

(12) **PATENTO APRAŠYMAS**

(11) Patent numeris: **3874**

(51) Int.Cl.⁵: **C07D 239/24,**
A01N 43/54

(21) Paraiškos numeris: **IP1643**

(22) Paraiškos padavimo data: **1993 12 21**

(41) Paraiškos paskelbimo data: **1995 07 25**

(45) Patent paskelbimo data: **1996 04 25**

(60) SU duomenys: **SU 4356644, 1988 09 27**

(31,32,33) Prioritetas: **3750/87, 1987 09 28, CH 1333/88, 1988 04 11, CH**

(72) Išradėjas:
Adolf Hubele, CH

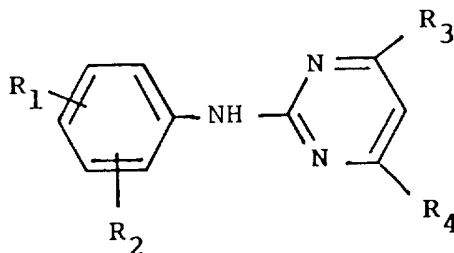
(73) Patent savininkas:
CIBA-GEIGY AG, Klybeckstrasse 141, 4002 Basle, CH

(74) Patentinis patikėtinis:
Rita Laurinavičiūtė, 5, UAB "Metida", Pilies g. 8/1-2, 2600 MTP Vilnius, LT

(54) Pavadinimas:
2-Anilino-pirimidino dariniai

(57) Referatas:

Junginys, kurio formulė I



(I),

kurioje

R₁ ir R₂, nepriklausomai vienas nuo kito, yra vandenilis, halogenas, C₁-C₃ - alkilas, C₁-C₂ - halogenalkilas, C₁-C₃ - alkoksi arba C₁-C₃ - halogenalkoksi;

R₃ - vandenilis, C₁-C₄ - alkilas, arba pakeistas halogenu, hidroksilu ir/arba ciano grupe C₁-C₄ - alkilas; ciklopropilas arba pakeistas iki trijų kartų vienodai arba skirtingai metilu ir/arba halogenu ciklopropilas;

R₄-C₃-C₆ - cikloalkilas arba pakeistas iki trijų kartų vienodai arba skirtingai metilu ir/arba halogenu C₃-C₆ - cikloalkilas; turi vertingas mikrobicidines ir insekticidines savybes.

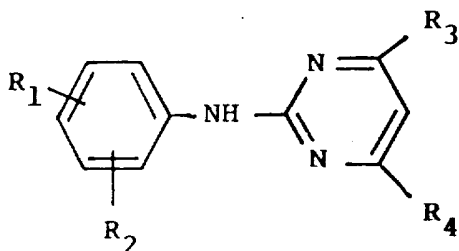
Naujos biologiškai aktyvios medžiagos gali būti panaudotos augalų apsaugai prieš kultūrinių augalų pažeidimą fitopatogeniniais mikroorganizmais arba kenksmingus vabzdžius ir kovai su šiais kenkėjais.

Šis išradimas priskirtinas naujiems, biologiškai aktyviems 2-anilino-pirimidino dariniams.

Šio išradimo junginiai atitinka 1 formulę:

5

10



(1),

kurioje:

15

R₁ ir R₂, nepriklausomai vienas nuo kito, gali būti vandenilis, halogenas, C₁-C₃ alkilas, C₁-C₂ halogenalkilas, C₁-C₃ alkoksi - arba C₁-C₃ halogenalkoksi grupė;

20

R₃ - vandenilis, C₁-C₄ alkilas arba pakeistas halogenu, hidroksilo arba ciano grupe, C₁-C₄ aklilas; ciklopropilas arba iki 3 kartų vienodai arba skirtingai pakeistas metilu ir/arba halogenu ciklopropilas;

25

R₄ - C₃-C₆ cikloalkilas arba vienodai ar skirtingai iki trijų pakeistas metilu ir/arba halogenu C₃-C₆ cikloalkilas, o taip pat jų adityvios rūgšties druskos, ar jų druskų kompleksai su metalu.

30

Alkilu, tiek vienu, tiek ir esančiu kito pakaito dalimi pvz., halogenalkilas, alkoksi arba halogenalkoksi), priklausomai nuo anglies atomų skaičiaus, gali būti metilas, etilas, propilas, butilas, o taip pat jų izomerai, kaip antai izopropilas, izobutilas antrinis arba tretinis butilas. Halogenu, pažymėtu Hal, gali būti fluoras, chloras, bromas arba jodas.

35

Halogenalkilu arba halogenalkoksi gali būti nuo paprastų iki perhalogenintų liekanų, kaip antai CHCl_2 , CH_2F , CCl_3 , CH_2Cl , CHF_2 , CF_3 , $\text{CH}_2\text{CH}_2\text{Br}$, C_2Cl_5 , CH_2Br , CHBrCl ir kt., bet geriausia CF_3 . Cikloalkilu, priklausomai nuo nurodyto anglies atomų skaičiaus, gali būti, pavyzdžiui, ciklopropilas, ciklobutilas, ciklopentilas arba cikloheksilas.

Yra žinomi N - pirimidinilaniliniai junginiai. Taip, DD paraiškoje Nr. 0224339 bei patente Nr. 151 404 aprašyti junginiai, turintys N - 2 - pirimidinilo struktūrą, ir efektyvūs prieš augalams kenksmingus grybelius. Tačiau žinomi junginiai negalėjo pilnai patenkinti praktiniame vartojime kylančių reikalavimų. Šio išradimo 1 formulės junginiai iš esmės skiriasi nuo žinomų bent vienos cikloalkilo liekanos ar kitų pakaitų įvedimu į anilino-pirimidino struktūrą, dėl ko pasiekiamas netikėtai didelis fungicidinis bei insekticidinis aktyvumas.

1 formulės junginiai kambario temperatūroje yra stabilūs aliejai, dervos arba kietos medžiagos, kurios skiriasi vertingomis mikrobicidinėmis savybėmis.

Pagal išradimą druskos, iš dalies, yra adityvios neorganinių arba organinių rūgščių druskos, pavyzdžiui, halogenvandenilio rūgštys, būtent, chlor-, brom- arba jodvandenilio rūgštys, sieros rūgštis, fosforo rūgštis, azoto rūgštis arba organinės rūgštys, pavyzdžiui, acto rūgštis, trifluoracto rūgštis, trichloracto rūgštis, propano rūgštis, glikolio rūgštis, tiociano rūgštis, pieno rūgštis, gintaro rūgštis, citrinos rūgštis, benzoinė rūgštis, cinamono rūgštis, rūgštynių rūgštis, benzosulfo rūgštis, p-toluensulforūgštis, metansulforūgštis, salicilo rūgštis, p-aminosalicilo rūgštis, 2-fenoksibenzoinė rūgštis arba 1,2-naftalendisulforūgštis.

Svarbią grupę sudaro 1 formulės junginiai, kuriuose R_1 ir R_2 yra vandenilis.

5 Ypatingą grupę sudaro 1 formulės junginiai, kur R_1 ir R_2 , nepriklausomai vienas nuo kito, yra vandenilis, halogenas, C_1-C_3 - alkilas, C_1-C_2 - halogenalkilas, C_1-C_3 alkoksi arba C_1-C_3 - halogenalkoksi; R_3 - vandenilis, C_1-C_4 - alkilas arba pakeistas halogenu arba ciano grupe C_1-C_4 alkilas; ir $R_4-C_3-C_6$ cikloalkilas arba pakeistas metilu arba halogenų C_3-C_6 - cikloalkilas.

Kitos biologiškai aktyvių medžiagų priimtinesnės dėl aiškiai išreikšto mikrobicidinio, iš dalies, fungicidinio aktyvumo, grupės:

15

Grupė 1a: Formulės 1 junginiai, kuriuose R_1 ir R_2 , nepriklausomai vienas nuo kito, yra vandenilis, fluoras, chloras, bromas, metilas, etilas, halogenmetilas, metoksi, etoksi arba halogenmetoksi;

20

R_3 - vandenilis, metilas, pakeistas fluoru, chloru, bromu arba ciano grupe metilas; etilas, arba pakeistas fluoru, chloru, bromu arba ciano grupe etilas; n-propilas arba fluorbutilas;

25

R_4 - C_3-C_6 cikloalkilas arba pakeistas metilu, fluoru, chloru arba bromu C_3-C_6 cikloalkilas.

30 Tarp anksčiau išvardintų junginių ypatingai vertingi junginiai, kuriuose $R_1=R_2$ =vandenilis/grupė 1aa/.

Grupė 1b: Formulės 1 junginiai, kuriuose R_1 ir R_2 , nepriklausomai vienas nuo kito, yra vandenilis, chloras, metilas, etilas, trifluormetilas, metoksi, etoksi arba difluormetoksi. R_3 - vandenilis, metilas, pakeistas fluoru, chloru arba ciano - grupe metilas; etilas arba n - propilas;

35

R_4 - C_3-C_5 - cikloalkilas arba pakeistas metilu arba chloru C_3-C_5 - cikloalkilas.

5 Tarp aukščiau išvardintų junginių ypatingai vertingi junginiai, kuriuose $R_1 = R_2 =$ vandenilis/grupė 1 bb/.

10 Grupė 1 c: Formulės 1 junginiai, kuriuose R_1 ir R_2 , nepriklausomai vienas nuo kito, yra vandenilis, R_3 - vandenilis, metilas, etilas arba trifluormetilas; R_4 - ciklopropilas arba pakeistas metilu arba chloru ciklopropilas;

15 Tarp aukščiau išvardintų junginių ypatingai vertingi junginiai, kuriuose $R_1 = R_2 =$ vandenilis/grupė 1cc/.

Grupė 1d: Formulės 1 junginiai, kuriuose R_1 - vandenilis; R_2 ir R_3 , nepriklausomai vienas nuo kito, yra vandenilis arba metilas;

20 R_4 - ciklopropilas arba pakeistas metilu ciklopropilas.

25 Grupė 2a: Formulės 1 junginiai, kuriuose R_1 ir R_2 , nepriklausomai vienas nuo kito, yra vandenilis, halogenas, C_1-C_2 - alkilas, halogenmetilas, C_1-C_2 - alkoksi arba C_1-C_2 - halogenolalkoksi;

30 R_3 - vandenilis, $C_1 - C_4$ - alkilas, pakeistas halogenu arba hidroksigrupe C_1-C_2 - alkilas; ciklopropilas arba pakeistos metilu ir/arba halogenu iki trijų kartų vienodai arba skirtingai ciklopropilas;

R_4 - C_3-C_6 - cikloalkilas, arba vienodai arba skirtingai iki 3 kartų pakeistas metilu ir/arba halogenu C_3-C_4 - cikloalkilas.

35 Tarp aukščiau išvardintų junginių ypatingai svarbūs junginiai, kuriuose $R_1=R_2 =$ vandenilis (grupė 2aa).

Grupė 2b: Formulės 1 junginiai, kuriuose R_1 ir R_2 , nepriklausomai vienas nuo kito, yra vandenilis, fluoras, chloras, bromas, metilas, trifluormetilas, metoksi arba difluormetoksi;

5

R_3 - vandenilis, C_1-C_3 - alkilas, pakeistas halogenu arba hidroksilo grupe, C_1-C_2 - alkilas, ciklopropilas arba pakeistas iki trijų kartų vienodai arba skirtingai metilu ir/arba halogenu ciklopropilas;

10

R_4 - C_3-C_6 - cikloalkilas arba pakeistas iki trijų kartų vienodai arba skirtingai metilu ir/arba halogenu C_3-C_4 - cikloalkilas.

15

Tarp aukščiau išvardintų junginių ypatingai vertingi junginiai, kuriuose $R_1 = R_2 =$ vandenilis (grupė 2bb).

Grupė 2c: Formulės 1 junginiai, kuriuose R_1 ir R_2 , nepriklausomai vienas nuo kito, yra vandenilis, fluoras, chloras, metilas, trifluormetilas, metoksi arba difluormetoksi;

20

R_3 - vandenilis, C_1-C_3 - alkilas, pakeistas halogenu arba hidroksilo grupe C_1-C_2 alkilas; ciklopropilas arba pakeistas iki trijų kartų vienodai arba skirtingai metilu ir/arba halogenu ciklopropilas,

25

$R_4-C_3-C_6$ - cikloalkilas arba pakeistas iki trijų kartų vienodai arba skirtingai metilu ir/arba halogenu C_3-C_4 - cikloalkilas.

30

Tarp aukščiau paminėtų junginių pirmenybė teikiama junginiams, kuriuose $R_1=R_2 =$ vandenilis (grupė 2 cc).

35

Grupė 2d: Formulės 1 junginiai, kuriuose R_1 ir R_2 - vandenilis; $R_3-C_1-C_3$ - alkilas, pakeistas fluoru, chloru, bromu arba hidroksilo grupe metilas; ciklopropilas,

pakeistas metilu, fluoru, chloru arba bromu ciklopropilas;

5 R_4 - C_3-C_4 - cikloalkilas arba pakeistas metilu ir/arba fluoru chloru, bromu iki trijų kartų vienodai arba skirtingai C_3-C_4 cikloalkilas.

Kaip ypatingai vertingų junginių pavyzdžius reikėtų nurodyti:

10

2 - fenilamino - 4-metil-6-ciklopropilpirimidiną (jung. 1.1);

2 - fenilamino - 4-etil-6-ciklopropilpirimidiną (jung. 1.6);

15

2 - fenilamino - 4-metil-6-(2-metilciklopropil)pirimidiną (jung. 1.1);

2 - fenilamino - 4,6-bisciklopropilpirimidiną (jung. 1.236);

20

2 - fenilamino - 4-hidroksimetil-6-ciklopropilpirimidiną (jung. 1.48);

2 - fenilamino - 4-fluormetil-6-ciklopropilpirimidiną (jung. 1.59);

25

2 - fenilamino - 4-hidroksimetil-6-(2-metilciklopropil)pirimidiną (jung. 1.13);

30

2 - fenilamino - 4-metil-6-(2-fluorciklopropil)pirimidiną (jung. 1.66);

2 - fenilamino - 4-metil-6-(2-chlorciklopropil)pirimidiną (jung. 1.69);

35

2 - fenilamino - 4-metil-6-(2-difluorciklopropil)pirimidiną (jung. 1.84);

2 - fenilamino - 4-fluormetil-6-(2-fluorciklopropil)pi-
rimidina (jung. 1.87);

2 - fenilamino - 4-fluormetil-6-(2-chlorciklopropil)pi-
rimidina (jung. 1.94);

2 - fenilamino - 4-fluormetil-6-(2-metilciklopropil)pi-
rimidina (jung. 1.108);

2 - fenilamino - 4-etil-6-(2-metilciklopropil)pirimi-
dina (jung. 1.131);

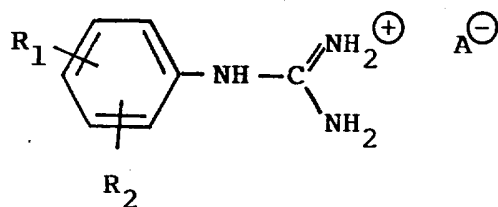
2 - (p-fluorfenilamino)-4-metil-6-ciklopropilpirimidina
(jung. 1.33).

15

Formulės 1 junginiai gaunami

1. fenilguanidino druska (formulė 11a)

20

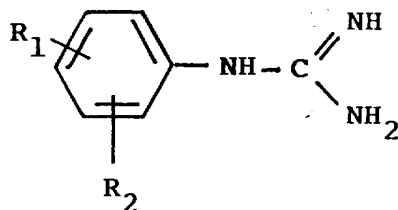


11a

25

arba guanidinas (formulė 11b)

30



11b

35

reaguoja su diketonu (formulė 111)



5

be tirpiklio arba aprotoniniame, geriau protoniniame tirpiklyje nuo 60°C iki 160°C temperatūroje, geriausiai 60-110°C, arba

10

2. Daugiastadijiniu būdu:

2.1. karbamidas (formulė IV)

15



20

reaguoja su diketonu (formulė III),

25



esant rūgščiai inertiniame tirpiklyje nuo 20 iki 40°C/geriausiai 20-40°C temperatūroje ir ciklinama, kol gaunamas pirimidino junginys (formulė V)

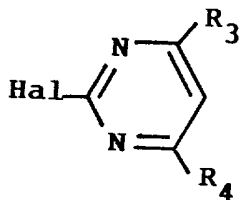
30



35

ir 2.2 gautame (V) junginyje OH - grupę toliau pakeičia halogenu POHal perteklių, esant arba nesant tirpikliui nuo 50° iki 110°C temperatūroje, geriausiai POHal virimo temperatūroje

5



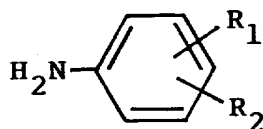
VI

10

be to, Hal aukščiau nurodytoje formulėje yra halogenas, geriausiai chloras arba bromas ir

2.3. gautas junginys (formulė VI) toliau reaguoja su anilino junginiu (formulė VII)

20



VII

priklausomai nuo būdo varianto arba

a) esant protonų akceptoriumi, pavyzdžiui, anilino junginio (formulė VII) pertekliui arba esant neorganiniam šarmiui su arba be tirpiklio, arba

30

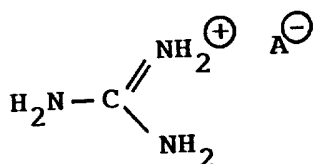
b) esant rūgščiai inertiniame tirpiklyje nuo 60° iki 120°C temperatūroje, geriausiai 80-100°C, arba

3. dvistadijiniu būdu:

35

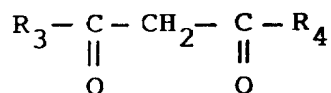
3.1. guanidino druska (formulė VIII)

5



VIII

10 ciklina su diketonu (formulė III)



III

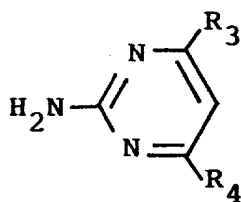
15

a) be tirpiklio nuo 100° iki 160°C temperatūroje, geriausiai 120-150°C, arba

20

b) inertiniame tirpiklyje nuo 30° iki 140°C temperatūroje, geriausiai 60-120°C, kol gaunamas pirimidino junginys (formulė IX)

25

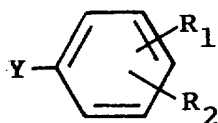


IX

30

3.2. gautą junginį (formulė IX) veikia junginiu (formulė X)

35

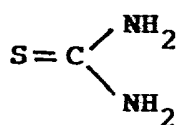


X,

atskeliant HY, esant protonų akceptoriumi aprotoniniame tirpiklyje nuo 30° iki 140°C temperatūroje, geriausiai 60-120°C, be to formulėse II pakaita R₁-R₄ turi formulėje 1 nurodytas reikšmes, A[⊖] yra rūgšties anijonas ir Y - halogenas, arba

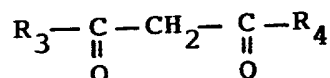
4. Daugiastadijiniu būdu:

4.1. a) tiokarbamidas (formulė XI)



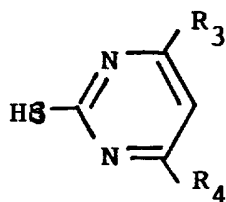
XI

reaguoja su diketonu (formulė III)



III

esant rūgščiai inertiniame tirpiklyje nuo 20°C iki 140°C temperatūroje, geriausiai 20-60°C, ir ciklinama, kol gaunamas pirimidino junginys (formulė XII)



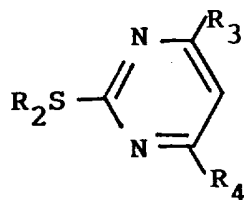
XII

ir jo šarminio arba žemės šarminio metalo druską veikia junginiu (formulė XIII)

(ZR₅)

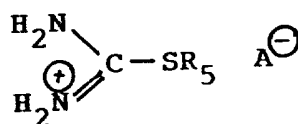
XIII,

kurioje R_5 yra C_1-C_8 - alkilas arba nepakeistas arba pakeistas halogenu ir/arba C_1-C_4 - alkilu benzilas ir Z - halogenas, kol gauna pirimidino junginį (formulė XIV)



XIV

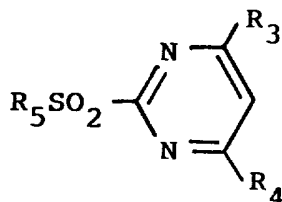
arba b) izotiuronio druska (formulė XV)



XV

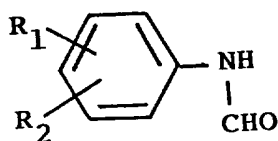
reaguoja su diketonu (formulė III), geriausiai protoniniame tirpiklyje, nuo 20°C iki 140°C temperatūroje, geriausiai 20-80°C taip pat, kol gaunamas pirimidino junginys (formulė XIV) ir

4.2. gautą junginį (formulė XIV) oksiduoja oksiduojančia priemone, pavyzdžiui perrūgštimi, kol gauna pirimidino junginį (formulė XVI)



XVI

ir 4.3. gautą junginį (formulė XVI) veikia formil-anilinu (formulė XVII)

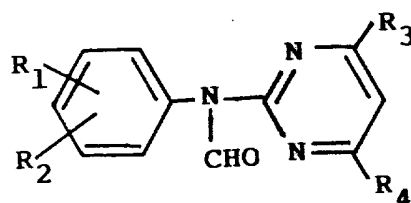


XVII

5

inertiniame tirpiklyje, esant šarmui protonų akceptoriui, nuo - 30°C iki 120°C temperatūroje, kol gaunamas junginys (formulė XVIII)

10



XVIII

15

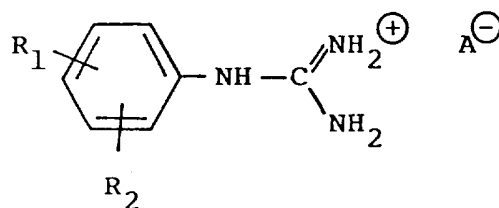
ir 4.4 gautą junginį (formulė XVIII) hidrolizuoja, esant šarmui, pavyzdžiui, šarminio metalo hidroksidui, arba rūgščiai, pavyzdžiui, halogenvandenilinei arba sieros rūgščiai, vandenyje arba vandens ir tirpiklio mišinyje, kaip antai vandeniniuose alkoholiuose arba dimetilformamide, nuo 10°C iki 110°C temperatūroje, geriausiai 30 - 60°C, be to, formulėse XI - XVIII pakaitai $R_1 - R_4$ turi formulėje I nurodytos reikšmės, o $A^\ominus$ yra rūgšties anijonas ir Y - halogenas.

25

Formulei I junginiai, kuriuose R_3 yra CH_2OH grupė, gauna specialiu būdu.

30

A. 1.1 guanidino druską (formulė IIa)

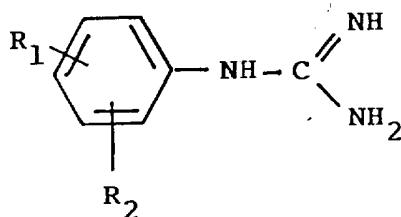


IIa

35

arba guanidiną (formulė IIb)

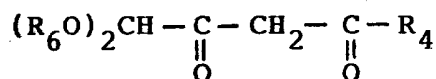
5



IIb

veikia ketonu (formulė XIX)

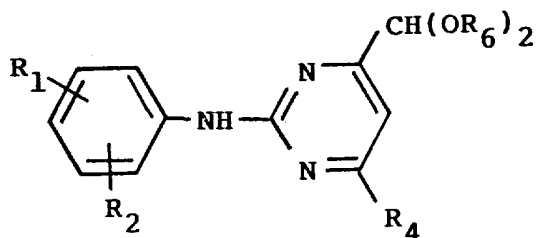
10



XIX,

15 kur R_6 yra C_1-C_4 - alkilas, protoniniame tirpiklyje arba be tirpiklio nuo $40^\circ C$ iki $160^\circ C$ temperatūroje, geriausiai $60-110^\circ C$, kol gaunamas pirimidino junginys (formulė XX)

20

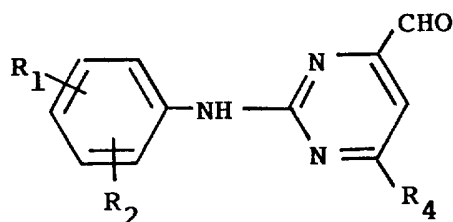


XX

25

ir A 1.2 gautas acetalį (formulė XX) esant rūgščiai, pavyzdžiui halogenvandenilinei arba sieros rūgščiai, vandenyje arba vandens ir tirpiklio mišinyje, nuo $20^\circ C$ iki $100^\circ C$ temperatūroje, geriausiai $30-60^\circ C$, hidrolizuoja iki pirimidinaldehido (formulė XXI)

30



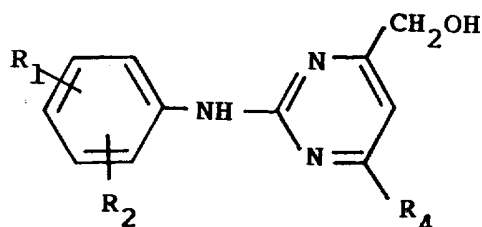
XXI

35

ir A 1.3 gautą junginį (formulė XXI) hidrina atominiu vandeniliu, naudojant katalizatorių arga rėdukuoja reduktoriumi kaip antai natrio borhidridu iki atitin- kamo alkoholio (formulė XXII)

5

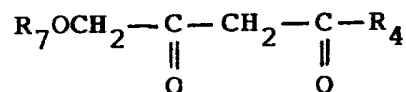
10



XXII

arba A 2.1 guanidino druską (formulė IIa) arba gua- nidiną (formulė IIb) veikia diketonu (formulė XXIII)

15

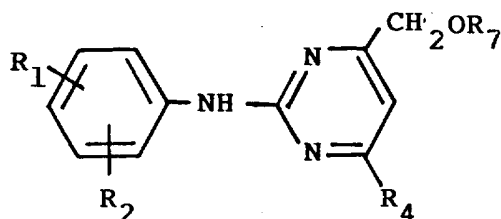


XXIII,

20

kur R₇ yra nepakeistas arba pakeistas halogenu arba C₁-C₄ - alkilu benzilas, protoniniame tirpiklyje arba be tir- piklio nuo 40°C iki 160°C, geriausiai 60-110°C tem- peratūroje iki pirimidino junginio (formulė XXIV)

25



XXIV

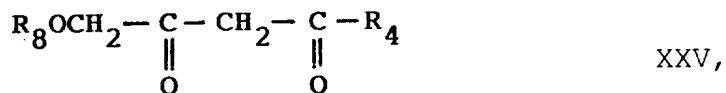
30

ir jame A 2.2 hidrina tirpiklyje, geriausiai aproto- niniam tirpiklyje, pavyzdžiui dioksane arba tetra- hidrofurane, su katalizatoriumi kaip antai aktyvuota anglimi ant paladžio arba geriausiai Renėjaus nikeliu

35

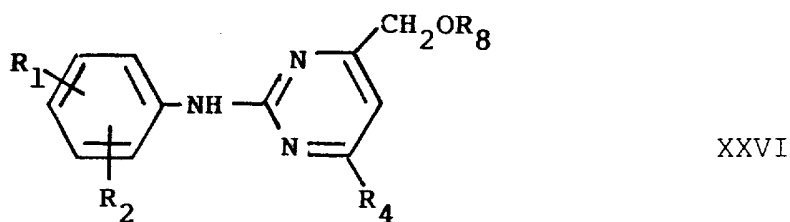
nuo 20°C iki 90°C temperatūroje, geriausiai 50-90°C, CH₂OR₇ liekaną paverčia į CH₂OH liekaną: arba A 3.1 guanidino druską (formulė IIa) arba guanidiną (formulė IIb) veikia diketonu (formulė XXV)

5



10 kur R₈ yra C₁-C₆ - alkilas, C₃-C₆ - alkenilas arba nepakeistas arba pakeistas halogenu arba C₁-C₄ alkilu benzilas, protoniniame tirpiklyje arba be tirpiklio nuo 40°C iki 160°C temperatūroje geriausiai 60-110°C, kol gauna pirimidino junginį (formulė XXVI)

15



20

ir A 3.2 gautam junginiui

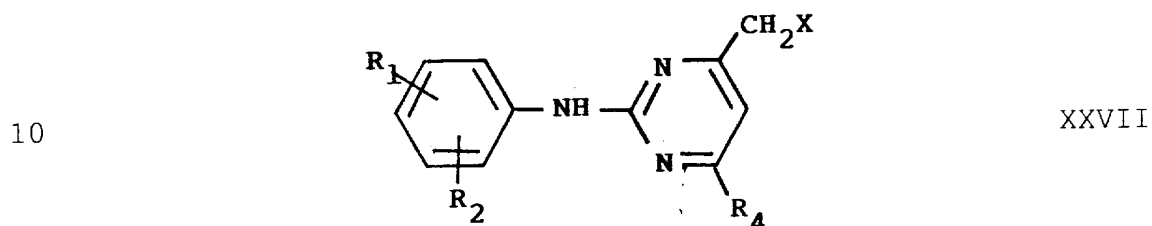
25 (formulė XXVI) atlieka eterio skaldymą su halogenvandenilio rūgštimi, geriausiai bromvandenilio rūgštimi, arba Liuiso rūgštimi kaip antai aliuminio helogenidu (pavyzdžiui AlCl₃) arba borhalogenidu (pavyzdžiui BBr₃ arba BCl₃) aprotoniniame tirpiklyje, pavyzdžiui, angliavandeniliuose, arba halogenintuose angliavandeniliuose, nuo -80°C iki -30°C temperatūroje, geriausiai -70°-20°C.

30

35 Formulės I junginiai, kuriuose R₃ yra CH₂-Hal grupė, gaunami, veikiant formulės XXII junginį, fosforhalogenidu arba tionilhalogenidu, esant tretinei bazei, pavyzdžiui piridinui arba trietilaminui, inertiniame tir-

piklyje nuo 0 iki 110°C temperatūroje, geriausiai 0-80°C.

Formulės I junginiai, kuriuose R_3 yra CH_2F - grupė,
5 gaunami, reaguojant formulės XXVII junginiai



15 kur X - chloras arba bromas, su kalio fluoridu, geriausiai liofilintu kalio chloridu, esant katalitiniam cerio fluorida arba kraun-eterio kiekiui, pavyzdžiui 13 - kraun - 6 - eteriui, aprotoniniame tirpiklyje, kaip
20 antai acetonitrile nuo 50° iki 160°C teperatūroje auto-klave, padidintame slėgyje.

Kitas formulės I junginių gavimo būdas, kur R_3 yra CH_2F - grupė, fluorinant formulės XXII junginį su N,N - di-
25 etilaminotiotrifluoridu (DEATT) aprotoniniame tirpik-lyje tokiame, kaip dichlormetanas, chloroformas, tet-rahidrofuranas arba dioksanas, nuo 0°C iki 100°C tempe-
ratūroje, geriausiai 10°-50°C.

Aukščiau nurodytose formulėse XVIII-XXVII pakaitai R_1
30 ir R_2 , o taip pat R_4 turi formulėje 1 nurodytas reikšmes.

Aprašytuose būduose formulių IIa ir VIII junginiuose rūgšties anijonu $A^\ominus$ galėtų būti tokios druskų lie-
35 kanos: karbonatas, hidroksikarbonatas, nitratas, halo-genidas, sulfatas arba hidrosulfatas.

Anksčiau aprašytuose būduose formulės XV junginiuose rūgšties anijonu $A^{\ominus}$ galėtų būti, pavyzdžiui, tokios druskų liekanos: halogenidas, sulfatas arba hidrosulfatas.

5

Halogenidai yra fluoridas, chloridas, bromidas arba jodidas, geriausiai bromidas arba chloridas.

10 Geriausiai tinkamos neorganinės rūgštys, yra kaip antai halogenvandenilio rūgštys, pavyzdžiui, fluorvandenilio, chlorvandenilio arba bromvandenilio rūgštis, o taip pat sieros, fosforo arba azoto rūgštis; vienok galima taip pat naudoti tinkamas organines rūgštis, būtent, acto, toluensulforūgštį ir kt. Protonų akceptoriai yra, pa-
15 vyzdžiui neorganinės arba organinės bazės, kaip antai šarminių arba žemės šarminių metalų junginiai, kaip antai hidroksidai, ličio, natrio, kalio, magnio, kalcio, stroncio, bario oksidai arba karbonatai, arba taip pat hidridai, kaip antai natrio hidridas. Organinių
20 bazių pavyzdžiais galima nurodyti tretinius aminus, kaip antai trietilaminą, trietilendiaminą ir piridiną.

Anksčiau aprašytuose būduose, atsižvelgiant į tam tikras reakcijos sąlygas, galima naudoti šiuos tirpiklius
25 kartu su dalinai paminėtais: halogeninti angliavandeniliai, iš dalies chlorą turintys angliavandeniliai, kaip antai tetrachloretilenas, tetrachlorešanas, dichlorpropanas, metilenchloridas, dichlorbutanas, chloroformas, chlornaftalenas, anglies tetrachloridas, tri-
30 chlorešanas, trichloretilenas, pentachlorešanas, difluorbenzenas, 1,2-dichlorešanas, 1,1-dichlorešanas, 1,2-cis-dichlorešanas, chlorbenzenas, fluorbenzenas, brombenzenas, dichlorbenzenas, dibrombenzenas, chlor-
toluenas, trichlortoluenas: eteriai, kaip antai etil-
35 propiloeteris, metiltretbutilo eteris, n-butilo eteris, di-n-butilo eteris, di-izobutilo eteris, diizoamilo eteris, di-izopropilo eteris, anizolas, cikloheksilme-

tilo eteris, dietilo eteris, etilenglikoldimetilo eteris, tetrahidrofuranas, dioksanas, tioanizolas, dichlordietilo eteris; angliavandenilių nitrodariniai, pavyzdžiui, nitrometanas, nitroetanas, nitrobenzenas, chlornitrobenzenas, o-nitrotoluenas; nitrilai, pavyzdžiui, acetonitrilas, butironitrilas, izobutironitrilas, benzonitrilas, m-chlorbenzonitrilas; alifatiniai arba cikloalifatiniai angliavandeniliai: heptanas, heksanas, oktanas, nonanas, cimolas, benzino frakcijos su vir. temp. nuo 70°C iki 190°C, cikloheksanas, metilcikloheksanas, dekalinas, petrolio eteris, ligroinas, trimetilpentanas, 2,3,3-trimetilpentanas; esteriai: atilacetatas, acetoacto rūgšties esteris, izobutilacetatas; amidai, kaip antai formamidas, metilformamidas; ketonai, kaip antai acetonas, metiletilketonas; alkoholiai, kaip antai iš dalies žemesnieji alifatiniai alkoholiai, metanolis, etanolis, n-propanolis, izopropanolis, o taip pat butanolio izomerai; tam tikru atveju taip pat ir vanduo. Reikia turėti galvoje ir šių tirpiklių ir skiediklių mišinius.

Nelauktai buvo nustatyta, kad formulės 1 junginiai turi labai palankų praktiniam vartojimui biocidinį spektrą, kovojant su vabzdžiais ir fitopatogeniniais mikroorganizmais, iš dalies grybeliais. Jie turi labai naudingas kuratyvines prevencines ir, dalinai sisteminės savybės ir gali būti panaudoti daugelio kultūrinių augalų apsaugai. Dėka biologiškai aktyvių (formulės 1) medžiagų įvairių naudingų kultūrų augaluose arba jų atskirose dalyse (vaisiai, gėlės, stiebas, gumbai, šaknys) galima apriboti arba panaikinti atsirandančius pažeidimus, be to, netgi vėliau išaugusios augalų dalys lieka apsaugotos, pavyzdžiui, nuo fitopatogeninių mikroorganizmų.

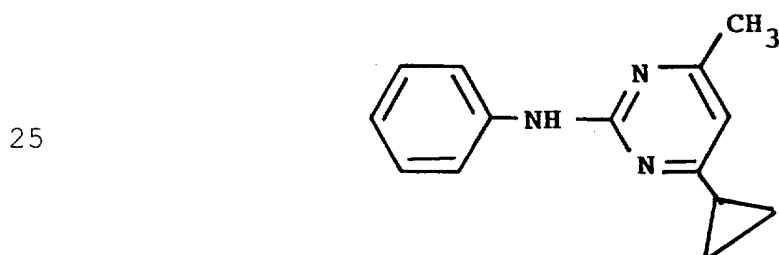
Formulės 1 junginiai yra biologiškai aktyvūs prieš šių klasių fitopatogeninius grybelius: Fungi imperfecti

(Botrytis, Pyricularia, Helminthosporium, Fussarium,
Septoria, Cesconspora, Alternaria) Basidiomyceten
(Chizoctania, Hemilcia, Puccinia). Be to, jie veikia
prieš askomicetų klasės (pavyzdžiui, Ascomyceten
5 (Venturia, Erysiphe, Podospaera, Monilinia, Uncinula)
ir omicetų klasės atstovus (pavyzdžiui, Phytophthora,
Pytium, Plasmopara). Be to, formulės 1 junginiai gali
būti panaudoti kaip beicavimo priemonės sėklų (vaisių,
gumbų, grūdų) apdorojimui ir augalų kotų apsaugai nuo
10 grybelinių infekcijų, o taip pat prieš žemėje esančius
fitopatogeninius grybelius.

Formulės 1 junginiai yra efektyvūs prieš kenksmingus
vabzdžius pavyzdžiui prieš javų kenkėjus, iš dalies
15 ryžių kenkėjus. Žemiau pateikti pavyzdžiai paaiškina
išradimą, jo neapribodami.

1. GAVIMO PAVYZDŽIAI

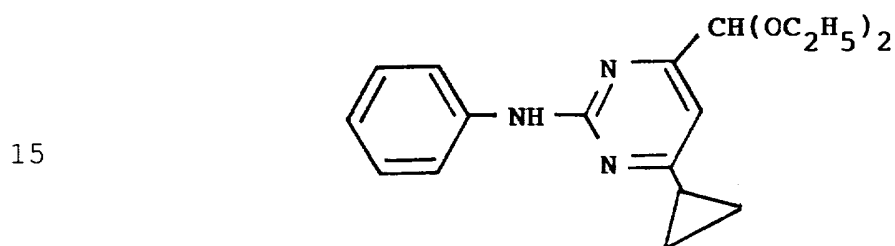
20 PAVYZDYS 1.1. 2-fenilamino - 4-metil-6-ciklopropirimi-
dino gavimas



30 10 g (51 mmol) fenilguanidino hidrokarbonato ir 9,7 g
(77 mmol) 1-ciklopropil-1,3-butandiono šildoma maišant
6 valandas iki 110°C, vykstant reakcijai didėja iš-
siskiriančio anglies dioksido kiekis. Atšaldžius iki
kambario temperatūros, tamsiai ruda emulsija sumaišoma
35 su 50 ml dietilo eterio, du kartus praplaunama vandeniu
po 20 ml, išdžiovinama natrio sulfatu, filtruojama ir
tirpiklis išgarinamas. Likęs tamsiai rudas aliejus

(10,1 g) išgryninamas kolonėlių chromatografija per silikagelį (dietilo eteris: toluenas 5:3). Išgarinus eliuojantį skystį, rudas aliejus kristalinamas ir perkristalinamas iš dietilo eterio (petrolio eterio, vir. t. 30-50°C temp.). Gaunami rudi kristalai. Lydimosi temperatūra 67-69°C. Išeiga 8,55 g (38 mmol) (74,5% nuo teorinės).

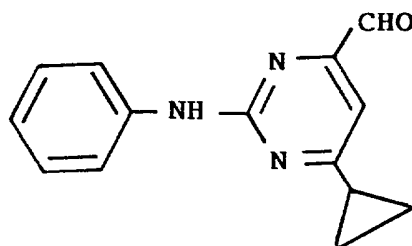
PAVYZDYS 1.2. 2-anilino - 4-formildietilacetat-6-ciklopropilpirimidino gavimas



11,7 g (59,2 mmol) fenilguanidino hidrokarbonato ir 13,3 g (62,2 mmol) 1-ciklopropil-3-formildietilacetal-1,3-propandiono 40 ml etanolio šildoma maišant iki flegmos virimo temperatūros, anglies dioksido išsiskyrimas didėja, vykstant reakcijai. Atšaldžius iki kambario temperatūros, tamsiai ruda emulsija sumaišoma su 80 ml dietilo eterio, du kartus praplaunama vandeniu po 30 ml, džiovinama natrio sulfatu, filtruojama ir tirpiklis išgarinamas. Likęs tamsiai rudas aliejus (17 g) išgryninamas kolonėlių chromatografija per silikagelį (toluenas:etilacetatas 5:2). Išgarinus eliuojantį mišinį, lieka rausvai rudas aliejus, lūžio rodiklis $H_D^{20}: 1,5815$

Išeiga 15 g (48 mmol, 81,5% nuo teorinės).

PAVYZDYS 1.3. 2-anilino-4-formil-6-ciklopropilpirimidino gavimas (jung. 2.1.)



5

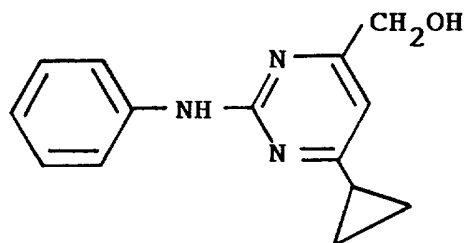
12,3 g (39,3 mmol) 2-anilino -4-formildietilacetal -6-ciklopropilpirimidino, 4 g (39,3 mmol) koncentruotos druskos rūgštis ir 75 ml vandens šildoma intensyviai maišant 14 valandų 50°C temperatūroje ir pridėjus 2 g (19,6 mmol) koncentruotos druskos rūgštis, maišoma dar 24 valandas toje pačioje temperatūroje. Atšaldžius iki kambario temperatūros, į šviesiai rudos spalvos suspensiją pridedama 50 ml etilacetato ir neutralizuojama, pridedant 7 ml 30% natrio šarmo. Po to etilacetato tirpalas atskiriamas, išdžiovinamas natrio sulfatu, nufiltruojama ir tirpiklis išgarinamas. Išvalymui, rudos spalvos kieta medžiaga perkristalinama iš 20 ml izopropanolio, pridedant aktyvuotos anglies. Gelsvos spalvos kristalai lydosi 112-114°C.

15

20

Išeiga 7,9 g (33 mmol 84 % nuo teorinės).

25 PAVYZDYS 1.4. 2-anilin-4-hidroksimetil-6-ciklopropilpirimidino gavimas (jung. 1.48)



30

a) Į 14,1 g (59 mmol) 2-anilino -4-formil-6-ciklopropilpirimidino 350 ml absoliutaus metanolio per 15 minučių, maišant kambario temperatūroje, dalimis pridedama 2,3 g (60 mmol) natrio borhidrido, be to, reak-

35

cijos mišinys, skiriantis vandeniliui, šildomas iki 28°C, po 4 valandų reakcijos mišinys parūgštinamas, lašinant 10 ml koncentruotos druskos rūgšties; lašais pridedama 120 ml 10%-nio natrio hidrokarbonato tirpalo ir tuoj po to praskiedžiama 250 ml vandens. Iškritusios nuosėdos nufiltruojamos, išdžiovinamos, pilnai ištirpinamos 600 ml dietilo eterio šildant, apdorojama aktyvuota anglimi ir filtruojama. Skaidrus filtratas išgarinamas, kol susidrumsčia, praskiedžiama petrolio eteriu ir nufiltruojamos šviesiai geltonos kristalinės dulkės: vir. t. 123-125°C. Išeiga 10,8 g (44,8 mmol, 75,9% nuo teorinės).

b) 5,9 (23 mmol) 2-anilino -4-metoksimetil-6 ciklo-propilpirimidino, gauto iš fenilguanidino ir 1-ciklo-propil-4-metoksi-1,3-butandiono, ištirpinama 200 ml dichlormetano ir atšaldoma iki -68°C. Į lengvai nudažytą tirpalą, intensyviai maišant, lėtai per 30 minučių lašais pridedama 6,8 g (27 mmol) bortribromido, tuoj po to pašalinama šaldanti vonia ir maišoma dar dvi valandas kambario temperatūroje. Pridėjus 150 g vandens su ledu, iškritęs drėgnas produktas nufiltruojamas ir perkristalinamas iš metanolio, naudojant aktyvuotą anglį. Šviesiai geltoni kristalai lydosi 124-126°C. Išeiga 4,7 g (19,5 mmol), 84,7 % nuo teorinės).

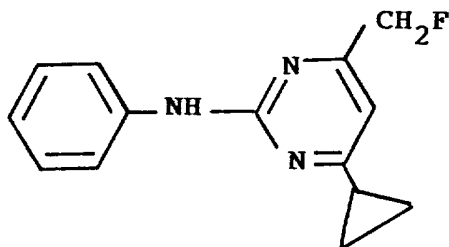
Į 12 g (50 mmol) 2-fenilamino-4-hidroksimetil-6-ciklo-propilpiramidino ir 0,4 g (50 mmol) piridino 350 ml dietilo eterio, lašinant ir per 30 minučių maišant, pridedama 15,6 (75 mmol) tionilbromido 50 ml dietilo eterio. Po 2 valandų maišymo kambario temperatūroje, pridedama dar 0,4 g (50 mmol) piridino ir šildoma 5 valandas iki flegmos virimo temperatūros. Atšaldžius iki kambario temperatūros, pridedama 200 ml vandens, pridedant 140 ml sotaus natrio hidrokarbonato tirpalo, nustatoma tirpalo pH reikšmė 7. Atskyrus dietilo eterio fazę, praplaunama vandeniu po 100 ml du kartus, iš-

džiovinama natrio sulfatu, nufiltruojama ir tirpiklis išgarinamas. Likęs rudas aliejus išvalomas kolonėlių chromatografija per silikagelį (toluenas:chloroformas:di-
 etilo eteris:petrolio eteris (vir. t. 50-70°C):
 5 (5:3:1:1). Išgarinus eliuojantį mišinį, geltonas aliejus praskiedžiamas dietilo eterio, petrolio eterio (vir. t. 50-70°C) mišiniu ir pastatoma šaltai kris-
 talizuoti. Geltonos kristalinės dulkės lydosi prie 77,5-79,5°C. Išeiga 9,7 g -32 mmol (64 % nuo teorinės).

10

PAVYZDYS 1.6. 2-fenilamino-4-fluormetil-6-ciklopropil-
 pirimidino gavimas (Jung. 1.59)

15



20 a) 3,9 g (12,8 mmol) 2-fenilamino-4-brometil-6 cik-
 lopropilpirimidino, 1,5 g (12,8 mmol), išdžiovinto sub-
 limavimu kalio fluorida ir 0,3 g (1,13 mmol) 18-kraun-6
 eterio šildoma 50 ml acetonitrilo 40 valandų iki fleg-
 mos virimo temperatūros. Po to papildomai pridedama
 25 0,75 g (13 mmol) kalio fluorida ir šildoma 22 valandas.
 Pilnam reakcijos įvykimui dar kartą pridedama 0,75 g
 (13 mmol) išdžiovinto sublimatavimu kalio fluorida ir
 0,1 g (0,38 mmol) 18-kraun-6-eterio ir papildomai šil-
 doma 24 valandas iki flegmos virimo temperatūros. At-
 30 šaldžius iki kambario temperatūros, suspensija sumai-
 šoma su 150 ml dietilo eterio, tris kartus praplaunama
 vandeniu po 20 ml, išdžiovinama natrio sulfatu, nu-
 filtruojama ir tirpiklis išgarinamas. Likęs rudas
 aliejus išvalomas kolonėlių chromatografija per sili-
 35 kagelį (toluenas:chloroformas:diethyl eteris:petrolio
 eteris (vir. t. 50-70°C):(5:3:1:1). Išgarinus eliuo-
 jantį mišinį, geltonas aliejus sudedamas į 10 ml pet-

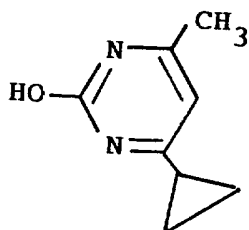
rolio eterio (vir. t. 50-70°C) ir pastatomas šaltai kristalizuotis. Geltoni kristalai lydosi 48-52°C. Išeiga 2,1 g (8,6 mmol), 67,5% nuo teorinės).

- 5 b) Į 9,1 g (37,8 mmol) 2-fenilamino -4-hidroksimetil-6-ciklopropilpirimidino suspensijos 80 ml dichlormetano per valandą lašais lėtai pridedama 6,1 g (37,8 mmol) dietilaminotiotrifluorido 15 mmol dichlormetano. Pridėjus 15 ml ledinio vandens, lašinant pridedama 50 ml 10%-nio vandeninio natrio hidrokarbonato tirpalo. Pasibaigus anglies dioksido skyrimuisi, organinė fazė atskiriama ir vandeninė fazė du kartus ekstrahuojama dichlormetanu po 20ml. Sujungti dichlormetano tirpalai praplaunami vandeniu (15 ml), išdžiovinama virš natrio sulfato, nufiltruojama, o tirpiklis išgarinamas. Likęs juodas aliejus išvalomas kolonėlių chromatografija per silikagelį (toluenas:chloroformas:petrolio eteris, vir. t. 50-70°C:(5:3:1:1). Išgarinus eliuojantį mišinį, geltonas aliejus praskiedžiamas 20 ml petrolio eterio (vir. t. 50-70°C) ir patalpinama šaltai kristalizuotis. Geltoni kristalai lydosi 50-52°C.

Išeiga 4,9 g (20,1 mmol, 53 % nuo teorinės).

- 25 PAVYZDYS 1.7 2-hidroksi-4-metil-6-ciklopropilpirimidino gavimas

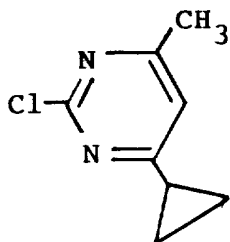
30



- 35 6 g (100 mmol) karbamido ir 12,6 g (100 mmol) 1-ciklopropil-1,3-butandiono kambario temperatūroje sumaišoma 35-se ml etanolio su 15 ml koncentruotos druskos rūgšties. Po 10 dienų išlaikymo kambario tempe-

ratūroje, išgarinamas rotoriaus garintuve, esant maksimaliai vonios temperatūrai 45°C. Liekana ištirpinama 20 ml etanolio, be to labai greitai atšaldomas reakcijos produkto hidrochloridas. Maišant, pridedama 20 ml dietilo eterio, iškritę balti kristalai nufiltruojami ir praplaunami etanolio ir dietilo eterio mišiniu ir išdžiovinami. Išgarinus filtratą ir liekaną perkristalinus iš etanolio ir dietilo eterio /1:2/ mišinio, gaunamas papildomas hidrochlorido kiekis. Balti kristalai lydosi virš 230°C temperatūros. Hidrochlorido išeiga 12,6 g (67,5 mmol, 67,5 % nuo teorinės).

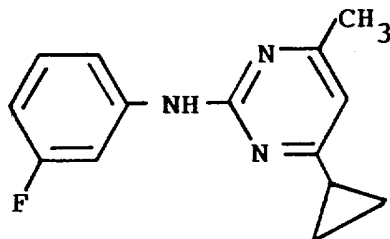
PAVYZDYS 1.8 2-chlor-4-metil-6-ciklopropilpirimidino gavimas (Jung. 3.1)



52,8 g (0,24 mmol) 2-hidroksi-4-metil-6-ciklopropil-pirimidino hidrochlorido, maišant kambario temperatūroje, sudedama į 100 ml (1,1 mol) fosforo oksichlorido ir 117 g (0,79 mol) dietilanilino mišinį, be to, temperatūra pakeliama iki 63°C. Pakaitinus 2 valandas iki 110°C, atšaldoma iki kambario temperatūros ir reakcijos mišinys maišant pernešamas į vandens su ledu ir metilenchlorido mišinį. Organinė fazė atskiriama ir praplaunama iki neutralios reakcijos sočiu natrio hidrokarbonato vandeniniu tirpalu. Išgarinus tirpiklį, gaunama 116,4 g aliejaus, kuris susideda iš reakcijos produkto ir dietilanilino. Dietilanilino atskyrimas ir karbamido reakcijos produkto valymas atliekamas kolonėlių chromatografija per silikagelį heksanas:dietilacetatas):(3:1). Po keleto dienų susikristalizavęs bespalvis aliejus turi lūžio rodiklį n_D^{25} 1,5419. Išeiga 35,7 g (0,21 mol, 87,5% nuo teorinės). Lyd. t. 33-34°C.

PAVYZDYS 1.9 2-(m-fluorfenilamino)-4-metil-6-ciklopropilpirimidino gavimas (Jung.1.63)

5



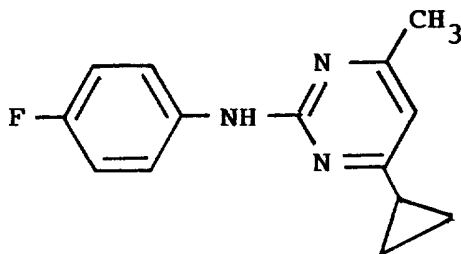
10

5,5 g (50 mmol) 3-fluoranilino ir 9,3 g (55 mmol) 2-chlor-4-metil-6-ciklopropilpirimidino tirpalas 100 ml etanolio maišant ir pridėdant 5 ml koncentruotos druskos rūgšties, parūgštinamas iki pH 1 ir, po to be-tarpiškai 18 valandų kaitinama flegmos virimo tempera-tūroje. Atšaldžius iki kambario temperatūros, ruda emulsija šarminama 10 ml 30% amoniako iki šarminės reakcijos, išpilama į 100 ml vandens su ledu ir du kartus ekstrahuojama dietilo eteriu po 150 ml. Sujungti ekstraktai praplaunami 50 ml vandens, išdžiovinami natrio sulfatu, filtruojami ir tirpiklis išgarinamas.

20

PAVYZDYS 1.10. 2-/p-fluorfenilamino/-4-metil-6-ciklo-propilpirimidino gavimas (Jung. 1.33)

30

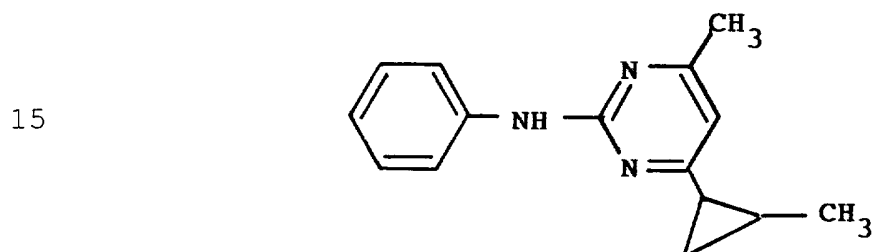


35

24,8 g (0,115 mol) 4-fluorfenilguanidino hidrokarbonato ir 17,5 g (0,138 mol) 1-ciklopropil-1,3-butandiono 150-je ml metanolio šildoma maišant 24 valandas flegmos virimo temperatūroje, be to, anglies dioksido kiekis po tam tikro laiko aiškiai sumažėja. Gautas tamsiai rudas

skaidrus tirpalas apdorojamas aktyvuota anglimi, nufiltruojama ir filtratas garinamas ant rotoriaus garintuvo iki kristalinės masės atsiskyrimo ir maišant išpilama į 500 ml vandens. Iškritę kristalai nufiltruojami, praplaunami nedideliu šalto etanolio kiekiu, išdžiovinami ir perkristalinami iš diizopropilo eterio ir petrolio eterio (50-70°C) mišinio. Nudažyti šviesiai ruda spalva kristalai lydosi 89-91°C.

10 PAVYZDYS 1.11 2-fenilamino-4-metil-6-(2-metilciklopropil)pirimidino gavimas (Jung. 1.14)



20 62,2 g (0,3 mol) 95 %-nio fenilguanidino hidrokarbonato patalpinama į 300 ml izopropanolio ir maišant 124°C išorinėje temperatūroje šildoma iki flegmos virimo temperatūros (78°C), be to, susidaro šviesiai rudos spalvos suspensija. Per 40 minučių sulašinama 42,1 g
 25 (0,3 mol) 1-(2-metilciklopropil)-1,3-butandiono, ir tuomet pradeda energingai skirtis anglies dioksidas. Baigiant lašinti, reakcijos mišinys šildomas 6 valandas, maišant flegmos virimo temperatūroje ir, sumažėjus išorinei temperatūrai, nudistiliuojama 200 ml
 30 izopropanolio. Toliau nebešildant, esant vidinei temperatūrai 60°C, maišant, lėtai pridedama 100 ml vandens į rudą tirpalą, kuris pridėjus vandens, pradeda lėtai drumstis. Po 12-os valandų maišymo kambario temperatūroje, šaldoma vieną valandą iki +5°C ir po to dvi
 35 valandas - iki +3°C. Iškritusi košelė iš kristalų nufiltruojama, praplaunama 40 ml šalto izopropanolio ir vandens (1:1) mišiniu ir balti kristalai džiovinami.

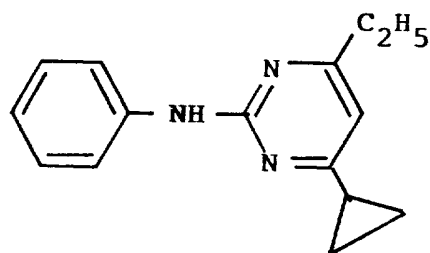
Lydimosi temperatūra 73-74°C. Išeiga 51,4 g (0,215 mol; išeiga nuo teorinės 75,3 %).

PAVYZDYS 1.12

5

2-fenilamino-4-etil-6-ciklopropilpirimidino gavimas
(Jung. 1.6)

10



15

27 g (0,2 mol) fenilguanidino 200 ml dimetilformamido maišant kambario temperatūroje sumaišoma su 6 ml acto rūgšties. Sušildžius iki 50°C, per pusę valandos maišant sulašinama 28 g (0,2 mol) 1-ciklopropil-1,3-pentadiono ir maišant šildoma kitas dvi valandas iki 150°C. Atšaldžius iki kambario temperatūros, vakuume išgarinamas tirpiklis ir maišant tamsiai rudas reakcijos mišinys išpilamas į 500 ml vandens. Nustačius su nedideliu kiekiu praskiesto natrio šarmo (NaOH) pH=9, du kartus vandeninė fazė ekstrahuojama dietilo eteriu po 150 ml, sujungti ekstraktai praplaunami 200 ml vandens ir džiovinama natrio sulfatu, filtruojama ir eteris išgarinamas. Likęs aliejus distiliuojamas giliam vakuume. Vir. t. 125-129°C/IIIa. Geltonas aliejus po kurio laiko sukietėja: lyd. t. 42-45°C.

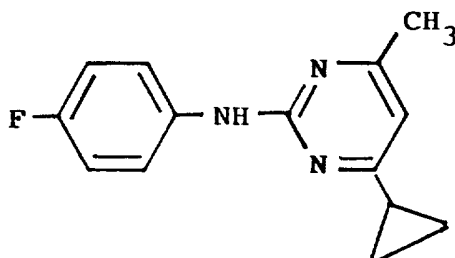
35

Pilnam pareikštų junginių kiekio patvirtinimui, pareiškėjas pateikia papildomus fizikinius duomenis šiems junginiams:

Jung.	1.55	lyd. t. 51-53°C
	1.82	lyd. t. 79-81°C

PAVYZDYS 1.13

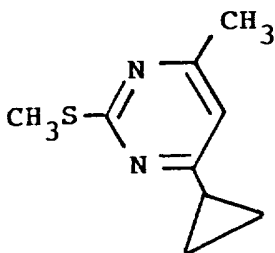
2-(4-fluorfenilamino)-4-metil-6-ciklopropilpirimidino
gavimas (Jung. 1.33)



5 g (30 mmol) 2-chlor-4-metil-6-ciklopropilpirimidino
ištirpinama 50-je ml absoliutaus metanolio ir maišant
kambario temperatūroje sumaišoma 3,3 g (30 mmol) 4-
fluoranilino. Esant aliejaus vonios temperatūrai 85-
90°C iš karto po to maišant šildoma 19 valandų flegmos
virimo temperatūroje. Atšaldžius, per pusę valandos
sulašinama į 300 ml vandens, kuris turi 1,2 g (30 mmol)
natrio hidroksido. Labai greitai nusėda šviesiai rudi
kristalai, kurie nusiurbiami pamaišius valandą ir pra-
plaunami vandeniu. Išdžiovinus, gaunama 6,8 g (28 mmol)
gelsvų kristalų, kurie lydosi 89-91°C temperatūroje,
išeiga 93,3 % nuo teorinės.

PAVYZDYS 1.14.

2-metilmerkpto-4-metil-6-ciklopropilpirimidino gavimas



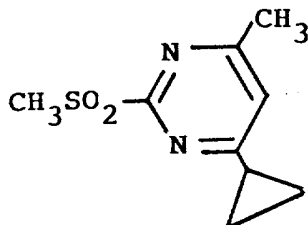
Į 69,5 g (0,25 mol) 5-metilizotiokarbamido sulfato ir 41 g (0,5 mol) bevandenio natrio acetato 375 ml acto rūgšties, maišant kambario temperatūroje per 10 minučių sulašinama 63 g (0,5 mol) 1-ciklopropil-1,3-butandiono ir iš karto po to šildoma 14 valandų flegmos virimo temperatūroje. Atšaldžius iki kambario temperatūros, filtruojama ir gautas produktas po to praplaunamas acto rūgštimi. Filtratas išgarinamas ant rotoriaus garintuvo ir likęs rudas aliejus maišant išpilamas į 600 ml vandens. Po dvigubos ekstrakcijos metilenchloridu po 200 ml, ekstraktas išgarinamas ant rotoriaus garintuvo ir likęs aliejus distiliuojamas giliame vakuume. Vir. t. 81-82°C. Išeiga: 64,8 g (0,36 mol), išeiga nuo teorinės 72%.

15

PAVYZDYS 1.15

2-metilsulfonil-4-metil-6-ciklopropilpirimidino gavimas (Jung. 4.1)

20



25

18 g (0,1 mol) 2-metilmerkaptio-4-metil-6-ciklopropilpirimidino ištirpinama 100 ml acto rūgšties ir maišant 0°C temperatūroje per 1 valandą sulašinama 28 3 g (0,25 mol) 30%-nio vandenilio peroksido. Po valandos, kai buvo baigtas lašinimas, reakcijos mišinys šildomas 2 valandas iki 70°C, atšaldoma iki kambario temperatūros ir maišant išpilama į 800 ml vandens su ledu. Iškrite balti kristalai nufiltruojami ir išdžiovinami, lyd. t. 74-76°C.

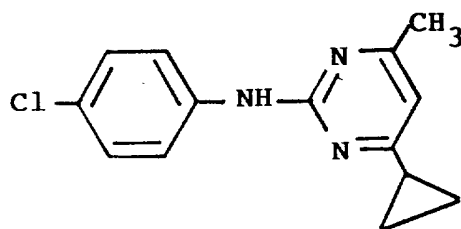
35

PAVYZDYS 1.16

2-(4-chlorfenilamino)-4-metil-6-ciklopropilpirimidino
gavimas (Jung. 1.7)

5

10



15

20

25

30

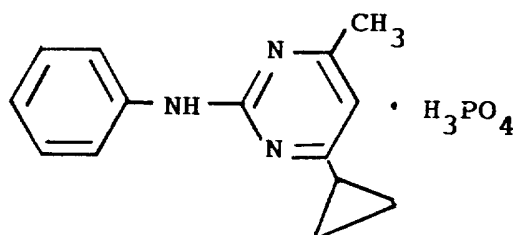
35

15,5 g (0,1 mol) 4-chlorformanilido 300-se ml tolueno
maišant kambario temperatūroje sumaišoma su 4,4 g
(0,11 mol) 60%-nės natrio hidrido dispersija. Pakai-
tinus 1 valandą iki 100°C, atšaldoma iki kambario tem-
peratūros ir per 1 valandą pridedama 20,1 g (0,095 molio)
2-metilsulfonil-4-metil-6-ciklopropilpirimidino maišant.
Pamaisius 5 valandas, praplaunama 100 ml vandens, to-
lueno tirpalas išdžiovinamas natrio sulfatu, nufilt-
ruojamas ir tirpiklis išgarinamas. Rudos nuosėdos iš-
tirpinamos 300-se ml etanolio ir kambario temperatūroje
per 10 minučių sumaišoma su 60 ml 10% vandeninio natrio
hidroksido tirpalu ir maišoma 3 valandas kambario tem-
peratūroje. Išgarinus etanolį, liekana maišant išpilama
į 300 ml vandens ir tris kartus ekstrahuojama dietilo
eteriu po 50 ml. Sujungti ekstraktai praplaunami 30 ml
vandens, išdžiovinami natrio sulfatu, nufiltruojami ir
eteris išgarinamas. Likęs tamsiai rudas aliejus iš-
valomas kolonėlių chromatografija per silikagelį (eliu-
entas toluenas:chloroformas:dietilo eteris):(4:2:1).
Išgarinus eliuojantį mišinį, gelsvas aliejus kris-
talinamas, ištrinant su petrolio eteriu (50-70°C).
Šviesiai geltoni kristalai lydosi 86-87°C temperatū-
roje.

Analogišku būdu gali būti gauti tokie junginiai: žiūr. lentelę 1.

PAVYZDYS 1.17: 2-fenilamino-4-metil-6-ciklopropilpirimidino fosfato gavimas

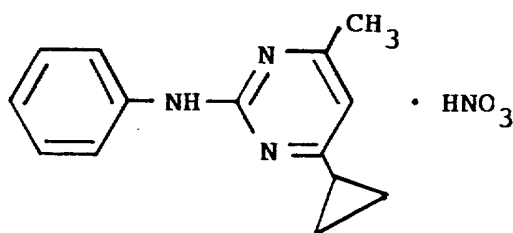
10



4 g (18 mmol) 2-fenil-4-metil-6-ciklopropilpirimidino
250-je ml absoliutaus dietilo eterio kambario temperatūroje greitai maišant per 10 minučių lašinant, sumaišoma su 2,19 g (19 mmol) 35% orto-fosforo rūgšties (g.a.). Susidarę baltos nuosėdos nufiltruojamos ir papildomai praplaunama 20 ml absoliutaus dietilo eterio. Baltos spalvos kristalai lydosi 188-191°C temperatūroje. Išeiga: 5,6 g (17,3 mmol=96% nuo teorinės).

PAVYZDYS 1.18: 2-fenilamino-4-metil-6-ciklopropilpirimidino nitrato gavimas

25



30

12 g (53 mmol) 2-fenilamino-4-metil-6-ciklopropilpirimidino 180-je ml absoliutaus dietilo eterio kambario temperatūroje ir greitai maišant per 20 minučių lašais sumaišoma su 5,81 g (60 mmol) 65%-nės azoto rūgšties (g.a.). Tuo metu susidarę baltos spalvos nuosėdos nu-

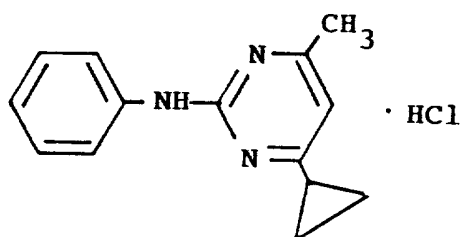
35

filtruojamos ir papildomai praplaunamos 20 ml abso-
liutaus dietilo eterio. Baltos spalvos su silpnai rus-
voku atspalviu kristalai lydosi 151-153°C temperatūroje
skildami. Išeiga: 14,7 g (52 mmol = 96% nuo teorinės).

5

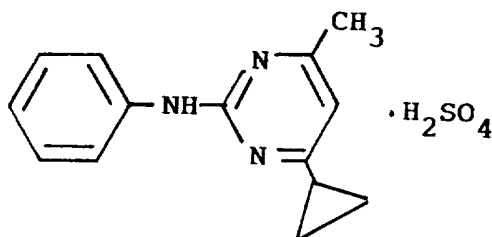
Analogiškai realizuojamais 1.17 ir 1.18 pavyzdžiuose
būdais papildomai gaminamos druskos:

10



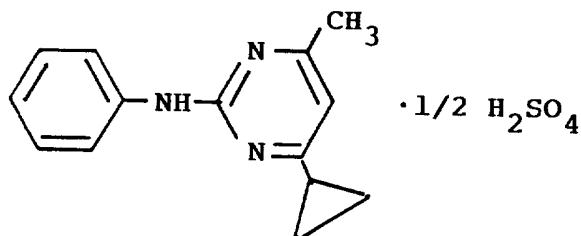
Lyd. t. 151-154°C

15



Lyd. t. 183-185°C

20



Lyd. t. 200-202°C

25

BIOLOGINIAI PAVYZDŽIAI

30

PAVYZDUS 3.1. Poveikis prieš Veutuvia inaegualis ant
obelų ūglių (Rezidentiškai apsaugantis veikimas).

35

Obelų šakelės su jaunais ūgliais 10-20 cm ilgio api-
purškiama purškimo skysčiu, pagaminto iš drėkstančių
biologiškai aktyvios medžiagos (0,006% aktyvios me-
džiagos) miltelių. Po 24 valandų apdoroti augalai buvo

užkrėsti grybelių sporų suspensija. Augalai buvo patalpinti į inkubatorių 5 dienoms, esant 90-100% santykiniam oro drėgnumui ir po to buvo dar laikomi 10 dienų 20-24°C temperatūroje šiltnamyje. Šašų pavidalo pažeidimai buvo įvertinami po 15 dienų nuo užkrėtimo.

1 lentelės junginiai rodo gerą efektyvumą prieš Veutuvia (pažeidimas mažiau 20%). Taigi, junginiai: 1.1, 1.6, 1.13, 1.14, 1.33, 1.48, 1.59, 1.63, 1.66, 1.69, 1.84, 1.87, 1.94, 1.108, 1.126, 1.131, 1.145, 1.158, 1.180, 1.200, 1.236, 1.254 ir 1.255 sumažina Veutuvia pažeidimą iki 0-10%. Neapdoroti, bet užkrėsti Veutuvia kontroliniai augalai buvo užkrėsti 100%.

PAVYZDYS 3.2. Poveikis prieš Botrytis cinerea ant obelių.

Rezidentiškai - apsauginis veikimas.

Dirbtinai pažeistos obelys buvo apdorojamos tokiu būdu, kad ant pažeistų vietų buvo purškiamas purškimo skystis, pagamintas iš biologiškai aktyvaus junginio (0,002% aktyvios medžiagos) drėkstančių miltelių. Apdoroti vaisiai betarpiškai po to buvo užkrėsti grybelių sporų suspensija ir savaitę buvo laikomi didelio drėgnumo ore apie 20°C temperatūroje. Įvertinant buvo skaičiuojamos supuvusios pažeistos vietos ir iš čia buvo skaičiuojamos bandomosios medžiagos fungicidinis veikimas.

30

1 lentelėje pateikiami junginiai rodo gerą efektyvumą prieš Botrytis (pažeidimas mažiau 20%). Kaip antai, junginiai: 1.1, 1.4, 1.6, 1.9, 1.13, 1.14, 1.17, 1.31, 1.33, 1.35, 1.48, 1.54, 1.58, 1.59, 1.62, 1.66, 1.69, 1.74, 1.82, 1.84, 1.87, 1.94, 1.108, 1.126, 1.131, 1.142, 1.145, 1.152, 1.166, 1.173, 1.180, 1.192, 1.200, 1.236, 1.247, 1.254, 1.255 ir 1.256 sumažino Botrytis

pažeidimą iki 0-10%. Neapdoroti užkrėsti kontroliniai augalai buvo pažeisti Botrytis 100%.

PAVYZDYS 3.3. Poveikis prieš Frysiphae graminis mie-
5 žiuose

a) Rezidentiškai - apsauginis veikimas.

10 Miežių augalai apie 8 cm aukščio buvo apipurkšti apipurškimo skysčiu, paruoštu iš biologiškai aktyvios medžiagos (0,006% aktyvios medžiagos) drėkstančių miltelių. Po 3-4 valandų apdoroti augalai buvo apdulkinti grybelių sporomis. Užkrėsti miežių augalai buvo patalpinti į šiltnamį apie 22°C temperatūroje ir grybelių
15 pažeidimai įvertinami po 10 dienų.

1 lentelėje pateikiami junginiai rodo gerą efektyvumą prieš Erysiphae (pažeidimas mažiau 20%). Kaip antai, junginiai: 1.1, 1.3, 1.13, 1.14, 1.33, 1.35, 1.46,
20 1.59, 1.63, 1.66, 1.69, 1.84, 1.87, 1.94, 1.108, 1.131, 1.158, 1.236, 1.254, ir 1.255 sumažino Erysiphae iki 0-10%. Neapdoroti užkrėsti kontroliniai augalai buvo pažeisti 100%.

25 PAVYZDUS 3.4. Poveikis prieš Helmin thosporium gramineum. Kviečių grūdai buvo išmirkyti gerybelių sporų suspensijoje ir vėl išdžiovinti. Išmirkyti grūdai beicuojami bandomos medžiagos (600 m.d. aktyvios medžiagos, skaičiuojant sėklų svoriui) drėkstančių miltelių suspensija. Po dviejų dienų grūdai buvo patalpinti į tam
30 tikras agarines lėkštes ir po keturių dienų buvo vertinamas grybelių kolonijos išplitimas aplink grūdą. Pagal grybelių kolonijos kiekį ir dydį buvo įvertinta bandomoji medžiaga. Lentelės junginiai stipriai kliudo
35 grybeliniam pažeidimui (0-10% pažeidimų).

PAVYZDYS 3.5. Poveikis prieš Colletotrichum lagenarium ant agurkų.

5 Išdygus, agurkų augalai per 2 savaites apipurškiami purškimo skysčiu, pagamintu iš biologiškai aktyvios medžiagos, (koncentracija 0,002%) drėkstančių miltelių. Po dviejų dienų augalai buvo užkrečiami grybelių suspensija ($1,5 \times 10$ sporų/ml) ir patalpinti į inkubatorių 36 valandoms 23°C temperatūroje ir dideliame oro drėgnume. Po to inkubatoriuje buvo palaikomas normalus drėgnumas ir apie $22-23^{\circ}\text{C}$ temperatūra. Grybelių pažeidimas buvo vertinamas po 8 dienų po užkrėtimo. Neapdoroti, bet užkrėsti kontrolinai augalai buvo pažeisti grybeliu 100%.

15 1 lentelės junginiai parodė gerą efektyvumą ir sustabdė išplitusią ligos pažeidimą. Grybelio pažeidimas buvo sumažintas iki 20% ir mažiau.

20 PAVYZDYS 3.6.

a) Kontaktinis veikimas prieš Nephotettix cincticeps ir Nilaparvata lutea (Nymphen)

25 Testas buvo atliekamas ant sudygusių ryžių augalais. Tam, į puodus (5,5 cm skersmens) buvo pasodinta atitinkamai po 4 augalus apie 15 cm aukščio (14-20 dienų).

30 Augalai buvo apipurškiami ant besisukančios lėkštės 100 ml paruoštos vandeninės suspensijos, turinčios 400 m.d. atitinkamos biologiškai aktyvios medžiagos. Išdžiūvus išpurkštam sluoksniui, ant kiekvieno augalo buvo pasodinta po 40 bandomų trečioje išsivystymo stadijoje nimfų (vikšrų). Kad sukliudytų cikadų plitimui, augalai su vikšrais iš abiejų pusių buvo apsupti atviru cilindru ir uždengti metaliniu tinkleliu. Po 6 dienų nimfos pasiekdavo suaugusių vabzdžių išsivystymo stadiją

ant apdorotų augalų. Sunaikinimo įvertinimas procentais buvo atliekamas po 6 dienų, iškėlus nimfas. Bandymas buvo atliekamas apytiksliai 27°C temperatūroje, 60% santykiniam oro drėgnumui ir 16 valandų apšvietimo periodui.

b) Sisteminis veikimas prieš Nilaparvate lugens (vandu). Apytiksliai 10 dienų amžiaus (aukštis 10 cm) ryžių augalai buvo patalpinti į plastikines stiklines, kurios turėjo vandenines bandomąsias biologiškai aktyvios medžiagos 100 m.d. koncentracijos emulsijas ir buvo uždengtos plastikiniu dangteliu su skylė. Ryžių augalo šaknys per skylę plastikiniame dangtelyje patalpintos į paruoštą bandomą tirpalą. Po to ant ryžių augalų buvo pasodinta po 20 2-os ir 3-os išsivystymo stadijų nimfų (vikšrų) Nilaparvate lugens ir uždengta plastikiniu cilindru. Bandymas buvo atliekamas apytiksliai 26°C temperatūroje ir 60% santykiniam oro drėgnumui su 16 valandų apšvietimo periodu. Po 5 dienų buvo įvertinama sunaikintų bandomų gyvūnų skaičius, lyginant su neapdorotais kontroliniais. Tokiu būdu buvo nustatyta, kad biologiškai aktyvi medžiaga patenkanti per šaknį, sunaikina bandomuosius gyvūnus ant viršutinių augalų dalių.

Junginiai iš lentelės 1 parodė kaip teste a), taip ir teste b) stiprų naikinantį poveikį ryžių kenkėjams. Naikinimo laipsnis sudaro 80% ir daugiau. Su junginiais 1.1. 1.6, 1.14, 1.59, 1.66, 1.87, 1.94. 1,108 ir 1.236 buvo pasiektas beveik pilnas sunaikinimas (98-100%). Gauti rezultatai akivaizdžiai demonstruoja didelį fungicidinio aktyvumo potencialą, kuris būdingas visoms formulės 1 junginių druskoms.

Formulės 1 junginių pranašumo įrodymui, lyginant su struktūriniais analogais, buvo atlikti fungicidinio aktyvumo bandymai ant įvairių patogenų. Naudoti formulės

1 junginiai reprezentuoja visus junginius ir demonstruoja išreikštą fungicidinį aktyvumą visiems formulės 1 junginiams.

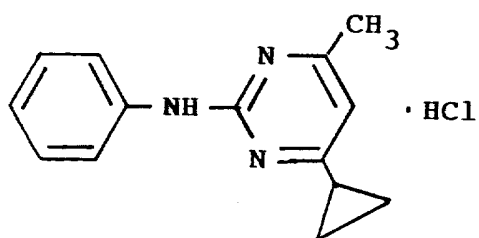
- 5 Be fungicidinių savybių, formulės 1 junginiai kaip matyti iš pavyzdžio 3.6, demonstruoja ir geresnius insekticidinius aktyvumus.

Formulės 1 junginių druskų aktyvumo įrodymas

10

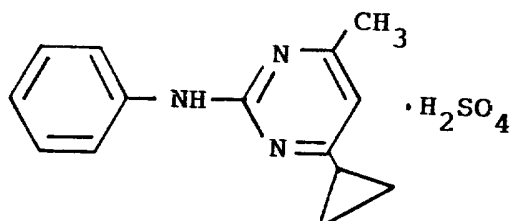
1. Junginių druskos

15



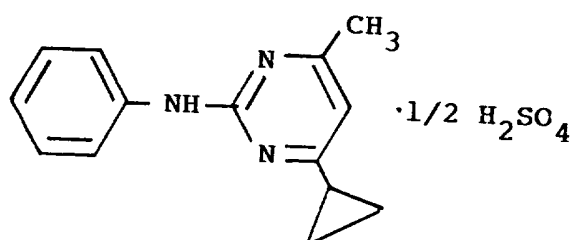
A)

20



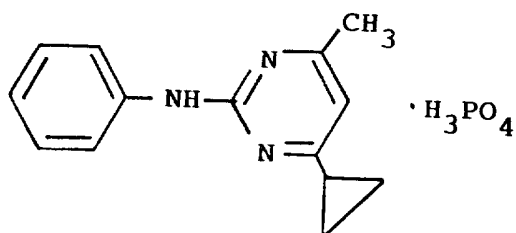
B)

25



C)

30



D)

35

2. Bandymai:

2.1. Veikimas prieš Botrytis cinerea ant obuolių.

- 5 Dirbtinai pažeisti obuoliai apdorojami taip, kad ant pažeidimo vietų lašinamas paruoštas iš aktyvios medžiagos drėkstančių miltelių apipurškimo skystis (0,02%, 0,006%, 0,002%, 0,006% aktyvios medžiagos). Apdoroti vaisiai infekuojami grybelių sporų suspensija
- 10 ir visą savaitę laikoma inkubatoriuje, esant dideliam oro drėgnumui 20°C temperatūroje. Įvertinant, suskaičiuojamos papuvę pažeidimo vietos ir iš to išvedamas bandomosios medžiagos fungicidinis veikimas.
- 15 Palyginamuoju būdu neapdoroti, bet infekuoti kontroliniai augalai rodo 100% pažeidimą Botrytis.

- ### 2.2. Veikimas prieš Veuturia inaequalis ant obelių ūglių.
- Obelių koteliai su šviežiais ūgliais 10-20 cm
- 20 ilgio apipurškiama paruoštu iš biologiškai aktyvios medžiagos drėkstančių miltelių apipurškio skysčiu (0,02%, 0,006%, 0,002%, 0,0006% aktyvios medžiagos). Praėjus 24 valandoms apdoroti augalai infekuojami grybelių suspensija. Po to augalai inkubuojami 5 dienas,
- 25 esant santykiniam oro drėgnumui 90-100% ir kitas 10 dienų laikoma šiltnamyje 20-24°C temperatūroje. Šašų pavidalo pažeidimas įvertinamas praėjus 15 dienų po infekcijos.

- Palyginamuoju būdu, neapdoroti, bet infekuoti kontroliniai augalai, rodo 100% pažeidimą Veuturia.
- 30

3. Vertinimo skalė

Vertinimas*	aktyvumas, %
1	>95 (pilnas veikimas)
3	30-95 (priimtinas veikimas)

Vertinimas*	aktyvumas, %
6	50-80 (nepakankamas veikimas)
9	<50 (veikimo nėra)

* Tarpinių reikšmių įvertinimas yra keleto bandymų rezultatų vidutinė reikšmė.

5 Rezultatai

Junginys-druska	Įvertinimas/bandymas							
	2.1				2.2			
	dozė (m.d.)							
	200	60	20	6	200	60	20	6
A	1	1	1	2	1	1	1	2
B	1	1	1	2	1	1	1	2
C	1	1	1	1	1	1	1	1
D	1	1	1	1	1	1	3	1

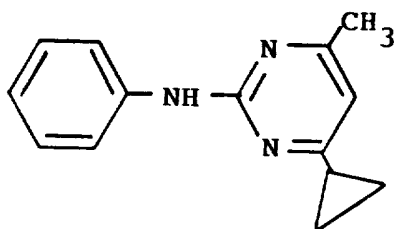
Bandymo aprašymas

10 Šios paraiškos biologiškai aktyvių medžiagų aktyvumo palyginimas su žinomo technikos lygio atitikmenimis

1. Junginys /PS/5-16701/1+2/E/

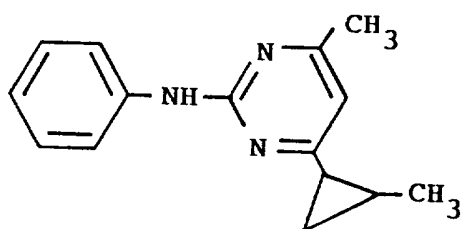
15

X₁



Jung. 1.1

X₂

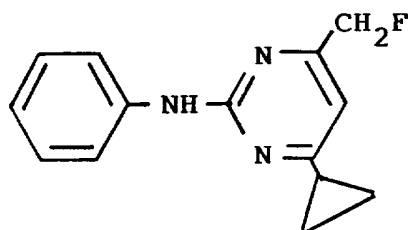


Jung. 1.14

20

5

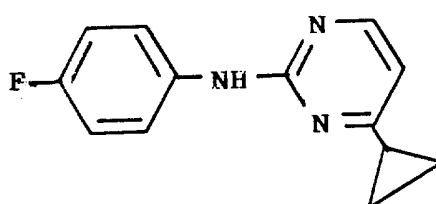
X₃



Jung. 1.59

10

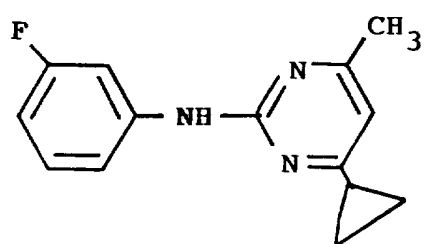
X₄



Jung.1.33

15

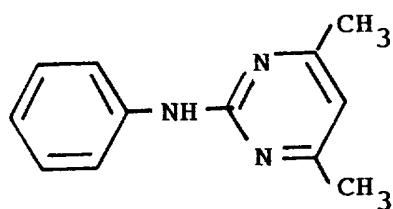
X₅



Jung. 1.63

20

Y₁

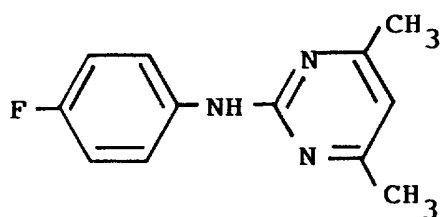


DD-151404

Jung. 1

25

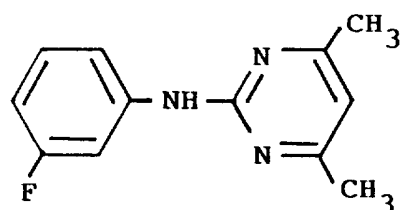
Y₂



DD-151404

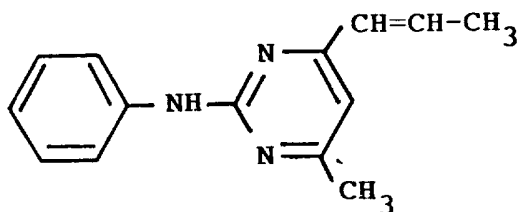
Jung. 35

Y₃



DD-151404

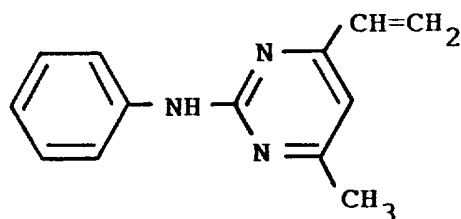
Jung. 34

Y₄

El-224339

Jung. 37

5

Y₅

El-224339

Jung. 36

10

2. Bandymo eiga

2.1. Poveikis prieš Botrytis cinerea ant obuolių.

15

Dirbtinai užkrėsti obuoliai apdorojami taip, kad ant pažeidimo vietų lašinamas pagamintas iš aktyvios medžiagos drėkstančių miltelių apipurškimo skystis (0,002% aktyvios medžiagos). Apdoroti vaisiai po to infekuojami grybelių sporų suspensija ir inkubuojami visą savaitę, esant dideliame santykiniam oro drėgnumui ir apytiksliai 20°C. Įvertinant, apskaičiuojamos pažeistos papuvę vietos ir iš to daroma išvada apie bandomos medžiagos fungicidinį veikimą.

25

Palyginamuoju būdu, neapdoroti, bet infekuoti kontroliniai augalai rodo 100% pažeidimą Botrytis.

2.2. Poveikis prieš Veuturia inaequalis ant obelių ūglių.

30

Obelių koteliai su šviežiais 10-20 cm ūgliais apipurškiami pagaminto iš biologiškai aktyvios medžiagos drėkstančių miltelių apipurškimo skysčiu (0,006% akty-

vios medžiagos). Po 24 valandų apdoroti augalai infekuojami konidijų grybelių suspensija. Augalai inkubuojami 5 dienas, esant santykiniam oro drėgnumui 90-100% ir kitas 10 dienų laikoma šiltnamyje 20-24°C temperatūroje. Šašų pavidalo pažeidimai įvertinami praėjus 15 dienų po infekcijos.

Palyginamuoju būdu, neapdoroti, bet infekuoti kontroliniai augalai rodo 100% pažeidimą Veuturia.

10

2.8. Poveikis prieš Erysiaae graminis ant miežių.

Maždaug 8 cm miežių augalai apipurškiami paruoštu iš biologiškai aktyvios medžiagos drėkstančių miltelių apipurškimo skysčiu (0,006% aktyvios medžiagos). Praėjus 3-4 valandoms apipurkšti augalai apdulkinami grybinėmis konidijomis. Infekuoti miežių augalai laikomi šiltnamyje apytiksliai 22°C temperatūroje ir praėjus 10 dienų, įvertinamas pažeidimas grybeliu.

20

Palyginamuoju būdu, neapdoroti, bet infekuoti kontroliniai augalai rodo 100% pažeidimą Erysiphae.

3. Vertinimo skalė

25

Įvertinimas*	aktyvumas, %
1	>95 (pilnas veikimas)
3	80-95 (akceptuojamas veikimas)
6	50-80 (nepakankamas veikimas)
9	<50 (jokio poveikio)

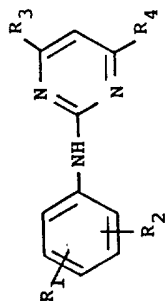
*Tarpinių reikšmių įvertinimas yra keleto bandymų rezultatų vidutinė reikšmė

4. Rezultatai

Junginys	Įvertinimas/bandymas		
	2.1	2.2	2.3
X_1	1	1	1
X_2	2	2	1
X_3	1	3	1
X_4	1	3	2
X_5	1	1	1
Y_1	8	9	9
Y_2	9	9	9
Y_3	*	9	9
Y_4	9	9	9
Y_5	9	9	9

* nebuvo atliekama.

1 lentelė. Junginiai formulės

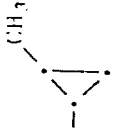
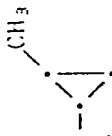
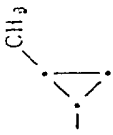


Pvz. Nr.	R ₁	R ₂	R ₃	R ₄	Fizikinė konstanta
1.1	H	H	CH ₃		lyd.t. 67069°C
1.2	2-Cl	H	CH ₃		
1.3	H	H	H		lyd.t. 53-56°C
1.4	H	H	-CH ₂ Br		lyd.t. 77,5-79,5°C
1.5	3-Cl	H	CH ₃		lyd.t. 104-105°C

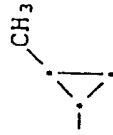
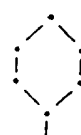
1 lentelė (tęsinys)

Pvz. Nr.	R ₁	R ₂	R ₃	R ₄	Fizikinė konstanta
1.6	H	H	-C ₂ H ₅		lyd.t. 42-45°C
1.7	4-Cl	H	-CH ₃		lyd.t. 86-87°C
1.8	H	H	-CH ₂ Br		
1.9	H	H	-CH ₂ Cl		lyd.t. 50-52°C
1.10	4-CH ₃	H	-CH ₃		lyd.t. 53-56°C
1.11	H	H	-CF ₃		

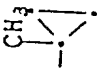
1 lentelė (tęsinys)

Pvz. Nr.	R ₁	R ₂	R ₃	R ₄	Fizikinė konstanta
1.12	H	H	-C ₃ H ₇ -n		lyd.t. 44-46°C
1.13	H	H	-CH ₂ OH		lyd.t. 111-113°C
1.14	H	H	-CH ₃		lyd.t. 73-74°C
1.15	4-OCH ₃	H	CH ₃		lyd.t. 48-50°C
1.16	H	H	-CH ₂ CH ₂ OH		
1.17	H	H	-CH ₂ Br		

1 lentelė (tęsinys)

Pvz. Nr.	R ₁	R ₂	R ₃	R ₄	Fizikinė konstanta
1.18	H	H	-C ₄ H ₉ -n		tamsiai rudas aliejus n _D ²⁴ : 1.5992
1.19	H	H	-CH ₂ OH		
1.20	4-OCH ₂ H ₅	H	CH ₃		lyd.t. 33-36°C
1.21	H	H	H		
1.22	H	H	-CH ₂ Br		
1.23	H	H	-CH ₂ Br		

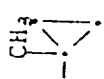
1 lentelė (tęsinys)

Pvz. Nr.	R ₁	R ₂	R ₃	R ₄	Fizikinė konstanta
1.24	H	H	H		
1.25	H	H	-C ₄ H ₉ antr.		aliejus n _D ²⁴ :1.6002
1.26	H	H	-CH ₂ OH		
1.27	4-Br	H	-CH ₃		lyd.t. 94-95°C
1.28	H	H	-CH ₃		lyd.t. 97-98°C
1.29	H	H	-CF ₃		

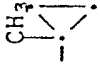
1 lentelė (tęsinys)

Pvz. Nr.	R ₁	R ₂	R ₃	R ₄	Fizikinė konstanta
1.30	H	H	-C ₄ H ₉ tret.		
1.31	H	H	-CH ₃		lyd.t. 50-52°C
1.32	H	H	-CF ₃		
1.33	4-F	H	-CH ₃		lyd.t. 89-91°C
1.34	-H	H	H		
1.35	H	H	-CH ₂ Cl		lyd.t. 55-57°C

1 lentelė (tęsinys)

Pvz. Nr.	R ₁	R ₂	R ₃	R ₄	Fizikinė konstanta
1.36	H	H	-CF ₃		
1.37	4-OCHF ₂	H	-CH ₃		aliejus n _D ²⁵ :1.5763
1.38	H	H	-C ₂ H ₅		
1.39	H	H	-CHCl ₂		Lyd.t. 56-58°C
1.40	3-Cl	5-Cl	-CH ₃		.
1.41	H	H	-CH ₂ Cl ₂		

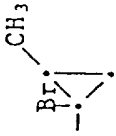
1 lentelė (tęsinys)

Pvz. Nr.	R ₁	R ₂	R ₃	R ₄	Fizikinė konstanta
1.42	H	H	-CH ₃		lyd.t. 63-65°C
1.43	H	H	-CH ₂ OH		
1.44	3-OC ₂ H ₅	4-OC ₂ H ₅	-CH ₃		aliejus n _D ²⁵ :1.5498
1.45	H	H	-CF ₃		lyd.t. 66-69°C
1.46	4-OCF ₃	H	-CH ₃		.
1.47	H	H	-CH ₂ OH		

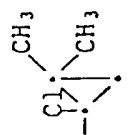
1 lentelė (tęsinys)

Pvz. Nr.	R ₁	R ₂	R ₃	R ₄	Fizikinė konstanta
1.48	H	H	-CH ₂ OH		lyd.t. 123-125°C
1.49	3-CF ₃	4-Cl	-CH ₃		lyd.t. 128-130°C
1.50	H	H	H		
1.51	H	H	H		
1.52	H	H	-CH ₂ CH ₂ OH		
1.53	3-Cl	4-Cl	-CH ₃		lyd.t. 85-87°C

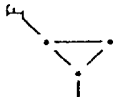
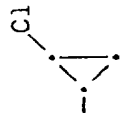
1 lentelė (tęsinys)

Pvz. Nr.	R ₁	R ₂	R ₃	R ₄	Fizikinė konstanta
1.54	H	H	-CH ₃		lyd.t. 73-74°C
1.55	2-F	H	-CH ₃		lyd.t. 51-53°C
1.56	H	H	-CH ₃		
1.57	H	H	H		
1.58	H	H	-CH ₃		lyd.t. 58-61°C

1 lentelė (tęsinys)

Pvz. Nr.	R ₁	R ₂	R ₃	R ₄	Fizikinė konstanta
1.59	H	H	-CH ₂ F		lyd.t. 48-52°C
1.60	3-Cl	4-CH ₃	-CH ₃		
1.61	H	H	H		
1.62	H	H	-CH ₃		
1.63	3-F	H	-CH ₃		lyd.t. 87-89°C
1.64	H	H	-CH ₃		

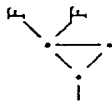
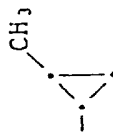
1 lentelė (tęsinys)

Pvz. Nr.	R ₁	R ₂	R ₃	R ₄	Fizikinė konstanta
1.65	2-CH ₃	3-Cl	-CH ₃		
1.66	H	H	-CH ₃		lyd.t. 81-84°C
1.67	H	H	-CH ₂ F		lyd.t. 63-65°C
1.68	2-Cl	5-CH ₃	-CH ₃		
1.69	H	H	-CH ₃		lyd.t. 67-69°C
1.70	2-Br	H	-CH ₃		

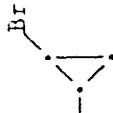
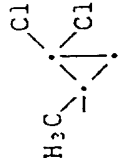
1 lentelė (tęsinys)

Pvz. Nr.	R ₁	R ₂	R ₃	R ₄	Fizikinė konstanta
1.71	2-CH ₃	4-Cl	-CH ₃		
1.72	H	H	-CH ₃		lyd.t. 64-66°C
1.73	2-Cl	6-CH ₃	-CH ₃		
1.74	H	H	-CH ₂ F		lyd.t. 43-45°C
1.75	H	H	-CH ₂ F		
1.76	3-Br	H	-CH ₃		

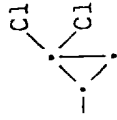
1 lentelė (tęsinys)

Pvz. Nr.	R ₁	R ₂	R ₃	R ₄	Fizikinė konstanta
1.82	3-Cl	4-F	-CH ₃		lyd.t. 79-81°C
1.83	H	H	-C ₃ H ₇ -i		
1.84	H	H	-CH ₃		lyd.t. 81-84°C
1.85	H	H	-C ₃ H ₇ -i		
1.86	4-J	H	-CH ₃		
1.87	H	H	-CH ₂ F		lyd.t. 63-64°C

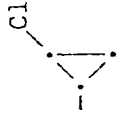
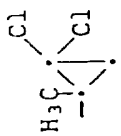
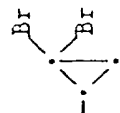
1 lentelė (tęsinys)

Pvz. Nr.	R ₁	R ₂	R ₃	R ₄	Fizikinė konstanta
1.77	H	H			
1.78	H	H	-CH ₃		lyd.t. 51-53°C
1.79	2-Cl	4-CH ₃	-CH ₃		
1.80	H	H			liejus n _D ²⁴ :1.6101
1.81	H	H	-CH ₂ F		.

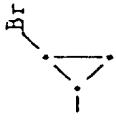
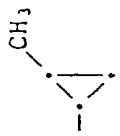
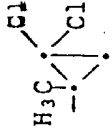
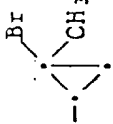
1 lentelė (tęsinys)

Pvz. Nr.	R ₁	R ₂	R ₃	R ₄	Fizikinė konstanta
1.88	H	H	-C ₄ H ₉ -n		
1.89	2-CH ₃	H	-CH ₃		
1.90	H	H	-C ₃ H ₇ -i		aliejus n_D^{24} : 1.6074
1.91	H	H	-CH ₃		lyd.t. 65-68°C
1.92	2-CH ₃	5-Cl	-CH ₃		,
1.93	H	H	-CH ₃		

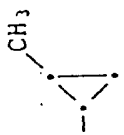
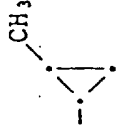
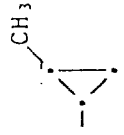
1 lentelė (tęsinys)

Pvz. Nr.	R ₁	R ₂	R ₃	R ₄	Fizikinė konstanta
1.94	H	H	-CH ₂ F		lyd.t. 48-50°C
1.95	2-OCH ₃	5-Cl	-CH ₃		
1.96	3-Cl	4-OCH ₃	-CH ₃		
1.97	H	H	-CH ₂ CH ₂ OH		
1.98	H	H	-CH ₃		
1.99	2-Br	4-Br	-CH ₃		

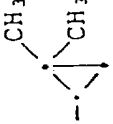
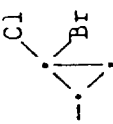
1 lentelė (tęsinys)

Pvz. Nr.	R ₁	R ₂	R ₃	R ₄	Fiziikinė konstanta
1.100	H	H	-CH ₂ F		lyd.t. 38-41°C
1.101	3-CH ₃	H	-CH ₃		lyd.t. 51-52°C
1.102	H	H	-C ₄ H ₉ -n		
1.103	3-CH ₃	4-Br	-CH ₃		
1.104	H	H	-C ₃ H ₇ -n		
1.105	H	H	-CH ₃		

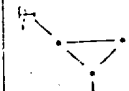
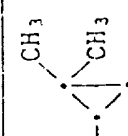
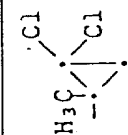
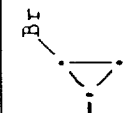
1 lentelė (tęsinys)

Pvz. Nr.	R ₁	R ₂	R ₃	R ₄	Fizikinė konstanta
1.106	H	H	-CH ₂ CH ₂ OH		
1.107	2-C ₂ H ₅	H	-CH ₃		
1.108	H	H	-CH ₂ F		lyd.t. 55-57°C
1.109	H	H	H		
1.110	H	H	-C ₃ H ₇ -n		
1.111	3-C ₂ H ₅	H	-CH ₃		

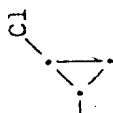
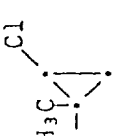
1 lentelė (tęsinys)

Pvz. Nr.	R ₁	R ₂	R ₃	R ₄	Fizikinė konstanta
1.112	H	H	-CH ₂ F		
1.113	H	H	-CH ₃		lyd.t. 83-85°C
1.114	2-Br	5-Br	-CH ₃		
1.115	2-CH ₃	4-Br	-CH ₃		
1.116	H	H	-C ₄ H ₉ -antr.		
1.117	2-CH ₃	5-F	-CH ₃		

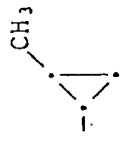
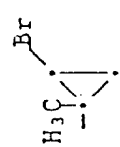
1 lentelė (tęsinys)

Pvz. Nr.	R ₁	R ₂	R ₃	R ₄	Fizikinė konstanta
1.118	4-C ₂ H ₅	H	-CH ₃		
1.119	H	H	H		
1.120	H	H	-CH ₃		lyd.t. 51-54°C
1.121	2-Br	4-CH ₃	-CH ₃		
1.122	H	H	-CH ₂ F		
1.123	H	H	-CF ₃		

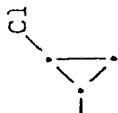
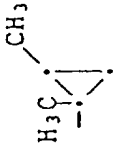
1 lentelė (tęsinys)

Pvz. Nr.	R ₁	R ₂	R ₃	R ₄	Fizikinė konstanta
1.124	H	H	-CF ₃		
1.125	2-C ₃ H ₇ -i	H	-CH ₃		
1.126	H	H	-CH ₂ F		lyd.t. 44-47°C
1.127	H	H	-CH ₂		
1.128	H	H			lyd.t. 54-56°C
1.129	2-Cl	4-Br	-CH ₃		

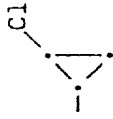
1 lentelė (tęsinys)

Pvz. Nr.	R ₁	R ₂	R ₃	R ₄	Fizikinė konstanta
1.130	H	H	-C ₄ H ₉ -antr.		
1.131	H	H	-C ₂ H ₅		lyd.t. 57-59°C
1.132	4-C ₃ H ₇ -i	H	-CH ₃		
1.133	2-OCH ₃	5-CH ₃	-CH ₃		
1.134	H	H	-CH ₃		
1.135	H	H	-CH ₂ Cl		

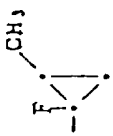
1 lentelė (tęsinys)

Pvz. Nr.	R ₁	R ₂	R ₃	R ₄	Fizikinė konstanta
1.136	3-CF ₃	5-CF ₃	-CH ₃		
1.137	H	H	-CF ₃		
1.138	H	H	-C ₂ H ₅		
1.139	2-CF ₃	H	-CH ₃		lyd.t. 56-58°C
1.140	H	H	H		
1.141	H	H	-CH ₃		

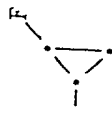
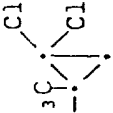
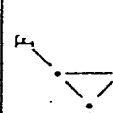
1 lentelė (tęsinys)

Pvz. Nr.	R ₁	R ₂	R ₃	R ₄	Fizikinė konstanta
1.142	H	H	-CH ₂ Cl		
1.143	2-Cl	3-Cl	-CH ₃		
1.144	H	H	-C ₄ H ₉ -tret.		
1.145	H	H	-C ₂ H ₅		lyd.t. 55-60°C
1.146	2-CF ₃	4-Cl	-CH ₃		
1.147	2-Cl	4-Cl	-CH ₃		

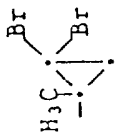
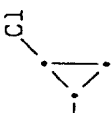
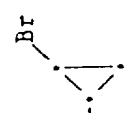
1 lentelė (tęsinys)

Pvz. Nr.	R ₁	R ₂	R ₃	R ₄	Fizikinė konstanta
1.148	H	H	-CH ₃		
1.149	H	H	-CH ₂ Cl		
1.150	3-CF ₃	H	-CH ₃		lyd.t. 81-83°C
1.151	H	H	-C ₄ H ₉ -tret.		
1.152	4-CF ₃	H	-CH ₃		lyd.t. 60-62°C
1.153	2-Cl	5-CF ₃	-CH ₃		

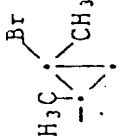
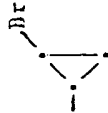
1 lentelė (tęsinys)

Pvz. Nr.	R ₁	R ₂	R ₃	R ₄	Fizikinė konstanta
1.154	H	H	-CH ₂ Cl		lyd.t. 63-66°C
1.155	H	H	-CH ₃		lyd.t. 99-109°C
1.156	2-Cl	5-Cl	-CH ₃		
1.157	4-OC ₃ H ₇ -i	H	-CH ₃		
1.158	H	H	-C ₂ H ₅		lyd.t. 58-61°C
1.159	2-Cl	6-Cl	-CH ₃		

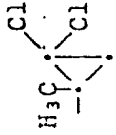
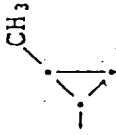
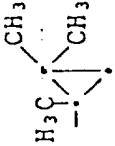
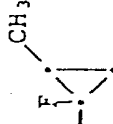
1 lentelė (tęsinys)

Pvz. Nr.	R ₁	R ₂	R ₃	R ₄	Fizikinė konstanta
1.160	H	H	-C ₂ H ₅		
1.161	H	H	-CH ₃		
1.162	H	H	-CH ₂ Cl		lyd.t. 55-57°C
1.163	2-OCH ₃	H	-CH ₃		
1.164	H	H	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ Cl		
1.165	H	H	H		

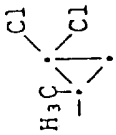
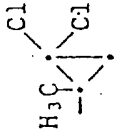
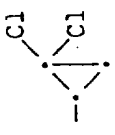
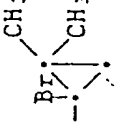
1 lentelė (tęsinys)

Pvz. Nr.	R ₁	R ₂	R ₃	R ₄	Fizikinė konstanta
1.166	2-F	3-F	-CH ₃		lyd.t. 65-67°C
1.167	H	H	-CH ₂ H ₅		
1.168	H	H	-CH ₃		
1.169	H	H	-CH ₂ Cl		
1.170	3-OCH ₃	H	-CH ₃		lyd.t. 47-50°C

1 lentelė (tęsinys)

Pvz. Nr.	R ₁	R ₂	R ₃	R ₄	Fizikinė konstanta
1.171	H	H	-CH ₂ Cl		
1.172	2-CH ₃	4-OCH ₃	-CH ₃		
1.173	2-F	4-F	-CH ₃		lyd.t. 73-73,5°C
1.174	H	H	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ Cl		
1.175	H	H	-CH ₃		
1.176	H	H	-CH ₂ Cl		

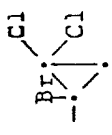
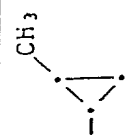
1 lentelė (tęsinys)

Pvz. Nr.	R ₁	R ₂	R ₃	R ₄	Fizikinė konstanta
1.177	2-OCHF ₂	H	-CH ₃		
1.178	H	H	-CH ₂ OH		
1.179	H	H	H		
1.180	2-F	5-F	-CH ₃		lyd.t. 77-79°C
1.181	H	H	-CH ₂ OH		
1.182	H	H	-CH ₃		

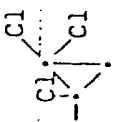
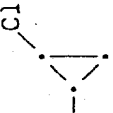
1 lentelė (tęsinys)

Pvz. Nr.	R ₁	R ₂	R ₃	R ₄	Fizikinė konstanta
1.183	H	H	-CHCl ₂		
1.184	4-OCF ₂ CHF ₂	H	-CH ₃		
1.185	H	H	-CH ₂ Cl		
1.186	H	H	H		
1.187	H	H			aliejus $n_D^{24}=1.0074$
1.188	H	H			

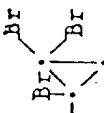
1 lentelė (tęsinys)

Pvz. Nr.	R ₁	R ₂	R ₃	R ₄	Fizikinė konstanta
1.189	H	H	-CH ₃		
1.190	4-OCF ₂ CHClF	H	-CH ₃		
1.191	H	H	-CH ₂ Cl		
1.192	2-F	6-F	-CH ₃		lyd.t. 135-137°C
1.193	H	H			
1.194	4-OC ₃ H ₇ -n	H	-CH ₃		

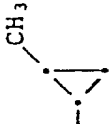
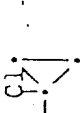
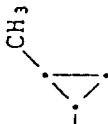
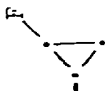
1 lentelė (tęsinys)

Pvz. Nr.	R ₁	R ₂	R ₃	R ₄	Fizikinė konstanta
1.195	H	H			
1.196	H	H	-CH ₃		
1.197	H	H			
1.198	4-OCF ₂ CHCl ₂	H	-CH ₃		
1.199	H	H			
1.200	3-F	4-F	-CH ₃		lyd.t. 91-92°C

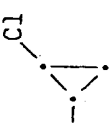
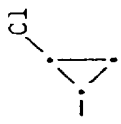
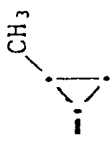
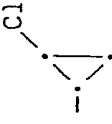
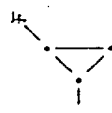
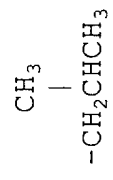
1 lentelė (tęsinys)

Pvz. Nr.	R ₁	R ₂	R ₃	R ₄	Fizikinė konstanta
1.201	H	H	-CClF ₂		lyd.t. 68-70°C
1.202	3-OC ₂ H ₅	H	-CH ₃		
1.203	H	H	-CH ₃		
1.204	H	H	-CH ₂ Br		
1.205	4-OCF ₂ CFCl ₂	H	-CH ₃		
1.206	2-OCH ₃	5-OCH ₃	-CH ₃		

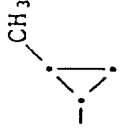
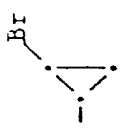
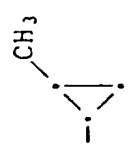
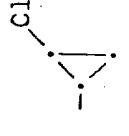
1 lentelė (tęsinys)

Pvz. Nr.	R ₁	R ₂	R ₃	R ₄	Fizikinė konstanta
1.207	H	H	-CH ₂ OH		
1.208	H	H	-CClF ₂		
1.209	H	H	-CH ₂ Br		
1.210	2-OCH ₃	4-OCH ₃	-CH ₃		
1.211	H	H			aliejus $n_D^{20}=1.6077$
1.212	H	H	-CH ₂ Br		

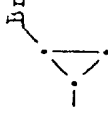
1 lentelė (tęsinys)

Pvz. Nr.	R ₁	R ₂	R ₃	R ₄	Fizikinė konstanta
1.213	H	H			
1.214	H	H	-CH ₂ OH		
1.215	H	H			
1.216	3-OCH ₃	5-OCH ₃	-CH ₃		
1.217	H	H	-CH ₂ Br		
1.218	H	H			lyd.t. 44-46°C

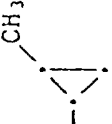
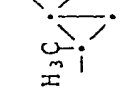
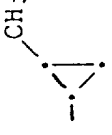
1 lentelė (tęsinys)

Pvz. Nr.	R ₁	R ₂	R ₃	R ₄	Fizikinė konstanta
1.219	2-CH ₃	3-CH ₃	-CH ₃		
1.220	H	H	-CH ₂ OH		
1.221	H	H			
1.222	H	H	$\begin{array}{c} \text{CH}_3 \\ \\ -\text{CH}_2\text{CHCH}_3 \end{array}$		
1.223	2-CH ₃	4-CH ₃	-CH ₃		
1.224	H	H	-CH ₂ Br		

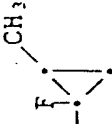
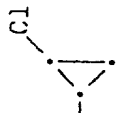
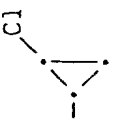
1 lentelė (tęsinys)

Pvz. Nr.	R ₁	R ₂	R ₃	R ₄	Fizikinė konstanta
1.225	H	H			
1.226	2-CH ₃	5-CH ₃	-CH ₃		
1.227	H	H	-CH ₂ OH		
1.228	H	H	-CF ₂ CF ₃		lyd.t. 50-52°C
1.229	H	H	-CH ₂ OH		
1.230	H	H			

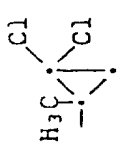
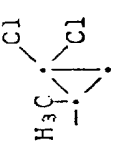
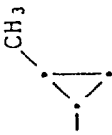
1 lentelė (tęsinys)

Pvz. Nr.	R ₁	R ₂	R ₃	R ₄	Fizikinė konstanta
1.231	2-CH ₃	6-CH ₃	-CH ₃		lyd.t. 122-123°C
1.232	H	H	-CH ₂ Br		
1.233	H	H	-CF ₂ CF ₃		
1.234	H	H			
1.235	H	H			lyd.t. 58-60°C
1.236	H	H			lyd.t. 75-77°C

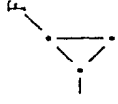
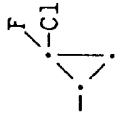
1 lentelė (tęsinys)

Pvz. Nr.	R ₁	R ₂	R ₃	R ₄	Fizikinė konstanta
1.237	3-CH ₃	4-CH ₃	-CH ₃		
1.238	H	H	-CH ₂ OH		lyd.t. 98-101°C
1.239	H	H	-CH ₂ Br		
1.240	H	H			
1.241	H	H			
1.242	H	H			

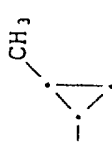
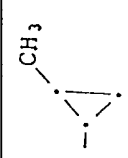
1 lentelė (tęsinys)

Pvz. Nr.	R ₁	R ₂	R ₃	R ₄	Fizikinė konstanta
1.243	H	H	-CH ₂ Br		
1.244	H	H			
1.245	3-CH ₃	5-CH ₃	-CH ₃		
1.246	H	H			aliejus n _D ²⁵ :1,6232
1.247	3-F	4-CH ₃	-CH ₃		lyd.t. 75-78°C

1 lentelė (tęsinys)

Pvz. Nr.	R ₁	R ₂	R ₃	R ₄	Fizikinė konstanta
1.248	H	H			
1.249	H	H	-CH ₂ Br		
1.250	2-OCHF ₂	4-CH ₃	-CH ₃		lyd.t. 85-87°C
1.251	3-Cl	4-OCHF ₂	-CH ₃		aliejus n _D ²⁵ :1.5898
1.252	3-OCH ₃	4-OCH ₃	-CH ₃		lyd.t. 74-76°C
1.253	H	H	-CH ₃		lyd.t. 97-99°C

1 lentelė (tęsinys)

Pvz. Nr.	R ₁	R ₂	R ₃	R ₄	Fizikinė konstanta
1.254	3-F	H	-CH ₃		lyd.t. 79-80°C
1.255	3-F	5-F	-CH ₃		lyd.t. 105-107°C
1.256	4-F	H	-CH ₃		lyd.t. 89-91°C

50% mirtinos dozės (LD₅₀)

Junginio Nr.	LD ₅₀ m.d.	Testuojamas organizmas
1.28	200	<u>Erysiphae graminis</u>
1.31	200	<u>Erysiphae graminis</u>
1.45	200	<u>Erysiphae graminis</u>
1.201	200	<u>Erysiphae graminis</u>
1.236	60	<u>Erysiphae graminis</u>

5

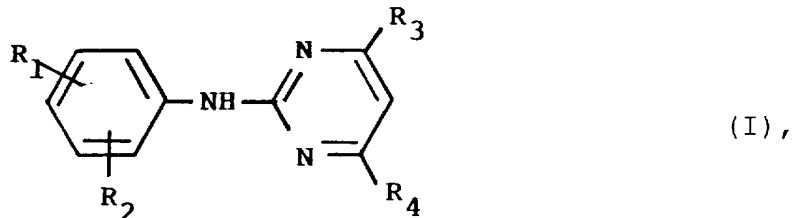
10

15

20

IŠRADIMO APIBRĖŽTIS

1. 2-anilino-pirimidino dariniai formulės I:



kurioje R_1 ir R_2 , nepriklausomai vienas nuo kito, reiškia vandenilį, halogeną, C_1 - C_3 -alkilą, C_1 - C_2 -halogenalkilą, C_1 - C_3 -alkoksi arba C_1 - C_3 -halogenalkoksi;

15

R_3 - vandenilis, C_1 - C_4 -alkilas arba pakeistas halogenu, hidroksilo arba ciano - grupe C_1 - C_4 alkilas, ciklopropilas arba pakeistas iki trijų kartų vienodai arba skirtingai metilu ir/arba halogenu ciklopropilas;

20

R_4 - C_3 - C_6 -cikloalkilas arba pakeistas iki trijų kartų vienodai arba skirtingai metilu ir/arba halogenu C_3 - C_6 -cikloalkilas, arba jų druskos, rodančios biologinį aktyvumą.

25

2. Formulės 1 junginys pagal 1 punktą, b e s i s k i - r i a n t i s tuo, kad R_3 ir R_4 turi nurodytas reikšmes, o R_1 ir R_2 yra vandenilis.

30

3. Formulės 1 junginys pagal 1 punktą, b e s i s k i - r i a n t i s tuo, kad R_1 ir R_2 , nepriklausomai vienas nuo kito, yra vandenilis, halogenas, C_1 - C_3 -alkilas, C_1 - C_2 -halogenalkilas, C_1 - C_3 -alkoksi arba C_1 - C_3 -halogenalkoksi;

35

R_3 - vandenilis, C_1 - C_4 -alkilas arba pakeistas halogenu arba ciano grupe C_1 - C_4 -alkilas;

5 R_4 - C_3 - C_6 -cikloalkilas arba pakeistas metilu arba halogenu C_3 - C_6 -cikloalkilas.

10 4. Formulės 1 junginys pagal 3 punktą, b e s i s k i - r i a n t i s tuo, kad R_1 ir R_2 , nepriklausomai vienas nuo kito, yra vandenilis, fluoras, chloras, bromas, metilas, etilas, halogenmetilas, metoksi, etoksi arba halogenmetoksi;

15 R_3 - vandenilis, metilas, etilas, n - propilas arba fluorbutilas; arba pakeistas fluoru, chloru, bromu arba ciano grupe metilas arba etilas;

R_4 - C_3 - C_6 -cikloalkilas arba pakeistas metilu, fluoru, chloru arba bromu C_3 - C_6 -cikloalkilas.

20 5. Formulės 1 junginys pagal 1 punktą, b e s i s k i - r i a n t i s tuo, kad R_1 ir R_2 , nepriklausomai vienas nuo kito, yra vandenilis, fluoras, chloras, metilas, trifluormetilas, metoksi arba difluormetoksi;

25 R_3 - vandenilis, C_1 - C_3 -alkilas, pakeistas halogenu arba hidroksilo grupe, C_1 - C_2 -alkilas; ciklopropilas arba pakeistas iki trijų kartu vienodai arba skirtingai metilu ir/arba halogenu ciklopropilas;

30 R_4 - C_3 - C_6 -cikloalkilas arba pakeistas iki trijų kartu vienodai arba skirtingai metilu ir/arba halogenu C_3 - C_4 -cikloalkilas.

35 6. Formulės 1 junginys pagal 1 punktą, b e s i s k i - r i a n t i s tuo, kad R_1 ir R_2 yra vandenilis;

R_3 - C_1 - C_3 -alkilas, pakeistas fluoru, chloru, bromu arba hidroksilo grupe metilas; ciklopropilas, pakeistas metilu, fluoru, chloru arba bromu ciklopropilas;

5 R_4 - C_3 - C_4 -cikloalkilas arba pakeistas iki trijų kartų vienodai arba skirtingai metilu ir/arba fluoru, chloru, bromu C_3 - C_4 -cikloalkilas.

10 7. Junginys pagal 3 punktą, b e s i s k i r i a n t i s tuo, kad jis parinktas iš grupės:

2-fenilamino-4-metil-6-ciklopropilpirimidinas,

15 2-fenilamino-4-etil-6-ciklopropilpirimidinas,

2-fenilamino-4-metil-5-(metilciklopropil)pirimidinas,

2-(p-fluorfenilamino)-4-metil-6-ciklopropilpirimidinas.

20 8. Junginys pagal 1 punktą, b e s i s k i r i a n t i s tuo, kad jis parinktas iš grupės:

2-fenilamino-4,6-bis(ciklopropil)pirimidinas,

25 2-fenilamino-4-hidroksimetil-6-ciklopropilpirimidinas,

2-fenilamino-4-fluormetil-6-ciklopropilpirimidinas,

30 2-fenilamino-4-hidroksimetil-6-(2-metilciklopropil)pirimidinas,

2-fenilamino-4-metil-6-(2-fluorciklopropil)pirimidinas,

35 2-fenilamino-4-metil-6-(2-chlorciklopropil)pirimidinas,

2-fenilamino-4-metil-6-(2-difluorciklopropil)pirimidinas,

2-fenilamino-4-fluormetil-6-(2-fluorciklopropil)pirimi-
dinas,

5 2-fenilamino-4-fluormetil-6-(2-chlorciklopropil)pirimi-
dinas,

2-fenilamino-4-fluormetil-6-(2-metilciklopropil)pirimi-
dinas,

10 2-fenilamino-4-etil-6-(2-metilciklopropil)pirimidinas.