

Данное изобретение относится к новым спирокетальзамещенным циклическим кетоенолам, к нескольким способам их получения и к их применению в качестве средств борьбы с вредителями, и/или нежелательными растениями, и/или микроорганизмами. Предметом изобретения также являются селективные гербицидные средства, которые содержат спирокетальзамещенные циклические кетоенолы, с одной стороны, и соединение, улучшающее переносимость гербицидов культурными растениями - с другой стороны.

Ранее были описаны фармацевтические свойства 3-ацилпирролидин-2,4-дионов (S. Suzuki и др., Chem. Pharm. Bull. 15: 1120 (1967)). Кроме того, были синтезированы N-фенилпирролидин-2,4-дионы (R. Schmierer и H. Mildenerger Liebigs Ann. Chem. 1985, 1095). Биологическая активность этих соединений не была описана.

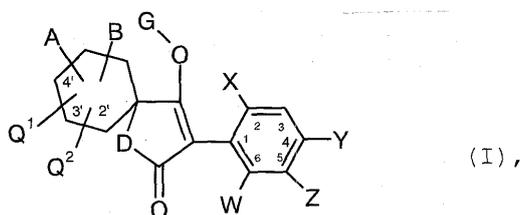
В патентных заявках EP-A-0262399 и GB-A-2266888 описаны соединения аналогичной структуры (3-арилпирролидин-2,4-дионы), однако ничего не известно об их гербицидной, инсектицидной или акарицидной активности. Известны своей гербицидной, инсектицидной и акарицидной активностью производные незамещенных бициклических 3-арилпирролидин-2,4-дионов (EP-A-355599, EP-A-415211 и JP-A-12053670), а также производные замещенных моноциклических 3-арилпирролидин-2,4-дионов (EP-A-377893 и EP-A-442077).

Далее известны производные полициклических 3-арилпирролидин-2,4-дионов (EP-A-442073), а также производные 1H-арилпирролидиндионов (EP-A-456063, EP-A-521334, EP-A-596298, EP-A-613884, EP-A-613885, WO 94/01997, WO 95/26954, WO 95/20572, EP-A-0668267, WO 96/25395, WO 96/35664, WO 97/01535, WO 97/02243, WO 97/36868, WO 97/43275, WO 98/05638, WO 98/06721, WO 98/25928, WO 99/24437, WO 99/43649, WO 99/48869 и WO 99/55673, WO 01/17972, WO 01/23354, WO 01/74770, WO 03/013249, WO 03/062244, WO 2004/007448, WO 2004/024688, WO 04/065366, WO 04/080962, WO 04/111042, WO 05/044791, WO 05/044796, WO 05/048710, WO 05/049596, WO 05/066125, WO 05/092897 и DE-A-04030753. Кроме того, известны кетальзамещенные 1H-арилпирролидин-2,4-дионы из WO 99/16748 и (спиро)кетальзамещенные N-алкоксиалкоксизамещенные арилпирролидиндионы из JP-A-14205984 и Ito M. и др., Bioscience, Biotechnology and Biochemistry 67, 1230-1238, (2003).

Известно, что некоторые производные замещенных Δ^3 -дигидрофуран-2-она обладают гербицидными свойствами (см. DE-A-4014420). Синтез использованных в качестве исходных веществ производных тетрановой кислоты (таких как, например, 3-(2-метилфенил)-4-гидрокси-5-(4-фторфенил)- Δ^3 -дигидрофуранона-(2)) также описан в DE-A-4014420. Опубликованы соединения аналогичной структуры без указания инсектицидного и/или акарицидного действия (Campbell и др., J. Chem. Soc., Perkin Trans. 1, 1985, (8) 1567-76). Далее известны производные 3-арил- Δ^3 -дигидрофуранона, которые обладают гербицидными, акарицидными и инсектицидными свойствами из следующих публикаций: EP-A-528156, EP-A-0647637, WO 95/26345, WO 96/20196, WO 96/25395, WO 96/35664, WO 97/01535, WO 97/02243, WO 97/36868, WO 98/05638, WO 98/25928, WO 99/16748, WO 99/43649, WO 99/48869, WO 99/55673, WO 01/17972, WO 01/23354, WO 01/74770, WO 03/013249, WO 2004/024688, WO 04/080962, WO 04/111042, WO 05/092897 и DE-A-04030753.

Гербицидное, и/или акарицидное, и/или инсектицидное действие и/или широта действия, и/или переносимость растениями известных соединений, в особенности культурными растениями, однако, не всегда достаточны.

Были открыты новые соединения формулы (I)



где W означает водород, алкил, алкенил, алкинил, галоид, алкокси-, алкенилокси- или галоидалкил, галоидалкокси- или цианогруппу;

X означает галоид, алкил, алкенил, алкинил, алкокси-, алкенилокси-, алкилтиогруппу, алкилсульфинил, алкилсульфонил, галоидалкил, галоидалкокси-, галоидалкенилокси-, нитро- или цианогруппу;

Y и Z независимо один от другого означают водород, алкил, алкенил, алкинил, алкоксигруппу, галоид, галоидалкил, галоидалкокси-, циано-, нитрогруппу или незамещенные или замещенные арил или гетарил,

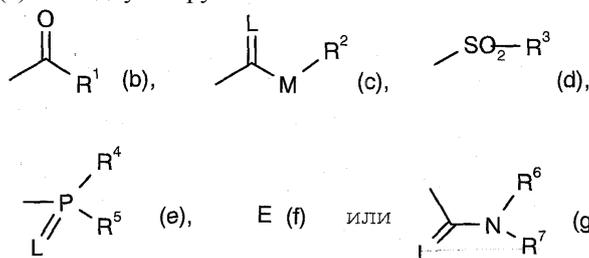
при условии, что как минимум один из радикалов W или Z не является водородом, когда X и Y означают метил;

A и B и атом углерода, к которому они присоединены, означают 5-7-членные кеталь, тиокеталь или дитиокеталь, которые могут содержать дополнительно еще один гетероатом и которые не замещены или замещены алкилом, галоидалкилом, алкоксигруппой, алкоксиалкилом или не замещенным или замещенным фенилом;

D означает NH или кислород;

Q^1, Q^2 независимо один от другого означают водород, алкил, галоидалкил или алкоксигруппу;

G означает водород (a) или одну из групп



где E означает ион металла или ион аммония;

L означает кислород или серу;

M означает кислород или серу;

R^1 означает не замещенные или замещенные галоидом или цианогруппой алкил, алкенил, алкоксиалкил, алкилтиоалкил или полиалкоксиалкил, или означает не замещенные или замещенные галоидом, алкилом или алкоксигруппой циклоалкил или гетероциклил, или означает незамещенные или замещенные фенил, фенилалкил, гетарил, феноксиалкил или гетарилоксиалкил;

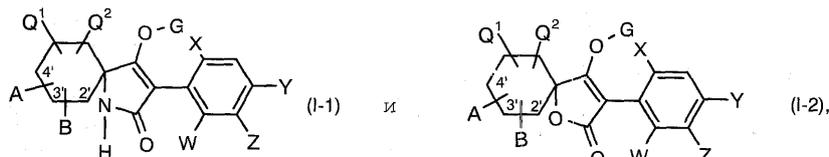
R^2 означает не замещенные или замещенные галоидом или цианогруппой алкил, алкенил, алкоксиалкил или полиалкоксиалкил или означает незамещенные или замещенные циклоалкил, фенил или бензил;

R^3, R^4 и R^5 независимо один от другого означают не замещенные или замещенные галоидом алкил, алкокси-, алкиламино-, диалкиламино-, алкилтио-, алкенилтио- или циклоалкилтиогруппу или означают незамещенные или замещенные фенил, бензил, фенокси- или фенилтиогруппу;

R^6 и R^7 независимо один от другого означают водород, не замещенные или замещенные галоидом или цианогруппой алкил, циклоалкил, алкенил, алкоксигруппу, алкоксиалкил, не замещенные или замещенные фенил или бензил или вместе с N-атомом, к которому они присоединены, образуют незамещенный или замещенный цикл, который может содержать кислород или серу.

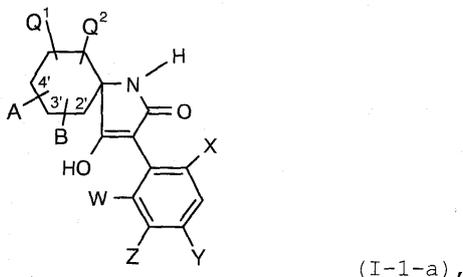
Соединения формулы (I) могут в зависимости от вида заместителей существовать в виде оптических изомеров или смесей изомеров в различных соотношениях, которые можно разделить обычными способами и методами. Как чистые изомеры, так и смеси изомеров, их получение и применение, а также содержащие их средства являются предметом данного изобретения. В дальнейшем для простоты речь будет идти только о соединениях формулы (I), хотя имеются в виду как чистые соединения, так при необходимости и смеси с различными долями изомерных соединений.

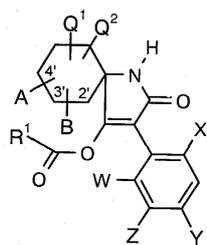
При включении значений D, означающего NH (1), и D, означающего O (2), получают следующие главные структуры (I-1)-(I-2):



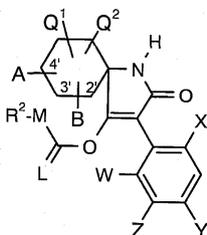
где A, B, G, Q^1, Q^2 , W, X, Y и Z имеют значения, приведенные выше.

При вовлечении различных значений (a), (b), (c), (d), (e), (f) и (g) для группы G получают следующие главные структуры (I-1-a)-(I-1-g), когда D означает NH (1)

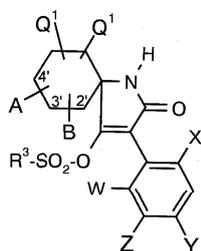




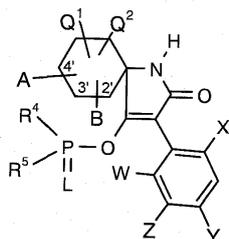
(I-1-b),



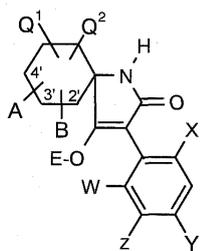
(I-1-c),



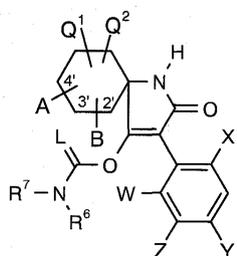
(I-1-d),



(I-1-e),



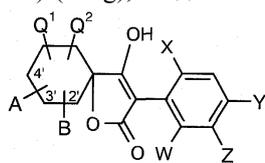
(I-1-f),



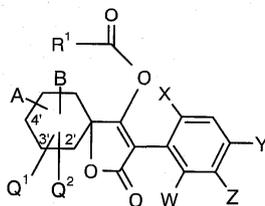
(I-1-g),

где A, B, E, L, M, Q¹, Q², W, X, Y, Z, R¹, R², R³, R⁴, R⁵, R⁶ и R⁷ имеют значения, приведенные выше.

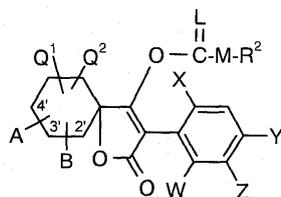
При вовлечении различных значений (a), (b), (c), (d), (e), (f) и (g) для группы G получаются следующие главные структуры (I-2-a)-(I-2-g), когда D означает O (2)



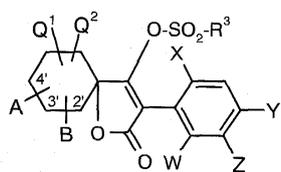
(I-2-a),



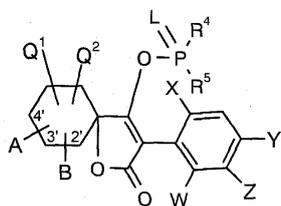
(I-2-b),



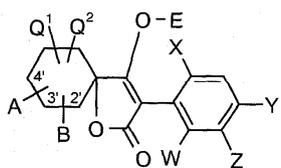
(I-2-c),



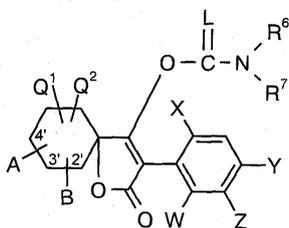
(I-2-d),



(I-2-e),



(I-2-f),

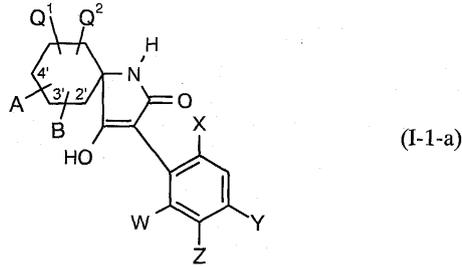


(I-2-g),

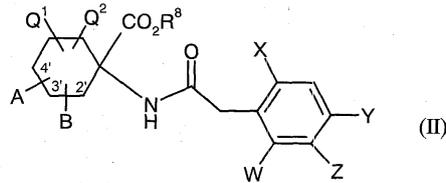
где A, B, E, L, M, Q¹, Q², W, X, Y, Z, R¹, R², R³, R⁴, R⁵, R⁶ и R⁷ имеют значения, приведенные выше.

Далее было открыто, что новые соединения формулы (I) могут быть получены способами, описанными ниже.

(A) Соединения формулы (I-1-a)

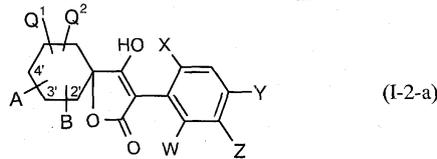


где A, B, Q¹, Q², W, X, Y и Z имеют значения, приведенные выше, получают, когда соединения формулы (II)

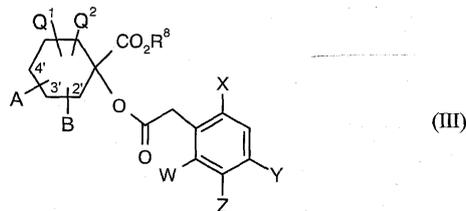


где A, B, Q¹, Q², W, X, Y и Z имеют значения, приведенные выше, и R⁸ означает алкил (предпочтительно (C₁-C₆)алкил), подвергают внутримолекулярной конденсации в присутствии разбавителя и в присутствии основания. Кроме того, было открыто, что:

(B) соединения формулы (I-2-a)



где A, B, Q¹, Q², W, X, Y и Z имеют значения, приведенные выше, получают, когда соединения формулы (III)



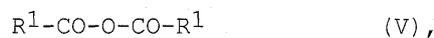
где A, B, Q¹, Q², W, X, Y, Z и R⁸ имеют значения, приведенные выше, подвергают внутримолекулярной конденсации в присутствии разбавителя и в присутствии основания;

(C) соединения приведенных выше формул (I-1-b)-(I-2-b), где R¹, A, B, Q¹, Q², W, X, Y и Z имеют значения, приведенные выше, получают, когда соединения приведенных выше формул (I-1-a)-(I-2-a), где A, B, Q¹, Q², W, X, Y и Z имеют значения, приведенные выше, в каждом случае подвергают взаимодействию

a) с соединениями формулы (IV)



где R¹ имеет значение, приведенное выше, и Hal означает галоид (предпочтительно хлор или бром) или
b) с ангидридами карбоновой кислоты формулы (V)



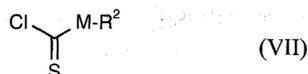
где R¹ имеет значение, приведенное выше, при необходимости в присутствии разбавителя и при необходимости в присутствии средства, связывающего кислоту;

(D) соединения приведенных выше формул (I-1-c)-(I-2-c), где R^2 , A, B, Q^1 , Q^2 , W, M, X, Y и Z имеют значения, приведенные выше, и L означает кислород, получают, когда соединения приведенных выше формул (I-1-a)-(I-2-a), где A, B, Q^1 , Q^2 , W, X, Y и Z имеют значения, приведенные выше, в каждом случае подвергают взаимодействию с эфирами или тиоэфирами хлормуравьиной кислоты формулы (VI)



где R^2 и M имеют значения, приведенные выше,
при необходимости в присутствии разбавителя и при необходимости в присутствии средства, связывающего кислоту;

(E) соединения приведенных выше формул (I-1-c)-(I-2-c), где R^2 , A, B, Q^1 , Q^2 , W, M, X, Y и Z имеют значения, приведенные выше, и L означает серу, получают, когда соединения приведенных выше формул (I-1-a)-(I-2-a), где A, B, Q^1 , Q^2 , W, X, Y и Z имеют значения, приведенные выше, в каждом случае подвергают взаимодействию с эфирами хлормонотиомуравьиной или хлордитиомуравьиной кислоты формулы (VII)



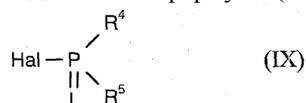
где M и R^2 имеют значения, приведенные выше,
при необходимости в присутствии разбавителя и при необходимости в присутствии средства, связывающего кислоту;

(F) соединения приведенных выше формул (I-1-d)-(I-2-d), где R^3 , A, B, W, Q^1 , Q^2 , X, Y и Z имеют значения, приведенные выше, получают, когда соединения приведенных выше формул (I-1-a)-(I-2-a), где A, B, Q^1 , Q^2 , W, X, Y и Z имеют значения, приведенные выше, в каждом случае подвергают взаимодействию с хлоридами сульфоновой кислоты формулы (VIII)



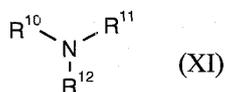
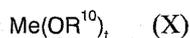
где R^3 имеет значение, приведенное выше,
при необходимости в присутствии разбавителя и при необходимости в присутствии средства, связывающего кислоту;

(G) соединения приведенных выше формул (I-1-e)-(I-2-e), где L, R^4 , R^5 , A, B, Q^1 , Q^2 , W, X, Y и Z имеют значения, приведенные выше, получают, когда соединения приведенных выше формул (I-1-a)-(I-2-a), где A, B, Q^1 , Q^2 , W, X, Y и Z имеют значения, приведенные выше, в каждом случае подвергают взаимодействию с фосфорными соединениями формулы (IX)



где L, R^4 и R^5 имеют значения, приведенные выше, и
Hal означает галоид (предпочтительно хлор или бром),
при необходимости в присутствии разбавителя и при необходимости в присутствии средства, связывающего кислоту;

(H) соединения приведенных выше формул (I-1-f)-(I-2-f), где E, A, B, Q^1 , Q^2 , W, X, Y и Z имеют значения, приведенные выше, получают, когда соединения формул (I-1-a)-(I-2-a), где A, B, Q^1 , Q^2 , W, X, Y и Z имеют значения, приведенные выше, в каждом случае подвергают взаимодействию с соединениями металлов или с аминами формул (X) или (XI)



где Me означает одно- или двухвалентный металл (предпочтительно щелочной или щелочноземельный металл, такой как литий, натрий, калий, магний или кальций);

t означает число 1 или 2 и

R^{10} , R^{11} , R^{12} независимо один от другого означают водород или алкил (предпочтительно (C_1-C_8) алкил),

при необходимости в присутствии разбавителя;

(I) соединения приведенных выше формул (I-1-g)-(I-2-g), где L, R^6 , R^7 , A, B, Q^1 , Q^2 , W, X, Y и Z имеют значения, приведенные выше, получают, когда соединения приведенных выше формул (I-1-a)-(I-2-a), где A, B, Q^1 , Q^2 , W, X, Y и Z имеют значения, приведенные выше, в каждом случае подвергают взаимодействию:

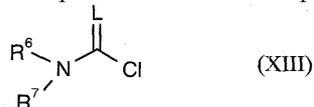
α) с изоцианатами или изотиоцианатами формулы (XII)



где R^6 и L имеют значения, приведенные выше,

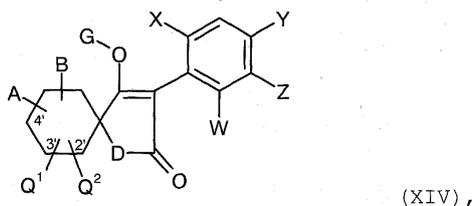
при необходимости в присутствии разбавителя и при необходимости в присутствии катализатора или

β) с хлоридами карбамидной или тиокарбамидной кислоты формулы (XIII)



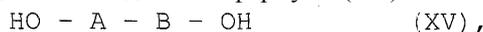
где L, R⁶ и R⁷ имеют значения, приведенные выше, при необходимости в присутствии разбавителя и при необходимости в присутствии средства, связывающего кислоту;

(J) соединения приведенных выше формул (I-1-a)-(I-1-g) и (I-2-a)-(I-2-g), где A, B, D, G, Q¹, Q², W, X, Y и Z имеют значения, приведенные выше, получают, когда соединения формулы (XIV)



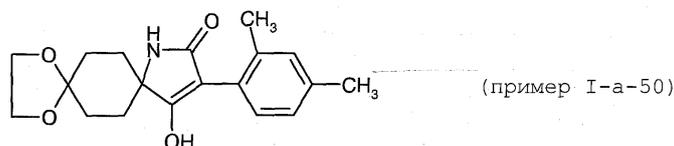
где D, G, Q¹, Q², W, X, Y и Z имеют значения, приведенные выше, и A, B и атом углерода, к которому они присоединены, означают группу $\text{C}=\text{O}$

подвергают, например, взаимодействию с диолами формулы (XV)



где A и B имеют значения, приведенные выше, при необходимости в присутствии разбавителя, в присутствии кислого катализатора в условиях обезвоживания.

Следующее соединение формулы (I-a) известно с 1994 года в рамках европейской патентной проверки по патенту EP 596298



Далее было открыто, что новые соединения формулы (I) проявляют хорошую активность в качестве средств для борьбы с вредителями, предпочтительно в качестве инсектицидов, и/или акарицидов, и/или фунгицидов, и/или гербицидов и, кроме того, часто очень хорошо переносятся растениями, особенно культурными растениями.

Неожиданно было открыто, что определенные замещенные циклические кетоенолы при совместном применении с описанными ниже соединениями, улучшающими переносимость гербицидов культурными растениями (защитные вещества/антидоты), очень хорошо препятствуют повреждению культурных растений и особенно предпочтительно могут быть использованы в виде комбинационных препаратов с широким действием для селективной борьбы с нежелательными растениями в культурах полезных растений, таких как, например, зерновые культуры, а также кукуруза, соя, рис.

Предметом данного изобретения являются также селективные гербицидные средства с эффективным содержанием комбинации биологически активных веществ, которые включают в качестве компонентов:

(a') как минимум, одно соединение формулы (I), где A, B, D, G, Q¹, Q², W, X, Y и Z имеют значения, приведенные выше, и

(b') как минимум, одно соединение, улучшающее переносимость гербицидов культурными растениями, из следующей группы соединений:

4-дихлорацетил-1-окса-4-азаспиро[4,5]декан (AD-67, MON-4660),

1-дихлорацетилгексагидро-3,3,8a-триметилпирроло[1,2-a]пиримидин-6(2H)-он (дициклонон, BAS-145138),

4-дихлорацетил-3,4-дигидро-3-метил-2H-1,4-бензоксазин (беноксакор),

1-метилгексильный эфир 5-хлорхинолин-8-оксиуксусной кислоты (клоквинтоцет-мексил - см. также родственные соединения в EP-A-86750, EP-A-94349, EP-A-191736, EP-A-492366),

3-(2-хлорбензил)-1-(1-метил-1-фенилэтил)мочевина (кумилурон),

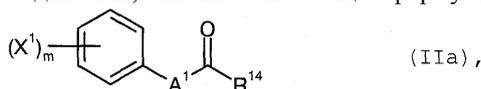
α-(цианометоксимино)фенилацетонитрил (циометринил),

2,4-дихлорфеноксиуксусная кислота (2,4-D),

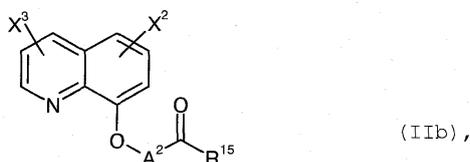
4-(2,4-дихлорфенокси)масляная кислота (2,4-DB),

1-(1-метил-1-фенилэтил)-3-(4-метилфенил)мочевина (даймурон, димрон),
 3,6-дихлор-2-метоксибензойная кислота (дикамба),
 S-1-метил-1-фенилэтиловый эфир пиперидин-1-тиокарбоновой кислоты (димепиперат),
 2,2-дихлор-N-(2-оксо-2-(2-пропениламино)этил)-N-(2-пропенил)ацетамид (ДКА-24),
 2,2-дихлор-N,N-ди-2-пропенилацетамид (дихлормид),
 4,6-дихлор-2-фенилпиримидин (фенклорим),
 этиловый эфир 1-(2,4-дихлорфенил)-5-трихлор-метил-1Н-1,2,4-триазол-3-карбоновой кислоты
 (фенхлоразол-этил - см. также родственные соединения в EP-A-174562 и EP-A-346620),
 фенилметиловый эфир 2-хлор-4-трифторметилтиазол-5-карбоновой кислоты (флуразол),
 4-хлор-N-(1,3-диоксолан-2-илметокси)-α-трифторацетофеноноксим (флюксофеним),
 3-дихлор-ацетил-5-(2-фуранил)-2,2-диметилноксазолидин (фурилазол, MON-13900),
 этил-4,5-дигидро-5,5-дифенил-3-изоксазолкарбоксилат (изоксадифен-этил - см. также родственные
 соединения в WO 95/07897),
 1-(этоксикарбонил)этил-3,6-дихлор-2-метоксибензоат (лактидихлор),
 (4-хлор-о-толилокси)уксусная кислота (MCPA),
 2-(4-хлор-о-толилокси)пропионовая кислота (мекопроп),
 диэтил-1-(2,4-дихлорфенил)-4,5-дигидро-5-метил-1Н-пиразол-3,5-дикарбоксилат (мефенпир-диэтил -
 см. также родственные соединения в WO 91/07874),
 2-дихлорметил-2-метил-1,3-диоксолан (MG-191),
 2-пропенил-1-окса-4-азаспиро[4,5]декан-4-карбодитиоат (MG-838),
 ангидрид 1,8-нафталевой кислоты,
 α-(1,3-диоксолан-2-илметоксимино)фенилацетонитрил (оксабетринил),
 2,2-дихлор-N-(1,3-диоксолан-2-илметил)-N-(2-пропенил)ацетамид (PPG-1292),
 3-дихлорацетил-2,2-диметилноксазолидин (R-28725),
 3-дихлорацетил-2,2,5-триметилноксазолидин (R-29148),
 4-(4-хлор-о-толил)масляная кислота,
 4-(4-хлорфеноксид)масляная кислота,
 дифенилметоксиуксусная кислота,
 метиловый эфир дифенилметоксиуксусной кислоты,
 этиловый эфир дифенилметоксиуксусной кислоты,
 метиловый эфир 1-(2-хлорфенил)-5-фенил-1Н-пиразол-3-карбоновой кислоты,
 этиловый эфир 1-(2,4-дихлорфенил)-5-метил-1Н-пиразол-3-карбоновой кислоты,
 этиловый эфир 1-(2,4-дихлорфенил)-5-изопропил-1Н-пиразол-3-карбоновой кислоты,
 этиловый эфир 1-(2,4-дихлорфенил)-5-(1,1-диметилэтил)-1Н-пиразол-3-карбоновой кислоты,
 этиловый эфир 1-(2,4-дихлорфенил)-5-фенил-1Н-пиразол-3-карбоновой кислоты (см. также родст-
 венные соединения в EP-A-269806 и EP-A-333131),
 этиловый эфир 5-(2,4-дихлорбензил)-2-изоксазолин-3-карбоновой кислоты,
 этиловый эфир 5-фенил-2-изоксазолин-3-карбоновой кислоты,
 этиловый эфир 5-(4-фторфенил)-5-фенил-2-изоксазолин-3-карбоновой кислоты (см. также родст-
 венные соединения в WO-A-91/08202),
 1,3-диметилбут-1-иловый эфир 5-хлорхинолин-8-оксиуксусной кислоты,
 4-аллилоксибутиловый эфир 5-хлорхинолин-8-оксиуксусной кислоты,
 1-аллилоксипроп-2-иловый эфир 5-хлорхинолин-8-оксиуксусной кислоты,
 метиловый эфир 5-хлорхиноксалин-8-оксиуксусной кислоты,
 этиловый эфир 5-хлорхинолин-8-оксиуксусной кислоты,
 аллиловый эфир 5-хлорхиноксалин-8-оксиуксусной кислоты,
 2-оксопроп-1-иловый эфир 5-хлорхинолин-8-оксиуксусной кислоты,
 диэтиловый эфир 5-хлорхинолин-8-оксималоновой кислоты,
 диаллиловый эфир 5-хлорхиноксалин-8-оксималоновой кислоты,
 диэтиловый эфир 5-хлорхинолин-8-оксималоновой кислоты (см. также родственные соединения в
 EP-A-582198),
 4-карбоксихроман-4-илуксусная кислота (AC-304415, см. EP-A-613618),
 4-хлорфеноксидуксусная кислота,
 3,3'-диметил-4-метоксибензофенон,
 1-бром-4-хлор-метилсульфонилбензол,
 1-[4-(N-2-метоксибензоилсульфамоил)фенил]-3-метилмочевина (т.е. N-(2-метоксибензоил)-4-
 [(метиламинокарбонил)амино]бензолсульфонамид),
 1-[4-(N-2-метоксибензоилсульфамоил)фенил]-3,3-диметилмочевина,
 1-[4-(N-4,5-диметилбензоилсульфамоил)фенил]-3-метилмочевина,
 1-[4-(N-нафтилсульфамоил)фенил]-3,3-диметилмочевина,
 N-(2-метокси-5-метилбензоил)-4-(циклопропиламинокарбонил)бензолсульфонамид,

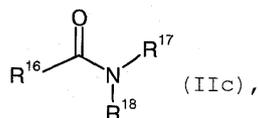
и/или одно из следующих соединений, описываемых общей формулой (IIa):



или общей формулой (IIb)

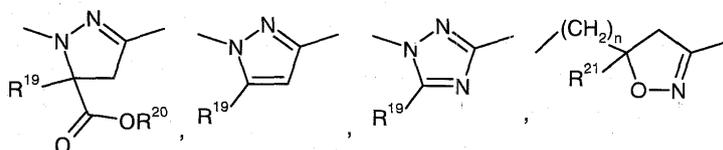


или формулой (IIc)



где m означает число 0, 1, 2, 3, 4 или 5;

A¹ означает одну из приведенных ниже двухвалентных гетероциклических групп



n означает число 0, 1, 2, 3, 4 или 5;

A² означает не замещенный или замещенный (C₁-C₄)алкилом, и/или (C₁-C₄)алкоксикарбонил, и/или (C₁-C₄)алкенилоксикарбонил алкандиол, содержащий 1 или 2 атома углерода;

R¹⁴ означает гидрокси-, меркапто-, amino-, (C₁-C₆)алкокси-, (C₁-C₆)алкилтио-, (C₁-C₆)алкиламино- или ди((C₁-C₄)алкил)аминогруппу;

R¹⁵ означает гидрокси-, меркапто-, amino-, (C₁-C₇)алкокси-, (C₁-C₆)алкилтио-, (C₁-C₆)алкенилокси-, (C₁-C₆)алкенилокси(C₁-C₆)алкокси-, (C₁-C₆)алкиламино- или ди((C₁-C₄)алкил)аминогруппу;

R¹⁶ означает не замещенный или замещенный фтором, хлором и/или бромом (C₁-C₄)алкил;

R¹⁷ означает водород, не замещенные или замещенные фтором, хлором и/или бромом (C₁-C₆)алкил, (C₂-C₆)алкенил или (C₂-C₆)алкинил, (C₁-C₄)алкокси(C₁-C₄)алкил, диоксоланил(C₁-C₄)алкил, фурил, фурил(C₁-C₄)алкил, тиенил, тиазолил, пиперидинил или не замещенный или замещенный фтором, хлором и/или бромом или (C₁-C₄)алкилом фенил;

R¹⁸ означает водород, не замещенные или замещенные фтором, хлором и/или бромом (C₁-C₆)алкил, (C₂-C₆)алкенил или (C₂-C₆)алкинил, (C₁-C₄)алкокси(C₁-C₄)алкил, диоксоланил(C₁-C₄)алкил, фурил, фурил(C₁-C₄)алкил, тиенил, тиазолил, пиперидинил или не замещенный или замещенный фтором, хлором и/или бромом или (C₁-C₄)алкилом фенил или

R¹⁷ и R¹⁸ также вместе означают (C₃-C₆)алкандиол или (C₂-C₅)оксаалкандиол, которые не замещены или замещены (C₁-C₄)алкилом, фенилом, фурилом, аннелированным бензольным кольцом или двумя заместителями, которые вместе с C-атомом, к которому они присоединены, образуют 5- или 6-членный карбоцикл;

R¹⁹ означает водород, цианогруппу, галоид или означает не замещенные или замещенные фтором, хлором и/или бромом (C₁-C₄)алкил, (C₃-C₆)циклоалкил или фенил;

R²⁰ означает водород, не замещенные или замещенные гидрокси-, цианогруппой, галоидом или (C₁-C₄)алкоксигруппой (C₁-C₆)алкил, (C₃-C₆)циклоалкил или три((C₁-C₄)алкил)силил;

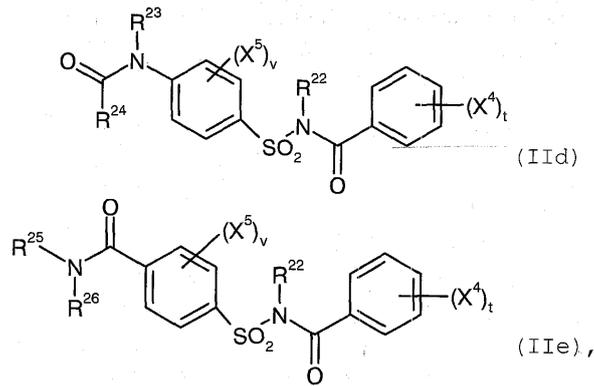
R²¹ означает водород, цианогруппу, галоид или означает не замещенные или замещенные фтором, хлором и/или бромом (C₁-C₄)алкил, (C₃-C₆)циклоалкил или фенил;

X¹ означает нитро-, цианогруппу, галоид, (C₁-C₄)алкил, (C₁-C₄)галоидалкил, (C₁-C₄)алкокси или (C₁-C₄)галоидалкоксигруппу;

X² означает водород, циано-, нитрогруппу, галоид, (C₁-C₄)алкил, (C₁-C₄)галоидалкил, (C₁-C₄)алкокси- или (C₁-C₄)галоидалкоксигруппу;

X³ означает водород, циано-, нитрогруппу, галоид, (C₁-C₄)алкил, (C₁-C₄)галоидалкил, (C₁-C₄)алкокси- или (C₁-C₄)галоидалкоксигруппу;

и/или следующие соединения, описываемые общей формулой (IId) или общей формулой (IIe)



где t означает число 0, 1, 2, 3, 4 или 5;

v означает число 0, 1, 2, 3, 4 или 5;

R^{22} означает водород или (C_1-C_4) алкил;

R^{23} означает водород или (C_1-C_4) алкил;

R^{24} означает водород, не замещенные или замещенные цианогруппой, галоидом или (C_1-C_4) алкоксигруппой (C_1-C_6) алкил, (C_1-C_6) алкокси-, (C_1-C_6) алкилтио-, (C_1-C_6) алкиламино- или ди $((C_1-C_4)$ алкил)аминогруппу или не замещенные или замещенные цианогруппой, галоидом или (C_1-C_4) алкилом (C_3-C_6) циклоалкил, (C_3-C_6) циклоалкилокси-, (C_3-C_6) циклоалкилтио- или (C_3-C_6) циклоалкиламиногруппу;

R^{25} означает водород, не замещенный или замещенный циано-, гидроксигруппой, галоидом или (C_1-C_4) алкоксигруппой (C_1-C_6) алкил, не замещенные или замещенные цианогруппой или галоидом (C_3-C_6) алкенил или (C_3-C_6) алкинил или не замещенный или замещенный цианогруппой, галоидом или (C_1-C_4) алкилом (C_3-C_6) циклоалкил;

R^{26} означает водород, не замещенный или замещенный циано-, гидроксигруппой, галоидом или (C_1-C_4) алкоксигруппой (C_1-C_6) алкил, не замещенные или замещенные цианогруппой или галоидом (C_3-C_6) алкенил или (C_3-C_6) алкинил, не замещенный или замещенный цианогруппой, галоидом или (C_1-C_4) алкилом (C_3-C_6) циклоалкил или означает не замещенный или замещенный нитро-, цианогруппой, галоидом, (C_1-C_4) алкилом, (C_1-C_4) галоидалкилом, (C_1-C_4) алкокси- или (C_1-C_4) галоидалкоксигруппой фенил или вместе с R^{25} означают не замещенные или замещенные (C_1-C_4) алкилом (C_2-C_6) алкандиил или (C_2-C_5) оксаалкандиил;

X^4 означает нитро-, циано-, карбоксигруппу, карбамоил, формил, сульфамойл, гидрокси-, аминогруппу, галоид, (C_1-C_4) алкил, (C_1-C_4) галоидалкил, (C_1-C_4) алкокси- или (C_1-C_4) галоидалкоксигруппу и

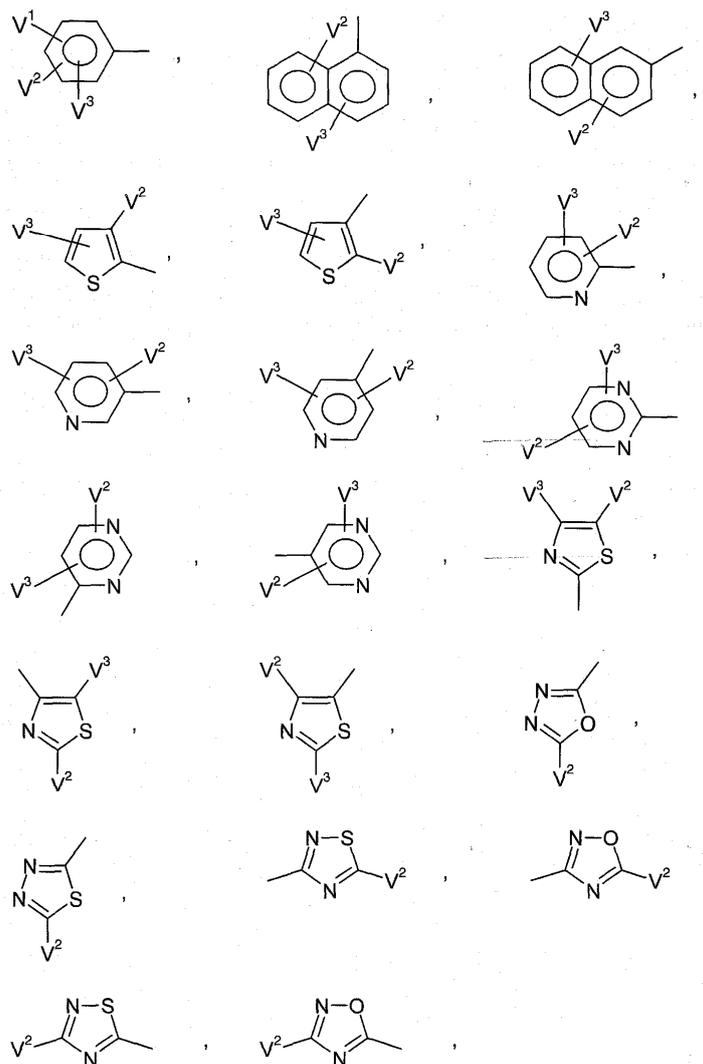
X^5 означает нитро-, циано-, карбоксигруппу, карбамоил, формил, сульфамойл, гидрокси-, аминогруппу, галоид, (C_1-C_4) алкил, (C_1-C_4) галоидалкил, (C_1-C_4) алкокси- или (C_1-C_4) галоидалкоксигруппу.

Соединения согласно данному изобретению описываются в общем виде формулой (I). Предпочтительные заместители, соответственно области значений заместителей, в формулах, которые приведены выше и будут приведены ниже, описаны ниже:

W предпочтительно означает водород, (C_1-C_6) алкил, (C_2-C_6) алкенил, (C_2-C_6) алкинил, галоид, (C_1-C_6) алкоксигруппу, (C_1-C_4) галоидалкил, (C_1-C_4) галоидалкокси- или цианогруппу;

X предпочтительно означает галоид, (C_1-C_6) алкил, (C_2-C_6) алкенил, (C_2-C_6) алкинил, (C_1-C_6) галоидалкил, (C_1-C_6) алкокси-, (C_3-C_6) алкенилокси-, (C_1-C_6) алкилтиогруппу, (C_1-C_6) алкилсульфинил, (C_1-C_6) алкилсульфонил, (C_1-C_6) галоидалкокси-, (C_3-C_6) галоидалкенилокси-, нитро- или цианогруппу;

Y и Z независимо один от другого предпочтительно означают водород, галоид, (C_1-C_6) алкил, (C_2-C_6) алкенил, (C_2-C_6) алкинил, (C_1-C_6) алкоксигруппу, (C_1-C_6) галоидалкил, (C_1-C_6) галоидалкокси-, цианогруппу, (C_2-C_6) алкенил, (C_2-C_6) алкинил или означают один из (гет)арилловых радикалов



причем в случае (гет)арильных радикалов только один из радикалов Y или Z может означать (гет)арил;

V¹ предпочтительно означает водород, галоген, (C₁-C₁₂)алкил, (C₁-C₆)алкокси-, (C₁-C₆)алкилтио-группу, (C₁-C₆)алкилсульфинил, (C₁-C₆)алкилсульфонил, (C₁-C₄)галоидалкил, (C₁-C₄)галоидалкокси-, нитро-, цианогруппу или не замещенные или замещенные однократно или многократно галогеном, (C₁-C₆)алкилом, (C₁-C₆)алкоксигруппой, (C₁-C₄)галоидалкилом, (C₁-C₄)галоидалкокси-, нитро- или цианогруппой фенил, феноксигруппу, фенокси(C₁-C₄)алкил, фенил(C₁-C₄)алкоксигруппу, фенилтио(C₁-C₄)алкил или фенил(C₁-C₄)алкилтиогруппу;

V² и V³ независимо один от другого предпочтительно означают водород, галоген, (C₁-C₆)алкил, (C₁-C₆)алкоксигруппу, (C₁-C₄)галоидалкил или (C₁-C₄)галоидалкоксигруппу,

при условии, что по крайней мере один из радикалов W или Z не означает водород, когда X и Y означают метил;

A и B и атом углерода, к которому они присоединены, предпочтительно означают не замещенные или замещенные от однократно до четырехкратно (C₁-C₆)алкилом, (C₁-C₄)галоидалкилом, (C₁-C₆)алкоксигруппой или (C₁-C₄)алкокси(C₁-C₄)алкилом 5-7-членные кетали, тиокетали или дитиокетали, которые могут содержать другой атом кислорода, серы или группу λ_{N-V^1} ;

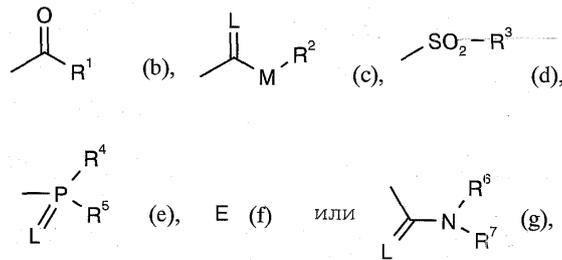
V⁴ предпочтительно означает водород, (C₁-C₆)алкил, (C₃-C₆)алкенил или одну из групп -CO-V⁵, -CO₂V⁵, CO-NH-V⁵ или CO-NH-O-V⁵;

V⁵ предпочтительно означает (C₁-C₆)алкил;

D предпочтительно означает NH (1) или кислород (2);

Q¹ и Q² независимо один от другого предпочтительно означают водород, (C₁-C₆)алкил, (C₁-C₂)галоидалкил или (C₁-C₄)алкоксигруппу;

G предпочтительно означает водород (a) или означает одну из групп



где E означает ион металла или ион аммония;

L означает кислород или серу и

M означает кислород или серу;

R¹ предпочтительно

означает не замещенные или замещенные галоидом или цианогруппой (C₁-C₂₀)алкил, (C₂-C₂₀)алкенил, (C₁-C₈)алкокси(C₁-C₈)алкил, (C₁-C₈)алкилтио(C₁-C₈)алкил или поли(C₁-C₈)алкокси(C₁-C₈)алкил или означает не замещенный или замещенный галоидом, (C₁-C₆)алкилом или (C₁-C₆)алкоксигруппой (C₃-C₈)циклоалкил, у которого при необходимости одна или две не соседние метиленовые группы заменены на кислород и/или серу,

означает не замещенный или замещенный галоидом, циано-, нитрогруппой, (C₁-C₆)алкилом, (C₁-C₆)алкоксигруппой, (C₁-C₆)галоидалкилом, (C₁-C₆)галоидалкокси-, (C₁-C₆)алкилтиогруппой или (C₁-C₆)алкилсульфонилем фенил,

означает не замещенный или замещенный галоидом, нитро-, цианогруппой, (C₁-C₆)алкилом, (C₁-C₆)алкоксигруппой, (C₁-C₆)галоидалкилом или (C₁-C₆)галоидалкоксигруппой фенил(C₁-C₆)алкил,

означает не замещенный или замещенный галоидом или (C₁-C₆)алкилом 5- или 6-членный гетарил, содержащий один или два гетероатома из ряда, который включает кислород, серу и азот,

означает не замещенный или замещенный галоидом или (C₁-C₆)алкилом фенокси(C₁-C₆)алкил или

означает не замещенный или замещенный галоидом, аминогруппой или (C₁-C₆)алкилом 5- или 6-членный гетарилокси(C₁-C₆)алкил, содержащий один или два гетероатома из ряда, который включает кислород, серу и азот;

R² предпочтительно

означает не замещенные или замещенные галоидом или цианогруппой (C₁-C₂₀)алкил, (C₂-C₂₀)алкенил, (C₁-C₈)алкокси(C₂-C₈)алкил или поли(C₁-C₈)алкокси(C₂-C₈)алкил,

означает не замещенный или замещенный галоидом, (C₁-C₆)алкилом или (C₁-C₆)алкоксигруппой (C₃-C₈)циклоалкил или

означает не замещенные или замещенные галоидом, циано-, нитрогруппой, (C₁-C₆)алкилом, (C₁-C₆)алкоксигруппой, (C₁-C₆)галоидалкилом или (C₁-C₆)галоидалкоксигруппой фенил или бензил;

R³ предпочтительно означает не замещенный или замещенный галоидом (C₁-C₈)алкил или не замещенные или замещенные галоидом, (C₁-C₆)алкилом, (C₁-C₆)алкоксигруппой, (C₁-C₄)галоидалкилом, (C₁-C₄)галоидалкокси-, циано- или нитрогруппой фенил или бензил;

R⁴ и R⁵ независимо один от другого предпочтительно означают не замещенные или замещенные галоидом (C₁-C₈)алкил, (C₁-C₈)алкокси-, (C₁-C₈)алкиламино-, ди((C₁-C₈)алкил)амино-, (C₁-C₈)алкилтио- или (C₃-C₈)алкенилтиогруппу или означают не замещенные или замещенные галоидом, нитро-, циано-, (C₁-C₄)алкокси-, (C₁-C₄)галоидалкокси-, (C₁-C₄)алкилтио-, (C₁-C₄)галоидалкилтиогруппой, (C₁-C₄)алкилом или (C₁-C₄)галоидалкилом фенил, фенокси- или фенилтиогруппу;

R⁶ и R⁷ независимо один от другого предпочтительно означают водород, не замещенные или замещенные галоидом или цианогруппой (C₁-C₈)алкил, (C₃-C₈)циклоалкил, (C₁-C₈)алкоксигруппу, (C₃-C₈)алкенил или (C₁-C₈)алкокси(C₂-C₈)алкил, означают не замещенные или замещенные галоидом, (C₁-C₈)алкилом, (C₁-C₈)галоидалкилом или (C₁-C₈)алкоксигруппой фенил или бензил или вместе означают не замещенный или замещенный (C₁-C₆)алкилом (C₃-C₆)алкиленовый радикал, в котором при необходимости одна метиленовая группа заменена кислородом или серой.

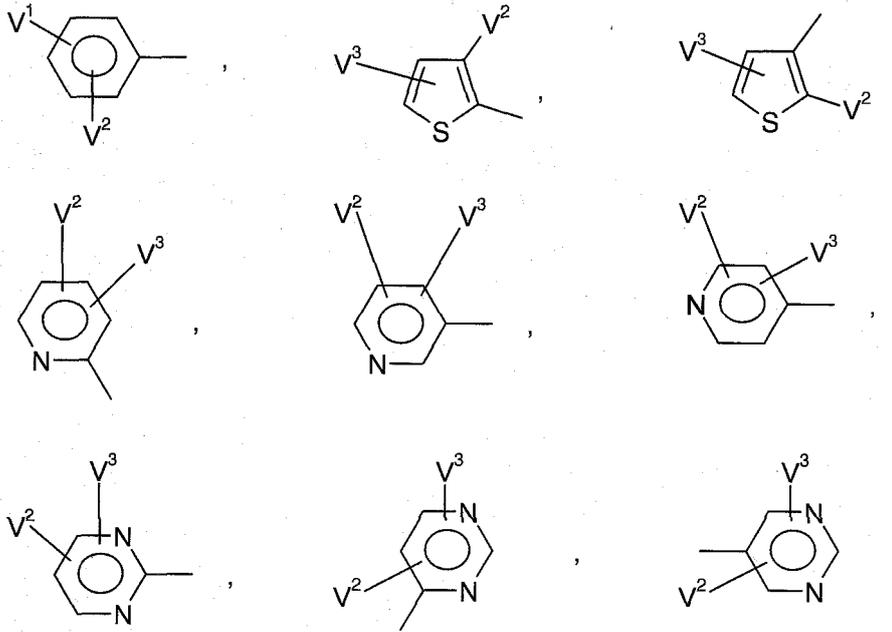
В значениях радикалов, названных в качестве предпочтительных

галоид предпочтительно означает фтор, хлор, бром и йод, более предпочтительно означает фтор, хлор и бром;

W более предпочтительно означает водород, хлор, бром, (C₁-C₄)алкил, (C₂-C₄)алкенил, (C₂-C₄)алкинил, (C₁-C₄)алкоксигруппу, (C₁-C₂)галоидалкил или (C₁-C₂)галоидалкоксигруппу;

X более предпочтительно означает хлор, бром, (C₁-C₄)алкил, (C₂-C₄)алкенил, (C₂-C₄)алкинил, (C₁-C₄)алкоксигруппу, (C₁-C₄)галоидалкил, (C₁-C₄)галоидалкокси- или цианогруппу;

Y и Z независимо один от другого более предпочтительно означают водород, фтор, хлор, бром, (C₁-C₄)алкил, (C₂-C₄)алкенил, (C₂-C₄)алкинил, (C₁-C₆)алкоксигруппу, (C₁-C₄)галоидалкил, (C₁-C₄)галоидалкокси-, цианогруппу, (C₂-C₄)алкенил, (C₂-C₄)алкинил или один из (гет)арильных радикалов:



причем в случае (гет)ариллов только один из радикалов Y или Z может означать (гет)арил;

V¹ более предпочтительно означает водород, фтор, хлор, бром, (C₁-C₆)алкил, (C₁-C₄)алкоксигруппу, (C₁-C₂)галоидалкил, (C₁-C₂)галоидалкокси-, нитро-, цианогруппу или не замещенный или замещенный однократно или двукратно фтором, хлором, бромом, (C₁-C₄)алкилом, (C₁-C₄)алкоксигруппой, (C₁-C₂)галоидалкилом, (C₁-C₂)галоидалкокси-, нитро- или цианогруппой фенил;

V² и V³ независимо один от другого более предпочтительно означают водород, фтор, хлор, бром, (C₁-C₄)алкил, (C₁-C₄)алкоксигруппу, (C₁-C₂)галоидалкил или (C₁-C₂)галоидалкоксигруппу,

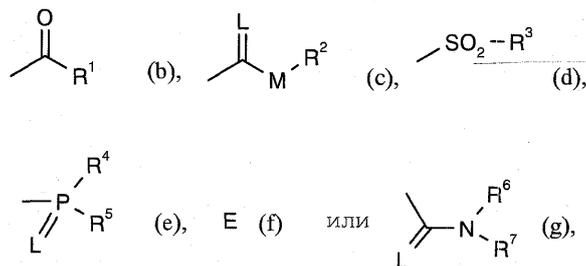
при условии, что по крайней мере один из радикалов W или Z не должен означать водород, когда X и Y означают метил;

A и B и атом углерода, к которому они присоединены, более предпочтительно означают не замещенный или замещенный от однократно до трехкратно (C₁-C₄)алкилом, (C₁-C₃)галоидалкилом, (C₁-C₄)алкоксигруппой или (C₁-C₄)алкокси(C₁-C₂)алкилом 5-, 6- или 7-членный кеталь, который может содержать еще один атом кислорода;

D более предпочтительно означает NH (1) или кислород (2);

Q¹ и Q² независимо один от другого более предпочтительно означают водород, метил, этил, трифторметил, метокси- или этокси-группу;

G более предпочтительно означает водород (a) или означает одну из групп



где E означает ион металла или ион аммония;

L означает кислород или серу;

M означает кислород или серу;

R¹ более предпочтительно

означает не замещенные или замещенные от однократно до трехкратно фтором или хлором (C₁-C₁₆)алкил, (C₂-C₁₆)алкенил, (C₁-C₆)алкокси(C₁-C₄)алкил, (C₁-C₆)алкилтио(C₁-C₄)алкил или поли(C₁-C₆)алкокси(C₁-C₄)алкил или означает не замещенный или замещенный однократно или двукратно фтором, хлором, (C₁-C₃)алкилом или (C₁-C₅)алкоксигруппой (C₃-C₇)циклоалкил, у которого одна или две несоседние метиленовые группы могут быть заменены кислородом и/или серой,

означает не замещенный или замещенный от однократно до трехкратно фтором, хлором, бромом, циано-, нитрогруппой, (C₁-C₄)алкилом, (C₁-C₄)алкоксигруппой, (C₁-C₃)галоидалкилом, (C₁-C₃)галоидалкокси-, (C₁-C₄)алкилтиогруппой или (C₁-C₄)алкилсульфонилем фенил,

означает не замещенный или замещенный однократно или двукратно фтором, хлором, бромом,

(C₁-C₄)алкилом, (C₁-C₄)алкоксигруппой, (C₁-C₃)галоидалкилом или (C₁-C₃)галоидалкоксигруппой фенол(C₁-C₄)алкил,

означает не замещенные или замещенные однократно или двукратно фтором, хлором, бромом или (C₁-C₄)алкилом пиразолил, тиазолил, пиридил, пиримидил, фуранил или тиенил,

означает не замещенный или замещенный однократно или двукратно фтором, хлором, бромом или (C₁-C₄)алкилом фенокси(C₁-C₅)алкил или

означает не замещенные или замещенные однократно или двукратно фтором, хлором, бромом, аминогруппой или (C₁-C₄)алкилом пиридилокси(C₁-C₅)алкил, пиримидилокси(C₁-C₅)алкил или тиазолилокси(C₁-C₅)алкил;

R² более предпочтительно

означает не замещенные или замещенные от однократно до трехкратно фтором или хлором (C₁-C₁₆)алкил, (C₂-C₁₆)алкенил, (C₁-C₆)алкокси(C₂-C₆)алкил или поли(C₁-C₆)алкокси(C₂-C₆)алкил,

означает не замещенный или замещенный однократно или двукратно фтором, хлором, (C₁-C₄)алкилом или (C₁-C₄)алкоксигруппой (C₃-C₇)циклоалкил или

означает не замещенные или замещенные от однократно до трехкратно фтором, хлором, бромом, циано-, нитрогруппой, (C₁-C₄)алкилом, (C₁-C₃)алкоксигруппой, (C₁-C₃)галоидалкилом или (C₁-C₃)галоидалкоксигруппой фенол или бензил;

R³ более предпочтительно означает не замещенный или замещенный от однократно до трехкратно фтором или хлором (C₁-C₆)алкил или означает не замещенные или замещенные однократно или двукратно фтором, хлором, бромом, (C₁-C₄)алкилом, (C₁-C₄)алкокси-, (C₁-C₂)галоидалкоксигруппой, (C₁-C₂)галоидалкилом, циано- или нитрогруппой фенол или бензил;

R⁴ и R⁵ независимо один от другого более предпочтительно означают не замещенные или замещенные от однократно до трехкратно фтором или хлором (C₁-C₆)алкил, (C₁-C₆)алкокси-, (C₁-C₆)алкиламино-, ди((C₁-C₆)алкил)амино-, (C₁-C₆)алкилтио- или (C₃-C₄)алкенилтиогруппу или означают не замещенные или замещенные однократно или двукратно фтором, хлором, бромом, нитро-, циано-, (C₁-C₃)алкокси-, (C₁-C₃)галоидалкокси-, (C₁-C₃)алкилтио-, (C₁-C₃)галоидалкилтиогруппой, (C₁-C₃)алкилом или (C₁-C₃)галоидалкилом фенол, фенокси- или фенилтиогруппу;

R⁶ и R⁷ независимо один от другого более предпочтительно означают водород, означают не замещенные или замещенные от однократно до трехкратно фтором или хлором (C₁-C₆)алкил, (C₃-C₆)циклоалкил, (C₁-C₆)алкоксигруппу, (C₃-C₆)алкенил или (C₁-C₆)алкокси(C₂-C₆)алкил, означают не замещенные или замещенные от однократно до трехкратно фтором, хлором, бромом, (C₁-C₃)галоидалкилом, (C₁-C₃)алкилом или (C₁-C₅)алкоксигруппой фенол или бензил или вместе означают не замещенный или замещенный (C₁-C₄)алкилом (C₃-C₆)алкиленовый радикал, в котором при необходимости одна метиленовая группа заменена кислородом или серой.

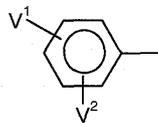
В значениях радикалов, названных в качестве более предпочтительных

галоид предпочтительно означает фтор, хлор и бром, более предпочтительно означает фтор и хлор;

W еще более предпочтительно означает водород, хлор, бром, метил, этил, винил, этинил, пропинил, метокси-, этоксигруппу или трифторметил;

X еще более предпочтительно означает хлор, бром, метил, этил, пропил, изопропил, винил, этинил, пропинил, метокси-, этоксигруппу, трифторметил, дифторметокси-, трифторметокси- или цианогруппу;

Y и Z независимо один от другого еще более предпочтительно означают водород, фтор, хлор, бром, метил, этил, винил, этинил, пропинил, метоксигруппу, трифторметил, трифторметокси-, цианогруппу или фенильный радикал



причем в случае фенила только один из радикалов Y или Z может означать фенил;

V¹ еще более предпочтительно означает водород, фтор, хлор, бром, метил, этил, н-пропил, изопропил, трет-бутил, метокси-, этокси-, н-пропокси-, изопропоксигруппу, трифторметил или трифторметоксигруппу;

V² еще более предпочтительно означает водород, фтор, хлор, метил, этил, н-пропил, изопропил, метокси-, этоксигруппу или трифторметил,

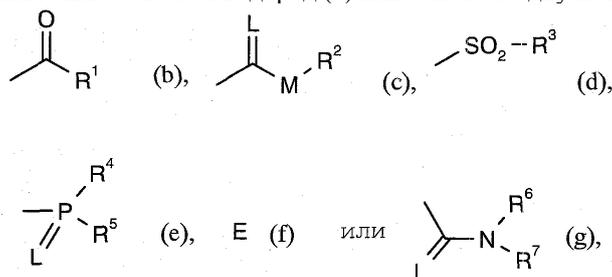
при условии, что по крайней мере один из радикалов W или Z не должен означать водород, когда X и Y означают метил,

A и B в атом углерода, к которому они присоединены, еще более предпочтительно означают не замещенный или замещенный однократно или двукратно метилом, этилом, пропилом, трифторметилом, монохлорметилом, метокси-, этоксигруппой, метоксиметилом или этоксиметилом 5-, 6- или 7-членный кеталь, который может включать еще один атом кислорода,

D еще более предпочтительно означает NH (1) или кислород (2);

Q¹ и Q² еще более предпочтительно означают водород;

G еще более предпочтительно означает водород (а) или означает одну из групп



где E означает ион металла или ион аммония;

L означает кислород или серу;

M означает кислород или серу;

R¹ еще более предпочтительно

означает не замещенные или замещенные от однократно до трехкратно фтором или хлором (C₁-C₁₀)алкил, (C₂-C₁₀)алкенил, (C₁-C₄)алкокси(C₁-C₂)алкил, (C₁-C₄)алкилтио(C₁-C₂)алкил или означает не замещенный или замещенный однократно фтором, хлором, метилом, этилом или метоксигруппой (C₃-C₆)циклоалкил,

означает не замещенный или замещенный однократно или двукратно фтором, хлором, бромом, циано-, нитрогруппой, метилом, этилом, n-пропилом, изопропилом, метокси-, этоксигруппой, трифторметилом или трифторметоксигруппой фенил,

означает не замещенный или замещенный однократно хлором, бромом или метилом фуранил, тиенил или пиридил;

R² еще более предпочтительно

означает не замещенные или замещенные от однократно до трехкратно фтором или хлором (C₁-C₁₀)алкил, (C₂-C₁₀)алкенил или (C₁-C₄)алкокси(C₂-C₄)алкил,

означает циклопентил или циклогексил или

означает не замещенные или замещенные однократно или двукратно фтором, хлором, циано-, нитрогруппой, метилом, этилом, метоксигруппой, трифторметилом или трифторметоксигруппой фенил или бензил;

R³ еще более предпочтительно означает не замещенные или замещенные от однократно до трехкратно фтором или хлором метил, этил, пропил или изопропил или не замещенный или замещенный однократно фтором, хлором, бромом, метилом, этилом, изопропилом, трет-бутилом, метокси-, этокси-, изопропоксигруппой, трифторметилом, трифторметокси-, циано- или нитрогруппой фенил;

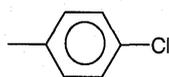
R⁴ и R⁵ независимо один от другого еще более предпочтительно означают (C₁-C₄)алкокси- или (C₁-C₄)алкилтиогруппу или означают не замещенные или замещенные однократно фтором, хлором, бромом, нитро-, цианогруппой, метилом, метоксигруппой, трифторметилом или трифторметоксигруппой фенил, фенокси- или фенилтиогруппу;

R⁶ и R⁷ независимо один от другого еще более предпочтительно означают водород, означают (C₁-C₄)алкил, (C₃-C₆)циклоалкил, (C₁-C₄)алкоксигруппу, (C₃-C₄)алкенил или (C₁-C₄)алкокси(C₂-C₄)алкил, означают не замещенный или замещенный однократно или двукратно фтором, хлором, бромом, метилом, метоксигруппой или трифторметилом фенил, или вместе означают (C₅-C₆)алкиленовый радикал, в котором при необходимости одна метиленовая группа заменена кислородом или серой;

W наиболее предпочтительно означает водород, хлор, бром, метил, этил или метоксигруппу;

X наиболее предпочтительно означает хлор, бром, метил, этил или метоксигруппу;

Y и Z независимо один от другого наиболее предпочтительно означают водород, хлор, бром, метил или означают радикал



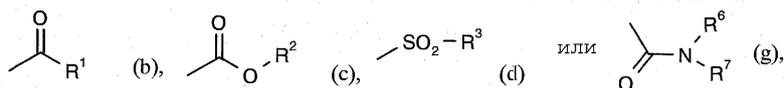
причем в этом случае только один из радикалов Y или Z может означать  при условии, что по крайней мере один из радикалов W или Z не должен означать водород, когда X и Y означают метил;

A и B и атом углерода, к которому они присоединены, наиболее предпочтительно означают не замещенный или замещенный однократно или двукратно метилом, этилом, пропилом, монохлорметилом или метоксиметилом 5- или 6-членный кеталь;

D наиболее предпочтительно означает NH (1) или кислород (2);

Q¹ и Q² наиболее предпочтительно означают водород;

G наиболее предпочтительно означает водород (а) или означает одну из групп



R^1 наиболее предпочтительно означает $(\text{C}_1\text{-C}_{10})$ алкил, $(\text{C}_1\text{-C}_4)$ алкокси $(\text{C}_1\text{-C}_2)$ алкил, $(\text{C}_3\text{-C}_6)$ цикло-алкил, означает не замещенный или замещенный однократно хлором фенил или означает тиенил;

R^2 наиболее предпочтительно означает $(\text{C}_1\text{-C}_{10})$ алкил, $(\text{C}_2\text{-}_{10})$ алкенил или означает бензил;

R^3 наиболее предпочтительно означает метил;

R^6 и R^7 наиболее предпочтительно вместе означают $(\text{C}_5\text{-C}_6)$ алкиленовый радикал, в котором при необходимости одна метиленовая группа заменена кислородом или серой.

Приведенные выше общие и предпочтительные области значений радикалов, соответственно пояснения, могут комбинироваться между собой, т.е. между любыми областями значений и областями предпочтительных значений любым образом. Они соответственно справедливы для конечных продуктов, а также для исходных и промежуточных продуктов.

Согласно изобретению предпочтительны соединения формулы (I), у которых имеет место комбинация значений радикалов, которые приведены выше в качестве предпочтительных значений.

Согласно изобретению более предпочтительны соединения формулы (I), у которых имеет место комбинация значений радикалов, которые приведены выше в качестве более предпочтительных значений.

Согласно изобретению еще более предпочтительны соединения формулы (I), у которых имеет место комбинация значений радикалов, которые приведены выше в качестве еще более предпочтительных значений.

Согласно изобретению наиболее предпочтительны соединения формулы (I), у которых имеет место комбинация значений радикалов, которые приведены выше в качестве наиболее предпочтительных значений.

Предпочтительны соединения формулы (I), у которых G означает водород.

В случае соединений формулы (I-1) предпочтительно фенильное кольцо, которое трехкратно замещено, причем предпочтительно 2,4,6-, 2,4,5- или 2,5,6-замещение. Кроме того, в случае соединений формулы (I-1) предпочтительно фенильное кольцо, которое четырехкратно замещено, причем предпочтительно 2,4,5,6-замещение. В случае соединений формулы (I-1) также предпочтительно фенильное кольцо, которое двукратно замещено (в 2,5-положении). В случае соединений формулы (I-1) также предпочтительно фенильное кольцо, которое однократно замещено (орто-положение). Другие заместители W, X, Y, Z, G, A, B, Q^1 и Q^2 имеют значения, указанные в тексте.

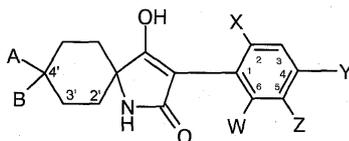
Кроме того, в случае соединений формулы (I-1), в которой фенильное кольцо замещено в 2,4-положении, предпочтителен заместитель G для группы (b), а также для группы (c), или (d), или (e), или (f), или (g). Более предпочтителен G в этом случае для групп (a), (b) или (c). Остальные заместители W, X, Y, Z, A, B, Q^1 и Q^2 имеют значения, приведенные в тексте. Далее, в случае соединений формулы (I-1), в которой фенильное кольцо замещено в 2,4-положении, предпочтительны заместители A и B в 3'-положении спироцикла. Далее, в случае соединений формулы (I-1), у которых фенильное кольцо замещено в 2,4-положении, предпочтительны заместители A и B в 4'-положении у спироцикла.

Насыщенные или ненасыщенные углеводородные радикалы, такие как алкил, алкандиил или алкенил, могут быть, так же и в случае радикалов, содержащих гетероатомы, таких как алкоксигруппа, в каждом случае линейными или разветвленными.

При необходимости замещенные радикалы, если особо не оговорено, могут быть замещены однократно или многократно, причем при многократном замещении заместители могут быть одинаковыми или различными.

По отдельности следует привести, кроме соединений, приведенных в примерах получения, следующие соединения формулы (I-1-a).

Таблица 1



(I-1-a)

| A-B | X | W | Y | Z |
|--|--------------------------------|--------------------------------|-------------------------------|---|
| -O-(CH ₂) ₂ -O- | CH ₃ | H | H | H |
| -O-(CH ₂) ₂ -O- | Br | H | H | H |
| -O-(CH ₂) ₂ -O- | Cl | H | H | H |
| -O-(CH ₂) ₂ -O- | CF ₃ | H | H | H |
| -O-(CH ₂) ₂ -O- | OCH ₃ | H | H | H |
| -O-(CH ₂) ₂ -O- | Br | H | Cl | H |
| -O-(CH ₂) ₂ -O- | Cl | H | Br | H |
| -O-(CH ₂) ₂ -O- | Cl | H | Cl | H |
| -O-(CH ₂) ₂ -O- | Cl | H | CH ₃ | H |
| -O-(CH ₂) ₂ -O- | CH ₃ | H | Cl | H |
| -O-(CH ₂) ₂ -O- | Cl | Cl | H | H |
| -O-(CH ₂) ₂ -O- | Cl | OCH ₃ | H | H |
| -O-(CH ₂) ₂ -O- | Cl | CH ₃ | H | H |
| -O-(CH ₂) ₂ -O- | Cl | OC ₂ H ₅ | H | H |
| -O-(CH ₂) ₂ -O- | OCH ₃ | OCH ₃ | H | H |
| -O-(CH ₂) ₂ -O- | CH ₃ | CH ₃ | H | H |
| -O-(CH ₂) ₂ -O- | C ₂ H ₅ | CH ₃ | H | H |
| -O-(CH ₂) ₂ -O- | C ₂ H ₅ | C ₂ H ₅ | H | H |
| -O-(CH ₂) ₂ -O- | Br | CH ₃ | Br | H |
| -O-(CH ₂) ₂ -O- | Cl | CH ₃ | Cl | H |
| -O-(CH ₂) ₂ -O- | CH ₃ | Br | CH ₃ | H |
| -O-(CH ₂) ₂ -O- | CH ₃ | Cl | CH ₃ | H |
| -O-(CH ₂) ₂ -O- | OCH ₃ | CH ₃ | CH ₃ | H |
| -O-(CH ₂) ₂ -O- | OC ₂ H ₅ | CH ₃ | CH ₃ | H |
| -O-(CH ₂) ₂ -O- | OC ₃ H ₇ | CH ₃ | CH ₃ | H |
| -O-(CH ₂) ₂ -O- | CH ₃ | CH ₃ | CH ₃ | H |
| -O-(CH ₂) ₂ -O- | Br | Br | CH ₃ | H |
| -O-(CH ₂) ₂ -O- | Cl | Cl | CH ₃ | H |
| -O-(CH ₂) ₂ -O- | CH ₃ | CH ₃ | Br | H |
| -O-(CH ₂) ₂ -O- | OCH ₃ | C ₂ H ₅ | CH ₃ | H |
| -O-(CH ₂) ₂ -O- | OC ₂ H ₅ | C ₂ H ₅ | CH ₃ | H |
| -O-(CH ₂) ₂ -O- | CH ₃ | CH ₃ | OCH ₃ | H |
| -O-(CH ₂) ₂ -O- | Br | Cl | CH ₃ | H |
| -O-(CH ₂) ₂ -O- | Br | CH ₃ | Cl | H |
| -O-(CH ₂) ₂ -O- | Cl | CH ₃ | Br | H |
| -O-(CH ₂) ₂ -O- | CH ₃ | CH ₃ | Cl | H |
| -O-(CH ₂) ₂ -O- | C ₂ H ₅ | CH ₃ | CH ₃ | H |
| -O-(CH ₂) ₂ -O- | C ₂ H ₅ | C ₂ H ₅ | CH ₃ | H |
| -O-(CH ₂) ₂ -O- | C ₂ H ₅ | CH ₃ | C ₂ H ₅ | H |
| -O-(CH ₂) ₂ -O- | C ₂ H ₅ | C ₂ H ₅ | C ₂ H ₅ | H |
| -O-(CH ₂) ₂ -O- | C ₂ H ₅ | CH ₃ | Cl | H |
| -O-(CH ₂) ₂ -O- | C ₂ H ₅ | C ₂ H ₅ | Cl | H |
| -O-(CH ₂) ₂ -O- | C ₂ H ₅ | CH ₃ | Br | H |
| -O-(CH ₂) ₂ -O- | C ₂ H ₅ | C ₂ H ₅ | Br | H |
| -O-(CH ₂) ₂ -O- | C ₂ H ₅ | Cl | CH ₃ | H |
| -O-(CH ₂) ₂ -O- | C ₂ H ₅ | Br | CH ₃ | H |

| A-B | X | W | Y | Z |
|--|--------------------------------|--------------------------------|------------------------------------|------------------------------------|
| -O-(CH ₂) ₂ -O- | C ₂ H ₅ | Cl | Cl | H |
| -O-(CH ₂) ₂ -O- | C ₂ H ₅ | Br | Br | H |
| -O-(CH ₂) ₂ -O- | C ₂ H ₅ | Cl | Br | H |
| -O-(CH ₂) ₂ -O- | C ₂ H ₅ | Br | Cl | H |
| -O-(CH ₂) ₂ -O- | OCH ₃ | CH ₃ | Cl | H |
| -O-(CH ₂) ₂ -O- | OCH ₃ | C ₂ H ₅ | Cl | H |
| -O-(CH ₂) ₂ -O- | OC ₂ H ₅ | CH ₃ | Cl | H |
| -O-(CH ₂) ₂ -O- | OC ₂ H ₅ | C ₂ H ₅ | Cl | H |
| -O-(CH ₂) ₂ -O- | Cl | OCH ₃ | CH ₃ | H |
| -O-(CH ₂) ₂ -O- | Cl | OC ₂ H ₅ | CH ₃ | H |
| -O-(CH ₂) ₂ -O- | CH ₃ | CH ₃ | Cl | H |
| -O-(CH ₂) ₂ -O- | Cl | H | Cl | Cl |
| -O-(CH ₂) ₂ -O- | CH ₃ | H | CH ₃ | CH ₃ |
| -O-(CH ₂) ₂ -O- | CH ₃ | H | Cl | CH ₃ |
| -O-(CH ₂) ₂ -O- | Br | H | Cl | CH ₃ |
| -O-(CH ₂) ₂ -O- | Br | H | CH ₃ | CH ₃ |
| -O-(CH ₂) ₂ -O- | Cl | H | Br | CH ₃ |
| -O-(CH ₂) ₂ -O- | Cl | H | Cl | CH ₃ |
| -O-(CH ₂) ₂ -O- | CH ₃ | H | Br | CH ₃ |
| -O-(CH ₂) ₂ -O- | Cl | H | CH ₃ | Cl |
| -O-(CH ₂) ₂ -O- | CH ₃ | H | H | CH ₃ |
| -O-(CH ₂) ₂ -O- | Cl | H | H | CH ₃ |
| -O-(CH ₂) ₂ -O- | Br | H | H | CH ₃ |
| -O-(CH ₂) ₂ -O- | CH ₃ | H | H | Cl |
| -O-(CH ₂) ₂ -O- | CH ₃ | H | H | Br |
| -O-(CH ₂) ₂ -O- | CH ₃ | CH ₃ | CH ₃ | CH ₃ |
| -O-(CH ₂) ₂ -O- | CH ₃ | CH ₃ | CH ₃ | F |
| -O-(CH ₂) ₂ -O- | CH ₃ | CH ₃ | CH ₃ | Cl |
| -O-(CH ₂) ₂ -O- | CH ₃ | CH ₃ | CH ₃ | Br |
| -O-(CH ₂) ₂ -O- | CH ₃ | CH ₃ | H | Cl |
| -O-(CH ₂) ₂ -O- | CH ₃ | CH ₃ | H | Br |
| -O-(CH ₂) ₂ -O- | Cl | Cl | H | Br |
| -O-(CH ₂) ₂ -O- | CH ₃ | CH ₃ | 4-Cl-C ₆ H ₄ | H |
| -O-(CH ₂) ₂ -O- | C ₂ H ₅ | CH ₃ | 4-Cl-C ₆ H ₄ | H |
| -O-(CH ₂) ₂ -O- | C ₂ H ₅ | C ₂ H ₅ | 4-Cl-C ₆ H ₄ | H |
| -O-(CH ₂) ₂ -O- | Cl | CH ₃ | 4-Cl-C ₆ H ₄ | H |
| -O-(CH ₂) ₂ -O- | Cl | C ₂ H ₅ | 4-Cl-C ₆ H ₄ | H |
| -O-(CH ₂) ₂ -O- | CH ₃ | H | H | 4-Cl-C ₆ H ₄ |
| -O-(CH ₂) ₂ -O- | CH ₃ | CH ₃ | H | 4-Cl-C ₆ H ₄ |
| -O-(CH ₂) ₂ -O- | CH ₃ | H | CH ₃ | 4-Cl-C ₆ H ₄ |
| -O-(CH ₂) ₂ -O- | CH ₃ | CH ₃ | CH ₃ | 4-Cl-C ₆ H ₄ |
| -O-(CH ₂) ₂ -O- | Cl | H | H | 4-Cl-C ₆ H ₄ |
| -O-(CH ₂) ₂ -O- | J | H | H | H |
| -O-(CH ₂) ₂ -O- | J | H | CH ₃ | H |
| -O-(CH ₂) ₂ -O- | J | CH ₃ | H | H |

| A-B | X | W | Y | Z |
|--|-------------------------------|-------------------------------|-----------------|-----------------|
| -O-(CH ₂) ₂ -O- | J | C ₂ H ₅ | H | H |
| -O-(CH ₂) ₂ -O- | CH ₃ | H | H | J |
| -O-(CH ₂) ₂ -O- | CH ₃ | H | CH ₃ | J |
| -O-(CH ₂) ₂ -O- | J | CH ₃ | CH ₃ | H |
| -O-(CH ₂) ₂ -O- | J | C ₂ H ₅ | CH ₃ | H |
| -O-(CH ₂) ₂ -O- | J | CH ₃ | Cl | H |
| -O-(CH ₂) ₂ -O- | J | C ₂ H ₅ | Cl | H |
| -O-(CH ₂) ₂ -O- | J | Cl | CH ₃ | H |
| -O-(CH ₂) ₂ -O- | J | H | CH ₃ | CH ₃ |
| -O-(CH ₂) ₂ -O- | CH ₃ | H | J | H |
| -O-(CH ₂) ₂ -O- | C ₂ H ₅ | H | J | H |
| -O-(CH ₂) ₂ -O- | CH ₃ | CH ₃ | J | H |
| -O-(CH ₂) ₂ -O- | C ₂ H ₅ | CH ₃ | J | H |
| -O-(CH ₂) ₂ -O- | C ₂ H ₅ | C ₂ H ₅ | J | H |
| -O-(CH ₂) ₂ -O- | Cl | CH ₃ | J | H |
| -O-(CH ₂) ₂ -O- | Cl | C ₂ H ₅ | J | H |
| -O-(CH ₂) ₂ -O- | CH ₃ | H | J | CH ₃ |
| -O-(CH ₂) ₂ -O- | CH ₃ | CH ₃ | H | J |
| -O-(CH ₂) ₂ -O- | J | H | H | CH ₃ |
| -O-(CH ₂) ₂ -O- | C ₂ H ₅ | H | H | H |

Таблица 2: W, X, Y и Z имеют такие же значения, какие приведены в табл. 1, и A-B=4'-O-CH₂-CHCH₃-O-.

Таблица 3: W, X, Y и Z имеют такие же значения, какие приведены в табл. 1, и A-B=4'-O-CHCH₃-CHCH₃-O-.

Таблица 4: W, X, Y и Z имеют такие же значения, какие приведены в табл. 1, и A-B=4'-O-(CH₂)₃-O-.

Таблица 5: W, X, Y и Z имеют такие же значения, какие приведены в табл. 1, и A-B=4'-O-CHCH₃-(CH₂)₂-O-.

Таблица 6: W, X, Y и Z имеют такие же значения, какие приведены в табл. 1, и A-B=4'-O-CHCH₃-CH₂-CHCH₃-O-.

Таблица 7: W, X, Y и Z имеют такие же значения, какие приведены в табл. 1, и A-B=4'-O-CH₂-C(CH₃)₂-CH₂-O-.

Таблица 8: W, X, Y и Z имеют такие же значения, какие приведены в табл. 1, и A-B =
$$\begin{array}{c} 4'-O-CH_2-CH-CH_2-O-CH_3 \\ | \\ O- \end{array}$$

Таблица 9: W, X, Y и Z имеют такие же значения, какие приведены в табл. 1, и A-B=3'-O(CH₂)₂-O-.

Таблица 10: W, X, Y и Z имеют такие же значения, какие приведены в табл. 1, и A-B=3'-O-CH₂-CHCH₃-O-.

Таблица 11: W, X, Y и Z имеют такие же значения, какие приведены в табл. 1, и A-B=3'-O-CHCH₃-CHCH₃-O-.

Таблица 12: W, X, Y и Z имеют такие же значения, какие приведены в табл. 1, и A-B=3'-O-(CH₂)₃-O-.

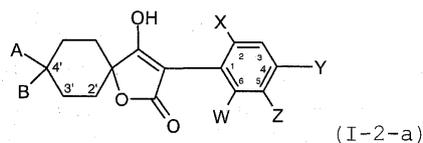
Таблица 13: W, X, Y и Z имеют такие же значения, какие приведены в табл. 1, и A-B=3'-O-CHCH₃-(CH₂)₂-O-.

Таблица 14: W, X, Y и Z имеют такие же значения, какие приведены в табл. 1, и A-B=3'-O-CHCH₃-CH₂-CHCH₃-O-.

Таблица 15: W, X, Y и Z имеют такие же значения, какие приведены в табл. 1, и A-B=3'-O-CH₂-C(CH₃)₂-CH₂-O-.

Таблица 16: W, X, Y и Z имеют такие же значения, какие приведены в табл. 1, и A-B =
$$\begin{array}{c} 3'-O-CH_2-CH-CH_2-O-CH_3 \\ | \\ O- \end{array}$$

По отдельности следует привести, кроме соединений, приведенных в примерах получения, следующие соединения формулы (I-2-a).



| A-B | X | W | Y | Z |
|--|--------------------------------|--------------------------------|-------------------------------|---|
| -O-(CH ₂) ₂ -O- | CH ₃ | H | H | H |
| -O-(CH ₂) ₂ -O- | Br | H | H | H |
| -O-(CH ₂) ₂ -O- | Cl | H | H | H |
| -O-(CH ₂) ₂ -O- | CF ₃ | H | H | H |
| -O-(CH ₂) ₂ -O- | OCH ₃ | H | H | H |
| -O-(CH ₂) ₂ -O- | Br | H | Cl | H |
| -O-(CH ₂) ₂ -O- | Cl | H | Br | H |
| -O-(CH ₂) ₂ -O- | Cl | H | Cl | H |
| -O-(CH ₂) ₂ -O- | Cl | H | CH ₃ | H |
| -O-(CH ₂) ₂ -O- | CH ₃ | H | Cl | H |
| -O-(CH ₂) ₂ -O- | Cl | Cl | H | H |
| -O-(CH ₂) ₂ -O- | Cl | OCH ₃ | H | H |
| -O-(CH ₂) ₂ -O- | Cl | CH ₃ | H | H |
| -O-(CH ₂) ₂ -O- | Cl | OC ₂ H ₅ | H | H |
| -O-(CH ₂) ₂ -O- | OCH ₃ | OCH ₃ | H | H |
| -O-(CH ₂) ₂ -O- | CH ₃ | CH ₃ | H | H |
| -O-(CH ₂) ₂ -O- | C ₂ H ₅ | CH ₃ | H | H |
| -O-(CH ₂) ₂ -O- | C ₂ H ₅ | C ₂ H ₅ | H | H |
| -O-(CH ₂) ₂ -O- | Br | CH ₃ | Br | H |
| -O-(CH ₂) ₂ -O- | Cl | CH ₃ | Cl | H |
| -O-(CH ₂) ₂ -O- | CH ₃ | Br | CH ₃ | H |
| -O-(CH ₂) ₂ -O- | CH ₃ | Cl | CH ₃ | H |
| -O-(CH ₂) ₂ -O- | OCH ₃ | CH ₃ | CH ₃ | H |
| -O-(CH ₂) ₂ -O- | OC ₂ H ₅ | CH ₃ | CH ₃ | H |
| -O-(CH ₂) ₂ -O- | OC ₃ H ₇ | CH ₃ | CH ₃ | H |
| -O-(CH ₂) ₂ -O- | CH ₃ | CH ₃ | CH ₃ | H |
| -O-(CH ₂) ₂ -O- | Br | Br | CH ₃ | H |
| -O-(CH ₂) ₂ -O- | Cl | Cl | CH ₃ | H |
| -O-(CH ₂) ₂ -O- | CH ₃ | CH ₃ | Br | H |
| -O-(CH ₂) ₂ -O- | OCH ₃ | C ₂ H ₅ | CH ₃ | H |
| -O-(CH ₂) ₂ -O- | OC ₂ H ₅ | C ₂ H ₅ | CH ₃ | H |
| -O-(CH ₂) ₂ -O- | CH ₃ | CH ₃ | OCH ₃ | H |
| -O-(CH ₂) ₂ -O- | Br | Cl | CH ₃ | H |
| -O-(CH ₂) ₂ -O- | Br | CH ₃ | Cl | H |
| -O-(CH ₂) ₂ -O- | Cl | CH ₃ | Br | H |
| -O-(CH ₂) ₂ -O- | CH ₃ | CH ₃ | Cl | H |
| -O-(CH ₂) ₂ -O- | C ₂ H ₅ | CH ₃ | CH ₃ | H |
| -O-(CH ₂) ₂ -O- | C ₂ H ₅ | C ₂ H ₅ | CH ₃ | H |
| -O-(CH ₂) ₂ -O- | C ₂ H ₅ | CH ₃ | C ₂ H ₅ | H |
| -O-(CH ₂) ₂ -O- | C ₂ H ₅ | C ₂ H ₅ | C ₂ H ₅ | H |
| -O-(CH ₂) ₂ -O- | C ₂ H ₅ | CH ₃ | Cl | H |
| -O-(CH ₂) ₂ -O- | C ₂ H ₅ | C ₂ H ₅ | Cl | H |
| -O-(CH ₂) ₂ -O- | C ₂ H ₅ | CH ₃ | Br | H |
| -O-(CH ₂) ₂ -O- | C ₂ H ₅ | C ₂ H ₅ | Br | H |
| -O-(CH ₂) ₂ -O- | C ₂ H ₅ | Cl | CH ₃ | H |
| -O-(CH ₂) ₂ -O- | C ₂ H ₅ | Br | CH ₃ | H |

| A-B | X | W | Y | Z |
|--|--------------------------------|--------------------------------|------------------------------------|------------------------------------|
| -O-(CH ₂) ₂ -O- | C ₂ H ₅ | Cl | Cl | H |
| -O-(CH ₂) ₂ -O- | C ₂ H ₅ | Br | Br | H |
| -O-(CH ₂) ₂ -O- | C ₂ H ₅ | Cl | Br | H |
| -O-(CH ₂) ₂ -O- | C ₂ H ₅ | Br | Cl | H |
| -O-(CH ₂) ₂ -O- | OCH ₃ | CH ₃ | Cl | H |
| -O-(CH ₂) ₂ -O- | OCH ₃ | C ₂ H ₅ | Cl | H |
| -O-(CH ₂) ₂ -O- | OC ₂ H ₅ | CH ₃ | Cl | H |
| -O-(CH ₂) ₂ -O- | OC ₂ H ₅ | C ₂ H ₅ | Cl | H |
| -O-(CH ₂) ₂ -O- | Cl | OCH ₃ | CH ₃ | H |
| -O-(CH ₂) ₂ -O- | Cl | OC ₂ H ₅ | CH ₃ | H |
| -O-(CH ₂) ₂ -O- | CH ₃ | CH ₃ | Cl | H |
| -O-(CH ₂) ₂ -O- | Cl | H | Cl | Cl |
| -O-(CH ₂) ₂ -O- | CH ₃ | H | CH ₃ | CH ₃ |
| -O-(CH ₂) ₂ -O- | CH ₃ | H | Cl | CH ₃ |
| -O-(CH ₂) ₂ -O- | Br | H | Cl | CH ₃ |
| -O-(CH ₂) ₂ -O- | Br | H | CH ₃ | CH ₃ |
| -O-(CH ₂) ₂ -O- | Cl | H | Br | CH ₃ |
| -O-(CH ₂) ₂ -O- | Cl | H | Cl | CH ₃ |
| -O-(CH ₂) ₂ -O- | CH ₃ | H | Br | CH ₃ |
| -O-(CH ₂) ₂ -O- | Cl | H | CH ₃ | Cl |
| -O-(CH ₂) ₂ -O- | CH ₃ | H | H | CH ₃ |
| -O-(CH ₂) ₂ -O- | Cl | H | H | CH ₃ |
| -O-(CH ₂) ₂ -O- | Br | H | H | CH ₃ |
| -O-(CH ₂) ₂ -O- | CH ₃ | H | H | Cl |
| -O-(CH ₂) ₂ -O- | CH ₃ | H | H | Br |
| -O-(CH ₂) ₂ -O- | CH ₃ | CH ₃ | CH ₃ | CH ₃ |
| -O-(CH ₂) ₂ -O- | CH ₃ | CH ₃ | CH ₃ | F |
| -O-(CH ₂) ₂ -O- | CH ₃ | CH ₃ | CH ₃ | Cl |
| -O-(CH ₂) ₂ -O- | CH ₃ | CH ₃ | CH ₃ | Br |
| -O-(CH ₂) ₂ -O- | CH ₃ | CH ₃ | H | Cl |
| -O-(CH ₂) ₂ -O- | CH ₃ | CH ₃ | H | Br |
| -O-(CH ₂) ₂ -O- | Cl | Cl | H | Br |
| -O-(CH ₂) ₂ -O- | CH ₃ | CH ₃ | 4-Cl-C ₆ H ₄ | H |
| -O-(CH ₂) ₂ -O- | C ₂ H ₅ | CH ₃ | 4-Cl-C ₆ H ₄ | H |
| -O-(CH ₂) ₂ -O- | C ₂ H ₅ | C ₂ H ₅ | 4-Cl-C ₆ H ₄ | H |
| -O-(CH ₂) ₂ -O- | Cl | CH ₃ | 4-Cl-C ₆ H ₄ | H |
| -O-(CH ₂) ₂ -O- | Cl | C ₂ H ₅ | 4-Cl-C ₆ H ₄ | H |
| -O-(CH ₂) ₂ -O- | CH ₃ | H | H | 4-Cl-C ₆ H ₄ |
| -O-(CH ₂) ₂ -O- | CH ₃ | CH ₃ | H | 4-Cl-C ₆ H ₄ |
| -O-(CH ₂) ₂ -O- | CH ₃ | H | CH ₃ | 4-Cl-C ₆ H ₄ |
| -O-(CH ₂) ₂ -O- | CH ₃ | CH ₃ | CH ₃ | 4-Cl-C ₆ H ₄ |
| -O-(CH ₂) ₂ -O- | Cl | H | H | 4-Cl-C ₆ H ₄ |
| -O-(CH ₂) ₂ -O- | J | H | H | H |
| -O-(CH ₂) ₂ -O- | J | H | CH ₃ | H |
| -O-(CH ₂) ₂ -O- | J | CH ₃ | H | H |

| A-B | X | W | Y | Z |
|--|-------------------------------|-------------------------------|-----------------|-----------------|
| -O-(CH ₂) ₂ -O- | J | C ₂ H ₅ | H | H |
| -O-(CH ₂) ₂ -O- | CH ₃ | H | H | J |
| -O-(CH ₂) ₂ -O- | CH ₃ | H | CH ₃ | J |
| -O-(CH ₂) ₂ -O- | J | CH ₃ | CH ₃ | H |
| -O-(CH ₂) ₂ -O- | J | C ₂ H ₅ | CH ₃ | H |
| -O-(CH ₂) ₂ -O- | J | CH ₃ | Cl | H |
| -O-(CH ₂) ₂ -O- | J | C ₂ H ₅ | Cl | H |
| -O-(CH ₂) ₂ -O- | J | Cl | CH ₃ | H |
| -O-(CH ₂) ₂ -O- | J | H | CH ₃ | CH ₃ |
| -O-(CH ₂) ₂ -O- | CH ₃ | H | J | H |
| -O-(CH ₂) ₂ -O- | C ₂ H ₅ | H | J | H |
| -O-(CH ₂) ₂ -O- | CH ₃ | CH ₃ | J | H |
| -O-(CH ₂) ₂ -O- | C ₂ H ₅ | CH ₃ | J | H |
| -O-(CH ₂) ₂ -O- | C ₂ H ₅ | C ₂ H ₅ | J | H |
| -O-(CH ₂) ₂ -O- | Cl | CH ₃ | J | H |
| -O-(CH ₂) ₂ -O- | Cl | C ₂ H ₅ | J | H |
| -O-(CH ₂) ₂ -O- | CH ₃ | H | J | CH ₃ |
| -O-(CH ₂) ₂ -O- | CH ₃ | CH ₃ | H | J |
| -O-(CH ₂) ₂ -O- | J | H | H | CH ₃ |

Таблица 18: W, X, Y и Z имеют такие же значения, какие приведены в табл. 17, и A-B=4'-O-CH₂-CHCH₃-O-.

Таблица 19: W, X, Y и Z имеют такие же значения, какие приведены в табл. 17, и A-B=4'-O-CHCH₃-CHCH₃-O-.

Таблица 20: W, X, Y и Z имеют такие же значения, какие приведены в табл. 17, и A-B=4'-O-(CH₂)₃-O-.

Таблица 21: W, X, Y и Z имеют такие же значения, какие приведены в табл. 17, и A-B=4'-O-CHCH₃-(CH₂)₂-O-.

Таблица 22: W, X, Y и Z имеют такие же значения, какие приведены в табл. 17, и A-B=4'-O-CHCH₃-CH₂-CHCH₃-O-.

Таблица 23: W, X, Y и Z имеют такие же значения, какие приведены в табл. 17, и A-B=4'-O-CH₂-C(CH₃)₂-CH₂-O-.

Таблица 24: W, X, Y и Z имеют такие же значения, какие приведены в табл. 17, и

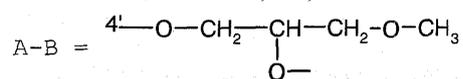


Таблица 25: W, X, Y и Z имеют такие же значения, какие приведены в табл. 17, и A-B=3'-O(CH₂)₂-O-.

Таблица 26: W, X, Y и Z имеют такие же значения, какие приведены в табл. 17, и A-B=3'-O-CH₂-CHCH₃-O-.

Таблица 27: W, X, Y и Z имеют такие же значения, какие приведены в табл. 17, и A-B=3'-O-CHCH₃-CHCH₃-O-.

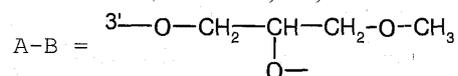
Таблица 28: W, X, Y и Z имеют такие же значения, какие приведены в табл. 17, и A-B=3'-O-(CH₂)₃-O-.

Таблица 29: W, X, Y и Z имеют такие же значения, какие приведены в табл. 17, и A-B=3'-O-CHCH₃-(CH₂)₂-O-.

Таблица 30: W, X, Y и Z имеют такие же значения, какие приведены в табл. 17, и A-B=3'-O-CHCH₃-CH₂-CHCH₃-O-.

Таблица 31: W, X, Y и Z имеют такие же значения, какие приведены в табл. 17, и A-B=3'-O-CH₂-C(CH₃)₂-CH₂-O-.

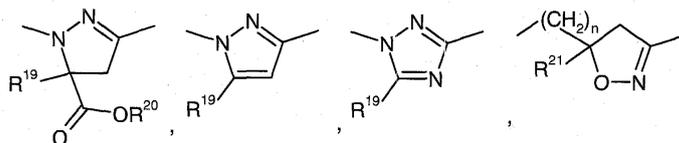
Таблица 32: W, X, Y и Z имеют такие же значения, какие приведены в табл. 17, и



Предпочтительные значения радикалов, групп, заместителей и индексов в случае приведенных выше соединений, улучшающих переносимость гербицидов культурными растениям ("защитное вещество от гербицидов"), формул (IIa)-(IIe) пояснены ниже.

m предпочтительно означает число 0, 1, 2, 3 или 4;

A¹ предпочтительно означает одну из приведенных ниже двухвалентных гетероциклических групп



n предпочтительно означает число 0, 1, 2, 3 или 4;

A^2 предпочтительно означает не замещенные или замещенные метилом, этилом, метоксикарбонилем или этоксикарбонилем, или аллилоксикарбонилем метилен или этилен;

R^{14} предпочтительно означает гидрокси-, меркапто-, amino-, метокси-, этокси-, n - или изопропокси-, n -, изо-, втор- или трет-бутокси-, метилтио-, этилтио-, n - или изопропилтио-, n -, изо-, втор- или трет-бутилтио-, метиламино-, этиламино-, n - или изопропиламино-, n -, изо-, втор- или трет-бутиламино-, диметиламино- или диэтиламиногруппу;

R^{15} предпочтительно означает гидрокси-, меркапто-, amino-, метокси-, этокси-, n - или изопропокси-, n -, изо-, втор- или трет-бутокси-, 1-метилгексилокси-, аллилокси-, 1-аллилоксиметилэтокси-, метилтио-, этилтио-, n - или изопропилтио-, n -, изо-, втор- или трет-бутилтио-, метиламино-, этиламино-, n - или изопропиламино-, n -, изо-, втор- или трет-бутиламино-, диметиламино- или диэтиламиногруппу;

R^{16} предпочтительно означает не замещенные или замещенные фтором, хлором и/или бромом метил, этил, n - или изопропил;

R^{17} предпочтительно означает водород, не замещенные или замещенные фтором и/или хлором метил, этил, n - или изопропил, n -, изо-, втор- или трет-бутил, пропенил, бутенил, пропирил или бутинил, метоксиметил, этоксиметил, метоксиэтил, этоксиэтил, диоксоланилметил, фурил, фурилметил, тиенил, тиазолил, пиперидинил, или означает не замещенный или замещенный фтором, хлором, метилом, этилом, n - или изопропилом, n -, изо-, втор- или трет-бутилом фенил;

R^{18} предпочтительно означает водород, не замещенные или замещенные фтором и/или хлором метил, этил, n - или изопропил, n -, изо-, втор- или трет-бутил, пропенил, бутенил, пропирил или бутинил, метоксиметил, этоксиметил, метоксиэтил, этоксиэтил, диоксоланилметил, фурил, фурилметил, тиенил, тиазолил, пиперидинил, или не замещенный или замещенный фтором, хлором, метилом, этилом, n - или изопропилом, n -, изо-, втор- или трет-бутилом фенил, или вместе с R^{17} означают один из радикалов $-CH_2-O-CH_2-CH_2-$ и $-CH_2-CH_2-O-CH_2-CH_2-$, которые не замещены или замещены метилом, этилом, фурилом, фенилом, аннелированным бензольным кольцом или двумя заместителями, которые вместе с C -атомом, к которому они присоединены, образуют 5- или 6-членный карбоцикл;

R^{19} предпочтительно означает водород, цианогруппу, фтор, хлор, бром, или означает не замещенный или замещенные фтором, хлором и/или бромом метил, этил, n - или изопропил, циклопропил, циклобутил, циклопентил, циклогексил или фенил;

R^{20} предпочтительно означает водород, не замещенный или замещенный гидрокси-, цианогруппой, фтором, хлором, метокси-, этокси-, n - или изопропоксигруппой метил, этил, n - или изопропил, n -, изо-, втор- или трет-бутил;

R^{21} предпочтительно означает водород, цианогруппу, фтор, хлор, бром, или означает не замещенные или замещенные фтором, хлором и/или бромом метил, этил, n - или изопропил, n -, изо-, втор- или трет-бутил, циклопропил, циклобутил, циклопентил, циклогексил или фенил;

X^1 предпочтительно означает нитро-, цианогруппу, фтор, хлор, бром, метил, этил, n - или изопропил, n -, изо-, втор- или трет-бутил, дифторметил, дихлорметил, трифторметил, трихлор-метил, хлордифторметил, фтордихлорметил, метокси-, этокси-, n - или изопропокси-, дифторметокси- или трифторметоксигруппу;

X^2 предпочтительно означает водород, нитро-, цианогруппу, фтор, хлор, бром, метил, этил, n - или изопропил, n -, изо-, втор или трет-бутил, дифторметил, дихлорметил, трифторметил, трихлорметил, хлордифторметил, фтордихлорметил, метокси-, этокси-, n - или изопропокси-, дифторметокси- или трифтор-метоксигруппу;

X^3 предпочтительно означает водород, нитро-, цианогруппу, фтор, хлор, бром, метил, этил, n - или изопропил, n -, изо-, втор или трет-бутил, дифторметил, дихлорметил, трифторметил, трихлорметил, хлордифторметил, фтордихлорметил, метокси-, этокси-, n - или изопропокси-, дифторметокси- или трифтор-метоксигруппу;

t предпочтительно означает число 0, 1, 2, 3 или 4;

v предпочтительно означает число 0, 1, 2, 3 или 4;

R^{22} предпочтительно означает водород, метил, этил, n - или изопропил;

R^{23} предпочтительно означает водород, метил, этил, n - или изопропил;

R^{24} предпочтительно означает водород, не замещенные или замещенные цианогруппой, фтором, хлором, метокси-, этокси-, n - или изопропоксигруппой метил, этил, n - или изопропил, n -, изо-, втор- или трет-бутил, метокси-, этокси-, n - или изопропокси-, n -, изо-, втор- или трет-бутокси-, метилтио-, этилтио-, n - или изопропилтио-, n -, изо-, втор- или трет-бутилтио-, метиламино-, этиламино-, n - или изопропиламино-, n -, изо-, втор- или трет-бутиламино-, диметиламино- или диэтиламиногруппу, или означает не

замещенные или замещенные цианогруппой, фтором, хлором, бромом, метилом, этилом, н- или изопропилом циклопропил, циклобутил, циклопентил, циклогексил, циклопропилокси-, циклобутилокси-, циклопентилокси-, циклогексилокси-, циклопропилтио-, циклобутилтио-, циклопентилтио-, циклогексилтио-, циклопропиламино-, циклобутиламино-, циклопентиламино- или циклогексиламиногруппу;

R^{25} предпочтительно означает водород, не замещенные или замещенные циано-, гидроксигруппой, фтором, хлором, метокси-, этокси-, н- или изопропоксигруппой метил, этил, н- или изопропил, н-, изо- или втор-бутил, не замещенные или замещенные цианогруппой, фтором, хлором или бромом пропил, бутенил, пропирил или бутирил, или означает не замещенные или замещенные цианогруппой, фтором, хлором, бромом, метилом, этилом, н- или изопропилом циклопропил, циклобутил, циклопентил или циклогексил;

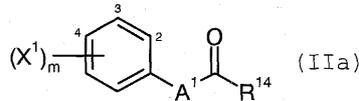
R^{26} предпочтительно означает водород, не замещенные или замещенные циано-, гидроксигруппой, фтором, хлором, метокси-, этокси-, н- или изопропоксигруппой метил, этил, н- или изопропил, н-, изо- или втор-бутил, означает не замещенные или замещенные цианогруппой, фтором, хлором или бромом пропил, бутенил, пропирил или бутирил, не замещенные или замещенные цианогруппой, фтором, хлором, бромом, метилом, этилом, н- или изопропилом циклопропил, циклобутил, циклопентил или циклогексил, или означает не замещенный или замещенный нитро-, цианогруппой, фтором, хлором, бромом, метилом, этилом, н- или изопропилом, н-, изо-, втор- или трет-бутилом, трифторметилом, метокси-, этокси-, н- или изопропокси-, дифторметокси- или трифторметоксигруппой фенил, или вместе с R^{25} означают не замещенные или замещенные метилом или этилом бутан-1,4-диил (триметилен), пентан-1,5-диил, 1-оксабутан-1,4-диил или 3-оксапентан-1,5-диил;

X^4 предпочтительно означает нитро-, циано-, карбоксигруппу, карбамоил, формил, сульфамойл, гидрокси-, аминогруппу, фтор, хлор, бром, метил, этил, н- или изопропил, н-, изо-, втор- или трет-бутил, трифторметил, метокси-, этокси-, н- или изопропокси-, дифторметокси- или трифторметоксигруппу;

X^5 предпочтительно означает нитро-, циано-, карбоксигруппу, карбамоил, формил, сульфамойл, гидрокси-, аминогруппу, фтор, хлор, бром, метил, этил, н- или изопропил, н-, изо-, втор- или трет-бутил, трифторметил, метокси-, этокси-, н- или изопропокси-, дифторметокси- или трифторметоксигруппу.

Примеры более предпочтительных соединений формулы (IIa), используемых согласно данному изобретению в качестве защитных веществ от действия гербицидов, приведены в следующей таблице.

Примеры соединений формулы (IIa)



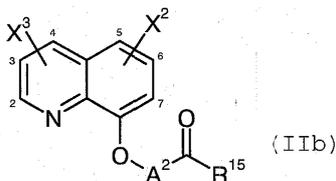
| Пример № | (Положения) $(X^1)_m$ | A^1 | R^{14} |
|----------|-----------------------|-------|--------------------------------|
| IIa-1 | (2) Cl, (4) Cl | | OCH ₃ |
| IIa-2 | (2) Cl, (4) Cl | | OCH ₃ |
| IIa-3 | (2) Cl, (4) Cl | | OC ₂ H ₅ |
| IIa-4 | (2) Cl, (4) Cl | | OC ₂ H ₅ |
| IIa-5 | (2) Cl | | OCH ₃ |

| Пример № | (Положения) (X ¹) _m | A ¹ | R ¹⁴ |
|----------|--|----------------|--------------------------------|
| IIa-6 | (2) Cl, (4) Cl | | OCH ₃ |
| IIa-7 | (2) F | | OCH ₃ |
| IIa-8 | (2) F | | OCH ₃ |
| IIa-9 | (2) Cl, (4) Cl | | OC ₂ H ₅ |
| IIa-10 | (2) Cl, (4) CF ₃ | | OCH ₃ |
| IIa-11 | (2) Cl | | OCH ₃ |
| IIa-12 | - | | OC ₂ H ₅ |
| IIa-13 | (2) Cl, (4) Cl | | OC ₂ H ₅ |
| IIa-14 | (2) Cl, (4) Cl | | OC ₂ H ₅ |
| IIa-15 | (2) Cl, (4) Cl | | OC ₂ H ₅ |
| IIa-16 | (2) Cl, (4) Cl | | OC ₂ H ₅ |
| IIa-17 | (2) Cl, (4) Cl | | OC ₂ H ₅ |
| IIa-18 | - | | OH |

В формулах таблицы i означает изо и t означает трет.

Примеры более предпочтительных соединений формулы (IIb), используемых согласно данному изобретению в качестве защитных веществ от действия гербицидов, приведены в следующей таблице.

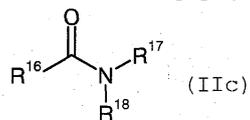
Примеры соединений формулы (IIb)

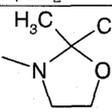
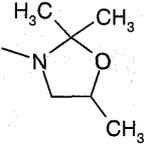
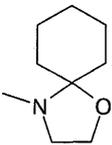
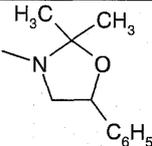
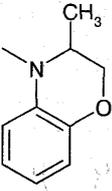
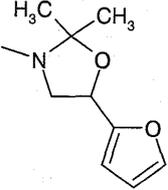


| Пример № | (Положение) X ² | (Положение) X ³ | A ² | R ¹⁵ |
|----------|----------------------------|----------------------------|-----------------|--|
| IIb-1 | (5) Cl | - | CH ₂ | OH |
| IIb-2 | (5) Cl | - | CH ₂ | OCH ₃ |
| IIb-3 | (5) Cl | - | CH ₂ | OC ₂ H ₅ |
| IIb-4 | (5) Cl | - | CH ₂ | O-n-C ₃ H ₇ |
| IIb-5 | (5) Cl | - | CH ₂ | O-изо-C ₃ H ₇ |
| IIb-6 | (5) Cl | - | CH ₂ | O-n-C ₄ H ₉ |
| IIb-7 | (5) Cl | - | CH ₂ | OCH(CH ₃)-n-C ₅ H ₁₁ |
| IIb-8 | (5) Cl | (2) F | CH ₂ | OH |
| IIb-9 | (5) Cl | (2) Cl | CH ₂ | OH |
| IIb-10 | (5) Cl | - | CH ₂ | OCH ₂ CH=CH ₂ |
| IIb-11 | (5) Cl | - | CH ₂ | O-изо-C ₄ H ₉ |
| IIb-12 | (5) Cl | - | CH ₂ | |
| IIb-13 | (5) Cl | - | | OCH ₂ CH=CH ₂ |
| IIb-14 | (5) Cl | - | | OC ₂ H ₅ |
| IIb-15 | (5) Cl | - | | OCH ₃ |

Примеры более предпочтительных соединений формулы (IIc), используемых согласно данному изобретению в качестве защитных веществ от действия гербицидов, приведены в следующей таблице.

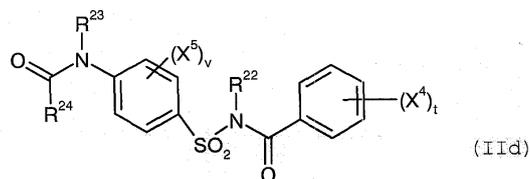
Примеры соединений формулы (IIc)



| Пример № | R ¹⁶ | N(R ¹⁷ , R ¹⁸) |
|----------|-------------------|---|
| Iic-1 | CHCl ₂ | N(CH ₂ CH=CH ₂) ₂ |
| Iic-2 | CHCl ₂ |  |
| Iic-3 | CHCl ₂ |  |
| Iic-4 | CHCl ₂ |  |
| Iic-5 | CHCl ₂ |  |
| Iic-6 | CHCl ₂ |  |
| Iic-7 | CHCl ₂ |  |

Примеры более предпочтительных соединений формулы (IIд), используемых согласно данному изобретению в качестве защитных веществ от действия гербицидов, приведены в следующей таблице.

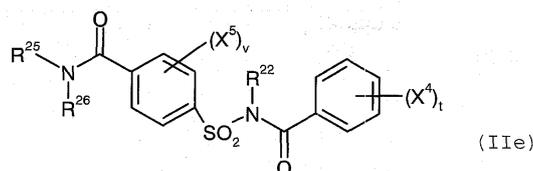
Примеры соединений формулы (IIд)



| Пример № | R ²² | R ²³ | R ²⁴ | (Положения) (X ⁴) _t | (Положения) (X ⁵) _v |
|----------|-----------------|-----------------|---|---|--|
| IIд-1 | H | H | CH ₃ | (2) OCH ₃ | - |
| IIд-2 | H | H | C ₂ H ₅ | (2) OCH ₃ | - |
| IIд-3 | H | H | n-C ₃ H ₇ | (2) OCH ₃ | - |
| IIд-4 | H | H | изо-C ₃ H ₇ | (2) OCH ₃ | - |
| IIд-5 | H | H |  | (2) OCH ₃ | - |
| IIд-6 | H | H | CH ₃ | (2) OCH ₃ (5) CH ₃ | - |
| IIд-7 | H | H | C ₂ H ₅ | (2) OCH ₃ (5) CH ₃ | - |
| IIд-8 | H | H | n-C ₃ H ₇ | (2) OCH ₃ (5) CH ₃ | - |
| IIд-9 | H | H | изо-C ₃ H ₇ | (2) OCH ₃ (5) CH ₃ | - |
| IIд-10 | H | H |  | (2) OCH ₃ (5) CH ₃ | - |
| IIд-11 | H | H | OCH ₃ | (2) OCH ₃ (5) CH ₃ | - |
| IIд-12 | H | H | OC ₂ H ₅ | (2) OCH ₃ (5) CH ₃ | - |
| IIд-13 | H | H | O-изо-C ₃ H ₇ | (2) OCH ₃ (5) CH ₃ | - |
| IIд-14 | H | H | SCH ₃ | (2) OCH ₃ (5) CH ₃ | - |
| IIд-15 | H | H | SC ₂ H ₅ | (2) OCH ₃ (5) CH ₃ | - |
| IIд-16 | H | H | S-изо-C ₃ H ₇ | (2) OCH ₃ (5) CH ₃ | - |
| IIд-17 | H | H | NHCH ₃ | (2) OCH ₃ (5) CH ₃ | - |
| IIд-18 | H | H | NHC ₂ H ₅ | (2) OCH ₃ (5) CH ₃ | - |
| IIд-19 | H | H | NH-изо-C ₃ H ₇ | (2) OCH ₃ (5) CH ₃ | - |
| IIд-20 | H | H |  | (2) OCH ₃ (5) CH ₃ | - |
| IIд-21 | H | H | NHCH ₃ | (2) OCH ₃ | - |
| IIд-22 | H | H | NH-изо-C ₃ H ₇ | (2) OCH ₃ | - |
| IIд-23 | H | H | N(CH ₃) ₂ | (2) OCH ₃ | - |
| IIд-24 | H | H | N(CH ₃) ₂ | (3) CH ₃ (4) CH ₃ | - |
| IIд-25 | H | H | CH ₂ -O-CH ₃ | (2) OCH ₃ | - |

Примеры более предпочтительных соединений формулы (IIe), используемых согласно данному изобретению в качестве защитных веществ от действия гербицидов, приведены в следующей таблице.

Примеры соединений формулы (IIe)



| Пример № | R ²² | R ²⁵ | R ²⁶ | (Положения) (X ⁴) _t | (Положения) (X ⁵) _v |
|----------|-----------------|-----------------|--|---|--|
| IIe-1 | H | H | CH ₃ | (2) OCH ₃ | - |
| IIe-2 | H | H | C ₂ H ₅ | (2) OCH ₃ | - |
| IIe-3 | H | H | n-C ₃ H ₇ | (2) OCH ₃ | - |
| IIe-4 | H | H | изо-C ₃ H ₇ | (2) OCH ₃ | - |
| IIe-5 | H | H |  | (2) OCH ₃ | - |
| IIe-6 | H | CH ₃ | CH ₃ | (2) OCH ₃ | - |
| IIe-7 | H | H | CH ₃ | (2) OCH ₃ (5) CH ₃ | - |
| IIe-8 | H | H | C ₂ H ₅ | (2) OCH ₃ (5) CH ₃ | - |
| IIe-9 | H | H | n-C ₃ H ₇ | (2) OCH ₃ (5) CH ₃ | - |
| IIe-10 | H | H | изо-C ₃ H ₇ | (2) OCH ₃ (5) CH ₃ | - |
| IIe-11 | H | H |  | (2) OCH ₃ (5) CH ₃ | - |
| IIe-12 | H | CH ₃ | CH ₃ | (2) OCH ₃ (5) CH ₃ | - |

В качестве соединений, улучшающих переносимость гербицидов культурными растениями [компонент (b)], еще более предпочтительны клоквинтоцет-мексил, фенхлоразол-этил, изоксадифен-этил, мефенпир-диэтил, фурилазол, фенклорим, кумилурон, димрон, димепиперат и соединения Пе-5 и Пе-11 наиболее предпочтительны, причем среди них предпочтительны клоквинтоцет-мексил и мефенпир-диэтил.

Применяемые согласно данному изобретению в качестве защитных веществ соединения общей формулы (IIa) известны и/или могут быть получены известными способами (см. WO-A-91/07874, WO-A-95/07897).

Применяемые согласно данному изобретению в качестве защитных веществ соединения общей формулы (IIb) известны и/или могут быть получены известными способами (см. EP-A-191736).

Применяемые согласно данному изобретению в качестве защитных веществ соединения общей формулы (IIc) известны и/или могут быть получены известными способами (см. DE-A-2218097, DE-A-2350547).

Применяемые согласно данному изобретению в качестве защитных веществ соединения общей формулы (IId) известны и/или могут быть получены известными способами (см. DE-A-19621522/US-A-6235680).

Применяемые согласно данному изобретению в качестве защитных веществ соединения общей формулы (IIe) известны и/или могут быть получены известными способами (см. WO-A-99/66795/US-A-6251827).

Примеры селективных гербицидных комбинаций согласно данному изобретению, каждая из которых содержит одно биологически активное вещество формулы (I) и одно защитное вещество, описанное выше, приведены в следующей таблице.

Примеры комбинаций согласно данному изобретению

| Биологически активное вещество формулы (I) | Защитное вещество |
|--|---------------------|
| I-1-a | Клоквинтоцет-мексил |
| I-1-a | Фенхлоразол-этил |
| I-1-a | Изоксадифен-этил |
| I-1-a | Мефенпир-диэтил |
| I-1-a | Фурилазол |
| I-1-a | Фенклорим |
| I-1-a | Кумилурон |
| I-1-a | Даймурон /Димрон |
| I-1-a | Димепиперат |
| I-1-a | IIe-11 |
| I-1-a | IIe-5 |
| I-1-b | Клоквинтоцет-мексил |
| I-1-b | Фенхлоразол-этил |
| I-1-b | Изоксадифен-этил |
| I-1-b | Мефенпир-диэтил |
| I-1-b | Фурилазол |
| I-1-b | Фенклорим |
| I-1-b | Кумилурон |
| I-1-b | Даймурон /Димрон |
| I-1-b | Димепиперат |
| I-1-b | IIe-11 |
| I-1-b | IIe-5 |
| I-1-c | Клоквинтоцет-мексил |
| I-1-c | Фенхлоразол-этил |
| I-1-c | Изоксадифен-этил |
| I-1-c | Мефенпир-диэтил |
| I-1-c | Фурилазол |
| I-1-c | Фенклорим |
| I-1-c | Кумилурон |
| I-1-c | Даймурон /Димрон |
| I-1-c | Димепиперат |
| I-1-c | IIe-5 |
| I-1-c | IIe-11 |
| I-1-d | Клоквинтоцет-мексил |
| I-1-d | Фенхлоразол-этил |
| I-1-d | Изоксадифен-этил |
| I-1-d | Мефенпир-диэтил |
| I-1-d | Фурилазол |
| I-1-d | Фенклорим |
| I-1-d | Кумилурон |
| I-1-d | Даймурон /Димрон |
| I-1-d | Димепиперат |
| I-1-d | IIe-11 |
| I-1-d | IIe-5 |
| I-1-e | Клоквинтоцет-мексил |
| I-1-e | Фенхлоразол-этил |

| Биологически активное вещество формулы (I) | Защитное вещество |
|---|---------------------|
| I-1-e | Изоксадифен-этил |
| I-1-e | Мефенпир-диэтил |
| I-1-e | Фурилазол |
| I-1-e | Фенклорим |
| I-1-e | Кумилурон |
| I-1-e | Даймурон /Димрон |
| I-1-e | Димепиперат |
| I-1-e | IIe-5 |
| I-1-e | IIe-11 |
| I-1-f | Клоквинтоцет-мексил |
| I-1-f | Фенхлоразол-этил |
| I-1-f | Изоксадифен-этил |
| I-1-f | Мефенпир-диэтил |
| I-1-f | Фурилазол |
| I-1-f | Фенклорим |
| I-1-f | Кумилурон |
| I-1-f | Даймурон /Димрон |
| I-1-f | Димепиперат |
| I-1-f | IIe-5 |
| I-1-f | IIe-11 |
| I-1-g | Клоквинтоцет-мексил |
| I-1-g | Фенхлоразол-этил |
| I-1-g | Изоксадифен-этил |
| I-1-g | Мефенпир-диэтил |
| I-1-g | Фурилазол |
| I-1-g | Фенклорим |
| I-1-g | Кумилурон |
| I-1-g | Даймурон /Димрон |
| I-1-g | Димепиперат |
| I-1-g | IIe-5 |
| I-1-g | IIe-11 |
| I-2-a | Клоквинтоцет-мексил |
| I-2-a | Фенхлоразол-этил |
| I-2-a | Изоксадифен-этил |
| I-2-a | Мефенпир-диэтил |
| I-2-a | Фурилазол |
| I-2-a | Фенклорим |
| I-2-a | Кумилурон |
| I-2-a | Даймурон /Димрон |
| I-2-a | Димепиперат |
| I-2-a | IIe-5 |
| I-2-a | IIe-11 |
| I-2-b | Клоквинтоцет-мексил |
| I-2-b | Фенхлоразол-этил |
| I-2-b | Изоксадифен-этил |
| I-2-b | Мефенпир-диэтил |
| I-2-b | Фурилазол |
| I-2-b | Фенклорим |
| I-2-b | Кумилурон |

| Биологически активное вещество формулы (I) | Защитное вещество |
|--|---------------------|
| I-2-b | Даймурон / Димрон |
| I-2-b | Димепиперат |
| I-2-b | I Ie-5 |
| I-2-b | I Ie-11 |
| I-2-c | Клоквинтоцет-мексил |
| I-2-c | Фенхлоразол-этил |
| I-2-c | Изоксадифен-этил |
| I-2-c | Мефенпир-диэтил |
| I-2-c | Фурилазол |
| I-2-c | Фенклорим |
| I-2-c | Кумилурон |
| I-2-c | Даймурон / Димрон |
| I-2-c | Димепиперат |
| I-2-c | I Ie-5 |
| I-2-c | I Ie-11 |
| I-2-d | Клоквинтоцет-мексил |
| I-2-d | Фенхлоразол-этил |
| I-2-d | Изоксадифен-этил |
| I-2-d | Мефенпир-диэтил |
| I-2-d | Фурилазол |
| I-2-d | Фенклорим |
| I-2-d | Кумилурон |
| I-2-d | Даймурон / Димрон |
| I-2-d | Димепиперат |
| I-2-d | I Ie-5 |
| I-2-d | I Ie-11 |
| I-2-e | Клоквинтоцет-мексил |
| I-2-e | Фенхлоразол-этил |
| I-2-e | Изоксадифен-этил |
| I-2-e | Мефенпир-диэтил |
| I-2-e | Фурилазол |
| I-2-e | Фенклорим |
| I-2-e | Кумилурон |
| I-2-e | Даймурон / Димрон |
| I-2-e | Димепиперат |
| I-2-e | I Ie-5 |
| I-2-e | I Ie-11 |
| I-2-f | Клоквинтоцет-мексил |
| I-2-f | Фенхлоразол-этил |
| I-2-f | Изоксадифен-этил |
| I-2-f | Мефенпир-диэтил |
| I-2-f | Фурилазол |
| I-2-f | Фенклорим |
| I-2-f | Кумилурон |
| I-2-f | Даймурон / Димрон |
| I-2-f | Димепиперат |
| I-2-f | I Ie-5 |
| I-2-f | I Ie-11 |
| I-2-g | Клоквинтоцет-мексил |
| I-2-g | Фенхлоразол-этил |
| I-2-g | Изоксадифен-этил |
| I-2-g | Мефенпир-диэтил |
| I-2-g | Фурилазол |
| I-2-g | Фенклорим |
| I-2-g | Кумилурон |
| I-2-g | Даймурон / Димрон |
| I-2-g | Димепиперат |
| I-2-g | I Ie-5 |
| I-2-g | I Ie-11 |

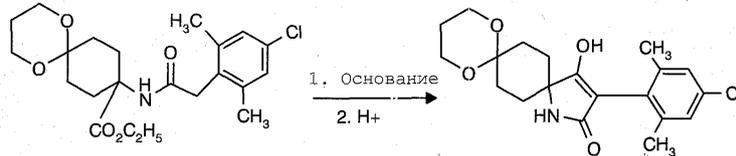
Неожиданно было открыто, что обсужденные выше комбинации биологически активных веществ, включающие соединения общей формулы (I) и защитные вещества (антидоты) приведенной группы (b'), при хорошей переносимости культурными растениями проявляют особенно высокую гербицидную активность и могут быть использованы в различных культурах растений, особенно в зерновых культурах (прежде всего в пшенице), а также в сое, картофеле, кукурузе и рисе для селективной борьбы с сорняками.

Неожиданным оказалось то, что из большого числа известных защитных веществ или антидотов, которые способны подавлять повреждающее действие гербицидов на культурные растения, именно приведенные выше соединения группы (b') подходят для того, чтобы почти полностью подавлять повреждающее действие замещенных циклических кетоенолов на культурные растения, не затрагивая при этом

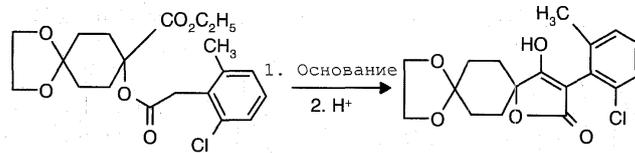
существенно гербицидную активность по отношению к сорнякам.

Очень важно при этом особенно предпочтительное действие более предпочтительных и наиболее предпочтительных компонентов комбинации из группы (b'), в частности, в связи с широким действием на растения зерновых культур, таких как, например, пшеница, ячмень, и рожь, а также, кукуруза и рис, в качестве культурных растений.

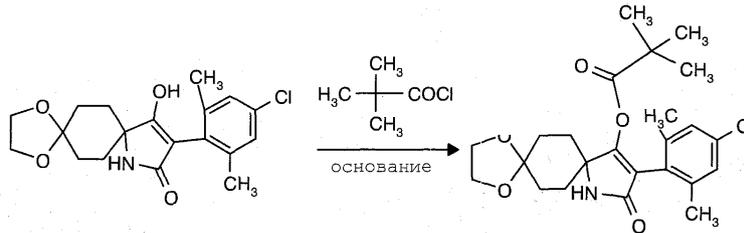
Если использовать, например, согласно способу (A) в качестве исходного вещества этиловый эфир N-[(4-хлор-2,6-диметил)фенилацетил]-1-амино-4,4'-пропилендиоксициклогексанкарбоновой кислоты, то осуществление способа согласно данному изобретению можно описать следующей схемой реакции:



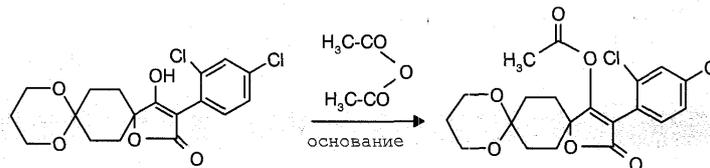
Если использовать, например, согласно способу (B) в качестве исходного вещества этиловый эфир O-[(2-хлор-6-метил)фенилацетил]-1-гидрокси-4,4'-этилендиоксициклогексанкарбоновой кислоты, то осуществление способа согласно данному изобретению можно описать следующей схемой реакции:



Если использовать, например, согласно способу (C, вариант α) в качестве исходных веществ 8,8'-этилендиокси-3-[(4-хлор-2,6-диметил)фенил]-1-азаспиро[4,5]декан-2,4-дион и пивалоилхлорид, то осуществление способа согласно данному изобретению можно описать следующей схемой реакции:



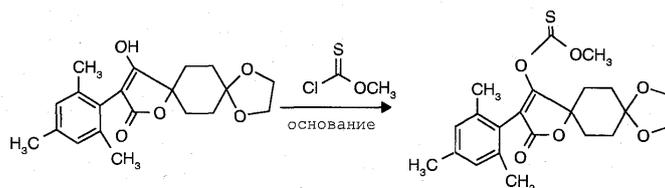
Если использовать, например, согласно способу (C, вариант β) в качестве исходных веществ 8,8'-пропилендиокси-3-[(2,4-дихлор)фенил]-1-оксапиро[4,5]декан-2,4-дион и ацетангидрид, то осуществление способа согласно данному изобретению можно описать следующей схемой реакции:



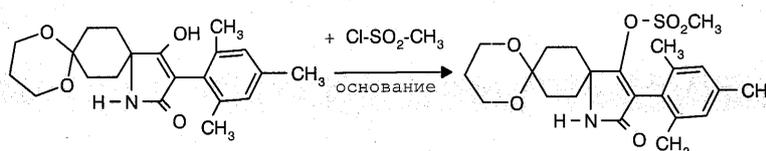
Если использовать, например, согласно способу (D) в качестве исходных веществ 8,8'-пропилендиокси-3-[(2,4-дихлор-6-метил)фенил]-1-азаспиро[4,5]декан-2,4-дион и этиловый эфир хлормуравьиной кислоты, то осуществление способа согласно данному изобретению можно описать следующей схемой реакции:



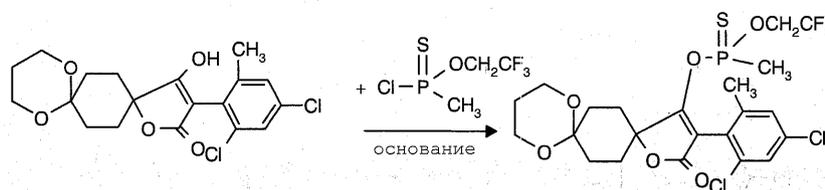
Если использовать, например, согласно способу (E) в качестве исходных веществ 8,8'-этилендиокси-3-[(2,4,6-триметил)фенил]-1-оксапиро[4,5]декан-2,4-дион и метиловый эфир хлормуравьиной кислоты, то осуществление способа согласно данному изобретению можно описать следующей схемой реакции:



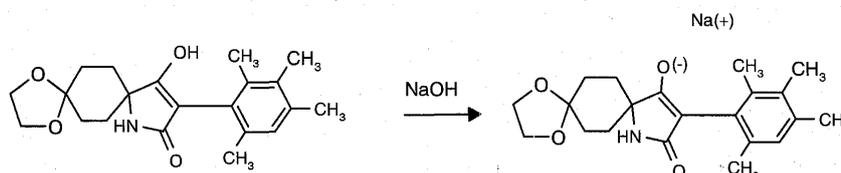
Если использовать, например, согласно способу (F) в качестве исходных веществ 8,8'-пропилендиокси-3-(2,4,6-триметил)фенил]-1-азаспиро[4,5]декан-2,4-дион и хлорид метансульфоновой кислоты, то осуществление способа согласно данному изобретению можно описать следующей схемой реакции:



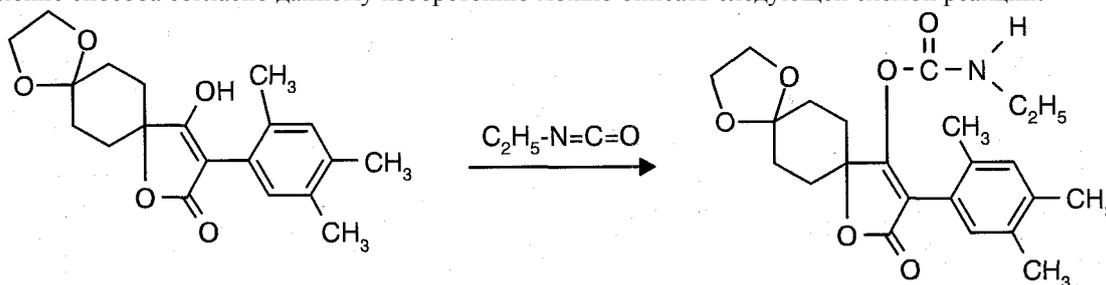
Если использовать, например, согласно способу (G) в качестве исходных веществ 8,8'-пропилендиокси-3-(2,4-дихлор-6-метил)фенил]-1-оксаспиро[4,5]декан-2,4-дион и хлорид 2,2,2-трифторэтилового эфира метантиофосфоновой кислоты, то осуществление способа согласно данному изобретению можно описать следующей схемой реакции:



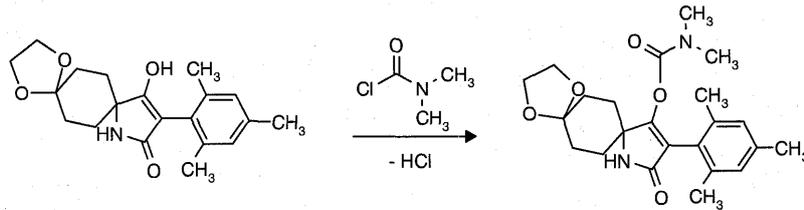
Если использовать, например, согласно способу (H) в качестве исходных веществ 8,8'-этилендиокси-3-(2,3,4,6-тетраметил)фенил]-1-азаспиро[4,5]декан-2,4-дион и NaOH, то осуществление способа согласно данному изобретению можно описать следующей схемой реакции:



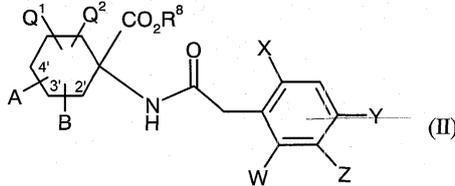
Если использовать, например, согласно способу (I, вариант а) в качестве исходных веществ 8,8'-этилендиокси-3-(2,4,5-триметил)фенил]-1-оксаспиро[4,5]декан-2,4-дион и этилизоцианат, то осуществление способа согласно данному изобретению можно описать следующей схемой реакции:



Если использовать, например, согласно способу (I, вариант b) в качестве исходных веществ 8,8'-этилендиокси-3-(2,4,6-триметил)фенил]-1-азаспиро[4,5]декан-2,4-дион и хлорид диметилкарбамидной кислоты, то осуществление способа согласно данному изобретению можно описать следующей схемой реакции:

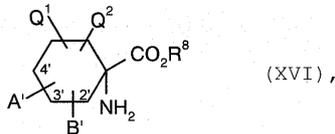


Соединения формулы (II), используемые в качестве исходных веществ при осуществлении способа (A) согласно данному изобретению

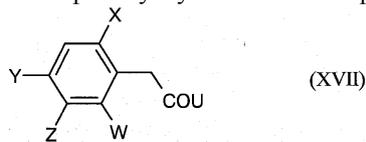


где A, B, Q¹, Q², W, X, Y, Z и R⁸ имеют значения, приведенные выше, являются новыми соединениями.

Эфиры ациламинной кислоты формулы (II) получают, например, когда производные аминокислоты формулы (XVI)

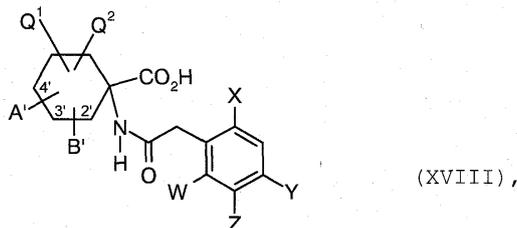


где A, B, Q¹ и Q² и R⁸ имеют значения, приведенные выше, ацилируют замещенными производными фенилуксусной кислоты формулы (XVII)



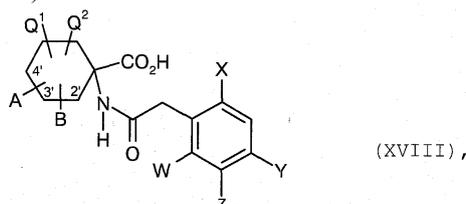
где W, X, Y и Z имеют значения, приведенные выше, и

U означает отщепляемую группу, вводимую с помощью активирующих реагентов карбоновой кислоты, таких как карбонилдиимдазол, карбонилдиимид (такой как, например, дициклогексил карбондиимид), фосфорилирующих реагентов (таких как, например, POCl₃, BOP-Cl), галоидирующих средств, таких как, например, тионилхлорид, оксалилхлорид, фосген или эфир хлормуравьиной кислоты (см. Chem. Reviews 52, 237-416 (1953); Bhattacharya, Indian J. Chem. 6, 341-5, 1968), или когда ациламино кислоты формулы (XVIII)



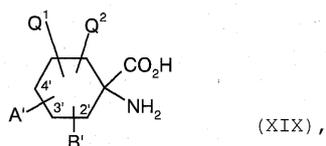
где A, B, Q¹, Q², W, X, Y и Z имеют значения, приведенные выше, подвергают перэтерификации (см. Chem. Ind. (London) 1568 (1968)).

Соединения формулы (XVIII)

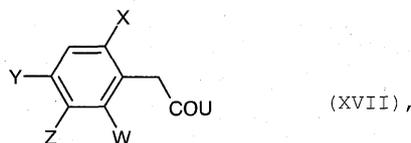


где A, B, Q¹, Q², W, X, Y и Z имеют значения, приведенные выше, являются новыми соединениями.

Соединения формулы (XVIII) получают, например, когда 1-аминоциклогексанкарбоновые кислоты формулы (XIX)



где A, B, Q¹ и Q² имеют значения, приведенные выше, ацилируют согласно Шоттен-Бауманну замещенными производными фенилуксусной кислоты формулы (XVII)

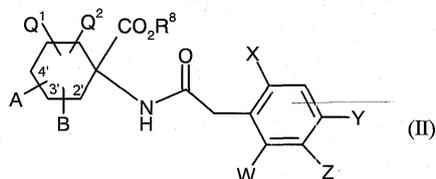


где U, W, X, Y и Z имеют значения, приведенные выше (см. Organikum, VEB Deutscher Verlag der Wissenschaften, Berlin, 1977, p. 505).

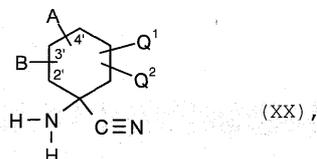
Соединения формулы (XVII) отчасти известны и/или могут быть получены известными способами, которые приведены в публикациях, цитированных в начале описания.

Соединения формулы (XVI) и (XIX) отчасти являются новыми соединениями и могут быть получены известными способами (см., например, Compagnon, Ann. Chim. (Paris) [14] 5, с. 11-22, 23-27 (1970), L. Munday, J. Chem. Soc. 4372 (1961); J. T. Eward, C. Jitrangeri, Can. J. Chem. 53, 3339 (1975)).

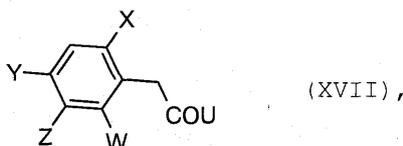
Далее исходные вещества формулы (II), используемые в приведенном выше способе (A)



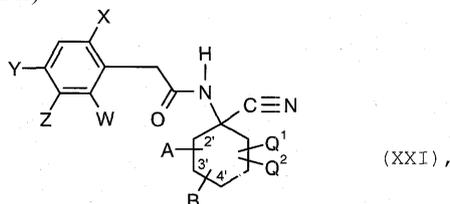
где A, B, Q¹, Q², W, X, Y, Z и R⁸ имеют значения, приведенные выше, могут быть получены, когда нитрилы 1-аминоциклогексанкарбоновой кислоты формулы (XX)



где A, B, Q¹ и Q² имеют значения, приведенные выше, подвергают взаимодействию с замещенными производными фенилуксусной кислоты формулы (XVII)



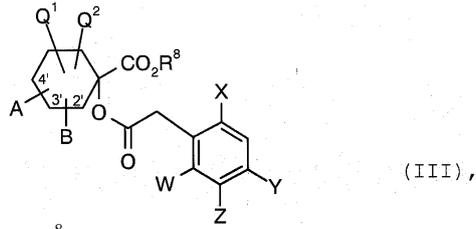
где U, W, X, Y и Z имеют значения, приведенные выше, получая соединения формулы (XXI)



где A, B, Q¹, Q², W, X, Y и Z имеют значения, приведенные выше, и эти соединения в заключение подвергают кислому алкоголизу.

Соединения формулы (XXI) также являются новыми соединениями. Соединения формулы (XX) отчасти являются новыми и могут быть, например, получены способом, описанным в EP-A-595130.

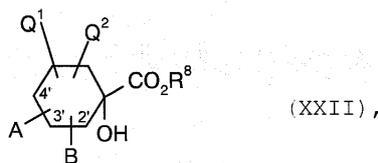
Используемые в качестве исходных веществ при осуществлении способа (B) согласно данному изобретению соединения формулы (III)



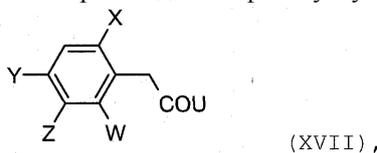
где A, B, Q¹, Q², W, X, Y, Z и R⁸ имеют значения, приведенные выше, являются новыми соединениями.

Они могут быть просто получены известными способами.

Соединения формулы (III) получают, например, когда эфир 1-гидроксициклогексанкарбоновой кислоты формулы (XXII)



где A, B, Q¹, Q² и R⁸ имеют значения, приведенные выше, подвергают ацилированию замещенными производными фенилуксусной кислоты формулы (XVII)



где U, W, X, Y и Z имеют значения, приведенные выше (см. Chem. Reviews 52, 237-416 (1953)).

Эфиры 1-гидрокси-3-алкоксициклогексилкарбоновых кислот формулы (XXII) являются новыми соединениями. Их получают, например, когда замещенные нитрилы 1-гидрокси-4,4'-алкилденил диоксициклогексанкарбоновых кислот подвергают согласно, например, Пиннеру взаимодействию со спиртами в присутствии кислот и образующиеся эфиры 1-гидрокси-4-оксоциклогексанкарбоновой кислоты, известные из WO 99/16748 (пример XXI-1) снова катализируют диолами. Циангидрин можно получить, например, при взаимодействии замещенных 4,4'-алкилденилдиоксициклогексан-1-онов с синильной кислотой (см. WO 99/16748).

Используемые для осуществления способов (C)-(J) согласно данному изобретению, а также в качестве исходных веществ галоидиды кислот формулы (IV), ангидриды карбоновых кислот формулы (V), эфиры или тиоэфиры хлормуравьиной кислоты формулы (VI), эфиры хлормонотиомуравьиной или эфиры хлордигтиомуравьиной кислоты формулы (VII), хлориды сульфоновой кислоты формулы (VIII), фосфорные соединения формулы (IX) и гидроксиды металлов, алкоксиды металлов или амины формул (X) и (XI), изоцианаты формулы (XII), хлориды карбамидной кислоты формулы (XIII) и диолы формулы (XV) являются известными соединениями органической, соответственно неорганической, химии. Соединения формулы (XIV) отчасти известны из WO 99/16748.

Соединения формулы (XVII) известны также из цитированных в начале описания патентных заявок и могут быть получены способами, которые приведены в них.

Способ (A) отличается тем, что соединения формулы (II), где A, B, Q¹, Q², W, X, Y, Z и R⁸ имеют значения, приведенные выше, подвергают внутримолекулярной конденсации в присутствии разбавителя и в присутствии основания.

В качестве разбавителя при осуществлении способа (A) согласно данному изобретению можно использовать органические растворители, инертные по отношению ко всем участникам реакции. Предпочтительно используют углеводороды, такие как толуол и ксилол, далее эфиры, такие как дибутиловый эфир, тетрагидрофуран, диоксан, диметиловый эфир гликоля и диметиловый эфир дигликоля, кроме того, полярные растворители, такие как диметилсульфоксид, сульфолан, диметилформамид и N-метилпирролидон, а также спирты, такие как метанол, этанол, пропанол, изопропанол, бутанол, изобутанол и трет-бутанол.

В качестве основания (депротонирующего средства) при осуществлении способа (A) согласно данному изобретению можно использовать все обычные акцепторы протонов. Предпочтительно используют оксиды, гидроксиды и карбонаты щелочных и щелочно-земельных металлов, такие как гидроксид натрия, гидроксид калия, оксид магния, оксид кальция, карбонат натрия, карбонат калия и карбонат кальция, которые можно использовать и в присутствии межфазных катализаторов, таких как, например, хлорид триэтилбензиламмония, бромид тетрабутиламмония, адоген 464 (=хлорид метилтри(C₈-C₁₀)алкиламмония) или TDA 1 (=трис-(метоксиэтил)амин). Далее можно использовать щелочные металлы, такие как натрий и калий. Кроме того, можно использовать амиды и гидриды щелочных и щелочно-земельных металлов, такие как амид натрия, гидрид натрия и гидрид кальция, а также алкоголяты щелочных металлов, такие как метилат натрия, этилат натрия и трет-бутилат калия.

Температуру реакции при осуществлении способа (A) согласно данному изобретению можно варьировать в широких пределах. Вообще работают при температурах от -75 до 200°C, более предпочтительно от -50 до 150°C.

Способ (A) согласно данному изобретению осуществляют, как правило, при нормальном давлении.

При осуществлении способа (A) согласно данному изобретению реакционный компонент формулы (II) и депротонирующее основание, как правило, используют от эквимолярного до примерно двух эквимолярных количеств. Однако возможно также, что один или другой компонент используют в большем избытке (до 3 моль).

Способ (B) отличается тем, что соединения формулы (III), где A, B, Q¹, Q², W, X, Y, Z и R⁸ имеют значения, приведенные выше, подвергают внутримолекулярной конденсации в присутствии разбавителя и в присутствии основания.

В качестве разбавителя при осуществлении способа (B) согласно данному изобретению можно использовать органические растворители, инертные по отношению ко всем участникам реакции. Предпочтительно используют углеводороды, такие как толуол и ксилол, далее эфиры, такие как дибутиловый эфир, тетрагидрофуран, диоксан, диметиловый эфир гликоля и диметиловый эфир дигликоля, кроме того, полярные растворители, такие как диметилсульфоксид, сульфолан, диметилформамид и N-метилпирролидон, а также спирты, такие как метанол, этанол, пропанол, изопропанол, бутанол, изобутанол и трет-бутанол.

В качестве основания (депротонирующего средства) при осуществлении способа (B) согласно данному изобретению можно использовать все обычные акцепторы протонов. Предпочтительно используют оксиды, гидроксиды и карбонаты щелочных и щелочно-земельных металлов, такие как гидроксид натрия, гидроксид калия, оксид магния, оксид кальция, карбонат натрия, карбонат калия и карбонат кальция, которые можно использовать и в присутствии межфазных катализаторов, таких как, например, хлорид триэтилбензиламмония, бромид тетрабутиламмония, адоген 464 (=хлорид метилтри(C₈-C₁₀)алкиламмония) или TDA 1 (=трис-(метоксиэтоксиэтил)амин). Далее можно использовать щелочные металлы, такие как натрий или калий. Кроме того, можно использовать амиды и гидриды щелочных и щелочно-земельных металлов, такие как амид натрия, гидрид натрия и гидрид кальция, а также алкоголяты щелочных металлов, такие как метилат натрия, этилат натрия и трет-бутилат калия.

Температуру реакции при осуществлении способа (B) согласно данному изобретению можно варьировать в широких пределах. Вообще работают при температурах от -75 до 200°C, более предпочтительно от -50 до 150°C.

Способ (B) согласно данному изобретению осуществляют, как правило, при нормальном давлении.

При осуществлении способа (B) согласно данному изобретению реакционный компонент формулы (III) и депротонирующее основание используют, как правило, в примерно эквимолярных количествах. Однако возможно также, что один или другой компонент используют в большем избытке (до 3 моль).

Способ (C, вариант α) отличается тем, что соединения формул (I-1-a)-(I-2-a) в каждом случае подвергают взаимодействию с галоидами карбоновой кислоты формулы (IV) при необходимости в присутствии разбавителя и при необходимости в присутствии средства, связывающего кислоту.

В качестве разбавителя при осуществлении способа (C, вариант α) обычно используют все растворители, инертные по отношению к галоидам кислот. Предпочтительно используют углеводороды, такие как бензин, бензол, толуол, ксилол и тетралин, далее галоидуглеводороды, такие как метиленхлорид, хлороформ, четыреххлористый углерод, хлорбензол и о-дихлорбензол, а также кетоны, такие как ацетон и метилизопропилкетон, далее эфиры, такие как диэтиловый эфир, тетрагидрофуран и диоксан, а также эфиры карбоновых кислот, такие как этилацетат, и также сильно полярные растворители, такие как диметилформамид, диметилсульфоксид и сульфолан. В случае, если позволяет стабильность к гидролизу галоида кислоты, взаимодействие можно проводить также в присутствии воды.

В качестве средства, связывающего кислоту, при взаимодействии по способу (C, вариант α) согласно данному изобретению пригодны все обычные акцепторы кислоты. Предпочтительно используют третичные амины, такие как триэтиламин, пиридин, диазабициклооктан (DABCO), диазабициклоундецен (DBU), диазабициклононен (DBN), основание Хьюнига и N,N-диметиланилин, оксиды щелочно-земельных металлов, такие как оксид магния и оксид кальция, а также карбонаты щелочных и щелочно-земельных металлов, такие как карбонат натрия, карбонат калия и карбонат кальция и гидроксиды щелочных металлов, такие как гидроксид натрия и гидроксид калия.

Температуру реакции при осуществлении способа (C, вариант α) согласно данному изобретению можно варьировать в широких пределах. Вообще работают при температурах от -20 до 150°C, более предпочтительно от 0 до 100°C.

При осуществлении способа (C, вариант α) согласно данному изобретению исходные вещества формул (I-1-a)-(I-2-a) и галоидид карбоновой кислоты формулы (IV), как правило, используют приблизительно в эквивалентных количествах. Однако также возможно, что галоидид карбоновой кислоты используют в большем избытке (до 5 моль).

Переработку проводят обычными способами.

Способ (C, вариант β) отличается тем, что соединения формул (I-1-a)-(I-2-a) в каждом случае подвергают взаимодействию с ангидридами карбоновых кислот формулы (V) при необходимости в присутствии разбавителя и при необходимости в присутствии средства, связывающего кислоту.

В качестве разбавителей при осуществлении способа (C, вариант β) согласно данному изобретению предпочтительно используют те же разбавители, которые используют и при применении галоидидов кислот. В частности, в качестве разбавителя может одновременно служить и взятый в избытке ангидрид карбоновой кислоты.

В качестве добавляемого при необходимости средства, связывающего кислоту, подходят в случае способа (С, вариант β) предпочтительно те средства, связывающие кислоту, которые предпочтительно используют и при применении галоидидов кислот.

Температуру реакции при осуществлении способа (С, вариант β) согласно данному изобретению можно варьировать в широких пределах. Вообще работают при температурах от -20 до 150°C, более предпочтительно от 0 до 100°C.

При осуществлении способа (С, вариант β) согласно данному изобретению исходные вещества формул (I-1-a)-(I-2-a) и ангидрид карбоновой кислоты формулы (V) используют, как правило, в каждом случае приблизительно в эквивалентных количествах. Однако возможно также, что ангидрид карбоновой кислоты используют в большем избытке (до 5 моль). Переработку осуществляют обычными способами.

Вообще поступают таким образом, что разбавитель и находящийся в избытке ангидрид карбоновой кислоты, а также образовавшуюся карбоновую кислоту удаляют перегонкой или промыванием органическим растворителем или водой.

Способ (D) отличается тем, что соединения формул (I-1-a)-(I-2-a) в каждом случае подвергают взаимодействию с эфирами или тиоэфирами хлормуравьиной кислоты формулы (VI) при необходимости в присутствии разбавителя и при необходимости в присутствии средства, связывающего кислоту.

В качестве средства, связывающего кислоту, в случае способа (D) согласно данному изобретению подходят все обычные акцепторы кислоты. Предпочтительно используют третичные амины, такие как триэтиламин, пиридин, диазабициклооктан (DABCO), диазабициклоундецен (DBU), диазабициклононен (DBN), основание Хьюнига и N,N-диметиланилин, оксиды щелочно-земельных металлов, такие как оксид магния и оксид кальция, а также карбонаты щелочных и щелочно-земельных металлов, такие как карбонат натрия, карбонат калия и карбонат кальция и гидроксиды щелочных металлов, такие как гидроксид натрия и гидроксид калия.

В качестве разбавителей при осуществлении способа (D) согласно данному изобретению можно использовать все растворители, инертные по отношению к эфирам хлормуравьиной кислоты, соответственно тиоэфирам хлормуравьиной кислоты.

Предпочтительно используют углеводороды, такие как бензин, бензол, толуол, ксилол и тетралин, далее галоидуглеводороды, такие как метиленхлорид, хлороформ, четыреххлористый углерод, хлорбензол и о-дихлорбензол, а также кетоны, такие как ацетон и метилизопропилкетон, далее эфиры, такие как диэтиловый эфир, тетрагидрофуран и диоксан, а также эфиры карбоновых кислот, такие как этилацетат, кроме того, нитрилы, такие как ацетонитрил, и также сильно полярные растворители, такие как диметилформамид, диметилсульфоксид и сульфолан.

Температуру реакции при осуществлении способа (D) согласно данному изобретению можно варьировать в широких пределах. Вообще работают при температурах от -20 до 100°C, более предпочтительно от 0 до 50°C.

Способ (D) согласно данному изобретению вообще осуществляют при нормальном давлении.

При осуществлении способа (D) согласно данному изобретению исходные вещества формул (I-1-a)-(I-2-a) и соответствующие эфир хлормуравьиной кислоты, тиоэфир хлормуравьиной кислоты формулы (VI) используют, как правило, приблизительно в эквивалентных количествах. Однако возможно также, что один или другой компонент берут в большем избытке (до 2 моль). Переработку проводят обычными способами. Вообще поступают таким образом, что соль, выпадающую в осадок, удаляют, а из оставшейся реакционной смеси удаляют растворитель.

Способ (E) согласно данному изобретению отличается тем, что соединения формул (I-1-a)-(I-2-a) в каждом случае подвергают взаимодействию с соединениями формулы (VII) в присутствии разбавителя и при необходимости в присутствии средства, связывающего кислоту.

В случае способа получения (E) используют на 1 моль исходных соединений формул (I-1-a)-(I-2-a) около 1 моль эфира хлормонотиомуравьиной кислоты, соответственно эфира хлордитиомуравьиной кислоты формулы (VII) при температуре от 0 до 120°C, более предпочтительно от 20 до 60°C.

В качестве добавляемых при необходимости разбавителей подходят все инертные полярные органические растворители, такие как простые эфиры, амиды, сульфоны, сульфоксиды, а также галоидалканы.

Предпочтительно используют диметилсульфоксид, тетрагидрофуран, диметилформамид, этиловый эфир уксусной кислоты или метиленхлорид.

В том случае, когда в одном из предпочтительных вариантов изобретения в результате добавления сильных депротонирующих средств, таких как гидрид натрия и трет-бутилат калия, получают енолятную соль соединений (I-1-a)-(I-2-a), можно пренебречь дальнейшим добавлением средств, связывающих кислоту.

В качестве оснований при осуществлении способа (E) можно использовать все обычные акцепторы протонов. Предпочтительно используют гидриды щелочных металлов, алкоголяты щелочных металлов, карбонаты или гидрокарбонаты щелочных или щелочно-земельных металлов или азотные основания. Следует назвать, например, гидрид натрия, метанолат натрия, гидроксид натрия, гидроксид кальция, карбонат калия, гидрокарбонат натрия, триэтиламин, дибензиламин, диизопропиламин, пиридин, хино-

лин, диазабициклооктан (DABCO), диазабициклононен (DBN) и диазабициклоундецен (DBU).

Реакцию можно осуществлять при нормальном и повышенном давлении, предпочтительно работают при нормальном давлении. Переработку проводят обычными способами.

Способ (F) согласно данному изобретению отличается тем, что соединения формул (I-1-a)-(I-2-a) подвергают в каждом случае взаимодействию с хлоридами сульфоновой кислоты формулы (VIII) при необходимости в присутствии разбавителя и при необходимости в присутствии средства, связывающего кислоту.

В случае способа получения (F) используют на 1 моль исходного соединения формулы (I-1-a)-(I-2-a) примерно 1 моль хлорида сульфоновой кислоты формулы (VIII), реакцию осуществляют при температуре от -20 до 150°C, более предпочтительно при температуре от 0 до 70°C.

Способ (F) предпочтительно осуществляют в присутствии разбавителя.

В качестве разбавителей подходят все инертные полярные органические растворители, такие как простые эфиры, амиды, кетоны, эфиры карбоновых кислот, нитрилы, сульфоны, сульфоксиды или галоидированные углеводороды, такие как метиленхлорид.

Предпочтительно используют диметилсульфоксид, тетрагидрофуран, диметилформамид, этиловый эфир уксусной кислоты или метиленхлорид.

В том случае, когда в предпочтительном варианте изобретения добавлением сильных депротонирующих средств (таких как гидрид натрия или трет-бутилат калия) получают енолятную соль соединений (I-1-a)-(I-2-a), можно пренебречь дальнейшим добавлением средств, связывающих кислоту.

Когда используют средства, связывающие кислоту, то имеются в виду обычные неорганические или органические основания, в качестве примера следует назвать гидроксид натрия, карбонат натрия, карбонат калия, пиридин и триэтиламин.

Реакцию можно осуществлять при нормальном и повышенном давлении, предпочтительно работают при нормальном давлении. Переработку проводят обычными способами.

Способ (G) согласно данному изобретению отличается тем, что соединения формул (I-1-a)-(I-2-a) в каждом случае подвергают взаимодействию с фосфорными соединениями формулы (IX) при необходимости в присутствии разбавителя и при необходимости в присутствии средства, связывающего кислоту.

В случае способа получения (G) для получения соединений формул (I-1-e)-(I-2-e) берут на 1 моль соединений (I-1-a)-(I-2-a) от 1 до 2 моль, более предпочтительно от 1 до 1,3 моль фосфорного соединения формулы (IX). Реакцию проводят при температуре от -40 до 150°C, более предпочтительно от -10 до 110°C.

Способ (G) предпочтительно осуществляют в присутствии разбавителя.

В качестве разбавителей подходят все инертные полярные органические растворители, такие как простые эфиры, эфиры карбоновых кислот, галоидированные углеводороды, кетоны, амиды, нитрилы, сульфоны, сульфоксиды и т.п.

Предпочтительно используют ацетонитрил, диметилсульфоксид, тетрагидрофуран, диметилформамид, метиленхлорид.

В качестве добавляемых при необходимости средств, связывающих кислоту, подходят все обычные неорганические и органические основания, такие как гидроксиды, карбонаты или амины. В качестве примера следует привести гидроксид натрия, карбонат натрия, карбонат калия, пиридин и триэтиламин.

Взаимодействие можно осуществлять при нормальном и повышенном давлении, предпочтительно работают при нормальном давлении.

Переработку проводят обычными способами органической химии. Очистку конечных продуктов предпочтительно осуществляют кристаллизацией, хроматографическим способом или отгонкой летучих компонентов в вакууме.

Способ (H) отличается тем, что соединения формул (I-1-a)-(I-2-a) подвергают в каждом случае взаимодействию с гидроксидами металлов, соответственно, алкоксидами металлов формулы (X) или с аминами формулы (XI), при необходимости в присутствии разбавителя.

В качестве разбавителя при осуществлении способа (H) согласно данному изобретению предпочтительно используют эфиры, такие как тетрагидрофуран, диоксан, диэтиловый эфир, а также спирты, такие как метанол, этанол, изопропанол, а также воду. Способ (H) согласно данному изобретению осуществляют обычно при нормальном давлении. Температура реакции обычно составляет от -20 до 100°C, более предпочтительно от 0 до 50°C.

Способ (I) согласно данному изобретению отличается тем, что соединения формул (I-1-a)-(I-2-a) в каждом случае подвергают взаимодействию (I, вариант a) с соединениями формулы (XII) при необходимости в присутствии разбавителя и при необходимости в присутствии катализатора или (I, вариант b) с соединениями формулы (XIII) при необходимости в присутствии разбавителя и при необходимости в присутствии средства, связывающего кислоту.

В случае способа получения (I, вариант a) берут на 1 моль исходного соединения формул (I-1-a)-(I-2-a) около 1 моль изоцианата формулы (XII). Температура реакции обычно составляет от 0 до 100°C, более предпочтительно от 20 до 50°C.

Способ (I, вариант а) предпочтительно осуществляют в присутствии разбавителя.

В качестве разбавителей подходят все инертные органические растворители, такие как ароматические углеводороды, галоидированные углеводороды, простые эфиры, амиды, нитрилы, сульфоны или сульфоксиды.

При необходимости для ускорения реакции можно добавлять катализаторы. В качестве катализаторов можно очень предпочтительно использовать оловоорганические соединения, такие как, например, дибутилоловодилаурат.

Работают предпочтительно при нормальном давлении.

В случае способа получения (I, вариант б) берут на 1 моль исходного соединения формул (I-1-a)-(I-2-a) около 1 моль хлорида карбамидной кислоты формулы (XIII). Температура реакции обычно составляет от 0 до 150°C, более предпочтительно от 20 до 70°C.

В качестве разбавителей, добавляемых при необходимости, подходят все инертные полярные органические растворители, такие как простые эфиры, эфиры карбоновых кислот, нитрилы, кетоны, амиды, сульфоны, сульфоксиды или галоидированные углеводороды.

Предпочтительно используют диметилсульфоксид, тетрагидрофуран, диметилформамид или метилхлорид.

В том случае, когда в предпочтительном варианте изобретения добавлением сильных депротонирующих средств (таких как гидрид натрия или трет-бутилат калия) получают енолятную соль соединений (I-1-a)-(I-2-a), можно пренебречь дальнейшим добавлением средств, связывающих кислоту.

Когда используют средства, связывающие кислоту, то имеют в виду обычные неорганические и органические основания, в качестве примера следует назвать гидроксид натрия, карбонат натрия, карбонат калия, триэтиламин или пиридин.

Реакцию можно осуществлять при нормальном или повышенном давлении, предпочтительно работают при нормальном давлении. Переработку проводят обычными способами.

В случае способа получения (J) берут на 1 моль исходного соединения (I-1-a)-(I-1-g) или (I-2-a)-(I-2-g) до 50 моль диола формулы (XVI), более предпочтительно от 1 до 10 моль. Температура реакции обычно составляет от -50 до 250°C, более предпочтительно от 0 до 150°C.

В качестве разбавителей подходят все инертные органические растворители, такие как ароматические углеводороды, галоидированные углеводороды, простые эфиры, сложные эфиры, амиды, нитрилы, сульфоны или сульфоксиды.

При необходимости для ускорения реакции можно добавлять катализаторы. В качестве катализаторов предпочтительно используют кислоты, такие как, например, *p*-толуолсульфоновая кислота, концентрированная серная кислота, а также кислоты Льюиса, такие как, например, бортрифторэтерат.

Работают предпочтительно при нормальном давлении.

Реакцию обезвоживания можно осуществлять как азеотропным удалением воды, так и добавлением подходящих реагентов, отбирающих воду, таких как, например, ортоэфир муравьиной кислоты, диметоксипропан, а также молекулярное сито.

Переработку осуществляют обычными способами.

Биологически активные вещества/комбинации биологически активных веществ, благодаря хорошей переносимости культурными растениями, благоприятной токсичности для теплокровных животных и хорошей переносимости окружающей средой, подходят для защиты растений и органов растений, для повышения урожайности, улучшения качества продуктов урожая и для борьбы с животными-вредителями, в частности, с насекомыми, паукообразными животными, гельминтами, нематодами и моллюсками, которые встречаются в сельском хозяйстве, в садоводстве, в животноводстве, в лесах, в садах и местах отдыха, при защите запасов и защите материалов, а также в секторе гигиены. Предпочтительно их можно применять при защите растений. Они эффективны по отношению к нормальным и устойчивым, видам, а также по отношению ко всем или к отдельным стадиям развития. К упомянутым выше вредителям относятся следующие виды.

Виды отряда аноплура (фтираптера) (*Anoplura* (*Phthiraptera*)), например *Damalinea* spp., *Haematopinus* spp., *Linognathus* spp., *Pediculus* spp., *Trichodectes* spp.

Виды класса арахнида (*Arachnida*), например *Acarus siro*, *Aceria sheldoni*, *Aculops* spp., *Aculus* spp., *Amblyomma* spp., *Argas* spp., *Boophilus* spp., *Brevipalpus* spp., *Bryobia praetiosa*, *Chorioptes* spp., *Dermanyssus gallinae*, *Eotetranychus* spp., *Epitrimerus pyri*, *Eutetranychus* spp., *Eriophyes* spp., *Hemitarsonemus* spp., *Hyalomma* spp., *Ixodes* spp., *Latrodectus mactans*, *Metatetranychus* spp., *Oligonychus* spp., *Ornithodoros* spp., *Panonychus* spp., *Phyllocoptura oleivora*, *Polyphagotarsonemus latus*, *Psoroptes* spp., *Rhipicephalus* spp., *Rhizoglyphus* spp., *Sarcoptes* spp., *Scorpio maurus*, *Stenotarsonemus* spp., *Tarsonemus* spp., *Tetranychus* spp., *Vasates lycopersici*.

Виды класса бивалва (*Bivalva*), например *Dreissena* spp.

Виды отряда хилопода (*Chilopoda*), например *Geophilus* spp., *Scutigera* spp.

Виды отряда колеоптера (*Coleoptera*), например *Acanthoscelides obtectus*, *Adoretus* spp., *Agelastica alni*, *Agriotes* spp., *Amphimallon solstitialis*, *Anobium punctatum*, *Anoplophora* spp., *Anthonomus* spp., *Anthrenus* spp., *Apogonia* spp., *Atomaria* spp., *Attagenus* spp., *Bruchidius obtectus*, *Bruchus* spp.,

Ceuthorhynchus spp., Cleonus mendicus, Conoderus spp., Cosmopolites spp., Costelytra zealandica, Curculio spp., Cryptorhynchus lapathi, Dermestes spp., Diabrotica spp., Epilachna spp., Faustinus cubae, Gibbium psylloides, Heteronychus arator, Hylamorpha elegans, Hylotrupes bajulus, Hypera postica, Hypothenemus spp., Lachnosterna consanguinea, Leptinotarsa decemlineata, Lissorhoptrus oryzophilus, Lixus spp., Lyctus spp., Meligethes aeneus, Melolontha melolontha, Migdolus spp., Monochamus spp., Naupactus xanthographus, Niptus hololeucus, Oryctes rhinoceros, Oryzaephilus surinamensis, Otiorrhynchus sulcatus, Oxycetonia jucunda, Phaedon cochleariae, Phyllophaga spp., Popillia japonica, Premnotypes spp., Psylliodes chrysocephala, Ptinus spp., Rhizobius ventralis, Rhizopertha dominica, Sitophilus spp., Sphenophorus spp., Sternechus spp., Symphyletes spp., Tenebrio molitor, Tribolium spp., Trogoderma spp., Tychius spp., Xylotrechus spp., Zabrus spp.

Виды отряда коллембола (Collembola), например Onychiurus armatus.

Виды отряда дермаптера (Dermaptera), например Forficula auricularia.

Виды отряда диплопода (Diplopoda), например Blaniulus guttulatus.

Виды отряда диптера (Diptera), например Aedes spp., Anopheles spp., Bibio hortulanus, Calliphora erythrocephala, Ceratitis capitata, Chrysomya spp., Cochliomyia spp., Cordylobia anthropophaga, Culex spp., Cuterebra spp., Dacus oleae, Dermatobia hominis, Drosophila spp., Fannia spp., Gastrophilus spp., Hylemyia spp., Huppobosca spp., Hypoderma spp., Liriomyza spp., Lucilia spp., Musca spp., Nezara spp., Oestrus spp., Os-cinella frit, Pegomyia hyoscyami, Phorbia spp., Stomoxys spp., Tabanus spp., Tannia spp., Tipula paludosa.

Виды класса гастропода (Gastropoda), например Arion spp., Biomphalaria spp., Bulinus spp., Deroceras spp., Galba spp., Lymnaea spp., Oncomelania spp., Succinea spp.

Виды класса гельминтов, например Ancylostoma duodenale, Ancylostoma ceylanicum, Ancylostoma braziliense, Ancylostoma spp., Ascaris lubricoides, Ascaris spp., Brugia malayi, Brugia timori, Bunostomum spp., Chabertia spp., Clonorchis spp., Cooperia spp., Dicrocoelium spp., Dictyocaulus filaria, Diphylobothrium latum, Dracunculus medinensis, Echinococcus granulosus, Echinococcus multilocularis, Enterobius vermicularis, Faciola spp., Haemonchus spp., Heterakis spp., Hymenolepis nana, Hyostrombulus spp., Loa Loa, Nematodirus spp., Oesophagostomum spp., Opisthorchis spp., Onchocerca volvulus, Ostertagia spp., Paragonimus spp., Schistosomen spp., Strongyloides fuelleborni, Strongyloides stercoralis, Strongyloides spp., Taenia saginata, Taenia solium, Trichinella spiralis, Trichinella nativa, Trichinella britovi, Trichinella nelsoni, Trichinella pseudospiralis, Trichostrongylus spp., Trichuris trichuria, Wuchereria bancrofti.

Далее возможна борьба с протозоями (Protozoen), такими как Eimeria.

Виды отряда гетероптера (Heteroptera), например Anasa tristis, Antestiopsis spp., Blissus spp., Calocoris spp., Campylomma livida, Cavalerius spp., Cimex spp., Creontiades dilutus, Dasynus piperis, Dichelops furcatus, Diconocoris hewetti, Dysdercus spp., Euschistus spp., Eurygaster spp., Heliopeltis spp., Horcias nobillellus, Leptocoris spp., Leptoglossus phyllopus, Lygus spp., Macropes excavatus, Miridae, Nezara spp., Oebalus spp., Pentomidae, Piesma quadrata, Piezodorus spp., Psallus seriatus, Pseudacysta perseae, Rhodnius spp., Sahlbergella singularis, Scotinophora spp., Stephanitis nashi, Tibraca spp., Triatoma spp.

Виды отряда гомоптера (Homoptera), например Acyrthosipon spp., Aeneolamia spp., Agonoscena spp., Aleurodes spp., Aleurolobus barodensis, Aleurothrixus spp., Amrasca spp., Anuraphis cardui, Aonidiella spp., Aphanostigma piri, Aphis spp., Arboridia apicalis, Aspidiella spp., Aspidiotus spp., Atanus spp., Aulacorthum solani, Bemisia spp., Brachycaudus helichrysi, Brachycolus spp., Brevicoryne brassicae, Calligypona marginata, Carnecephala fulgida, Ceratovacuna lanigera, Cercopidae, Ceroplastes spp., Chaetosiphon fragaefolii, Chionaspis tegalensis, Chlorita onukii, Chromaphis juglandicola, Chrysomphalus ficus, Cicadulina mbila, Coccomytilus halli, Coccus spp., Cryptomyzus ribis, Dalbulus spp., Dialeurodes spp., Diaphorina spp., Diaspis spp., Drosicha spp., Dysaphis spp., Dysmicoccus spp., Empoasca spp., Eriosoma spp., Erythroneura spp., Euscelis bilobatus, Geococcus coffeae, Homalodisca coagulata, Hyalopterus arundinis, Icerya spp., Idiocerus spp., Idioscopus spp., Laodelphax striatellus, Lecanium spp., Lepidosaphes spp., Lipaphis erysimi, Macrosiphum spp., Mahanarva fimbriolata, Melanaphis sacchari, Metcalfiella spp., Metopolophium dirhodum, Monellia costalis, Monelliopsis pecanis, Myzus spp., Nasonovia ribisnigri, Nephrotettix spp., Nilaparvata lugens, Oncometopia spp., Orthezia praelonga, Parabemisia myricae, Paratrioza spp., Parlatoria spp., Pemphigus spp., Peregrinus maidis, Phenacoccus spp., Phloeomyzus passerinii, Phorodon humuli, Phylloxera spp., Pinnaspis aspidistrae, Planococcus spp., Protopulvinaria pyriformis, Pseudaulacaspis poentagona, Pseudococcus spp., Psylla spp., Pteromalus spp., Pyrilla spp., Quadraspidiotus spp., Quesada gigas, Rastrococcus spp., Rhopa-losiphum spp., Saissetia spp., Scaphoides titanus, Schizaphis graminum, Selenaspis articulatus, Sogata spp., Sogatella furcifera, Sogatodes spp., Stictocephala festina, Tenalaphara malayensis, Tinocallis caryaefoliae, Tomaspis spp., Toxoptera spp., Trialeurodes vaporariorum, Trioza spp., Typhlocyba spp., Unaspis spp., Viteus vitifolii.

Виды отряда гименоптера (Hymenoptera), например Diprion spp., Hoplocampa spp., Lasius spp., Monomorium pharaonis, Vespa spp.

Виды отряда изопода (Isopoda), например Armadillidium vulgare, Oniscus asellus, Porcellio scaber.

Виды отряда изоптера (Isoptera), например Reticulitermes spp.

Виды отряда лепидоптера (Lepidoptera), например Acronicta major, Aedia leucomelas, Agrotis spp., Alabama argillacea, Anticarsia spp., Barathra brassicae, Bucculatrix thurberiella, Bupalus piniarius, Cacoccia podana, Capua reticulana, Carpocapsa pomonella, Cheimatobia brumata, Chilo spp., Choristoneura fumiferana,

Clysia ambiguella, *Cnaphalocerus* spp., *Earias insulana*, *Ephestia kuehniella*, *Euproctis chryorrhoea*, *Euxoa* spp., *Feltia* spp., *Galleria mellonella*, *Helicoverpa* spp., *Heliothis* spp., *Hofmannophila pseudospretella*, *Homona magnanima*, *Hyponomeuta padella*, *Laphygma* spp., *Lithocolletis blancardella*, *Lithophane antennata*, *Loxagrotis albicosta*, *Lymantria* spp., *Malacosoma neustria*, *Mamestra brassicae*, *Mocis repanda*, *Mythimna separata*, *Oria* spp., *Oulema oryzae*, *Panolis flammea*, *Pectinophora gossypiella*, *Phyllocnistis citrella*, *Pieris* spp., *Plutella xylostella*, *Prodenia* spp., *Pseudaletia* spp., *Pseudoplusia includens*, *Pyrausta nubilalis*, *Spodoptera* spp., *Thermesia gemmatalis*, *Tinea pellionella*, *Tineola bisselliella*, *Tortrix viridana*, *Trichoplusia* spp.

Виды отряда ортоптера (Orthoptera), например *Acheta domesticus*, *Blatta orientalis*, *Blattella germanica*, *Grylotalpa* spp., *Leucophaea maderae*, *Locusta* spp., *Melanoplus* spp., *Periplaneta americana*, *Schistocerca gregaria*.

Виды отряда сифонаптера (Siphonaptera), например *Ceratophyllus* spp., *Xenopsylla cheopis*.

Виды отряда симфила (Symphyla), например *Scutigera* spp.

Виды отряда тисаноптера (Thysanoptera), например *Baliothrips biformis*, *Enneothrips flavens*, *Frankliniella* spp., *Heliothrips* spp., *Hercinothrips femoralis*, *Rhipiphorothrips cruentatus*, *Scirtothrips* spp., *Taeniothrips cardamoni*, *Thrips* spp.

Виды отряда тисанура (Thysanura), например *Lepisma saccharina*.

К нематодам, паразитирующим на растениях, относятся, например, *Aphelenchoides* spp., *Bursaphelenchus* spp., *Ditylenchus dipsaci*, *Globodera* spp., *Heterodera* spp., *Longidorus* spp., *Meloidogyne* spp., *Pratylenchus* spp., *Radopholus similis*, *Trichodorus* spp., *Tylenchulus semipenetrans*, *Xiphinema* spp.

Биологически активные вещества/комбинации биологически активных веществ согласно данному изобретению могут при необходимости в определенных концентрациях, соответственно расходных количествах, также использоваться в качестве гербицидов, защитных веществ, регуляторов роста или средств, улучшающих свойства растений, или в качестве микробицидов, например в качестве фунгицидов, антимикотиков, бактерицидов, вирицидов (включая средства против виридов) или в качестве средств против MLO (организмов, подобных микоплазме) и RLO (организмов, подобных риккетсии). Их можно также использовать в качестве промежуточных или исходных продуктов для синтеза других биологически активных веществ.

Согласно данному изобретению можно обрабатывать растения целиком или части растений. При этом под растениями понимают все растения и популяции растений, такие как желательные и нежелательные дикие и культурные растения (включая встречающиеся в природе культурные растения). Культурные растения могут быть растениями, полученными традиционными методами выращивания и оптимизирования или методами биотехнологии и генной инженерии или комбинацией этих методов, включая трансгенные растения и включая сорта растений, защищенные и незащищенные законом по защите сортов. Под частями растений следует понимать все надземные и подземные части и органы растений, такие как побег (отросток), лист, цветок и корень, причем включаются, например, листья, иголки, стебли, стволы, цветы, плоды и семена, а также корни, клубни, корневища. К частям растения относят также товарный продукт урожая, а также вегетативный и генеративный материал для размножения, например, черенки, клубни, корневища, отводки и семена.

Обработка согласно данному изобретению растений или частей растений биологически активными веществами/комбинациями биологически активных веществ происходит непосредственно или путем воздействия на их окружающую среду, место обитания или складские помещения обычными методами обработки, например путем окунания, опрыскивания, обработки паром, распыления, рассеивания, нанесения, впрыскивания, а в случае материала для размножения, в особенности семян, путем формирования на них одно- или многослойных оболочек.

Биологически активные вещества/комбинации биологически активных веществ могут быть переведены в обычные препараты, такие как растворы, эмульсии, порошки для опрыскивания, суспензии на водной или масляной основе, порошки, распыляемые средства, пасты, растворимые порошки, растворимые грануляты, грануляты для рассыпания, суспензионно-эмульсионные концентраты, природные или синтетические вещества, пропитанные биологически активным веществом, удобрения, а также мелкие капсулы в полимерных веществах.

Эти препараты получают известными способами, например при смешивании биологически активных веществ/комбинаций биологически активных веществ с наполнителями, т.е. с жидкими растворителями и/или с твердыми носителями, при необходимости, с применением поверхностно-активных средств, т.е. эмульгаторов, и/или диспергирующих средств, и/или пенообразующих средств.

В случае использования воды в качестве наполнителя могут быть также использованы, например, органические растворители в качестве вспомогательных средств для растворения. В качестве жидких растворителей имеют в виду в существенной мере ароматические соединения, такие как ксилол, толуол или алкилнафталины, хлорированные ароматические соединения и хлорированные алифатические углеводороды, такие как хлорбензолы, хлорэтилены или метилхлорид, алифатические углеводороды, такие как циклогексан или парафины, например фракции нефтей, минеральные и растительные масла, спирты, такие как бутанол или глицоль, а также их простые и сложные эфиры, кетоны, такие как ацетон, метилэтилкетон, метилизобутилкетон или циклогексанон, сильно полярные растворители, такие как ди-

метилформамид и диметилсульфоксид, а также воду.

В качестве твердых носителей имеются в виду, например, аммониевые соли и помолы природных горных пород, такие как каолины, глиноземы, тальк, мел, кварц, аттапульгит, монтмориллонит или диатомовая земля, и помолы синтетических камней, такие как высокодисперсная кремниевая кислота, оксид алюминия и силикаты.

В качестве носителей для гранулятов имеются в виду, например, измельченные и фракционированные природные горные породы, такие как кальцит, мрамор, пемза, сепиолит, доломит, а также синтетические грануляты из помолов неорганических и органических материалов, а также грануляты из органического материала, такого как древесные опилки, скорлупа кокосовых орехов, кукурузные початки и стебли табака.

В качестве эмульгирующих и/или пенообразующих средств имеются в виду, например, неионогенные и анионные эмульгаторы, такие как эфиры полиоксиэтилена с жирной кислотой, эфиры полиоксиэтилена с жирным спиртом, например, алкиларилпиплигликолевый эфир, алкилсульфонаты, алкилсульфаты, арилсульфонаты, а также гидролизаты яичного белка; в качестве диспергирующих средств имеются в виду, например, лигнин-сульфитовые щелоки и метилцеллюлоза.

В препаратах могут использоваться адгезионные средства, такие как карбоксиметилцеллюлоза, природные или синтетические, порошкообразные, зернистые или латексной формы полимеры, такие как гуммиарабик, поливиниловый спирт, поливинилацетат, а также природные фосфолипиды, такие как кефалины и лецитины, и синтетические фосфолипиды. Другими добавками могут быть минеральные и растительные масла.

Могут быть использованы красители, такие как неорганические пигменты, например, оксид железа, оксид титана, ферроциан синий, и органические красители, такие как ализариновые, азо- и металлфталоцианиновые красители и следовые количества питательных веществ, таких как соли железа, марганца, бора, меди, кобальта, молибдена и цинка.

Препараты содержат, как правило, от 0,1 до 95 вес.% биологически активных веществ, включая защитные биологически активные вещества, более предпочтительно от 0,5 до 90 вес.%.

Биологически активные вещества/комбинации биологически активных веществ согласно данному изобретению могут применяться как в виде их препаратов, имеющих в продаже, так и в виде форм, готовых для применения, приговленных из этих препаратов в смеси с другими биологически активными веществами, такими как инсектициды, аттрактанты, стерилианты, бактерициды, акарициды, нематодциды, фунгициды, вещества, регулирующие рост растений, гербициды, защитные вещества, удобрения или пухимикаты.

Особенно благоприятными примешиваемыми компонентами являются следующие.

Фунгициды

2-Фенилфенол; 8-гидроксихинолинсульфат; ацибензолар-S-метил; альдиморф; амидофлумет; ампропилфос; ампропилфос-калий; андоприм; анилазине; азаконазол; азоксистробин; беналаксил; беноданил; беномил; бентиаваликарб-изопропил; бензамакрил; бензамакрил изобутил; биланафос; бинапакрил; бифенил; битерганоил; бластицидин-S; бромуконазол; бупиримат; бутиобат; бутиламин; полисульфиды кальция; капсимицин; каптафол; каптан; карбендазим; карбоксин; карпропамид; карвон; хинометонат; хлобентиазон; хлорфеназол; хлоронеб; хлороталонил; хлозолинат; хлозилакон; циазофамид; цифлуфенамид; цимоксанил; ципроконазол; ципродинил; ципрофурам; даггер G, дебакарб; дихлофлуанид; дихлон; дихлорофен; диклоцимет; дикломезин; диклоран; дизтофенкарб; дифеноконазол; дифлуметорим; диметиримол; диметоморф; димоксистробин; диниконазол; диниконазол-M; динокап; дифениламин; дипиририон; диталимфос; дитианон; додин; дразоксолон; эдифенфос; эпоксиконазол; этабоксам; этиримол; этиридиазол; фамоксадон; фенамидон; фенапанил; фенаримол; фенбуконазол; фенфурам; фенгексамид; фенитропан; феноксанил; фенпиклонил; фенпропидин; фенпропиморф; фербам; флазунам; флублимимин; флудиоксонил; флуметовер; флуморф; флуоромид; флуоксастробин; флуквинконазол; флурпримидол; флусилазол; флусульфамид; флутоланил; флутриафол; фолпет; фосетил-Al, фосетилнатрий; фуберидазол; фуралаксил; фураметпир; фуркарбанил; фурмециклокс; гуазатин; гексахлорбензол; гексаконазол; гимексазол; имазалил; имибенконазол; иминоктадина триацетат; иминоктадин трис-(албесилат); йодоккарб; ипконазол; ипробенфос; ипродион; ипроваликарб; ирумацин; изопропиолан; изоваледион; касугамицин; кресоксим-метил; манкозоб; манеб; меферимзон; мепанипирим; мепронил; металаксил; металаксил-M; метконазол; метасульфоккарб; метфуросам; метирам; метоминостробин; метсульфовакс; милдиомицин; миклобутанил; миклозолин; натамицин; никобифен; нитротал-изопропил; новифлумурон; нуаримол; офурац; оризастробин; оксадиксил; оксолиновая кислота; окспоконазол; оксикарбоксин; оксифентиин; паклобутразол; пефуразоат; пенконазол; пенцикурон; фосдифен; фталид; пикоксистробин; пипералин; полиоксины; полиоксорим; пробеназол; прохлораз; процимидон; пропамокарб; пропаносиннатрий; пропиконазол; пропинеб; проквиназид; протиоконазол; пиракlostробин; пиразофос; пирифеннокс; пириметанил; пироквилон; пироксифур; пирролнитрин; квинконазол; квиноксифен; квинтоцен; симеконазол; спирокарсамин; сера; тебуконазол; теклофталам; текназен; тетциклаксин; тетраконазол; тиабендазол; тициофен; тифлузамиде; тиофанат-метил; тирам; тиоксимид; толклофос-метил; толифлуанид; триадимефон; триадименол; триазбутил; триазоксид; трициклаксин; трициклаксин; тридеморф; трифлукси-

стробин; трифлумизол; трифорин; тритриконазол; униконазол; валидамицин А; винклозолин; зинеб; зирам; зоксамид;

(2S)-N-[2-[4-[[3(4-хлорфенил)-2-пропинил]окси]-3-метоксифенил]этил]-3-метил-2-[(метилсульфонил)амино]бутанамид;

1-(1-нафталенил)-1Н-пиррол-2,5-дион;

2,3,5,6-тетрахлор-4-(метилсульфонил)пиридин;

2-амино-4-метил-N-фенил-5-тиазолкарбоксамид;

2-хлор-N-(2,3-дигидро-1,1,3-триметил-1Н-инден-4-ил)-3-пиридинкарбоксамид;

3,4,5-трихлор-2,6-пиридиндикарбонитрил;

актиноват;

цис-1-(4-хлорфенил)-2-(1Н-1,2,4-триазол-1-ил)циклогептанол;

метил 1-(2,3-дигидро-2,2-диметил-1Н-инден-1-ил)-1Н-имидазол-5-карбоксилат;

гидрокарбонат калия;

N-(6-метокси-3-пиридинил)циклопропанкарбоксамид;

N-бутил-8-(1,1-диметилэтил)-1-оксаспиро[4,5]декан-3-амин;

тетрагиокарбонат натрия;

а также соли меди и препараты меди, такие как бордосская жидкость; гидроксид меди; нафтенат меди; оксихлорид меди; сульфат меди; куфранеб; оксид меди; манкоппер; оксин меди.

Бактерициды

Бронопол; дихлорофен; нитрапирин; диметилдитиокарбамат никеля; касугамицин; октилинон; фуранкарбоновая кислота; окситетрациклин; пробеназол; стрептомицин; теклофалам; сульфат меди и другие соединения меди.

Инсектициды/акарициды/нематоды

1. Ингибиторы ацетилхолинэстеразы (AChE).

1.1. Карбаматы, например аланилкарб, алдикарб, алдоксикарб, алликсикарб, аминокарб, бендиокарб, бенфуракарб, буфенкарб, бутакарб, бутоксикарбосим, бутоксикарбосим, карбарил, карбофуран, карбосульфат, клоэтокарб, диметилан, этиофенкарб, фенобукарб, фенотиокарб, форметанат, фуратиокарб, изопрокарб, метам-натрий, метиокарб, метомил, метолкарб, оксамил, пиримикарб, промекарб, пропоксур, тиодикарб, тиофанокс, триметакарб, ХМС, ксилкарб, триазамат.

1.2. Органофосфаты, например ацефат, азаметифос, азинфос (-метил, -этил), бромфос-этил, бромфенвинфос (-метил), бутатиофос, кадусафос, карбофенотион, хлорэтоксифос, хлорфенвинфос, хлормефос, хлорпирифос (-метил/-этил), коумафос, цианофенфос, цианофос, хлорфенвинфос, деметон-S-метил, деметон-S-метилсульфон, диалифос, диазинон, дихлофентион, дихлорвос/DDVP, дикротофос, диметоат, диметилвинфос, диоксабензофос, дисульфотон, EPN, этион, этопрофос, этримфос, фамфур, фенамифос, фенитротрион, фенсульфотион, фентион, флупиразофос, фонофос, формотион, фосметилан, фостиазат, гептенофос, йодофенфос, ипробенфос, исазофос, изофенфос, изопропил О-салицилат, изоксатион, малаатион, мекарбам, метагрифос, метамидофос, метидатион, мевинфос, монокротофос, налед, ометоат, оксидеметон-метил, паратион (-метил/-этил), фентоат, форафос, фосалон, фосмет, фосфамидон, фосфокарб, фоксим, пиримифос (-метил/-этил), профенофос, пропафос, пропетамфос, протиофос, протоат, пираклофос, пиридафентион, пиридатион, квиналфос, себуфос, сульфотеп, сулпрофос, тебупиримфос, темефос, тербуфос, тетрахлорвинфос, тиометон, триазофос, трихлорфон, ванидотион.

Модуляторы натриевого канала/зависящие от напряжения блокираторы натриевого канала

2.1. Пиретроиды, например акринатрин, аллетрин (d-цис-транс, d-транс), бета-цифлутрин, бифентрин, биоаллетрин, биоаллетрин-S-циклопентилизомер, биоэтанометрин, биоперметрин, биоресметрин, хловапоратрин, цис-циперметрин, цис-ресметрин, цис-перметрин, клоцитрин, циклопротрин, цифлутрин, цигалотрин, циперметрин (альфа-, бета-, тета-, зета-), цифенотрин, дельтаметрин, эмпентрин (1R-изомер), эсфенвалерат, этофенпрокс, фенфлутрин, фенпропатрин, фенпиритрин, фенвалерат, флуорцитринат, флуцитринат, флуфенпрокс, флуметрин, флувалинат, фубфенпрокс, гамма-цигалотрин, имипротрин, кадетрин, лямбда-цигалотрин, метофлутрин, перметрин (цис-, транс-), фенотрин (1R-транс-изомер), праллетрин, профлутрин, протрифенбут, пиресметрин, ресметрин, RU 15525, силафлуофен, тауфлувалинат, тефлутрин, тераллетрин, тетраметрин (-1R-изомер), тралометрин, трансфлутрин, ZXI 8901, пиретрины (пиретрум), DDT.

2.2. Оксадиазины, например, индоксакарб.

2.3. Семикарбазоны, например метафлумизон (BAS 3201).

Агонисты/антагонисты ацетилхолиновых рецепторов

3.1. Хлороникотинилы, например ацетамиприд, клотианидин, динотефуран, имидаклоприд, нитенпирам, нитиазин, тиаклоприд, тиаметоксам.

3.2. Никотин, бенсултап, картап.

Модуляторы ацетилхолиновых рецепторов

4.1. Спиносин, например спиносид.

GABA-управляемые антагонисты хлоридных каналов

5.1 Органохлорины, например камфехлор, хлордан, эндосульфат, гамма-НСН, НСН, гептахлор,

линдан, метоксихлор.

5.2. Фипролы, например ацетопрол, этипрол, фипронил, пирафлупрол, пирипрол ванилипрол.

Активаторы хлоридного канала

6.1. Мектины, например авермектин, эмаектин, эмаектин-бензоат, ивермектин, мильбемицин.

Миметики ювенильного гормона, например диофенолан, эпофенонан, феноксикарб, гидропрен, кинопрен, метопрен, пирипроксифен, трипрен.

Экдисонагонисты/разрыватели

8.1. Диацилгидразины, например хромафенозид, галофенозид, метоксифенозид, тебуфенозид.

Ингибиторы биосинтеза хитина

9.1. Бензоилмочевины, например бистрифлурон, хлофлазулон, дифлубензулон, флазулон, флуциклоксурон, флуфеноксурон, гексафлумурон, луфенурон, новалурон, новифлумурон, пенфлурон, тефлубензулон, трифлумурон.

9.2. Бупрофезин.

9.3 Циромазин.

Ингибиторы оксидативного фосфорилирования, АТФ-разрыватели

10.1. Диафентиурон.

10.2. Органотины, например азоциклотин, цигексатин, фенбутатин-оксид.

Разъединители оксидативного фосфорилирования через прерывание Н-протонного градиента

11.1. Пирролы, например хлорфенапир.

11.2. Динитрофенолы, например бинапакрил, динобутон, динокап, DNOC.

Ингибиторы транспорта электронов

12.1 Ингибиторы транспорта сайт-I-электронов.

МЕТТ'сы, например феназаквин, фенпироксимат, пиримидифен, пиридабен, тебуфенпирад, толфенпирад, а также гидрометилнон, дикофол.

12.2. Ингибиторы транспорта сайт-II-электронов.

Ротеноны.

12.3. Ингибиторы транспорта сайт-III-электронов.

Ацеквиноцил, флуакрипирим.

Микробные разрыватели мембраны кишок насекомых

Bacillus thuringiensis-штаммы. Ингибиторы биосинтеза жирных кислот.

14.1. Тетроновые кислоты, например спиродиклофен, спиромесифен,

14.2. Тетрамовые кислоты, например спиротетрамат.

Карбоксамиды, например флониламид.

Октопаминергические агонисты, например амитраз.

Ингибиторы стимулированной магнием АТФазы, например пропаргит.

Эффекторы рианодин рецепторов

18.1 Дикарбоксамиды бензойной кислоты, например флубендиамиды.

18.2. Антраниламиды, например DPX E2 Y45.

Аналоги неристоксина, например гидрооксалаты тиоциклама, тиосултап-натрий.

Биологика, гормоны или феромоны

Азадирахтин, *Bacillus spec.*, *Beauveria spec.*, кодлемон, *Metarrhizium spec.*, *Paecilomyces spec.*, турингиенсин, *Verticillium spec.*

Биологически активные вещества с неизвестными или неспецифическими механизмами действия

21.1. Средства, которые воздействуют газом, например фосфид алюминия, метилбромид, сульфурилфторид.

21.2. Средства, ингибирующие поедание, например криолиты, флониламид, пиметрозин.

21.3. Ингибитора роста клещей, например клофентезин, этоксазол, гекситиазокс.

21.4. Амидофлумет, бенклотиаз, бензоксимат, бифеназат, бромпропилат, бупрофезин, хинометионат, хлордимеформ, хлоробензилат, хлоропикрин, клотиазобен, циклопрен, цифлуметофен, дицикланил, феноксакрим, фентрифанил, флубензимин, флуфенерим, флутензин, госсиплур, гидраметилнон, японилур, метоксадиазон, керосин, пиперонилбутоксид, олеат калия, пиридалил, сульфуранид, тетрадифон, тетрасул, триаратен, вербутин.

Возможно также смешивание с другими известными биологически активными веществами, такими как гербициды, удобрения, регуляторы роста растений, защитные вещества, полухимикаты, или также со средствами, улучшающими свойства растений.

Биологически активные вещества/комбинации биологически активных веществ согласно данному изобретению могут далее при использовании в качестве инсектицидов в виде препаратов, имеющихся в продаже, а также в приготовленных из них формах, готовых для применения, находиться в смеси с синергическими веществами. Синергические вещества являются соединениями, которые повышают эффективность биологически активных веществ, при этом необязательно, чтобы сами синергические вещества были биологически активными.

Биологически активные вещества/комбинации биологически активных веществ согласно данному изобретению могут далее при использовании в качестве инсектицидов в виде препаратов, имеющихся в продаже, а также в виде приготовленных из них форм, готовых для применения, находиться в смеси с ингибиторами, которые замедляют распад биологически активного вещества после применения в окрестностях растений, на поверхности частей растений или в тканях растений.

Содержание биологически активного вещества в готовых для применения формах, полученных из имеющихся в продаже препаратов, может варьироваться в широких пределах. Концентрация биологически активного вещества в формах, готовых для применения, может составлять от 0,00000001 до 95 вес.% биологически активного вещества, более предпочтительно от 0,00001 до 1 вес.%.

Применение проводят обычным способом, который приспособлен к форме, готовой для применения.

Как уже упоминалось выше, согласно данному изобретению можно обрабатывать растения целиком или их части. В предпочтительном варианте осуществления изобретения обрабатываются встречающиеся в диком виде или полученные путем традиционных биологических методов выращивания, таких как скрещивание или слияние протопластов, виды растений и сорта растений, а также их части. В другом предпочтительном варианте исполнения обрабатываются трансгенные растения и сорта растений, которые получены методами генной инженерии в случае необходимости в комбинации с традиционными методами (генетически модифицированные организмы) и их части. Понятие "части" и "части растений" пояснены выше.

Особенно предпочтительно согласно данному изобретению обрабатываются растения соответствующего стандартного торгового качества или находящихся в употреблении сортов. Под сортами растений понимают растения с новыми свойствами ("Traits"), которые выращены обычными способами селекции, в результате мутагенеза, или с помощью рекомбинантной ДНК-техники. Это могут быть сорта, био- и генотипы.

В зависимости от видов или сортов растений, их месторасположения и условий произрастания (почвы, климат вегетационный период, питание) могут встречаться в результате обработки согласно данному изобретению также супераддитивные ("синергические") эффекты. Так, например, возможно уменьшение расходных количеств, и/или расширение спектра воздействия, и/или усиление эффективности применяемых согласно данному изобретению веществ и средств, лучший рост растений, повышенная толерантность к высоким и низким температурам, повышенная толерантность к засухе или к содержанию солей в воде и почве, повышенная продуктивность цветения, облегчение уборки урожая, ускорение созревания, повышение размеров урожая, улучшенное качество и/или повышенная пищевая ценность продукта урожая, повышенная устойчивость при хранении и/или обрабатываемость, которые превышают собственно ожидаемые эффекты.

К предпочтительным обрабатываемым согласно данному изобретению трансгенным (полученным с помощью генно-инженерных технологий) растениям или сортам растений относятся все растения, которые получены путем генно-инженерных модификаций генетического материала, что придало этим растениям особенно выгодные ценные свойства ("Traits"). Примерами таких свойств являются лучший рост растений, повышенная толерантность к высоким или низким температурам, повышенная толерантность к засухе или к содержанию солей в воде и почве, повышенная продуктивность цветения, облегчение уборки урожая, ускорение созревания, повышение размеров урожая, улучшенное качество и/или повышенная пищевая ценность продукта урожая, повышенная устойчивость при хранении и/или обрабатываемость продукта урожая. Другими и особенно выдающимися примерами таких свойств являются повышенная защита растений от животных и микробных вредителей, таких как насекомые, клещи, фитопатогенные грибы, бактерии и/или вирусы, а также повышенная толерантность растений к некоторым гербицидным биологически активным веществам. В качестве примера трансгенных растений упоминаются важные культурные растения, такие как зерновые (пшеница, рис), кукуруза, соя, картофель, сахарная свекла, томаты, горох и другие виды овощных культур, хлопчатник, табак, рапс, а также фруктовые растения (с такими плодами, как яблоки, груши, цитрусы и виноград), причем особенно выделяются кукуруза, соя, картофель, хлопчатник, табак и рапс. В качестве свойств ("Traits") особенно подчеркивается повышенная защита растений от насекомых, паукообразных, нематод и улиток с помощью образующихся в растениях токсинов, особенно таких, которые продуцируются в растениях посредством генетического материала из *Bacillus Thuringiensis* (например, через гены CryIA(a), CryIA(b), CryIA(c), CryIIA, CryIIIA, CryIIIB2, Cry9c, Cry2Ab, Cry3Bb и CryIF, а также их комбинаций), далее "Bt-растения". В качестве свойств ("Traits") далее особенно подчеркивается повышенная защита растений от грибов, бактерий и вирусов с помощью системной приобретенной устойчивости (SAR), системина, фитоалексина, элициторов, а также резистентных генов и соответствующим образом экспримируемых протеинов и токсинов. В качестве свойств ("Traits") далее особенно подчеркивается повышенная толерантность растений к некоторым гербицидным биологически активным веществам, например, имидазолинонам, сульфонилмочевинам, глифосате или фосфинотрицину (например, "PAT"-ген). Гены, придающие соответствующие желаемые свойства ("Traits") трансгенным растениям, могут встречаться в комбинации друг с другом. В качестве примеров "Bt-растений" следует назвать сорта кукурузы, хлопчатника, сои и картофеля, которые прода-

ются под торговыми названиями YIELD GARD® (например, кукуруза, хлопчатник, соя), KnockOut® (например, кукуруза), StarLink® (например, кукуруза), Bollgard® (хлопчатник), Nucotn® (хлопчатник) и NewLeaf® (картофель). В качестве примера толерантных к гербицидам растений следует назвать сорта кукурузы, хлопчатника и сои, которые продаются под торговыми названиями Roundup Ready® (толерантность к глифосате, например кукуруза, хлопчатник, соя), Liberty Link® (толерантность к фосфинотрицину, например рапс), IMI® (толерантность к имидазолинону) и STS® (толерантность к сульфонилмочевине, например, кукуруза). В качестве резистентных к гербицидам растений (обычно выращенных на толерантности к гербицидам) следует упомянуть сорта, которые продаются под названием Clearfield® (например, кукуруза). Само собой разумеется, эти высказывания также действительны для сортов, которые будут разработаны в будущем и появятся в будущем на рынке сортов растений с этими или новыми, разработанными в будущем, генетическими свойствами ("Traits").

Приведенные растения можно особенно предпочтительно обработать согласно данному изобретению соединениями общей формулы (I), соответственно, смесями биологически активных веществ согласно данному изобретению. Предпочтительные области, приведенные выше для биологически активных веществ, соответственно смесей, справедливы и для обработки этих растений. Особенно предпочтительна обработка растений веществами, соответственно смесями, специально приведенными в данном тексте.

Биологически активные вещества/комбинации биологически активных веществ согласно данному изобретению действуют не только на вредителей растений, вредителей в секторе гигиены и вредителей запасов продуктов, но также и в ветеринарно-медицинском секторе на паразитов животных (экто- и эндопаразиты), таких как панцирные клещи, кожные клещи, чесоточные клещи, бегающие клещи, мухи (кусающие и лижущие), паразитирующие личинки мух, вши, власоседы, пероеды и блохи. К этим паразитам относятся следующие виды.

Виды отряда аноплурида (Anoplurida), например *Haematopinus* spp., *Linognathus* spp., *Pediculus* spp., *Phthirus* spp., *Solenopotes* spp.

Виды отряда маллофагида (Mallophagida) и подотрядов амблицерина (Amblycerina), а также ишноцерина (Ischnocerina), например *Trimenopon* spp., *Menopon* spp., *Trinoton* spp., *Bovicola* spp., *Werneckiella* spp., *Lepikentron* spp., *Damalina* spp., *Trichodectes* spp., *Felicola* spp.

Виды отряда диптера (Diptera) и подотрядов нематоцерина (Nematocera) и брахицерина (Brachycera), например *Aedes* spp., *Anopheles* spp., *Culex* spp., *Simulium* spp., *Eusimulium* spp., *Phlebotomus* spp., *Lutzomyia* spp., *Culicoides* spp., *Chrysops* spp., *Hybomitra* spp., *Atylotus* spp., *Tabanus* spp., *Haematopota* spp., *Philopomyia* spp., *Braula* spp., *Musca* spp., *Hydrotaea* spp., *Stomoxys* spp., *Caematobia* spp., *Morellia* spp., *Fannia* spp., *Glossina* spp., *Calliphora* spp., *Lucilia* spp., *Chrysomyia* spp., *Wohlfahrtia* spp., *Sarcophaga* spp., *Oestrus* spp., *Hypoderma* spp., *Gasterophilus* spp., *Hippobosca* spp., *Lipoptena* spp., *Melophagus* spp.

Виды отряда сифонаптерида (Siphonaptera), например *Pulex* spp., *Ctenocephalides* spp., *Xenopsylla* spp., *Ceratophyllus* spp.

Виды отряда гетероптерида (Heteroptera), например *Cimex* spp., *Triatoma* spp., *Rhodnius* spp., *Panstrongylus* spp.

Виды отряда Blattarida, например *Blatta orientalis*, *Periplaneta americana*, *Blattella germanica*, *Supella* spp.

Виды подкласса акари (Acari), акарина (Acarina) и виды отрядов метастигмата (Metastigmata) и мезостигмата (Mesostigmata), например *Argas* spp., *Ornithodoros* spp., *Otobius* spp., *Ixodes* spp., *Amblyomma* spp., *Voophilus* spp., *Dermacentor* spp., *Haemophysalis* spp., *Hyalomma* spp., *Rhipicephalus* spp., *Dermanyssus* spp., *Raillietia* spp., *Pneumonyssus* spp., *Sternostoma* spp., *Varroa* spp.

Виды отряда актинидида (Actiniedida) (простигмата (Prostigmata)) и акаридида (Acaridida) (астигмата (Astigmata)), например *Acarapis* spp., *Cheyletiella* spp., *Ornithocheyletia* spp., *Myobia* spp., *Psorergates* spp., *Demodex* spp., *Trombicula* spp., *Listrophorus* spp., *Acarus* spp., *Tyrophagus* spp., *Caloglyphus* spp., *Hypodectes* spp., *Pterolichus* spp., *Psoroptes* spp., *Chorioptes* spp., *Otodectes* spp., *Sarcoptes* spp., *Notoedres* spp., *Knemidocoptes* spp., *Cytodites* spp., *Laminosioptes* spp.

Биологически активные вещества/комбинации биологически активных веществ формулы (I) согласно данному изобретению пригодны также для борьбы с артроподами, которые нападают на сельскохозяйственных полезных животных, таких как, например, коровы, овцы, козы, лошади, свиньи, ослы, верблюды, буйволы, кролики, куры, индейки, утки, гуси, пчелы, домашних животных, таких как, например, собаки, кошки, комнатные птицы, аквариумные рыбы, так называемых подопытных животных, таких как, например, хомяки, морские свинки, крысы и мыши. В результате борьбы с этими артроподами удастся уменьшить число смертных случаев и предотвратить уменьшение производства (при производстве мяса, молока, шерсти, шкур, яиц, меда и т.п.), таким образом, применение биологически активных веществ согласно данному изобретению создает возможность для более экономичного и более простого содержания животных.

Применение биологически активных веществ/комбинации биологически активных веществ согласно данному изобретению происходит в секторе ветеринарии известным способом при энтеральном приеме в виде, например, таблеток, капсул, микстур, насыщением кислородом, гранулятов, паст, болусов, способом введения вместе с пищей, в виде свеч, при парентеральном введении, например инъекции (внутримышечно, подкожно, внутривенно, внутривентриально и др.), имплантантов, при назальном применении или при накожном применении в виде, например, окунания или купания (погружения), опрыскивания (спрей), поливания (вливания и намазывания пятнами), мытья, напудривания, а также с помощью предметов, содержащих биологически активное вещество, таких как ошейники, метки на ушах, метки на хвостах, повязки на частях тела, хомуты, устройства для маркировки и т.п.

При применении для обработки скота, домашней птицы, домашних животных и т.д. можно использовать биологически активные вещества формулы (I) в виде препаратов (например, порошки, эмульсии, текучие средства), которые содержат биологически активные вещества в количестве от 1 до 80 вес.%, напрямую или после разбавления в 100-10000 раз или в виде химической ванны.

Кроме того, было обнаружено, что биологически активные вещества согласно данному изобретению обладают высокой инсектицидной активностью по отношению к насекомым, которые разрушают технические материалы.

В качестве примера и предпочтительно - однако ни в коем случае не ограничивая - следует назвать следующих насекомых.

Жуки, такие как *Hylotrupes bajulus*, *Chlorophorus pilosis*, *Anobium punctatum*, *Xestobium rufovillosum*, *Ptilinus pecticornis*, *Dendrobium pertinex*, *Ernobius mollis*, *Priobium carpini*, *Lyctus brunneus*, *Lyctus africanus*, *Lyctus planicollis*, *Lyctus linearis*, *Lyctus pubescens*, *Trogoxylon aequale*, *Minthes rugicollis*, *Xyleborus spec.* *Tryptodendron spec.* *Apate monachus*, *Bostrychus capucins*, *Heterobostrychus brunneus*, *Sinoxylon spec.* *Dinoderus minutus*.

Перепончатокрылые, такие как *Sirex juvencus*, *Urocerus gigas*, *Urocerus gigas taignus*, *Urocerus augur*.

Термиты, такие как *Kaloterme flavicollis*, *Cryptotermes brevis*, *Heterotermes indicola*, *Reticulitermes flavipes*, *Reticulitermes santonensis*, *Reticulitermes lucifugus*, *Mastotermes darwiniensis*, *Zootermopsis nevadensis*, *Coptotermes formosanus*.

Щетинохвостки, такие как *Lepisma saccharina*.

Под техническими материалами в данном контексте понимают неживые материалы, такие как предпочтительно пластмассы, клеи, глины, бумага и картон, кожа, древесина, продукты переработки древесины и покрасочные средства.

Еще более предпочтительно имеются в виду в случае материалов, которые нужно защитить от нападения насекомых, древесина и продукты переработки древесины.

Под древесиной и продуктами переработки древесины, которые могут быть защищены средством согласно данному изобретению, соответственно, содержащими его смесями, следует, например, понимать строительный лес, деревянные балки, железнодорожные шпалы, детали мостов, корпуса лодок, транспортные средства, сделанные из дерева, ящики, поддоны, контейнеры, телефонные столбы, деревянные покрытия, деревянные окна и двери, древесные ограждения, опорные столбы, столярные предметы или деревянные поделки, которые вообще применяют при строительстве домов или столярных работах.

Биологически активные вещества могут применяться как сами по себе, так и в виде концентратов или общепринятых препаратов, таких как порошки, грануляты, растворы, суспензии, эмульсии или пасты.

Названные препараты могут быть приготовлены известными способами, например при смешивании биологически активных веществ как минимум с одним растворителем, соответственно разбавителем, эмульгатором, диспергирующим, и/или связующим, или фиксирующим средством, водоотталкивающим средством, при необходимости сиккативами и УФ-стабилизаторами и при необходимости с красителями и пигментами, а также с другими вспомогательными для переработки веществами.

Инсектицидные средства или концентраты, применяемые для защиты древесины, предметов, изготовленных из древесины, содержат биологически активное вещество согласно данному изобретению в концентрации от 0,0001 до 95 вес.%, более предпочтительно от 0,001 до 60 вес.%.

Расходное количество средства, соответственно концентрата, зависит от вида и наличия насекомых и от окружающей среды. Оптимальное расходное количество каждый раз можно установить с помощью рядов тестирования. Однако вообще достаточно применять от 0,0001 до 20 вес.%, предпочтительно от 0,001 до 10 вес.% биологически активного вещества в пересчете на вес материала, подлежащего защите.

В качестве растворителя и/или разбавителя служит органический растворитель или смесь растворителей, и/или масляный или маслоподобный труднолетучий органический растворитель или смесь растворителей, и/или полярный органический растворитель или смесь растворителей, и/или вода и при необходимости один эмульгатор и/или смачивающее средство.

В качестве органических растворителей применяют предпочтительно масляные или маслообразные растворители с коэффициентом испарения выше 35 и точкой воспламенения выше 30°C, предпочтительно выше 45°C. В качестве такого рода труднолетучих, не растворимых в воде, масляных или маслообразных растворителей используют соответствующие минеральные масла или их ароматические фракции

или смеси растворителей, содержащих минеральное масло, предпочтительно тест-бензин, нефть и нефтепродукты и/или алкилбензол.

Предпочтительны для применения минеральные масла с температурой кипения от 170 до 220°C, тест-бензин с температурой кипения от 170 до 220°C, веретенное масло с температурой кипения от 250 до 350°C, нефть, соответственно ароматические соединения, с температурой кипения от 160 до 280°C, терпентиновое масло и т.п.

В одном из предпочтительных вариантов изобретения применяют жидкие алифатические углеводороды с температурой кипения от 180 до 210°C или высококипящие смеси ароматических и алифатических углеводородов с температурой кипения от 180 до 220°C и/или веретенное масло и/или моноклорнафталин, предпочтительно α -моноклорнафталин.

Органические труднолетучие масляные или маслообразные растворители с коэффициентом испарения выше 35 и точкой воспламенения выше 30°C, предпочтительно выше 45°C могут быть частично заменены легколетучими и среднелетучими органическими растворителями при условии, что смесь растворителей также имеет коэффициент испарения выше 35 и точку воспламенения выше 30°C, предпочтительно выше 45°C и что инсектицидно-фунгицидная смесь растворима или эмульгируема в этой смеси растворителей.

В одном из предпочтительных вариантов изобретения часть органического растворителя или смеси растворителей или алифатического полярного органического растворителя или смеси растворителей заменяют. Предпочтительно для замены используют алифатические органические растворители, содержащие гидроксильные и/или простые или сложноэфирные группы, например гликолевый простой и сложный эфир и т.п.

В качестве органических связующих средств применяют в рамках данного изобретения разбавляемые водой и/или растворимые или диспергируемые, соответственно диспергируемые в применяемых органических растворителях, искусственные смолы и/или связующие высыхающие масла, более предпочтительны связующие средства, состоящие или содержащие акрилатную смолу, винильную смолу, например поливинилацетат, полиэфирная смола, поликонденсационная или полиаддитивная смола, полиуретановая смола, алкидная смола, соответственно модифицированная алкидная смола, фенольная смола, углеводородная смола, такая как инденкумароновая смола, силиконовая смола, сохнувшие растительные масла и/или сохнувшие масла и/или физически сохнувшие связующие средства на основе природной и/или искусственной смолы.

Искусственная смола, применяемая в качестве связующего средства, может находиться в виде эмульсии, дисперсии или раствора. В качестве связующих средств могут использоваться также битумы и битуминозные вещества в количестве до 10 вес.%. Дополнительно могут использоваться также известные красители, пигменты, водоотталкивающие средства, вещества, изменяющие запах, и ингибиторы, соответственно средства, защищающие от коррозии и т.п.

Предпочтительны согласно данному изобретению органические связующие средства, которые содержат в средстве или в концентрате как минимум одну алкидную смолу, соответственно модифицированную алкидную смолу, и/или сохнувшее растительное масло. Предпочтительно согласно изобретению используют алкидные смолы с содержанием масла более 45 вес.%, более предпочтительно от 50 до 68 вес.%.

Упомянутые связующие средства могут быть полностью или частично заменены фиксирующим средством (смесью) или умягчителем (смесью). Эти добавки должны препятствовать испарению биологически активных веществ, а также кристаллизации, соответственно осаждению. Предпочтительно они заменяют от 0,01 до 30% связующего средства (в пересчете на 100% используемого связующего средства).

Умягчители выбирают из химических классов эфиров фталевой кислоты, таких как дибутил-, диоктил- или бензилбутилфталат, эфиров фосфорной кислоты, таких как трибутилфосфат, эфиров адипиновой кислоты, таких как ди(2-этилгексил)адипат, стеаратов, таких как бутилстеарат или амилстеарат, олеатов, таких как бутилолеат, глицериновых эфиров или высокомолекулярных гликолевых эфиров, глицериновых сложных эфиров, таких как эфир п-толуолсульфоновой кислоты.

Фиксирующие средства базируются химически на поливинилалкиловых эфирах, таких как, например, поливинилметилэфир, или кетонах, таких как бензофенон, этиленбензофенон.

В качестве растворителей, соответственно разбавителей, имеют в виду более предпочтительно также воду, при необходимости в смеси с одним или несколькими упомянутыми выше органическими растворителями, соответственно разбавителями, эмульгаторами и диспергирующими средствами.

Особенно эффективной защиты древесины добиваются промышленным способом пропитывания, например в вакууме, в двойном вакууме или под давлением.

Средства, готовые к применению, могут еще содержать при необходимости другие инсектициды и при необходимости один или несколько фунгицидов.

В качестве дополнительно примешиваемых компонентов предпочтительно пригодны инсектициды и фунгициды, приведенные в WO 94/29268. Соединения, приведенные в этом патенте, являются определенной составной частью данного изобретения. В качестве более предпочтительного примешиваемого компонента могут служить инсектициды, такие как хлорпирифос, фоксим, силлафлуофин, альфаметрин,

цифлутрин, циперметрин, дельтаметрин, перметрин, имидаклоприд, NI-25, флуфеноксурон, гексафлумурон, трансфлутрин, тиаклоприд, метоксифеноксид, трифлумурон, клотианидин, спиносид и тефлутрин, а также фунгициды, такие как эпоксиконазол, гексаконазол, азаконазол, пропиконазол, тебуконазол, ципроконазол, метконазол, имазалил, дихлорфлуанид, толилфлуанид, 3-йод-2-пропинилбутилкарбамат, N-октилзотиазолин-3-он и 4,5-дихлор-N-октилзотиазолин-3-он.

Одновременно биологически активные вещества согласно данному изобретению могут использоваться для защиты от обрастания предметов, более предпочтительно таких, как корпуса кораблей, сита, рыболовные сети, строительные сооружения, причалы и сигнализационные установки, которые соприкасаются с морской водой или со сточными водами.

Обрастание оседлыми *Oligochaeten*, такими как кораллы, а также моллюсками и видами группы *Ledamogpha* (уточные моллюски), такими как различные *Lepas*- и *Scalpellum*-виды, или видами группы *Balanomogpha* (морская оспа), такими как *Balanus*- или *Pollicipes* виды, повышают коэффициент трения судов и в результате ведет к повышенным затратам энергии, а сверх того в результате частого нахождения в сухих доках - к существенному увеличению производственных расходов.

Наряду с обрастанием водорослями, например, такими как *Ectocarpus* sp. и *Ceramium*, sp., придают особое значение обрастанию оседлыми *Entomotraken*-группами, которые совместно охватываются под названием *Cirripedia* (речные вьющиеся раки).

Неожиданно было обнаружено, что соединения согласно данному изобретению сами по себе или в комбинации с другими биологически активными веществами обнаруживают очень хорошее противообрастающее действие.

В результате применения соединений согласно данному изобретению самих по себе или в комбинации с другими биологически активными веществами можно пренебречь применением или существенно понизить концентрации соединений, содержащих тяжелые металлы, таких как, например, бис-(триалкилолово)сульфиды, три-н-бутилоловолаурат, три-н-бутилоловохлорид, оксид меди(I), три-этилоловохлорид, три-н-бутил(2-фенил-4-хлорфенокси)олово, трибутилоловооксид, дисульфид молибдена, оксид мышьяка, полимерный бутилтитанат, фенил(биспиридин)висмутхлорид, три-н-бутилоловофторид, марганецэтилен-бис-тиокарбамат, цинкдиметилдитиокарбамат, цинкэтилен-бис-тиокарбамат, соли цинка и меди 2-пиридинтиол-1-оксида, бис-диметилдитиокарбамоилцинкэтилен-бис-тиокарбамат, оксид цинка, медь(I) этилен-бис-дитиокарбамат, тиоцианат меди, нафтенат меди и галоиды трибутилолова.

Готовые к применению противообрастающие краски могут при необходимости содержать и другие биологически активные вещества, предпочтительно альгициды, фунгициды, гербициды, моллюскициды, соответственно, другие вещества, препятствующие обрастанию.

В качестве примешиваемого компонента для средств, препятствующих обрастанию, согласно данному изобретению предпочтительно пригодны следующие:

альгициды, такие как 2-трет-бутиламино-4-циклопропиламино-6-метилтио-1,3,5-триазин, дихлорофен, диурон, эндотал, фентинацетат, изопротурон, метабензтиазурон, оксифлуорфен, хинокламин и тербутрин;

фунгициды, такие как циклогексиламид-S,S-диоксид бензо[b]тиофенкарбоновой кислоты, дихлофлуанид, флуорфолпет, 3-йод-2-пропинилбутилкарбамат, толилфлуанид и азолы, такие как азаконазол, ципроконазол, эпоксиконазол, гексаконазол, метконазол, пропиконазол и тебуконазол;

моллюскициды, такие как фентинацетат, метальдегид, метиокарб, никлосамид, тиодикарб и триметакарб, хелат железа;

или традиционные вещества, препятствующие обрастанию, такие как 4,5-дихлор-2-октил-4-изотиазолин-3-он, дийодметилпаратрил сульфид, 2-(N,N-диметилтиокарбамоилтио)-5-нитротиазил, калиевые, медные, натриевые и цинковые соли 2-ниридинтиол-1-оксида, пиридин-трифенилборан, тетрабутилдистанноксан, 2,3,5,6-тетрахлор-4-(метилсульфонил)пиридин, 2,4,5,6-тетрахлоризофталонитрил, тетраметилтиоурамдисульфид и 2,4,6-трихлорфенилмалеинимид.

Применяемые средства, препятствующие обрастанию, содержат биологически активное вещество согласно данному изобретению в концентрации от 0,001 до 50 вес.%, более предпочтительно от 0,01 до 20 вес.%.

Средства, препятствующие обрастанию, согласно данному изобретению содержат далее обычные компоненты, такие, например, как описаны в Ungerer, Chem. Ind., 1985, 37, 730-732 и Williams, Antifouling Marine Coatings, Noyes, Park Ridge, 1973.

Покрасочные средства, препятствующие обрастанию, содержат наряду с альгицидами, фунгицидами, моллюскицидами и инсектицидными биологически активными веществами согласно данному изобретению, также более предпочтительно связующее средство.

Примерами признанных связующих средств являются поливинилхлорид в системе растворителей, хлорированный каучук в системе растворителей, акриловые смолы в системе растворителей, более предпочтительно в водной системе, винилхлорид/винилацетатсополимерная система в виде водной дисперсии или в виде системы органических растворителей, бутадиен/стирол/акрилонитриловые каучуки, высыхающие масла, такие как льняное масло, эфирные смолы или модифицированные твердые смолы в ком-

бинации с дегтем или битумом, асфальт, а также эпоксисоединения, небольшие количества хлоркаучука, хлорированный полипропилен и виниловые смолы.

При необходимости покрасочные средства содержат также неорганические пигменты, органические пигменты или красители, которые предпочтительно нерастворимы в морской воде. Далее покрасочные средства могут содержать материалы, такие как колофоний, для создания возможности управляемого высвобождения биологически активных веществ. Далее покрасочные средства могут содержать умягчители, модифицирующие вещества, влияющие на реологические свойства, а также другие традиционные компоненты. К соединениям согласно изобретению, а также к названным смесям могут примешиваться самополирующиеся-противообрастающие системы.

Биологически активные вещества также пригодны для борьбы с животными-вредителями, более предпочтительно с насекомыми, паукообразными и клещами, которые встречаются в замкнутых помещениях, таких, например, как квартиры, заводские цеха, офисы, кабины автомобилей и т.д. Они могут применяться для борьбы с этими вредителями как сами по себе, так и в комбинации с другими биологически активными веществами и вспомогательными веществами в инсектицидных препаратах для домашнего хозяйства. Они эффективны по отношению к чувствительным и устойчивым видам, а также по отношению ко всем стадиям развития. К этим вредителям относятся следующие виды.

Виды отряда скорпионидея (*Scorpionidea*), например *Buthus occitanus*.

Виды отряда акарина (*Acarina*), например *Argas persicus*, *Argas reflexus*, *Bryobia* spp., *Dermanyssus gallinae*, *Glyciphagus domesticus*, *Ornithodoros moubat*, *Rhipicephalus sanguineus*, *Trombicula alfreddugesi*, *Neutrombicula autumnalis*, *Dermatophagoides pteronissimus*, *Dermatophagoides forinae*.

Виды отряда аранеае (*Araneae*), например *Aviculariidae*, *Araneidae*.

Виды отряда опилонес (*Opiliones*), например *Pseudoscorpiones chelifer*, *Pseudoscorpiones cheiridium*, *Opiliones phalangium*.

Виды отряда изопода (*Isopoda*), например *Oniscus asellus*, *Porcellio scaber*.

Виды отряда диплопода (*Diplopoda*), например *Blaniulus guttulatus*, *Polydesmus* spp.

Виды отряда хилопода (*Chilopoda*), например *Geophilus* spp.

Виды отряда цигентома (*Zygentoma*), например *Ctenolepisma* spp., *Lepisma saccharina*, *Lepismodes inquilinus*.

Виды отряда блаттария (*Blattaria*), например *Blatta orientalis*, *Blattella germanica*, *Blattella asahinai*, *Leucophaea maderae*, *Panchlora* spp., *Parcoblatta* spp., *Periplaneta australasiae*, *Periplaneta americana*, *Periplaneta brunnea*, *Periplaneta fuliginosa*, *Supella longipalpa*.

Виды отряда салтатория (*Saltatoria*), например *Acheta domesticus*.

Виды отряда дермаптера (*Dermaptera*), например *Forficula auricularia*.

Виды отряда изоптера (*Isoptera*), например *Kaloterme* spp., *Reticuliterme* spp.

Виды отряда псокоптера (*Psocoptera*), например *Lepinatus* spp., *Liposcelis* spp.

Виды отряда колоптера (*Coloptera*), например *Anthrenus* spp., *Attagenus* spp., *Dermestes* spp., *Latheticus oryzae*, *Necrobia* spp., *Ptinus* spp., *Rhizopertha dominica*, *Sitophilus granarius*, *Sitophilus oryzae*, *Sitophilus zeamais*, *Stegobium paniceum*.

Виды отряда диптера (*Diptera*), например *Aedes aegypti*, *Aedes albopictus*, *Aedes taeniorhynchus*, *Anopheles* spp., *Calliphora erythrocephala*, *Chrysozona pluvialis*, *Culex quinquefasciatus*, *Culex pipiens*, *Culex tarsalis*, *Drosophila* spp., *Fannia canicularis*, *Musca domestica*, *Phlebotomus* spp., *Sarcophaga carnaria*, *Simulium* spp., *Stomoxys calcitrans*, *Tipula paludosa*.

Виды отряда лепидоптера (*Lepidoptera*), например *Achroia grisella*, *Galleria mellonella*, *Plodia interpunctella*, *Tinea cloacella*, *Tinea pellionella*, *Tineola bisselliella*.

Виды отряда сифонаптера (*Siphonaptera*), например *Ctenocephalides canis*, *Ctenocephalides felis*, *Pulex irritans*, *Tunga penetrans*, *Xenopsylla cheopis*.

Виды отряда гименоптера (*Hymenoptera*), например *Camponotus herculeanus*, *Lasius fuliginosus*, *Lasius niger*, *Lasius umbratus*, *Monomorium pharaonis*, *Paravespula* spp., *Tetramorium caespitum*.

Виды отряда аноплура (*Anoplura*), например *Pediculus humanus capitis*, *Pediculus humanus corporis*, *Phthirus pubis*.

Виды отряда гетероптера (*Heteroptera*), например *Cimex hemipterus*, *Cimex lectularius*, *Rhodinus prolixus*, *Triatoma infestans*.

Применение инсектицидов для домашнего хозяйства происходит само по себе или в комбинации с другими подходящими биологически активными веществами, такими как эфиры фосфорной кислоты, карбаматы, пиретроиды, неоникотиноиды, регуляторы роста или биологически активные вещества из других известных классов инсектицидов.

Применение осуществляют в виде аэрозолей, средств опрыскивания без давления, например спреи для опрыскивания насосом или спреи для распыления, автоматов для образования туманов, пен, гелей, испаряемых продуктов с пластинкой для испарения из целлюлозы или пластмассы, испарителей жидкости, гелевых и мембранных испарителей, испарителей с пропеллером, не питаемых энергией, соответственно, пассивных систем испарения, бумаги против моли, мешочков против моли и гелей против моли, в виде гранулятов или пылей, рассыпных приманок или приманочных станций.

Биологически активные вещества/комбинации биологически активных веществ согласно данному изобретению могут применяться в виде дефолиантов, десикантов, средств, уничтожающих сорняки, и более предпочтительно в качестве средств уничтожения сорных растений. Под сорными растениями в широком смысле понимают все растения, которые растут в местах, где они нежелательны. Действуют ли вещества согласно данному изобретению в качестве тотальных или селективных гербицидов, это зависит в существенной мере от использованных расходных количеств.

Биологически активные вещества/комбинации биологически активных веществ согласно данному изобретению могут применяться, например, в следующих растениях.

Двудольные сорные растения родов

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

Двудольные культурные растения родов

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

Однодольные сорные растения родов

Aegilops, Agropyron, Agrostis, Alopecurus, Apera, Avena, Brachiaria, Bromus, Cenchrus, Commelina, Cynodon, Cyperus, Dactyloctenium, Digitaria, Echinochloa, Eleocharis, Eleusine, Eragrostis, Eriochloa, Festuca, Fimbristylis, Heteranthera, Imperata, Ischaemum, Leptochloa, Lolium, Monochoria, Panicum, Paspalum, Phalaris, Phleum, Poa, Rottboellia, Sagittaria, Scirpus, Setaria, Sorghum.

Однодольные культурные растения родов

Allium, Ananas, Asparagus, Avena, Hordeum, Oryza, Panicum, Saccharum, Secale, Sorghum, Triticale, Triticum, Zea.

Применение биологически активных веществ/комбинации биологически активных веществ согласно данному изобретению, однако, ни в коем случае не ограничено этими родами и распространяется в равной мере на все растения.

Биологически активные вещества/комбинации биологически активных веществ согласно данному изобретению пригодны в зависимости от концентрации к полному уничтожению сорняков, например, на промышленных установках и на железнодорожных путях, а также на дорогах и площадях в населенных пунктах, не обросших или обросших деревьями. Наряду с этим, биологически активные вещества согласно данному изобретению могут использоваться для борьбы с сорными растениями в многолетних культурах, например в лесах, посадках декоративных кустарников, в садах, виноградниках, на плантациях цитрусовых деревьев, орехов, бананов, кофе, чая, каучука, масличных пальм, какао, на посадках ягод и хмеля, на декоративных лужайках и спортивных полях, на пастбищах, а также для селективной борьбы с сорными растениями в однолетних культурах.

Биологически активные вещества формулы (I)/комбинации биологически активных веществ согласно данному изобретению обнаруживают высокую гербицидную эффективность и широкий спектр действия при применении на почве и на надземных частях растений. Они пригодны в определенном смысле также для селективной борьбы с однодольными и двудольными сорными растениями в однодольных и двудольных культурах растений как при предвсходовом, так и при послевсходовом способе обработки.

Биологически активные вещества/комбинации биологически активных веществ согласно данному изобретению могут в определенных концентрациях, соответственно, расходных количествах также применяться для борьбы с животными-вредителями и с грибковыми и бактериальными болезнями растений. Их можно также использовать в качестве промежуточных или исходных продуктов для синтеза других биологически активных веществ.

Биологически активные вещества/комбинации биологически активных веществ согласно данному изобретению могут быть переведены в обычные препараты, такие как растворы, эмульсии, порошки для опрыскивания, суспензии, порошки, средства для распыления, пасты, растворимые порошки, грануляты, суспензионно-эмульсионные концентраты, пропитанные биологически активным веществом природные и синтетические вещества, а также микрокапсулы в полимерных веществах.

Эти препараты получают известным способом, например при смешивании биологически активных веществ с наполнителями, т.е. жидкими растворителями и/или твердыми носителями, при необходимости с использованием поверхностно-активных средств, т.е. эмульгирующих и/или диспергирующих средств, и/или пенообразующих веществ.

В случае использования воды в качестве наполнителя могут использоваться также органические растворители в качестве вспомогательных для растворения веществ.

В качестве жидких растворителей имеются в виду, по существу, следующие ароматические соединения, такие как ксилол, толуол или алкилнафталины, хлорированные ароматические или хлорирован-

ные алифатические углеводороды, такие как хлорбензол, хлорэтилен или метиленхлорид, насыщенные углеводороды, такие как циклогексан или парафины, например, фракции нефтей, минеральные и растительные масла, спирты, такие как бутанол или гликоль, а также их простые и сложные эфиры, кетоны, такие как ацетон, метилэтилкетон, метилизобутилкетон или циклогексанон, сильно полярные растворители, такие как диметилформамид и диметилсульфоксид, а также вода.

В качестве твердых носителей имеются в виду, например, аммониевые соли и помолы природных горных пород, таких как каолины, глины, тальк, мел, кварц, аттапульгит, монтмориллонит или диатомовая земля, и помолы синтетических камней, таких как высокодисперсная кремниевая кислота, оксид алюминия и силикаты.

В качестве твердых носителей для гранулятов имеются в виду, например, измельченные и фракционированные природные каменные породы, такие как кальцит, мрамор, пемза, сепиолит, доломит, а также синтетические грануляты из помолов неорганических и органических веществ, а также грануляты из органического материала, такого как древесные опилки, скорлупа кокосовых орехов, кукурузные кочерыжки и стебли табака.

В качестве эмульгаторов и пенообразующих средств подходят, например, неионогенные и анионные эмульгаторы, такие как эфиры полиоксиэтилена с жирной кислотой, эфиры полиоксиэтилена с жирным спиртом, например алкиларилполигликолевый эфир, алкилсульфонаты, алкилсульфаты, арилсульфонаты, а также гидролизаты яичного белка.

В качестве диспергирующих средств имеют в виду, например, лигнин-сульфитовые щелоки и метилцеллюлозу.

В препаратах могут использоваться адгезионные средства, такие как карбоксиметилцеллюлоза, природные и синтетические порошкообразные, зернистые или в латексной форме полимеры, такие как гуммиарабик, поливиниловый спирт, поливинилацетат, а также природные фосфолипиды, такие как кефалины и лецитины, и синтетические фосфолипиды. Другими добавками могут быть природные или растительные масла.

Могут использоваться красители, такие как неорганические пигменты, например, оксид железа, оксид титана, ферроциан синий и органические красители, такие как ализариновые, азо- и металлфталоцианиновые красители, и следовые количества питательных веществ, таких как соли железа, марганца, бора, меди, кобальта, молибдена и цинка.

Препараты содержат вообще от 0,1 до 95 вес.% биологически активного вещества, предпочтительно от 0,5 до 90 вес.%.

Биологически активные вещества/комбинации биологически активных веществ согласно данному изобретению могут как сами по себе, так и в случае их препаратов применяться также в смесях с известными гербицидами и/или веществами, которые улучшают переносимость гербицидов культурными растениями ("защитные вещества"), для борьбы с сорными растениями, причем возможно использование готовых форм препаратов или смесей, приготавливаемых в больших резервуарах. Возможны также смеси со средствами борьбы с сорными растениями, которые содержат один или несколько неизвестных гербицидов и защитное вещество.

Для смесей подходят известные гербициды, такие как, например ацетохлор, ацифлуорфен (-натрий), аклонифен, алахлор, аллоксидим (-натрий), аметрин, амикарбазон, амидохлор, амидосульфурон, амидопиралид, анилофос, асулам, атразин, азафенидин, азимсульфурон;

бефлбутамид, беназолин (-этил), бенфуресат, бенсульфурон (-метил), бентазон, бензкарбазон, бензфендизон, бензобициклон, бензофенап, бензоилпроп (-этил), биалафос, бифенокс, биспирибак (-натрий), бромобутид, бромофеноксим, бром-оксинил, бутахлор, бутафенацил (-аллил), бутроксидим, бутилат;

кафенстрол, калоксидим, карбетамид, карфентразон (-этил);

хлорметоксифен, хлорамбен, хлоридазон, хлоримурон (-этил), хлорнитрофен, хлорсульфурон, хлортолурун;

цинидон (-этил), цинметилин, циносульфурон;

клефоксидим, клетодим, клодинафоп (-пропаргил), кломазон, кломепроп, клопиралид, клопирасульфурон (-метил), клорансулам (-метил), кумилурон;

цианазин, цибутрин, циклоат, циклосульфамурон, циклоксидим, цигалофоп (-бутил);

2,4-D, 2,4-DB, десмедифам, диаллат, дикамба, дихлорпроп (-P), диклофоп (-метил), диклосулам, диэтатил (-этил), дифензокват, дифлуфеникан, дифлуфензопир, димефурон, димепиперат, диметахлор, диметаметрин, диметенамид, димексифлам, динитрамин, дифенамид, дикват, дитиопир, диурон, димрон;

эпроподан, ЕРТС, эспрокарб, эталфлуралин, этаметсульфурон (-метил), этофумесат, этоксифен, этоксисульфурон, этобензанид;

феноксапроп (-P-этил), фентразамид, флампроп (-изопропил, -изопропил-L, -метил), флазасульфурон, флорасулам, флазифоп (-P-бутил), флазолат, флукарбазон (-натрий), флуфенацет, флуметсулам, флумиклорак (-пентил), флумиоксазин, флумипропин, флуметсулам, флуометурон, флуорохлоридон, флуорогликофен (-этил), флупоксам, флупропацил, флурпирсульфурон (-метил, -натрий), флуренол

(-бутил), флуридон, флуроксипир (-бутоксипропил, -мептил), флурпримидол, флуртамон, флутиацет (-метил), флутиамид, фомезафен, форамсульфурон;

глуфосинат (-аммоний), глифосат (-изопропиламмоний), галосафен, галоксифоп (-этоксиэтил, -P-метил), гексазинос, НОК-201;

имазаметабенз (-метил), имазаметапир, имазамокс, имазапик, имазапир, имазаквин, имазетапир, имазосульфурон, йодосульфурон (-метил, -натрий), иоксинил, изопропалин, изопротурон, изоурон, изо-ксабен, изоксахлортол, изоксафлутол, изоксапирифоп;

КТН 485;

лактофен, ленацил, линурон;

МСРА, мекопроп, мефенацет, мезосульфурон, мезотрион, метамифоп, метамитрон, метазахлор, мета-бензтиазурон, метобензулон, метобромурон, (альфа-)метола-хлор, метосулам, метоксурон, метрибузин, метсульфурон (-метил), молинат, монолинурон;

напроанилид, напропамид, небурон, никосульфурон, норфлуразон;

орбенкарб, ортасульфамурон, оризалин, оксадиаргил, оксадиазон, оксасульфурон, оксацикломефон, оксифлуорфен;

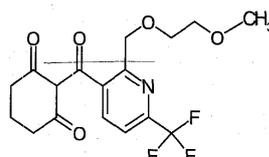
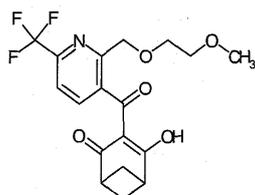
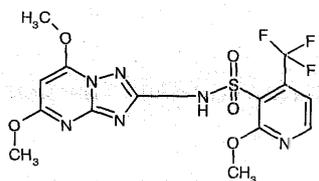
паракват, пеларгоновая кислота, пендиметалин, пендралин, пенокосулам, пентоксазон, фенмедифам, пиколинафен, пиноксаден, пиперофос, претилахлор, примисульфурон (-метил), профлуазол, прометрин, пропахлор, пропанил, пропаквизафоп, пропизохлор, пропоксикарбазон (-натрий), пропизамид, просульфокарб, просульфурон, пирафлуфен (-этил), пирасульфотол, пиразогил, пиразолат, пиразосульфурон (-этил), пиразоксифен, пирибензоксим, пирибутикарб, пиридат, пиридатол, пирифталид, пириминобак (-метил), пиритиобак (-натрий), пиримисульфан;

квинхлорак, квинмерак, квинокламин, квизалофоп (-P-этил, -P-тефурил);

римсульфурон;

сетоксидим, симазин, симетрин, сулкотрион, сульфентразон, сульфометурон (-метил), сульфосат, сульфосульфурон;

тебутам, тебутиурон, темботрион, тепралоксидим, тербутилазин, тербутрин, тенилхлор, тиафлуамид, тиазопир, тидиазимин, тифенсульфурон (-метил), тиобенкарб, тиокарбазил, топрамезон, тралкоксидим, триаллат, триасульфурон, трибенурон (-метил), триклопир, тридифан, трифлуралин, трифлюксисульфурон, трифлусульфурон (-метил), тритосульфурон и



Возможна также смесь с другими известными биологически активными веществами, такими как фунгициды, инсектициды, акарициды, нематоды, защитные вещества от поедания птицами, питательные для растений вещества и средства для улучшения структуры почвы.

Биологически активные вещества/комбинации биологически активных веществ могут применяться как сами по себе, в виде их препаратов или в виде полученных из них в результате дальнейшего разбавления готовых для применения форм, таких как готовые к применению растворы, суспензии, эмульсии, порошки, пасты и грануляты. Применение осуществляют обычным образом, например поливанием, опрыскиванием, разбрызгиванием, рассыпанием.

Биологически активные вещества/комбинации биологически активных веществ согласно данному изобретению могут наноситься как перед всходами, так и после всходов растений. Их можно также вносить в почву перед посевом.

Расходное количество биологически активного вещества может колебаться в широких интервалах. Оно существенно зависит от вида желательного эффекта. Вообще расходные количества составляют от 1 г до 10 кг биологически активного вещества на 1 га поверхности почвы, предпочтительно от 5 г до 5 кг на 1 га.

Биологически активные вещества/комбинации биологически активных веществ согласно данному изобретению обнаруживают сильное микробицидное действие и могут применяться для борьбы с нежелательными микроорганизмами, такими как грибы и бактерии, при защите растений и при защите мате-

риалов.

Фунгициды можно применять для борьбы с плазмодиофоромицетами (Plasmodiophoromycetes), оомицетами (Oomycetes), хитридиомицетами (Chytridiomycetes), зигомицетами (Zygomycetes), аскомицетами (Ascomycetes), базидиомицетами (Basidiomycetes) и дейтеромицетами (Deuteromycetes).

Бактерициды можно применять для борьбы с псевдомонадацеае (Pseudomonadaceae), ризобиацеае (Rhizobiaceae), энтеробактериацеае (Enterobacteriaceae), коринебактериацеае (Corynebacteriaceae) и стрептомицетацеае.

В качестве примера, но ни в коем случае не ограничивая, следует перечислить некоторых возбудителей грибковых и бактериальных заболеваний, которые подпадают под приведенные выше более общие понятия:

виды рода ксантомонас (*Xanthomonas*), такие как, например, *Xanthomonas campestris* pv. *oryzae*;
 виды рода псевдомонас (*Pseudomonas*), такие как, например, *Pseudomonas syringae* pv. *lachrymans*;
 виды рода эрвиния (*Erywinia*), такие как, например, *Erywinia amylovora*;
 виды рода питуиум (*Pythium*), такие как, например, *Pythium ultimum*;
 виды рода фитопфтора (*Phytophthora*), такие как, например, *Phytophthora infestans*;
 виды рода псевдопероноспора (*Pseudoperonospora*), такие как, например, *Pseudoperonospora humuli* или *Pseudoperonospora cubensis*;
 виды рода плазмопара (*Plasmopara*), такие как, например, *Plasmopara viticola*;
 виды рода бремия (*Bremia*), такие как, например, *Bremia lactucae*;
 виды рода пероноспора (*Peronospora*), такие как, например, *Peronospora pisi* или *P. brassicae*;
 виды рода эрисифе (*Erysiphe*), такие как, например, *Erysiphe graminis*;
 виды рода сферотека (*Sphaerotheca*), такие как, например, *Sphaerotheca fuliginea*;
 виды рода подосфера (*Podosphaera*), такие как, например, *Podosphaera leucotricha*;
 виды рода вентурия (*Venturia*), такие как, например, *Venturia inaequalis*;
 виды рода пиренофора (*Pyrenophora*), такие как, например, *Pyrenophora teres* или *P. Graminea* (конидиевая форма: Дрекслера, син: гельминтоспориум);
 виды рода кохлиоболус (*Cochliobolus*), такие как, например, *Cochliobolus sativus* (конидиевая форма: Дрекслера, син: гельминтоспориум);
 виды рода уромицес (*Uromyces*), такие как, например, *Uromyces appendiculatus*;
 виды рода пукциния (*Puccinia*), такие как, например, *Puccinia recondita*;
 виды рода склеротиния (*Sclerotinia*), такие как, например, *Sclerotinia sclerotiorum*;
 виды рода тиллетия (*Tilletia*), такие как, например, *Tilletia caries*;
 виды рода устилаго (*Ustilago*), такие как, например, *Ustilago nuda* или *Ustilago avenae*;
 виды рода пелликулария (*Pellicularia*), такие как, например, *Pellicularia sasakii*;
 виды рода пирикулария (*Pyricularia*), такие как, например, *Pyricularia oryzae*;
 виды рода фузариум (*Fusarium*), такие как, например, *Fusarium culmorum*;
 виды рода ботритис (*Botrytis*), такие как, например, *Botrytis cinerea*;
 виды рода септория (*Septoria*), такие как, например, *Septoria nodorum*;
 виды рода лептосферия (*Leptosphaeria*), такие как, например, *Leptosphaeria nodorum*;
 виды рода церкоспора (*Cercospora*), такие как, например, *Cercospora canescens*;
 виды рода алтернария (*Alternaria*), такие как, например, *Alternaria brassicae*;
 виды рода псевдоцеркоспорелла (*Pseudocercospora*), такие как, например, *Pseudocercospora herpotrichoides*.

Биологически активные вещества/комбинации биологически активных веществ согласно данному изобретению проявляют также сильное укрепляющее действие на растения. В связи с этим они пригодны для мобилизации собственных защитных сил растений против нападения нежелательных микроорганизмов.

Под веществами, укрепляющими растения (индуцирующими устойчивость), в этом контексте понимают такие вещества, которые способны таким образом стимулировать защитную систему растений, что обработанные растения при последующей инокуляции нежелательными микроорганизмами проявляют длительную устойчивость по отношению к этим микроорганизмам.

Под нежелательными микроорганизмами в рассматриваемом случае понимают фитопатогенные грибы, бактерии и вирусы. Вещества согласно данному изобретению можно таким образом применять для того, чтобы защитить растения в течение определенного времени после обработки от поражения упомянутыми возбудителями болезней.

Промежуток времени, по истечению которого возникает защита, составляет, как правило, от 1 до 10 дней, более предпочтительно от 1 до 7 дней после обработки растений биологически активными веществами.

Хорошая переносимость растениями биологически активных веществ/комбинаций биологически активных веществ в концентрациях, необходимых для борьбы с болезнями растений, позволяет производить обработку наземных частей растений, растительного и семенного материала и почвы.

Биологически активные вещества/комбинации биологически активных веществ согласно данному

изобретению пригодны также для повышения урожая. Кроме того, они малотоксичны и характеризуются хорошей переносимостью растениями.

Биологически активные вещества/комбинации биологически активных веществ согласно данному изобретению при необходимости могут применяться в определенных концентрациях и расходных количествах также в качестве гербицидов, для воздействия на рост растений, а также для борьбы с животными-вредителями. Их можно при необходимости также использовать в качестве промежуточных и исходных продуктов для синтеза других биологически активных веществ.

В случае защиты материалов вещества согласно данному изобретению используют для защиты технических материалов от поражения и разрушения нежелательными микроорганизмами.

Под техническими материалами понимают здесь неживые материалы, которые приготовлены для применения в технике. К примерам технических материалов, которые могут быть защищены от микробного изменения или разрушения с помощью биологически активных веществ согласно данному изобретению, относятся клеящие вещества, клеи, бумага и картон, текстильные материалы, кожа, древесина, покрасочные средства и изделия из пластмасс, охлаждающие смазочные вещества и другие материалы, которые могут подвергаться нападению микроорганизмов или разрушаться ими. К защищаемым таким образом материалам относятся также части производственных установок, например, циркуляционные системы охлаждающей воды, которые могут подвергаться опасности в результате размножения микроорганизмов. В рамках данного изобретения в качестве технических материалов предпочтительно имеют в виду клеящие вещества, клеи, бумагу и картон, кожу, древесину, покрасочные средства, охлаждающие смазывающие средства и жидкости-теплоносители, более предпочтительно древесину.

В качестве микроорганизмов, которые могут вызвать разрушение или изменение технических материалов, следует, например, назвать бактерии, грибы, дрожжи, водоросли и слизневые организмы. Вещества согласно данному изобретению предпочтительно действуют на грибы, в особенности на плесневые грибы, окрашивающие и разрушающие древесину грибы базидиомицеты (*Basidiomyceten*), а также на слизневые организмы и водоросли.

В качестве примера следует назвать микроорганизмы следующих родов:

- виды рода альтернария (*Alternaria*), такие как *Alternaria tenuis*;
- виды рода аспергиллус (*Aspergillus*), такие как *Aspergillus niger*;
- виды рода хаетомиум (*Chaetomium*), такие как *Chaetomium globosum*;
- виды рода кониофора (*Coniophora*), такие как *Coniophora puetana*;
- виды рода лентинус (*Lentinus*), такие как *Lentinus tigrinus*;
- виды рода пенициллиум (*Penicillium*), такие как *Penicillium glaucum*;
- виды рода полипорус (*Polyporus*), такие как *Polyporus versicolor*;
- виды рода ауреобазидиум (*Aureobasidium*), такие как *Aureobasidium pullulans*;
- виды рода склерофома (*Sclerophoma*), такие как *Sclerophoma pityophila*;
- виды рода триходерма (*Trichoderma*), такие как *Trichoderma viride*;
- виды рода эшерихия (*Escherichia*), такие как *Escherichia coli*;
- виды рода псевдомонас (*Pseudomonas*), такие как *Pseudomonas aeruginosa*;
- виды рода стафилококкус (*Staphylococcus*), такие как *Staphylococcus aureus*.

Биологически активные вещества/комбинации биологически активных веществ в зависимости от физических и/или химических свойств могут быть переведены в обычные препараты, такие как растворы, эмульсии, суспензии, порошки, пены, пасты, грануляты, аэрозоли, мелкие капсулы в полимерных веществах и для покрывания пленкой семенного материала, препаратов с ультрамалыми объемами для образования холодного или теплого тумана.

Эти препараты получают известными способами, например, при смешивании биологически активных веществ/комбинаций биологически активных веществ с наполнителями, т.е. с жидкими носителями, сжиженными газами, находящимися под давлением и/или твердыми носителями, при необходимости с использованием поверхностно-активных веществ, т.е. эмульгаторов и/или диспергирующих средств, и/или вспенивающих средств. В случае использования воды в качестве наполнителя могут также использоваться органические растворители в качестве вспомогательных для растворения средств.

В качестве жидких растворителей имеют в существенной мере в виду ароматические соединения, такие как ксилол, толуол или алкилнафталины, хлорированные ароматические соединения или хлорированные алифатические соединения, такие как хлорбензолы, хлорэтилены или метилхлорид, алифатические углеводороды, такие как циклогексан или парафины, например фракции нефтей, спирты, такие как бутанол или гликоль, а также их простые и сложные эфиры, кетоны, такие как ацетон, метилэтилкетон, метилизобутилкетон или циклогексанон, сильно полярные растворители, такие как диметилформамид и диметилсульфоксид, а также воду. Под сжиженными газообразными наполнителями или носителям понимают такие жидкости, которые при нормальной температуре и нормальном давлении являются газообразными, например газы-носители аэрозолей, такие как галоидуглеводороды, а также бутан, пропан, азот и двуокись углерода.

В качестве твердых носителей имеют в виду, например, помолы природных горных пород, такие как каолины, глиноземы, тальк, мел, кварц, аттапульгит, монтмориллонит или диатомовая земля и помо-

лы синтетических камней, такие как высокодисперсная кремниевая кислота, оксид алюминия и силикаты.

В качестве твердых носителей для гранулятов имеют в виду, например, измельченные и фракционированные природные горные породы, такие как кальцит, мрамор, пемза, сепиолит, доломит, а также синтетические грануляты из помолов неорганических и органических материалов и грануляты из органического материала, такого как древесные опилки, скорлупа кокосовых орехов, кочаны кукурузы и стебли табака.

В качестве эмульгирующих средств и/или пенообразующих средств имеются в виду, например, неионогенные и анионные эмульгаторы, такие как эфиры полиоксиэтилена с жирной кислотой, эфиры полиоксиэтилена с жирным спиртом, например, алкиларилполиглицоловый эфир, алкилсульфонаты, алкилсульфаты, арилсульфонаты, а также гидролизаты яичного белка.

В качестве диспергирующих средств имеются в виду, например, лигнинсульфитовые щелоки и метилцеллюлоза.

В препаратах могут использоваться адгезионные средства, такие как карбоксиметилцеллюлоза, природные и синтетические порошкообразные, зернистые или в латексной форме полимеры, такие как гуммиарабик, поливиниловый спирт, поливинилацетат, а также природные фосфолипиды, такие как кефалины и лецитины, и синтетические фосфолипиды. Другими добавками могут быть минеральные или растительные масла.

Могут использоваться красители и неорганические пигменты, например оксид железа, оксид титана, ферроциан синий и органические красители, такие как ализариновые, азо- и металлфталоцианиновые красители и следовые количества питательных веществ, таких как соли железа, марганца, бора, меди, кобальта, молибдена и цинка.

Препараты содержат, как правило, от 0,1 до 95 вес.% биологически активного вещества, более предпочтительно от 0,5 до 90 вес.%.

Биологически активные вещества/комбинации биологически активных веществ согласно данному изобретению могут применяться как сами по себе, так и в виде их препаратов также в смеси с известными фунгицидами, бактерицидами, акарицидами, нематоцидами или инсектицидами, для того чтобы, например, расширить спектр действия или предупредить развитие устойчивости. Во многих случаях при этом достигаются синергические эффекты, т.е. эффективность смеси больше суммы эффективностей компонентов, применяемых по отдельности.

В качестве примешиваемых компонентов имеют в виду, например, следующие соединения.

Фунгициды

2-Фенилфенол; сульфат 8-гидроксихинолина;
ацибензолар-S-метил; алдиморф; амидофлумет; ампропилфос; ампропилфос-калий; андоприм; анилазин; азаконазол; азоксистробин;
беналаксил; беноданил; беномил; бентиаваликарб-изопропил; бензамакрил; бензамакрилизобутил; биланафос; бинапакрил; бифенил; битертанол; бластицидин-S; бромкуназол; бупиримат; бутиобат; бутиламин;
полисульфид кальция; капсимицин; каптафол; каптан; карбендазим; карбоксин; карпропамид; карвон;
хинометионат; хлорбентазон; хлорфеназол; хлоронеб; хлороталонил; хлоролинат;
клозилакзон; циазофамид; цифлуфенамид; цимоксанил; ципроконазол; ципродинил; ципрофурам;
даггер G, дебакарб; дихлофлуанид; дихлон; дихлорофен; диклоцимет; дикломезин; диклоран; диэтофенкарб; дифеноконазол; дифлуметорим; диметиримол; диметоморф; димоксистробин; диниконазол; диниконазол-M; динокап; дифениламин; дипиритион; диталимфос; дитианон; додин; дразоксолон;
эдифенфос; эпоксиконазол; этабоксам; этиримол; этридиазол;
фамоксадон; фенамидон; фенапанил; фенаримол; фенбуконазол; фенфурам; фенгексамид; фенитропан; феноксанил; фенпиклонил; фенпропидин; фенпропиморф; фербам; флуазинам; флубензимин; флудиоксонил; флуметовер; флуморф; флуоромид; флуоксастробин; флуквинконазол; флурпримидол; флусилазол; флусульфамид; флутоланил; флутриафол; фолпет; фосетил-Al, фосетилнатрий; фуберидазол; фуралаксил; фураметпир; фуркарбанил; фурмециклокс;
гуазатин; гексахлорбензол; гексаконазол; гимексазол;
имазалил; имибенконазол; иминоктадина триацетат; иминоктадине трис-(албесилат); йодокарб; ипконазол; ипробенфос; ипродион; ипроваликарб; ирумацин; изопропиолан; изоваледион;
касугамицин; кресоксим-метил;
манкозеп; манеб; меферимзон; мепанипирим; мепронил; металаксил; металаксил-M; метконазол; метасульфоккарб; метфуроксам; метирам; метоминостробин; метсульфовакс; милдиомицин; миклобутанил; миклозолин;
натамицин; никобифен; нитротал-изопропил; новифлумурон; нуаримол;
офурац; оризастробин; оксадиксил; оксолиновая кислота; окспоконазол; оксикарбоксин; оксифентин;
паклобутразол; пефуразоат; пенконазол; пенцикурон; фосдифен; фталид; пикоксистробин; пипералин; полиоксины; полиоксорим; пробеназол; прохлораз; процимидон; пропамокарб; пропаносин-натрий;

пропиконазол; пропинеб; проквиназид; протиоконазол; пираклостробин; пиразофос; пирифенокс; пири-метанил; пироквилон; пироксифур; пирролнитрин;

квинконазол; квиноксифен; квинтоцен;

симеконазол; спирокамин; сера;

тебуконазол; теклофалам; текназен; тетциклацис; тетраконазол; тиабендазол; тициофен; тифлуза-мид; тиофанат-метил; тирам; тиоксимид; толклофос-метил; толилфлуанид; триадимефон; триадименол; триазбутил; триазоксид; трицикламид; трициклазол; тридеморф; трифлуксистробин; трифлумизол; три-форин; тритиконазол;

униконазол;

валидамицин А; винклозолин;

зинеб; зирам; зоксамид;

(2S)-N-[2-[4-[[3-(4-хлорфенил)-2-пропинил]окси]-3-метоксифенил]этил]-3-метил-2-

[(метилсульфонил)амино]бутанамид;

1-(1-нафталенил)-1Н-пиррол-2,5-дион;

2,3,5,6-тетрахлор-4-(метилсульфонил)пиридин;

2-амино-4-метил-N-фенил-5-тиазолкарбоксамид;

2-хлор-N-(2,3-дигидро-1,1,3-триметил-1Н-инден-4-ил)-3-пиридинкарбоксамид;

3,4,5-трихлор-2,6-пиридиндикарбонитрил;

актиноват;

цис-1-(4-хлорфенил)-2-(1Н-1,2,4-триазол-1-ил)циклогептанол;

метил 1-(2,3-дигидро-2,2-диметил-1Н-инден-1-ил)-1Н-имидазол-5-карбоксилат;

гидрокарбонат калия;

N-(6-метокси-3-пиридинил)циклопропанкарбоксамид;

N-бутил-8-(1,1-диметилэтил)-1-оксапиро[4,5]декан-3-амин;

тетратиокарбонат натрия;

а также соли меди и препараты меди, такие как бордосская жидкость; гидроксид меди; нафтенат меди; оксихлорид меди; сульфат меди; куфранеб; оксид меди; манкоппер; оксин меди.

Бактерициды

Бронопол; дихлорофен; нитрапирин; диметилдитиокарбамат никеля; касугамицин; октилинон; фу-ранкарбоновая кислота; окситетрациклин; пробеназол; стрептомицин; теклофалам; сульфат меди и дру-гие соединения меди.

Инсектициды/акарициды/нематициды

Абамектин, АВG-9008, ацефат, ацеквиноцил, ацетамиприд, ацетопрол, акринатрин, АКD-1022, АКD-3059, АКD-3088, аланикарб, алдикарб, алдоксикарб, аллетрин, аллетрин 1R-изомер, альфа-циперметрин (альфаметрин), амидофлумет, аминокарб, амитраз, авермектин, AZ-60541, азадирахтин, азаметифос, азинфос-метил, азинфос-этил, азоциклотин;

Bacillus popilliae, *Bacillus sphaericus*, *Bacillus subtilis*, *Bacillus thuringiensis*, *Bacillus thuringiensis* штамм EG-2348, *Bacillus thuringiensis* штамм GC-91, *Bacillus thuringiensis* штамм NCTC-11821, бакуло вирусы, *Beauveria bassiana*, *Beauveria tenella*, бендиокарб, бенфуракарб, бенсултап, бензоксимат, бета-цифлутрин, бета-циперметрин, бифеназат, бифентрин, бинапакрил, биоаллетрин, биоаллетрин-S-циклопентилизомер, биоэтанометрин, биоперметрин, биоресметрин, бистрифлурун, ВРМС, брофен-прокс, бромофос-этил, бромопропилат, бромфенвинфос (-метил), BTG-504, BTG-505, буфенкарб, бупро-фезин, бутатиофос, бутокарбоксим, бутоксикарбоксим, бутилпиридабен;

кадусафос, камфехлор, карбарил, карбофуран, карбофенотион, карбосульфат, картап, CGA-50439;

хинометионат, хлордан, хлордимерформ, хлорэтокарб, хлорэтоксифос, хлорфенапир, хлорфенвинфос, хлорфлуазурон, хлормефос, хлоробензилат, хлоропикрин, хлорпроксифен, хлорпирифос-метил, хлорпи-рифос (-этил), хловапортрин, хромафенозид;

цис-циперметрин, цис-ресметрин, цис-перметрин, клоцитрин, клоэтокарб, клофентезин, клотиани-дин, клотиазобен, кодлемон, коумафос, цианофенфос, цианофос, циклопрен, циклопротрин, *Cydia pom-ponella*, цифлутрин, цигалотрин, цигексатин, циперметрин, цифенотрин (1R-транс-изомер), циромазин;

DDT, дельтаметрин, деметон-S-метил, деметон-S-метилсульфон, диафентиурон, диалифос, диази-нон, дихлофентион, дихлорвос, дикофол, дикротофос, дицикланил, дифлубензурун, диметоат, диметил-винфос, динобутин, динокап, динотефуран, диофенолан, дисульфотон, докузат-натрий, дофенапин, DOWCO-439;

эфлусиланат, эмаектин, эмаектин-бензоат, эмпентрин (1R-изомер), эндосульфат, *Entomophthora* spp., EPN, эсфенвалерат, этиофенкарб, этипрол, этион, этопрофос, этофенпрокс, этоксазол, этримфос;

фасфур, фенамифос, феназакин, фенбутатин оксид, фенфлутрин, фенитроотион, фенобукарб, фено-тиокарб, феноксакрим, феноксикарб, фенпропатрин, фенпирад, фенпиритрин, фенпироксимат, фенсуль-фотион, фентион, фентрифанил, фенвалерат, фипронил, флониамид, флуакрипирим, флуазурон, флу-бензимин, флуброцитринат, флуциклоксурон, флуцитринат, флуфенерим, флуфенноксурон, флуфенпрокс, флуметрин, флупиразофос, флулентзин (флуфензин), флувалинат, фонофос, форметанат, формотион, фосметилан, фостиазат, фубфенпрокс (флупроксифен), фуратиокарб;

гамма-НСН, госсиплуре, грандлуре, грануло вирусы, галфенпрокс, галофенозид, НСН, НСН-801, гептенофос, гексафлумурон, гекситиазокс, гидраметиллон, гидропрен;

КА-2002, имидаклоприд, имипротрин, индоксакарб, йодофенфос, ипробенфос, исазофос, изофенфос, изопрокарб, изоксатион, ивермектин;

японилур;

кадетрин, вирусы с полиэдровым ядром, кинопрен;

лямбда-цигалотрин, линдан, луфенурон;

малатион, мекарбам, месульфенфос, метальдегид, метам-натрий, метакрифос, метамидофос, *Metharhizium anisopliae*, *Metharhizium flavoviride*, метидатион, метиокарб, метомил, метопрен, метокси-хлор, метоксифенозид, метолкарб, метоксадиазон, мевинфос, милбемектин, милбемицин, МКИ-245, MON-45700, монокротофос, моксидектин, МТИ-800;

налед, NC-104, NC-170, NC-184, NC-194, NC-196, никлосамид, никотин, нитенпирам, нитиазин, NNI-0001, NNI-0101, NNI-0250, NNI-9768, новалурон, новифлумурон;

ОК-5101, ОК-5201, ОК-9601, ОК-9602, ОК-9701, ОК-9802, ометоат, оксамил, оксидеметон-метил;

Raecilomyces fumosogoseus, паратион-метил, паратион (-этил), перметрин (цис-, транс-), керосин, PH-6045, фенотрин (1R-транс-изомер), фентоат, форат, фосалон, фосмет, фосфамидон, фосфокарб, фоксим, пиперонил бутоксид, пиримикарб, пиримифос-метил, пиримифос-этил, праллетрин, профенофос, промекарб, пропафос, пропаргит, пропетамфос, пропоксур, протиофос, протоат, протрифенбут, пиметро-зин, пираклофос, пиресметрин, пиретрум, пиридабен, пиридалил, пиридафентион, пиридатион, пирими-дифен, пирипроксифен;

квиналфос;

ресметрин, RH-5849, рибавирин, RU-12457, RU-15525;

S-421, S-1833, салитион, себуфос, SI-0009, силафлуофен, спиносад, спиридиклофен, спирумезифен, сулфлурамид, сульфотеп, сулпрофос, SZI-121;

тау-флувалинат, тебуфенозид, тебуфенпирад, тебупиримфос, тефлубензурон, тефлутрин, темефос, темивинфос, тербам, тербуфос, тетрахлорвинфос, тетрадифон, тетраметрин, тетраметрин (1R-изомер), тетрасул, тета-циперметрин, тиаклоприд, тиаметоксам, тиапронил, тиатрифос, тиоциклам гидрооксалат, тиодикарб, тиофанокс, тиометон, тиосултап-натрий, турингиенсин, толфенпирад, тралоцитрин, трало-метрин, трансфлутрин, триаратен, триазамат, триазофос, триазурон, трихлофенидин, трихлорфон, триф-лумурон, триметакарб;

вамидотион, ванилипрол, вербутин, *Verticillium lecanii*;

WL-108477, WL-40027;

YI-5201, YI-5301, YI-5302;

ХМС, ксиллкарб;

ZA-3274, зета-циперметрин, золапрофос, ZXI-8901;

3-метилфенилпропилкарбамат (тсумацид Z) ;

3-(5-хлор-3-пиридинил)-8-(2,2,2-трифторэтил)-8-азабицикло[3.2.1]октан-3-карбонитрил (CAS-Reg.-№185982-80-3) и соответствующий 3-эндо-изомер (CAS-Reg.-№ 185984-60-5) (см. WO 96/37494, WO 98/25923),

а также препараты, которые содержат инсектицидно действующие экстракты растений, нематоды, грибы или вирусы.

Возможна также смесь с другими известными биологически активными веществами, такими как гербициды, или с удобрениями и регуляторами роста растений.

Кроме того, соединения формулы (I)/комбинации биологически активных веществ согласно данно-му изобретению проявляют очень хорошую антимикотическую эффективность. Они отличаются очень широким антимикотическим спектром действия, предпочтительно против дерматофитов и побеговых грибов, плесени и дифазных грибов (например, против видов рода *Candida*, таких как *Candida albicans*, *Candida glabrata*), а также против *Epidermophyton floccosum*, видов рода *Aspergillus*, таких как *Aspergillus niger* и *Aspergillus fumigatus*, видов рода *Trichophyton*, таких как *Trichophyton mentagrophytes*, видов рода *Microsporon*, таких как *Microsporon canis* и *audouinii*. Перечисление этих грибов ни в коем случае не означает ограничение охватываемого микотического спектра, а носит только пояснительный характер.

Биологически активные вещества/комбинации биологически активных веществ могут применяться сами по себе, в виде их препаратов или в виде приготовленных из них форм, готовых к применению, таких как готовые для использования растворы, суспензии, порошки для опрыскивания, пасты, растворимые порошки, распылительные средства и грануляты. Применение осуществляют обычным образом, например поливанием, опрыскиванием, разбрызгиванием, рассыпанием, опылением, покрыванием пеной, намазыванием и т.д. Наряду с этим возможно нанесение веществ способом ультрамалых объемов или препаратом биологически активного вещества или само биологически активное вещество инъектировать в почву. Можно также обработать семенной материал растений.

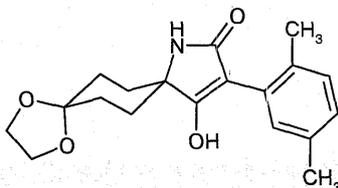
При применении биологически активных веществ/комбинаций биологически активных веществ согласно данному изобретению в качестве фунгицидов расходные количества могут варьироваться в большом интервале в зависимости от способа применения. При обработке частей растений расходные коли-

чества биологически активного вещества составляют, как правило, от 0,1 до 10000 г/га, более предпочтительно от 10 до 1000 г/га. При обработке семенного материала расходные количества биологически активного вещества составляют, как правило, от 0,001 до 50 г/кг семенного материала, более предпочтительно от 0,01 до 10 г/кг семенного материала. При обработке почвы расходные количества биологически активного вещества составляют, как правило, от 0,1 до 10000 г/га, более предпочтительно от 1 до 5000 г/га.

Получение и применение биологически активных веществ/комбинаций биологически активных веществ согласно данному изобретению описано в примерах, приведенных ниже.

Примеры получения

Пример I-1-a-1

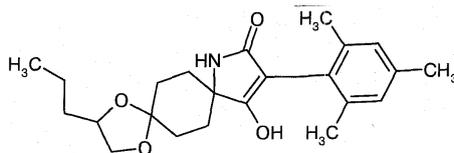


4,88 г (0,042 моль) трет-бутилата калия помещают в 13 мл безводного диметилформамида (ДМФ) и при температуре около 60°C добавляют по каплям 6,82 г вещества примера II-1, растворенного в 14 мл безводного ДМФ, и перемешивают при температуре около 80°C, осуществляя контроль тонкослойной хроматографией.

После завершения реакции реакционный раствор выливают в 150 мл ледяной воды и подкисляют при температуре 0-10°C концентрированной серной кислотой до значения pH 2, отсасывают осадок, промывают ледяной водой и затем сушат. Проводят очистку на хроматографической колонке с силикагелем (дихлорметан/ацетон=5:1).

Выход: 2,5 г (40% от теор.), $T_{пл}$: 233°C.

Пример I-1-a-8

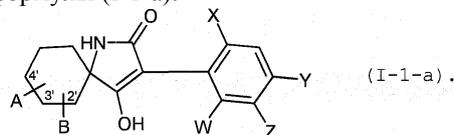


0,644 г (2 ммоль) соединения примера XIV-1-1 в атмосфере аргона, в качестве защитного газа, помещают в 30 мл ксилола, при комнатной температуре добавляют 2,083 г (20 ммоль) 1,2-пентандиола и 0,059 г (0,29 ммоль) п-толуолсульфокислоты и около 0,5 г молекулярного сита 4 Å (порошок) и три дня перемешивают в условиях рефлюкса с контролем тонкослойной хроматографией.

После завершения реакции растворитель отгоняют. Затем проводят очистку на хроматографической колонке с силикагелем (дихлорметан/ацетон=5:1).

Выход: 0,27 г (примерно 35% от теор.), $T_{пл}$: 273°C.

По аналогии с примером (I-1-a-1) и в соответствии с общими прописями получения соединений получают следующие соединения формулы (I-1-a):



| Пример № | W | X | Y | Z | A | B | $T_{пл}$ °C | Изомер |
|----------|-----------------|-----------------|-----------------|-----------------|---|---|-------------|----------------|
| I-1-a-2 | CH ₃ | CH ₃ | CH ₃ | H | 4'-O-(CH ₂) ₂ -O- | | >220 | - |
| I-1-a-3 | CH ₃ | CH ₃ | CH ₃ | CH ₃ | 4'-O-(CH ₂) ₂ -O- | | >240 | - |
| I-1-a-4 | CH ₃ | CH ₃ | Cl | H | 4'-O-(CH ₂) ₂ -O- | | >240 | - |
| I-1-a-5 | H | CH ₃ | CH ₃ | CH ₃ | 4'-O-(CH ₂) ₂ -O- | | 240 | - |
| I-1-a-6 | CH ₃ | Cl | Cl | H | 4'-O-(CH ₂) ₂ -O- | | >245 | - |
| I-1-a-7 | CH ₃ | CH ₃ | CH ₃ | H | 4'-O-CH(CH ₃)-CH(CH ₃)-O- | | * | Смесь |
| I-1-a-8 | CH ₃ | CH ₃ | CH ₃ | H | 4'-O-CH(CH ₃)CH ₂ -O- | | 273 | A logP 2,73 |
| I-1-a-9 | CH ₃ | CH ₃ | CH ₃ | H | 4'-O-CH(CH ₃)CH ₂ -O- | | Разл. | B logP 2,78 |
| I-1-a-10 | CH ₃ | CH ₃ | CH ₃ | H | 4'-O-CH(CH ₃)-CH(CH ₃)-O- | | 275 | Смесь |
| I-1-a-11 | CH ₃ | Cl | Cl | H | 4'-O-(CH ₂) ₃ -O- | | 262 | - |
| I-1-a-12 | H | CH ₃ | H | CH ₃ | 4'-O-(CH ₂) ₃ -O- | | 166 | - |

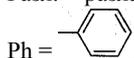
| Пример № | W | X | Y | Z | A | B | T _{пл} °C | Изомер |
|----------|-------------------------------|-------------------------------|-----------------|-----------------|---|---|--------------------|--------|
| I-1-a-13 | CH ₃ | CH ₃ | CH ₃ | CH ₃ | 4'-O-(CH ₂) ₃ -O- | | 263 | - |
| I-1-a-14 | CH ₃ | CH ₃ | Cl | H | 4'-O-(CH ₂) ₃ -O- | | 312 | - |
| I-1-a-15 | H | Cl | H | 4-Cl-Ph | 4'-O-(CH ₂) ₃ -O- | | 133 | - |
| I-1-a-16 | H | CH ₃ | H | 4-Cl-Ph | 4'-O-(CH ₂) ₃ -O- | | 210 | - |
| I-1-a-17 | H | CH ₃ | CH ₃ | CH ₃ | 4'-O-(CH ₂) ₃ -O- | | 189 | - |
| I-1-a-18 | CH ₃ | CH ₃ | CH ₃ | H | 4'-O-(CH ₂) ₃ -O- | | 229 | - |
| I-1-a-19 | CH ₃ | CH ₃ | Br | H | 4'-O-(CH ₂) ₃ -O- | | 255 | - |
| I-1-a-20 | CH ₃ | CH ₃ | Cl | H | 4'-O-CH ₂ -C(CH ₃) ₂ -CH ₂ -O- | | 273 | - |
| I-1-a-21 | CH ₃ | CH ₃ | CH ₃ | H | 4'-O-CHCH ₃ -CH ₂ -CHCH ₃ -O- | | 265 | Смесь |
| I-1-a-22 | CH ₃ | CH ₃ | CH ₃ | H | 4'-O-CHCH ₃ -C(CH ₂) ₂ -O- | | 230 | Смесь |
| I-1-a-23 | CH ₃ | CH ₃ | CH ₃ | H | 4'-O-CH ₂ -C(CH ₃) ₂ -CH ₂ -O- | | 230 | - |
| I-1-a-24 | CH ₃ | OCH ₃ | CH ₃ | H | 4'-O-(CH ₂) ₃ -O- | | 202 | - |
| I-1-a-25 | CH ₃ | C ₂ H ₅ | CH ₃ | H | 4'-O-(CH ₂) ₂ -O- | | Разл. | - |
| I-1-a-26 | CH ₃ | CH ₃ | Br | H | 4'-O-(CH ₂) ₂ -O- | | 306 | - |
| I-1-a-27 | H | CH ₃ | H | 5-(4-Cl-Ph) | 4'-O-(CH ₂) ₂ -O- | | 154 | - |
| I-1-a-28 | H | CH ₃ | H | CH ₃ | 4'-O-CHCH ₃ -CH ₂ -O- | | Воск | Смесь |
| I-1-a-29 | H | CH ₃ | H | CH ₃ | 4'-O-CHCH ₃ -CHCH ₃ -O- | | 84 | Смесь |
| I-1-a-30 | CH ₃ | CH ₃ | Cl | H | 4'-O-CHCH ₃ -CHCH ₃ -O- | | 268 | Смесь |
| I-1-a-31 | CH ₃ | CH ₃ | Cl | H | 4'-O-CHCH ₃ -CH ₂ -O- | | 301 | Смесь |
| I-1-a-32 | CH ₃ | CH ₃ | Br | H | 4'-O-CH ₂ -CHCH ₃ -CH ₂ -O- | | 171 | Смесь |
| I-1-a-33 | CH ₃ | CH ₃ | Br | H | 4'-O-CH ₂ -C(CH ₃) ₂ -CH ₂ -O- | | 266 | - |
| I-1-a-34 | CH ₃ | CH ₃ | Cl | H | 4'-O-CH ₂ -CHCH ₃ -CH ₂ -O- | | 265 | Смесь |
| I-1-a-35 | CH ₃ | CH ₃ | Cl | H | 4'-O-CHCH ₃ -(CH ₂) ₂ -O- | | 243 | Смесь |
| I-1-a-36 | H | CH ₃ | H | CH ₃ | 4'-O-CHCH ₃ -CH ₂ -CHCH ₃ -O- | | 161 | Смесь |
| I-1-a-37 | H | CH ₃ | H | CH ₃ | 4'-O-CHCH ₃ -(CH ₂) ₂ -O- | | Масло | Смесь |
| I-1-a-38 | CH ₃ | CH ₃ | Cl | H | 4'-O-CHCH ₃ -CH ₂ -CHCH ₃ -O- | | 276 | Смесь |
| I-1-a-39 | CH ₃ | C ₂ H ₅ | Br | H | 4'-O-(CH ₂) ₂ -O- | | 293 | - |
| I-1-a-40 | C ₂ H ₅ | C ₂ H ₅ | CH ₃ | H | 4'-O-(CH ₂) ₂ -O- | | 269 | - |
| I-1-a-41 | H | CH ₃ | Cl | CH ₃ | 4'-O-(CH ₂) ₂ -O- | | 236 | - |
| I-1-a-42 | C ₂ H ₅ | OCH ₃ | Cl | H | 4'-O-(CH ₂) ₂ -O- | | 234 | - |
| I-1-a-43 | CH ₃ | OCH ₃ | CH ₃ | H | 4'-O-(CH ₂) ₂ -O- | | 237 | - |
| I-1-a-44 | C ₂ H ₅ | Cl | Cl | H | 4'-O-(CH ₂) ₂ -O- | | 305 | - |
| I-1-a-45 | C ₂ H ₅ | CH ₃ | Br | H | 4'-O-CHCH ₃ -CHCH ₃ -O- | | 148 | Смесь |
| I-1-a-46 | CH ₃ | CH ₃ | Br | H | 4'-O-CHCH ₃ -CHCH ₃ -O- | | 275 | Смесь |

| Пример № | W | X | Y | Z | A | B | T _{пл} °C | Изомер |
|----------|-------------------------------|-------------------------------|-----------------|-----------------|---|---|--------------------|--------|
| I-1-a-47 | CH ₃ | CH ₃ | Br | H | 4'-O-CHCH ₃ -CH ₂ -O- | | 292 | Смесь |
| I-1-a-48 | C ₂ H ₅ | Br | CH ₃ | H | 4'-O-(CH ₂) ₂ -O- | | 296 | - |
| I-1-a-49 | H | Cl | H | 4-Cl-Ph | 4'-O-(CH ₂) ₂ -O- | | 257 | - |
| I-1-a-50 | CH ₃ | CH ₃ | Br | H | 4'-O-CH-CH ₂ -O- CH ₂ -OCH ₃ | | 116 | Смесь |
| I-1-a-51 | CH ₃ | CH ₃ | H | 4-Cl-Ph | 4'-O-CHCH ₃ -CH ₂ -O- | | 288 | Смесь |
| I-1-a-52 | H | CH ₃ | H | 4-Cl-Ph | 4'-O-CHCH ₃ -CH ₂ -O- | | 198 | Смесь |
| I-1-a-53 | CH ₃ | C ₂ H ₅ | Br | H | 4'-O-CHCH ₃ -CH ₂ -O- | | 255 | Смесь |
| I-1-a-54 | H | CH ₃ | H | 4-Cl-Ph | 4'-O-CHCH ₃ -CHCH ₃ -O- | | 213 | Смесь |
| I-1-a-55 | H | CH ₃ | Cl | CH ₃ | 4'-O-CHCH ₃ -CH ₂ -O- | | 272 | Смесь |
| I-1-a-56 | CH ₃ | CH ₃ | Br | H | 4'-O-CHCH ₃ -CH ₂ -CHCH ₃ -O- | | 262 | Смесь |
| I-1-a-57 | H | Cl | Cl | H | 4'-O-(CH ₂) ₃ -O- | | 237 | - |
| I-1-a-58 | CH ₃ | CH ₃ | Br | H | 4'-O-CHCH ₃ -(CH ₂) ₂ -O- | | 80 | Смесь |
| I-1-a-59 | CH ₃ | Cl | Cl | H | 4'-O-CH ₂ -C(CH ₃) ₂ -CH ₂ -O- | | 264 | - |
| I-1-a-60 | CH ₃ | C ₂ H ₅ | Br | H | 4'-O-CHCH ₃ -(CH ₂) ₂ -O- | | 190 | Смесь |
| I-1-a-61 | H | CH ₃ | H | CH ₃ | 4'-O-CH ₂ -C(CH ₃) ₂ -CH ₂ -O- | | 240 | - |
| I-1-a-62 | H | CH ₃ | H | CH ₃ | 4'-O-CH ₂ -CHCH ₃ -CH ₂ -O- | | 276 | Смесь |
| I-1-a-63 | CH ₃ | C ₂ H ₅ | Br | H | 4'-O-CHCH ₃ -CH ₂ -CHCH ₃ -O- | | >300 | Смесь |
| I-1-a-64 | H | Cl | H | 4-Cl-Ph | 4'-O-CH ₂ -C(CH ₃) ₂ -CH ₂ -O- | | 276 | - |
| I-1-a-65 | H | Cl | H | 4-Cl-Ph | 4'-O-CH ₂ -CHCH ₃ -CH ₂ -O- | | 79 | Смесь |
| I-1-a-66 | H | CH ₃ | H | 4-Cl-Ph | 4'-O-CHCH ₃ -(CH ₂) ₂ -O- | | 67 | Смесь |
| I-1-a-67 | H | CH ₃ | H | 4-Cl-Ph | 4'-O-CH ₂ -C(CH ₃) ₂ -CH ₂ -O- | | 234 | - |
| I-1-a-68 | H | CH ₃ | H | CH ₃ | 3'-O-(CH ₂) ₂ -O- | | 211 | - |
| I-1-a-69 | C ₂ H ₅ | Br | CH ₃ | H | 3'-O-(CH ₂) ₂ -O- | | Разл. | - |
| I-1-a-70 | CH ₃ | CH ₃ | Cl | H | 3'-O-(CH ₂) ₂ -O- | | 260 | - |
| I-1-a-71 | CH ₃ | CH ₃ | CH ₃ | H | 3'-O-CH-CH ₂ -O- CH ₂ -OCH ₃ | | Масло | Смесь |
| I-1-a-72 | C ₂ H ₅ | Br | CH ₃ | H | 3'-O-CH-CH ₂ -O- CH ₂ -OCH ₃ | | Масло | Смесь |
| I-1-a-73 | H | CH ₃ | H | CH ₃ | 3'-O-CH-CH ₂ -O- CH ₂ -OCH ₃ | | Масло | Смесь |

| Пример № | W | X | Y | Z | A | B | T _{пл} °C | Изомер |
|----------|-------------------------------|-------------------------------|-----------------|---------|---|---|--------------------|--------|
| I-1-a-74 | CH ₃ | CH ₃ | Cl | H | 3'-O-CH-CH ₂ -O- CH ₂ -OCH ₃ | | 82 | Смесь |
| I-1-a-75 | CH ₃ | CH ₃ | Cl | H | 4'-O-CH-CH ₂ -O- CH ₂ -OCH ₃ | | 67 | Смесь |
| I-1-a-76 | H | Cl | H | 4-Cl-Ph | 4'-O-CHCH ₃ -CH ₂ -O- | | 68 | Смесь |
| I-1-a-77 | C ₂ H ₅ | Br | CH ₃ | H | 4'-O-CHCH ₃ -CH ₂ -O- | | 281 | Смесь |
| I-1-a-78 | H | Cl | H | 4-Cl-Ph | 4'-O-CHCH ₃ -(CH ₂) ₂ -O- | | 232 | Смесь |
| I-1-a-79 | H | Cl | H | 4-Cl-Ph | 4'-O-CH ₂ -CHCH ₃ -CH ₂ -O- | | 160 | Смесь |
| I-1-a-80 | H | Cl | H | 4-Cl-Ph | 4'-O-CHCH ₃ -CH ₂ -CHCH ₃ - O- | | 268 | Смесь |
| I-1-a-81 | H | Cl | H | 4-Cl-Ph | 4'-O-CH ₂ -C(CH ₃) ₂ -CH ₂ -O- | | 151 | - |
| I-1-a-82 | CH ₃ | C ₂ H ₅ | Br | H | 4'-O-(CH ₂) ₃ -O- | | 244 | - |
| I-1-a-83 | CH ₃ | CH ₃ | Cl | H | 3'-O-CHCH ₃ -CH ₂ -O- | | 167 | Смесь |
| I-1-a-84 | CH ₃ | CH ₃ | Cl | H | 3'-O-CH ₂ -C(CH ₃) ₂ -CH ₂ -O- | | 266 | Смесь |
| I-1-a-85 | CH ₃ | CH ₃ | Cl | H | 3'-O-(CH ₂) ₃ -O- | | 261 | Смесь |
| I-1-a-86 | CH ₃ | C ₂ H ₅ | 4-Cl-Ph | H | 4'-O-CHCH ₃ -CH ₂ -O- | | 219-222 | Смесь |

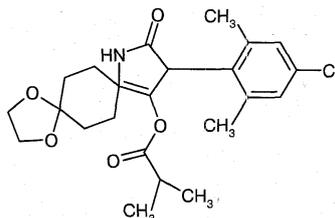
*¹H-ЯМР (400 МГц, d₆-ДМСО=диметилсульфоксид): δ=1,05-1,09 (2d, 6H, 2×CHCH₃); 4,18-4,23 (m, 2H, 2×CHCH₃) млн. долей.

Разл. = разлагается.



T_{пл} = температура плавления.

Пример I-1-b-1



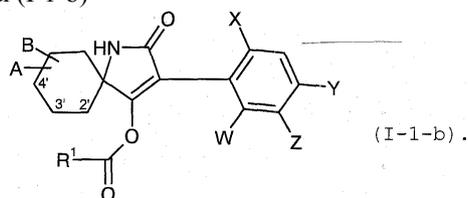
1,82 г соединения согласно примеру I-1-a-4 помещают в 50 мл безводного этилового эфира уксусной кислоты и 0,11 мл (5,5 ммоль) триэтиламина в условиях рефлюкса. Добавляют 0,55 мл (0,0055 моль) хлорида изомаляной кислоты в 5 мл безводного этилового эфира уксусной кислоты и перемешивают в условиях рефлюкса.

После завершения реакции (контроль осуществляют тонкослойной хроматографией) отгоняют растворитель и остаток растворяют в дихлорметане. Промывают 2 раза по 30 мл 0,5н. NaOH, сушат и отгоняют растворитель.

После этого проводят очистку на хроматографической колонке с силикагелем (дихлорметан/этиловый эфир уксусной кислоты = 3:1).

Выход: 0,3 г (14% от теор.), T_{пл}: 215°C.

По аналогии с примером (I-1-b-1) и согласно общим прописям получения соединений получают следующие соединения формулы (I-1-b)



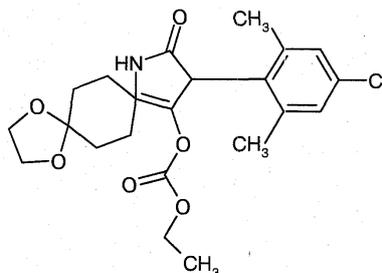
| Пример № | W | X | Y | Z | A | B | R ¹ | T _{пл} , °C | Изомер |
|----------|-------------------------------|-------------------------------|-----------------|---|---|---|---|--|--------|
| I-1-b-2 | CH ₃ | C ₂ H ₅ | Br | H | 4'-O-(CH ₂) ₂ -O- | | H ₃ CO-CH ₂ - | *3,23 (s,3H, OCH ₃) 7,21 (s,2H, -Ar-H) | - |
| I-1-b-3 | CH ₃ | C ₂ H ₅ | Br | H | 4'-O-(CH ₂) ₂ -O- | | Изо-C ₃ H ₇ | Затвердевшая пена | - |
| I-1-b-4 | C ₂ H ₅ | Cl | Cl | H | 4'-O-(CH ₂) ₂ -O- | | Изо-C ₃ H ₇ | 106-112 | - |
| I-1-b-5 | C ₂ H ₅ | Br | CH ₃ | H | 4'-O-CHCH ₃ -CHCH ₃ -O- | | Изо-C ₃ H ₇ | 198-200 | Смесь |
| I-1-b-6 | C ₂ H ₅ | Cl | Cl | H | 4'-O-(CH ₂) ₂ -O- | | H ₃ CO-CH ₂ - | *2,63(m,2H,Ar-CH ₂) 3,29(s,3H,OCH ₃) | - |
| I-1-b-7 | C ₂ H ₅ | OCH ₃ | Cl | H | 4'-O-(CH ₂) ₂ -O- | | H ₃ CO-CH ₂ - | 170-175 | - |
| I-1-b-8 | C ₂ H ₅ | Br | CH ₃ | H | 3'-O-(CH ₂) ₂ -O- | | Изо-C ₃ H ₇ | Затвердевшая пена **1,07(m,6H, CH(CH ₃) ₂) 2,28(s,3H,ArCH ₃) | - |
| I-1-b-9 | C ₂ H ₅ | Br | CH ₃ | H | 3'-O-(CH ₂) ₂ -O- | | H ₃ CO-CH ₂ - | *2,29(s,3H,Ar-CH ₃) 3,26(s,3H,OCH ₃) | - |
| I-1-b-10 | C ₂ H ₅ | Br | CH ₃ | H | 3'-O-CH-CH ₂ -O- CH ₂ -OCH ₃ | | Изо-C ₃ H ₇ | Масло **1,05(m,6H, CH(CH ₃) ₂) 2,29(s,3H,ArCH ₃) | Смесь |
| I-1-b-11 | C ₂ H ₅ | Br | CH ₃ | H | 3'-O-CH-CH ₂ -O- CH ₂ -OCH ₃ | | H ₃ CO-CH ₂ - | Масло **2,29(s,3H, ArCH ₃) 3,26(s,3H,OCH ₃) | Смесь |
| I-1-b-12 | CH ₃ | C ₂ H ₅ | Br | H | 4'-O-CHCH ₃ -CH ₂ -CHCH ₃ -O- | |  | 225 | Смесь |
| I-1-b-13 | CH ₃ | C ₂ H ₅ | Br | H | 4'-O-CHCH ₃ -(CH ₂) ₂ -O- | | 2-Cl-Ph | 225 | Смесь |
| I-1-b-14 | CH ₃ | C ₂ H ₅ | Br | H | 4'-O-CHCH ₃ -CHCH ₃ -O- | |  | 246 | Смесь |
| I-1-b-15 | CH ₃ | C ₂ H ₅ | Br | H | 3'-O-CH-CH ₂ -O- CH ₂ -OCH ₃ | | Трет-C ₄ H ₉ | Затвердевшая пена | Смесь |
| I-1-b-16 | CH ₃ | C ₂ H ₅ | Br | H | 4'-O-CHCH ₃ -CH ₂ -O- | | изо-C ₃ H ₇ | 194 | Смесь |
| I-1-b-17 | CH ₃ | C ₂ H ₅ | Br | H | 4'-O-CHCH ₃ -(CH ₂) ₂ -O- | | изо-C ₃ H ₇ | *1,06(m,6H, CH(CH ₃) ₂) 7,21(s,2H,ArH) | Смесь |
| I-1-b-18 | C ₂ H ₅ | CH ₃ | Br | H | 4'-O-CHCH ₃ -CHCH ₃ -O- | | H ₃ CO-CH ₂ - | *3,24(s,3H, OCH ₃) 7,21(s,2H,Ar-H) | Смесь |
| I-1-b-19 | C ₂ H ₅ | CH ₃ | CH ₃ | H | 4'-O-(CH ₂) ₂ -O- | | изо-C ₃ H ₇ | *0,98 (dd, 6H, CH(CH ₃) ₂) 3,98 (m, 4H, CH ₂ O) 6,86 (s, 2H, Ar-H) | - |
| I-1-b-20 | C ₂ H ₅ | CH ₃ | Br | H | 4'-O-CHCH ₃ -CH ₂ -CHCH ₃ -O- | | изо-C ₃ H ₇ | 120 | Смесь |

*¹H-ЯМР (400 МГц, CDCl₃): химические сдвиги δ в млн. долях.

**¹H-ЯМР (300 МГц, CDCl₃): химические сдвиги δ в млн. долях.

Ar = арил.

Пример I-1-c-1



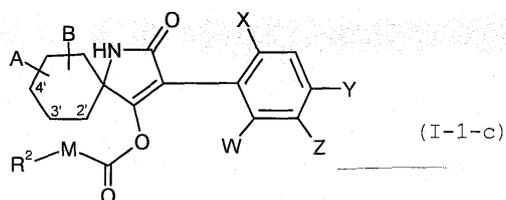
1,82 г соединения примера I-1-a-4 помещают в 30 мл безводного дихлорметана и 0,7 мл триэтиламина и перемешивают при температуре от 10 до 20°C. Добавляют 0,5 мл этилового эфира хлормуравьиной кислоты в 2 мл безводного дихлорметана и перемешивают при комнатной температуре.

После завершения реакции (контроль проводят тонкослойной хроматографией) промывают 2 раза по 10 мл 0,5н. NaOH и сушат над сульфатом магния. В заключение отгоняют растворитель.

После этого проводят очистку на хроматографической колонке с силикагелем (дихлорметан/этанол=30:1).

Выход: 1,15 г (52% от теор.), $T_{пл}$: 198°C.

По аналогии с примером (I-1-c-1) и в соответствии с прописями получения соединений получают следующие соединения формулы (I-1-c)



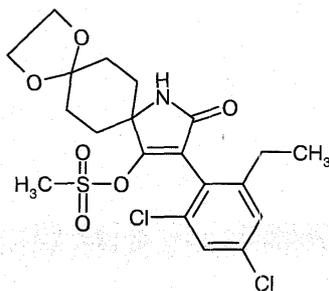
| Пример № | W | X | Y | Z | A | B | M | R ² | T _{пл} °C | Изомер |
|----------|-----------------|-------------------------------|-----------------|-----------------|---|---|---|-------------------------------|--------------------|--------|
| I-1-c-2 | CH ₃ | CH ₃ | CH ₃ | H | 4'-O-(CH ₂) ₂ -O- | | O | C ₂ H ₅ | 181 | - |
| I-1-c-3 | H | CH ₃ | CH ₃ | CH ₃ | 4'-O-(CH ₂) ₂ -O- | | O | C ₂ H ₅ | 221 | - |
| I-1-c-4 | CH ₃ | Cl | Cl | H | 4'-O-(CH ₂) ₂ -O- | | O | C ₂ H ₅ | 233 | - |
| I-1-c-5 | CH ₃ | CH ₃ | CH ₃ | CH ₃ | 4'-O-(CH ₂) ₂ -O- | | O | C ₂ H ₅ | 209 | - |
| I-1-c-6 | CH ₃ | CH ₃ | CH ₃ | H | 4'-O-CHCH ₃ -CH ₂ -O- | | O | C ₂ H ₅ | 218 | Смесь |
| I-1-c-7 | CH ₃ | Cl | Cl | H | 4'-O-(CH ₂) ₃ -O- | | O | C ₂ H ₅ | 235 | - |
| I-1-c-8 | CH ₃ | CH ₃ | Cl | H | 4'-O-(CH ₂) ₃ -O- | | O | C ₂ H ₅ | 195 | - |
| I-1-c-9 | H | CH ₃ | CH ₃ | CH ₃ | 4'-O-(CH ₂) ₃ -O- | | O | C ₂ H ₅ | 235 | - |
| I-1-c-10 | CH ₃ | CH ₃ | Br | H | 4'-O-(CH ₂) ₃ -O- | | O | C ₂ H ₅ | 234 | - |
| I-1-c-11 | CH ₃ | CH ₃ | CH ₃ | H | 4'-O-(CH ₂) ₃ -O- | | O | C ₂ H ₅ | 229 | - |
| I-1-c-12 | CH ₃ | CH ₃ | Cl | H | 4'-O-CH ₂ -CHCH ₃ -CH ₂ -O- | | O | C ₂ H ₅ | 241 | Смесь |
| I-1-c-13 | CH ₃ | CH ₃ | Cl | H | 4'-O-CH ₂ -C(CH ₃) ₂ -CH ₂ -O- | | O | C ₂ H ₅ | 247 | - |
| I-1-c-14 | CH ₃ | C ₂ H ₅ | Br | H | 4'-O-(CH ₂) ₂ -O- | | O | C ₂ H ₅ | 200-201 | - |
| I-1-c-15 | CH ₃ | C ₂ H ₅ | CH ₃ | H | 4'-O-(CH ₂) ₂ -O- | | O | C ₂ H ₅ | Масло | - |
| I-1-c-16 | H | CH ₃ | H | 4-Cl-Ph | 4'-O-(CH ₂) ₂ -O- | | O | C ₂ H ₅ | 197 | - |
| I-1-c-17 | CH ₃ | CH ₃ | Cl | H | 4'-O-CHCH ₃ -CH ₂ -O- | | O | C ₂ H ₅ | 223 | Смесь |
| I-1-c-18 | CH ₃ | CH ₃ | Cl | H | 4'-O-CHCH ₃ -CHCH ₃ -O- | | O | C ₂ H ₅ | 232 | Смесь |
| I-1-c-19 | H | CH ₃ | H | CH ₃ | 4'-O-CHCH ₃ -CH ₂ -O- | | O | C ₂ H ₅ | 141 | Смесь |
| I-1-c-20 | CH ₃ | CH ₃ | Br | H | 4'-O-(CH ₂) ₂ -O- | | O | C ₂ H ₅ | 222 | - |

| Пример № | W | X | Y | Z | A | B | M | R ² | T _{пл} °C | Изомер |
|----------|-------------------------------|-------------------------------|-----------------|-----------------|---|---|---|--|---|--------|
| I-1-c-21 | H | CH ₃ | Cl | CH ₃ | 4'-O-(CH ₂) ₂ -O- | | O | C ₂ H ₅ | 187 | - |
| I-1-c-22 | H | CH ₃ | H | CH ₃ | 4'-O-CHCH ₃ -CHCH ₃ -O- | | O | C ₂ H ₅ | 180 | Смесь |
| I-1-c-23 | C ₂ H ₅ | C ₂ H ₅ | CH ₃ | H | 4'-O-(CH ₂) ₂ -O- | | O | C ₂ H ₅ | 179 | - |
| I-1-c-24 | CH ₃ | O-CH ₃ | CH ₃ | H | 4'-O-(CH ₂) ₂ -O- | | O | C ₂ H ₅ | 176 | - |
| I-1-c-25 | C ₂ H ₅ | O-CH ₃ | Cl | H | 4'-O-(CH ₂) ₂ -O- | | O | C ₂ H ₅ | **1,16 (s,q ⁶ H, -Ar-CH ₂ -CH ₃ и O-CH ₂ -CH ₃) 3,79 (s,3H,Ar- OCH ₃) | - |
| I-1-c-26 | C ₂ H ₅ | Cl | Cl | H | 4'-O-(CH ₂) ₂ -O- | | O | C ₂ H ₅ | 175-183 | - |
| I-1-c-27 | CH ₃ | C ₂ H ₅ | Br | H | 4'-O-CHCH ₃ -CH ₂ -O- | | O | C ₂ H ₅ | 181 | Смесь |
| I-1-c-28 | C ₂ H ₅ | Cl | Cl | H | 4'-O-(CH ₂) ₂ -O- | | O | C ₆ H ₅ -CH ₂ - | 173 | - |
| I-1-c-29 | CH ₃ | C ₂ H ₅ | Br | H | 4'-O-CHCH ₃ -CHCH ₃ -O- | | O | CH ₂ = CH- CH ₂ - | 187 | Смесь |
| I-1-c-30 | CH ₃ | CH ₃ | Cl | H | 4'-O-CHCH ₃ -(CH ₂) ₂ -O- | | O | C ₂ H ₅ | 229 | Смесь |
| I-1-c-31 | H | CH ₃ | H | 4-Cl-Ph | 4'-O-(CH ₂) ₃ -O- | | O | C ₂ H ₅ | 207 | - |
| I-1-c-32 | CH ₃ | CH ₃ | Br | H | 4'-O-CH ₂ -CHCH ₃ -CH ₂ -O- | | O | C ₂ H ₅ | 242 | Смесь |
| I-1-c-33 | CH ₃ | CH ₃ | Br | H | 4'-O-CH ₂ -C(CH ₃) ₂ -CH ₂ -O- | | O | C ₂ H ₅ | 250 | - |
| I-1-c-34 | CH ₃ | O-CH ₃ | CH ₃ | H | 4'-O-(CH ₂) ₃ -O- | | O | C ₂ H ₅ | 222 | - |
| I-1-c-35 | H | CH ₃ | H | CH ₃ | 4'-O-CH ₂ -C(CH ₃) ₂ -CH ₂ -O- | | O | C ₂ H ₅ | 194 | - |
| I-1-c-36 | H | CH ₃ | H | CH ₃ | 4'-O-CH ₂ -CHCH ₃ -CH ₂ -O- | | O | C ₂ H ₅ | 169 | Смесь |
| I-1-c-37 | CH ₃ | C ₂ H ₅ | Br | H | 4'-O-CHCH ₃ -CH ₂ -CHCH ₃ -O- | | O | C ₂ H ₅ | 175-178 | Смесь |
| I-1-c-38 | CH ₃ | C ₂ H ₅ | Br | H | 4'-O-CHCH ₃ -(CH ₂) ₂ -O- | | O | C ₂ H ₅ | 97 | Смесь |
| I-1-c-39 | H | Cl | H | 4-Cl-Ph | 4'-O-(CH ₂) ₃ -O- | | O | C ₂ H ₅ | 237 | - |
| I-1-c-40 | H | CH ₃ | H | CH ₃ | 3'-O-(CH ₂) ₂ -O- | | O | C ₂ H ₅ | 156 | - |
| I-1-c-41 | CH ₃ | CH ₃ | Cl | H | 3'-O-(CH ₂) ₂ -O- | | O | C ₂ H ₅ | 193 | - |
| I-1-c-42 | C ₂ H ₅ | Br | CH ₃ | H | 3'-O-(CH ₂) ₂ -O- | | O | C ₂ H ₅ | **2,58 (m,2H,Ar- CH ₂), 4,08 (d, 2H, OCH ₂ -CH ₃) | - |
| I-1-c-43 | C ₂ H ₅ | Br | CH ₃ | H | 3'-O-CH-CH ₂ -O- CH ₂ -OCH ₃ | | O | C ₂ H ₅ | Масло**1,18 (s,q ⁶ H, Ar- CH ₂ -CH ₃ и O-CH ₂ -CH ₃) 2,32 (s,3H,Ar- CH ₃) | Смесь |
| I-1-c-44 | C ₂ H ₅ | Br | CH ₃ | H | 3'-O-(CH ₂) ₂ -O- | | O | (H ₃ C) ₃ C-CH ₂ - | Пена **0,8 (s,9H, C(CH ₃) ₃) 2,28 (s,3H,Ar- CH ₃) | - |
| I-1-c-45 | H | Cl | H | 4-Cl-Ph | 4'-O-CHCH ₃ -CH ₂ -O- | | O | C ₂ H ₅ | 219 | Смесь |
| I-1-c-46 | H | Cl | H | 4-Cl-Ph | 4'-O-(CH ₂) ₂ -O- | | O | C ₂ H ₅ | 239 | - |

*¹H-ЯМР (400 МГц, CDCl₃): химические сдвиги δ в млн. долях.

**¹H-ЯМР (300 МГц, CDCl₃): химические сдвиги δ млн. долях.

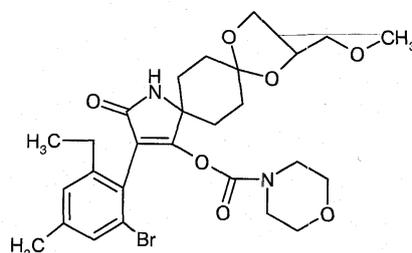
Пример I-1-d-1



0,159 г соединения примера I-1-a-44 помещают в 10 мл трихлорметана, добавляют при комнатной температуре 0,098 мл диизопропилэтиламина и 1,5 мг DMAP (4-диметиламинопиридин), 0,037 мл хлорида метансульфокислоты и перемешивают в течение 20 ч, добавляют 5 мл раствора NaCl, перемешивают примерно 0,5 ч при комнатной температуре, отделяют органическую фазу, сушат сульфатом натрия и отгоняют растворитель. Получаемый сырой продукт очищают на хроматографической колонке на силикагеле с градиентом *n*-гептан/этиловый эфир уксусной кислоты от 4:1 до 0:100.

Выход 0,07 г (37% от теор.), $T_{пл}$: 217°C.

Пример I-1-g-1

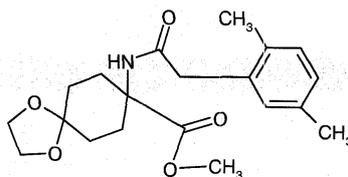


0,233 г соединения примера I-1-a-72 помещают в 8 мл хлороформа, 0,098 мл диизопропилэтиламина и 1,5 мг DMAP, затем добавляют еще 0,056 мл хлорида морфолинкарбоновой кислоты, перемешивают в течение 20 ч при комнатной температуре, добавляют 5 мл 5%-ного раствора карбоната натрия, перемешивают в течение 0,5 ч, отделяют органическую фазу, сушат сульфатом натрия и отгоняют растворитель. Сырой продукт очищают на хроматографической колонке на силикагеле с градиентом *n*-гептан/этиловый эфир уксусной кислоты от 4:1 до 0:100.

Выход: 0,148 г (64% от теор.), масло.

$^1\text{H-NMR}$ (400 МГц, CDCl_3) δ : 2,31 (2, 3H, Ar-CH₃), 3,1, 3,2 (каждый m, 2H, CH₂O) млн. долей.

Пример II-1



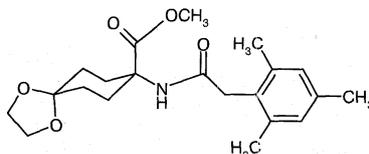
9,56 г гидрохлорида 8-аминометилового эфира 1,4-диокса Spiro[4,5]декан-8-карбоновой кислоты помещают в 38 мл безводного ацетонитрила и добавляют 17,5 г (0,127 моль) перемолотого карбоната калия при температуре 5-10°C. После этого добавляют по каплям 6,94 г хлорида 2,5-диметилфенилуксусной кислоты в 10 мл безводного ацетонитрила в течение 12 мин.

Перемешивают в течение 3 ч при комнатной температуре.

Реакционную смесь выливают в 250 мл ледяной воды и отсасывают осадок. Промывают водой и растворяют осадок в дихлорметане, сушат и отгоняют растворитель. Очистку проводят на хроматографической колонке на силикагеле (дихлорметан/этиловый эфир уксусной кислоты=3:1).

Выход: 6,82 г (49% от теор.), $T_{пл}$: 115°C.

Пример II-2



В реакционный сосуд помещают 154,6 г (1,579 моль) концентрированной серной кислоты и добавляют по каплям 107,9 г соединения примера (XXI-1) в 630 мл метилхлорида в виде суспензии при внутренней температуре от 30 до 40°C. Перемешивают в течение 2 ч при температуре от 30 до 40°C и

добавляют по каплям 220 мл безводного метанола, так что в сосуде устанавливается внутренняя температура 40°C.

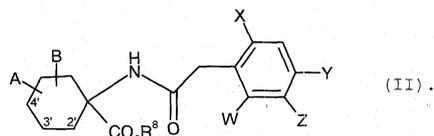
Перемешивают далее в течение 6 ч при наружной температуре от 40 до 70°C.

Реакционную смесь добавляют к 1,5 кг льда, экстрагируют дихлорметаном и промывают раствором NaHCO₃. Сушат и отгоняют растворитель.

Затем проводят очистку на хроматографической колонке на силикагеле (толуол/этиловый эфир уксусной кислоты=1:1).

Выход: 11,4 г (10% от теор.).

По аналогии с примерами (II-1) и (II-2) в соответствии с общими прописями получают следующие соединения формулы (II):



| Пример № | W | X | Y | Z | A | B | R ⁸ | T _{пл} °C |
|----------|-------------------------------|-------------------------------|-----------------|-----------------|---|---|-----------------|--------------------|
| II-2 | CH ₃ | CH ₃ | CH ₃ | H | 4'-O-(CH ₂) ₂ -O- | | CH ₃ | Log P 2,68 |
| II-3 | CH ₃ | CH ₃ | CH ₃ | CH ₃ | 4'-O-(CH ₂) ₂ -O- | | CH ₃ | 141 |
| II-4 | CH ₃ | CH ₃ | Cl | H | 4'-O-(CH ₂) ₂ -O- | | CH ₃ | 181 |
| II-5 | H | CH ₃ | CH ₃ | CH ₃ | 4'-O-(CH ₂) ₂ -O- | | CH ₃ | 129 |
| II-6 | CH ₃ | Cl | Cl | H | 4'-O-(CH ₂) ₂ -O- | | CH ₃ | 159 |
| II-7 | CH ₃ | CH ₃ | Br | H | 4'-O-(CH ₂) ₂ -O- | | CH ₃ | Воск, log P 2,81* |
| II-8 | CH ₃ | C ₂ H ₅ | CH ₃ | H | 4'-O-(CH ₂) ₂ -O- | | CH ₃ | Воск, log P 2,95* |
| II-9 | CH ₃ | C ₂ H ₅ | Br | H | 4'-O-(CH ₂) ₂ -O- | | CH ₃ | Воск, log P 3,19* |
| II-11 | CH ₃ | Cl | Cl | H | 4'-O-(CH ₂) ₃ -O- | | CH ₃ | 175 |
| II-12 | H | CH ₃ | H | CH ₃ | 4'-O-(CH ₂) ₃ -O- | | CH ₃ | 144 |
| II-13 | CH ₃ | CH ₃ | CH ₃ | CH ₃ | 4'-O-(CH ₂) ₃ -O- | | CH ₃ | 148 |
| II-14 | CH ₃ | CH ₃ | Cl | H | 4'-O-(CH ₂) ₃ -O- | | CH ₃ | 184 |
| II-15 | H | Cl | H | 4-Cl-Ph | 4'-O-(CH ₂) ₃ -O- | | CH ₃ | 177 |
| II-16 | H | CH ₃ | H | 4-Cl-Ph | 4'-O-(CH ₂) ₃ -O- | | CH ₃ | 181 |
| II-17 | H | CH ₃ | CH ₃ | CH ₃ | 4'-O-(CH ₂) ₃ -O- | | CH ₃ | log P 2,59* |
| II-18 | CH ₃ | CH ₃ | CH ₃ | H | 4'-O-(CH ₂) ₃ -O- | | CH ₃ | 143 |
| II-19 | CH ₃ | CH ₃ | Br | H | 4'-O-(CH ₂) ₃ -O- | | CH ₃ | 189 |
| II-20 | CH ₃ | CH ₃ | Cl | H | 4'-O-CH ₂ -C(CH ₃) ₂ -CH ₂ -O- | | CH ₃ | 178 |
| II-21 | CH ₃ | CH ₃ | Cl | H | 4'-O-CH ₂ -CH(CH ₃)-CH ₂ -O- | | CH ₃ | 170 |
| II-22 | CH ₃ | CH ₃ | Br | H | 4'-O-CH ₂ -C(CH ₃) ₂ -CH ₂ -O- | | CH ₃ | 181 |
| II-23 | CH ₃ | CH ₃ | Br | H | 4'-O-CH ₂ -CH(CH ₃)-CH ₂ -O- | | CH ₃ | 177 |
| II-24 | CH ₃ | OCH ₃ | CH ₃ | H | 4'-O-(CH ₂) ₃ -O- | | CH ₃ | log P 2,49* |
| II-25 | CH ₃ | CH ₃ | Br | H | 4'-O-CH(CH ₃)-CH(CH ₃)-O- | | CH ₃ | 189 |
| II-26 | CH ₃ | CH ₃ | Br | H | 4'-O-CH(CH ₃)-CH ₂ -O- | | CH ₃ | 161 |
| II-27 | H | CH ₃ | H | CH ₃ | 4'-O-CH(CH ₃)-CH(CH ₃)-O- | | CH ₃ | 166 |
| II-28 | CH ₃ | CH ₃ | Cl | H | 4'-O-CH(CH ₃)-CH(CH ₃)-O- | | CH ₃ | 183 |
| II-29 | CH ₃ | CH ₃ | Cl | H | 4'-O-CH(CH ₃)-CH ₂ -O- | | CH ₃ | 170 |
| II-30 | H | CH ₃ | H | CH ₃ | 4'-O-CH(CH ₃)-CH ₂ -O- | | CH ₃ | 141 |
| II-31 | H | CH ₃ | H | 5-(4-Cl-Ph) | 4'-O-(CH ₂) ₂ -O- | | CH ₃ | log P 3,47* |
| II-32 | C ₂ H ₅ | C ₂ H ₅ | CH ₃ | H | 4'-O-(CH ₂) ₂ -O- | | CH ₃ | log P 3,28* |
| II-33 | CH ₃ | OCH ₃ | CH ₃ | H | 4'-O-(CH ₂) ₂ -O- | | CH ₃ | 139 |
| II-34 | H | CH ₃ | Cl | CH ₃ | 4'-O-(CH ₂) ₂ -O- | | CH ₃ | 182 |
| II-35 | C ₂ H ₅ | OCH ₃ | Cl | H | 4'-O-(CH ₂) ₂ -O- | | CH ₃ | 153 |
| II-36 | C ₂ H ₅ | Br | CH ₃ | H | 4'-O-(CH ₂) ₂ -O- | | CH ₃ | log P 3,04* |

| Пример № | W | X | Y | Z | A | B | R ⁸ | T _{пл} °C |
|----------|-------------------------------|-------------------------------|-----------------|-----------------|---|-----------------|-----------------|--------------------|
| II-37 | H | CH ₃ | H | CH ₃ | 4'-O-CHCH ₃ -CH ₂ -CHCH ₃ -O- | CH ₃ | CH ₃ | 122 |
| II-38 | CH ₃ | CH ₃ | Cl | H | 4'-O-CHCH ₃ -CH ₂ -CHCH ₃ -O- | CH ₃ | CH ₃ | 208 |
| II-39 | H | CH ₃ | H | CH ₃ | 4'-O-CHCH ₃ -(CH ₂) ₂ -O- | CH ₃ | CH ₃ | 144 |
| II-40 | CH ₃ | CH ₃ | Cl | H | 4'-O-CHCH ₃ -(CH ₂) ₂ -O- | CH ₃ | CH ₃ | 174 |
| II-41 | CH ₃ | CH ₃ | Br | H | 4'-O-CHCH ₃ -(CH ₂) ₂ -O- | CH ₃ | CH ₃ | 175 |
| II-42 | CH ₃ | CH ₃ | Br | H | 4'-O-CHCH ₃ -CH ₂ -CHCH ₃ -O- | CH ₃ | CH ₃ | 202 |
| II-43 | CH ₃ | C ₂ H ₅ | Br | H | 4'-O-CHCH ₃ -CH ₂ -CHCH ₃ -O- | CH ₃ | CH ₃ | 200 |
| II-44 | H | CH ₃ | H | CH ₃ | 4'-O-CH ₂ -C(CH ₃) ₂ -CH ₂ -O- | CH ₃ | CH ₃ | 157 |
| II-45 | H | CH ₃ | H | CH ₃ | 4'-O-CH ₂ -CHCH ₃ -CH ₂ -O- | CH ₃ | CH ₃ | 154 |
| II-46 | CH ₃ | C ₂ H ₅ | Br | H | 4'-O-CHCH ₃ -(CH ₂) ₂ -O- | CH ₃ | CH ₃ | 158 |
| II-47 | CH ₃ | Cl | Cl | H | 4'-O-CH ₂ -C(CH ₃) ₂ -CH ₂ -O- | CH ₃ | CH ₃ | 197 |
| II-48 | CH ₃ | Cl | Cl | H | 4'-O-CH ₂ -CHCH ₃ -CH ₂ -O- | CH ₃ | CH ₃ | 174 |
| II-49 | H | Cl | H | 4-Cl-Ph | 4'-O-CH ₂ -C(CH ₃) ₂ -CH ₂ -O- | CH ₃ | CH ₃ | 205 |
| II-50 | H | Cl | H | 4-Cl-Ph | 4'-O-CH ₂ -CHCH ₃ -CH ₂ -O- | CH ₃ | CH ₃ | 166 |
| II-51 | H | CH ₃ | H | 4-Cl-Ph | 4'-O-CH ₂ -C(CH ₃) ₂ -CH ₂ -O- | CH ₃ | CH ₃ | 184 |
| II-52 | H | CH ₃ | H | 4-Cl-Ph | 4'-O-CH ₂ -CHCH ₃ -CH ₂ -O- | CH ₃ | CH ₃ | 163 |
| II-53 | H | CH ₃ | H | 4-Cl-Ph | 4'-O-CHCH ₃ -CH ₂ -CHCH ₃ -O- | CH ₃ | CH ₃ | 149 |
| II-54 | CH ₃ | C ₂ H ₅ | Br | H | 4'-O-CH ₂ -C(CH ₃) ₂ -CH ₂ -O- | CH ₃ | CH ₃ | 241 |
| II-55 | CH ₃ | C ₂ H ₅ | Br | H | 4'-O-CH ₂ -CHCH ₃ -CH ₂ -O- | CH ₃ | CH ₃ | 147 |
| II-56 | CH ₃ | C ₂ H ₅ | Br | H | 4'-O-CHCH ₃ -CH ₂ -O- | CH ₃ | CH ₃ | 157 |
| II-57 | CH ₃ | C ₂ H ₅ | Br | H | 4'-O-CHCH ₃ -CHCH ₃ -O- | CH ₃ | CH ₃ | 167 |
| II-58 | C ₂ H ₅ | Cl | Cl | H | 4'-O-(CH ₂) ₂ -O- | CH ₃ | CH ₃ | 281 |
| II-59 | H | Cl | H | 4-Cl-Ph | 4'-O-(CH ₂) ₂ -O- | CH ₃ | CH ₃ | |
| II-60 | CH ₃ | CH ₃ | H | 4-Cl-Ph | 4'-O-CHCH ₃ -CH ₂ -O- | CH ₃ | CH ₃ | 173 |
| II-61 | H | CH ₃ | Cl | CH ₃ | 4'-O-CHCH ₃ -CH ₂ -O- | CH ₃ | CH ₃ | 165 |
| II-62 | H | CH ₃ | H | 4-Cl-Ph | 4'-O-CHCH ₃ -CH ₂ -O- | CH ₃ | CH ₃ | 174 |
| II-63 | H | CH ₃ | H | 4-Cl-Ph | 4'-O-CHCH ₃ -CHCH ₃ -O- | CH ₃ | CH ₃ | 151 |
| II-64 | H | Cl | H | 4-Cl-Ph | 4'-O-CHCH ₃ -CH ₂ -O- | CH ₃ | CH ₃ | 181 |
| II-65 | H | Cl | H | 4-Cl-Ph | 4'-O-CHCH ₃ -CHCH ₃ -O- | CH ₃ | CH ₃ | 182 |
| II-66 | H | CH ₃ | H | CH ₃ | 3'-O-(CH ₂) ₂ -O- | CH ₃ | CH ₃ | 111 |
| II-67 | C ₂ H ₅ | Br | CH ₃ | H | 3'-O-(CH ₂) ₂ -O- | CH ₃ | CH ₃ | 174 |
| II-68 | CH ₃ | CH ₃ | Cl | H | 3'-O-(CH ₂) ₂ -O- | CH ₃ | CH ₃ | 154 |
| II-69 | CH ₃ | CH ₃ | Cl | H | $\begin{array}{c} 3'-O-CH-CH_2-O- \\ \\ CH_2-OCH_3 \end{array}$ | CH ₃ | Масло | |
| II-70 | CH ₃ | CH ₃ | CH ₃ | H | $\begin{array}{c} 3'-O-CH-CH_2-O- \\ \\ CH_2-OCH_3 \end{array}$ | CH ₃ | Масло | |
| II-71 | H | CH ₃ | H | CH ₃ | $\begin{array}{c} 3'-O-CH-CH_2-O- \\ \\ CH_2-OCH_3 \end{array}$ | CH ₃ | Масло | |
| II-72 | C ₂ H ₅ | Br | CH ₃ | H | $\begin{array}{c} 3'-O-CH-CH_2-O- \\ \\ CH_2-OCH_3 \end{array}$ | CH ₃ | Масло | |
| II-73 | C ₂ H ₅ | Br | CH ₃ | H | 4'-O-CHCH ₃ -CH ₂ -O- | CH ₃ | CH ₃ | 143 |
| II-74 | H | Cl | H | 4-Cl-Ph | 4'-O-CH ₂ -CHCH ₃ -CH ₂ -O- | CH ₃ | CH ₃ | 169 |
| II-75 | CH ₃ | C ₂ H ₅ | Br | H | 4'-O-(CH ₂) ₃ -O- | CH ₃ | CH ₃ | 165 |
| II-76 | H | Cl | H | 4-Cl-Ph | 4'-O-CHCH ₃ -(CH ₂) ₂ -O- | CH ₃ | CH ₃ | 161 |
| II-77 | H | Cl | H | 4-Cl-Ph | 4'-O-CHCH ₃ -CH ₂ -CHCH ₃ -O- | CH ₃ | CH ₃ | 74 |
| II-78 | C ₂ H ₅ | Br | CH ₃ | H | 4'-O-CHCH ₃ -CH ₂ -CHCH ₃ -O- | CH ₃ | CH ₃ | 84 |

Ph = фенил.

*Определение значений $\log P$, приведенных в предшествующих таблицах и примерах получения, проводят согласно инструкции EEC-Directive 79/831 Annex V.A8 с помощью ЖХВД (жидкостная хроматография высокого давления) на колонке с обращением фаз (С 18). Температура: 43°C.

Определение значений проводят в кислой области при pH 2,3 с 0,1% водной фосфорной кислотой и ацетонитрилом в качестве элюентов; линейный градиент от 10 до 95% ацетонитрила.

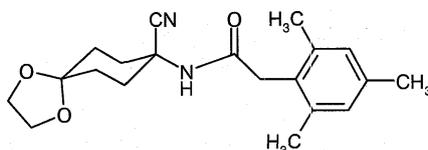
Определение значений с помощью ЖХ-МС (жидкостная хроматография-масс-спектрометрия) проводят в кислой области при pH 2,7 с 0,1% водной муравьиной кислотой и ацетонитрилом (содержит 0,1% муравьиной кислоты) в качестве элюентов; линейный градиент от 10 до 95% ацетонитрила.

Определение значений с помощью ЖХ-МС проводят в нейтральной области при pH 7,8 с 0,001 мольным водным раствором гидрокарбоната аммония и ацетонитрилом в качестве элюентов; линейный градиент от 10 до 95% ацетонитрила.

Градуировку проводят с помощью неразветвленных алкан-2-онов (с 3-16 атомами углерода), для которых известны значения $\log P$ (определение значений $\log P$ осуществляют, опираясь на времена удерживания, с линейной интерполяцией между двумя последовательными алканами).

Значения лямбда-макс определяют по УФ-спектрам в интервале 200-400 нм по максимумам хроматографического сигнала.

Пример (XXI-1)

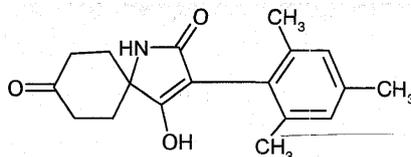


К 65 г нитрила 1,4-диоксапило[4,5]декан-8-амино-8-карбоновой кислоты в 800 мл безводного тетрагидрофурана (ТГФ) добавляют 49,4 мл триэтиламина. При температуре 0-10°C добавляют по каплям 70,2 г хлорида мезитилеуксусной кислоты в 80 мл безводного ТГФ. Перемешивают при комнатной температуре.

После завершения реакции (контроль тонкослойной хроматографией) реакцию смесь примешивают к 1,2 л ледяной воды, добавляют 200 мл 1н. HCl и отсасывают осадок. Осадок растворяют в дихлорметане и отделяют водную фазу. Органическую фазу сушат, растворитель отгоняют и остаток перекристаллизуют из 320 мл толуола/640 мл н-гексана.

Выход: 107,9 г (88% от теор.), $T_{пл} > 220^\circ\text{C}$.

Пример XIV-1-1

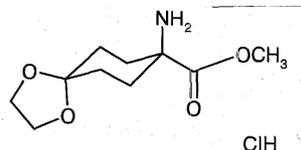


20,6 г соединения согласно примеру I-1-с-2 помещают в 24 г полуконцентрированного натронного щёлока и примерно 100 мл этанола и перемешивают при комнатной температуре в течение 1 ч в атмосфере защитного газа и в заключение выпаривают этанол. После этого раствор подкисляют соляной кислотой, все растворяют в метиленхлориде, отделяют органическую фазу и упаривают. Остаток перемешивают в течение 2 ч при температуре 60°C в 4н. соляной кислоте.

Осадок отделяют и примешивают к этиловому эфиру уксусной кислоты.

Выход: 6,67 г; $T_{пл}$: 293,9°C

Пример XVI-1

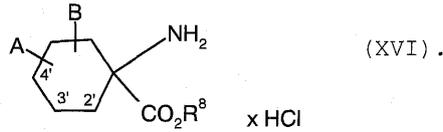


46 г 1,4-диокса[4,5]декан-8-амино-8-карбоновой кислоты растворяют в 350 мл безводного метанола и при температуре 0-5°C добавляют по каплям 32,6 г (0,275 моль) тионилхлорида. Перемешивают в течение 30 мин при температуре 0°C (суспензия) и затем в течение ночи при температуре 40°C.

Смесь охлаждают, отсасывают хлорид калия и отгоняют растворитель. Остаток протирают с метилтретбутиловым эфиром и отсасывают.

Выход: 48,63 г (83% от теор.), $T_{пл}$: разлагается.

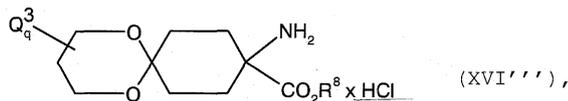
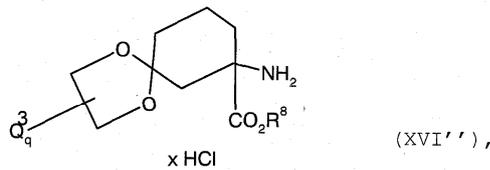
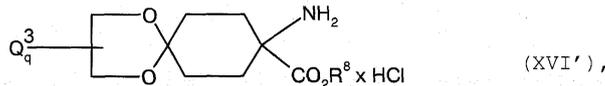
По аналогии с примером XVI-1 получают следующие новые соединения формулы (XVI)



| Пример № | A | B | R ⁸ | T _{пл} °C |
|----------|---|---|-----------------|---|
| XVI-2 | | 4'-O-CHCH ₃ -CH ₂ -O- | CH ₃ | * 1,18-1,19 (2d, 3H, CHCH ₃) 3,76 (2s, 3H, OCH ₃) |
| XVI-3 | | 4'-O-CHCH ₃ -CHCH ₃ -O- | CH ₃ | * 3,76 (s, 3H, OCH ₃) 4,18-4,23 (m, 2H, 2xCH-O) |
| XVI | | 4'-O-(CH ₂) ₃ -O- | CH ₃ | Смола |
| XVI-5 | | 4'-O-CHCH ₃ -(CH ₂) ₂ -O- | CH ₃ | * 1,07-1,08 (d, 3H, CHCH ₃) 3,77 (s, 3H, OCH ₃) |
| XVI-6 | | -O-CH ₂ -CHCH ₃ -CH ₂ -O- | CH ₃ | * 0,77 (d, 3H, CHCH ₃) 8,71 (3H, br, NH ₃ ⁺) |
| XVI-7 | | 4'-O-CHCH ₃ -CH ₂ -CHCH ₃ -O- | CH ₃ | * 1,07-1,15 (m, 6H, 2xCHCH ₃) 3,93-4,0 (m, 2H, O-CH) |
| XVI-8 | | 4'-O-CH ₂ -C(CH ₃) ₂ -CH ₂ -O- | CH ₃ | * 0,9 (s, 6H, C(CH ₃) ₂) 3,76 (s, 3H, OCH ₃) |
| XVI-9 | | 3'-O-(CH) ₂ -O- | CH ₃ | * 3,74, 3,75 (2s, 3H, CO ₂ CH ₃) 3,79-3,99 (m, 4H, -O-(CH ₂) ₂ -O-) |
| XVI-10 | | 3'-O-CH-CH ₂ -O- CH ₂ -OCH ₃ | CH ₃ | * 3,28 (2s, 3H, OCH ₃) 3,73-3,75 (4s, 3H, CO ₂ CH ₃) |

*¹Н-ЯМР (400 МГц, d₆-ДМСО): химические сдвиги δ в млн. долях.

Эфиры замещенных 1,4-диокса[4,5]декан-8-амино-8-карбоновых кислот и их соли формулы (XVI'), эфиры незамещенных или замещенных 1,4-диокса[4,5]декан-7-амино-7-карбоновых кислот и их соли формулы (XVI'') и эфиры незамещенных или замещенных 1,5-диокса[5,5]ундекан-9-амино-9-карбоновых кислот и их соли формулы (XVI'''), которые содержат в качестве заместителей упомянутые выше А и В с приведенными выше значениями, являются новыми соединениями и предметом данного изобретения:

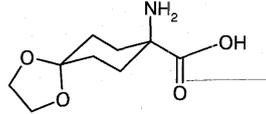


где Q³ означает (C₁-C₄)алкил, (C₁-C₃)галоидалкил, (C₁-C₄)алкоксигруппу или (C₁-C₄)алкокси(C₁-C₂)алкил;

q означает 1, 2 или 3 и в случае соединений формул (XVI'') и (XVI''') может также означать 0;

R⁸ имеет значения, приведенные выше.

Пример XIX-1

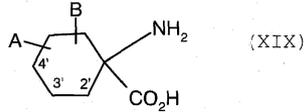


112 г соединения согласно примеру XXIII-8 суспендируют в 710 мл 30%-ного КОН и в условиях рефлюкса перемешивают в атмосфере азота.

При температуре 0-20°C подкисляют концентрированной HCl до значения pH 5,2-5,3, отсасывают, фильтрат отгоняют до около 0,5 л азеотропа с метанолом, хлорид калия отсасывают, отгоняют растворитель, с помощью метанола азеотроп обезвоживают.

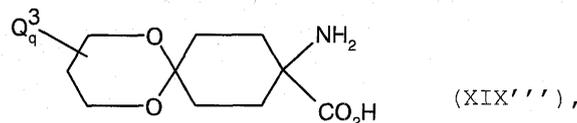
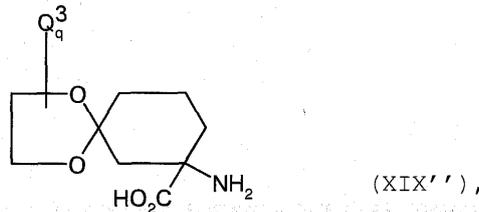
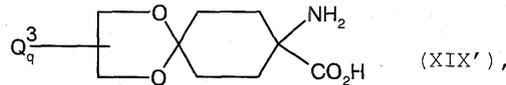
Выход: 46 г (46% от теор.).

По аналогии с примером XIX-1 получают следующие новые соединения формулы (XIX):



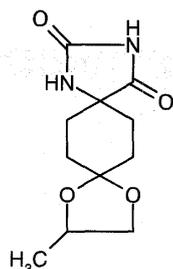
| Пример № | A | B |
|----------|---|---|
| XIX-2 | 4'-O-CHCH ₃ -CH ₂ -O- | |
| XIX-3 | 4'-O-CHCH ₃ -CHCH ₃ -O- | |
| XIX-4 | 4'-O-(CH ₂) ₃ -O- | |
| XIX-5 | 4'-O-CHCH ₃ -(CH ₂) ₂ -O- | |
| XIX-6 | 4'-O-CH ₂ -CHCH ₃ -CH ₂ -O- | |
| XIX-7 | 4'-O-CHCH ₃ -CH ₂ -CHCH ₃ -O- | |
| XIX-8 | 4'-O-CH ₂ -C(CH ₃) ₂ -CH ₂ -O- | |
| XIX-9 | 3'-O-(CH ₂) ₂ -O- | |
| XIX-10 | 3'-O-CH-CH ₂ -O- CH ₂ -OCH ₃ | |

Аминокислоты без дальнейшей очистки непосредственно подвергают этерификации с получением соединений формулы (XVI). После этого их характеризуют. Замещенные 1,4-диокса[4,5]декан-8-амино-8-карбоновые кислоты формулы (XIX'), при необходимости замещенные 1,4-диокса[4,5]декан-7-амино-7-карбоновые кислоты формулы (XIX'') и при необходимости замещенные 1,5-диокса[5,5]ундекан-9-аминокарбоновые кислоты формулы (XIX'''), у которых заместители А, В имеют значения, приведенные выше, являются новыми соединениями и предметом данного изобретения:



где Q³ имеет значения, приведенные выше; и q означает 1, 2 или 3, а в случае соединений формул (XIX'') и (XIX''') может означать 0.

Пример XXIII-1



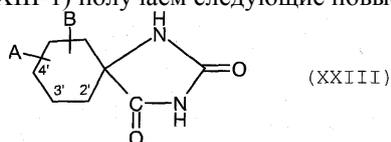
16,4 г (335 ммоль) цианида натрия и 128,7 г (1339 ммоль) карбоната аммония растворяют в 600 мл воды и при комнатной температуре медленно добавляют по каплям 57 г (335 ммоль) 1,4-диокса[4,5]декан-2-метил-8-она (XXIV-1), растворенного в 30 мл этанола.

Смесь перемешивают от 12 до 15 ч при температуре от 55 до 60°C.

Охлаждают до 0°C, твердое вещество отсасывают, добавляя воду, образуют шлам, отсасывают, промывают гексаном, сушат.

Выход: 73,6 г (92% от теор.). 2 изомера 1:1.

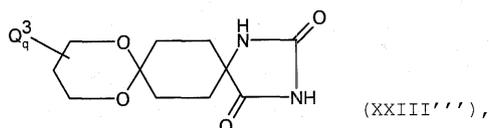
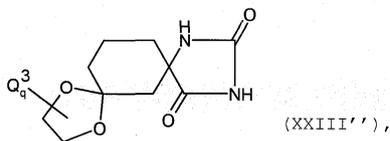
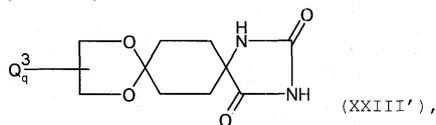
По аналогии с примером (XXIII-1) получаем следующие новые соединения формулы (XXIII):



| Пример № | A | B | ¹ H-ЯМР (400 МГц) | Химические сдвиги δ в млн. долях |
|----------|--|---|--|---|
| XXIII-1 | 4'-O-CHCH ₃ -CH ₂ -O- | | D ₆ -DMCO | 10,53 (s); 8,35 (s); 4,15 (m, 1H); 4,02 (m, 1H); 3,37 (m, 1H); 1,93-1,50 (6m, 8H); 1,18 (dd, J=6,2 Гц, 6,5 Гц, 3H) |
| XXIII-2 | 4'-O-CHCH ₃ -CHCH ₃ -O- | | D ₆ -DMCO 2 диастерео-мера 2:1 | 10,52 (s); 8,35 (s); 4,18 (m) + 3,59 (m): Σ2H; 1,90-1,50 (bm, Σ8H); 1,18 (dd, J=6,3 Гц, 5,8 Гц) + 1,06 (dd, J=6,1 Гц, 7,7 Гц): Σ6H |
| XXIII-3 | 4'-O-(CH ₂) ₃ -O- | | D ₆ -DMCO | 10,50 (s); 8,35 (s); 3,81 (m, 4H); 2,12 (m, 2H); 1,78 (m, 2H); 1,60 (m, 4H); 1,48 (m, 2H) |
| XXIII-4 | 4'-O-CHCH ₃ -(CH ₂) ₂ -O- | | D ₆ -DMCO 2 диастерео-мера | 10,50 (s); 8,31/8,30 (s.); 4,09-3,67 (6m, 3H); 2,54 (m, 1H); 1,88 (m, 1H); 1,76-1,39 (6m, 8H); 1,08 (dd, J=6Гц) |
| XXIII-5 | 4'-O-CH ₂ -CHCH ₃ -CH ₂ -O- | | D ₆ -DMCO | 10,51 (s); 8,34 (s); 3,73 (m, 2H); 3,51 (dd, J=9,7 Гц, 11,5 Гц, 1H); 3,43 (dd, J=9,7 Гц, 11,5 Гц, 1H); 2,41 (m, 1H); 1,88-1,41 (bm, 8H); 0,76 (d, J=6,8 Гц, 3H) |

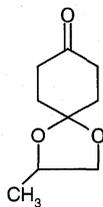
| Пример № | А | В | ¹ H-ЯМР (400 МГц) | Химические сдвиги δ в млн. долях |
|----------|---|---|--|--|
| XXIII-6 | | 4'-O-CHCH ₃ -CH ₂ - CHCH ₃ -O- | D ₆ -DMSO 2 диастерео- мера 2:1 | 10,53 (s); 8,28 (s); 4,02 + 3,92 (в каждом случае m, Σ2H); 1,95 (6m) + 1,75-1,40 (bm): Σ10H; 1,12 (dd, J=6,3 Гц, 10,8 Гц) + 1,08 (dd, J=6,1 Гц, 11,3 Гц): Σ6H |
| XXIII-7 | | 4'-O-CH ₂ -C(CH ₃) ₂ - CH ₂ -O- | D ₆ -DMCO | 10,50 (s); 8,34 (s); 3,45 (s, 2H); 3,43 (s, 2H); 2,11 (m, 2H); 1,78 (m, 2H); 1,62 (m, 2H); 1,50 (m, 2H); 0,89 (s, 6H) |
| XXIII-8 | | 3'-O-(CH ₂) ₂ -O- | D ₆ -DMCO | 10,6 (bm, 1H), 7,32 (bm, 1H), 3,9 (m, 4H), 1,71 (m, 4H), 1,61 (m, 1H), 1,52 (m, 3H) |
| XXIII-9 | | 3'-O-CH-CH ₂ -O- CH ₂ -OCH ₃ | D ₆ -DMCO смесь изомеров | 10,5 (bm), 7,16 (bm), 6,98 (bm), 6,87 (bm), 6,60 (bm), 4,22 (m), 4,01 (m), 3,64 (m), 3,34 (m), 3,27 (m), 3,17 (s), 2,40 (m), 2,22 (m), 2,01 (m), 1,90-1,60 (bm) |

Соединения формул (XXIII')-(XXIII''')



где Q³ имеет значения, приведенные выше; и q означает 1, 2 или 3, а в случае соединений формул (XXIII'') и (XXIII''') может также означать 0, являясь новыми соединениями и являясь предметом данного изобретения.

Пример XXIV-1



53,7 г (423 ммоль) дихлорида оксалоовой кислоты растворяют в 1000 мл дихлорметана. При температуре -70°C добавляют по каплям раствор 60 мл диметилсульфоксида в 100 мл дихлорметана и перемешивают в течение 20 мин. 66 г (385 ммоль) 1,4-диокса[4,5]декан-2-метил-8-ола растворяют в 300 мл дихлорметана и при той же температуре добавляют по каплям к реакционной смеси в течение 1 ч. Перемешивают в течение 1 ч, после этого в течение 30 мин повышают температуру до -40°C. Перемешивают в течение 30 мин при этой температуре, после этого добавляют триэтиламин (140 мл), повышают температуру до комнатной (1 ч) и перемешивают в течение ночи.

Добавляют 500 мл воды и перемешивают в течение 15 мин.

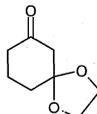
Отделяют органическую фазу, водный раствор экстрагируют дихлорметаном 3 раза по 200 мл. Объединенные органические фазы сушат сульфатом натрия и отгоняют растворитель.

Хроматографическую очистку проводят на силикагеле, гексан/эфир уксусной кислоты 2:1.

Выход: 58 г (88% от теор.)

¹H-ЯМР (400 МГц, d₆-DMCO) δ: 4,24 (m, 1H), 3,46 (t, 1H), 4,10 (dd, 1H), 2,36 (m, 4H), 1,94 (m, 4H), 1,23 (d, 3H) млн. долей.

Пример XXIV-7

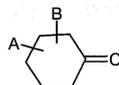


50 г циклогексан-1,3-диона, 27,67 г 1,2-этандиола, 500 мл толуола и 0,849 г моногидрата 4-толуолсульфоновой кислоты помещают в реакционный сосуд и в присутствии средства, отбирающего воду, кипятят в течение 3-4 ч в условиях рефлюкса. Смесь промывают 100 мл насыщенного раствора NaHCO₃ и 2 раза насыщенным раствором NaCl, сушат и отгоняют растворитель. В заключение проводят фракционную дистиляцию в высоком вакууме (дистиляция продукта при 85°C/1 мбар соответственно 62-75°C/0,15 мм Hg).

Выход: 21,9 г (27% от теор.).

¹H-ЯМР (400 МГц, CD₃CN) δ: 3,9 (m, 4H), 2,52 (s, 2H), 2,27 (m, 2H), 1,87 (m, 2H), 1,79 (m, 2H) млн. долей.

По аналогии с примерами (XXIV-1) и (XXIV-7) получают следующие новые соединения формулы (XXIV):

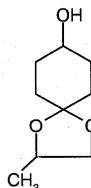


(XXIV).

| Пример № | A | B | ¹ H-ЯМР (400 МГц) | Химические сдвиги δ в млн. долях |
|----------|---|---|--|---|
| XXIV-1 | 4'-O-CHCH ₃ -CH ₂ -O- | | d ₆ -DMCO | 4,24 (m, 1H); 3,46 (t, 1H, J=7,7 Гц); 4,10 (dd, 1H, J=5,8 Гц, 7,9 Гц); 2,36 (m, 4H); 1,94 (m, 4H); 1,23 (d, J=6Гц/3H) |
| XXIV-2 | 4'-O-CHCH ₃ -CHCH ₃ -O- | | d ₆ -DMCO 2 изомера 2:1 | 4,28/3,68 (в каждом случае m, Σ2H); 2,35/1,94 (в каждом случае m, Σ8H); 1,22 (d, J=5,7 Гц) + 1,10 (d, J=6,1Гц); Σ6H |
| XXIV-3 | 4'-O-(CH ₂) ₃ -O- | | d ₆ -DMCO | 3,88 (dd, J=5,6Гц, 4H); 2,25 (m, 4H); 2,08 (m, 4H); 1,64 (m, 2H) |
| XXIV-4 | 4'-O-CHCH ₃ -(CH ₂) ₂ -O- | | d ₆ -DMCO | 4,03 (m, 1H); 3,93 (m, 1H); 3,80 (m, 1H); 2,30 (m, 2H); 2,22 (m, 4H); 1,87 (m, 2H); 1,51 (m, 2H); 1,10 (d, 3H, J=6,1 Гц) |
| XXIV-5 | 4'-O-CH ₂ -CHCH ₃ -CH ₂ -O- | | d ₆ -DMCO 1 изомер | 3,81 (dd, J=4,7 Гц, 12,0 Гц, 2H); 3,52 (dd, 2H, J=9,7 Гц); 2,28 (m, 2H); 2,21 (m, 4H); 1,95 (m, 2H); 1,91 (m, 1H); 0,80 (d, J=6,8 Гц, 1H) |
| XXIV-6 | 4'-O-CHCH ₃ -CH ₂ -CHCH ₃ -O- | | d ₆ -DMCO 2 изомера 45:55 | 4,02 (m, 2H); 2,31/2,21/1,97/1,87/1,61 (в каждом случае m, Σ10H); 1,17 (d, 3H, J=6,3 Гц); 1,12 (d, 3H, J=6,1 Гц) |
| XXIV-8 | 3'-O-CH-CH ₂ -O- CH ₂ -OCH ₃ | | CD ₃ CN смесь изомеров | 4,23 (m), 4,01 (m), 3,66 (m), 3,38 (m), 3,31 (s), 2,54 (s), 2,26 (m), 1,87 (m), 1,78 (m), 1,56 (m) |

Кетоны формулы (XXIV) отчасти имеются в продаже, отчасти известны (JACS 108, 2691-2699; 1986; JACS 109, 1363-1370, 1987) и отчасти являются новыми соединениями.

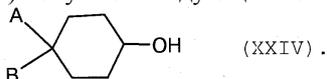
Пример XXV-1



114 г 4-гидроксициклогексанона, 80 г 1,2 пропандиола (77 мл) и 2 г дигидрата 4-толуолсульфо-кислоты вместе подают в 500 мл толуола. Кипятят в присутствии средства, забирающего воду, до тех пор, пока не прекратится отделение воды. Для переработки добавляют 1 мл триэтиламина, промывают 200 мл воды, сушат и отгоняют растворитель из реакционного раствора. Остаток (104 г) дестилируют в вакууме.

Выход: 76,3 г (44% от теор.).

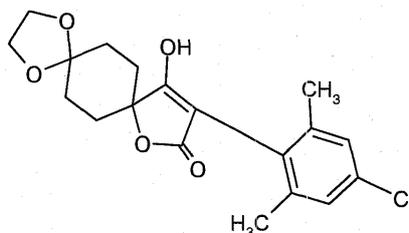
По аналогии с примером (XXIV-1) получают следующие новые соединения формулы (XXIV):



| Пример № | A | B | 1H-ЯМР (400 МГц, d ₆ -ДМСО) химический сдвиг δ в млн. долях |
|----------|--|---|--|
| XXV-1 | -O-CHCH ₃ -CH ₂ -O- | | 4,38 (dd, 1 H J=4,2 Гц, 5,3 Гц); 4,12 (m, 1H); 3,97 (m, 1H); 3,54 (6s, 1H); 3,33 (m, 1H); 1,67 (m, 4H); 1,44 (m, 4H); 1.16 (dd, J=6.1Гц, 3H); |
| XXV-2 | -O-CHCH ₃ -CHCH ₃ -O- | | 4,35 (m); 4,16 (m); 3,54 (m); 1,67 (m); 1,44 (m); 1,15 (dd, J= 5,7 Гц); 1,03 (dd, J=6,1 Гц) |
| XXV-3 | -O-(CH ₂) ₃ -O- | | 4,35 (OH); 3,77 (m, 4H); 3,52 (m, 1H); 1,96 (m, 2H); 1,57 (m, 4H); 1,50-1,28 (m, 4H) |
| XXV-4 | -O-CHCH ₃ -(CH ₂) ₂ -O- | | 4,34 (m, 1H); 3,95 (m, 1H); 3,87 (m, 1H); 3,67 (m, 1H); 3,53 (m, 1H); 2,25 (m, 1H); 2,66-2,20 (m, 10H); 1,06 (dd, J=6,1 Гц, 3H) |
| XXV-5 | -O-CH ₂ -CHCH ₃ -CH ₂ -O- | | 4,41 (bs, OH); 3,69 (m) + 3,53 (m) + 3,43 (m) + 3,35 (m) + 3,25 (m): Σ5 H; 2,12 (m, 1H); 1,74 (m, 2H); 1,62-1,23 (m, 5H); 0,80 (d, J=6,8 Гц) + 0,75 (d, J = 6,8 Гц) : Σ3 H |
| XXV-6 | -O-CHCH ₃ -CH ₂ -CHCH ₃ - O- | | 4,34 (s, OH); 3,94 (m); 3,53 (m) 2,20 (m); 1,78 (m); 2,65-2,20 (bm); 1,10 (dd, J= 6,3 Гц); 1,05 (dd, J = 6 Гц) |

Соединения формулы (XXV) отчасти могут находиться в продаже, отчасти известны (J. Med. Chem. 24, 341-346, 1981) и отчасти являются новыми.

Пример I-2-a-1

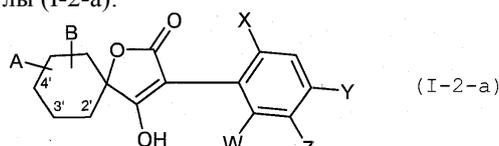


0,32 г (1,00 ммоль) соединения согласно примеру (XIV-2-1), 0,62 г (10 ммоль) этиленгликоля и 50 мг 4-толуолсульфо-кислоты нагревают в 15 мл толуола в условиях рефлюкса в течение ночи.

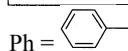
Для переработки смесь охлаждают, твердое вещество отсасывают и сушат.

Выход: 0,35 г (96% от теор.), T_{пл}: 267°C.

По аналогии с примером (I-2-a-1) и согласно общим прописям по получению соединений получают следующие соединения формулы (I-2-a):

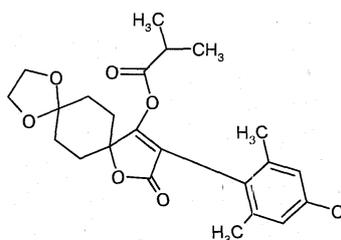


| Пример № | W | X | Y | Z | A | B | T _{пл} °C |
|----------|-----------------|-----------------|-----------------|---------|---|---|--------------------|
| I-2-a-2 | CH ₃ | CH ₃ | CH ₃ | H | | 4'-O-(CH ₂) ₂ -O- | >250 |
| I-2-a-3 | CH ₃ | CH ₃ | Cl | H | | 4'-O-CHCH ₃ -CH ₂ -O- | 198 |
| I-2-a-4 | CH ₃ | CH ₃ | Cl | H | | 4'-O-CHCH ₂ Cl-CH ₂ -O- | 248 |
| I-2-a-5 | CH ₃ | CH ₃ | Br | H | | 4'-O-(CH ₂) ₂ -O- | 266 |
| I-2-a-6 | CH ₃ | CH ₃ | Cl | H | | 4'-O-(CH ₂) ₃ -O- | 227 |
| I-2-a-7 | CH ₃ | CH ₃ | Cl | H | | 4'-O-CH ₂ -C(CH ₃) ₂ -CH ₂ -O- | 270 |
| I-2-a-8 | H | CH ₃ | H | 4-Cl-Ph | | 4'-O-(CH ₂) ₂ -O- | * |



*¹H-ЯМР (400 МГц, d₆-DMCO) δ: 2,19 (s, 3H, Ar-CH₃), 3,92 (s, 4H, (O-CH₂)₂), 7,3 (m, 1H, Ar-H), 7,4 (m, 1H, Ar-H), 7,5 (m, 3H, Ar-H), 7,65 (m, 2H-Ar-H) млн. долей.

Пример I-2-b-1

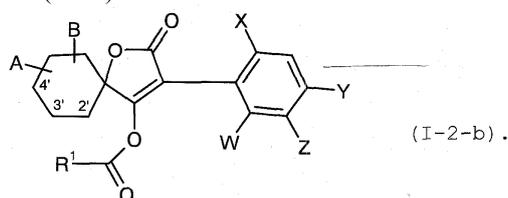


0,22 г (0,60 ммоль) соединения согласно примеру (I-2-a-1) растворяют в 10 мл дихлорметана, добавляют 0,067 г (0,66 ммоль) триэтиламина, в условиях охлаждения льдом добавляют по каплям 0,071 г (0,66 ммоль) хлорида изомасляной кислоты и перемешивают в течение ночи при комнатной температуре.

Переработку проводят, экстрагируя 10%-ным раствором лимонной кислоты и насыщенным раствором раствором гидрокарбоната натрия, органическую фазу сушат сульфатом натрия и отгоняют растворитель.

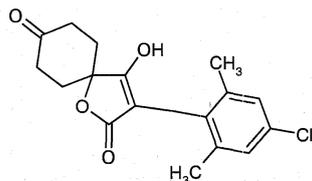
Выход: 0,22 г (77% от теор.), T_{пл}: 142°C.

По аналогии с примером (I-2-b-1) и согласно общим прописям по получению соединений получают следующие соединения формулы (I-2-b):



| Пример № | W | X | Y | Z | A | B | R ¹ | T _{пл} °C |
|----------|-----------------|-----------------|-----------------|---|---|---|--|--------------------|
| I-2-b-2 | CH ₃ | CH ₃ | CH ₃ | H | | 4'-O-(CH ₂) ₂ -O- | трет- C ₄ H ₉ | 165- 169 |
| I-2-b-3 | CH ₃ | CH ₃ | Cl | H | | 4'-O-CHCH ₂ Cl- CH ₂ -O- | изо- C ₃ H ₇ | 240- 243 |
| I-2-b-4 | CH ₃ | CH ₃ | Cl | H | | 4'-O-CHCH ₃ -CH ₂ - O- | изо- C ₃ H ₇ | 232 |

Пример XIV-2-1



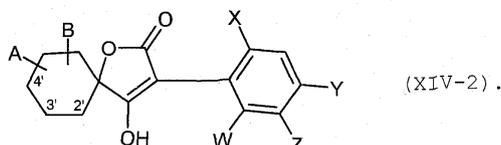
4,59 г (40,89 ммоль) трет-бутилата калия растворяют в 35 мл диметилформамида (ДМФ), добавляют по каплям в условиях охлаждения льдом раствор 10,00 г (27,26 ммоль) соединения согласно примеру (III-A-1) в 15 мл диметилформамида при температуре 0-10°C и в течение ночи перемешивают при комнатной температуре.

Для переработки отгоняют в значительной мере ДМФ на ротационном испарителе и распределяют остаток между водой и эфиром уксусной кислоты. Водную фазу подкисляют соляной кислотой, выпадающий в осадок продукт отсасывают, промывают водой и сушат.

Дальнейшую очистку проводят с помощью препаративной хроматографии ЖХВД (силикагель RP-18, элюент ацетонитрил/вода).

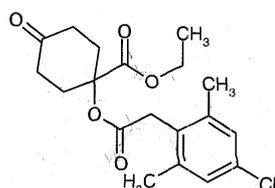
Выход: 2,20 г (25% от теор.), $T_{пл}$: 210°C.

По аналогии с примером (XIV-2-1) и согласно общим прописям по получению соединений формулы (XIV-2), приведенным в WO 99/16748, получены следующие соединения формулы (XIV-2):



| Пример № | W | X | Y | Z | A | B | $T_{пл}$ °C |
|----------|-----------------|-----------------|-----------------|---|---|---|-------------|
| XIV-2-2 | CH ₃ | CH ₃ | CH ₃ | H | | | 187-190 |
| XIV-2-3 | CH ₃ | CH ₃ | Br | H | | | 222 |

Пример III-A-1

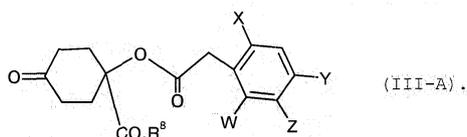


5,00 г (26,85 ммоль) этилового эфира 4-оксо-1-гидроксициклогексанкарбоновой кислоты и 3,26 г (32,22 ммоль) триэтиламина растворяют в 3,5 мл дихлорметана, добавляют по каплям раствор 6,41 г (29,53 ммоль) хлорида 2,6-диметил-4-хлор-фенилуксусной кислоты в 15 мл дихлорметана в условиях охлаждения на ледяной бане при температуре 0-10°C и перемешивают в течение ночи при комнатной температуре.

Для переработки экстрагируют 10%-ным раствором лимонной кислоты и насыщенным раствором гидрокарбоната натрия, органическую фазу сушат сульфатом натрия и отгоняют растворитель.

Выход: 10,00 г масла (67% от теор.).

По аналогии с примером (III-A-1) и согласно общим прописям получают следующие соединения формулы (III-A):



| Пример № | W | X | Y | Z | R ⁸ | $T_{пл}$ °C |
|----------|-----------------|-----------------|-----------------|---|-------------------------------|-------------|
| III-A-2 | CH ₃ | CH ₃ | CH ₃ | H | C ₂ H ₅ | Масло |
| III-A-3 | CH ₃ | CH ₃ | Br | H | C ₂ H ₅ | Масло |

Масло без дальнейшей переработки применяют в синтезе соединений формулы (XIV-2).

Пример А.

Тест на *Muzus persicae* (7:1).

Растворитель: 7 вес.ч. диметилформамида.

Эмульгатор: 1 вес.ч. алкиларилполигликолевого эфира.

Для получения целесообразного готового к применению препарата биологически активного вещества смешивают 1 вес.ч. биологически активного вещества с приведенными количествами растворителя и эмульгатора и разбавляют концентрат водой до необходимой концентрации.

Листья капусты (*Brassica oleracea*), которые сильно поражены зелеными вшами персиковых листьев (*Muzus persicae*), обрабатывают окунанием в готовый к применению препарат биологически активного вещества необходимой концентрации.

По истечении заданного промежутка времени определяют умерщвление в процентах (%). При этом 100% означают, что все листовые вши умерщвлены, а 0% означает, что ни одна листовая вошь не была умерщвлена.

В этом тесте показывают, например, следующие соединения, приведенные в примерах получения, которые проявляют эффективность, равную или большую 80% при концентрации 1000 млн. долей: примеры получения I-1-a-2, I-1-a-1, I-1-a-3, I-1-a-4, I-1-b-1, I-1-c-3, I-1-c-4, I-1-c-1.

Пример В.

Тест на *Aphis gossypii* (7:1).

Растворитель: 7 вес.ч. диметилформаида.

Эмульгатор: 1 вес.ч. алкиларилполигликолевого эфира.

Для получения целесообразного готового к применению препарата биологически активного вещества смешивают 1 вес.ч. биологически активного вещества с приведенными количествами растворителя и эмульгатора и разбавляют концентрат водой до необходимой концентрации.

Листья хлопчатника (*Gossypium hirsutum*), подвергшиеся сильному нападению вшей листьев хлопчатника (*Aphis gossypii*), обрабатывают окунанием в раствор препарата биологически активного вещества необходимой концентрации.

По истечении заданного промежутка времени определяют умерщвление в процентах (%). При этом 100% означают, что все листовые вши умерщвлены, а 0% означает, что ни одна листовая вошь не была умерщвлена.

В этом тесте показывают, например, следующие соединения, приведенные в примерах получения, которые проявляют эффективность, равную или большую 80% при концентрации 200 млн. долей: примеры получения I-1-a-2, I-1-a-3, I-1-a-4, I-1-c-1.

Пример С.

Тест на *Phaedon cochleariae* - личинки (7:1).

Растворитель: 7 вес.ч. диметилформаида.

Эмульгатор: 1 вес.ч. алкиларилполигликолевого эфира.

Для получения целесообразного готового к применению препарата биологически активного вещества смешивают 1 вес.ч. биологически активного вещества с приведенными количествами растворителя и эмульгатора и разбавляют концентрат водой до необходимой концентрации.

Листья капусты (*Brassica oleracea*) обрабатывают окунанием в готовый к применению препарат биологически активного вещества необходимой концентрации и помещают на них личинок жучка листьев хрена (*Phaedon cochleariae*), пока листья еще влажные.

По истечении заданного промежутка времени определяют умерщвление в процентах (%). При этом 100% означают, что все личинки жучков умерщвлены, а 0% означает, что ни одна личинка жучка не была умерщвлена.

В этом тесте показывают, например, следующие соединения, приведенные в примерах получения, которые проявляют эффективность, равную или большую 90% при концентрации 1000 млн. долей: пример получения I-2-a-2, I-2-b-2, I-1-a-2, I-1-a-1, I-1-a-3, I-1-a-4, I-1-c-3, I-1-c-4, I-1-c-5, I-1-b-1, I-1-c-1.

Пример D.

Тест на *Plutella* (7:1).

Растворитель: 7 вес.ч. диметилформаида.

Эмульгатор: 1 вес.ч. алкиларилполигликолевого эфира.

Для получения целесообразного готового к применению препарата биологически активного вещества смешивают 1 вес.ч. биологически активного вещества с приведенными количествами растворителя и эмульгатора и разбавляют концентрат водой до необходимой концентрации.

Листья капусты (*Brassica oleracea*) обрабатывают окунанием в препарат биологически активного вещества необходимой концентрации и помещают на них гусениц капустных тараканов (*Plutella xylostella*), пока листья еще влажные.

По истечении заданного промежутка времени определяют умерщвление в процентах (%). При этом 100% означают, что все гусеницы умерщвлены, а 0% означает, что ни одна гусеница не была умерщвлена.

В этом тесте показывают, например, следующие соединения, приведенные в примерах получения, которые проявляют эффективность, равную 100% при концентрации 1000 млн. долей: примеры получения I-2-a-2, I-2-b-2, I-1-a-2.

Пример Е.

Тест на *Spodoptera frugiperda* (7:1).

Растворитель: 7 вес.ч. диметилформаида.

Эмульгатор: 1 вес.ч. алкиларилполигликолевого эфира.

Для получения целесообразного готового к применению препарата биологически активного вещества смешивают 1 вес.ч. биологически активного вещества с приведенными количествами растворителя и эмульгатора и разбавляют концентрат водой до необходимой концентрации.

Листья капусты (*Brassica oleracea*) обрабатывают окунанием в раствор препарата биологически активного вещества заданной концентрации и помещают на них гусениц червяка (*Spodoptera frugiperda*), пока листья еще влажные.

По истечении заданного промежутка времени определяют умерщвление в процентах (%). При этом 100% означают, что все гусеницы умерщвлены, а 0% означает, что ни одна гусеница не была умерщвлена.

В этом тесте показывают, например, следующие соединения, приведенные в примерах получения, которые проявляют эффективность, равную или большую 85% при концентрации 1000 млн. долей: примеры получения I-2-a-2, I-2-b-2, I-1-a-2, I-1-a-3, I-1-c-3.

Пример F.

Тест на *Nephotettix* (7:1).

Растворитель: 7 вес.ч. диметилформаида.

Эмульгатор: 1 вес.ч. алкиларилполигликолевого эфира.

Для получения целесообразного готового к применению препарата биологически активного вещества смешивают 1 вес.ч. биологически активного вещества с приведенными количествами растворителя и эмульгатора и разбавляют концентрат водой до необходимой концентрации.

Проростки риса (*Oryza sativa*) обрабатывают окунанием в раствор препарата биологически активного вещества заданной концентрации и помещают на них зеленых рисовых цикад (*Nephotettix cincticeps*), пока листья еще влажные.

По истечении заданного промежутка времени определяют умерщвление в процентах (%). При этом 100% означают, что все цикады умерщвлены, а 0% означает, что ни одна цикада не была умерщвлена.

В этом тесте показывают, например, следующие соединения, приведенные в примерах получения, которые проявляют эффективность, равную 100% при концентрации 1000 млн. долей: примеры получения I-2-a-2, I-2-b-2, I-1-a-2.

Пример G.

Тест на *Tetranychus* (7:1) (ОР-устойчивый, т.е. устойчивый к действию сложных эфиров ортофосфорной кислоты/обработка окунанием).

Растворитель: 7 вес.ч. диметилформаида.

Эмульгатор: 1 вес.ч. алкиларилполигликолевого эфира.

Для получения целесообразного готового к применению препарата биологически активного вещества смешивают 1 вес.ч. биологически активного вещества с приведенными количествами растворителя и эмульгатора и разбавляют концентрат водой до необходимой концентрации.

Растения фасоли (*Phaseolus vulgaris*), которые сильно поражены обычными паукообразными клещами всех стадий развития (*Tetranychus urticae*), обрабатывают окунанием в раствор препарата биологически активного вещества заданной концентрации.

По истечении заданного промежутка времени определяют эффективность в процентах (%). При этом 100% означают, что все паукообразные клещи умерщвлены, а 0% означает, что ни один паукообразный клещ не был умерщвлен.

В этом тесте показывают, например, следующие соединения, приведенные в примерах получения, которые проявляют эффективность, равную или большую 98% при концентрации 1000 млн. долей: примеры получения I-1-a-1, I-1-a-3, I-1-a-4, I-1-c-4.

Пример H.

Тест на *Meloidogyne* (7:1).

Растворитель: 7 вес.ч. диметилформаида.

Эмульгатор: 1 вес.ч. алкиларилполигликолевого эфира.

Для получения целесообразного готового к применению препарата биологически активного вещества смешивают 1 вес.ч. биологически активного вещества с приведенными количествами растворителя и эмульгатора и разбавляют концентрат водой до необходимой концентрации.

В горшки помещают песок, раствор биологически активного вещества, суспензию из яиц и личинок *Meloidogyne incognita* и семена салата. Семена салата прорастают и растения развиваются. На корнях образуются наросты.

По истечении заданного промежутка времени определяют нематцидную эффективность в процентах (%) по образованию наростов. При этом 100% означают, что не образуется никаких наростов, а 0% означает, что число наростов на обработанных растениях соответствует числу наростов в случае растений необработанного контроля.

В этом тесте показывают, например, следующее соединение, которое проявляет эффективность, равную 95% при концентрации 20 млн. долей: пример получения I-1-a-4.

Пример I.

Тест на *Myzus persicae*.

Растворитель: 7 вес.ч. диметилформаида.

Эмульгатор: 2 вес.ч. алкиларилполигликолевого эфира.

Для получения целесообразного готового к применению препарата биологически активного вещества смешивают 1 вес.ч. биологически активного вещества с приведенными количествами растворителя и эмульгатора и разбавляют концентрат водой, содержащей эмульгатор до необходимой концентрации.

Листья капусты (*Brassica oleracea*), которые сильно поражены зелеными вшами персиковых листьев (*Myzus persicae*), обрабатывают окунанием в раствор препарата биологически активного вещества заданной концентрации.

По истечении заданного промежутка времени определяют умерщвление в процентах (%). При этом 100% означают, что все листовые вши умерщвлены, а 0% означает, что ни одна листовая вошь не была умерщвлена.

В этом тесте показывают, например, следующие соединения, приведенные в примерах получения, которые проявляют эффективность, равную или большую 80% при концентрации 100 млн. долей: примеры получения I-2-a-5, I-1-a-11, I-1-a-14, I-1-a-12, I-1-a-13.

Пример J.

Тест на *Tetranychus* (ОР-устойчивый/обработка окунанием).

Растворитель: 7 вес.ч. диметилформаида.

Эмульгатор: 2 вес.ч. алкиларилполигликолевого эфира.

Для получения целесообразного готового к применению препарата биологически активного вещества смешивают 1 вес.ч. биологически активного вещества с приведенными количествами растворителя и эмульгатора и разбавляют концентрат водой до необходимой концентрации.

Растения фасоли (*Phaseolus vulgaris*), которые сильно поражены обычными паукообразными клещами всех стадий развития (*Tetranychus urticae*), обрабатывают окунанием в раствор препарата биологически активного вещества необходимой концентрации.

По истечении заданного промежутка времени определяют умерщвление в процентах (%). При этом 100% означают, что все паукообразные клещи умерщвлены, а 0% означает, что ни один паукообразный клещ не умерщвлен.

В этом тесте показывают, например, следующие соединения, приведенные в примерах получения, которые проявляют эффективность, равную или большую 90% при концентрации 100 млн. долей: примеры получения I-1-a-11, I-1-a-14, I-1-a-12, I-1-a-21, I-1-a-22, I-1-a-9, I-1-a-43, I-1-a-46, I-1-a-53, I-1-a-70, I-1-c-16, I-1-c-20.

Пример K.

Тест на *Meloidogyne*.

Растворитель: 7 вес.ч. диметилформаида.

Эмульгатор: 2 вес.ч. алкиларилполигликолевого эфира.

Для получения целесообразного готового к применению препарата биологически активного вещества смешивают 1 вес.ч. биологически активного вещества с приведенными количествами растворителя и эмульгатора и разбавляют концентрат водой до необходимой концентрации.

В горшки помещают песок, раствор биологически активного вещества, суспензию из яиц и личинок *Meloidogyne incognita* и семена салата. Семена салата прорастают и растения развиваются. На корнях образуются наросты.

По истечении заданного промежутка времени по образованию наростов оценивают нематодцидную эффективность в процентах (%). При этом 100% означают, что никакие наросты не обнаружены, а 0% означает, что число наростов на обработанных растениях соответствует числу наростов на необработанном контроле.

В этом тесте показывают, например, следующее соединение, которое проявляет эффективность, равную 80% при концентрации 20 млн. долей: пример получения I-1-a-12.

Пример L.

Тест на *Aphis gossypii*.

Растворитель: 7 вес.ч. диметилформаида.

Эмульгатор: 2 вес.ч. алкиларилполигликолевого эфира.

Для получения целесообразного готового к применению препарата биологически активного вещества смешивают 1 вес.ч. биологически активного вещества с приведенными количествами растворителя и эмульгатора и разбавляют концентрат водой до необходимой концентрации.

Листья хлопчатника (*Gossypium hirsutum*), которые сильно поражены листовыми вшами хлопчатника (*Aphis gossypii*), обрабатывают окунанием в раствор препарата биологически активного вещества, необходимой концентрации.

По истечении заданного промежутка времени определяют умерщвление в процентах (%). При этом

100% означают, что все листовые вши умерщвлены, а 0% означает, что ни одна листовая вошь не была умерщвлена.

В этом тесте показывают, например, следующие соединения, приведенные в примерах получения, которые проявляют эффективность, равную или большую 80% при концентрации 100 млн. долей: примеры получения I-1-a-19, I-1-a-7, I-1-a-14, I-1-a-30, I-1-a-31, I-1-a-38, I-1-a-48, I-1-a-50, I-1-a-53, I-1-a-56, I-1-a-58, I-1-a-63, I-1-b-4, I-1-c-15, I-1-c-19, I-1-c-20, I-1-c-32, I-2-a-5.

Пример М.

Тест на *Phaedon cochleariae* - личинки.

Растворитель: 7 вес.ч. диметилформамида.

Эмульгатор: 2 вес.ч. алкиларилполигликолевого эфира.

Для получения целесообразного готового к применению препарата биологически активного вещества смешивают 1 вес.ч. биологически активного вещества с приведенными количествами растворителя и эмульгатора и разбавляют концентрат водой до необходимой концентрации.

Листья капусты (*Brassica oleracea*) обрабатывают окунанием в раствор препарата биологически активного вещества необходимой концентрации и помещают на них личинок жучка листьев хрена (*Phaedon cochleariae*), пока листья еще влажные.

По истечении заданного промежутка времени определяют умерщвление в процентах (%). При этом 100% означают, что все личинки жучка умерщвлены, а 0% означает, что ни одна личинка жучка не была умерщвлена.

В этом тесте показывают, например, следующее соединение, которое проявляет эффективность, равную 100% при концентрации 100 млн. долей: пример получения I-1-a-23.

Пример N.

Тест на *Phaedon* (обработка опрыскиванием).

Растворитель: 78 вес.ч. ацетона, 1,5 вес.ч. диметилформамида.

Эмульгатор: 0,5 вес.ч. алкиларилполигликолевого эфира.

Для получения целесообразного готового к применению препарата биологически активного вещества смешивают 1 вес.ч. биологически активного вещества с приведенными количествами растворителя и эмульгатора и разбавляют концентрат водой до необходимой концентрации.

Листья китайской капусты (*Brassica pekinensis*) обрабатывают опрыскиванием препаратом биологически активного вещества необходимой концентрации и после высыхания помещают на них личинок жучка листьев хрена (*Phaedon cochleariae*).

По истечении заданного промежутка времени определяют умерщвление в процентах (%). При этом 100% означают, что все личинки жука умерщвлены, а 0% означает, что ни одна личинка жука не была умерщвлена.

В этом тесте показывают, например, следующие соединения, приведенные в примерах получения, которые проявляют эффективность, равную или большую 80% при расходном количестве 100 г/га: примеры получения I-1-a-15, I-1-c-9, I-1-a-21, и эффективность, равную 100% при расходном количестве 500 г/га: примеры/получения I-1-a-18, I-1-a-20, I-1-a-22, I-1-a-8, I-1-a-10, I-1-a-7, I-1-a-9, I-1-c-6, I-1-a-16, I-1-a-24, I-1-a-27, I-1-a-30, I-1-a-31, I-1-a-32, I-1-a-33, I-1-a-34, I-1-a-38, I-1-a-39, I-1-a-43, I-1-a-45, I-1-a-46, I-1-a-47, I-1-a-49, I-1-a-51, I-1-a-52, I-1-a-53, I-1-a-54, I-1-a-56, I-1-a-61, I-1-a-63, I-1-a-64, I-1-a-65, I-1-a-66, I-1-a-67, I-1-a-68, I-1-a-71, I-1-c-19, I-1-c-31, I-1-c-34.

Пример O.

Тест на *Tetranychus* (ОР-устойчивый/обработка опрыскиванием).

Растворитель: 78 вес.ч. ацетона, 1,5 вес.ч. диметилформамида.

Эмульгатор: 0,5 вес.ч. алкиларилполигликолевого эфира.

Для получения целесообразного готового к применению препарата биологически активного вещества смешивают 1 вес.ч. биологически активного вещества с приведенными количествами растворителя и эмульгатора и разбавляют концентрат водой до необходимой концентрации.

Листья фасоли (*Phaseolus vulgaris*), которые поражены обычными паукообразными клещами всех стадий развития (*Tetranychus urticae*), обрабатывают опрыскиванием готовым к применению препаратом биологически активного вещества необходимой концентрации.

По истечении заданного промежутка времени определяют эффективность в процентах (%). При этом: 100% означают, что все паукообразные клещи умерщвлены, а 0% означает, что ни один паукообразный клещ не был умерщвлен.

В этом тесте показывают, например, следующие соединения, приведенные в примерах получения, которые проявляют эффективность, равную или большую 80% при расходном количестве 100 г/га: примеры получения I-2-b-1, I-1-a-16, I-1-a-15, I-1-c-9, I-1-c-11, I-1-a-23, I-1-c-6, I-1-a-24, I-1-a-27, I-1-a-38, I-1-a-50, I-1-a-58, I-1-c-24, I-1-c-43.

Пример P.

Тест на *Meloidogone* (обработка опрыскиванием).

Растворитель: 80 вес.ч. ацетона.

Для получения целесообразного готового к применению препарата биологически активного веще-

ства смешивают 1 вес.ч. биологически активного вещества с приведенным количеством растворителя и разбавляют концентрат водой до необходимой концентрации.

В горшки помещают песок, раствор препарата биологически активного вещества, суспензию из яиц и личинок *Meloidogyne incognita* и семена салата. Семена салата прорастают и растения развиваются. На корнях развиваются наросты.

По истечении заданного промежутка времени оценивают нематодцидное действие по образованию наростов в процентах (%). При этом 100% означают, что никаких наростов не обнаружено, а 0% означает, что число наростов на обработанных растениях соответствует числу наростов на необработанном контроле.

В этом тесте показывает, например, следующее соединение, эффективность 100% при концентрации 20 млн. долей: пример получения I-1-a-15.

Пример Q.

Тест на *Myzus* (обработка опрыскиванием).

Растворитель: 78 вес.ч. ацетона, 1,5 вес.ч. диметилформаида.

Эмульгатор: 0,5 вес.ч. алкиларилполиглицолевого эфира.

Для получения целесообразного готового к применению препарата биологически активного вещества смешивают 1 вес.ч. биологически активного вещества с приведенными количествами растворителя и эмульгатора и разбавляют концентрат водой до необходимой концентрации.

Листья китайской капусты (*Brassica pekinensis*), которые поражены зелеными вшами персиковых листьев всех стадий развития (*Myzus persicae*), опрыскивают готовым к применению препаратом биологически активного вещества необходимой концентрации.

По истечении заданного промежутка времени определяют умерщвление в процентах (%). При этом 100% означают, что все листовые вши умерщвлены, а 0% означает, что ни одна листовая вошь не была умерщвлена.

В этом тесте показывают, например, следующие соединения, приведенные в примерах получения, которые проявляют эффективность, равную или большую 90% при расходном количестве 500 г/га: примеры получения I-1-a-18, I-1-a-19, I-1-c-10, I-1-a-20, I-1-c-11, I-1-a-23, I-1-a-21, I-1-a-22, I-1-a-8, I-1-a-10, I-1-a-7, I-1-a-9, I-1-c-6, I-2-a-1, I-2-a-3, I-2-a-4, I-2-a-7, I-2-b-1, I-2-b-3, I-2-b-4, I-2-a-5, I-1-a-16, I-1-a-24, I-1-a-26, I-1-a-28, I-1-a-29, I-1-a-30, I-1-a-31, I-1-a-32, I-1-a-33, I-1-a-34, I-1-a-35, I-1-a-36, I-1-a-37, I-1-a-38, I-1-a-39, I-1-a-40, I-1-a-41, I-1-a-42, I-1-a-43, I-1-a-44, I-1-a-45, I-1-a-46, I-1-a-47, I-1-a-48, I-1-a-49, I-1-a-50, I-1-a-51, I-1-a-52, I-1-a-53, I-1-a-54, I-1-a-56, I-1-a-57, I-1-a-58, I-1-a-59, I-1-a-60, I-1-a-61, I-1-a-62, I-1-a-63, I-1-a-64, I-1-a-65, I-1-a-66, I-1-a-67, I-1-a-69, I-1-a-70, I-1-a-71, I-1-b-4, I-1-b-6, I-1-b-7, I-1-b-8, I-1-b-10, I-1-b-11, I-1-c-14, I-1-c-15, I-1-c-16, I-1-c-17, I-1-c-18, I-1-c-19, I-1-c-20, I-1-c-21, I-1-c-22, I-1-c-23, I-1-c-24, I-1-c-25, I-1-c-26, I-1-c-30, I-1-c-31, I-1-c-32, I-1-c-33, I-1-c-34, I-1-c-35, I-1-c-36, I-1-c-40, I-1-c-41, I-1-c-42, I-1-c-43.

Пример R.

Тест на *Spodoptera frugiperda* (обработка опрыскиванием).

Растворитель: 78 вес.ч. ацетона, 1,5 вес.ч. диметилформаида.

Эмульгатор: 0,5 вес.ч. алкиларилполиглицолевого эфира.

Для получения целесообразного готового к применению препарата биологически активного вещества смешивают 1 вес.ч. биологически активного вещества с приведенными количествами растворителя и эмульгатора и разбавляют концентрат водой до необходимой концентрации.

Листья кукурузы (*Zea mays*) обрабатывают опрыскиванием готовым к применению препаратом биологически активного вещества необходимой концентрации и после высыхания помещают на них гусениц червяка (*Spodoptera frugiperda*).

По истечении заданного промежутка времени определяют умерщвление в процентах (%). При этом 100% означают, что все гусеницы умерщвлены, а 0% означает, что ни одна гусеница не была умерщвлена.

В этом тесте показывают, например, следующие соединения, приведенные в примерах получения, которые проявляют эффективность, равную или большую 80% при расходном количестве 500 г/га: примеры получения I-2-a-7, I-1-a-16, I-1-a-21, I-1-a-22, I-1-a-8, I-1-a-10, I-1-a-27, I-1-a-31, I-1-a-49, I-1-a-51, I-1-a-52, I-1-a-54, I-1-a-64, I-1-a-65, I-1-a-66, I-1-a-67, I-1-c-16, I-1-c-19, I-1-c-31, I-1-c-36, I-1-c-40.

Пример S.

Тест на *Myzus persicae* (обработка гидропоникой).

Растворитель: 7 вес.ч. диметилформаида.

Эмульгатор: 2 вес.ч. алкиларилполиглицолевого эфира.

Для получения целесообразного готового к применению препарата биологически активного вещества смешивают 1 вес.ч. биологически активного вещества с приведенными количествами растворителя и эмульгатора и разбавляют концентрат водой до необходимой концентрации.

Готовый к применению препарат биологически активного вещества смешивают с водой. Приведенная концентрация относится к количеству биологически активного вещества на единицу объема воды (мг/л = млн. долей). Обработанную воду заливают в сосуды с растениями гороха (*Pisum sativum*). По истечении заданного времени растения инфицируют зелеными вшами персиковых листьев (*Myzus*

persicae).

По истечении заданного промежутка времени определяют умерщвление в процентах (%). При этом 100% означают, что все листовые вши умерщвлены, а 0% означает, что ни одна листовая вошь не была умерщвлена.

В этом тесте показывают, например, следующие соединения, приведенные в примерах получения, которые проявляют эффективность, равную или большую 95% при концентрации 20 млн. долей: примеры получения I-1-a-23, I-1-a-21, I-1-a-7, I-1-a-24, I-1-a-26, I-1-a-30, I-1-a-32, I-1-a-34, I-1-a-35, I-1-a-36, I-1-a-38, I-1-a-39, I-1-a-40, I-1-a-42, I-1-a-43, I-1-a-44, I-1-a-45, I-1-a-46, I-1-a-47, I-1-a-48, I-1-a-50, I-1-a-53, I-1-a-56, I-1-a-57, I-1-a-58, I-1-a-59, I-1-a-69, I-1-a-70, I-1-a-71, I-1-b-4, I-1-b-8, I-1-b-10, I-1-b-11, I-1-c-15, I-1-c-17, I-1-c-19, I-1-c-20, I-1-c-23, I-1-c-24, I-1-c-25, I-1-c-32, I-1-c-43.

Пример Т.

Испытания при обработке после всходов.

Растворитель: 5 вес.ч. ацетона.

Эмульгатор: 1 вес.ч. алкиларилполигликолевого эфира.

Для получения целесообразного готового к применению препарата биологически активного вещества смешивают 1 вес.ч. биологически активного вещества с приведенными количествами растворителя и эмульгатора и разбавляют концентрат водой до необходимой концентрации.

Готовым к применению препаратом биологически активного вещества опрыскивают испытываемые растения, достигшие высоты 5-15 см, таким образом, чтобы нанести необходимые количества биологически активного вещества на единицу площади. Концентрацию жидкости для опрыскивания выбирают таким образом, чтобы необходимое количество биологически активного вещества вносилось 1000 л воды/га.

Через 3 недели бонитируют повреждение растений в процентах (%) по сравнению с необработанным контролем.

При этом 0% означает = никакого действия (как в случае необработанного контроля), 100% = полное уничтожение.

Пример У.

Тестирование при предвсходовой обработке (испытание биологически активных веществ и гербицида монхайм)

Растворитель: 5 вес.ч. ацетона.

Эмульгатор: 1 вес.ч. алкиларилполигликолевого эфира.

Для получения целесообразного готового к применению препарата биологически активного вещества смешивают 1 вес.ч. биологически активного вещества с приведенными количествами растворителя и эмульгатора и разбавляют концентрат водой до необходимой концентрации.

Семена испытываемых растений высевают в нормальную почву. По истечении 24 ч почву опрыскивают готовым к применению препаратом биологически активного вещества таким образом, чтобы нанести необходимые количества биологически активного вещества на единицу площади. Концентрацию жидкости для опрыскивания выбирают таким образом, чтобы необходимое количество биологически активного вещества вносилось 1000 л воды/га.

Через 3 недели бонитируют повреждение растений в процентах (%) по сравнению с необработанным контролем.

При этом 0% означает = никакого действия (как в случае необработанного контроля), 100% = полное уничтожение.

| Теплица | Концентрация биологически активного вещества, г а.в./га | Echinochloa | Setaria | Amaranthus | Galium | Sinapis |
|-----------------|---|-------------|-------------|-------------|---------|---------|
| Пример I-1-a-4 | 250 | 100 | 100 | 95 | 70 | 70 |
| Теплица | Концентрация биологически активного вещества, г а.в./га | Alopecurus | Avena fatua | Echinochloa | Setaria | Sinapis |
| Пример I-1-c-4 | 250 | 80 | - | 90 | 99 | 80 |
| Пример I-1-b-1 | 250 | 70 | 70 | 80 | 95 | 70 |
| Пример I-1-a-11 | 250 | 90 | 70 | 80 | 90 | - |

| Теплица | Концентрация биологически активного вещества, г а.в./га | Сахарная свекла | Alopecurus | Avena fatua | Echinochloa | Setaria |
|-----------------|---|-----------------|------------|-------------|-------------|---------|
| Пример I-1-a-14 | 250 | 0 | 95 | 80 | 80 | 90 |
| Пример I-1-a-15 | 250 | 0 | 95 | 80 | 99 | 70 |

| Теплица | Концентрация биологически активного вещества, г а.в./га | Alopecurus | Echinochloa | Setaria |
|-----------------|---|------------|-------------|---------|
| Пример I-1-a-11 | 250 | 80 | 80 | 100 |

Пример V.

1. Гербицидное действие при обработке перед всходами.

Семена однодольных, соответственно, двудольных сорняков, соответственно культурных растений, помещают в древесно-волоконистые горшки в песчанистую глинистую почву и покрывают почвой. Из препаратов испытываемых соединений в виде смачиваемых порошков (СП) приготавливают водную суспензию, которую наносят в различных дозировках на поверхность покрывающей почвы с расходным количеством воды в пересчете на гектар 600 л/га с добавлением 0,2% смачивающих средств.

После обработки горшки помещают в теплицу и выдерживают при хороших условиях для роста испытываемых растений. Визуальную бонитировку повреждений при всходах испытываемых растений осуществляют по истечении испытательного срока в 3 недели по сравнению с необработанным контролем (гербицидное действие в процентах (%): 100% эффективности = все растения погибли, 0% эффективности = как в случае контрольных растений).

При этом наряду с ранее названными примерами, следующие соединения при применении перед всходами с расходным количеством 320 г/га а.в. против *Solium multiflorum* и *Setaria viridis* проявляют эффективность, равную или большую 80%: примеры I-1-a-24, I-1-a-39, I-1-a-40, I-1-a-42, I-1-a-43, I-1-a-44, I-1-a-45, I-1-a-48, I-1-a-69, I-1-a-71, I-1-b-4, I-1-b-5, I-1-b-8, I-1-b-9, I-1-b-10, I-1-c-14, I-1-c-15, I-1-c-23, I-1-c-25, I-1-c-42 и I-1-c-43 (а.в. = активное вещество).

2. Гербицидное действие при обработке после всходов.

Семена однодольных, соответственно двудольных, сорняков, соответственно, культурных растений помещают в древесно-волоконистые горшки в песчанистую глинистую почву, покрывают почвой и выращивают в теплице при хороших условиях для роста растений. Через 2-3 недели после посева испытываемые растения обрабатывают на стадии одного листочка. Из препаратов испытываемых соединений в виде смачиваемых порошков (СП) приготавливают водную суспензию, которую в различных дозировках с расходным количеством воды в пересчете на гектар 600 л/га с добавлением 0,2% смачивающих средств наносят опрыскиванием на зеленые части растений. Примерно через 3 недели нахождения испытываемых растений в теплице при благоприятных для роста растений условиях проводят визуальную бонитировку действия препаратов по сравнению с необработанным контролем (гербицидное действие оценивают в процентах (%): 100% эффективности = все растения погибли, 0% эффективности = как в случае контрольных растений).

| Теплица | Концентрация биологически активного вещества, г а.в./га | Lolium | Setaria | Sinapis | Echinochloa |
|-----------------|---|--------|---------|---------|-------------|
| Пример I-1-a-18 | 320 | 80 | 100 | - | 90 |
| Пример I-1-a-19 | 320 | 90 | 90 | 70 | 90 |
| Пример I-2-a-6 | 320 | 80 | 80 | 60 | 60 |
| Пример I-2-b-3 | 320 | 100 | 90 | - | 80 |
| Пример I-1-a-2 | 320 | 70 | 90 | 60 | 80 |
| Пример I-1-a-7 | 320 | 80 | 80 | 60 | 60 |
| Пример I-1-a-21 | 320 | 80 | 90 | 70 | 80 |
| Пример I-1-a-22 | 320 | 70 | 80 | 70 | 100 |
| Пример I-1-c-6 | 320 | 90 | 90 | 60 | 80 |

| Теплица | Концентрация биологически активного вещества, г а.в./га | Lolium | Setaria | Amaranthus | Sinapis | Echinochloa |
|----------------|---|--------|---------|------------|---------|-------------|
| Пример I-2-a-2 | 320 | 90 | 100 | 60 | 70 | 80 |

| Теплица | Концентрация биологически активного вещества, г а.в./га | Lolium | Setaria | Amaranthus | Stellaria |
|----------------|---|--------|---------|------------|-----------|
| Пример I-2-a-5 | 320 | 100 | 70 | 70 | 60 |

Наряду с ранее названными примерами, приведенные ниже соединения при применении после всходов с расходным количеством 320 г а.в./га по отношению к *Echinochloa crus-galli*, *Lolium multiflorum* и *Setaria viridis* проявляют эффективность, равную или большую 80%: примеры получения I-1-a-10, I-1-a-18, I-1-a-19, I-1-a-21, I-1-a-24, I-1-a-25, I-1-a-27, I-1-a-39, I-1-a-40, I-1-a-42, I-1-a-45, I-1-a-48, I-1-a-71, I-1-b-8, I-1-b-9, I-1-b-10, I-1-b-11, I-1-c-6, I-1-c-15, I-1-c-23, I-1-c-25, I-1-c-26, I-1-c-42, I-1-c-43, I-2-a-2 и I-2-b-3.

Описание испытаний для профильных опытов.

2. Гербицидное действие при обработке после всходов.

Семена однодольных, соответственно двудольных, сорняков, соответственно, культурных растений помещают в древесно-волоконистые или пластиковые горшки в песчанистую глинистую почву, покрывают почвой и выращивают в теплице во время вегетационного периода, а также вне теплицы при хороших условиях для роста растений. Через 2-3 недели после посева испытываемые растения обрабатывают на стадии от одного до трех листочков. Препараты испытываемых соединений в виде порошков для опрыскивания или жидкости для опрыскивания смешивают в различных дозировках с водой и наносят с расходным количеством воды в пересчете на гектар 300 л/га с добавлением смачивающих средств (0,2-0,3%), опрыскивая растения и поверхность почвы. Спустя 3-4 недели после обработки испытываемых растений визуально бонитируют эффективность препаратов по сравнению с необработанным контролем (гербицидное действие оценивают в процентах (%): 100% эффективности = все растения погибли,

0% эффективности = как в случае контрольных растений).

Применение защитных веществ.

Для того чтобы дополнительно проверить, могут ли защитные вещества улучшить переносимость испытываемых веществ культурными растениями, используют следующие возможности для применения защитного вещества:

семена культурных растений перед посевом протравливают защитным веществом (данные по количеству защитного вещества приведены в процентах в пересчете на вес зерна);

культурные растения перед обработкой испытываемыми соединениями опрыскивают определенным расходным количеством защитного вещества на гектар (обычно за 1 день до применения испытываемых соединений);

защитное вещество применяют совместно с испытываемым соединением в виде смеси, приготовляемой в большом резервуаре (приводится количество защитного вещества в виде г/га или в виде отношения к гербициду).

Сравнивая действие испытываемого соединения на культурные растения, обработанные им без защитных веществ или совместно с защитными веществами, можно оценить эффективность защитного вещества.

Тепличные опыты с зерновыми культурами, выращиваемыми в горшках.

Мефенпир применяют за 1 день до обработки гербицидами

Таблица 1

| 10 дней после обработки | | | |
|-------------------------|---------------------------------|-------------------------------|--------------------------------|
| | Расходное количество, г а.в./га | Яровой ячмень, обнаружено (%) | Яровая пшеница, обнаружено (%) |
| I-1-a-25 | 25 | 50 | 40 |
| | 12,5 | 30 | 20 |
| I-1-a-25 + Мефенпир | 25 + 100 | 15 | 10 |
| | 12,5 + 100 | 10 | 5 |

Таблица 2

| 28 дней после обработки | | |
|-------------------------|---------------------------------|--------------------------------|
| | Расходное количество, г а.в./га | Яровая пшеница, обнаружено (%) |
| I-1-a-25 | 50 | 60 |
| | 25 | 20 |
| | 12,5 | 10 |
| I-1-a-25 + Мефенпир | 50 + 100 | 10 |
| | 25 + 100 | 5 |
| | 12,5 + 100 | 0 |

Таблица 3

| 28 дней после обработки | | | |
|-------------------------|---------------------------------|-------------------------------|--------------------------------|
| | Расходное количество, г а.в./га | Яровой ячмень, обнаружено (%) | Яровая пшеница, обнаружено (%) |
| I-1-c-25 | 23,8 | 50 | 70 |
| | 11,9 | | 20 |
| I-1-c-25 + Мефенпир | 23,8 | 20 | 20 |
| | 11,9 | | 10 |

Пример W.

Тест на граничную концентрацию/почвенные насекомые - обработка трансгенных растений.

Испытуемое насекомое: *Diabrotica balteata* - личинки в почве.

Растворитель: 7 вес.ч. ацетона.

Эмульгатор: 1 вес.ч. алкиларилполигликолевого эфира.

Для получения целесообразного готового к применению препарата биологически активного вещества смешивают 1 вес.ч. биологически активного вещества с приведенными количествами растворителя и эмульгатора и разбавляют концентрат водой до необходимой концентрации.

Готовый к применению препарат выливают на почву. При этом концентрация биологически активного вещества в готовом препарате практически не играет никакой роли, определяющим является само весовое количество биологически активного вещества, приходящееся на единицу объема почвы, которую выражают в млн. долях (мг/л). Почвой наполняют 0,25 л горшки и оставляют их стоять при температуре 20°C.

Сразу после заполнения в каждый горшок помещают 5 проросших зерен кукурузы сорта YIELD GUARD (товарный знак фирмы Monsanto Comp., USA). Через 2 дня в обработанную почву помещают соответствующих испытуемых насекомых. По истечении дальнейших 7 дней определяют эффективность, подсчитывая взошедшие растения кукурузы (1 растение = 20% эффективности).

Пример X.

Тест на *Heliothis virescens* - обработка трансгенных растений.

Растворитель: 7 вес.ч. ацетона.

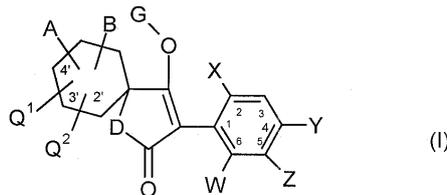
Эмульгатор: 1 вес.ч. алкиларилполигликолевого эфира.

Для получения целесообразного готового к применению препарата биологически активного вещества смешивают 1 вес.ч. биологически активного вещества с приведенными количествами растворителя и эмульгатора и разбавляют концентрат водой до необходимой концентрации.

Ростки сои (*Glycine max*) сорта Roundup Ready (товарный знак фирмы Monsanto Comp. USA) обрабатывают окунанием в готовый к применению препарат необходимой концентрации и помещают на них гусениц табачных бутонов *Heliothis virescens*, пока листья еще влажные. По истечении заданного промежутка времени определяют умерщвление насекомых.

ФОРМУЛА ИЗОБРЕТЕНИЯ

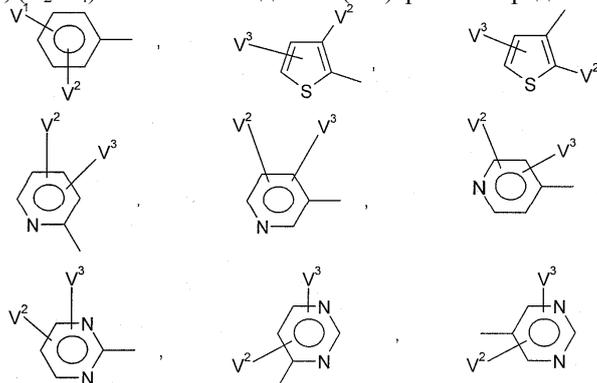
1. Соединения формулы (I)



где W означает водород, хлор, бром, (C₁-C₄)алкил, (C₂-C₄)алкенил, (C₂-C₄)алкинил, (C₁-C₄)алкоксигруппу, (C₁-C₂)галоидалкил или (C₁-C₂)галоидалкоксигруппу;

X означает хлор, бром, (C₁-C₄)алкил, (C₂-C₄)алкенил, (C₂-C₄)алкинил, (C₁-C₄)алкоксигруппу, (C₁-C₄)галоидалкил, (C₁-C₄)галоидалкокси- или цианогруппу;

Y и Z независимо один от другого означают водород, фтор, хлор, бром, (C₁-C₄)алкил, (C₂-C₄)алкенил, (C₂-C₄)алкинил, (C₁-C₆)алкоксигруппу, (C₁-C₄)галоидалкил, (C₁-C₄)галоидалкокси-, цианогруппу, (C₂-C₄)алкенил, (C₂-C₄)алкинил или один из (гет)арильных радикалов



причем в случае (гет)ариллов только один из радикалов Y или Z может означать (гет)арил;

V¹ означает водород, фтор, хлор, бром, (C₁-C₆)алкил, (C₁-C₄)алкоксигруппу, (C₁-C₂)галоидалкил, (C₁-C₂)галоидалкокси-, нитро-, цианогруппу или не замещенный или замещенный одно- или двукратно фтором, хлором, бромом, (C₁-C₄)алкилом, (C₁-C₄)алкоксигруппой, (C₁-C₂)галоидалкилом, (C₁-C₂)галоидалкокси-, нитро- или цианогруппой фенол;

V² и V³ независимо один от другого означают водород, фтор, хлор, бром, (C₁-C₄)алкил, (C₁-C₄)алкоксигруппу, (C₁-C₂)галоидалкил или (C₁-C₂)галоидалкоксигруппу,

при условии, что по крайней мере один из радикалов W или Z не должен означать водород, когда X

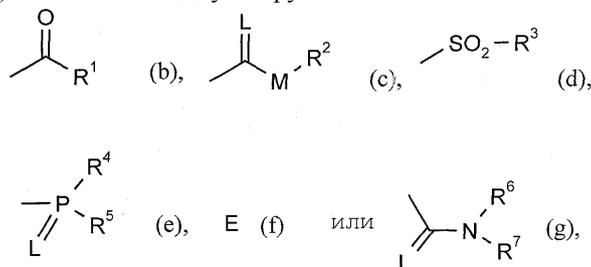
и Y означают метил;

A и B и атом углерода, к которому они присоединены, означают не замещенный или замещенный одно-трехкратно (C₁-C₄)алкилом, (C₁-C₃)галоидалкилом, (C₁-C₄)алкоксигруппой или (C₁-C₄)алкокси(C₁-C₂)алкилом 5-, 6- или 7-членный кеталь, который может содержать еще один атом кислорода;

D означает NH (1) или кислород (2);

Q¹ и Q² независимо один от другого означают водород, метил, этил, трифторметил, метокси- или этоксигруппу;

G означает водород (a) или означает одну из групп



где E означает ион металла или ион аммония,

L означает кислород или серу;

M означает кислород или серу;

R¹ означает не замещенные или замещенные одно-трехкратно фтором или хлором (C₁-C₁₆)алкил, (C₂-C₁₆)алкенил, (C₁-C₆)алкокси(C₁-C₄)алкил, (C₁-C₆)алкилтио(C₁-C₄)алкил или поли(C₁-C₆)алкокси(C₁-C₄)алкил или означает не замещенный или замещенный одно- или двукратно фтором, хлором, (C₁-C₅)алкилом или (C₁-C₅)алкоксигруппой (C₃-C₇)циклоалкил, у которого одна или две не соседние метиленовые группы могут быть заменены кислородом и/или серой,

означает не замещенный или замещенный одно-трехкратно фтором, хлором, бромом, циано-, нитрогруппой, (C₁-C₄)алкилом, (C₁-C₄)алкоксигруппой, (C₁-C₃)галоидалкилом, (C₁-C₃)галоидалкокси-, (C₁-C₄)алкилтиогруппой или (C₁-C₄)алкилсульфонилом фенил,

означает не замещенный или замещенный одно- или двукратно фтором, хлором, бромом, (C₁-C₄)алкилом, (C₁-C₄)алкоксигруппой, (C₁-C₃)галоидалкилом или (C₁-C₃)галоидалкоксигруппой фенил(C₁-C₄)алкил,

означает не замещенные или замещенные одно- или двукратно фтором, хлором, бромом или (C₁-C₄)алкилом пиразолил, тиазолил, пиридил, пиримидил, фуранил или тиенил,

означает не замещенный или замещенный одно- или двукратно фтором, хлором, бромом или (C₁-C₄)алкилом фенокси(C₁-C₅)алкил или

означает не замещенные или замещенные одно- или двукратно фтором, хлором, бромом, аминогруппой или (C₁-C₄)алкилом пиридилокси(C₁-C₅)алкил, пиримидилокси(C₁-C₅)алкил или тиазолилокси(C₁-C₅)алкил;

R² означает не замещенные или замещенные одно-трехкратно фтором или хлором (C₁-C₁₆)алкил, (C₂-C₁₆)алкенил, (C₁-C₆)алкокси(C₂-C₆)алкил или поли(C₁-C₆)алкокси(C₂-C₆)алкил,

означает не замещенный или замещенный одно- или двукратно фтором, хлором, (C₁-C₄)алкилом или (C₁-C₄)алкоксигруппой (C₃-C₇)циклоалкил или

означает не замещенные или замещенные одно-трехкратно фтором, хлором, бромом, циано-, нитрогруппой, (C₁-C₄)алкилом, (C₁-C₃)алкоксигруппой, (C₁-C₃)галоидалкилом или (C₁-C₃)галоидалкоксигруппой фенил или бензил;

R³ означает не замещенный или замещенный одно-трехкратно фтором или хлором (C₁-C₆)алкил или

означает не замещенные или замещенные одно- или двукратно фтором, хлором, бромом, (C₁-C₄)алкилом, (C₁-C₄)алкокси-, (C₁-C₂)галоидалкоксигруппой, (C₁-C₂)галоидалкилом, циано- или нитрогруппой фенил или бензил;

R⁴ и R⁵ независимо один от другого означают не замещенные или замещенные одно-трехкратно фтором или хлором (C₁-C₆)алкил, (C₁-C₆)алкокси-, (C₁-C₆)алкиламино-, ди((C₁-C₆)алкил)амино-, (C₁-C₆)алкилтио- или (C₃-C₄)алкенилтиогруппу или

означают не замещенные или замещенные одно- или двукратно фтором, хлором, бромом, нитро-, циано-, (C₁-C₃)алкокси-, (C₁-C₃)галоидалкокси-, (C₁-C₃)алкилтио-, (C₁-C₃)галоидалкилтиогруппой, (C₁-C₃)алкилом или (C₁-C₃)галоидалкилом фенил, фенокси- или фенилтиогруппу,

R⁶ и R⁷ независимо один от другого означают водород, означают не замещенные или замещенные одно-трехкратно фтором или хлором (C₁-C₆)алкил, (C₃-C₆)циклоалкил, (C₁-C₆)алкоксигруппу, (C₃-C₆)алкенил или (C₁-C₆)алкокси(C₂-C₆)алкил,

означают не замещенные или замещенные одно-трехкратно фтором, хлором, бромом, (C₁-C₅)галоидалкилом, (C₁-C₅)алкилом или (C₁-C₅)алкоксигруппой фенил или бензил, или вместе означают не замещенный или замещенный (C₁-C₄)алкилом (C₃-C₆)алкиленовый радикал, в котором при необ-

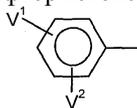
ходимости одна метиленовая группа заменена кислородом или серой.

2. Соединения формулы (I) по п.1, где

W означает водород, хлор, бром, метил, этил, винил, этинил, пропинил, метокси-, этоксигруппу или трифторметил;

X означает хлор, бром, метил, этил, пропил, изопропил, винил, этинил, пропинил, метокси-, этокси-группу, трифторметил, дифторметокси-, трифторметокси- или цианогруппу;

Y и Z независимо один от другого означают водород, фтор, хлор, бром, метил, этил, винил, этинил, пропинил, метоксигруппу, трифторметил, трифторметокси-, цианогруппу или фенильный радикал



причем в случае фенила только один из радикалов Y или Z может означать фенил;

V¹ означает водород, фтор, хлор, бром, метил, этил, н-пропил, изопропил, трет-бутил, метокси-, этокси-, н-пропокси-, изопропоксигруппу, трифторметил или трифторметоксигруппу;

V² означает водород, фтор, хлор, метил, этил, н-пропил, изопропил, метокси-, этоксигруппу или трифторметил,

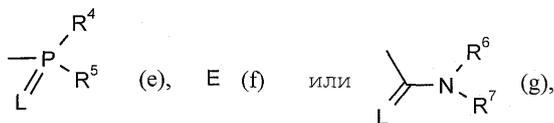
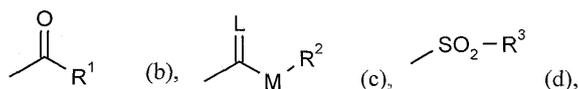
при условии, что по крайней мере один из радикалов W или Z не должен означать водород, когда X и Y означают метил;

A и B и атом углерода, к которому они присоединены, означают не замещенный или замещенный однократно или двукратно метилом, этилом, пропилом, трифторметилом, монохлорметилом, метокси-, этоксигруппой, метоксиметилом или этоксиметилом 5-, 6- или 7-членный кеталь, который может включать еще один атом кислорода;

D означает NH (1) или кислород (2);

Q¹ и Q² означают водород;

G означает водород (a) или означает одну из групп



где E означает ион металла или ион аммония;

L означает кислород или серу;

M означает кислород или серу;

R¹ означает не замещенные или замещенные одно-трехкратно фтором или хлором (C₁-C₁₀)алкил, (C₂-C₁₀)алкенил, (C₁-C₄)алкокси(C₁-C₂)алкил, (C₁-C₄)алкилтио(C₁-C₂)алкил или

означает не замещенный или замещенный однократно фтором, хлором, метилом, этилом или метоксигруппой (C₃-C₆)циклоалкил,

означает не замещенный или замещенный одно- или двукратно фтором, хлором, бромом, циано-, нитрогруппой, метилом, этилом, н-пропилом, изопропилом, метокси-, этоксигруппой, трифторметилом или трифторметоксигруппой фенил,

означает не замещенный или замещенный однократно хлором, бромом или метилом фуранил, тиенил или пиридил,

R² означает не замещенные или замещенные одно-трехкратно фтором или хлором (C₁-C₁₀)алкил, (C₂-C₁₀)алкенил или (C₁-C₄)алкокси(C₂-C₄)алкил,

означает циклопентил или циклогексил или

означает не замещенные или замещенные одно- или двукратно фтором, хлором, циано-, нитрогруппой, метилом, этилом, метоксигруппой, трифторметилом или трифторметоксигруппой фенил или бензил;

R³ означает не замещенные или замещенные одно-трехкратно фтором или хлором метил, этил, пропил или изопропил или не замещенный или замещенный однократно фтором, хлором, бромом, метилом, этилом, изопропилом, трет-бутилом, метокси-, этокси-, изопропоксигруппой, трифторметилом, трифторметокси-, циано- или нитрогруппой фенил;

R⁴ и R⁵ независимо один от другого означают (C₁-C₄)алкокси- или (C₁-C₄)алкилтиогруппу или означают не замещенные или замещенные однократно фтором, хлором, бромом, нитро-, цианогруппой, метилом, метоксигруппой, трифторметилом или трифторметоксигруппой фенил, фенокси- или фенилтиогруппу;

R⁶ и R⁷ независимо один от другого означают водород, означают (C₁-C₄)алкил, (C₃-C₆)циклоалкил,

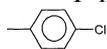
(C₁-C₄)алкоксигруппу, (C₃-C₄)алкенил или (C₁-C₄)алкокси(C₂-C₄)алкил, означают не замещенный или замещенный одно- или двукратно фтором, хлором, бромом, метилом, метоксигруппой или трифторметилом фенил или вместе означают (C₅-C₆)алкиленовый радикал, в котором при необходимости одна метиленовая группа заменена кислородом или серой.

3. Соединения формулы (I) по п.1, где

W означает водород, хлор, бром, метил, этил или метоксигруппу;

X означает хлор, бром, метил, этил или метоксигруппу;

Y и Z независимо один от другого означают водород, хлор, бром, метил или означают радикал



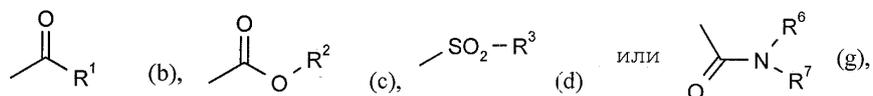
причем в этом случае только один из радикалов Y или Z может означать при условии, что по крайней мере один из радикалов W или Z не должен означать водород, когда X и Y означают метил;

A и B и атом углерода, к которому они присоединены, означают не замещенный или замещенный одно- или двукратно метилом, этилом, пропилом или монохлорметилом 5- или 6-членный кеталь;

D означает NH (1) или кислород (2);

Q¹ и Q² означают водород;

G означает водород (a) или означает одну из групп



R¹ означает (C₁-C₁₀)алкил, (C₁-C₄)алкокси(C₁-C₂)алкил, (C₃-C₆)циклоалкил, означает не замещенный или замещенный однократно хлором фенил или означает тиенил;

R² означает (C₁-C₁₀)алкил, (C₂-C₁₀)алкенил или бензил;

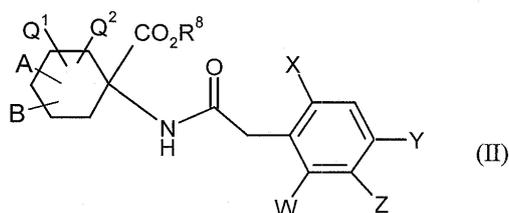
R³ означает метил;

R⁶ и R⁷ вместе означают (C₅-C₆)алкиленовый радикал, в котором при необходимости одна метиленовая группа заменена кислородом или серой.

4. Соединения формулы (I) по п.1, где радикалы W, X, Y, Z, D, Q¹, Q², G, A и B имеют значения, сведенные в следующей таблице:

| W | X | Y | Z | D | Q ¹ | Q ² | G | A | B |
|-----------------|-----------------|-----------------|---|----|----------------|----------------|---|--|---|
| CH ₃ | CH ₃ | CH ₃ | H | NH | H | H | H | 4'-O-(CH ₂) ₂ -O- | |
| CH ₃ | CH ₃ | Cl | H | NH | H | H | H | 4'-O-(CH ₂) ₂ -O- | |
| CH ₃ | CH ₃ | Br | H | NH | H | H | H | 4'-O-(CH ₂) ₂ -O- | |
| CH ₃ | CH ₃ | CH ₃ | H | NH | H | H | H | 4'-O-(CH ₂) ₃ -O- | |
| CH ₃ | CH ₃ | Cl | H | NH | H | H | H | 4'-O-(CH ₂) ₃ -O- | |
| CH ₃ | CH ₃ | Br | H | NH | H | H | H | 4'-O-(CH ₂) ₃ -O- | |

5. Способ получения соединений формулы (I) по п.1, где G означает водород и D означает NH, отличающийся тем, что соединения формулы (II)



где A, B, Q¹, Q², W, X, Y и Z имеют значения, приведенные выше, и R⁸ означает алкил, подвергают внутримолекулярной конденсации в присутствии разбавителя и основания.

6. Средство для борьбы с животными-вредителями, с ростом нежелательных растений и/или с нежелательными микроорганизмами, отличающееся тем, что содержит как минимум одно соединение формулы (I) по п.1.

7. Способ борьбы с животными-вредителями, с ростом нежелательных растений и/или с нежелательными микроорганизмами, отличающийся тем, что на вредителей, на рост нежелательных растений, на нежелательные микроорганизмы и/или на среду их обитания воздействуют соединениями формулы (I) по п.1.

8. Применение соединений формулы (I) по п.1 для борьбы с животными-вредителями, с ростом нежелательных растений и/или с нежелательными микроорганизмами.

9. Способ получения средств для борьбы с животными-вредителями, с ростом нежелательных растений и/или с нежелательными микроорганизмами, отличающийся тем, что смешивают соединения формулы (I) по п.1 с наполнителями и/или поверхностно-активными веществами.

10. Применение соединений формулы (I) по п.1 для получения средств для борьбы с животными-вредителями, с ростом нежелательных растений и/или с нежелательными микроорганизмами.

11. Средство, которое содержит эффективное количество комбинации биологически активных веществ, включающей в качестве компонентов

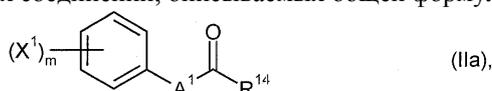
(a') как минимум одно соединение формулы (I), где A, B, D, G, Q¹, Q², W, X, Y и Z имеют значения, приведенные выше, и

(b') как минимум одно соединение, улучшающее переносимость гербицидов культурными растениями, из следующей группы соединений:

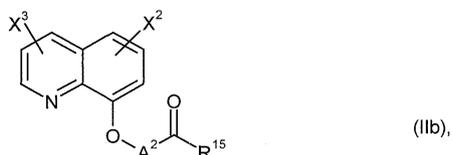
- 4-дихлорацетил-1-окса-4-азаспиро[4,5]декан (AD-67, MON-4660),
 1-дихлорацетилгексагидро-3,3,8a-триметилпирроло[1,2-a]пиримидин-6(2H)-он (дициклонон, BAS-145138),
 4-дихлорацетил-3,4-дигидро-3-метил-2H-1,4-бензоксазин (беноксакор),
 1-метилгексилловый эфир 5-хлорхинолин-8-оксиуксусной кислоты (клоквинтоцет-мексил - см. также родственные соединения в EP-A-86750, EP-A-94349, EP-A-191736, EP-A-492366),
 3-(2-хлорбензил)-1-(1-метил-1-фенилэтил)мочевина (кумилурон),
 α-(цианометоксимино)фенилацетонитрил (циометринил),
 2,4-дихлорфеноксиуксусная кислота (2,4-D),
 4-(2,4-дихлорфенокси)масляная кислота (2,4-DB),
 1-(1-метил-1-фенилэтил)-3-(4-метилфенил)мочевина (даймурон, димрон),
 3,6-дихлор-2-метоксибензойная кислота (дикамба),
 S-1-метил-1-фенилэтиловый эфир пиперидин-1-тиокарбоновой кислоты (димепиперат),
 2,2-дихлор-N-(2-оксо-2-(2-пропениламино)этил)-N-(2-пропенил)ацетамид (DKA-24),
 2,2-дихлор-N,N-ди-2-пропенилацетамид (дихлормид),
 4,6-дихлор-2-фенилпиримидин (фенклорим),
 этиловый эфир 1-(2,4-дихлорфенил)-5-трихлорметил-1H-1,2,4-триазол-3-карбоновой кислоты (фенхлоразол-этил - см. также родственные соединения в EP-A-174562 и EP-A-346620),
 фенилметилловый эфир 2-хлор-4-трифторметилтиазол-5-карбоновой кислоты (флуразол),
 4-хлор-N-(1,3-диоксолан-2-илметокси)-α-трифторацетофеноноксим (флуксофеним),
 3-дихлорацетил-5-(2-фуранил)-2,2-диметиллоксазолидин (фурилазол, MON-13900),
 этил-4,5-дигидро-5,5-дифенил-3-изоксазолкарбоксилат (изоксадифен-этил - см. также родственные соединения в WO 95/07897),
 1-(этоксикарбонил)этил-3,6-дихлор-2-метоксибензоат (лактидихлор),
 (4-хлор-о-толилокси)уксусная кислота (MCPA),
 2-(4-хлор-о-толилокси)пропионовая кислота (мекопроп),
 диэтил-1-(2,4-дихлорфенил)-4,5-дигидро-5-метил-1H-пиразол-3,5-дикарбоксилат (мефенпир-диэтил - см. также родственные соединения в WO 91/07874),
 2-дихлорметил-2-метил-1,3-диоксолан (MG-191),
 2-пропенил-1-окса-4-азаспиро[4,5]декан-4-карбодитиоат (MG-838),
 ангидрид 1,8-нафталевой кислоты,
 α-(1,3-диоксолан-2-илметоксимино)фенилацетонитрил (оксабетринил),
 2,2-дихлор-N-(1,3-диоксолан-2-илметил)-N-(2-пропенил)ацетамид (PPG-1292),
 3-дихлорацетил-2,2-диметиллоксазолидин (R-28725),
 3-дихлорацетил-2,2,5-триметиллоксазолидин (R-29148),
 4-(4-хлор-о-толил)масляная кислота,
 4-(4-хлорфенокси)масляная кислота, дифенилметоксиуксусная кислота, метиловый эфир дифенилметоксиуксусной кислоты, этиловый эфир дифенилметоксиуксусной кислоты,
 метиловый эфир 1-(2-хлорфенил)-5-фенил-1H-пиразол-3-карбоновой кислоты,
 этиловый эфир 1-(2,4-дихлорфенил)-5-метил-1H-пиразол-3-карбоновой кислоты,
 этиловый эфир 1-(2,4-дихлорфенил)-5-изопропил-1H-пиразол-3-карбоновой кислоты,
 этиловый эфир 1-(2,4-дихлорфенил)-5-(1,1-диметилэтил)-1H-пиразол-3-карбоновой кислоты,
 этиловый эфир 1-(2,4-дихлорфенил)-5-фенил-1H-пиразол-3-карбоновой кислоты (см. также родственные соединения в EP-A-269806 и EP-A-333131),
 этиловый эфир 5-(2,4-дихлорбензил)-2-изоксазолин-3-карбоновой кислоты,
 этиловый эфир 5-фенил-2-изоксазолин-3-карбоновой кислоты,
 этиловый эфир 5-(4-фторфенил)-5-фенил-2-изоксазолин-3-карбоновой кислоты (см. также родственные соединения в WO-A 91/08202),
 1,3-диметилбут-1-иловый эфир 5-хлорхинолин-8-оксиуксусной кислоты,
 4-аллилоксибутиловый эфир 5-хлорхинолин-8-оксиуксусной кислоты,
 1-аллилоксипроп-2-иловый эфир 5-хлорхинолин-8-оксиуксусной кислоты,
 метиловый эфир 5-хлорхиноксалин-8-оксиуксусной кислоты,
 этиловый эфир 5-хлорхинолин-8-оксиуксусной кислоты,

аллиловый эфир 5-хлорхиноксалин-8-оксиуксусной кислоты,
2-оксопроп-1-иловый эфир 5-хлорхинолин-8-оксиуксусной кислоты,
диэтиловый эфир 5-хлорхинолин-8-оксималоновой кислоты,
диаллиловый эфир 5-хлорхиноксалин-8-оксималоновой кислоты,
диэтиловый эфир 5-хлорхинолин-8-оксималоновой кислоты (см. также родственные соединения в
EP-A-582198),

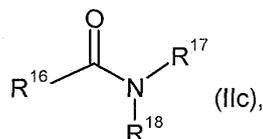
4-карбоксихроман-4-илуксусная кислота (AC-304415, см. EP-A-613618),
4-хлорфеноксидуксусная кислота,
3,3'-диметил-4-метоксибензофенон,
1-бром-4-хлорметилсульфонилбензол,
1-[4-(N-2-метоксибензоилсульфамоил)фенил]-3-метилмочевина (т.е. N-(2-метоксибензоил)-4-
[(метиламинокарбонил)амино]бензолсульфонамид),
1-[4-(N-2-метоксибензоилсульфамоил)фенил]-3,3-диметилмочевина,
1-[4-(N-4,5-диметилбензоилсульфамоил)фенил]-3-метилмочевина,
1-[4-(N-нафтилсульфамоил)фенил]-3,3-диметилмочевина,
N-(2-метокси-5-метилбензоил)-4-(циклопропиламинокарбонил)бензолсульфонамид
и/или одно из следующих соединений, описываемых общей формулой (IIa):



или общей формулой (IIb)

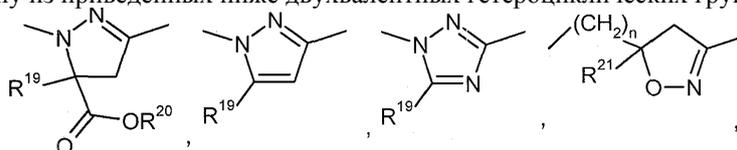


или формулой (IIc)



где m означает число 0, 1, 2, 3, 4 или 5,

A¹ означает одну из приведенных ниже двухвалентных гетероциклических групп



n означает число 0, 1, 2, 3, 4 или 5;

A² означает не замещенный или замещенный (C₁-C₄)алкилом, и/или (C₁-C₄)алкоксикарбонилем, и/или (C₁-C₄)алкенилоксикарбонилем алкандиил, содержащий 1 или 2 атома углерода;

R¹⁴ означает гидрокси-, меркапто-, amino-, (C₁-C₆)алкокси-, (C₁-C₆)алкилтио-, (C₁-C₆)алкиламино- или ди((C₁-C₄)алкил)аминогруппу,

R¹⁵ означает гидрокси-, меркапто-, amino-, (C₁-C₇)алкокси-, (C₁-C₆)алкилтио-, (C₁-C₆)алкенилокси-, (C₁-C₆)алкенилокси(C₁-C₆)алкокси-, (C₁-C₆)алкиламино- или ди((C₁-C₄)алкил)аминогруппу;

R¹⁶ означает не замещенный или замещенный фтором, хлором и/или бромом (C₁-C₄)алкил;

R¹⁷ означает водород, не замещенные или замещенные фтором, хлором и/или бромом (C₁-C₆)алкил, (C₂-C₆)алкенил или (C₂-C₆)алкинил, (C₁-C₄)алкокси(C₁-C₄)алкил, диоксоланил(C₁-C₄)алкил, фурил, фурил(C₁-C₄)алкил, тиенил, тиазолил, пиперидинил, или не замещенный или замещенный фтором, хлором и/или бромом или (C₁-C₄)алкилом фенил;

R¹⁸ означает водород, не замещенные или замещенные фтором, хлором и/или бромом (C₁-C₆)алкил, (C₂-C₆)алкенил или (C₂-C₆)алкинил, (C₁-C₄)алкокси(C₁-C₄)алкил, диоксоланил(C₁-C₄)алкил, фурил, фурил(C₁-C₄)алкил, тиенил, тиазолил, пиперидинил, или не замещенный или замещенный фтором, хлором и/или бромом или (C₁-C₄)алкилом фенил, или

R¹⁷ и R¹⁸ также вместе означают (C₃-C₆)алкандиил или (C₂-C₅)оксаалкандиил, которые не замещены или замещены (C₁-C₄)алкилом, фенилом, фурилом, аннелированным бензольным кольцом или двумя заместителями, которые вместе с C-атомом, к которому они присоединены, образуют 5- или 6-членный карбоцикл;

R¹⁹ означает водород, цианогруппу, галоид или означает не замещенные или замещенные фтором,

хлором и/или бромом (C₁-C₄)алкил, (C₃-C₆)циклоалкил или фенил;

R²⁰ означает водород, не замещенные или замещенные гидроксигруппой, цианогруппой, галоидом или (C₁-C₄)алкоксигруппой (C₁-C₆)алкил, (C₃-C₆)циклоалкил или три((C₁-C₄)алкил)силлил;

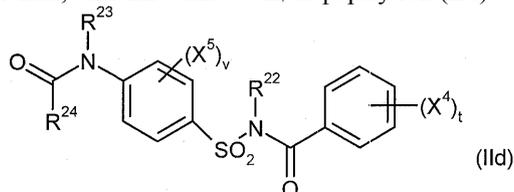
R²¹ означает водород, цианогруппу, галоид или означает не замещенные или замещенные фтором, хлором и/или бромом (C₁-C₄)алкил, (C₃-C₆)циклоалкил или фенил;

X¹ означает нитро-, цианогруппу, галоид, (C₁-C₄)алкил, (C₁-C₄)галоидалкил, (C₁-C₄)алкокси- или (C₁-C₄)галоидалкоксигруппу;

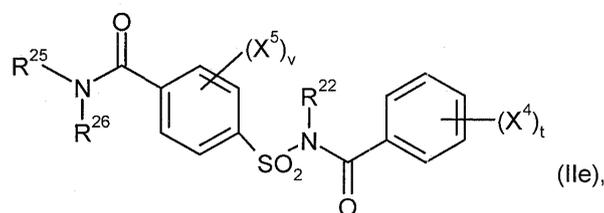
X² означает водород, циано-, нитрогруппу, галоид, (C₁-C₄)алкил, (C₁-C₄)галоидалкил, (C₁-C₄)алкокси- или (C₁-C₄)галоидалкоксигруппу;

X³ означает водород, циано-, нитрогруппу, галоид, (C₁-C₄)алкил, (C₁-C₄)галоидалкил, (C₁-C₄)алкокси- или (C₁-C₄)галоидалкоксигруппу;

и/или следующие соединения, описываемые общей формулой (IIд)



или общей формулой (IIе)



где t означает число 0, 1, 2, 3, 4 или 5;

v означает число 0, 1, 2, 3, 4 или 5;

R²² означает водород или (C₁-C₄)алкил;

R²³ означает водород или (C₁-C₄)алкил;

R²⁴ означает водород, не замещенные или замещенные цианогруппой, галоидом или (C₁-C₄)алкоксигруппой (C₁-C₆)алкил, (C₁-C₆)алкокси-, (C₁-C₆)алкилтио-, (C₁-C₆)алкиламино- или ди((C₁-C₄)алкил)аминогруппу, или не замещенные или замещенные цианогруппой, галоидом или (C₁-C₄)алкилом (C₃-C₆)циклоалкил, (C₃-C₆)циклоалкилокси-, (C₃-C₆)циклоалкилтио- или (C₃-C₆)циклоалкиламиногруппу;

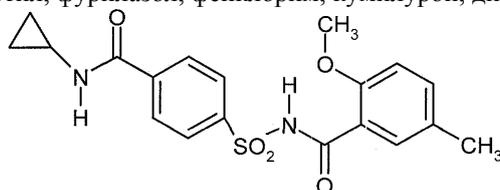
R²⁵ означает водород, не замещенный или замещенный циано-, гидроксигруппой, галоидом или (C₁-C₄)алкоксигруппой (C₁-C₆)алкил, не замещенные или замещенные цианогруппой или галоидом (C₃-C₆)алкенил или (C₃-C₆)алкинил или не замещенный или замещенный цианогруппой, галоидом или (C₁-C₄)алкилом (C₃-C₆)циклоалкил;

R²⁶ означает водород, не замещенный или замещенный циано-, гидроксигруппой, галоидом или (C₁-C₄)алкоксигруппой (C₁-C₆)алкил, означает не замещенные или замещенные цианогруппой или галоидом (C₃-C₆)алкенил или (C₃-C₆)алкинил, не замещенный или замещенный цианогруппой, галоидом или (C₁-C₄)алкилом (C₃-C₆)циклоалкил, или означает не замещенный или замещенный нитро-, цианогруппой, галоидом, (C₁-C₄)алкилом, (C₁-C₄)галоидалкилом, (C₁-C₄)алкокси- или (C₁-C₄)галоидалкоксигруппой фенил, или вместе с R²⁵ означают не замещенные или замещенные (C₁-C₄)алкилом (C₂-C₆)алкандиил или (C₂-C₃)оксаалкандиил,

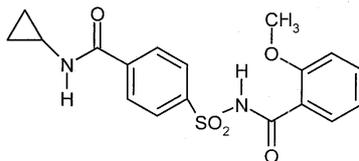
X⁴ означает нитро-, циано-, карбоксигруппу, карбамоил, формил, сульфамойл, гидроксигруппу, галоид, (C₁-C₄)алкил, (C₁-C₄)галоидалкил, (C₁-C₄)алкокси- или (C₁-C₄)галоидалкоксигруппу и

X⁵ означает нитро-, циано-, карбоксигруппу, карбамоил, формил, сульфамойл, гидроксигруппу, галоид, (C₁-C₄)алкил, (C₁-C₄)галоидалкил, (C₁-C₄)алкокси- или (C₁-C₄)галоидалкоксигруппу.

12. Средство по п.10, в котором соединение, улучшающее переносимость гербицидов культурными растениями, выбирают из следующей группы соединений: клоквинтоцет-мексил, фенхлоразол-этил, изоксадифен-этил, мефенпир-диэтил, фурилазол, фенклорим, кумилурон, димрон или соединения



и



13. Средство по одному из пп.10 или 11, в котором веществом, улучшающим переносимость гербицидов культурными растениями, является клоквинтоцет-мексил.

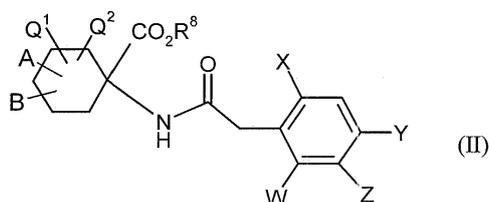
14. Средство по одному из пп.10 или 11, в котором веществом, улучшающим переносимость гербицидов культурными растениями, является мефенпир-диэтил.

15. Способ борьбы с ростом нежелательных растений, отличающийся тем, что наносят на растения или на окружающую их среду средство по п.10.

16. Применение средства по п.10 для борьбы с ростом нежелательных растений.

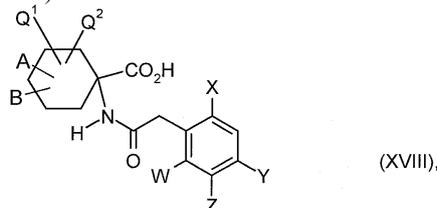
17. Способ борьбы с ростом нежелательных растений, отличающийся тем, что воздействуют на растения или на окружающую их среду с небольшим интервалом времени соединением формулы (I) по п.1 и соединением, улучшающим переносимость гербицидов культурными растениями, по п.10.

18. Соединения формулы (II)



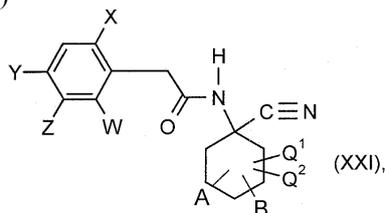
где A, B, Q¹, Q², R⁸, W, X, Y и Z имеют значения, приведенные выше.

19. Соединения формулы (XVIII)



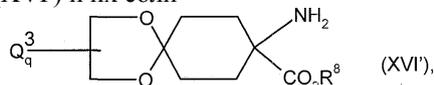
где A, B, Q¹, Q², W, X, Y и Z имеют значения, приведенные выше.

20. Соединения формулы (XXI)



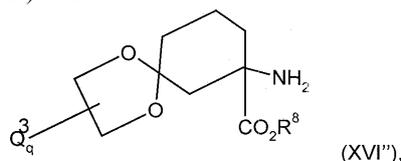
где A, B, Q¹, Q², W, X, Y и Z имеют значения, приведенные выше.

21. Соединения формулы (XVI') и их соли



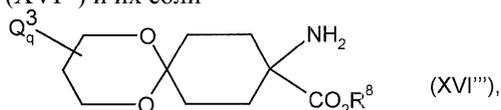
где Q³ означает (C₁-C₄)алкил, (C₁-C₃)галоидалкил, (C₁-C₄)алкоксигруппу или (C₁-C₄)алкокси(C₁-C₂)-алкил, q означает 1, 2 или 3, R⁸ имеет значения, приведенные выше.

22. Соединение формулы (XVI'') и их соли



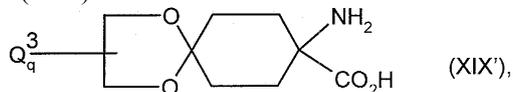
где Q³ и R⁸ имеют значения, приведенные выше, и q означает 0, 1, 2 или 3.

23. Соединения формулы (XVI''') и их соли



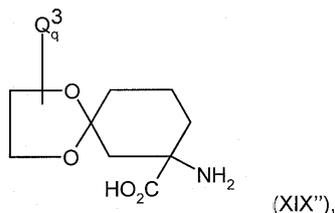
где Q^3 и R^8 имеют значения, приведенные выше, и q означает 0, 1, 2 или 3.

24. Соединения формулы (XIX')



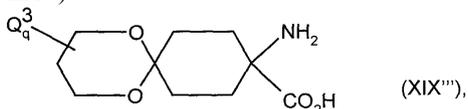
где Q^3 имеет значения, приведенные выше, и q означает 1, 2 или 3.

25. Соединения формулы (XIX'')



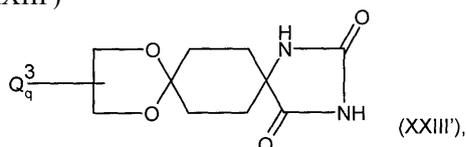
где Q^3 имеет значения, приведенные выше, и q означает 0, 1, 2 или 3.

26. Соединения формулы (XIX''')



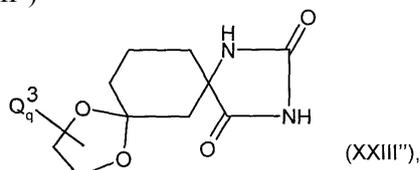
где Q^3 имеет значения, приведенные выше, и q означает 0, 1, 2 или 3.

27. Соединения формулы (XXIII')



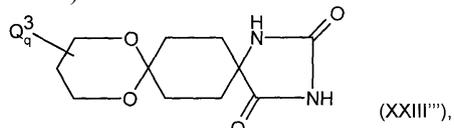
где Q^3 имеет значения, приведенные выше, и q означает 1, 2 или 3.

28. Соединения формулы (XXIII'')



где Q^3 имеет значения, приведенные выше, и q означают 0, 1, 2 или 3.

29. Соединения формулы (XXIII''')



где Q^3 имеет значения, приведенные выше, и q означает 0, 1, 2 или 3.

