через силикагель и концентрируют при пониженном давлении. Остаток экстрагируют горячим гексаном, а затем гексан удаляют выпариванием. Указанную фракцию очищают при помощи препаративной ВЭЖХ и получают около 5г целевого соединения. Вещества, не растворившиеся в гексане, растворяют в нагретом четыреххлористом углероде. В результате фильтрации и выпаривания четыреххлористого углерода получают маслянистое вещество, которое затвердевает, если в него добавить небольшое количество ацетона. Его объединяют с заранее выделенным продуктом и экстрагируют нагретым гексаном. Остаток сушат и получают 31,2г (теоретически 36%) целевого соединения в виде порошка бледно-желтого цвета 95% чистоты. Образец, который затем очищают при помощи ВЭЖХ, плавится при 140 - 141°C.

Элементный анализ для  $C_{14}H_{11}ClN_4OS$

Вычислено, %: С 50,89, Н 3,61, N 18,26

Найдено, %: С 50,00, Н 3,62, N 18,44

Соединение 8-бромо-5-хлоро-7-метокси-2-бензилтио-1,2,4-триазоло[1,5-с]пиримидин получают аналогичным способом; проведенный элементный анализ показал удовлетворительные результаты, его точка плавления составляет 124 - 125°C.

Пример 11. Получение 8-хлоро-2-хлоросульфонил-7-метокси-5-метил-1,2,4-триазоло[1,5-с]пиримидина.

2-Бензилтио-8-хлоро-7-метокси-5-метил-1,2,4-триазоло[1,5-с]пиримидин (2,0г; 0,0060М), 50мл хлороформа и 50мл воды объединяют и смесь охлаждают в ледяной ванне. Затем медленно добавляют газообразный хлор (4,4г, 0,060М), перемешивая и поддерживая температуру ниже 10°C. Затем смесь перемешивают еще 30мин, после чего водный слой удаляют, а органический слой сушат сульфатом натрия и концентрируют при пониженном давлении. Остаток растирают с гексаном и получают твердый продукт, который выделяют фильтрацией и сушат, в результате чего получают 1,6г (теоретически 90%) целевого соединения в виде белого порошка с точкой плавления 100 - 101°C.

Приведенные ниже соединения получают аналогичным способом, они имеют ЯМР- и УФ-спектры, соответствующие нужным структурам:

8-хлоро-2-хлоросульфонил-5-метокси-1,2,4-триазоло[1,5-с]пиримидин, порошок белого цвета с точкой плавления 122 - 124°C;

2-хлоросульфонил-7-фторо-5-метокси-1,2,4-триазоло[1,5-с]пиримидин, порошок белого цвета с точкой плавления 106 - 107°C;

7-хлоро-2-хлоросульфонил-5,8-диметокси-1,2,4-триазоло[1,5-с]пиримидин, порошок бледно-желтого цвета с точкой плавления 132 - 133°C;

2-хлоросульфонил-5-метокси-1,2,4-триазоло[1,5-с]пиримидин, порошок белого цвета с точкой плавления 128 - 129°C;

7-хлоро-2-хлоросульфонил-5-метокси-1,2,4-триазоло[1,5-с]пиримидин, бледно-желтый порошок с точкой плавления 136 - 137°C;

7-хлоро-2-хлоросульфонил-5-этокси-1,2,4-триазоло[1,5-с]пиримидин, порошок белого цвета с точкой плавления 99 - 101°C;

2-хлоросульфонил-5-метокси-7-метил-1,2,4-триазоло[1,5-с]пиримидин, белый порошок с точкой плавления 104 - 106°C.

Пример 12. Получение 5-хлоро-7-метокси-2-хлоросульфонил-1,2,4-триазоло[1,5-с]пиримидина.

5-Хлоро-7-метокси-2-бензилтио-1,2,4-триазоло[1,5-с]пиримидин (10,0г, 0,033М), 200мл хлороформа и 200мл воды объединяют и охлаждают в ледяной бане. Затем, перемешивая, медленно добавляют газообразный хлор (10,2г, 0,143М), поддерживая при этом температуру приблизительно ниже 3°C, и продолжают перевешивать еще 30мин. Затем органическую фазу отделяют, сушат сульфатом магния и концентрируют при пониженном давлении, в результате чего получают 9,1г (теоретически 97%) целевого соединения в виде полутвердого вещества желтого цвета. Небольшую часть очищают, растирая с эфиром, и получают белый порошок с точкой плавления 79 - 80°C.

Приведенное ниже соединение было получено аналогичным способом:

8-бромо-5-хлоро-7-метокси-2-хлоросульфонил-1,2,4-триазоло[1,5-с]пиримидин: т.пл. 164 - 166°C.

Пример 13. Получение 2,6-дихлорофенил-8-хлоро-7-метокси-5-метил-1,2,4-триазоло[1,5-с]пиримидин-2-сульфонамида.

Безводный йодит натрия (11,7г, 0,078М) помещают в 50мл сухого ацетонитрила и, перемешивая, добавляют 8,5г (0,078М) триметилсилилхлорида. Затем к смеси добавляют 6,3г (0,039М) 2,6-дихлоранилина и 7,9г (0,078М) триэтиламина. Смесь перемешивают при комнатной температуре в течение 30мин, затем летучие вещества осторожно удаляют путем выпаривания при пониженном давлении, а остаток разбавляют эфиром и фильтруют. Анализ путем газовой хроматографии показал, что раствор

содержит N-триметилсилил-2,6-дихлороанилин около 97% чистоты. Затем повторяют процедуру осаждения не растворенных веществ эфиром, после чего эфир удаляют путем выпаривания при пониженном давлении. Остаток смешивают с 50мл сухого ацетонитрила, 3,9г (0,013М) 8-хлоро-2-хлоросульфонил-7-метокси-5-метил-1,2,4-триазоло[1,5-с]пиримидина, и 0,2мл (0,008М) диметилсульфоксида и полученную смесь перемешивают в течение ночи. Затем смесь концентрируют при пониженном давлении, а твердый остаток смешивают с гексаном и водой и фильтруют. Затем остаток растворяют в 400мл метиленхлориде и полученный раствор дважды экстрагируют водой, высушивают сульфатом натрия и фильтруют, после чего концентрируют при пониженном давлении, а остаток смешивают с гексаном, собирают фильтрацией и сушат, в результате чего получают 3,3г (70% теоретически) целевого соединения в виде порошка бледно-желтого цвета с точкой плавления 255 - 256°C с разложением.

Элементный анализ для  $C_{17}H_{10}Cl_3N_5O_3S$

Вычислено, %: С 36,94, Н 2,38, N 16,57

Найдено, %: С 26,98, Н 2,41, N 16,30

Приведенные ниже соединения и другие соединения, свойства которых даны в табл.1, являются промежуточным для получения соединений, получены аналогичным способом и имеют удовлетворительные элементы (СНН) анализы и ЯМР-спектры, соответствующие желаемым структурам:

N-(2,6-дихлорофенил)-5-хлоро-7-метокси-1,2,4-триазоло[1,5-с]пиримидин-2-сульфонамид: порошок не совсем белого цвета;

N-(2,6-дихлоро-3-метилфенил)-5-хлоро-7-метокси-1,2,4-триазоло[1,5-с]пиримидин-2-сульфонамид: т.пл. 204 - 205°C;

N-(2,6-дихлорофенил)-8-бромо-5-хлоро-7-метокси-1,2,4-триазоло[1,5-с]пиримидин-2-сульфонамид: порошок,

N-(2,6-дихлоро-3-метилфенил)-8-бромо-5-хлоро-7-метокси-1,2,4-триазоло[1,5-с]пиримидин-2-сульфонамид: порошок желто-коричневого цвета;

N-(2,6-дихлоро-3-метилфенил)-8-хлоро-7-метокси-5-метил-1,2,4-триазоло[1,5-с]пиримидин-2-сульфонамид: т.пл. 234 - 236°C.

Пример 14. Получение N-(2,6-дихлорофенил)-5,7-диметокси-1,2,4-триазоло[1,5-с]пиримидин-2-сульфонамида.

N-(2,6-дихлорофенил)-5-хлоро-7-метокси-1,2,4-триазоло[1,5-с]пиримидин-2-сульфонамид (0,8г, 0,002мл) смешивают с 25мл метанола и, перемешивая, добавляют 1,34мл 25% - ного метоксида натрия в метаноле (0,006М). Через 10мин добавляют 2мл уксусной кислоты и полученную смесь концентрируют при пониженном давлении. Остаток растворяют в метиленхлориде и раствор экстрагируют водой, сушат сульфатом натрия и концентрируют при пониженном давлении. Остаток смешивают с четыреххлористым углеродом, собирают фильтрацией и сушат, в результате чего получают 0,5г целевого соединения в виде порошка не совсем белого цвета с точкой плавления 211 - 212°C.

Элементный анализ для  $C_{13}H_{11}Cl_2N_5O_4S$

Вычислено, %: С 38,62, Н 2,74, N 17,33

Найдено, %: С 38,09, Н 2,82, N 17,18

Приведенные ниже соединения получают аналогичным способом, они показали удовлетворительные результаты при элементном анализе и ЯМР-анализе:

N-(2,6-дихлоро-3-метилфенил)-5,7-диметокси-1,2,4-триазоло[1,5-с]пиримидин-2-сульфонамид: т.пл. 212 - 213°C;

N-(2,6-дихлорофенил)-8-бромо-5,7-диметокси-1,2,4-триазоло[1,5-с]пиримидин-2-сульфонамид: т.пл. 228 - 229°C (разл.); и

N-(2,6-дихлоро-3-метилфенил)-8-бромо-5,7-диметокси-1,2,4-триазоло[1,5-с]пиримидин-2-сульфонамид: т.пл. 228 - 229°C (разл.).

Пример 15. Оценка послевсходовой гербицидной активности.

Наиболее типичные соединения формулы I оценивают на послевсходовую гербицидную активность против различных видов растений. Для этого испытываемые растения выращивают до высоты около 4 дюймов (10см), а затем при помощи стандартной аппаратуры их опрыскивают водным составом, содержащим определенные концентрации соединений изобретения. Составы для разбрызгивания изготавливают путем смешивания требуемого количества активного ингредиента и эмульгатора или диспергатора в водном ацетоновом носителе для образования эмульсии или дисперсии. Контрольные растения опрыскивают тем же способом и аналогичными составами, в которых отсутствует активный ингредиент. После чего растения содержат в оранжерее в условиях, способствующих росту растений. Через две недели после обработки рост растений оценивают по шкале от 0 до 100, где оценка 0 означает отсутствие эффекта, а оценка 100 - полное уничтожение растения. В указанном испытании 100ppm представляет 0,25кг/га. Номера соединений (из табл.1) и испытываемые виды растений, применяемые дозы и полученные результаты испытаний представлены в табл.2.

Пример 16. Оценка предвсходовой гербицидной активности.

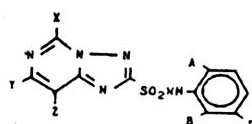
Наиболее типичные соединения формулы I оценивают на предвсходовую гербицидную активность против различных видов растений. С этой целью семена растений высаживают в горшки в пахотную почву, после чего почву с семенами сразу поливают определенными количествами испытываемых соединений в виде водной эмульсии или суспензии, позволяя им хорошо пропитать почву. Водные эмульсии или суспензии изготавливают путем смешивания требуемого количества активного ингредиента в водном ацетоном носителе, содержащем 0,1мас.% поверхностно-активного вещества. Контрольные горшки поливают аналогичной смесью, в которой отсутствует активный ингредиент. Затем горшки помещают в оранжерею при условиях, способствующих прорастанию и росту растения. Через 2 недели после обработки рост растений оценивают по шкале от 0 до 100, где оценка 0 означала отсутствие эффекта, а

оценка 100 - полное уничтожение растения. Соединения (номера взяты из табл.1), испытываемые виды растений, применяемые дозы, полученные результаты испытаний представлены в табл.3.

Были проведены испытания преимуществ соединений изобретения по сравнению с соединениями, описанными в ЕР №0244948. Данные, представленные в табл.2, достаточно ясно показывают высокую гербицидную активность заявленных соединений. Более высокая гербицидная активность соединений изобретения по отношению к соединениям ближайшего аналога продемонстрирована путем сравнения наиболее характерного соединения, описанного в ЕР №0244948, а именно (N-2,6-дифторофенил-5,7-диметил-1,2,4-триазоло[1,5-с]пиримидин-2-сульфонамида, с наиболее близким к нему соединениями изобретения, (N-2,6-дифторофенил-(моно- и ди)замещенными-1,2,4-триазоло[1,5-с]пиримидин-2-сульфонамидами. Результаты сравнения в табл.4 и 5 демонстрируют превосходство соединений изобретения по отношению к соединениям прототипа. Каждое из соединений изобретения значительно превосходит любое испытанное, известное соединение.

Таблица 1

1,2,4-Триазоло[1,5-с]пиримидин-2-сульфонамиды



Соединение №	X	Y	Z	A	B	D	t°, пл	Эл. анализ
1*	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	H	Cl	Cl	H	211-212	CHN
2*	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	H	Cl	Cl	CH <sub>3</sub>	212-213	CHN
3*	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	Br	Cl	Cl	H	225-226(d)	CHN
4*	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	Br	Cl	Cl	CH <sub>3</sub>	228-229(d)	CHN
5*	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	H	F	F	H	198-199(d)	CHN
6	OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	Cl	H	SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	F	H	300(d)	CHN
7	OCH <sub>3</sub>	H	CH <sub>3</sub>	CO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	F	H	175-178(d)	CHN
8	OCH <sub>3</sub>	H	Cl	F	SCH <sub>3</sub>	H	192-195(d)	CHN
9	OCH <sub>3</sub>	F	H	CF <sub>3</sub>	H	H	147-152(d)	CHN
10	OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	Cl	Cl	CO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	F	H	193-194(d)	CHN
11	OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	Cl	Cl	Cl	Cl	H	238-239(d)	CHN
12	OCH <sub>3</sub>	Cl	Cl	F	F	CH <sub>3</sub>	179-181(d)	CHN
13	OCH <sub>3</sub>	H	H	NO <sub>2</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	214-216(d)	CHN
14	OCH <sub>3</sub>	H	H	Cl	OCH <sub>3</sub>	H	190-192(d)	CHN
15	OCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	Cl	Cl	H	208-209	CHN
16	OCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	Cl	Cl	CH <sub>3</sub>	221-222	CHN
17	OCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	F	F	H	187-188	CHN
19	OC <sub>3</sub> H <sub>7</sub> (n)	F	H	CF <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	H	159-163	CHN
20	OCH <sub>3</sub>	Br	H	Cl	Cl	H	212-213(d)	CHN

21	OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	Cl	Cl	Cl	H	240-242(d)	CHN
22	OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	Cl	F	F	CH <sub>3</sub>	225-226(d)	CHN
23	OCH <sub>3</sub>	H	Br	F	F	H	207-210(d)	CHN
24	OCH <sub>3</sub>	H	Br	CO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	F	H	195-197(d)	CHN
25	OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	F	NO <sub>2</sub>	CH <sub>3</sub>	H	219-220(d)	CHN
26	OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	CH <sub>3</sub>	H	F	F	CH <sub>3</sub>	203-205	CHN
27	OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	CH <sub>3</sub>	H	NO <sub>2</sub>	CH <sub>3</sub>	H	225-227	CHN
28	OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	CH <sub>3</sub>	H	CO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	Cl	H	234-238	CHN
29	CH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	Cl	Cl	Cl	H	234-236(d)	CHN
30	CH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	Cl	Cl	Cl	CH <sub>3</sub>	231-232	CHN
31	CH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	Cl	F	F	H	219-220	CHN
32	CH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	Cl	NO <sub>2</sub>	CH <sub>3</sub>	H	216-218	CHN
33	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	Cl	Cl	Cl	H	234-235(d)	CHN
34	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	Cl	Cl	Cl	CH <sub>3</sub>	214-215(d)	CHN
35	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	Cl	F	F	H	245-246(d)	CHN
36	OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	F	H	CO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	190-191(d)	CHN
37	OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	F	H	NO <sub>2</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	219-220(d)	CHN
38	OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	F	H	CO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	Cl	H	222-223(d)	CHN
39	OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	F	H	F	Cl	H	212-213(d)	CHN
40	OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	F	H	CF <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	H	212-213(d)	CHN
41	OCH <sub>3</sub>	H	H	F	F	H	198-199(d)	CHN
42	OCH <sub>3</sub>	H	H	Cl	Cl	H	206-207(d)	CHN
43	OCH <sub>3</sub>	H	H	Cl	Cl	CH <sub>3</sub>	215-216(d)	CHN
44	OCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	CO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	F	H	175-177	CHN
45	OCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	Cl	CH <sub>3</sub>	H	185-235	CHN
46	OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	CH <sub>3</sub>	H	Cl	Cl	H	234-235	CHN
47	OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	CH <sub>3</sub>	H	CO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	F	H	180-185	CHN

48	OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	CH <sub>3</sub>	H	F	F	H	201-205	CHN
49	OCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	Cl	Cl	Cl	CH <sub>3</sub>	210-211	CHN
50	OCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	Cl	F	F	H	205-206	CHN
51	OCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	Cl	Cl	Cl	H	240-241	CHN
55	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	Cl	CO <sub>2</sub> H <sub>3</sub>	F	H	208-209(d)	CHN
56	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	H	CO <sub>2</sub> H <sub>3</sub>	F	H	166-167(d)	CHN
57	CH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	H	F	F	H	208-209	CHN
58	CH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	H	Cl	Cl	CH <sub>3</sub>	150-152	CHN
59	CH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	H	Cl	Cl	H	169-171	CHN
60	CH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	Cl	Br	H	H	165-166	CHN
61	CH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	Cl	CF <sub>3</sub>	H	H	128-130	CHN
62	OCH <sub>3</sub>	Cl	OCH <sub>3</sub>	Cl	Cl	H	229-230(d)	CHN
63	OCH <sub>3</sub>	Cl	OCH <sub>3</sub>	Cl	Cl	CH <sub>3</sub>	211-212	CHN
64	OCH <sub>3</sub>	Cl	OCH <sub>3</sub>	F	F	H	193-194	CHN
65	OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	Cl	H	Cl	Cl	H	125-126(d)	CHN
66	OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	Cl	H	Cl	Cl	CH <sub>3</sub>	212-213(d)	CHN
67	OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	Cl	H	F	F	H	219-220(d)	CHN
68	OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	Cl	H	CO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	F	H	166-167(d)	CHN
69	OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	Cl	H	CF <sub>3</sub>	H	H	156-157(d)	CHN
70	OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	Cl	H	F	H	CH <sub>3</sub>	159-160	CHN
71	OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	Cl	H	NO <sub>2</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	237-238(d)	CHN
72	OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	F	H	Cl	Cl	H	234-235(d)	CHN
73	OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	F	H	CO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	F	H	183-184(d)	CHN
74	OCH <sub>3</sub>	Cl	H	Cl	Cl	H	205-206(d)	CHN
75	OCH <sub>3</sub>	Cl	H	Cl	Cl	CH <sub>3</sub>	225-226(d)	CHN
76	OCH <sub>3</sub>	Cl	H	F	F	H	179-180(d)	CHN

77	OCH <sub>3</sub>	Cl	H	CO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	F	H	185-186(d)	CHN
78	OCH <sub>3</sub>	Cl	H	CF <sub>3</sub>	H	H	189-190(d)	CHN
79	OCH <sub>3</sub>	Cl	H	F	H	CH <sub>3</sub>	164-165(d)	CHN
80	OCH <sub>3</sub>	Cl	H	NO <sub>2</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	113-114(d)	CHN
81	OCH <sub>3</sub>	Cl	H	CO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	148-149(d)	CHN
82	OCH <sub>3</sub>	Cl	H	Br	Br	H	194-195(d)	CHN
83	OCH <sub>3</sub>	Cl	H	NO <sub>2</sub>	H	H	195-196(d)	CHN
84	OCH <sub>3</sub>	Cl	H	CO <sub>2</sub> N(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	F	H	165-166(d)	CHN
85	OCH <sub>3</sub>	Cl	H	Cl	CH <sub>3</sub>	H	175-176(d)	CHN
86	OCH <sub>3</sub>	Cl	H	Br	H	H	172-174(d)	CHN
87	OCH <sub>3</sub>	Cl	H	CO <sub>2</sub> -I-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	F	H	147-150(d)	CHN
88	OCH <sub>3</sub>	Cl	H	CO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	Cl	H	217-218(d)	CHN
89	OCH <sub>3</sub>	Cl	H	CO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	H	178-179(d)	CHN
90	OCH <sub>3</sub>	Cl	H	CF <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	H	177-178(d)	CHN
91	OCH <sub>3</sub>	Cl	H	Cl	OCH <sub>3</sub>	H	162-164	CHN
92	OCH <sub>3</sub>	Cl	H	NO <sub>2</sub>	CH <sub>3</sub>	H	205-206(d)	CHN
93	OCH <sub>3</sub>	Cl	H	CO <sub>2</sub> C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	Cl	H	191-192(d)	CHN
94	OCH <sub>3</sub>	Cl	H	F	F	CH <sub>3</sub>	178-179(d)	CHN
95	OCH <sub>3</sub>	Cl	H	F	H	H	179-180(d)	CHN
96	OCH <sub>3</sub>	F	H	Cl	Cl	H	201-202(d)	CHN
97	OCH <sub>3</sub>	F	H	F	F	H	179-180(d)	CHN
98	OCH <sub>3</sub>	F	H	CO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	F	H	180-182	CHN
99	OCH <sub>3</sub>	H	Cl	Cl	Cl	H	229-230	CHN
100	OCH <sub>3</sub>	H	Cl	Cl	Cl	CH <sub>3</sub>	203-205	CHN
101	OCH <sub>3</sub>	H	Cl	F	F	H	216-217	CHN
102	OCH <sub>3</sub>	H	Cl	CO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	F	H	185-187	CHN

103	OCH <sub>3</sub>	H	Cl	CF <sub>3</sub>	H	H	152-156	CHN
105	OCH <sub>3</sub>	H	F	Cl	Cl	CH <sub>3</sub>	236-237(d)	CHN
106	OCH <sub>3</sub>	H	F	CO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	F	H	147-148(d)	CHN
107	OCH <sub>3</sub>	H	F	F	F	H	220-221(d)	CHN

\*Получено по методике примера 14.  
(d) – с разложением.

Таблица 2

Послевсходовая активность. Процент уничтожения

Соединение №	Доза ррт	Цикорий	Дурнушник	Дурман вонюч.	Вьюнок пурпурный	Лебеда белая	Канатник Теофф.	Кукуруза	Рис	Пшеница	Соя культурн.	Чуфа
1	7.8	95	100	100	10	90	70	60	90	70	100	90
2	31	100	100	60	75	90	80	0	0	0	90	0
3	250	100	85	80	80	100	80	70	50	20	60	80
4	250	100	80	80	75	100	70	0	0	0	50	0
7	3.9	100	80	88	90	70	87	83	80	40	90	100
9	7.8	—	100	90	100	80	95	0	50	0	90	85
12	63	80	100	90	80	75	93	0	0	0	75	50
13	15.6	100	100	100	100	90	85	70	10	80	90	90
19	63	100	100	90	90	85	100	85	85	70	88	88
20	15.6	50	90	95	90	40	90	80	20	20	40	50
21	15.6	85	97	85	99	45	99	83	30	0	83	99

23	2.0	75	100	93	99	80	80	0	93	-	85	90
25	3.9	83	100	97	100	50	97	0	0	-	10	90
26	7.8	85	88	88	85	100	90	85	15	40	90	50
28	15.6	100	100	95	100	80	90	90	90	65	90	100
30	500	100	100	70	90	85	95	0	0	0	85	85
31	1000	85	80	60	70	75	75	0	-	0	10	30
32	500	100	80	90	75	0	50	50	-	-	-	-
37	15.6	90	83	50	88	50	90	30	15	0	65	75
38	15.6	40	100	90	88	100	100	90	70	10	0	100
39	15.6	90	70	90	97	97	99	40	35	10	25	93
40	3.9	100	100	90	100	85	100	90	70	60	85	80
41	7.8	95	90	90	100	89	90	20	75	0	90	100
42	31	95	90	90	90	90	98	80	85	50	90	95
43	16	95	95	75	90	50	85	0	0	0	90	78
44	1.9	100	90	88	89	25	85	20	45	70	90	-
45	125	70	100	90	90	100	90	90	85	100	90	95
46	7.8	95	100	100	75	30	75	100	50	75	75	85
47	3.9	90	100	100	90	85	70	70	100	75	93	-
48	63	90	100	100	100	100	95	90	100	95	90	-
49	16	100	100	60	80	90	70	0	40	0	80	0
50	250	100	100	90	85	100	85	80	40	40	70	85
51	125	95	100	85	80	100	85	90	60	20	80	80
52	250	100	100	100	90	100	100	90	40	70	70	70
53	125	100	90	100	90	100	80	60	20	50	70	50
54	125	95	100	90	80	90	80	50	30	50	80	0
55	31	90	90	85	85	75	80	20	70	40	90	-

56	16	88	90	88	100	75	65	35	80	50	90	-
57	500	70	40	70	30	30	70	0	0	0	35	0
58	250	98	100	30	70	0	70	0	0	0	80	0
59	500	95	100	80	70	0	75	0	0	0	25	70
62	16	95	95	95	90	20	80	25	0	0	0	0
63	500	95	100	95	90	95	90	0	0	15	80	20
64	125	90	85	95	80	80	85	0	50	0	70	20
65	7.8	88	88	95	100	85	90	55	50	75	88	70
66	16	85	88	75	100	75	90	10	0	20	86	0
67	31	90	100	88	100	90	95	65	35	20	88	70
68	7.8	85	100	98	100	85	90	0	50	20	88	60
69	3.9	88	90	45	90	45	85	0	0	0	70	0
70	16	88	88	85	90	55	88	0	0	0	85	40
71	7.8	88	100	60	90	85	85	0	10	0	88	0
72	1.0	75	100	100	100	0	90	75	35	0	10	65
73	15.6	93	90	99	80	95	99	55	80	40	15	100
74	1.0	88	90	75	85	30	70	30	0	40	40	40
75	7.8	90	95	80	100	75	70	0	0	0	65	0
76	16	100	90	85	100	90	80	65	75	45	90	88
77	7.8	85	100	90	100	90	90	5	70	35	75	-
78	63	70	100	80	80	85	80	0	40	10	70	85
79	16	80	80	80	0	80	80	0	20	50	50	75
80	63	90	90	80	90	80	80	0	0	0	75	70
81	7.8	90	85	90	80	95	80	0	80	90	60	60
82	16	100	100	100	80	100	90	70	40	60	70	80
83	3.9	100	90	65	75	65	70	0	0	0	60	65

84	500	50	70	60	50	70	30	40	25	40	80	20
85	7.8	75	100	80	85	75	80	30	0	30	50	70
86	31	90	100	85	85	15	45	25	20	0	75	80
87	16	80	90	80	80	75	80	0	20	0	35	75
88	125	100	90	90	80	100	100	50	85	60	80	85
89	250	100	100	80	80	95	100	75	45	70	70	85
90	31	90	90	80	90	85	85	60	40	40	75	85
91	3.9	88	90	70	90	80	90	70	75	85	85	90
92	16	88	95	70	100	70	90	0	15	30	88	70
93	63	88	85	98	100	80	98	0	90	85	88	100
94	16	80	100	80	50	85	88	75	20	40	88	50
95	31	90	95	88	100	0	70	28	40	0	88	90
96	3.9	80	100	85	85	70	80	40	40	15	20	85
97	2.0	80	90	70	85	70	80	20	60	10	35	70
98	7.8	75	85	90	90	80	88	40	70	40	0	95
99	31	75	90	95	100	99	100	75	95	60	90	-
100	16	95	100	70	90	50	85	0	0	0	90	70
101	3.9	100	90	100	85	65	90	0	60	0	90	100
102	125	90	95	90	100	100	95	100	90	98	90	100
103	63	90	95	75	90	85	90	45	95	100	90	95
105	15.6	100	90	70	95	70	95	0	0	0	90	75
106	7.8	100	80	95	100	99	97	99	60	50	70	99
107	15.6	100	100	95	100	90	98	20	75	0	90	90



Таблица 3

Предвсходовая активность, процент уничтожения

Соединение №	Доза, кг/га	Паслен черный	Вьюнок пурпурный	Лебеда белая	Канатник Теофраста
1	11	100	90	95	100
2	11	100	100	0	0
29	11	65	90	100	0
30	11	90	90	100	100
31	11	90	80	90	80
32	11	60	80	100	100
41	11	100	100	100	100
42	11	100	100	100	100
44	0,14	80	85	95	85
46	0,28	—	90	97	65
48	0,14	85	80	95	85
49	0,56	—	90	99	80
51	0,28	—	95	100	90
53	0,07	—	10	100	90
56	0,14	100	80	80	70
59	11	70	90	20	80
62	0,14	—	80	99	80
64	11	100	98	100	100
66	0,14	65	80	75	90
67	0,14	85	80	95	85
68	0,14	85	80	85	80
70	0,28	50	90	75	50
74	0,07	—	100	95	100
75	0,14	—	85	90	85
76	0,14	—	90	99	95
77	0,14	85	80	95	85
78	0,07	—	95	99	95
80	0,56	—	80	70	90
81	0,14	—	100	100	80
82	0,07	—	97	90	99
84	11	90	90	95	75
88	11	90	100	100	98
89	0,28	—	90	99	85
90	11	98	100	100	100
91	0,02	85	70	85	95
93	0,28	90	75	90	70
94	0,14	90	75	75	85
96	0,14	85	80	95	85
97	0,14	100	75	100	85
98	0,07	80	80	80	85
99	0,14	95	85	100	85
101	0,14	80	80	100	95
102	11	100	95	100	95

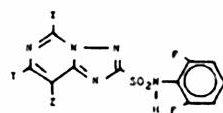
Таблица 4

## Гербицидная активность послевсходовая

Соединение №	Норма расхода, ч. на млн.	Сорняки кофейного дерева	Петуший репейник (Плевел)	Дурман обыкновенный	Вьюнок пурпурный	Лебеда белая	Канатник Теофраста
Известное	125	0	80	70	75	40	80
соединение	63	0	80	45	70	0	35
88	63	100	100	90	80	100	100
89	63	90	90	80	80	95	90
102	63	100	100	90	100	95	90

Таблица 5

## Сравнительная послевсходовая гербицидная активность 1,2,4-триазоло[1,5-с]пиримидин-2-сульфонамидов



Соединение №	X	Y	Z	Доза, ppm	Цикорий	Дурнушник	Дурман вонючий	Вьюнок пурпурный	Лебеда белая	Канатник Теофраста	Чуфа
Прототип	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	63	0	80	45	70	0	35	60
5	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	H	32	90	90	95	85	100	100	70
17	OCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	15.6	99	100	100	100	93	100	99
41	CH <sub>3</sub>	H	H	7.8	95	90	90	100	89	90	100
48	OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	CH <sub>3</sub>	H	63	90	100	100	100	100	95	-
67	OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	Cl	H	32	90	100	88	100	90	95	70
76	OCH <sub>3</sub>	Cl	H	16	100	90	85	100	90	80	88
97	OCH <sub>3</sub>	F	H	2	80	90	70	85	70	80	70
101	OCH <sub>3</sub>	H	Cl	3.9	100	90	100	85	65	90	100
107	OCH <sub>3</sub>	H	F	15.6	100	100	95	100	90	98	90