

(19)



Евразийское
патентное
ведомство

(11) 035195

(13) B1

(12) ОПИСАНИЕ ИЗОБРЕТЕНИЯ К ЕВРАЗИЙСКОМУ ПАТЕНТУ

(45) Дата публикации и выдачи патента
2020.05.14

(21) Номер заявки
201890559

(22) Дата подачи заявки
2011.05.26

(51) Int. Cl. C07D 253/075 (2006.01)
A01N 43/707 (2006.01)
A01P 13/02 (2006.01)

(54) СПОСОБ ПОДАВЛЕНИЯ РОСТА СОРНЯКОВ С ИСПОЛЬЗОВАНИЕМ
ПРОИЗВОДНЫХ ТРИАЗИНА

(31) 2010-148286

(32) 2010.06.29

(33) JP

(43) 2018.07.31

(62) 201790457; 2011.05.26

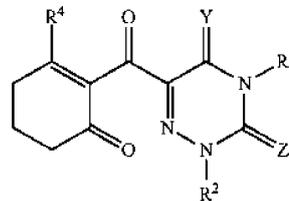
(71)(73) Заявитель и патентовладелец:
ФМК КОРПОРЕЙШН (US)

(72) Изобретатель:
Сибаяма Ацуси, Кадзика Риу, Кобаяси
Масами, Мицунари Такаси, Нагамацу
Ацуси (JP)

(74) Представитель:
Медведев В.Н. (RU)

(56) WO-A1-198600072
US-B1-6211178

(57) В изобретении описан способ подавления роста нежелательных сорняков, включающий нанесение агрохимической композиции на сорняки или почвы, в которых сорняки разрастаются. Агрохимическая композиция содержит эффективное количество производного триазина или его соли и приемлемый для сельского хозяйства носитель, где производное триазина представлено формулой II



Формула II,

где R¹ и R² независимо выбраны из C₁-C₆алкильной группы или фенильной группы, замещенной одним или несколькими заместителями, выбранными из атомов галогена; R⁴ представляет собой гидроксильную группу и Y и Z оба представляют собой атом кислорода. Композиция необязательно содержит дополнительный агрохимический активный компонент.

B1

035195

035195 B1

Область техники, к которой относится изобретение

Настоящее изобретение относится к способу подавления роста нежелательных сорняков с использованием агрохимической композиции на основе производных триазина.

Уровень техники

Производные триазина известны, например, из "Collection of Czechoslovak Chemical Communications (1969), 34(6), 1673-83" и т.д. Однако для соединений, описанных в этих литературных источниках, не описана гербицидная активность. Хотя различные соединения описаны в качестве гербицидов на основе триазинов (см., например, "The Pesticide Manual 15th Edition, 2009, published by BCPC"), они все имеют кольцо 1,3,5-триазина.

Конкретные примеры агрохимикатов на основе 1,3,5-триазина включают в себя 2-хлор-4,6-бис-(этиламино)-1,3,5-триазин (симазин), 2-хлор-4-этиламино-6-изопропиламино-1,3,5-триазин (атразин), 2,4-бис-(этиламино)-6-метилтио-1,3,5-триазин (симетрин), 2,4-бис-(изопропиламино)-6-метилтио-1,3,5-триазин (прометрин) и 2-(1,2-диметилпропиламино)-4-этиламино-6-метилтио-1,3,5-триазин (диметаметрин).

Кроме того, в качестве агрохимиката на основе 1,2,4-триазина известны 4-амино-3-метил-6-фенил-1,2,4-триазин-5(4Н)-он (метамитрон), 4-амино-6-трет-бутил-3-метилтио-1,2,4-триазин-5(4Н)-он (метрибузин) и т.д. В выложенной заявке на патент Японии (JP-A) № 8-259546 описано, что производные 4-(2,4-дигалоген-5-алкоксифенил)-1,2,4-триазин-3,5-диона, имеющие углеводородный заместитель в 6-положении, обладают гербицидной активностью. В JP-A № 5-51369 описано, что производные 3,5-диарил-6-амино-1,2,4-триазина обладают гербицидной активностью. В JP-A № 5-32641 описано, что производные 3-меркапто-1,2,4-триазина обладают гербицидной активностью.

Однако из всех литературных источников не известно, что производные 6-ацил-1,2,4-триазин-3,5-диона, представленные ниже формулой [1], обладают гербицидной активностью.

Перечень ссылок

Патентная литература.

Патентная ссылка 1: выложенная заявка на патент Японии № 8-259546.

Патентная ссылка 2: выложенная заявка на патент Японии № 5-51369.

Патентная ссылка 3: выложенная заявка на патент Японии № 5-32641.

Непатентная литература.

Непатентная ссылка 1: Collection of Czechoslovak Chemical Communications (1969), 34(6), 1673-83.

Непатентная ссылка 2: The Pesticide Manual 15th Edition (2009, published by BCPC).

Сущность изобретения

Проблемы, которые разрешаются изобретением

Необходимо, чтобы гербицид, применяемый для полезных сельскохозяйственных культур и полезных растений, был химическим препаратом, который можно наносить на почвы или листья и который обладает достаточным гербицидным действием при низкой химической дозе. Кроме того, поскольку существует увеличивающаяся потребность, относящаяся к безопасности и действию химического вещества на окружающую среду, ожидается разработка безопасных гербицидов. Изобретение предназначено для разрешения таких проблем.

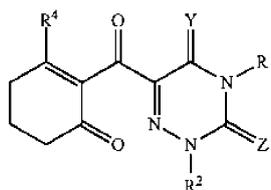
Способы разрешения проблем

Для достижения указанной выше цели авторы данного изобретения синтезировали много триазиновых соединений для изучения гербицидной активности различных производных триазина и усиленно определяли гербицидную активность и пригодность соединений. В результате этого обнаружено, что когда производные триазина изобретения наносят на сорняки или почвы, в которой сорняки бурно разрастаются, достигается превосходное гербицидное действие в течение длительного периода времени, и, таким образом, соответственно этому изобретение было завершено.

Таким образом, настоящее изобретение относится к способу подавления роста нежелательных сорняков, включающему нанесение агрохимической композиции на сорняки или почвы, в которых сорняки разрастаются,

где сорняки принадлежат к семейству, выбранному из группы, состоящей из семейства Onagraceae, семейства Ranunculaceae, семейства Polygonaceae, семейства Portulacaceae, семейства Caryophyllaceae, семейства Chenopodiaceae, семейства Amaranthaceae, семейства Brassicaceae, семейства Fabaceae, семейства Malvaceae, семейства Violet, семейства Rubiaceae, семейства Convolvulaceae, семейства Lamiaceae, семейства Scrophulariaceae, семейства Asteraceae, семейства Boraginaceae, семейства Asclepiadaceae, семейства Euphorbiaceae, семейства Geraniaceae, семейства Oxalidaceae, семейства Cucurbitaceae, семейства Poaceae, семейства Commelinaceae, семейства Equisetaceae, семейства Papaveraceae, семейства Sурегасеае, семейства Lythraceae, семейства Elatinaceae, семейства Сурегасеае, семейства Pontederiaceae, семейства Alismataceae, семейства Potamogetonaceae, семейства Eruocaulaceae, семейства Ариасеае, семейства Asteraceae, семейства Commelinaceae, семейства Characeae, семейства Lemnaceae, семейства Pontederiaceae, семейства Salviniaceae, семейства Araceae, семейства Haloragaceae, семейства Azollaceae, семейства Poaceae, семейства Ариасеае, семейства Hydrocharitaceae, семейства Cabrmbaceae и семейства Lemnaceae; и

агрохимическая композиция содержит эффективное количество производного триазина или его соли и приемлемый для сельского хозяйства носитель, где производное триазина представлено формулой II



Формула II,

где R^1 и R^2 независимо выбраны из C_1 - C_6 алкильной группы или фенильной группы, замещенной одним или несколькими заместителями, выбранными из атомов галогена;

R^4 представляет собой гидроксильную группу и

Y и Z представляют собой атом кислорода.

Способ, в котором почвы являются почвами сельскохозяйственного угодья.

Способ, в котором сельскохозяйственным угодьем является поле или рисовое поле, на котором выращивают сельскохозяйственные и садовые растения.

Действия патента

Изобретение относится к производному триазина, представленному формулой II, или его соли, которое может эффективно подавлять сорняки. Производное триазина изобретения или его соль проявляет превосходное гербицидное действие в борьбе с различными сорняками, которые создают проблему, особенно в сельскохозяйственной области, на протяжении длительного периода времени от предвсходовой стадии до стадии роста, например, широколистными сорняками, подобными белому перцу, *Amaranthus viridis*, мари белой, *Stellaria media*, пупавке, канатику Теофраста, грудинке колючей, *Sesbania*, борщевiku, дикому маку, вьюнку утреннему и дурнишнику, однолетними и многолетними сорняками семейства *Cyperus microiria*, в том числе сыти круглой, съедобной сыти желтоватой, *Kyllinga brevifolia*, вариант *leiolepis*, сыти желтоватой Java и *Cyperus iria*, и злаковыми сорняками, подобными просу японскому, росичке, лисохвосту, копыеносной траве, *Syrian sorghum nitidum*, короткой ости и овсягу. Кроме того, указанное соединение может подавлять сорняки рисовых полей, в том числе однолетние сорняки, такие как *Echinochloa oryzicola*, *Cyperus difformis* и *Monochoria vaginalis*, и многолетние сорняки, такие как *Sagittaria rugmaea*, *Sagittaria trifolia*, *Cyperus serotinus*, *Eleocharis kuroguwai*, *Scirpus hotarui* и *Alisma canaliculatum*.

Кроме того, соединение данного изобретения является исключительно безопасным для полезных сельскохозяйственных культур и полезных растений, в частности риса, пшеницы, ячменя, кукурузы, сорго, сои культурной, хлопка, сахарной свеклы и т.д.

Таким образом, в данном изобретении предлагается агрохимическая композиция, обладающая превосходным действием в качестве гербицида.

Способы осуществления изобретения

Определения терминов, применяемых в настоящем описании, приводятся ниже.

Атом галогена относится к атому фтора, атому хлора, атому брома или атому иода.

Символы, такие как C_1 - C_6 , указывают число атомов углерода в группе заместителей, описанной в контексте ниже. Например, C_1 - C_6 означает 1-6 атомов углерода.

C_1 - C_6 Алкильная группа означает, если не указано иное, неразветвленную или разветвленную алкильную группу, имеющую от 1 до 6 атомов углерода, и ее примеры включают в себя такую группу, как метил, этил, н-пропил, изопропил, н-бутил, втор-бутил, изобутил, трет-бутил, н-пентил, 1-метилбутил, 2-метилбутил, 3-метилбутил, 1-этилпропил, 1,1-диметилпропил, 1,2-диметилпропил, неопентил, н-гексил, 1-метилпентил, 2-метилпентил, 3-метилпентил, 4-метилпентил, 1-этилбутил, 2-этилбутил, 1,1-диметилбутил, 1,2-диметилбутил, 1,3-диметилбутил, 2,2-диметилбутил, 2,3-диметилбутил, 3,3-диметилбутил, 1,1,2-триметилпропил, 1,2,2-триметилпропил, 1-этил-1-метилпропил и 1-этил-2-метилпропил.

Щелочные металлы включают в себя натрий, калий и тому подобное.

В настоящем описании следующие обозначения, включенные в таблицы, означают соответствующую группу соответственно тому, как показано ниже.

Например, Me представляет собой метильную группу, Et представляет собой этильную группу, Pr-n представляет собой н-пропильную группу, Pr-i представляет собой изопропильную группу, Pr-c представляет собой циклопропильную группу, Bu-n представляет собой н-бутильную группу, Bu-s представляет собой вторичную бутильную группу, Bu-i представляет собой изобутильную группу, Bu-t представляет собой трет-бутильную группу, Bu-c представляет собой циклобутильную группу, Pen-n представляет собой н-пентильную группу, Pen-c представляет собой циклопентильную группу, Hex-n представляет собой н-гексильную группу, Hex-c представляет собой циклогексильную группу, Ac представляет собой ацетильную группу, Ph представляет собой фенильную группу, Bn представляет собой бензильную группу, Ts представляет собой п-толуолсульфонильную группу, пиридил представляет собой пиридинильную группу и пиримидинил представляет собой пиримидинильную группу. Кроме того, Ph(2-OMe) представляет собой 2-метоксифенильную группу, $CH_2Ph(2-OMe)$ представляет собой 2-метоксифенильную группу.

пу и Ph(3,4-Cl₂) представляет собой 3,4-дихлорфенильную группу.

Таблица 1

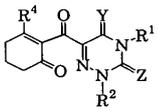
					
№ соединения	R ¹	R ²	Y	Z	R ⁴
I-1	Me	Me	0	0	OH
I-2	Et	Me	0	0	OH
I-3	Pr-n	Me	0	0	OH
I-4	Pr-i	Me	0	0	OH
I-5	Bu-n	Me	0	0	OH
I-6	Bu-i	Me	0	0	OH
I-7	Bu-s	Me	0	0	OH
I-8	Bu-t	Me	0	0	OH
I-9	Hex-n	Me	0	0	OH
I-10	CH ₂ CF ₃	Me	0	0	OH
I-11	CH ₂ CH=CH ₂	Me	0	0	OH
I-12	CH ₂ C(Me)=CH ₂	Me	0	0	OH
I-13	CH ₂ CH ₂ CH=CMe ₂	Me	0	0	OH
I-14	CH ₂ C≡CH	Me	0	0	OH
I-15	CH ₂ C≡CCH ₃	Me	0	0	OH
I-16	Pr-c	Me	0	0	OH
I-17	Bu-c	Me	0	0	OH
I-18	Pen-c	Me	0	0	OH
I-19	Hex-c	Me	0	0	OH
I-20	CH ₂ Pr-c	Me	0	0	OH
I-21	CH ₂ Bu-c	Me	0	0	OH
I-22	CH ₂ Pen-c	Me	0	0	OH
I-23	CH ₂ Hex-c	Me	0	0	OH
I-24	CH ₂ CH=CCl ₂	Me	0	0	OH
I-25	CH ₂ CCl=CHCl	Me	0	0	OH
I-26	CH ₂ CH ₂ CH=CCl ₂	Me	0	0	OH
I-27	CH ₂ CH ₂ C(Me)=CF ₂	Me	0	0	OH
I-28	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ C(Me)=CF ₂	Me	0	0	OH
I-29	CH ₂ CH=CF ₂	Me	0	0	OH
I-30	CH ₂ CH ₂ OMe	Me	0	0	OH
I-31	CH ₂ CH ₂ OEt	Me	0	0	OH
I-32	CH(Me)CH ₂ OMe	Me	0	0	OH
I-33	CH ₂ CH ₂ OCH ₂ CH ₂ OMe	Me	0	0	OH
I-34	CH ₂ CH ₂ OPr-n	Me	0	0	OH
I-35	CH ₂ CH ₂ OPr-i	Me	0	0	OH
I-36	CH ₂ CH ₂ OPr-c	Me	0	0	OH
I-37	CH ₂ CH ₂ OBu-c	Me	0	0	OH
I-38	CH ₂ CH ₂ OPen-c	Me	0	0	OH
I-39	CH ₂ CH ₂ OHex-c	Me	0	0	OH
I-40	CH ₂ CH ₂ OCH ₂ CF ₃	Me	0	0	OH
I-41	CH ₂ CH ₂ CH ₂ OMe	Me	0	0	OH

Таблица 2

№ соединения	R ¹	R ²	Y	Z	R ⁴
I-42	CH=CHMe	Me	0	0	OH
I-43	CH ₂ SMe	Me	0	0	OH
I-44	CH ₂ SP _{r-n}	Me	0	0	OH
I-45	CH ₂ CH ₂ SMe	Me	0	0	OH
I-46	CH ₂ SOMe	Me	0	0	OH
I-47	CH ₂ SO ₂ Me	Me	0	0	OH
I-48	CH ₂ CH ₂ CH ₂ SMe	Me	0	0	OH
I-49	CH ₂ CH ₂ CH ₂ SO ₂ Me	Me	0	0	OH
I-50	Ph	Me	0	0	OH
I-51	Ph(2-Cl)	Me	0	0	OH
I-52	Ph(3-Cl)	Me	0	0	OH
I-53	Ph(4-Cl)	Me	0	0	OH
I-54	Ph(2-F)	Me	0	0	OH
I-55	Ph(3-F)	Me	0	0	OH
I-56	Ph(4-F)	Me	0	0	OH
I-57	Ph(2-Me)	Me	0	0	OH
I-58	Ph(3-Me)	Me	0	0	OH
I-59	Ph(4-Me)	Me	0	0	OH
I-60	Ph(2-OMe)	Me	0	0	OH
I-61	Ph(3-OMe)	Me	0	0	OH
I-62	Ph(4-OMe)	Me	0	0	OH
I-63	Ph(2-CF ₃)	Me	0	0	OH
I-64	Ph(3-CF ₃)	Me	0	0	OH
I-65	Ph(4-CF ₃)	Me	0	0	OH
I-66	Ph(2-NO ₂)	Me	0	0	OH
I-67	Ph(3-NO ₂)	Me	0	0	OH
I-68	Ph(4-NO ₂)	Me	0	0	OH
I-69	Ph(2-OCF ₃)	Me	0	0	OH
I-70	Ph(3-OCF ₃)	Me	0	0	OH
I-71	Ph(4-OCF ₃)	Me	0	0	OH
I-72	Ph(2-CN)	Me	0	0	OH
I-73	Ph(3-CN)	Me	0	0	OH
I-74	Ph(4-CN)	Me	0	0	OH
I-75	Ph(3,4-F ₂)	Me	0	0	OH
I-76	Ph(3,5-F ₂)	Me	0	0	OH
I-77	Ph(2,3-F ₂)	Me	0	0	OH
I-78	Ph(2,4-F ₂)	Me	0	0	OH
I-79	Ph(2,5-F ₂)	Me	0	0	OH
I-80	Ph(2,6-F ₂)	Me	0	0	OH
I-81	Ph(3,4-Cl ₂)	Me	0	0	OH
I-82	Ph(3,5-Cl ₂)	Me	0	0	OH
I-83	Ph(2,3-Cl ₂)	Me	0	0	OH
I-84	Ph(2,4-Cl ₂)	Me	0	0	OH
I-85	Ph(2,5-Cl ₂)	Me	0	0	OH

Таблица 3

№ соединения	R ¹	R ²	Y	Z	R ⁴
I-86	Ph(2,6-Cl ₂)	Me	O	O	OH
I-87	Ph(3,4-Me ₂)	Me	O	O	OH
I-88	Ph(3,5-Me ₂)	Me	O	O	OH
I-89	Ph(2,3-Me ₂)	Me	O	O	OH
I-90	Ph(2,4-Me ₂)	Me	O	O	OH
I-91	Ph(2,5-Me ₂)	Me	O	O	OH
I-92	Ph(2,6-Me ₂)	Me	O	O	OH
I-93	Ph(3,4-OMe ₂)	Me	O	O	OH
I-94	Ph(3,5-OMe ₂)	Me	O	O	OH
I-95	Ph(2,3-OMe ₂)	Me	O	O	OH
I-96	Ph(2,4-OMe ₂)	Me	O	O	OH
I-97	Ph(2,5-OMe ₂)	Me	O	O	OH
I-98	Ph(2,6-OMe ₂)	Me	O	O	OH
I-99	Ph(3-F-4-OMe)	Me	O	O	OH
I-100	Ph(3-F-5-OMe)	Me	O	O	OH
I-101	Ph(2-F-3-OMe)	Me	O	O	OH
I-102	Ph(2-F-4-OMe)	Me	O	O	OH
I-103	Ph(2-F-5-OMe)	Me	O	O	OH
I-104	Ph(2-F-6-OMe)	Me	O	O	OH
I-105	Ph(3-F-4-Me)	Me	O	O	OH
I-106	Ph(3-F-5-Me)	Me	O	O	OH
I-107	Ph(2-F-3-Me)	Me	O	O	OH
I-108	Ph(2-F-4-Me)	Me	O	O	OH
I-109	Ph(2-F-5-Me)	Me	O	O	OH
I-110	Ph(2-F-6-Me)	Me	O	O	OH
I-111	Ph(3-OMe-4-F)	Me	O	O	OH
I-112	Ph(2-OMe-3-F)	Me	O	O	OH
I-113	Ph(2-OMe-4-F)	Me	O	O	OH
I-114	Ph(2-OMe-5-F)	Me	O	O	OH
I-115	Ph(3-Me-4-F)	Me	O	O	OH
I-116	Ph(2-Me-3-F)	Me	O	O	OH
I-117	Ph(2-Me-4-F)	Me	O	O	OH
I-118	Ph(2-Me-5-F)	Me	O	O	OH
I-119	Ph(3-Cl-4-OMe)	Me	O	O	OH
I-120	Ph(3-Cl-5-OMe)	Me	O	O	OH
I-121	Ph(2-Cl-3-OMe)	Me	O	O	OH
I-122	Ph(2-Cl-4-OMe)	Me	O	O	OH
I-123	Ph(2-Cl-5-OMe)	Me	O	O	OH
I-124	Ph(2-Cl-6-OMe)	Me	O	O	OH
I-125	Ph(3-Cl-4-Me)	Me	O	O	OH
I-126	Ph(3-Cl-5-Me)	Me	O	O	OH
I-127	Ph(2-Cl-3-Me)	Me	O	O	OH
I-128	Ph(2-Cl-4-Me)	Me	O	O	OH
I-129	Ph(2-Cl-5-Me)	Me	O	O	OH

Таблица 4

№ соединения	R ¹	R ²	Y	Z	R ⁴
I-130	Ph(2-Cl-6-Me)	Me	O	O	OH
I-131	Ph(3-OMe-4-Cl)	Me	O	O	OH
I-132	Ph(2-OMe-3-Cl)	Me	O	O	OH
I-133	Ph(2-OMe-4-Cl)	Me	O	O	OH
I-134	Ph(2-OMe-5-Cl)	Me	O	O	OH
I-135	Ph(3-Me-4-Cl)	Me	O	O	OH
I-136	Ph(2-Me-3-Cl)	Me	O	O	OH
I-137	Ph(2-Me-4-Cl)	Me	O	O	OH
I-138	Ph(2-Me-5-Cl)	Me	O	O	OH
I-139	Ph(3-F-4-Cl)	Me	O	O	OH
I-140	Ph(3-F-5-Cl)	Me	O	O	OH
I-141	Ph(2-F-3-Cl)	Me	O	O	OH
I-142	Ph(2-F-4-Cl)	Me	O	O	OH
I-143	Ph(2-F-5-Cl)	Me	O	O	OH
I-144	Ph(2-F-6-Cl)	Me	O	O	OH
I-145	Ph(3-Cl-4-F)	Me	O	O	OH
I-146	Ph(2-Cl-3-F)	Me	O	O	OH
I-147	Ph(2-Cl-4-F)	Me	O	O	OH
I-148	Ph(2-Cl-5-F)	Me	O	O	OH
I-149	Ph(3-Me-4-OMe)	Me	O	O	OH
I-150	Ph(3-Me-5-OMe)	Me	O	O	OH
I-151	Ph(2-Me-3-OMe)	Me	O	O	OH
I-152	Ph(2-Me-4-OMe)	Me	O	O	OH
I-153	Ph(2-Me-5-OMe)	Me	O	O	OH
I-154	Ph(2-Me-6-OMe)	Me	O	O	OH
I-155	Ph(3-OMe-4-Me)	Me	O	O	OH
I-156	Ph(2-OMe-3-Me)	Me	O	O	OH
I-157	Ph(2-OMe-4-Me)	Me	O	O	OH
I-158	Ph(2-OMe-5-Me)	Me	O	O	OH
I-159	Ph(3-CN-4-OMe)	Me	O	O	OH
I-160	Ph(3-OMe-4-CN)	Me	O	O	OH
I-161	Ph(3-Me-4-CN)	Me	O	O	OH
I-162	Ph(3-CN-4-Me)	Me	O	O	OH
I-163	Ph(3-NO ₂ -4-OMe)	Me	O	O	OH
I-164	Ph(3-OMe-4-NO ₂)	Me	O	O	OH
I-165	Ph(3-Me-4-NO ₂)	Me	O	O	OH
I-166	Ph(3-NO ₂ -4-Me)	Me	O	O	OH
I-167	Ph(3,5-F ₂ -4-OMe)	Me	O	O	OH
I-168	Ph(3,5-F ₂ -4-Me)	Me	O	O	OH
I-169	Ph(3,4,5-(OMe) ₃)	Me	O	O	OH

Таблица 5

№ соединения	R ¹	R ²	Y	Z	R ⁴
I-170		Me	O	O	OH
I-171		Me	O	O	OH
I-172		Me	O	O	OH
I-173		Me	O	O	OH
I-174		Me	O	O	OH
I-175		Me	O	O	OH
I-176		Me	O	O	OH
I-177		Me	O	O	OH
I-178		Me	O	O	OH
I-179		Me	O	O	OH
I-180		Me	O	O	OH
I-181		Me	O	O	OH
I-182		Me	O	O	OH
I-183		Me	O	O	OH
I-184		Me	O	O	OH

Таблица 6

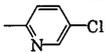
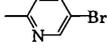
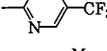
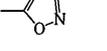
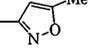
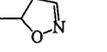
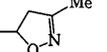
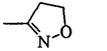
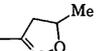
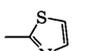
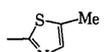
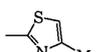
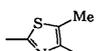
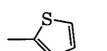
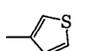
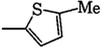
№ соединения	R ¹	R ²	Y	Z	R ⁴
I-185		Me	O	O	OH
I-186		Me	O	O	OH
I-187		Me	O	O	OH
I-188		Me	O	O	OH
I-189		Me	O	O	OH
I-190		Me	O	O	OH
I-191		Me	O	O	OH
I-192		Me	O	O	OH
I-193		Me	O	O	OH
I-194		Me	O	O	OH
I-195		Me	O	O	OH
I-196		Me	O	O	OH
I-197		Me	O	O	OH
I-198		Me	O	O	OH
I-199		Me	O	O	OH
I-200		Me	O	O	OH

Таблица 7

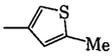
№ соединения	R ¹	R ²	Y	Z	R ⁴
I-201		Me	O	O	OH
I-202		Me	O	O	OH
I-203		Me	O	O	OH
I-204		Me	O	O	OH
I-205	CH ₂ Ph	Me	O	O	OH
I-206	CH ₂ CH ₂ Ph	Me	O	O	OH
I-207	CH ₂ CH ₂ CH ₂ Ph	Me	O	O	OH
I-208	CH ₂ CH=CHPh	Me	O	O	OH
I-209	CH ₂ C≡CPh	Me	O	O	OH
I-210	CH ₂ CH=NOMe	Me	O	O	OH
I-211	CH ₂ CH=NOEt	Me	O	O	OH
I-212	CH ₂ CH=NOPr-n	Me	O	O	OH
I-213	CH ₂ CH=NOPh	Me	O	O	OH
I-214	CH ₂ CH(OMe) ₂	Me	O	O	OH
I-215	CH ₂ CHO	Me	O	O	OH
I-216	NH ₂	Me	O	O	OH
I-217	NHMe	Me	O	O	OH
I-218	NHEt	Me	O	O	OH
I-219	NHPr-n	Me	O	O	OH
I-220	NHPr-i	Me	O	O	OH
I-221	NHBU-n	Me	O	O	OH
I-222	NHBU-i	Me	O	O	OH
I-223	NHBU-s	Me	O	O	OH
I-224	NHCH ₂ Pr-c	Me	O	O	OH
I-225	NHPen-n	Me	O	O	OH
I-226	NHHex-n	Me	O	O	OH
I-227	NHCH ₂ CH ₂ CH ₂ Cl	Me	O	O	OH
I-228	NHCH ₂ CH ₂ CH ₂ F	Me	O	O	OH
I-229	NHCH ₂ CH ₂ OMe	Me	O	O	OH
I-230	NMe ₂	Me	O	O	OH
I-231	NEt ₂	Me	O	O	OH
I-232	N(Pr-n) ₂	Me	O	O	OH
I-233	N(BU-n) ₂	Me	O	O	OH
I-234	N(Me)Et	Me	O	O	OH
I-235	N(Me)CH ₂ CH ₂ OMe	Me	O	O	OH
I-236	NHPh	Me	O	O	OH
I-237	NHCH ₂ Ph	Me	O	O	OH
I-238	N=CMe ₂	Me	O	O	OH
I-239	N=CEt ₂	Me	O	O	OH

Таблица 8

№ соединения	R ¹	R ²	Y	Z	R ⁴
I-240	N=CHNMe ₂	Me	O	O	OH
I-241	NHC(=O)Me	Me	O	O	OH
I-242	N[C(=O)Me] ₂	Me	O	O	OH
I-243	NHC(=O)OMe	Me	O	O	OH
I-244	N[C(=O)OMe] ₂	Me	O	O	OH
I-245	NHSO ₂ Me	Me	O	O	OH
I-246	NHSO ₂ Ph	Me	O	O	OH
I-247	NHSO ₂ CH ₂ Ph	Me	O	O	OH
I-248	OMe	Me	O	O	OH
I-249	OEt	Me	O	O	OH
I-250	OPr-n	Me	O	O	OH
I-251	OPr-i	Me	O	O	OH
I-252	OCH ₂ Pr-c	Me	O	O	OH
I-253	OCH ₂ Cl	Me	O	O	OH
I-254	OCHCl ₂	Me	O	O	OH
I-255	OCCL ₃	Me	O	O	OH
I-256	OCH ₂ F	Me	O	O	OH
I-257	OCHF ₂	Me	O	O	OH
I-258	OCF ₃	Me	O	O	OH
I-259	Ph	Et	O	O	OH
I-260	Ph	Pr-i	O	O	OH
I-261	Ph	CHF ₂	O	O	OH
I-262	Ph	Ph	O	O	OH
I-263	Ph	Me	O	S	OH
I-264	Ph	Me	S	S	OH
I-265	Me	Me	O	S	OH
I-266	Me	Me	S	S	OH
I-267	Ph	Me	O	O	SPh
I-268	Ph(4-OEt)	Me	O	O	OH
I-269	Ph(2-Ph)	Me	O	O	OH
I-270	Ph(3-Ph)	Me	O	O	OH
I-271	Ph(4-Ph)	Me	O	O	OH
I-272		Me	O	O	OH
I-273		Me	O	O	OH
I-274	Me		O	O	OH
I-275	Et		O	O	OH
I-276		Me	O	O	OH

Таблица 9

№ соединения	R ¹	R ²	Y	Z	R ⁴
I-277		Me	O	O	OH
I-278		Me	O	O	OH
I-279		Me	O	O	OH
I-280		Me	O	O	OH
I-281		Me	O	O	OH
I-282	Ph(2-Me-4-Br)	Me	O	O	OH
I-283	Ph(2-Me-4-I)	Me	O	O	OH
I-284	Ph(2-Me-5-CF ₃)	Me	O	O	OH
I-285	Ph(2-Me-6-OCF ₃)	Me	O	O	OH
I-286	Ph(2-Pr-i)	Me	O	O	OH
I-287		Me	O	O	OH
I-288	Ph(2-Et)	Me	O	O	OH
I-289		Me	O	O	OH
I-290		Me	O	O	OH
I-291		Me	O	S	OH
I-292		Me	O	O	OH
I-293		Me	O	O	OH
I-294	CH ₂ COOBu ^t	Me	O	O	OH
I-295	(C ₇ H ₁₄)CH ₃	Me	O	O	OH
I-296	(C ₉ H ₁₈)CH ₃	Me	O	O	OH
I-297	Ph(2-F,4-Cl,5-OMe)	Me	O	O	OH
I-298	Ph(2,3,4-(OMe) ₃)	Me	O	O	OH
I-299	Ph(3,5-Cl ₂ -4-OMe)	Me	O	O	OH
I-300	Ph(3,5-Cl ₂ -4-SMe)	Me	O	O	OH
I-301	Ph(3,5-Cl ₂ -4-SO ₂ Me)	Me	O	O	OH
I-302	Ph(3,4,5-F ₃)	Me	O	O	OH
I-303		Me	O	O	OH

Таблица 10

№ соединения	R ¹	R ²	Y	Z	R ⁴
I-304		Me	0	0	OH
I-305		Me	0	0	OH
I-306	Bu·n		0	0	OH
I-307	CH ₂ CH(CH ₃) ₂		0	0	OH
I-308	Ph	Pen·n	0	0	OH
I-309	H	Me	0	0	OH
I-310	CH ₂ C≡CF	Me	0	0	OH
I-311		Me	0	0	OH
I-312		Me	0	0	OH
I-313	CH ₂ NH ₂	Me	0	0	OH
I-314	CH ₂ NO ₂	Me	0	0	OH
I-315	CH ₂ NHCH ₃	Me	0	0	OH
I-316	CH ₂ N(CH ₃) ₂	Me	0	0	OH
I-317	CH ₂ SCH ₂ CF ₃	Me	0	0	OH
I-318	CH ₂ SOCH ₂ CF ₃	Me	0	0	OH
I-319	CH ₂ SO ₂ CH ₂ CF ₃	Me	0	0	OH
I-320	CH ₂ OH	Me	0	0	OH
I-321	CH ₂ OBn	Me	0	0	OH
I-322	CH ₂ OCH ₂ Pr ^c	Me	0	0	OH
I-323	CH ₂ OPh	Me	0	0	OH
I-324	CH ₂ SPh	Me	0	0	OH
I-325	CH ₂ SOPh	Me	0	0	OH
I-326	CH ₂ SO ₂ Ph	Me	0	0	OH
I-327	CH ₂ CON(CH ₃) ₂	Me	0	0	OH
I-328	CH ₂ COCH ₃	Me	0	0	OH
I-329	CH ₂ OCOCH ₃	Me	0	0	OH
I-330	CH ₂ ON=CHCH ₃	Me	0	0	OH
I-331	C ₂ H ₄ OC ₂ H ₄ SCH ₃	Me	0	0	OH
I-332	C ₂ H ₄ OC ₂ H ₄ SOCH ₃	Me	0	0	OH
I-333	C ₂ H ₄ OC ₂ H ₄ SO ₂ CH ₃	Me	0	0	OH
I-334	CH ₂ OCH ₂ CN	Me	0	0	OH
I-335	CH ₂ CN	Me	0	0	OH
I-336	OCH ₂ CH=CH ₂	Me	0	0	OH
I-337	OCH ₂ C≡CH	Me	0	0	OH
I-338	OPr ^c	Me	0	0	OH

Таблица 11

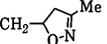
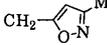
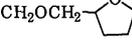
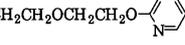
№ соединения	R ¹	R ²	Y	Z	R ⁴
I-339		Me	0	0	OH
I-340		Me	0	0	OH
I-341		Me	0	0	OH
I-342		Me	0	0	OH
I-343		Me	0	0	OH
I-344	Ph	H	0	0	OH
I-345	Ph	CH ₂ CH=CH ₂	0	0	OH
I-346	Ph	CH ₂ C≡CH	0	0	OH
I-347	Ph	Pr-c	0	0	OH
I-348	Ph	CH ₂ CH=CF ₂	0	0	OH
I-349	Ph	CH ₂ C≡CF	0	0	OH
I-350	Ph	C ₂ H ₄ OCH ₃	0	0	OH
I-351	Ph	C ₂ H ₄ OC ₂ H ₅	0	0	OH
I-352	Ph	CH(Me)OEt	0	0	OH
I-353	Ph	CH ₂ OPr-c	0	0	OH
I-354	Ph	CH(OCH ₃) ₂	0	0	OH
I-355	Ph	CH ₂ Ph	0	0	OH
I-356	Ph		0	0	OH
I-357	Ph		0	0	OH
I-358	Ph	Me	0	0	NH ₂
I-359	Ph	Me	0	0	Cl
I-360	Ph	Me	0	0	CN
I-361	Ph	Me	0	0	NCS
I-362	Ph	Me	0	0	NCO
I-363	Ph	Me	0	0	OCO ₂ H
I-364	Ph	Me	0	0	OCO ₂ CH ₃
I-365	Ph	Me	0	0	OCO ₂ CH ₂ Ph
I-366	Ph	Me	0	0	OMe
I-367	Ph	Me	0	0	OEt
I-368	Ph	Me	0	0	OPr
I-369	Ph	Me	0	0	OCH ₂ CH=CH ₂
I-370	Ph	Me	0	0	OCH ₂ C≡CH
I-371	Ph	Me	0	0	OPr-c
I-372	Ph	Me	0	0	OBu-c
I-373	Ph	Me	0	0	OPen-c

Таблица 12

№ соединения	R ¹	R ²	Y	Z	R ⁴
I-374	Ph	Me	O	O	OHex-c
I-375	Ph	Me	O	O	OCH ₂ CN
I-376	Ph	Me	O	O	OCH ₂ Pr-c
I-377	Ph	Me	O	O	OCOCH ₃
I-378	Ph	Me	O	O	OCOCCL ₃
I-379	Ph	Me	O	O	OCOCH=CH ₂
I-380	Ph	Me	O	O	OCOCH=CF ₂
I-381	Ph	Me	O	O	OCOCH ₂ C≡CH
I-382	Ph	Me	O	O	OCOCH ₂ C≡CF
I-383	Ph	Me	O	O	OCH ₂ CO ₂ CH ₃
I-384	Ph	Me	O	O	OPh
I-385	Ph	Me	O	O	OCH ₂ Ph
I-386	Ph	Me	O	O	OCOPh
I-387	Ph	Me	O	O	OCOCH ₂ Ph
I-388	Ph	Me	O	O	OCH ₂ COPh
I-389	Ph	Me	O	O	OSO ₂ CH ₂ CF ₃
I-390	Ph	Me	O	O	OSO ₂ CH ₂ Ph
I-391	Ph	Me	O	O	SCH ₃
I-392	Ph	Me	O	O	SOCH ₃
I-393	Ph	Me	O	O	SO ₂ CH ₃
I-394	Ph	Me	O	O	SCH ₂ CF ₃
I-395	Ph	Me	O	O	SOCH ₂ CF ₃
I-396	Ph	Me	O	O	SO ₂ CH ₂ CF ₃
I-397	Ph	Me	O	O	SCH ₂ CH=CH ₂
I-398	Ph	Me	O	O	SOCH ₂ CH=CH ₂
I-399	Ph	Me	O	O	SO ₂ CH ₂ CH=CH ₂
I-400	Ph	Me	O	O	SCH ₂ CH=CH
I-401	Ph	Me	O	O	SOCH ₂ CH≡CH
I-402	Ph	Me	O	O	SO ₂ CH ₂ CH≡CH
I-403	Ph	Me	O	O	SCH ₂ Ph
I-404	Ph	Me	O	O	SOPh
I-405	Ph	Me	O	O	SOCH ₂ Ph
I-406	Ph	Me	O	O	SO ₂ Ph
I-407	Ph	Me	O	O	SO ₂ CH ₂ Ph
I-408	Ph	Me	O	O	NHCH ₃
I-409	Ph	Me	O	O	N(CH ₃) ₂
I-410	Ph	Me	O	O	NHCOCH ₃
I-411	Ph	Me	O	O	OCH ₂ CH ₂ - 
I-412	Ph	Me	O	O	- 

Таблица 13

№ соединения	R ¹	R ²	Y	Z	R ⁴
I-413	Ph	Me	0	0	
I-414	Ph	Me	0	0	
I-415	Ph	Me	0	0	
I-416	Ph	Me	0	0	
I-417	(4-Pr-c)Ph	Me	0	0	OH
I-418	(4-CH ₂ Pr-c)Ph	Me	0	0	OH
I-419	(4-CH ₂ =CHCH ₂)Ph	Me	0	0	OH
I-420	(4-CH≡CCH ₂)Ph	Me	0	0	OH
I-421	(4-CH ₂ CH=CF ₂)Ph	Me	0	0	OH
I-422	(4-CH ₂ CH≡CF)Ph	Me	0	0	OH
I-423		Me	0	0	OH
I-424		Me	0	0	OH
I-425		Me	0	0	OH
I-426		Me	0	0	OH
I-427		Me	0	0	OH
I-428		Me	0	0	OH
I-429	(4-OCHF ₂)Ph	Me	0	0	OH
I-430	(4-SMe)Ph	Me	0	0	OH
I-431	(4-SOMe)Ph	Me	0	0	OH
I-432	(4-SO ₂ Me)Ph	Me	0	0	OH
I-433	(4-SCF ₃)Ph	Me	0	0	OH
I-434	(4-SOCF ₃)Ph	Me	0	0	OH
I-435	(4-SO ₂ CF ₃)Ph	Me	0	0	OH
I-436		Me	0	0	OH
I-437		Me	0	0	OH

Таблица 14

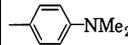
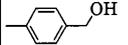
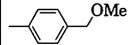
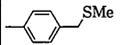
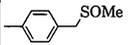
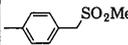
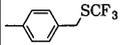
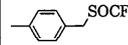
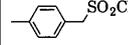
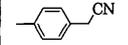
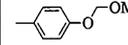
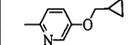
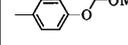
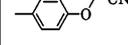
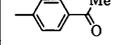
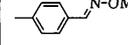
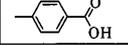
№ соединения	R ¹	R ²	Y	Z	R ⁴
I-438		Me	O	O	OH
I-439		Me	O	O	OH
I-440		Me	O	O	OH
I-441		Me	O	O	OH
I-442		Me	O	O	OH
I-443		Me	O	O	OH
I-444		Me	O	O	OH
I-445		Me	O	O	OH
I-446		Me	O	O	OH
I-447		Me	O	O	OH
I-448		Me	O	O	OH
I-449		Me	O	O	OH
I-450		Me	O	O	OH
I-451		Me	O	O	OH
I-452		Me	O	O	OH
I-453		Me	O	O	OH
I-454		Me	O	O	OH
I-455		Me	O	O	OH

Таблица 15

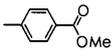
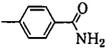
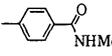
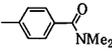
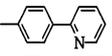
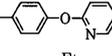
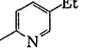
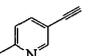
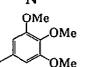
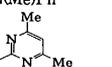
№ соединения	R ¹	R ²	Y	Z	R ⁴
I-456		Me	O	O	OH
I-457		Me	O	O	OH
I-458		Me	O	O	OH
I-459		Me	O	O	OH
I-460		Me	O	O	OH
I-461		Me	O	O	OH
I-462		Me	O	O	OH
I-463		Me	O	O	OH
I-464		Me	O	S	OH
I-465	Ph(3,4,5-Cl)	Me	O	O	OH
I-466	N(Me)Ph	Me	O	O	OH
I-467		Me	O	O	OH
I-468	CH ₂ CO(Bu-t)	Me	O	O	OH
I-469	Ph(2,3,5,6-F ₄)	Me	O	O	OH
I-470	Ph[(3,5-(CF ₃) ₂)]	Me	O	O	OH
I-471	CH ₂ C(Me)=NOMe	Me	O	O	OH
I-472	Ph(2,4,6-Me ₃)	Me	O	O	OH
I-473	Ph(2,3,4,5,6-F ₅)	Me	O	O	OH
I-474	N(Et)Ph	Me	O	O	OH
I-475	N(Pr-i)Ph	Me	O	O	OH
I-476	N(Me)Ph(4-F)	Me	O	O	OH
I-477	Ph	CH ₂ CF ₃	O	O	OH
I-478	CH ₂ C(Me)=NOEt	Me	O	O	OH
I-479	CH ₂ C(Me)=NO(Pr-i)	Me	O	O	OH
I-480	Ph(4-F)	Me	O	S	OH

Таблица 16

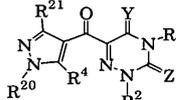
							
№ соединения	R ¹	R ²	Y	Z	R ²⁰	R ²¹	R ⁴
II-1	Me	Me	O	O	Me	H	OH
II-2	Et	Me	O	O	Me	Me	OH
II-3	Pr-n	Me	O	O	Me	H	OH
II-4	Pr-i	Me	O	O	Me	H	OH
II-5	Bu-n	Me	O	O	Me	H	OH
II-6	Bu-i	Me	O	O	Me	H	OH
II-7	Bu-s	Me	O	O	Me	Me	OH
II-8	Bu-t	Me	O	O	Me	H	OSO ₂ Pr
II-9	Hex-n	Me	O	O	Me	H	OH
II-10	CH ₂ CF ₃	Me	O	O	Me	H	OH
II-11	CH ₂ CH=CH ₂	Me	O	O	Et	H	OH
II-12	CH ₂ C(Me)=CH ₂	Me	O	O	Me	H	OH
II-13	CH ₂ CH ₂ CH=CMe ₂	Me	O	O	Me	H	OH
II-14	CH ₂ C≡CH	Me	O	O	Me	Me	OH
II-15	CH ₂ C≡CCH ₃	Me	O	O	Me	H	OSO ₂ Ph
II-16	Pr-c	Me	O	O	Me	H	OH
II-17	Bu-c	Me	O	O	i-Pr	H	OH
II-18	Pen-c	Me	O	O	Me	H	OH
II-19	Hex-c	Me	O	O	Et	H	OH
II-20	CH ₂ Pr-c	Me	O	O	Me	H	OH
II-21	CH ₂ Bu-c	Me	O	O	Me	H	OH
II-22	CH ₂ Pen-c	Me	O	O	Me	Me	OH
II-23	CH ₂ Hex-c	Me	O	O	Me	H	OH
II-24	CH ₂ CH=CCl ₂	Me	O	O	Me	H	OSO ₂ Pr
II-25	CH ₂ CCl=CHCl	Me	O	O	Me	H	OH
II-26	CH ₂ CH ₂ CH=CCl ₂	Me	O	O	Et	H	OH
II-27	CH ₂ CH ₂ C(Me)=CF ₂	Me	O	O	Me	H	OH
II-28	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ C(Me)=CF ₂	Me	O	O	Me	H	OH
II-29	CH ₂ CH=CF ₂	Me	O	O	Me	Me	OH
II-30	CH ₂ CH ₂ OMe	Me	O	O	Me	H	OH
II-31	CH ₂ CH ₂ OEt	Me	O	O	Me	H	OH
II-32	CH(Me)CH ₂ OMe	Me	O	O	Pr-i	H	OH
II-33	CH ₂ CH ₂ OCH ₂ CH ₂ OMe	Me	O	O	Me	H	OH
II-34	CH ₂ CH ₂ OPr-n	Me	O	O	Et	H	OH
II-35	CH ₂ CH ₂ OPr-i	Me	O	O	Me	H	OH
II-36	CH ₂ CH ₂ OPr-c	Me	O	O	Me	Me	OH
II-37	CH ₂ CH ₂ OBu-c	Me	O	O	Me	H	OH
II-38	CH ₂ CH ₂ OPen-c	Me	O	O	Me	H	OH
II-39	CH ₂ CH ₂ OHex-c	Me	O	O	Me	H	OH

Таблица 17

№ соединения	R ¹	R ²	Y	Z	R ²⁰	R ²¹	R ⁴
II-40	CH ₂ CH ₂ OCH ₂ CF ₃	Me	O	O	Et	Me	OH
II-41	CH ₂ CH ₂ CH ₂ OMe	Me	O	O	Me	H	OH
II-42	CH=CHMe	Me	O	O	Me	H	OSO ₂ Ph
II-43	CH ₂ SMe	Me	O	O	Me	H	OH
II-44	CH ₂ SPr ⁿ	Me	O	O	Me	H	OH
II-45	CH ₂ CH ₂ SMe	Me	O	O	Pr ⁱ	H	OH
II-46	CH ₂ CH ₂ SOMe	Me	O	O	Me	H	OH
II-47	CH ₂ CH ₂ SO ₂ Me	Me	O	O	Me	Me	OH
II-48	CH ₂ CH ₂ CH ₂ SMe	Me	O	O	Et	H	OH
II-49	CH ₂ CH ₂ CH ₂ SO ₂ Me	Me	O	O	Me	H	OH
II-50	Ph	Me	O	O	Me	H	OH
II-51	Ph(2-Cl)	Me	O	O	Me	H	OH
II-52	Ph(3-Cl)	Me	O	O	Me	H	OH
II-53	Ph(4-Cl)	Me	O	O	Me	H	OSO ₂ Pr
II-54	Ph(2-F)	Me	O	O	Pr ⁱ	H	OH
II-55	Ph(3-F)	Me	O	O	Me	H	OH
II-56	Ph(4-F)	Me	O	O	Me	H	OH
II-57	Ph(2-Me)	Me	O	O	Me	Me	OH
II-58	Ph(3-Me)	Me	O	O	Me	H	OH
II-59	Ph(4-Me)	Me	O	O	Et	H	OH
II-60	Ph(2-OMe)	Me	O	O	Me	H	OH
II-61	Ph(3-OMe)	Me	O	O	Me	H	OH
II-62	Ph(4-OMe)	Me	O	O	Me	H	OH
II-63	Ph(2-CF ₃)	Me	O	O	Me	H	OH
II-64	Ph(3-CF ₃)	Me	O	O	Pr ⁱ	H	OSO ₂ Ph
II-65	Ph(4-CF ₃)	Me	O	O	Me	H	OH
II-66	Ph(2-NO ₂)	Me	O	O	Me	H	OH
II-67	Ph(3-NO ₂)	Me	O	O	Me	H	OH
II-68	Ph(4-NO ₂)	Me	O	O	Me	Me	OH
II-69	Ph(2-OCF ₃)	Me	O	O	Me	H	OH
II-70	Ph(3-OCF ₃)	Me	O	O	Et	H	OH
II-71	Ph(4-OCF ₃)	Me	O	O	Me	H	OH
II-72	Ph(2-CN)	Me	O	O	Me	H	OH
II-73	Ph(3-CN)	Me	O	O	Me	H	OH
II-74	Ph(4-CN)	Me	O	O	Me	H	OH
II-75	Ph(3,4-F ₂)	Me	O	O	Pr ⁱ	H	OH
II-76	Ph(3,5-F ₂)	Me	O	O	Me	H	OH
II-77	Ph(2,3-F ₂)	Me	O	O	Me	Me	OSO ₂ Pr
II-78	Ph(2,4-F ₂)	Me	O	O	Me	H	OH
II-79	Ph(2,5-F ₂)	Me	O	O	Me	H	OH

Таблица 18

№ соединения	R ¹	R ²	Y	Z	R ²⁰	R ²¹	R ⁴
II-80	Ph(2,6-F ₂)	Me	O	O	Et	Me	OH
II-81	Ph(3,4-Cl ₂)	Me	O	O	Me	H	OH
II-82	Ph(3,5-Cl ₂)	Me	O	O	Me	H	OH
II-83	Ph(2,3-Cl ₂)	Me	O	O	Me	H	OH
II-84	Ph(2,4-Cl ₂)	Me	O	O	Me	H	OH
II-85	Ph(2,5-Cl ₂)	Me	O	O	Pr-i	H	OH
II-86	Ph(2,6-Cl ₂)	Me	O	O	Me	H	OH
II-87	Ph(3,4-Me ₂)	Me	O	O	Me	H	OH
II-88	Ph(3,5-Me ₂)	Me	O	O	Me	H	OH
II-89	Ph(2,3-Me ₂)	Me	O	O	Me	Me	OH
II-90	Ph(2,4-Me ₂)	Me	O	O	Me	H	OH
II-91	Ph(2,5-Me ₂)	Me	O	O	Me	H	OH
II-92	Ph(2,6-Me ₂)	Me	O	O	Me	H	OH
II-93	Ph(3,4-(OMe) ₂)	Me	O	O	Me	H	OH
II-94	Ph(3,5-(OMe) ₂)	Me	O	O	Me	H	OH
II-95	Ph(2,3-(OMe) ₂)	Me	O	O	Me	H	OH
II-96	Ph(2,4-(OMe) ₂)	Me	O	O	Pr-i	H	OH
II-97	Ph(2,5-(OMe) ₂)	Me	O	O	Me	H	OSO ₂ Ph
II-98	Ph(2,6-(OMe) ₂)	Me	O	O	Me	H	OH
II-99	Ph(3-F-4-OMe)	Me	O	O	Me	Me	OH
II-100	Ph(3-F-5-OMe)	Me	O	O	Me	H	OH
II-101	Ph(2-F-3-OMe)	Me	O	O	Me	H	OH
II-102	Ph(2-F-4-OMe)	Me	O	O	Me	H	OH
II-103	Ph(2-F-5-OMe)	Me	O	O	Me	H	OH
II-104	Ph(2-F-6-OMe)	Me	O	O	Me	H	OH
II-105	Ph(3-F-4-Me)	Me	O	O	Me	H	OSO ₂ Pr
II-106	Ph(3-F-5-Me)	Me	O	O	Me	H	OH
II-107	Ph(2-F-3-Me)	Me	O	O	Me	H	OH
II-108	Ph(2-F-4-Me)	Me	O	O	Me	H	OH
II-109	Ph(2-F-5-Me)	Me	O	O	Me	Me	OH
II-110	Ph(2-F-6-Me)	Me	O	O	Me	H	OH
II-111	Ph(3-OMe-4-F)	Me	O	O	Me	H	OH
II-112	Ph(2-OMe-3-F)	Me	O	O	Pr-i	H	OSO ₂ Ph(4-Me)
II-113	Ph(2-OMe-4-F)	Me	O	O	Me	H	OH
II-114	Ph(2-OMe-5-F)	Me	O	O	Me	H	OH
II-115	Ph(3-Me-4-F)	Me	O	O	Me	H	OH
II-116	Ph(2-Me-3-F)	Me	O	O	Me	H	OH
II-117	Ph(2-Me-4-F)	Me	O	O	Me	H	OH
II-118	Ph(2-Me-5-F)	Me	O	O	Me	H	OH
II-119	Ph(3-Cl-4-OMe)	Me	O	O	Me	Me	OH
II-120	Ph(3-Cl-5-OMe)	Me	O	O	Me	H	OH

Таблица 19

№ соединения	R ¹	R ²	Y	Z	R ²⁰	R ²¹	R ⁴
II-121	Ph(2-Cl-3-OMe)	Me	O	O	Me	H	OH
II-122	Ph(2-Cl-4-OMe)	Me	O	O	Me	H	OSO ₂ Ph(4-Me)
II-123	Ph(2-Cl-5-OMe)	Me	O	O	Pr-i	H	OH
II-124	Ph(2-Cl-6-OMe)	Me	O	O	Me	H	OH
II-125	Ph(3-Cl-4-Me)	Me	O	O	Me	H	OH
II-126	Ph(3-Cl-5-Me)	Me	O	O	Me	Me	OH
II-127	Ph(2-Cl-3-Me)	Me	O	O	Me	H	OH
II-128	Ph(2-Cl-4-Me)	Me	O	O	Me	H	OH
II-129	Ph(2-Cl-5-Me)	Me	O	O	Me	H	OH
II-130	Ph(2-Cl-6-Me)	Me	O	O	Me	H	OH
II-131	Ph(3-OMe-4-Cl)	Me	O	O	Me	H	OH
II-132	Ph(2-OMe-3-Cl)	Me	O	O	Me	H	OSO ₂ Ph
II-133	Ph(2-OMe-4-Cl)	Me	O	O	Pr-i	H	OH
II-134	Ph(2-OMe-5-Cl)	Me	O	O	Me	H	OH
II-135	Ph(3-Me-4-Cl)	Me	O	O	Me	Me	OH
II-136	Ph(2-Me-3-Cl)	Me	O	O	Me	H	OH
II-137	Ph(2-Me-4-Cl)	Me	O	O	Me	H	OH
II-138	Ph(2-Me-5-Cl)	Me	O	O	Me	H	OH
II-139	Ph(3-F-4-Cl)	Me	O	O	Me	H	OSO ₂ Ph(4-Me)
II-140	Ph(3-F-5-Cl)	Me	O	O	Me	H	OH
II-141	Ph(2-F-3-Cl)	Me	O	O	Me	H	OH
II-142	Ph(2-F-4-Cl)	Me	O	O	Me	H	OH
II-143	Ph(2-F-5-Cl)	Me	O	O	Me	H	OH
II-144	Ph(2-F-6-Cl)	Me	O	O	Me	H	OH
II-145	Ph(3-Cl-4-F)	Me	O	O	Me	H	OH
II-146	Ph(2-Cl-3-F)	Me	O	O	Me	Me	OH
II-147	Ph(2-Cl-4-F)	Me	O	O	Me	H	OH
II-148	Ph(2-Cl-5-F)	Me	O	O	Pr-i	H	OH
II-149	Ph(3-Me-4-OMe)	Me	O	O	Me	H	OH
II-150	Ph(3-Me-5-OMe)	Me	O	O	Me	H	OH
II-151	Ph(2-Me-3-OMe)	Me	O	O	Me	H	OSO ₂ Ph(4-Me)
II-152	Ph(2-Me-4-OMe)	Me	O	O	Me	H	OH
II-153	Ph(2-Me-5-OMe)	Me	O	O	Me	H	OH
II-154	Ph(2-Me-6-OMe)	Me	O	O	Me	H	OH
II-155	Ph(3-OMe-4-Me)	Me	O	O	Me	Me	OH
II-156	Ph(2-OMe-3-Me)	Me	O	O	Me	H	OH
II-157	Ph(2-OMe-4-Me)	Me	O	O	Me	H	OH
II-158	Ph(2-OMe-5-Me)	Me	O	O	Me	Me	OH
II-159	Ph(3-CN-4-OMe)	Me	O	O	Me	H	OH
II-160	Ph(3-OMe-4-CN)	Me	O	O	Me	H	OH
II-161	Ph(3-Me-4-CN)	Me	O	O	Pr-i	H	OSO ₂ Ph(4-Me)

Таблица 20

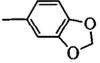
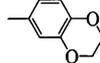
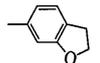
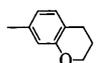
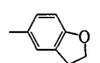
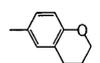
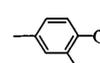
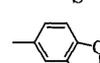
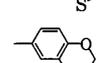
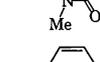
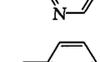
№ соединения	R ¹	R ²	Y	Z	R ²⁰	R ²¹	R ⁴
II-162	Ph(3-CN·4·Me)	Me	O	O	Me	H	OH
II-163	Ph(3-NO ₂ ·4·OMe)	Me	O	O	Me	H	OH
II-164	Ph(3-OMe·4·NO ₂)	Me	O	O	Me	H	OH
II-165	Ph(3-Me·4·NO ₂)	Me	O	O	Me	H	OH
II-166	Ph(3-NO ₂ ·4·Me)	Me	O	O	Me	H	OH
II-167	Ph(3,5-F ₂ ·5·OMe)	Me	O	O	Me	H	OH
II-168	Ph(3,5-F ₂ ·5·Me)	Me	O	O	Me	Me	OH
II-169	Ph(3,4,5-(OMe) ₃)	Me	O	O	Me	H	OH
II-170		Me	O	O	Me	H	OH
II-171		Me	O	O	Me	H	OH
II-172		Me	O	O	Pr-i	H	OSO ₂ Ph(4-Me)
II-173		Me	O	O	Me	H	OH
II-174		Me	O	O	Me	H	OH
II-175		Me	O	O	Me	Me	OH
II-176		Me	O	O	Me	H	OH
II-177		Me	O	O	Me	H	OH
II-178		Me	O	O	Me	H	OH
II-179		Me	O	O	Me	H	OH
II-180		Me	O	O	Me	H	OH

Таблица 21

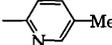
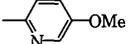
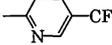
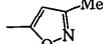
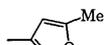
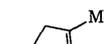
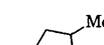
№ соединения	R ¹	R ²	Y	Z	R ²⁰	R ²¹	R ⁴
II-181		Me	O	O	Me	H	OH
II-182		Me	O	O	Me	H	OH
II-183		Me	O	O	Me	H	OH
II-184		Me	O	O	Pr-i	H	OH
II-185		Me	O	O	Me	Me	OH
II-186		Me	O	O	Me	H	OH
II-187		Me	O	O	Me	H	OH
II-188		Me	O	O	Me	H	OH
II-189		Me	O	O	Me	H	OSO ₂ Ph(4-Me)
II-190		Me	O	O	Me	H	OH
II-191		Me	O	O	Me	H	OH
II-192		Me	O	O	Me	H	OH
II-193		Me	O	O	Me	H	OH
II-194		Me	O	O	Me	H	OH

Таблица 22

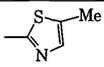
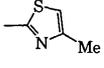
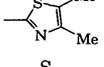
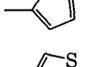
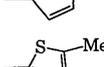
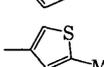
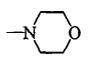
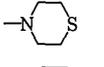
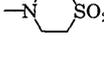
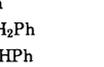
№ соединения	R ¹	R ²	Y	Z	R ²⁰	R ²¹	R ⁴
II-195		Me	O	O	Me	H	OH
II-196		Me	O	O	Me	H	OH
II-197		Me	O	O	Me	H	OH
II-198		Me	O	O	Me	H	OH
II-199		Me	O	O	Pr-i	Me	OH
II-200		Me	O	O	Me	H	OH
II-201		Me	O	O	Me	H	OH
II-202		Me	O	O	Me	H	OH
II-203		Me	O	O	Me	H	OH
II-204		Me	O	O	Me	Me	OH
II-205	CH ₂ Ph	Me	O	O	Me	H	OH
II-206	CH ₂ CH ₂ Ph	Me	O	O	Me	H	OH
II-207	CH ₂ CH ₂ CH ₂ Ph	Me	O	O	Me	H	OH
II-208	CH ₂ CH=CHPh	Me	O	O	Me	H	OH
II-209	CH ₂ C≡CPh	Me	O	O	Me	H	OH
II-210	CH ₂ CH=NOMe	Me	O	O	Me	H	OH
II-211	CH ₂ CH=NOEt	Me	O	O	Me	H	OH
II-212	CH ₂ CH=NOPr ⁿ	Me	O	O	Me	H	OH
II-213	CH ₂ CH=NOPh	Me	O	O	Me	Me	OH
II-214	CH ₂ CH(OMe) ₂	Me	O	O	Me	H	OH
II-215	CH ₂ CHO	Me	O	O	Et	H	OH
II-216	NH ₂	Me	O	O	Me	H	OH
II-217	NHMe	Me	O	O	Me	H	OH
II-218	NHEt	Me	O	O	Me	H	OH

Таблица 23

№ соединения	R ¹	R ²	Y	Z	R ²⁰	R ²¹	R ⁴
II-219	NHPr-n	Me	O	O	Me	H	OSO ₂ Ph(4-Me)
II-220	NHPr-i	Me	O	O	Me	H	OH
II-221	NHBu-n	Me	O	O	Pr-i	H	OH
II-222	NHBu-i	Me	O	O	Me	H	OH
II-223	NHBu-s	Me	O	O	Me	Me	OH
II-224	NHCH ₂ Pr-c	Me	O	O	Me	H	OH
II-225	NHPen-n	Me	O	O	Me	H	OH
II-226	NHHex-n	Me	O	O	Me	H	OH
II-227	NHCH ₂ CH ₂ CH ₂ Cl	Me	O	O	Me	H	OH
II-228	NHCH ₂ CH ₂ CH ₂ F	Me	O	O	Me	H	OH
II-229	NHCH ₂ CH ₂ OMe	Me	O	O	Me	H	OH
II-230	NMe ₂	Me	O	O	Me	H	OH
II-231	NEt ₂	Me	O	O	Me	H	OH
II-232	N(Pr-n) ₂	Me	O	O	Me	H	OH
II-233	N(Bu-n) ₂	Me	O	O	Me	H	OH
II-234	N(Me)Et	Me	O	O	Me	Me	OH
II-235	N(Me)CH ₂ CH ₂ OMe	Me	O	O	Et	H	OH
II-236	NHPh	Me	O	O	Me	H	OH
II-237	NHCH ₂ Ph	Me	O	O	Me	H	OH
II-238	N=CMe ₂	Me	O	O	Me	H	OH
II-239	N=CEt ₂	Me	O	O	Me	H	OSO ₂ Ph(4-Me)
II-240	N=CHNMe ₂	Me	O	O	Me	H	OH
II-241	NHC(=O)Me	Me	O	O	Me	H	OH
II-242	N[C(=O)Me] ₂	Me	O	O	Me	H	OH
II-243	NHC(=O)OMe	Me	O	O	Pr-i	H	OH
II-244	N[C(=O)OMe] ₂	Me	O	O	Me	H	OH
II-245	NHSO ₂ Me	Me	O	O	Me	H	OH
II-246	NHSO ₂ Ph	Me	O	O	Me	Me	OH
II-247	NHSO ₂ CH ₂ Ph	Me	O	O	Me	H	OH
II-248	OMe	Me	O	O	Et	H	OH
II-249	OEt	Me	O	O	Me	H	OH
II-250	OPr-n	Me	O	O	Me	H	OH
II-251	OPr-i	Me	O	O	Me	H	OH
II-252	OCH ₂ Pr-c	Me	O	O	Me	H	OH
II-253	OCH ₂ Cl	Me	O	O	Me	H	OH
II-254	OCHCl ₂	Me	O	O	Me	H	OH
II-255	OCCL ₃	Me	O	O	Me	Me	OH
II-256	OCH ₂ F	Me	O	O	Me	H	OH
II-257	OCHF ₂	Me	O	O	Me	H	OH
II-258	OCF ₃	Me	O	O	Me	H	OSO ₂ Ph(4-Me)
II-259	Ph	Et	O	O	Et	H	OH
II-260	Ph	Pr-i	O	O	Me	H	OH
II-261	Ph	CHF ₂	O	O	Me	H	OH

Таблица 24

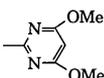
№ соединения	R ¹	R ²	Y	Z	R ²⁰	R ²¹	R ⁴
II-262	Ph	Ph	O	O	Me	H	OH
II-263	Ph	Me	O	S	Me	Me	OH
II-264	Ph	Me	S	S	Me	H	OH
II-265	Me	Me	O	S	Me	H	OH
II-266	Me	Me	S	S	Me	H	OH
II-267	Ph	Me	O	O	Pr-i	H	OSO ₂ Pr
II-268	Ph(4-OEt)	Me	O	O	Me	H	OH
II-269	Ph(2-Ph)	Me	O	O	Me	H	OH
II-270	Ph(3-Ph)	Me	O	O	Me	H	OH
II-271	Ph(4-Ph)	Me	O	O	Me	H	OH
II-272		Me	O	O	Me	Me	OH
II-273		Me	O	O	Et	H	OSO ₂ Ph(4-Me)
II-274	Me		O	O	Me	H	OH
II-275	Et		O	O	Me	H	OH
II-276	H	Me	O	O	Me	H	OH
II-277	CH ₂ C≡CF	Me	O	O	Me	H	OH
II-278		Me	O	O	Me	H	OH
II-279		Me	O	O	Me	H	OH
II-280	CH ₂ NH ₂	Me	O	O	Me	H	OH
II-281	CH ₂ NO ₂	Me	O	O	Me	H	OH
II-282	CH ₂ NHCH ₃	Me	O	O	Me	H	OH
II-283	CH ₂ N(CH ₃) ₂	Me	O	O	Me	H	OH
II-284	CH ₂ SCH ₂ CF ₃	Me	O	O	Me	H	OH
II-285	CH ₂ SOCH ₂ CF ₃	Me	O	O	Me	H	OH
II-286	CH ₂ SO ₂ CH ₂ CF ₃	Me	O	O	Me	H	OH
II-287	CH ₂ OH	Me	O	O	Me	H	OH
II-288	CH ₂ OBn	Me	O	O	Me	H	OH
II-289	CH ₂ OCH ₂ Pr-c	Me	O	O	Me	H	OH

Таблица 25

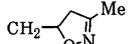
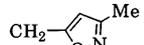
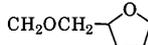
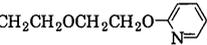
№ соединения	R ¹	R ²	Y	Z	R ²⁰	R ²¹	R ⁴
II-290	CH ₂ OPh	Me	O	O	Me	H	OH
II-291	CH ₂ SPh	Me	O	O	Me	H	OH
II-292	CH ₂ SOPh	Me	O	O	Me	H	OH
II-293	CH ₂ SO ₂ Ph	Me	O	O	Me	H	OH
II-294	CH ₂ CON(CH ₃) ₂	Me	O	O	Me	H	OH
II-295	CH ₂ COCH ₃	Me	O	O	Me	H	OH
II-296	CH ₂ OCOCH ₃	Me	O	O	Me	H	OH
II-297	CH ₂ ON=CHCH ₃	Me	O	O	Me	H	OH
II-298	C ₂ H ₄ OC ₂ H ₄ SCH ₃	Me	O	O	Me	H	OH
II-299	C ₂ H ₄ OC ₂ H ₄ SOCH ₃	Me	O	O	Me	H	OH
II-300	C ₂ H ₄ OC ₂ H ₄ SO ₂ CH ₃	Me	O	O	Me	H	OH
II-301	CH ₂ OCH ₂ CN	Me	O	O	Me	H	OH
II-302	CH ₂ CN	Me	O	O	Me	H	OH
II-303	OCH ₂ CH=CH ₂	Me	O	O	Me	H	OH
II-304	OCH ₂ C≡CH	Me	O	O	Me	H	OH
II-305	OPr-c	Me	O	O	Me	H	OH
II-306		Me	O	O	Me	H	OH
II-307		Me	O	O	Me	H	OH
II-308		Me	O	O	Me	H	OH
II-309		Me	O	O	Me	H	OH
II-310		Me	O	O	Me	H	OH
II-311	Ph	H	O	O	Me	H	OH
II-312	Ph	CH ₂ CH=CH ₂	O	O	Me	H	OH
II-313	Ph	CH ₂ C≡CH	O	O	Me	H	OH
II-314	Ph	Pr-c	O	O	Me	H	OH
II-315	Ph	CH ₂ CH=CF ₂	O	O	Me	H	OH
II-316	Ph	CH ₂ C≡CF	O	O	Me	H	OH
II-317	Ph	C ₂ H ₄ OCH ₃	O	O	Me	H	OH
II-318	Ph	C ₂ H ₄ OC ₂ H ₅	O	O	Me	H	OH
II-319	Ph	CH(Me)OEt	O	O	Me	H	OH
II-320	Ph	CH ₂ OPr-c	O	O	Me	H	OH
II-321	Ph	CH(OCH ₃) ₂	O	O	Me	H	OH
II-322	Ph	CH ₂ Ph	O	O	Me	H	OH

Таблица 26

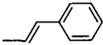
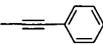
№ соединения	R ¹	R ²	Y	Z	R ²⁰	R ²¹	R ⁴
II-323	Ph		O	O	Me	H	OH
II-324	Ph		O	O	Me	H	OH
II-325	Ph	Me	O	O	Me	H	NH ₂
II-326	Ph	Me	O	O	Me	H	Cl
II-327	Ph	Me	O	O	Me	H	CN
II-328	Ph	Me	O	O	Me	H	NCS
II-329	Ph	Me	O	O	Me	H	NCO
II-330	Ph	Me	O	O	Me	H	OCO ₂ H
II-331	Ph	Me	O	O	Me	H	OCO ₂ CH ₃
II-332	Ph	Me	O	O	Me	H	OCO ₂ CH ₂ Ph
II-333	Ph	Me	O	O	Me	H	OMe
II-334	Ph	Me	O	O	Me	H	OEt
II-335	Ph	Me	O	O	Me	H	OPr
II-336	Ph	Me	O	O	Me	H	OCH ₂ CH=CH ₂
II-337	Ph	Me	O	O	Me	H	OCH ₂ C≡CH
II-338	Ph	Me	O	O	Me	H	OPr ^c
II-339	Ph	Me	O	O	Me	H	OBu ^c
II-340	Ph	Me	O	O	Me	H	OPen ^c
II-341	Ph	Me	O	O	Me	H	OHex ^c
II-342	Ph	Me	O	O	Me	H	OCH ₂ CN
II-343	Ph	Me	O	O	Me	H	OCH ₂ Pr ^c
II-344	Ph	Me	O	O	Me	H	OCOCH ₃
II-345	Ph	Me	O	O	Me	H	COCCl ₃
II-346	Ph	Me	O	O	Me	H	COCH=CH ₂
II-347	Ph	Me	O	O	Me	H	COCH=CF ₂
II-348	Ph	Me	O	O	Me	H	COCH ₂ C≡CH
II-349	Ph	Me	O	O	Me	H	COCH ₂ C≡CF
II-350	Ph	Me	O	O	Me	H	OCH ₂ CO ₂ CH ₃
II-351	Ph	Me	O	O	Me	H	OPh
II-352	Ph	Me	O	O	Me	H	OCH ₂ Ph
II-353	Ph	Me	O	O	Me	H	OCOPh
II-354	Ph	Me	O	O	Me	H	OCOCH ₂ Ph
II-355	Ph	Me	O	O	Me	H	OCH ₂ COPh
II-356	Ph	Me	O	O	Me	H	OSO ₂ CH ₂ CF ₃
II-357	Ph	Me	O	O	Me	H	OSO ₂ CH ₂ Ph
II-358	Ph	Me	O	O	Me	H	SCH ₃
II-359	Ph	Me	O	O	Me	H	SOCH ₃
II-360	Ph	Me	O	O	Me	H	SO ₂ CH ₃
II-361	Ph	Me	O	O	Me	H	SCH ₂ CF ₃
II-362	Ph	Me	O	O	Me	H	SOCH ₂ CF ₃
II-363	Ph	Me	O	O	Me	H	SO ₂ CH ₂ CF ₃

Таблица 27

№ соединения	R ¹	R ²	Y	Z	R ²⁰	R ²¹	R ⁴
II-364	Ph	Me	O	O	Me	H	SCH ₂ CH=CH ₂
II-365	Ph	Me	O	O	Me	H	SOCH ₂ CH=CH ₂
II-366	Ph	Me	O	O	Me	H	SO ₂ CH ₂ CH=CH ₂
II-367	Ph	Me	O	O	Me	H	SCH ₂ CH≡CH
II-368	Ph	Me	O	O	Me	H	SOCH ₂ CH≡CH
II-369	Ph	Me	O	O	Me	H	SO ₂ CH ₂ CH≡CH
II-370	Ph	Me	O	O	Me	H	SCH ₂ Ph
II-371	Ph	Me	O	O	Me	H	SOPh
II-372	Ph	Me	O	O	Me	H	SOCH ₂ Ph
II-373	Ph	Me	O	O	Me	H	SO ₂ Ph
II-374	Ph	Me	O	O	Me	H	SO ₂ CH ₂ Ph
II-375	Ph	Me	O	O	Me	H	NHCH ₃
II-376	Ph	Me	O	O	Me	H	N(CH ₃) ₂
II-377	Ph	Me	O	O	Me	H	NHCOCH ₃
II-378	Ph	Me	O	O	Me	H	OCH ₂ CH ₂ - 
II-379	Ph	Me	O	O	Me	H	
II-380	Ph	Me	O	O	Me	H	
II-381	Ph	Me	O	O	Me	H	
II-382	Ph	Me	O	O	Me	H	
II-383	Ph	Me	O	O	Me	H	

Таблица 28

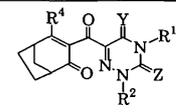
							
№ соединения	R ¹	R ²	Y	Z	R ⁴		
III-1	Me	Me	O	O	OH		
III-2	Et	Me	O	O	OH		
III-3	Pr-n	Me	O	O	OH		
III-4	Pr-i	Me	O	O	OH		
III-5	Bu-n	Me	O	O	OH		
III-6	Bu-i	Me	O	O	OH		
III-7	Bu-s	Me	O	O	OH		
III-8	Bu-t	Me	O	O	OH		
III-9	Hex-n	Me	O	O	OH		
III-10	CH ₂ CF ₃	Me	O	O	OH		
III-11	CH ₂ CH=CH ₂	Me	O	O	OH		
III-12	CH ₂ C(Me)=CH ₂	Me	O	O	OH		
III-13	CH ₂ CH ₂ CH=CMe ₂	Me	O	O	OH		
III-14	CH ₂ C≡CH	Me	O	O	OH		
III-15	CH ₂ C≡CCH ₃	Me	O	O	OH		
III-16	Pr-c	Me	O	O	OH		
III-17	Bu-c	Me	O	O	OH		
III-18	Pen-c	Me	O	O	OH		
III-19	Hex-c	Me	O	O	OH		
III-20	CH ₂ Pr-c	Me	O	O	OH		
III-21	CH ₂ Bu-c	Me	O	O	OH		
III-22	CH ₂ Pen-c	Me	O	O	OH		
III-23	CH ₂ Hex-c	Me	O	O	OH		
III-24	CH ₂ CH=CCl ₂	Me	O	O	OH		
III-25	CH ₂ CCl=CHCl	Me	O	O	OH		
III-26	CH ₂ CH ₂ CH=CCl ₂	Me	O	O	OH		
III-27	CH ₂ CH ₂ C(Me)=CF ₂	Me	O	O	OH		
III-28	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ C(Me)=CF ₂	Me	O	O	OH		
III-29	CH ₂ CH=CF ₂	Me	O	O	OH		
III-30	CH ₂ CH ₂ OMe	Me	O	O	OH		
III-31	CH ₂ CH ₂ OEt	Me	O	O	OH		
III-32	CH(Me)CH ₂ OMe	Me	O	O	OH		
III-33	CH ₂ CH ₂ OCH ₂ CH ₂ OMe	Me	O	O	OH		
III-34	CH ₂ CH ₂ OPr-n	Me	O	O	OH		
III-35	CH ₂ CH ₂ OPr-i	Me	O	O	OH		
III-36	CH ₂ CH ₂ OPr-c	Me	O	O	OH		
III-37	CH ₂ CH ₂ OBu-c	Me	O	O	OH		
III-38	CH ₂ CH ₂ OHex-c	Me	O	O	OH		

Таблица 29

№ соединения	R ¹	R ²	Y	Z	R ⁴
III-39	CH ₂ CH ₂ OH _{hex-c}	Me	O	O	OH
III-40	CH ₂ CH ₂ OCH ₂ CF ₃	Me	O	O	OH
III-41	CH ₂ CH ₂ CH ₂ OMe	Me	O	O	OH
III-42	CH=CHMe	Me	O	O	OH
III-43	CH ₂ SMe	Me	O	O	OH
III-44	CH ₂ SP _{r-n}	Me	O	O	OH
III-45	CH ₂ CH ₂ SMe	Me	O	O	OH
III-46	CH ₂ CH ₂ SOMe	Me	O	O	OH
III-47	CH ₂ CH ₂ SO ₂ Me	Me	O	O	OH
III-48	CH ₂ CH ₂ CH ₂ SMe	Me	O	O	OH
III-49	CH ₂ CH ₂ CH ₂ SO ₂ Me	Me	O	O	OH
III-50	Ph	Me	O	O	OH
III-51	Ph(2-Cl)	Me	O	O	OH
III-52	Ph(3-Cl)	Me	O	O	OH
III-53	Ph(4-Cl)	Me	O	O	OH
III-54	Ph(2-F)	Me	O	O	OH
III-55	Ph(3-F)	Me	O	O	OH
III-56	Ph(4-F)	Me	O	O	OH
III-57	Ph(2-Me)	Me	O	O	OH
III-58	Ph(3-Me)	Me	O	O	OH
III-59	Ph(4-Me)	Me	O	O	OH
III-60	Ph(2-OMe)	Me	O	O	OH
III-61	Ph(3-OMe)	Me	O	O	OH
III-62	Ph(4-OMe)	Me	O	O	OH
III-63	Ph(2-CF ₃)	Me	O	O	OH
III-64	Ph(3-CF ₃)	Me	O	O	OH
III-65	Ph(4-CF ₃)	Me	O	O	OH
III-66	Ph(2-NO ₂)	Me	O	O	OH
III-67	Ph(3-NO ₂)	Me	O	O	OH
III-68	Ph(4-NO ₂)	Me	O	O	OH
III-69	Ph(2-OCF ₃)	Me	O	O	OH
III-70	Ph(3-OCF ₃)	Me	O	O	OH
III-71	Ph(4-OCF ₃)	Me	O	O	OH
III-72	Ph(2-CN)	Me	O	O	OH
III-73	Ph(3-CN)	Me	O	O	OH
III-74	Ph(4-CN)	Me	O	O	OH
III-75	Ph(3,4-F ₂)	Me	O	O	OH
III-76	Ph(3,5-F ₂)	Me	O	O	OH
III-77	Ph(2,3-F ₂)	Me	O	O	OH
III-78	Ph(2,4-F ₂)	Me	O	O	OH

Таблица 30

№ соединения	R ¹	R ²	Y	Z	R ⁴
III-79	Ph(2,5-F ₂)	Me	O	O	OH
III-80	Ph(2,6-F ₂)	Me	O	O	OH
III-81	Ph(3,4-Cl ₂)	Me	O	O	OH
III-82	Ph(3,5-Cl ₂)	Me	O	O	OH
III-83	Ph(2,3-Cl ₂)	Me	O	O	OH
III-84	Ph(2,4-Cl ₂)	Me	O	O	OH
III-85	Ph(2,5-Cl ₂)	Me	O	O	OH
III-86	Ph(2,6-Cl ₂)	Me	O	O	OH
III-87	Ph(3,4-Me ₂)	Me	O	O	OH
III-88	Ph(3,5-Me ₂)	Me	O	O	OH
III-89	Ph(2,3-Me ₂)	Me	O	O	OH
III-90	Ph(2,4-Me ₂)	Me	O	O	OH
III-91	Ph(2,5-Me ₂)	Me	O	O	OH
III-92	Ph(2,6-Me ₂)	Me	O	O	OH
III-93	Ph(3,4-(OMe) ₂)	Me	O	O	OH
III-94	Ph(3,5-(OMe) ₂)	Me	O	O	OH
III-95	Ph(2,3-(OMe) ₂)	Me	O	O	OH
III-96	Ph(2,4-(OMe) ₂)	Me	O	O	OH
III-97	Ph(2,5-(OMe) ₂)	Me	O	O	OH
III-98	Ph(2,6-(OMe) ₂)	Me	O	O	OH
III-99	Ph(3-F-4-OMe)	Me	O	O	OH
III-100	Ph(3-F-5-OMe)	Me	O	O	OH
III-101	Ph(2-F-3-OMe)	Me	O	O	OH
III-102	Ph(2-F-4-OMe)	Me	O	O	OH
III-103	Ph(2-F-5-OMe)	Me	O	O	OH
III-104	Ph(2-F-6-OMe)	Me	O	O	OH
III-105	Ph(3-F-4-Me)	Me	O	O	OH
III-106	Ph(3-F-5-Me)	Me	O	O	OH
III-107	Ph(2-F-3-Me)	Me	O	O	OH
III-108	Ph(2-F-4-Me)	Me	O	O	OH
III-109	Ph(2-F-5-Me)	Me	O	O	OH
III-110	Ph(2-F-6-Me)	Me	O	O	OH
III-111	Ph(3-OMe-4-F)	Me	O	O	OH
III-112	Ph(2-OMe-3-F)	Me	O	O	OH
III-113	Ph(2-OMe-4-F)	Me	O	O	OH
III-114	Ph(2-OMe-5-F)	Me	O	O	OH
III-115	Ph(3-Me-4-F)	Me	O	O	OH
III-116	Ph(2-Me-3-F)	Me	O	O	OH
III-117	Ph(2-Me-4-F)	Me	O	O	OH

Таблица 31

№ соединения	R ¹	R ²	Y	Z	R ⁴
III-118	Ph(2-Me-5-F)	Me	O	O	OH
III-119	Ph(3-Cl-4-OMe)	Me	O	O	OH
III-120	Ph(3-Cl-5-OMe)	Me	O	O	OH
III-121	Ph(2-Cl-3-OMe)	Me	O	O	OH
III-122	Ph(2-Cl-4-OMe)	Me	O	O	OH
III-123	Ph(2-Cl-5-OMe)	Me	O	O	OH
III-124	Ph(2-Cl-6-OMe)	Me	O	O	OH
III-125	Ph(3-Cl-4-Me)	Me	O	O	OH
III-126	Ph(3-Cl-5-Me)	Me	O	O	OH
III-127	Ph(2-Cl-3-Me)	Me	O	O	OH
III-128	Ph(2-Cl-4-Me)	Me	O	O	OH
III-129	Ph(2-Cl-5-Me)	Me	O	O	OH
III-130	Ph(2-Cl-6-Me)	Me	O	O	OH
III-131	Ph(3-OMe-4-Cl)	Me	O	O	OH
III-132	Ph(2-OMe-3-Cl)	Me	O	O	OH
III-133	Ph(2-OMe-4-Cl)	Me	O	O	OH
III-134	Ph(2-OMe-5-Cl)	Me	O	O	OH
III-135	Ph(3-Me-4-Cl)	Me	O	O	OH
III-136	Ph(2-Me-3-Cl)	Me	O	O	OH
III-137	Ph(2-Me-4-Cl)	Me	O	O	OH
III-138	Ph(2-Me-5-Cl)	Me	O	O	OH
III-139	Ph(3-F-4-Cl)	Me	O	O	OH
III-140	Ph(3-F-5-Cl)	Me	O	O	OH
III-141	Ph(2-F-3-Cl)	Me	O	O	OH
III-142	Ph(2-F-4-Cl)	Me	O	O	OH
III-143	Ph(2-F-5-Cl)	Me	O	O	OH
III-144	Ph(2-F-6-Cl)	Me	O	O	OH
III-145	Ph(3-Cl-4-F)	Me	O	O	OH
III-146	Ph(2-Cl-3-F)	Me	O	O	OH
III-147	Ph(2-Cl-4-F)	Me	O	O	OH
III-148	Ph(2-Cl-5-F)	Me	O	O	OH
III-149	Ph(3-Me-4-OMe)	Me	O	O	OH
III-150	Ph(3-Me-5-OMe)	Me	O	O	OH
III-151	Ph(2-Me-3-OMe)	Me	O	O	OH
III-152	Ph(2-Me-4-OMe)	Me	O	O	OH
III-153	Ph(2-Me-5-OMe)	Me	O	O	OH
III-154	Ph(2-Me-6-OMe)	Me	O	O	OH
III-155	Ph(3-OMe-4-Me)	Me	O	O	OH
III-156	Ph(2-OMe-3-Me)	Me	O	O	OH

Таблица 32

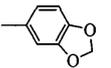
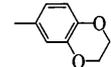
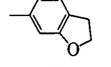
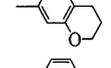
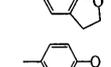
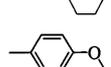
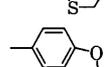
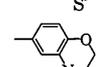
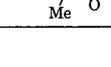
№ соединения	R ¹	R ²	Y	Z	R ⁴
III-157	Ph(2-OMe-4-Me)	Me	O	O	OH
III-158	Ph(2-OMe-5-Me)	Me	O	O	OH
III-159	Ph(3-CN-4-OMe)	Me	O	O	OH
III-160	Ph(3-OMe-4-CN)	Me	O	O	OH
III-161	Ph(3-Me-4-CN)	Me	O	O	OH
III-162	Ph(3-CN-4-Me)	Me	O	O	OH
III-163	Ph(3-NO ₂ -4-OMe)	Me	O	O	OH
III-164	Ph(3-OMe-4-NO ₂)	Me	O	O	OH
III-165	Ph(3-Me-4-NO ₂)	Me	O	O	OH
III-166	Ph(3-NO ₂ -4-Me)	Me	O	O	OH
III-167	Ph(3,5-F ₂ -5-OMe)	Me	O	O	OH
III-168	Ph(3,5-F ₂ -5-Me)	Me	O	O	OH
III-169	Ph(3,4,5-(OMe) ₃)	Me	O	O	OH
III-170		Me	O	O	OH
III-171		Me	O	O	OH
III-172		Me	O	O	OH
III-173		Me	O	O	OH
III-174		Me	O	O	OH
III-175		Me	O	O	OH
III-176		Me	O	O	OH
III-177		Me	O	O	OH
III-178		Me	O	O	OH

Таблица 33

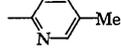
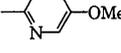
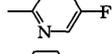
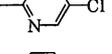
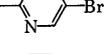
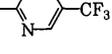
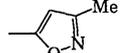
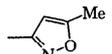
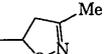
№ соединения	R ¹	R ²	Y	Z	R ⁴
III-179		Me	O	O	OH
III-180		Me	O	O	OH
III-181		Me	O	O	OH
III-182		Me	O	O	OH
III-183		Me	O	O	OH
III-184		Me	O	O	OH
III-185		Me	O	O	OH
III-186		Me	O	O	OH
III-187		Me	O	O	OH
III-188		Me	O	O	OH
III-189		Me	O	O	OH
III-190		Me	O	O	OH
III-191		Me	O	O	OH
III-192		Me	O	O	OH

Таблица 34

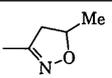
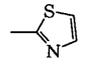
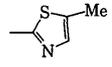
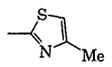
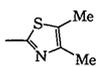
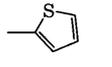
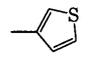
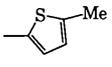
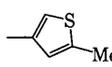
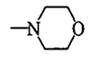
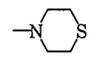
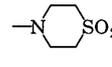
№ соединения	R ¹	R ²	Y	Z	R ⁴
III-193		Me	O	O	OH
III-194		Me	O	O	OH
III-195		Me	O	O	OH
III-196		Me	O	O	OH
III-197		Me	O	O	OH
III-198		Me	O	O	OH
III-199		Me	O	O	OH
III-200		Me	O	O	OH
III-201		Me	O	O	OH
III-202		Me	O	O	OH
III-203		Me	O	O	OH
III-204		Me	O	O	OH
III-205	CH ₂ Ph	Me	O	O	OH
III-206	CH ₂ CH ₂ Ph	Me	O	O	OH
III-207	CH ₂ CH ₂ CH ₂ Ph	Me	O	O	OH
III-208	CH ₂ CH=CHPh	Me	O	O	OH
III-209	CH ₂ C≡CPh	Me	O	O	OH
III-210	CH ₂ CH=NOMe	Me	O	O	OH
III-211	CH ₂ CH=NOEt	Me	O	O	OH

Таблица 35

№ соединения	R ¹	R ²	Y	Z	R ⁴
III-212	CH ₂ CH=NOPr-n	Me	O	O	OH
III-213	CH ₂ CH=NOPh	Me	O	O	OH
III-214	CH ₂ CH(OMe) ₂	Me	O	O	OH
III-215	CH ₂ CHO	Me	O	O	OH
III-216	NH ₂	Me	O	O	OH
III-217	NHMe	Me	O	O	OH
III-218	NHEt	Me	O	O	OH
III-219	NHPr-n	Me	O	O	OH
III-220	NHPr-i	Me	O	O	OH
III-221	NHBU-n	Me	O	O	OH
III-222	NHBU-i	Me	O	O	OH
III-223	NHBU-s	Me	O	O	OH
III-224	NHCH ₂ Pr-c	Me	O	O	OH
III-225	NHPr-n	Me	O	O	OH
III-226	NHHex-n	Me	O	O	OH
III-227	NHCH ₂ CH ₂ CH ₂ Cl	Me	O	O	OH
III-228	NHCH ₂ CH ₂ CH ₂ F	Me	O	O	OH
III-229	NHCH ₂ CH ₂ OMe	Me	O	O	OH
III-230	NMe ₂	Me	O	O	OH
III-231	NEt ₂	Me	O	O	OH
III-232	N(Pr-n) ₂	Me	O	O	OH
III-233	N(BU-n) ₂	Me	O	O	OH
III-234	N(Me)Et	Me	O	O	OH
III-235	N(Me)CH ₂ CH ₂ OMe	Me	O	O	OH
III-236	NHPh	Me	O	O	OH
III-237	NHCH ₂ Ph	Me	O	O	OH
III-238	N=CMe ₂	Me	O	O	OH
III-239	N=CEt ₂	Me	O	O	OH
III-240	N=CHNMe ₂	Me	O	O	OH
III-241	NHC(=O)Me	Me	O	O	OH
III-242	N[C(=O)Me] ₂	Me	O	O	OH
III-243	NHC(=O)OMe	Me	O	O	OH
III-244	N[C(=O)OMe] ₂	Me	O	O	OH
III-245	NHSO ₂ Me	Me	O	O	OH
III-246	NHSO ₂ Ph	Me	O	O	OH
III-247	NHSO ₂ CH ₂ Ph	Me	O	O	OH
III-248	OMe	Me	O	O	OH
III-249	OEt	Me	O	O	OH
III-250	OPr-n	Me	O	O	OH
III-251	OPr-i	Me	O	O	OH
III-252	OCH ₂ Pr-c	Me	O	O	OH
III-253	OCH ₂ Cl	Me	O	O	OH
III-254	OCHCl ₂	Me	O	O	OH

Таблица 36

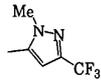
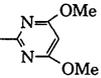
№ соединения	R ¹	R ²	Y	Z	R ⁴
III-255	OCCl ₃	Me	O	O	OH
III-256	OCH ₂ F	Me	O	O	OH
III-257	OCHF ₂	Me	O	O	OH
III-258	OCF ₃	Me	O	O	OH
III-259	Ph	Et	O	O	OH
III-260	Ph	Pr-i	O	O	OH
III-261	Ph	CHF ₂	O	O	OH
III-262	Ph	Ph	O	O	OH
III-263	Ph	Me	O	S	OH
III-264	Ph	Me	S	S	OH
III-265	Me	Me	O	S	OH
III-266	Me	Me	S	S	OH
III-267	Ph	Me	O	O	SPh
III-268	Ph(4-OEt)	Me	O	O	OH
III-269	Ph(2-Ph)	Me	O	O	OH
III-270	Ph(3-Ph)	Me	O	O	OH
III-271	Ph(4-Ph)	Me	O	O	OH
III-272		Me	O	O	OH
III-273		Me	O	O	OH
III-274	Me		O	O	OH
III-275	Et		O	O	OH
III-276	H	Me	O	O	OH
III-277	CH ₂ C≡CF	Me	O	O	OH
III-278		Me	O	O	OH
III-279		Me	O	O	OH
III-280	CH ₂ NH ₂	Me	O	O	OH
III-281	CH ₂ NO ₂	Me	O	O	OH
III-282	CH ₂ NHCH ₃	Me	O	O	OH
III-283	CH ₂ N(CH ₃) ₂	Me	O	O	OH
III-284	CH ₂ SCH ₂ CF ₃	Me	O	O	OH
III-285	CH ₂ SOCH ₂ CF ₃	Me	O	O	OH
III-286	CH ₂ SO ₂ CH ₂ CF ₃	Me	O	O	OH
III-287	CH ₂ OH	Me	O	O	OH
III-288	CH ₂ OBn	Me	O	O	OH
III-289	CH ₂ OCH ₂ Pr c	Me	O	O	OH

Таблица 37

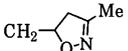
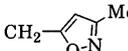
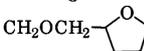
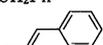
№ соединения	R ¹	R ²	Y	Z	R ⁴
III-290	CH ₂ OPh	Me	O	O	OH
III-291	CH ₂ SPh	Me	O	O	OH
III-292	CH ₂ SOPh	Me	O	O	OH
III-293	CH ₂ SO ₂ Ph	Me	O	O	OH
III-294	CH ₂ CON(CH ₃) ₂	Me	O	O	OH
III-295	CH ₂ COCH ₃	Me	O	O	OH
III-296	CH ₂ OCOCH ₃	Me	O	O	OH
III-297	CH ₂ ON=CHCH ₃	Me	O	O	OH
III-298	C ₂ H ₄ OC ₂ H ₄ SCH ₃	Me	O	O	OH
III-299	C ₂ H ₄ OC ₂ H ₄ SOCH ₃	Me	O	O	OH
III-300	C ₂ H ₄ OC ₂ H ₄ SO ₂ CH ₃	Me	O	O	OH
III-301	CH ₂ OCH ₂ CN	Me	O	O	OH
III-302	CH ₂ CN	Me	O	O	OH
III-303	OCH ₂ CH=CH ₂	Me	O	O	OH
III-304	OCH ₂ C≡CH	Me	O	O	OH
III-305	OPr-c	Me	O	O	OH
III-306		Me	O	O	OH
III-307		Me	O	O	OH
III-308		Me	O	O	OH
III-309		Me	O	O	OH
III-310		Me	O	O	OH
III-311	Ph	H	O	O	OH
III-312	Ph	CH ₂ CH=CH ₂	O	O	OH
III-313	Ph	CH ₂ C≡CH	O	O	OH
III-314	Ph	Pr-c	O	O	OH
III-315	Ph	CH ₂ CH=CF ₂	O	O	OH
III-316	Ph	CH ₂ C≡CF	O	O	OH
III-317	Ph	C ₂ H ₄ OCH ₃	O	O	OH
III-318	Ph	C ₂ H ₄ OC ₂ H ₅	O	O	OH
III-319	Ph	CH(Me)OEt	O	O	OH
III-320	Ph	CH ₂ OPr-c	O	O	OH
III-321	Ph	CH(OCH ₃) ₂	O	O	OH
III-322	Ph	CH ₂ Ph	O	O	OH
III-323	Ph		O	O	OH

Таблица 38

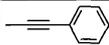
№ соединения	R ¹	R ²	Y	Z	R ⁴
III-324	Ph		O	O	OH
III-325	Ph	Me	O	O	NH ₂
III-326	Ph	Me	O	O	Cl
III-327	Ph	Me	O	O	CN
III-328	Ph	Me	O	O	NCS
III-329	Ph	Me	O	O	NCO
III-330	Ph	Me	O	O	OCO ₂ H
III-331	Ph	Me	O	O	OCO ₂ CH ₃
III-332	Ph	Me	O	O	OCO ₂ CH ₂ Ph
III-333	Ph	Me	O	O	OMe
III-334	Ph	Me	O	O	OEt
III-335	Ph	Me	O	O	OPr
III-336	Ph	Me	O	O	OCH ₂ CH=CH ₂
III-337	Ph	Me	O	O	OCH ₂ C≡CH
III-338	Ph	Me	O	O	OPr-c
III-339	Ph	Me	O	O	OBu-c
III-340	Ph	Me	O	O	OPen-c
III-341	Ph	Me	O	O	OHex-c
III-342	Ph	Me	O	O	OCH ₂ CN
III-343	Ph	Me	O	O	OCH ₂ Pr-c
III-344	Ph	Me	O	O	OCOCH ₃
III-345	Ph	Me	O	O	COCCl ₃
III-346	Ph	Me	O	O	COCH=CH ₂
III-347	Ph	Me	O	O	COCH=CF ₂
III-348	Ph	Me	O	O	COCH ₂ C≡CH
III-349	Ph	Me	O	O	COCH ₂ C≡CF
III-350	Ph	Me	O	O	OCH ₂ CO ₂ CH ₃
III-351	Ph	Me	O	O	OPh
III-352	Ph	Me	O	O	OCH ₂ Ph
III-353	Ph	Me	O	O	OCOPh
III-354	Ph	Me	O	O	OCOCH ₂ Ph
III-355	Ph	Me	O	O	OCH ₂ COPh
III-356	Ph	Me	O	O	OSO ₂ CH ₂ CF ₃
III-357	Ph	Me	O	O	OSO ₂ CH ₂ Ph
III-358	Ph	Me	O	O	SCH ₃
III-359	Ph	Me	O	O	SOCH ₃
III-360	Ph	Me	O	O	SO ₂ CH ₃
III-361	Ph	Me	O	O	SCH ₂ CF ₃
III-362	Ph	Me	O	O	SOCH ₂ CF ₃
III-363	Ph	Me	O	O	SO ₂ CH ₂ CF ₃
III-364	Ph	Me	O	O	SCH ₂ CH=CH ₂
III-365	Ph	Me	O	O	SOCH ₂ CH=CH ₂
III-366	Ph	Me	O	O	SO ₂ CH ₂ CH=CH ₂

Таблица 39

№ соединения	R ¹	R ²	Y	Z	R ⁴
III-367	Ph	Me	O	O	SCH ₂ CH≡CH
III-368	Ph	Me	O	O	SOCH ₂ CH≡CH
III-369	Ph	Me	O	O	SO ₂ CH ₂ CH≡CH
III-370	Ph	Me	O	O	SCH ₂ Ph
III-371	Ph	Me	O	O	SOPh
III-372	Ph	Me	O	O	SOCH ₂ Ph
III-373	Ph	Me	O	O	SO ₂ Ph
III-374	Ph	Me	O	O	SO ₂ CH ₂ Ph
III-375	Ph	Me	O	O	NHCH ₃
III-376	Ph	Me	O	O	N(CH ₃) ₂
III-377	Ph	Me	O	O	NHCOCH ₃
III-378	Ph	Me	O	O	OCH ₂ CH ₂ - 
III-379	Ph	Me	O	O	
III-380	Ph	Me	O	O	
III-381	Ph	Me	O	O	
III-382	Ph	Me	O	O	
III-383	Ph	Me	O	O	

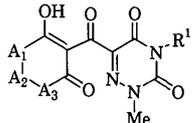
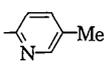
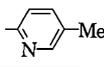
				
№ соединения	R ¹	A ₁	A ₂	A ₃
VI-1	Ph	C(CH ₃) ₂	CO	C(CH ₃) ₂
VI-2	Ph	CHCH ₃	CH ₂	CH ₂
VI-3	Ph	CH ₂	CHCH ₃	CH ₂
VI-4	Ph	CHCH ₃	CHCH ₃	CHCH ₃
VI-5	Ph	C(CH ₃) ₂	CH ₂	CH ₂
VI-6	Ph	CH ₂	C(CH ₃) ₂	CH ₂
VI-7	Ph	CHCH ₃	CH ₂	C(CH ₃) ₂
VI-8	Ph	CHCH ₃	CH ₂	CHCH ₃
VI-9	Ph	CHCH ₃	CHCH ₃	CH ₂
VI-10	Ph	NCH ₃	CO	CH ₂
VI-11	Ph	C(CH ₃) ₂	C(CH ₃) ₂	C(CH ₃) ₂
VI-12	Ph	C(CH ₃) ₂	S	C(CH ₃) ₂
VI-13	Ph	C(CH ₃) ₂	SO	C(CH ₃) ₂
VI-14	Ph	C(CH ₃) ₂	SO ₂	C(CH ₃) ₂
VI-15	Ph	C(CH ₃) ₂	O	C(CH ₃) ₂
VI-16	Ph	C(CH ₃) ₂	NCH ₃	C(CH ₃) ₂
VI-17	Me	C(CH ₃) ₂	CO	C(CH ₃) ₂
VI-18	Me	CHCH ₃	CH ₂	CH ₂
VI-19	Me	CH ₂	CHCH ₃	CH ₂
VI-20	Me	CHCH ₃	CHCH ₃	CHCH ₃
VI-21	Me	C(CH ₃) ₂	CH ₂	CH ₂
VI-22	Me	CH ₂	C(CH ₃) ₂	CH ₂
VI-23	Me	CHCH ₃	CH ₂	C(CH ₃) ₂
VI-24	Me	CHCH ₃	CH ₂	CHCH ₃
VI-25	Me	CHCH ₃	CHCH ₃	CH ₂
VI-26	Me	NCH ₃	CO	CH ₂
VI-27	Me	C(CH ₃) ₂	C(CH ₃) ₂	C(CH ₃) ₂
VI-28	Me	C(CH ₃) ₂	S	C(CH ₃) ₂
VI-29	Me	C(CH ₃) ₂	SO	C(CH ₃) ₂
VI-30	Me	C(CH ₃) ₂	SO ₂	C(CH ₃) ₂
VI-31	Me	C(CH ₃) ₂	O	C(CH ₃) ₂
VI-32	Me	C(CH ₃) ₂	NCH ₃	C(CH ₃) ₂
VI-33		C(CH ₃) ₂	CO	C(CH ₃) ₂
VI-34		CHCH ₃	CH ₂	CH ₂

Таблица 41

№ соединения	R ¹	A ₁	A ₂	A ₃
VI-35		CH ₂	CHCH ₃	CH ₂
VI-36		CHCH ₃	CHCH ₃	CHCH ₃
VI-37		C(CH ₃) ₂	CH ₂	CH ₂
VI-38		CH ₂	C(CH ₃) ₂	CH ₂
VI-39		CHCH ₃	CH ₂	C(CH ₃) ₂
VI-40		CHCH ₃	CH ₂	CHCH ₃
VI-41		CHCH ₃	CHCH ₃	CH ₂
VI-42		NCH ₃	CO	CH ₂
VI-43		C(CH ₃) ₂	C(CH ₃) ₂	C(CH ₃) ₂
VI-44		C(CH ₃) ₂	S	C(CH ₃) ₂
VI-45		C(CH ₃) ₂	SO	C(CH ₃) ₂
VI-46		C(CH ₃) ₂	SO ₂	C(CH ₃) ₂
VI-47		C(CH ₃) ₂	O	C(CH ₃) ₂
VI-48		C(CH ₃) ₂	NCH ₃	C(CH ₃) ₂
VI-49	Ph(4-OMe)	C(CH ₃) ₂	CO	C(CH ₃) ₂
VI-50	Ph(4-OMe)	CHCH ₃	CH ₂	CH ₂
VI-51	Ph(4-OMe)	CH ₂	CHCH ₃	CH ₂
VI-52	Ph(4-OMe)	CHCH ₃	CHCH ₃	CHCH ₃
VI-53	Ph(4-OMe)	C(CH ₃) ₂	CH ₂	CH ₂
VI-54	Ph(4-OMe)	CH ₂	C(CH ₃) ₂	CH ₂
VI-55	Ph(4-OMe)	CHCH ₃	CH ₂	C(CH ₃) ₂
VI-56	Ph(4-OMe)	CHCH ₃	CH ₂	CHCH ₃
VI-57	Ph(4-OMe)	CHCH ₃	CHCH ₃	CH ₂

Таблица 42

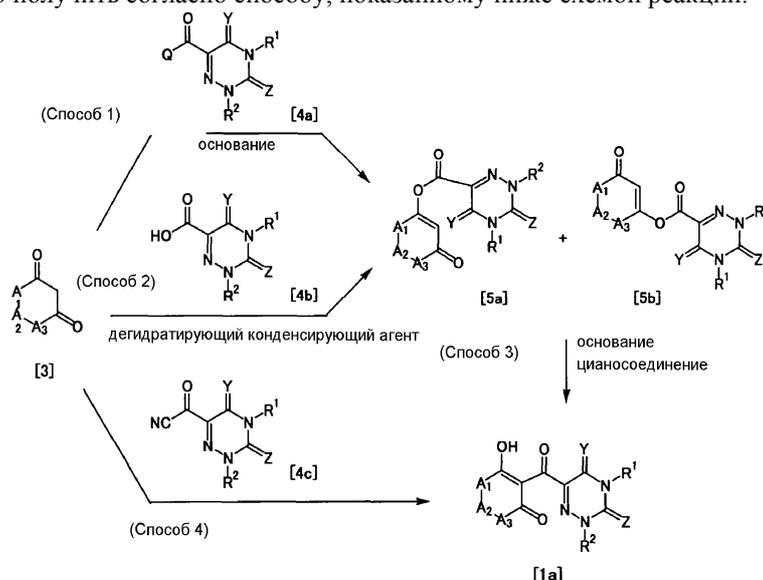
№ соединения	R ¹	A ₁	A ₂	A ₃
VI-58	Ph(4-OMe)	NCH ₃	CO	CH ₂
VI-59	Ph(4-OMe)	C(CH ₃) ₂	C(CH ₃) ₂	C(CH ₃) ₂
VI-60	Ph(4-OMe)	C(CH ₃) ₂	S	C(CH ₃) ₂
VI-61	Ph(4-OMe)	C(CH ₃) ₂	SO	C(CH ₃) ₂
VI-62	Ph(4-OMe)	C(CH ₃) ₂	SO ₂	C(CH ₃) ₂
VI-63	Ph(4-OMe)	C(CH ₃) ₂	O	C(CH ₃) ₂
VI-64	Ph(4-OMe)	C(CH ₃) ₂	NCH ₃	C(CH ₃) ₂
VI-65	Ph(2,4-Me ₂)	C(CH ₃) ₂	CO	C(CH ₃) ₂
VI-66	Ph(2,4-Me ₂)	CHCH ₃	CH ₂	CH ₂
VI-67	Ph(2,4-Me ₂)	CH ₂	CHCH ₃	CH ₂
VI-68	Ph(2,4-Me ₂)	CHCH ₃	CHCH ₃	CHCH ₃
VI-69	Ph(2,4-Me ₂)	C(CH ₃) ₂	CH ₂	CH ₂
VI-70	Ph(2,4-Me ₂)	CH ₂	C(CH ₃) ₂	CH ₂
VI-71	Ph(2,4-Me ₂)	CHCH ₃	CH ₂	C(CH ₃) ₂
VI-72	Ph(2,4-Me ₂)	CHCH ₃	CH ₂	CHCH ₃
VI-73	Ph(2,4-Me ₂)	CHCH ₃	CHCH ₃	CH ₂
VI-74	Ph(2,4-Me ₂)	NCH ₃	CO	CH ₂
VI-75	Ph(2,4-Me ₂)	C(CH ₃) ₂	C(CH ₃) ₂	C(CH ₃) ₂
VI-76	Ph(2,4-Me ₂)	C(CH ₃) ₂	S	C(CH ₃) ₂
VI-77	Ph(2,4-Me ₂)	C(CH ₃) ₂	SO	C(CH ₃) ₂
VI-78	Ph(2,4-Me ₂)	C(CH ₃) ₂	SO ₂	C(CH ₃) ₂
VI-79	Ph(2,4-Me ₂)	C(CH ₃) ₂	O	C(CH ₃) ₂
VI-80	Ph(2,4-Me ₂)	C(CH ₃) ₂	NCH ₃	C(CH ₃) ₂
VI-81		C(CH ₃) ₂	CO	C(CH ₃) ₂
VI-82		CHCH ₃	CH ₂	CH ₂
VI-83		CH ₂	CHCH ₃	CH ₂
VI-84		CHCH ₃	CHCH ₃	CHCH ₃
VI-85		C(CH ₃) ₂	CH ₂	CH ₂
VI-86		CH ₂	C(CH ₃) ₂	CH ₂
VI-87		CHCH ₃	CH ₂	C(CH ₃) ₂
VI-88		CHCH ₃	CH ₂	CHCH ₃

Таблица 43

№ соединения	R ¹	A ₁	A ₂	A ₃
VI-89		CHCH ₃	CHCH ₃	CH ₂
VI-90		NCH ₃	CO	CH ₂
VI-91		C(CH ₃) ₂	C(CH ₃) ₂	C(CH ₃) ₂
VI-92		C(CH ₃) ₂	S	C(CH ₃) ₂
VI-93		C(CH ₃) ₂	SO	C(CH ₃) ₂
VI-94		C(CH ₃) ₂	SO ₂	C(CH ₃) ₂
VI-95		C(CH ₃) ₂	O	C(CH ₃) ₂
VI-96		C(CH ₃) ₂	NCH ₃	C(CH ₃) ₂
VI-97	Ph(3,4,5-(OMe) ₃)	C(CH ₃) ₂	CO	C(CH ₃) ₂

Способ получения 1.

Соединение, представленное следующей формулой [1a], которое является одним из соединений изобретения, можно получить согласно способу, показанному ниже схемой реакций.



(в формуле R¹, R², A₁, A₂, A₃, Y и Z имеют такие же значения, как значения, указанные выше, и Q представляет собой уходящую группу, такую как атом галогена, алкилкарбонилксигруппа, алкоксикарбонилксигруппа, галогеналкилкарбонилксигруппа, галогеналкоксикарбонилксигруппа, бензоилксигруппа, пиридинильная группа и имидазолильная группа).

Реакция 1.

Реакцией соединения формулы [3] и соединения формулы [4a] в растворителе в присутствии основания можно получить сложноэфирное производное енола формулы [5a] и/или формулы [5b].

При этом соединении формулы [4a] можно подходящим образом применять в количестве, выбранном в диапазоне от 0,5 до 10 моль на 1 моль соединения формулы [3]. Предпочтительно в количестве от 1,0 до 1,2 моль.

Примеры основания, которое можно применять для данной реакции, включают в себя такие органические амины, как триэтиламин, пиридин, 4-диметиламинопиридин, N,N-диметиланилин и 1,8-дизабицикло[5.4.0]ундец-7-ен (DBU); карбонаты металлов, такие как карбонат натрия, карбонат калия, карбонат магния и карбонат кальция; гидрокарбонаты металлов, такие как гидрокарбонат натрия и гидрокарбонат калия; карбоксилатные соли металлов, представленные ацетатными солями металлов, такими как ацетат натрия, ацетат калия, ацетат кальция и ацетат магния; алкоксиды металлов, такие как метоксид натрия, этоксид натрия, третичный буюксид натрия, метоксид калия и третичный буюксид калия; гидроксиды металлов, такие как гидроксид натрия, гидроксид калия, гидроксид кальция и гидроксид

магния, и гидриды металлов, такие как гидрид лития, гидрид натрия, гидрид калия и гидрид кальция. Основание подходящим образом применяют в количестве, выбранном из диапазона от 0,5 до 10 моль на 1 моль соединения формулы [3]. Предпочтительно в количестве от 1,0 до 1,2 моль.

Растворителем, который можно применять для данной реакции, может быть любой растворитель, если он не ингибирует развитие реакции. Можно применять растворители, включающие в себя нитрилы, такие как ацетонитрил; простые эфиры, такие как диэтиловый эфир, диизопропиловый эфир, тетрагидрофуран, диоксан, моноглим и диглим; галогенированные углеводороды, такие как дихлорэтан, хлороформ, тетрахлорид углерода и тетрахлорэтан, ароматические углеводороды, такие как бензол, хлорбензол, нитробензол и толуол; амиды, такие как N,N-диметилформамид и N,N-диметилацетамид, имидазолины, такие как 1,3-диметил-2-имидазолинон, и серасодержащие соединения, такие как диметилсульфоксид. Кроме того, можно также применять смеси таких растворителей.

Температуру реакции можно выбрать из диапазона от -20°C до точки кипения применяемого инертного растворителя. Реакцию предпочтительно проводят в диапазоне температур от 0 до 100°C. При применении межфазного катализатора, такого как соль четвертичного аммония, реакцию можно проводить в двухфазной системе.

Время реакции варьирует в зависимости от температуры реакции, исходных реагентов, количества реагентов и т.д. Обычно оно составляет от 10 мин до 48 ч.

После завершения реакции соединение формулы [5a] и/или формулы [5b], которое является целевым соединением реакции, можно выделить из реакционной системы обычным методом и, если необходимо, очистить таким способом, как колоночная хроматография и перекристаллизация.

Реакция 2.

Соединение формулы [5a] и/или формулы [5b] можно также получить реакцией соединения формулы [3] и соединения формулы [4b] с дегидратирующим конденсирующим агентом в растворителе, в присутствии или в отсутствие основания.

Количество соединения формулы [4b], которое применяют для данной реакции, можно подходящим образом выбрать из диапазона от 0,5 до 10 моль на 1 моль соединения формулы [3]. Предпочтительно применяют количество от 1,0 до 1,2 моль.

Примеры дегидратирующего конденсирующего агента включают в себя дициклогексилкарбодиимид (DCC), N-(3-диметиламинопропил)-N'-этилкарбодиимид (EDC или WSC), N,N-карбонилдиимидазол, хлорид 2-хлор-1,3-диметилимидазолия и иодид 2-хлор-1-пиридиния.

Примеры основания и растворителя, которые можно применять для данной реакции, включают в себя основания и растворители, описанные выше для реакции 1.

Температуру реакции можно выбрать из диапазона от -20°C до точки кипения применяемого инертного растворителя. Реакцию предпочтительно проводят в диапазоне от 0 до 100°C.

Время реакции варьирует в зависимости от температуры реакции, исходных реагентов, количества реагентов и т.д. Обычно оно составляет от 10 мин до 48 ч.

Соединение формулы [5a] и/или формулы [5b], которое является целевым соединением реакции, можно выделить и очистить таким же образом, как в реакции 1.

Реакция 3.

Соединение формулы [1a] можно получить реакцией соединения формулы [5a] и/или формулы [5b], полученного реакцией 1 или реакцией 2, с цианосоединением в присутствии основания.

Примеры основания, которое можно применять для данной реакции, включают в себя основания, описанные выше для реакции 1. Применяемое количество основания можно подходящим образом выбрать из диапазона от 0,5 до 10 моль на 1 моль соединения формулы [5a] и соединения формулы [5b]. Предпочтительно оно составляет от 1,0 до 1,2 моль.

Примеры цианосоединения, которое можно применять для данной реакции, включают в себя цианид калия, цианид натрия, цианогидрин ацетона, цианид водорода и цианид водорода, нанесенный на полимер. Применяемое количество цианосоединения можно подходящим образом выбрать из диапазона от 0,01 до 1,0 моль на 1 моль соединения формулы [5a] и соединения формулы [5b]. Предпочтительно оно составляет от 0,05 до 0,2 моль.

Для данной реакции можно также применять небольшое количество межфазного катализатора, такого как краун-эфир.

Примеры растворителя, который можно применять для данной реакции, включают в себя растворители, описанные выше для способа 1. Температуру реакции выбирают из диапазона от -20°C до точки кипения применяемого инертного растворителя. Реакцию предпочтительно проводят в диапазоне от 0 до 100°C. Время реакции варьирует в зависимости от температуры реакции, исходных реагентов, количества реагентов и т.д. Обычно оно составляет от 10 мин до 48 ч.

Кроме того, согласно данному способу соединение формулы [1a] можно получить с применением соединения формулы [5a] и/или формулы [5b], полученного реакцией 1 или реакцией 2, без любого выделения.

Реакция 4.

Соединение формулы [1a] можно также получить реакцией соединения формулы [3] и соединения

формулы [4с] в присутствии основания или кислоты Льюиса.

Количество соединения формулы [4с], которое применяют для данной реакции, можно подходящим образом выбрать из диапазона от 0,5 до 10 моль на 1 моль соединения формулы [3]. Предпочтительно оно составляет от 1,0 до 1,2 моль.

Примеры кислоты Льюиса включают в себя хлорид цинка и хлорид алюминия.

Примеры основания, которое можно применять для данной реакции, включают в себя основания, описанные выше для реакции 1. Количество основания, которое можно применять для данной реакции, можно подходящим образом выбрать из диапазона от 0,5 до 10 моль на 1 моль соединения формулы [3]. Предпочтительно оно составляет от 1,0 до 1,2 моль.

Примеры растворителя, который можно применять для данной реакции, включают в себя растворители, описанные выше для реакции 1.

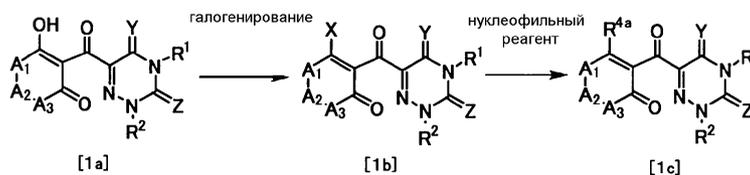
Температуру реакции выбирают из диапазона от -20°C до точки кипения применяемого инертного растворителя. Реакцию предпочтительно проводят в диапазоне от 0 до 100°C.

Время реакции варьирует в зависимости от температуры реакции, исходных реагентов, количества реагентов и т.д. Обычно оно составляет от 10 мин до 48 ч.

После завершения реакции соединение формулы [1а], которое получают согласно реакции 3 или реакции 4, можно выделить из реакционной системы обычным способом и, если необходимо, очистить таким способом, как колоночная хроматография и перекристаллизация.

Способ получения 2.

В случае соединения формулы [1а], полученного способом получения 1, гидроксильную группу в кольце циклогексана можно превратить в другую группу-заместитель согласно способу со следующей схемой реакций:



(в формуле R^1 , R^2 , A_1 , A_2 , A_3 , Y и Z имеют такие же значения, как значения, указанные выше, R^{4a} представляет собой аминогруппу, цианогруппу, изотиоцианатную группу, изоцианатную группу, гидроксикарбонилксигруппу, C_1 - C_6 алкоксикарбонилксигруппу, бензилоксикарбонилксигруппу, которая может быть замещена заместителем, выбранным из группы заместителей α , C_1 - C_6 алкоксигруппу, C_2 - C_6 алкенилоксигруппу, C_2 - C_6 алкинилоксигруппу, C_3 - C_6 циклоалкилоксигруппу, цианометиленоксигруппу, C_3 - C_6 циклоалкил C_1 - C_6 алкоксигруппу, C_1 - C_6 алкилкарбонилксигруппу, C_1 - C_6 галогеналкилкарбонилксигруппу, C_2 - C_6 алкенилкарбонилксигруппу, C_2 - C_6 галогеналкенилкарбонилксигруппу, C_2 - C_6 алкинилкарбонилксигруппу, C_2 - C_6 галогеналкинилкарбонилксигруппы, C_1 - C_6 алкоксикарбонил C_1 - C_6 алкоксигруппу, фенилоксигруппу, которая может быть замещена заместителем, выбранным из группы заместителей α , бензилоксигруппу, которая может быть замещена заместителем, выбранным из группы заместителей α , фенилкарбонилксигруппу, которая может быть замещена заместителем, выбранным из группы заместителей α , бензилкарбонилксигруппу, которая может быть замещена заместителем, выбранным из группы заместителей α , фенилкарбонил C_1 - C_6 алкилоксигруппу, которая может быть замещена заместителем, выбранным из группы заместителей α , C_1 - C_{10} алкилсульфонилксигруппу, фенилсульфонилксигруппу, которая может быть замещена заместителем, выбранным из группы заместителей α , бензилсульфонилксигруппу, которая может быть замещена заместителем, выбранным из группы заместителей α , C_1 - C_{10} алкилтиогруппу, C_1 - C_{10} алкилсульфинильную группу, C_1 - C_{10} алкилсульфонильную группу, C_1 - C_6 галогеналкилтиогруппу, C_1 - C_6 галогеналкилсульфинильную группу, C_1 - C_6 галогеналкилсульфонильную группу, C_2 - C_6 алкенилтиогруппу, C_2 - C_6 алкенилсульфинильную группу, C_2 - C_6 алкенилсульфонильную группу, C_2 - C_6 алкинилтиогруппу, C_2 - C_6 алкинилсульфинильную группу, C_2 - C_6 алкинилсульфонильную группу, фенилтиогруппу, которая может быть замещена заместителем, выбранным из группы заместителей α , бензилтиогруппу, которая может быть замещена заместителем, выбранным из группы заместителей α , фенилсульфинильную группу, которая может быть замещена заместителем, выбранным из группы заместителей α , бензилсульфинильную группу, которая может быть замещена заместителем, выбранным из группы заместителей α , фенилсульфонильную группу, которая может быть замещена заместителем, выбранным из группы заместителей α , бензилсульфонильную группу, которая может быть замещена заместителем, выбранным из группы заместителей α , C_1 - C_{10} алкиламиногруппу, ди(C_1 - C_{10} алкил) аминогруппу, C_1 - C_6 алкоксикарбониламиногруппу, C_1 - C_6 алкоксигруппу, замещенную гетероциклической группой, имеющей 3-10 атомов углерода и один или несколько гетероатомов, которые являются одинаковыми или отличными друг от друга и выбраны из атома кислорода, атома серы и атома азота [группа может быть замещена одним заместителем, выбранным из группы заместителей α , или 2-5 заместителями, которые являются одинаковыми или отличными друг от друга и выбраны из группы заместителей α], гете-

роциклическую группу, имеющую 3-10 атомов углерода и один или несколько гетероатомов, которые являются одинаковыми или отличными друг от друга и выбраны из атома кислорода, атома серы и атома азота [группа может быть замещена одним заместителем, выбранным из группы заместителей α , или 2-5 заместителями, которые являются одинаковыми или отличными друг от друга и выбраны из группы заместителей α], или гетероциклилоксигруппу, имеющую 3-10 атомов углерода и один или несколько гетероатомов, которые являются одинаковыми или отличными друг от друга и выбраны из атома кислорода, атома серы и атома азота [группа может быть замещена одним заместителем, выбранным из группы заместителей α , или 2-5 заместителями, которые являются одинаковыми или отличными друг от друга и выбраны из группы заместителей α], и X представляет собой атом галогена).

Конкретно, соединение формулы [1b] можно получить реакцией соединения формулы [1a] и галогенирующего агента и соединение формулы [1c] можно получить реакцией соединения формулы [1b] и нуклеофильного реагента в присутствии основания.

Примеры галогенирующего агента, который можно применять для получения соединения формулы [1b] из соединения формулы [1a], включают в себя тионилхлорид, тионилбромид, оксихлорид фосфора, оксидбромид фосфора, трибромид фенилтриметиламмония и трибромид кислоты Мельдрума. Количество применяемого галогенирующего агента можно подходящим образом выбрать из диапазона от 0,5 до 10 моль на 1 моль соединения формулы [1a]. Предпочтительно оно составляет от 1,0 до 1,2 моль.

Примеры растворителя, который можно применять для настоящего способа, включают в себя растворители, описанные выше для реакции 1 способа получения 1.

Температуру реакции можно выбрать из диапазона от -20°C до точки кипения применяемого инертного растворителя. Реакцию предпочтительно проводят в диапазоне от 0 до 100°C .

Время реакции варьирует в зависимости от температуры реакции, исходных реагентов, количества реагентов и т.д. Обычно оно составляет от 10 мин до 48 ч.

Примеры нуклеофильного реагента для реакции получения соединения формулы [1c] из соединения формулы [1b], которое является соединением, представленным формулой $\text{R}^{\text{4a}}\text{-H}$, включают в себя спирты, такие как метанол, этанол и бензиловый спирт; меркаптаны, такие как метилмеркаптан и этилмеркаптан; амины, такие как аммиак, метиламин и этиламин; фенолы, такие как п-крезол и фенол; тиофенолы, такие как п-хлортиофенол; $\text{C}_1\text{-C}_6$ алкановые кислоты, такие как уксусная кислота, и бензойная кислоты. Количество применяемого нуклеофильного реагента можно подходящим образом выбрать из диапазона от 0,5 до 10 моль на 1 моль соединения формулы [1b]. Предпочтительно оно составляет от 1,0 до 1,2 моль.

Примеры основания, которое можно применять для данной реакции, включают в себя основания, описанные выше для реакции 1 способа получения 1.

Примеры растворителя, который можно применять для данной реакции, включают в себя растворители, описанные выше для реакции 1 способа получения 1.

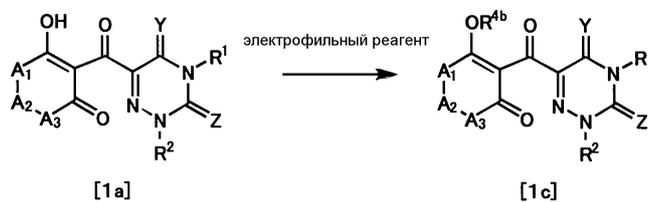
Температуру реакции выбирают из диапазона от -20°C до точки кипения применяемого инертного растворителя. Реакцию предпочтительно проводят в диапазоне от 0 до 100°C .

Время реакции варьирует в зависимости от температуры реакции, исходных реагентов, количества реагентов и т.д. Обычно оно составляет от 10 мин до 48 ч.

После завершения реакции соединение формулы [1c], которое получают согласно этому способу, можно выделить из реакционной системы обычным способом, и, если необходимо, очистить таким способом, как колоночная хроматография и перекристаллизация.

Способ получения 3.

Соединение формулы [1c] можно также получить способом со следующей схемой реакций:



(в формуле каждый из R^1 , R^2 , A_1 , A_2 , A_3 , Y и Z имеет такие же значения, какие указаны выше, R^{4a} представляет собой гидроксикарбонильную группу, $\text{C}_1\text{-C}_6$ алкоксикарбонильную группу, бензилоксикарбонильную группу, которая может быть замещена заместителем, выбранным из группы заместителей α , $\text{C}_1\text{-C}_6$ алкильную группу, $\text{C}_2\text{-C}_6$ алкенильную группу, $\text{C}_2\text{-C}_6$ алкинильную группу, $\text{C}_3\text{-C}_6$ циклоалкильную группу, цианометиленовую группу, $\text{C}_3\text{-C}_6$ циклоалкил $\text{C}_1\text{-C}_6$ алкильную группу, $\text{C}_1\text{-C}_6$ алкилкарбонильную группу, $\text{C}_1\text{-C}_{10}$ алкилтиокарбонильную группу, $\text{C}_1\text{-C}_6$ галогеналкилкарбонильную группу, $\text{C}_2\text{-C}_6$ алкенилкарбонильную группу, $\text{C}_2\text{-C}_6$ галогеналкенилкарбонильную группу, $\text{C}_2\text{-C}_6$ алкинилкарбонильную группу, $\text{C}_2\text{-C}_6$ галогеналкинилкарбонильную группу, $\text{C}_1\text{-C}_6$ алкоксикарбонил $\text{C}_1\text{-C}_6$ алкильную группу, $\text{C}_1\text{-C}_{10}$ алкилсульфонильную группу, фенильную группу, которая может быть замещена заместителем, выбранным из группы заместителей α , бензильную группу, которая может быть замещена заместителем, выбранным из

группы заместителей α , фенолкарбонильную группу, которая может быть замещена заместителем, выбранным из группы заместителей α , бензилкарбонильную группу, которая может быть замещена заместителем, выбранным из группы заместителей α , фенолсульфонильную группу, которая может быть замещена заместителем, выбранным из группы заместителей α , фенолкарбонил- C_1 - C_6 алкильную группу, которая может быть замещена заместителем, выбранным из группы заместителей α , или гетероциклическую группу, имеющую 3-10 атомов углерода и один или несколько гетероатомов, которые являются одинаковыми или отличными друг от друга и выбраны из атома кислорода, атома серы и атома азота [группа может быть замещена одним заместителем, выбранным из группы заместителей α , или 2-5 заместителями, которые являются одинаковыми или отличными друг от друга и выбраны из группы заместителей α]).

Конкретно, соединение формулы [1c] можно получить реакцией соединения формулы [1a] и электрофильного реагента в растворителе в присутствии или в отсутствие основания.

Электрофильный реагент означает соединение, представленное формулой $R^{4b}-L_a$ (L_a представляет собой уходящую группу), и примеры его включают в себя C_1 - C_6 алкилгалогенид, такой как метилиодид и пропирилхлорид; бензилгалогенид, такой как бензилбромид; C_1 - C_6 алкилкарбонилгалогенид, такой как ацетилхлорид и пропионилхлорид; бензоилгалогенид, такой как бензоилхлорид; C_2 - C_6 алкилкарбонилгалогенид, такой как метакрилхлорид и кротонилхлорид; C_2 - C_6 алкинилкарбонилгалогенид, такой как 4-пентиноилхлорид; C_1 - C_6 алкилсульфонилгалогенид, такой как метансульфонилхлорид и этансульфонилхлорид; бензолсульфонилгалогенид, такой как бензолсульфонилхлорид и *p*-толуолсульфонилхлорид; и ди- C_1 - C_6 алкилсульфатный эфир, такой как диметилсульфат и диэтилсульфат. Применяемое количество электрофильного реагента можно подходящим образом выбрать из диапазона от 0,1 до 10 моль на 1 моль соединения формулы [1a]. Предпочтительно оно составляет от 1,0 до 1,2 моль.

Примеры основания, которое можно применять для данной реакции, включают в себя основания, описанные выше для реакции 1 способа получения 1. Применяемое количество основания можно подходящим образом выбрать из диапазона 0,1-10 моль на 1 моль соединения формулы [1a]. Предпочтительно оно составляет от 1,0 до 1,2 моль.

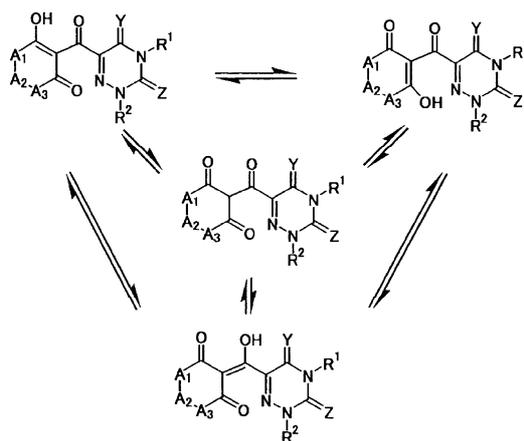
Примеры растворителя, который можно применять для данной реакции, включают в себя примеры, описанные выше для реакции 1 способа получения 1.

Температуру реакции выбирают из диапазона от -20°C до точки кипения применяемого инертного растворителя. Реакцию предпочтительно проводят в диапазоне от 0 до 100°C .

Время реакции изменяется в зависимости от температуры реакции, исходных реагентов, количества реагентов и т.д. Обычно оно составляет от 10 мин до 48 ч.

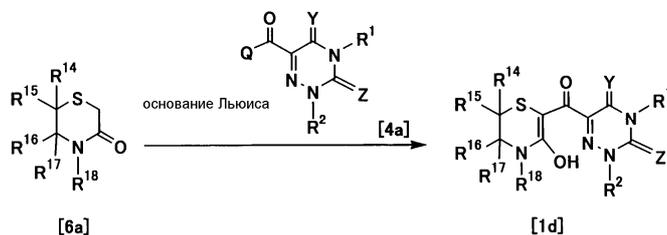
После завершения реакции соединение формулы [1c], которое является целевым соединением данной реакции, можно выделить из реакционной системы обычным способом и, если необходимо, можно очистить таким способом, как колоночная хроматография и перекристаллизация.

Соединение формулы [1c] имеет много таутомеров, показанных ниже, и все его таутомеры включены в изобретение.



Способ получения 4.

Соединение формулы [1d] можно также получить способом со следующей схемой реакций:



(в формулах каждый из R^1 , R^2 , R^{14} , R^{15} , R^{16} , R^{17} , R^{18} , Y и Z имеет такие же значения, какие указаны выше, и Q представляет собой уходящую группу, такую как атом галогена, алкилкарбонилксигруппу, алкоксикарбонилксигруппу, галогеналкилкарбонилксигруппу, галогеналкоксикарбонилксигруппу, бензоилксигруппу, пиридинильную группу и имидазолильную группу, как описано выше).

Конкретно, соединение формулы [1d] можно получить реакцией соединения формулы [6] и соединения формулы [4a] в растворителе и в присутствии кислоты Льюиса.

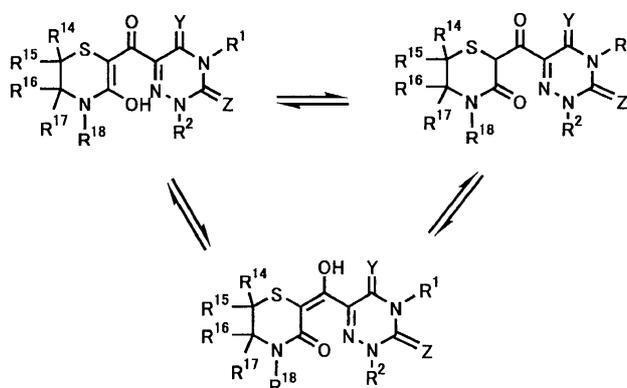
Применяемое количество соединения формулы [4a] можно подходящим образом выбрать из диапазона от 0,5 до 10 моль на 1 моль соединения формулы [6a]. Предпочтительно оно составляет от 1,0 до 1,2 моль.

Примеры кислоты Льюиса, которую можно применять, включают в себя литийорганические соединения, такие как метиллитий, этиллитий, *n*-бутиллитий, втор-бутиллитий, трет-бутиллитий и бензиллитий; реактив Гриньяра, такой как метилмагниййодид и этилмагнийбромид; соединения металлов, такие как соединения лития, калия и натрия; медьорганические соединения, полученные из реактива Гриньяра или металлорганического соединения и соли одновалентной меди; амиды щелочных металлов, такие как диизопропиламид лития (LDA); и органические амины, такие как триэтиламин, пиридин, 4-диметиламинопиридин, *N,N*-диметиланилин и 1,8-дизабицикло[5.4.0]ундец-7-ен (DBU). Особенно предпочтительными являются *n*-бутиллитий и диизопропиламид лития (LDA). Применяемое количество кислоты Льюиса можно подходящим образом выбрать из диапазона от 0,5 до 10 моль на 1 моль соединения формулы [5a]. Предпочтительно оно составляет от 1,0 до 1,2 моль.

Примеры растворителя, который можно применять для данного способа, включают в себя растворители, описанные выше для реакции 1 способа получения 1. Особенно предпочтительными являются диэтиловый простой эфир и тетрагидрофуран. Температуру реакции выбирают из диапазона от -20°C до точки кипения применяемого инертного растворителя. Реакцию предпочтительно проводят в диапазоне от 0 до 100°C . Время реакции изменяется в зависимости от температуры реакции, исходных реагентов, количества реагентов и т.д. Обычно оно составляет от 10 мин до 48 ч.

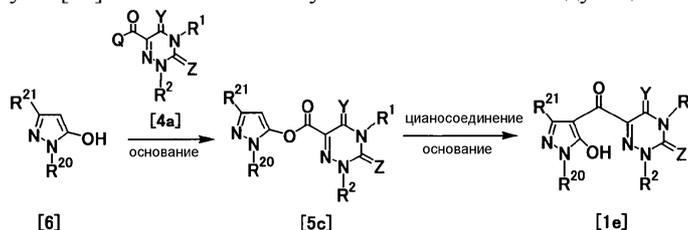
После завершения реакции соединение формулы [1d], т.е. целевое соединение данной реакции, можно выделить из реакционной системы обычным способом и, если необходимо, можно очистить таким способом, как колоночная хроматография и перекристаллизация.

Соединение формулы [1d] имеет много таутомеров, показанных ниже, и все его таутомеры включены в изобретение.



Способ получения 5.

Соединение формулы [1e] можно также получить способом со следующей схемой реакций:



(в формулах каждый из R^1 , R^2 , R^{20} , R^{21} , Y и Z имеет такие же значения, какие указаны выше, и Q представляет собой уходящую группу, такую как атом галогена, алкилкарбонилксигруппу, алкоксикарбонилксигруппу, галогеналкилкарбонилксигруппу, галогеналкоксикарбонилксигруппу, бензоилксигруппу, пиридинильную группу и имидазолильную группу, как описано выше).

Конкретно, соединение формулы [5c] можно получить реакцией соединения формулы [6] и соединения формулы [4a] в растворителе в присутствии основания и соединение формулы [1e] можно получить реакцией соединения формулы [5c] и цианосоединения в присутствии основания.

В указанной выше реакции количество применяемого соединения формулы [4a] для получения со-

единения формулы [5с] из соединения формулы [6] можно подходящим образом выбрать из диапазона от 0,1 до 10 моль на 1 моль соединения формулы [6]. Предпочтительно оно составляет от 1,0 до 1,2 моль.

Примеры основания и растворителя, которые можно применять, включают в себя основания и растворители, описанные выше для реакции 1 способа получения 1. Температуру реакции выбирают из диапазона от -20°C до точки кипения применяемого инертного растворителя. Реакцию предпочтительно проводят в диапазоне температур от 0 до 100°C . Время реакции изменяется в зависимости от температуры реакции, исходных реагентов, количества реагентов и т.д. Обычно оно составляет от 10 мин до 48 ч.

Примеры цианосоединения, которое можно применять для указанной выше реакции для получения соединения формулы [1e] из соединения формулы [5с], включают в себя цианид калия, цианид натрия, цианогидрин ацетона, цианид водорода и цианид водорода, осажденный на полимер. Применяемое количество цианосоединения можно подходящим образом выбрать из диапазона 0,01-1,0 моль на 1 моль соединения формулы [6]. Предпочтительно оно составляет от 0,05 до 0,2 моль.

Примеры основания, которое можно применять, включают в себя основания, описанные выше для реакции 1 способа получения 1. Применяемое количество основания можно подходящим образом выбрать из диапазона 0,1-1,0 моль на 1 моль соединения формулы [6]. Предпочтительно оно составляет от 1,0 до 1,2 моль.

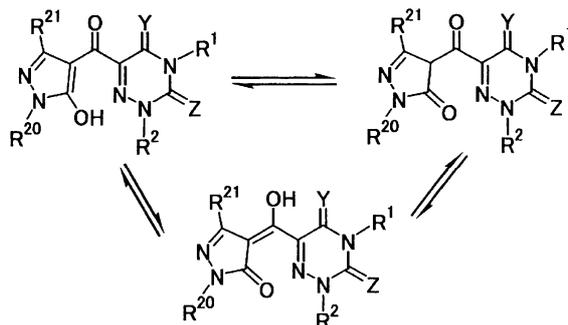
Примеры растворителя, который можно применять для данной реакции, включают в себя растворители, описанные выше для реакции 1 способа получения 1.

Температуру реакции выбирают из диапазона от -20°C до точки кипения применяемого инертного растворителя. Реакцию предпочтительно проводят в диапазоне от 0 до 100°C .

Время реакции изменяется в зависимости от температуры реакции, исходных реагентов, количества реагентов и т.д. Обычно оно составляет от 10 мин до 48 ч.

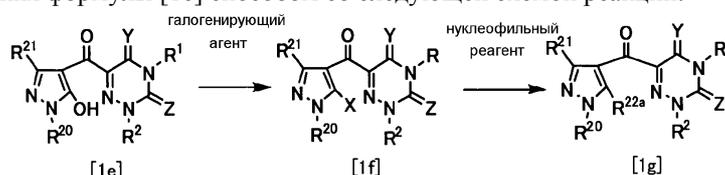
После завершения реакции соединение формулы [1e], т.е. целевое соединение данной реакции, можно выделить из реакционной системы обычным способом и, если необходимо, можно очистить таким способом, как колоночная хроматография и перекристаллизация.

Соединение формулы [1e] имеет много таутомеров, показанных ниже, и все его таутомеры включены в изобретение.



Способ получения 6.

Соединение формулы [1g], у которого заместитель в кольце пиразола модифицирован, можно также получить из соединения формулы [1e] способом со следующей схемой реакций:



(в формулах каждый из R^1 , R^2 , R^{20} , R^{21} , Y и Z имеет такие же значения, какие указаны выше, R^{22a} представляет собой аминогруппу, цианогруппу, изотиоцианатную группу, изоцианатную группу, гидроксикарбонилксигруппу, C_1 - C_6 алкоксикарбонилксигруппу, бензилоксикарбонилксигруппу, которая может быть замещена заместителем, выбранным из группы заместителей α , C_1 - C_6 алкоксигруппу, C_2 - C_6 алкенилоксигруппу, C_2 - C_6 алкинилоксигруппу, C_3 - C_6 циклоалкилоксигруппу, цианометиленоксигруппу, C_3 - C_6 циклоалкил C_1 - C_6 алкилоксигруппу, C_1 - C_6 алкилкарбонилксигруппу, C_1 - C_6 галогеналкилкарбонилксигруппу, C_2 - C_6 алкенилкарбонилксигруппу, C_2 - C_6 галогеналкенилкарбонилксигруппу, C_2 - C_6 алкинилкарбонилксигруппу, C_2 - C_6 галогеналкинилкарбонилксигруппу, C_1 - C_6 алкоксикарбонил C_1 - C_6 алкоксигруппу, фенилоксигруппу, которая может быть замещена заместителем, выбранным из группы заместителей α , бензилоксигруппу, которая может быть замещена заместителем, выбранным из группы заместителей α , фенилкарбонилксигруппу, которая может быть замещена заместителем, выбранным из группы заместителей α , бензилкарбонилксигруппу, которая может быть замещена заместителем, выбранным из группы заместителей α , фенилкарбонил C_1 - C_6 алкилоксигруппу, которая может быть замещена заместителем, выбранным из группы заместителей α , C_1 - C_{10} алкилсульфонилксигруппу, фенилсуль-

фонилоксигруппу, которая может быть замещена заместителем, выбранным из группы заместителей α , бензилсульфонилоксигруппу, которая может быть замещена заместителем, выбранным из группы заместителей α , C_1 - C_{10} алкилтиогруппу, C_1 - C_{10} алкилсульфинильную группу, C_1 - C_{10} алкилсульфонильную группу, C_1 - C_6 галогеналкилтиогруппу, C_1 - C_6 галогеналкилсульфинильную группу, C_1 - C_6 галогеналкилсульфонильную группу, C_2 - C_6 алкенилтиогруппу, C_2 - C_6 алкенилсульфинильную группу, C_2 - C_6 алкенилсульфонильную группу, C_2 - C_6 алкинилтиогруппу, C_2 - C_6 алкинилсульфинильную группу, C_2 - C_6 алкинилсульфонильную группу, фенилтиогруппу, которая может быть замещена заместителем, выбранным из группы заместителей α , бензилтиогруппу, которая может быть замещена заместителем, выбранным из группы заместителей α , фенилсульфинильную группу, которая может быть замещена заместителем, выбранным из группы заместителей α , бензилсульфинильную группу, которая может быть замещена заместителем, выбранным из группы заместителей α , фенилсульфонильную группу, которая может быть замещена заместителем, выбранным из группы заместителей α , бензилсульфонильную группу, которая может быть замещена заместителем, выбранным из группы заместителей α , C_1 - C_{10} алкиламиногруппу, ди(C_1 - C_{10} алкил)аминогруппу, C_1 - C_6 алкоксихарбониламиногруппу, C_1 - C_6 алкоксигруппу, замещенную гетероциклической группой, имеющей 3-10 атомов углерода и один или несколько гетероатомов, которые являются одинаковыми или отличными друг от друга и выбраны из атома кислорода, атома серы и атома азота [группа может быть замещена одним заместителем, выбранным из группы заместителей α , или 2-5 заместителями, которые являются одинаковыми или отличными друг от друга и выбраны из группы заместителей α], гетероциклическую группу, имеющую 3-10 атомов углерода и один или несколько гетероатомов, которые являются одинаковыми или отличными друг от друга и выбраны из атома кислорода, атома серы и атома азота [группа может быть замещена одним заместителем, выбранным из группы заместителей α , или 2-5 заместителями, которые являются одинаковыми или отличными друг от друга и выбраны из группы заместителей α], или гетероциклиоксигруппу, имеющую 3-10 атомов углерода и один или несколько гетероатомов, которые являются одинаковыми или отличными друг от друга и выбраны из атома кислорода, атома серы и атома азота [группа может быть замещена одним заместителем, выбранным из группы заместителей α , или 2-5 заместителями, которые являются одинаковыми или отличными друг от друга и выбраны из группы заместителей α], и X представляет собой атом галогена).

Конкретно, соединение формулы [1f] можно получить реакцией соединения формулы [1e] и галогенирующего агента и соединение формулы [1g] можно получить реакцией его с нуклеофильным реагентом.

Примеры галогенирующего агента, который можно применять для реакции получения соединения формулы [1f] из соединения формулы [1e], включают в себя тионилхлорид, тионилбромид, оксихлорид фосфора, оксидбромид фосфора, трибромид фенилтриметиламмония и трибромид кислоты Мелдрума.

Применяемое количество галогенирующего агента можно подходящим образом выбрать из диапазона от 0,1 до 10 моль на 1 моль соединения формулы [1e]. Предпочтительно оно составляет от 1,0 до 1,2 моль.

Примеры растворителя, который можно применять для данной реакции, включают в себя растворители, описанные выше для реакции 1 способа получения 1. Температуру реакции выбирают из диапазона от -20°C до точки кипения применяемого инертного растворителя. Реакцию предпочтительно проводят в диапазоне от 0 до 100°C . Время реакции изменяется в зависимости от температуры реакции, исходных реагентов, количества реагентов и т.д. Обычно оно составляет от 10 мин до 48 ч.

Нуклеофильным реагентом для реакции получения соединения формулы [1g] из соединения формулы [1f] является, например, соединение, представленное формулой $R^{22a}\text{-H}$, и примеры его включают в себя спирты, такие как метанол, этанол и бензиловый спирт; меркаптаны, такие как метилмеркаптан и этилмеркаптан; амины, такие как аммиак, метиламин и этиламин; фенолы, такие как п-крезол и фенол; тиофенолы, такие как п-хлортиофенол; C_1 - C_6 алкановые кислоты, такие как уксусная кислота, и бензойные кислоты. Применяемое количество нуклеофильного реагента можно подходящим образом выбрать из диапазона от 0,1 до 10 моль на 1 моль соединения формулы [1f]. Предпочтительно оно составляет от 1,0 до 1,2 моль.

Примеры растворителя, который можно применять для данной реакции, включают в себя растворители, описанные выше для реакции 1 способа получения 1.

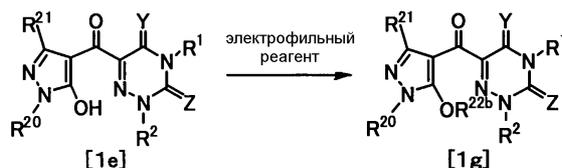
Температуру реакции выбирают из диапазона от -20°C до точки кипения применяемого инертного растворителя. Реакцию предпочтительно проводят в диапазоне температур от 0 до 100°C .

Время реакции изменяется в зависимости от температуры реакции, исходных реагентов, количества реагентов и т.д. Обычно оно составляет от 10 мин до 48 ч.

После завершения реакции соединения формулы [1g], т.е. целевое соединение данной реакции, можно выделить из реакционной системы обычным способом и, если необходимо, можно очистить таким способом, как колоночная хроматография и перекристаллизация.

Способ получения 7.

Соединение формулы [1g] можно также получить способом со следующей схемой реакций:



(в формуле каждый из R^1 , R^2 , R^{20} , R^{21} , Y и Z имеет такие же значения, какие указаны выше, R^{22b} представляет собой гидроксикарбонильную группу, C_1 - C_6 алкоксикарбонильную группу, бензилоксикарбонильную группу, которая может быть замещена заместителем, выбранным из группы заместителей α , C_1 - C_6 алкильную группу, C_2 - C_6 алкенильную группу, C_2 - C_6 алкинильную группу, C_3 - C_6 циклоалкильную группу, цианометиленовую группу, C_3 - C_6 циклоалкил C_1 - C_6 алкильную группу, C_1 - C_6 алкилкарбонильную группу, C_1 - C_{10} алкилтиокарбонильную группу, C_1 - C_6 галогеналкилкарбонильную группу, C_2 - C_6 алкенилкарбонильную группу, C_2 - C_6 галогеналкенилкарбонильную группу, C_2 - C_6 алкинилкарбонильную группу, C_2 - C_6 галогеналкинилкарбонильную группу, C_1 - C_6 алкоксикарбонил C_1 - C_6 алкильную группу, C_1 - C_{10} алкилсульфонильную группу, фенильную группу, которая может быть замещена заместителем, выбранным из группы заместителей α , бензильную группу, которая может быть замещена заместителем, выбранным из группы заместителей α , фенилкарбонильную группу, которая может быть замещена заместителем, выбранным из группы заместителей α , бензилкарбонильную группу, которая может быть замещена заместителем, выбранным из группы заместителей α , фенилсульфонильную группу, которая может быть замещена заместителем, выбранным из группы заместителей α , фенилкарбонил C_1 - C_6 алкильную группу, которая может быть замещена заместителем, выбранным из группы заместителей α , или гетероциклическую группу, имеющую 3-10 атомов углерода и один или несколько гетероатомов, которые являются одинаковыми или отличными друг от друга и выбраны из атома кислорода, атома серы и атома азота [группа может быть замещена одним заместителем, выбранным из группы заместителей α , или 2-5 заместителями, которые являются одинаковыми или отличными друг от друга и выбраны из группы заместителей α]).

Конкретно, соединение формулы [1g] можно получить реакцией соединения формулы [1e] и электрофильного реагента в растворителе и в присутствии или в отсутствие основания.

Электрофильным реагентом, который можно применять, является соединение, представленное формулой R^{22b} - L_a (L_a представляет собой уходящую группу), и примеры его включают в себя C_1 - C_6 алкилгалогенид, такой как метилиодид и пропилхлорид; бензилгалогенид, такой как бензилбромид; C_1 - C_6 алкилкарбонилгалогенид, такой как ацетилхлорид и пропионилхлорид; бензоилгалогенид, такой как бензоилхлорид; C_2 - C_6 алкенилкарбонилгалогенид, такой как метакрилхлорид и кротонилхлорид; C_2 - C_6 алкинилкарбонилгалогенид, такой как 4-пентиноилхлорид; C_1 - C_6 алкилсульфонилгалогенид, такой как метансульфонилхлорид и этансульфонилхлорид; бензолсульфонилгалогенид, такой как бензолсульфонилхлорид и *p*-толуолсульфонилхлорид; и ди C_1 - C_6 алкилсульфатный эфир, такой как диметилсульфат и диэтилсульфат. Применяемое количество электрофильного реагента можно подходящим образом выбрать из диапазона от 0,1 до 10 моль на 1 моль соединения формулы [1e]. Предпочтительно оно составляет от 1,0 до 1,2 моль.

Примеры основания и растворителя, которые можно применять для данной реакции, включают в себя основания и растворители, описанные выше для реакции 1 способа получения 1.

Применяемое количество основания можно подходящим образом выбрать из диапазона от 0,1 до 10 моль на 1 моль соединения формулы [1e]. Предпочтительно оно составляет от 1,0 до 1,2 моль.

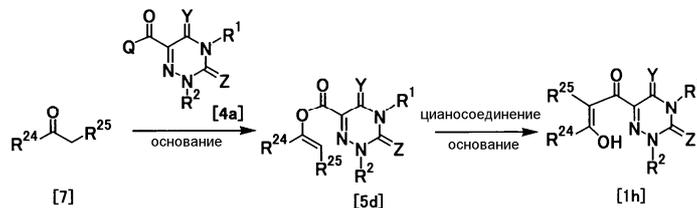
Температуру реакции выбирают из диапазона от -20°C до точки кипения применяемого инертного растворителя. Реакцию предпочтительно проводят в диапазоне температур от 0 до 100°C .

Время реакции изменяется в зависимости от температуры реакции, исходных реагентов, количества реагентов и т.д. Обычно оно составляет от 10 мин до 48 ч.

После завершения реакции соединение формулы [1g], т.е. целевое соединение данной реакции, можно выделить из реакционной системы обычным способом и, если необходимо, можно очистить таким способом, как колоночная хроматография и перекристаллизация.

Способ получения 8.

Соединение формулы [1h] можно также получить способом со следующей схемой реакций:



(в формулах каждый из R^1 , R^2 , R^{24} , R^{25} , Y и Z имеет такие же значения, какие указаны выше, и Q представляет собой уходящую группу, такую как атом галогена, алкилкарбонилксигруппа, алкоксикарбонилксигруппа, галогеналкилкарбонилксигруппа, галогеналкоксикарбонилксигруппа, бензоилксигруппа, пиридинная группа и имидазолильная группа, как описано выше).

Конкретно, соединение формулы [5d] можно получить реакцией соединения формулы [7] и соединения формулы [4a] в растворителе и в присутствии основания и соединение формулы [1h] можно получить реакцией соединения формулы [5d] и цианосоединения в присутствии основания.

В указанной выше реакции применяемое количество соединения формулы [4a] для получения соединения формулы [5d] из соединения формулы [7] можно подходящим образом выбрать из диапазона 0,1-10 моль на 1 моль соединения формулы [7]. Предпочтительно оно составляет от 1,0 до 1,2 моль.

Примеры основания, которое можно применять, включают в себя основания, описанные выше для реакции 1 способа получения 1. Применяемое количество основания можно подходящим образом выбрать из диапазона 0,1-10 моль на 1 моль соединения формулы [7]. Предпочтительно оно составляет от 1,0 до 1,2 моль.

Примеры растворителя, который можно применять, включают в себя растворители, описанные выше для реакции 1 способа получения 1.

Примеры цианосоединения, которое можно применять для указанной выше реакции для получения соединения формулы [1h] из соединения формулы [5d], включают в себя цианид калия, цианид натрия, цианогидрин ацетона, цианид водорода и цианид водорода, нанесенный на полимер. Применяемое количество цианосоединения можно подходящим образом выбрать из диапазона 0,01-1,0 моль на 1 моль соединения формулы [5d]. Предпочтительно оно составляет от 0,05 до 0,2 моль.

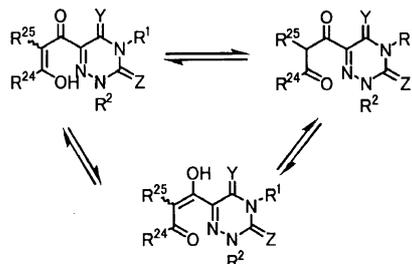
Примеры основания, которое можно применять, включают в себя основания, описанные выше для реакции 1 способа получения 1. Применяемое количество основания можно подходящим образом выбрать из диапазона 0,1-1,0 моль на 1 моль соединения формулы [5d]. Предпочтительно оно составляет от 1,0 до 1,2 моль.

Примеры растворителя, который можно применять, включают в себя растворители, описанные выше для реакции 1 способа получения 1.

Температуру реакции выбирают из диапазона от -20°C до точки кипения применяемого инертного растворителя. Реакцию предпочтительно проводят в диапазоне температур от 0 до 100°C . Время реакции изменяется в зависимости от температуры реакции, исходных реагентов, количества реагентов и т.д. Обычно оно составляет от 10 мин до 48 ч.

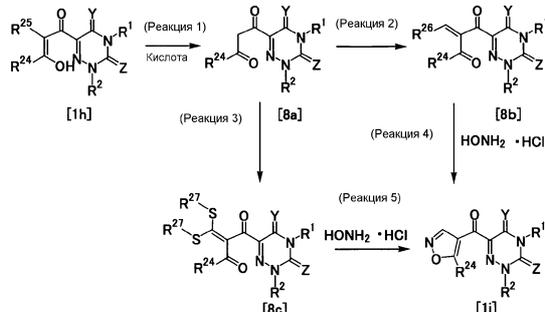
После завершения реакции соединение формулы [1h], т.е. целевое соединение данной реакции, можно выделить из реакционной системы обычным способом и, если нужно, можно очистить таким способом, как колоночная хроматография и перекристаллизация.

Соединение формулы [1h] изобретения имеет много таутомеров, показанных ниже, и все они включены в изобретение.



Способ получения 9.

Соединение формулы [1i] можно получить способом со следующей схемой реакций:



(в формулах каждый из R^1 , R^2 , R^{24} , Y и Z имеет такие же значения, какие указаны выше, R^{25} представляет собой C_1 - C_6 алкоксикарбонильную группу, R^{26} представляет собой алкоксигруппу, галогеналкоксигруппу, циклоалкоксигруппу или диметиламиногруппу и R^{27} представляет собой алкильную группу или бензильную группу).

Реакция 1.

В этой реакции соединение формулы [8a] можно получить реакцией соединения формулы [1h] и кислоты с применением или без применения растворителя.

Примеры кислоты, которую можно применять для данной реакции, включают в себя сульфоновые кислоты, такие как п-толуолсульфоновая кислота. Применяемое количество кислоты можно подходящим образом выбрать из диапазона 0,1-10 моль на 1 моль соединения формулы [1h]. Предпочтительно оно составляет от 1,0 до 1,2 моль.

Примеры растворителя, который можно применять, включают в себя растворители, описанные выше для реакции 1 способа получения 1.

Температуру реакции выбирают из диапазона от -20°C до точки кипения применяемого инертного растворителя. Реакцию предпочтительно проводят в диапазоне температур от 0°C до 100°C . Время реакции изменяется в зависимости от температуры реакции, исходных реагентов, количества реагентов и т.д. Обычно оно составляет от 10 мин до 48 ч.

Реакция 2.

Реакцией соединения формулы [8a] и ортоэфира муравьиной кислоты в диметилацетале N,N-диметилацетамида или уксусном ангидриде можно получить соединение формулы [8b]. Применяемое количество диметилацетала N,N-диметилацетамида и ортоэфира муравьиной кислоты можно подходящим образом выбрать из диапазона 0,1-10 моль на 1 моль соединения формулы [8a]. Предпочтительно оно составляет от 1,0 до 3,0 моль.

Температуру реакции выбирают из диапазона от -20°C до точки кипения применяемого инертного растворителя. Реакцию предпочтительно проводят в диапазоне температур от 0°C до 150°C . Время реакции изменяется в зависимости от температуры реакции, исходных реагентов, количества реагентов и т.д. Обычно оно составляет от 10 мин до 48 ч.

Реакция 3.

Соединение формулы [8c] можно получить реакцией соединения формулы [8a] и дисульфида углерода и, без выделения продукта, добавлением алкилгалогенида, такого как метилиодид, или бензилгалогенида, такого как бензилбромид. Применяемое количество дисульфида углерода можно подходящим образом выбрать из диапазона 0,1-10 моль на 1 моль соединения формулы [8a]. Предпочтительно оно составляет от 1,0 до 1,2 моль. Применяемое количество галогенида можно подходящим образом выбрать из диапазона 0,1-10 моль на 1 моль соединения формулы [8a]. Предпочтительно оно составляет от 2,0 до 2,4 моль. Примеры растворителя, который можно применять для данной реакции, включают в себя растворители, описанные выше для реакции 1 способа получения 1.

Температуру реакции выбирают из диапазона от -20°C до точки кипения применяемого инертного растворителя. Реакцию предпочтительно проводят в диапазоне температур от 0°C до 100°C . Время реакции изменяется в зависимости от температуры реакции, исходных реагентов, количества реагентов и т.д. Обычно оно составляет от 10 мин до 48 ч.

Реакции 4 и 5.

Соединение формулы [1i] можно получить реакцией соединения формулы [8b] или соединения формулы [8c], полученного указанной выше реакцией 2 или реакцией 3, и гидрохлорида гидросиламина в растворителе.

Применяемое количество гидрохлорида гидросиламина можно подходящим образом выбрать из диапазона 0,1-10 моль на 1 моль соединения формулы [8b] или соединения формулы [8c]. Предпочтительно оно составляет от 1,0 до 1,2 моль.

Примеры растворителя, который можно применять для данной реакции, включают в себя растворители, описанные выше для реакции 1 способа получения 1.

Температуру реакции выбирают из диапазона от -20°C до точки кипения применяемого инертного растворителя. Реакцию предпочтительно проводят в диапазоне температур от 0°C до 100°C .

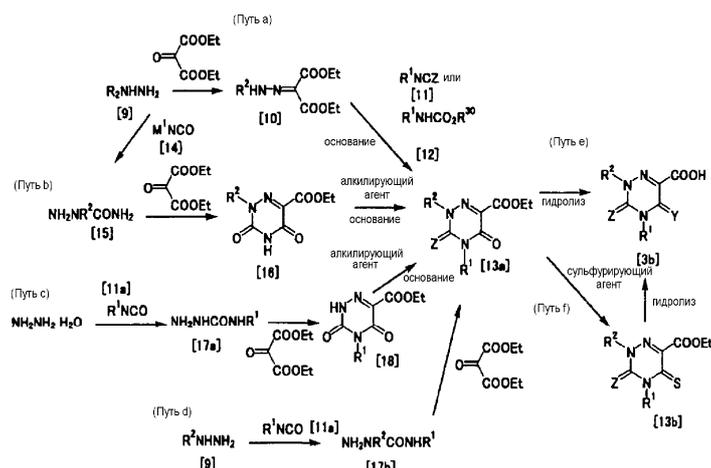
Время реакции изменяется в зависимости от температуры реакции, исходных реагентов, количества реагентов и т.д. Обычно оно составляет от 10 мин до 48 ч.

После завершения реакции соединение формулы [1i], т.е. целевое соединение данной реакции, можно выделить из реакционной системы обычным способом и, если необходимо, очистить таким способом, как колоночная хроматография и перекристаллизация.

Ниже в контексте указывается способ получения синтетических промежуточных продуктов соединений изобретения.

Способ получения 10.

Соединение формулы [3b] можно получить способом со следующей схемой реакций:



(в формулах каждый из R^1 , R^2 , Y и Z имеет такие же значения, какие указаны выше, R^{30} представляет собой фенильную группу или алкильную группу и M^1 представляет собой натрий, калий или триметилсилил).

Путь а.

Конкретно, соединение формулы [10] можно получить реакцией соединения формулы [9] и диэтилкетомалоната. Кроме того, соединение формулы [13a] можно получить реакцией соединения формулы [10] и соединения формулы [11] или соединения формулы [12] в присутствии основания.

Применяемое количество диэтилкетомалоната для реакции получения соединения формулы [10] из соединения формулы [9] можно подходящим образом выбрать из диапазона 1,0-1,5 моль на 1 моль соединения формулы [9]. Предпочтительно оно составляет от 1,0 до 1,2 моль.

Примеры растворителя, который можно применять для данной реакции, включают в себя растворители, описанные выше для реакции 1 способа получения 1.

Температуру реакции выбирают из диапазона от -20°C до точки кипения применяемого инертного растворителя. Реакцию предпочтительно проводят в диапазоне температур от 0 до 100°C . Время реакции изменяется в зависимости от температуры реакции, исходных реагентов, количества реагентов и т.д. Обычно оно составляет от 10 мин до 48 ч.

Применяемое количество соединения формулы [11] или соединения формулы [12] для реакции получения соединения формулы [13a] из соединения формулы [10] можно подходящим образом выбрать из диапазона 1,0-1,5 моль на 1 моль соединения формулы [10]. Предпочтительно оно составляет от 1,0 до 1,2 моль.

Примеры основания, которое можно применять для данной реакции, включают в себя основания, описанные выше для реакции 1 способа получения 1. Применяемое количество основания можно подходящим образом выбрать из диапазона 0,1-1,0 моль на 1 моль соединения формулы [10]. Предпочтительно оно составляет от 1,0 до 1,2 моль.

Примеры растворителя, который можно применять для данной реакции, включают в себя растворители, описанные выше для реакции 1 способа получения 1.

Температуру реакции выбирают из диапазона от -20°C до точки кипения применяемого инертного растворителя. Реакцию предпочтительно проводят в диапазоне температур от 0 до 100°C .

Время реакции изменяется в зависимости от температуры реакции, исходных реагентов, количества реагентов и т.д. Обычно оно составляет от 10 мин до 48 ч.

Путь б.

Конкретно, соединение формулы [15] можно получить реакцией соединения формулы [9] и соединения формулы [14]. Кроме того, соединение формулы [16] можно получить реакцией соединения формулы [15] и диэтилкетомалоната. Кроме того, соединение формулы [13a] можно получить реакцией соединения формулы [16] и алкилирующего агента в присутствии основания.

Применяемое количество соединения формулы [14] для реакции получения соединения формулы [15] из соединения формулы [9] можно подходящим образом выбрать из диапазона 1,0-1,5 моль на 1 моль соединения формулы [9]. Предпочтительно оно составляет от 1,0 до 1,2 моль.

Примеры растворителя, который можно применять для данной реакции, включают в себя растворители, описанные выше для реакции 1 способа получения 1.

Температуру реакции выбирают из диапазона от -20°C до точки кипения применяемого инертного растворителя. Реакцию предпочтительно проводят в диапазоне температур от 0 до 100°C . Время реакции изменяется в зависимости от температуры реакции, исходных реагентов, количества реагентов и т.д. Обычно оно составляет от 10 мин до 48 ч.

Применяемое количество диэтилкетомалоната для реакции получения соединения формулы [16] из соединения формулы [15] можно подходящим образом выбрать из диапазона 1,0-1,5 моль на 1 моль со-

единения формулы [15]. Предпочтительно оно составляет от 1,0 до 1,2 моль.

Примеры растворителя, который можно применять для данной реакции, включают в себя растворители, описанные выше для реакции 1 способа получения 1.

Температуру реакции выбирают из диапазона от -20°C до точки кипения применяемого инертного растворителя. Реакцию предпочтительно проводят в диапазоне температур от 0 до 100°C .

Время реакции изменяется в зависимости от температуры реакции, исходных реагентов, количества реагентов и т.д. Обычно оно составляет от 10 мин до 48 ч.

Применяемое количество алкилирующего агента для реакции получения соединения формулы [13a] из соединения формулы [16] можно подходящим образом выбрать из диапазона 1,0-3,0 моль на 1 моль соединения формулы [16]. Предпочтительно оно составляет от 1,0 до 1,5 моль.

Примеры алкилирующего агента, который можно применять, включают в себя алкилсульфаты, такие как диметилсульфат и диэтилсульфат; алкилгалогениды, такие как метилиодид, этилиодид, бензилхлорид, бензилбромид, пропаргилбромид, этилбромацетат и хлорацетонитрил; и эфиры сульфоновых кислот, такие как этоксиэтил-*p*-толуолсульфонат и циклопентилметансульфонат.

Примеры оснований, которое можно применять для данной реакции, включают в себя основания, описанные выше для реакции 1 способа получения 1. Применяемое количество основания можно подходящим образом выбрать из диапазона 0,1-10 моль на 1 моль соединения формулы [16]. Предпочтительно оно составляет от 1,0 до 1,2 моль.

Примеры растворителя, который можно применять для данной реакции, включают в себя растворители, описанные выше для реакции 1 способа получения 1.

Температуру реакции выбирают из диапазона от -20°C до точки кипения применяемого инертного растворителя. Реакцию предпочтительно проводят в диапазоне температур от 0 до 100°C . Время реакции изменяется в зависимости от температуры реакции, исходных реагентов, количества реагентов и т.д. Обычно оно составляет от 10 мин до 48 ч.

Путь с.

Конкретно, соединение формулы [17a] можно получить реакцией соединения формулы [11a] и гидразингидрата. Кроме того, соединение формулы [18] можно получить реакцией соединения формулы [17] и диэтилкетомалоната. Помимо этого, соединение формулы [13a] можно получить реакцией соединения формулы [18] и алкилирующего агента в присутствии основания.

Применяемое количество гидразингидрата для реакции получения соединения формулы [17a] из соединения формулы [11a] можно подходящим образом выбрать из диапазона 1,0-1,5 моль на 1 моль соединения формулы [9]. Предпочтительно оно составляет от 1,0 до 1,2 моль.

Примеры растворителя, который можно применять для данной реакции, включают в себя растворители, описанные выше для реакции 1 способа получения 1.

Температуру реакции выбирают из диапазона от -20°C до точки кипения применяемого инертного растворителя. Реакцию предпочтительно проводят в диапазоне температур от 0 до 100°C . Время реакции изменяется в зависимости от температуры реакции, исходных реагентов, количества реагентов и т.д. Обычно оно составляет от 10 мин до 48 ч.

Применяемое количество диэтилкетомалоната для реакции получения соединения формулы [18] из соединения формулы [17a] можно подходящим образом выбрать из диапазона 1,0-1,5 моль на 1 моль соединения формулы [17a]. Предпочтительно оно составляет от 1,0 до 1,2 моль.

Примеры растворителя, который можно применять для данной реакции, включают в себя растворители, описанные выше для реакции 1 способа получения 1.

Температуру реакции выбирают из диапазона от -20°C до точки кипения применяемого инертного растворителя. Реакцию предпочтительно проводят в диапазоне температур от 0 до 100°C . Время реакции изменяется в зависимости от температуры реакции, исходных реагентов, количества реагентов и т.д. Обычно оно составляет от 10 мин до 48 ч.

Применяемое количество алкилирующего агента для реакции получения соединения формулы [13a] из соединения формулы [18] можно подходящим образом выбрать из диапазона 1,0-3,0 моль на 1 моль соединения формулы [18]. Предпочтительно оно составляет от 1,0 до 1,5 моль.

Примеры алкилирующего агента, который можно применять, включают в себя алкилсульфаты, такие как диметилсульфат и диэтилсульфат; алкилгалогениды, такие как метилиодид, этилиодид, бензилхлорид, бензилбромид, пропаргилбромид, этилбромацетат и хлорацетонитрил; и эфиры сульфоновых кислот, такие как этоксиэтил-*p*-толуолсульфонат и циклопентилметансульфонат.

Примеры оснований, которые можно применять для данной реакции, включают в себя основания, описанные выше для реакции 1 способа получения 1. Применяемое количество основания можно подходящим образом выбрать из диапазона 0,1-10 моль на 1 моль соединения формулы [18]. Предпочтительно оно составляет от 1,0 до 1,2 моль.

Примеры растворителя, который можно применять для данной реакции, включают в себя растворители, описанные выше для реакции 1 способа получения 1.

Температуру реакции выбирают из диапазона от -20°C до точки кипения применяемого инертного растворителя. Реакцию предпочтительно проводят в диапазоне температур от 0 до 100°C . Время реакции

изменяется в зависимости от температуры реакции, исходных реагентов, количества реагентов и т.д. Обычно оно составляет от 10 мин до 48 ч.

Путь d.

Конкретно, соединение формулы [17b] можно получить реакцией соединения формулы [11a] и соединения формулы [9]. Кроме того, соединение формулы [13a] можно получить реакцией соединения формулы [17b] и диэтилкетомалоната с применением кислоты или основания в зависимости от условия реакции.

Применяемое количество соединения формулы [9] для реакции получения соединения формулы [17b] из соединения формулы [11a] можно подходящим образом выбрать из диапазона 1,0-1,5 моль на 1 моль соединения формулы [9]. Предпочтительно оно составляет от 1,0 до 1,2 моль.

Примеры кислоты, которую можно применять, включают в себя органические кислоты, представленные органической сульфоновой кислотой, такой как *p*-толуолсульфоновая кислота, метансульфовая кислота и бензолсульфовая кислота; кислоты типа галогенида водорода, представленные хлористоводородной кислотой и бромистоводородной кислотой; и неорганические кислоты, такие как серная кислота и фосфорная кислота. Эти кислоты можно применять либо по отдельности, либо в виде комбинации двух или более кислот.

Примеры основания, которое можно применять для данной реакции, включают в себя основания, описанные выше для реакции 1 способа получения 1

Примеры растворителя, который можно применять для данной реакции, включают в себя растворители, описанные выше для реакции 1 способа получения 1.

Температуру реакции выбирают из диапазона от -20°C до точки кипения применяемого инертного растворителя. Реакцию предпочтительно проводят в диапазоне температур от 0 до 100°C. Время реакции изменяется в зависимости от температуры реакции, исходных реагентов, количества реагентов и т.д. Обычно оно составляет от 10 мин до 48 ч.

Применяемое количество диэтилкетомалоната для реакции получения соединения формулы [13a] из соединения формулы [17b] можно подходящим образом выбрать из диапазона 1,0-1,5 моль на 1 моль соединения формулы [17b]. Предпочтительно оно составляет от 1,0 до 1,2 моль.

Примеры растворителя, который можно применять для данной реакции, включают в себя растворители, описанные выше для реакции 1 способа получения 1.

Температуру реакции выбирают из диапазона от -20°C до точки кипения применяемого инертного растворителя. Реакцию предпочтительно проводят в диапазоне температур от 0 до 100°C. Время реакции изменяется в зависимости от температуры реакции, исходных реагентов, количества реагентов и т.д. Обычно оно составляет от 10 мин до 48 ч.

Примеры кислоты включают в себя органические кислоты, такие как *p*-толуолсульфоновая кислота.

Примеры основания включают в себя органические основания, такие как триэтиламин и 1,8-диазабисцикло[5.4.0]ундец-7-ен (DBU), и неорганические основания, такие как гидрид натрия, метоксид натрия и этоксид натрия.

После завершения реакции соединения формулы [13a], т.е. целевое соединение данной реакции, можно выделить из реакционной системы обычным способом и, если необходимо, очистить таким способом, как колоночная хроматография и перекристаллизация.

Путь e.

Конкретно, соединение формулы [3b] можно получить гидролизом соединения формулы [13a].

Что касается реакции получения соединения формулы [3b] из соединения формулы [13a], получение можно проводить гидролизом в воде, органическом растворителе или смеси растворителей в присутствии кислоты или основания.

Примеры основания, которое можно применять, включают в себя основания, описанные выше для реакции 1 способа получения 1.

Применяемое количество основания можно подходящим образом выбрать из диапазона 0,01-100 моль на 1 моль соединения формулы [13a]. Предпочтительно оно составляет от 0,1 до 10 моль.

Примеры кислоты, которую можно применять, включают в себя неорганические кислоты, такие как хлористоводородная кислота, бромистоводородная кислота и серная кислота, и органические кислоты, такие как уксусная кислота и трифторуксусная кислота.

Применяемое количество кислоты можно подходящим образом выбрать из диапазона от 1 моля до избыточного количества на 1 моль соединения формулы [13a]. Предпочтительно оно составляет от 1 до 100 моль.

Примеры органического растворителя, который можно применять, включают в себя смесь растворителей из воды и органического растворителя. Примеры органического растворителя включают в себя спирты, такие как метанол и этанол, простой эфир, такой как тетрагидрофуран, кетоны, такие как ацетон и метилизобутилкетон, амиды, такие как *N,N*-диметилформамид и *N,N*-диметилацетамид, серасодержащие соединения, такие как диметилсульфоксид и сульфолан, ацетонитрил и их смесь.

Применяемое количество растворителя составляет от 0,01 до 100 л на 1 моль соединения формулы [13a]. Предпочтительно оно составляет от 0,1 до 10 л.

Температуру реакции выбирают из диапазона от -20°C до точки кипения применяемого инертного растворителя. Реакцию предпочтительно проводят в диапазоне температур от 0 до 100°C . Время реакции изменяется в зависимости от температуры реакции, исходных реагентов, количества реагентов и т.д. Обычно оно составляет от 10 мин до 48 ч.

Путь f.

Конкретно, соединение формулы [13b] можно получить реакцией соединения формулы [13a] и сульфурлирующего агента. Кроме того, соединение формулы [3b] можно получить гидролизом соединения формулы [13b].

Применяемое количество сульфурлирующего агента для реакции получения соединения формулы [13b] из соединения формулы [13a] можно подходящим образом выбрать из диапазона 1,0-8,0 моль на 1 моль соединения формулы [13a]. Предпочтительно оно составляет от 1,0 до 4,0 моль.

Примеры сульфурлирующего агента, который можно применять, включают в себя дифосфорпентоксид и 2,4-бис-(4-метоксифенил)-1,3,2,4-дитиадифосфетан-2,4-дисульфид.

Применяемое количество сульфурлирующего агента можно подходящим образом выбрать из диапазона 1,0-8,0 моль на 1 моль соединения формулы [13a]. Предпочтительно оно составляет от 1,0 до 4,0 моль.

Примеры растворителя, который можно применять, включают в себя растворители, описанные выше для реакции 1 способа получения 1.

Температуру реакции выбирают из диапазона от -20°C до точки кипения применяемого инертного растворителя. Реакцию предпочтительно проводят в диапазоне температур от 0 до 100°C . Время реакции изменяется в зависимости от температуры реакции, исходных реагентов, количества реагентов и т.д. Обычно оно составляет от 10 мин до 48 ч.

Что касается реакции получения соединения формулы [3b] из соединения формулы [13b], получение можно проводить гидролизом в воде, органическом растворителе или смеси растворителей в присутствии кислоты или основания.

Примеры основания, которое можно применять, включают в себя основания, описанные выше для реакции 1 способа получения 1.

Применяемое количество основания можно подходящим образом выбрать из диапазона 0,01-100 моль на 1 моль соединения формулы [13b]. Предпочтительно оно составляет от 0,1 до 10 моль.

Примеры кислоты, которую можно применять, включают в себя неорганические кислоты, такие как хлористоводородная кислота, бромистоводородная кислота и серная кислота, и органические кислоты, такие как уксусная кислота и трифторуксусная кислота.

Применяемое количество кислоты можно подходящим образом выбрать из диапазона от 1 моль до избыточного количества на 1 моль соединения формулы [13b]. Предпочтительно оно составляет от 1 до 100 моль.

Примеры органического растворителя, который можно применять, включают в себя смесь растворителей из воды и органического растворителя. Примеры органического растворителя включают в себя спирты, такие как метанол и этанол, простой эфир, такой как тетрагидрофуран, кетоны, такие как ацетон и метилизобутилкетон, амиды, такие как N,N-диметилформамид и N,N-диметилацетамид, серасодержащие соединения, такие как диметилсульфоксид и сульфолан, ацетонитрил и их смесь.

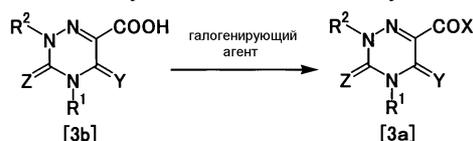
Применяемое количество растворителя составляет от 0,01 до 100 л на 1 моль соединения формулы [13b]. Предпочтительно оно составляет от 0,1 до 10 л.

Температуру реакции выбирают из диапазона от -20°C до точки кипения применяемого инертного растворителя. Реакцию предпочтительно проводят в диапазоне температур от 0 до 100°C . Время реакции изменяется в зависимости от температуры реакции, исходных реагентов, количества реагентов и т.д. Обычно оно составляет от 10 мин до 48 ч.

После завершения реакции соединение формулы [3b], т.е. целевое соединение данной реакции, можно выделить из реакционной системы обычным способом и, если необходимо, очистить таким способом, как колоночная хроматография и перекристаллизация.

Способ 1 синтеза промежуточных продуктов.

Соединение формулы [3a] можно получить согласно способу со следующей схемой реакций:



(в формулах R^1 , R^2 , Y и Z имеют такие же значения, какие указаны выше, и X представляет собой атом хлора или брома).

Конкретно, соединение формулы [3a] можно получить реакцией соединения формулы [3b] и подходящего галогенирующего агента с применением или без применения растворителя.

Примеры галогенирующего агента, который можно применять, включают в себя оксалилхлорид и тионилхлорид.

Применяемое количество галогенирующего агента можно подходящим образом выбрать из диапазона от 0,01 до 20 моль на 1 моль соединения формулы [3b]. Предпочтительно оно составляет от 1 до 10 моль.

Примеры растворителя включают в себя галогенированные углеводороды, такие как дихлорметан и хлороформ, простые эфиры, такие как диэтиловый эфир и тетрагидрофуран, и ароматические углеводороды, такие как бензол и толуол.

Применяемое количество растворителя составляет от 0,01 до 100 л на 1 моль соединения формулы [3b]. Предпочтительно оно составляет от 0,1 до 10 л.

Температуру реакции выбирают из диапазона от -20°C до точки кипения применяемого инертного растворителя. Реакцию предпочтительно проводят в диапазоне температур от 0 до 100°C . Время реакции изменяется в зависимости от температуры реакции, исходных реагентов, количества реагентов и т.д. Обычно оно составляет от 10 мин до 48 ч.

После завершения реакции соединение формулы [3a], т.е. целевое соединение данной реакции, можно выделить из реакционной системы обычным способом и, если необходимо, можно очистить таким способом, как колоночная хроматография и перекристаллизация.

Примеры получения промежуточных продуктов [13a] и [3b], которые можно описать в способе получения 10, указаны в табл. 44-67.

Таблица 44

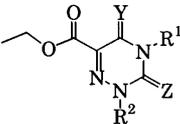
				
№ соединения	R ¹	R ²	Y	Z
IV-1	Me	Me	O	O
IV-2	Et	Me	O	O
IV-3	Pr-n	Me	O	O
IV-4	Pr-i	Me	O	O
IV-5	Bu-n	Me	O	O
IV-6	Bu-i	Me	O	O
IV-7	Bu-s	Me	O	O
IV-8	Bu-t	Me	O	O
IV-9	Hex-n	Me	O	O
IV-10	CH ₂ CF ₃	Me	O	O
IV-11	CH ₂ CH=CH ₂	Me	O	O
IV-12	CH ₂ C(Me)=CH ₂	Me	O	O
IV-13	CH ₂ CH ₂ CH=CMe ₂	Me	O	O
IV-14	CH ₂ C≡CH	Me	O	O
IV-15	CH ₂ C≡CCH ₃	Me	O	O
IV-16	Pr-c	Me	O	O
IV-17	Bu-c	Me	O	O
IV-18	Pen-c	Me	O	O
IV-19	Hex-c	Me	O	O
IV-20	CH ₂ Pr-c	Me	O	O
IV-21	CH ₂ Bu-c	Me	O	O
IV-22	CH ₂ Pen-c	Me	O	O
IV-23	CH ₂ Hex-c	Me	O	O
IV-24	CH ₂ CH=CCl ₂	Me	O	O
IV-25	CH ₂ CCl=CHCl	Me	O	O
IV-26	CH ₂ CH ₂ CH=CCl ₂	Me	O	O
IV-27	CH ₂ CH ₂ C(Me)=CF ₂	Me	O	O
IV-28	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ C(Me)=CF ₂	Me	O	O
IV-29	CH ₂ CH=CF ₂	Me	O	O
IV-30	CH ₂ CH ₂ OMe	Me	O	O
IV-31	CH ₂ CH ₂ OEt	Me	O	O
IV-32	CH(Me)CH ₂ OMe	Me	O	O
IV-33	CH ₂ CH ₂ OCH ₂ CH ₂ OMe	Me	O	O
IV-34	CH ₂ CH ₂ OPr-n	Me	O	O
IV-35	CH ₂ CH ₂ OPr-i	Me	O	O
IV-36	CH ₂ CH ₂ OPr-c	Me	O	O

Таблица 45

№ соединения	R ¹	R ²	Y	Z
IV-37	CH ₂ CH ₂ OBu-c	Me	0	0
IV-38	CH ₂ CH ₂ OPen-c	Me	0	0
IV-39	CH ₂ CH ₂ OHex-c	Me	0	0
IV-40	CH ₂ CH ₂ OCH ₂ CF ₃	Me	0	0
IV-41	CH ₂ CH ₂ CH ₂ OMe	Me	0	0
IV-42	CH=CHMe	Me	0	0
IV-43	CH ₂ SMe	Me	0	0
IV-44	CH ₂ SPr-n	Me	0	0
IV-45	CH ₂ CH ₂ SMe	Me	0	0
IV-46	CH ₂ SOMe	Me	0	0
IV-47	CH ₂ SO ₂ Me	Me	0	0
IV-48	CH ₂ CH ₂ CH ₂ SMe	Me	0	0
IV-49	CH ₂ CH ₂ CH ₂ SO ₂ Me	Me	0	0
IV-50	Ph	Me	0	0
IV-51	Ph(2-Cl)	Me	0	0
IV-52	Ph(3-Cl)	Me	0	0
IV-53	Ph(4-Cl)	Me	0	0
IV-54	Ph(2-F)	Me	0	0
IV-55	Ph(3-F)	Me	0	0
IV-56	Ph(4-F)	Me	0	0
IV-57	Ph(2-Me)	Me	0	0
IV-58	Ph(3-Me)	Me	0	0
IV-59	Ph(4-Me)	Me	0	0
IV-60	Ph(2-OMe)	Me	0	0
IV-61	Ph(3-OMe)	Me	0	0
IV-62	Ph(4-OMe)	Me	0	0
IV-63	Ph(2-CF ₃)	Me	0	0
IV-64	Ph(3-CF ₃)	Me	0	0
IV-65	Ph(4-CF ₃)	Me	0	0
IV-66	Ph(2-NO ₂)	Me	0	0
IV-67	Ph(3-NO ₂)	Me	0	0
IV-68	Ph(4-NO ₂)	Me	0	0
IV-69	Ph(2-OCF ₃)	Me	0	0
IV-70	Ph(3-OCF ₃)	Me	0	0
IV-71	Ph(4-OCF ₃)	Me	0	0
IV-72	Ph(2-CN)	Me	0	0
IV-73	Ph(3-CN)	Me	0	0
IV-74	Ph(4-CN)	Me	0	0
IV-75	Ph(3,4-F ₂)	Me	0	0

Таблица 46

№ соединения	R ¹	R ²	Y	Z
IV-76	Ph(3,5-F ₂)	Me	O	O
IV-77	Ph(2,3-F ₂)	Me	O	O
IV-78	Ph(2,4-F ₂)	Me	O	O
IV-79	Ph(2,5-F ₂)	Me	O	O
IV-80	Ph(2,6-F ₂)	Me	O	O
IV-81	Ph(3,4-Cl ₂)	Me	O	O
IV-82	Ph(3,5-Cl ₂)	Me	O	O
IV-83	Ph(2,3-Cl ₂)	Me	O	O
IV-84	Ph(2,4-Cl ₂)	Me	O	O
IV-85	Ph(2,5-Cl ₂)	Me	O	O
IV-86	Ph(2,6-Cl ₂)	Me	O	O
IV-87	Ph(3,4-Me ₂)	Me	O	O
IV-88	Ph(3,5-Me ₂)	Me	O	O
IV-89	Ph(2,3-Me ₂)	Me	O	O
IV-90	Ph(2,4-Me ₂)	Me	O	O
IV-91	Ph(2,5-Me ₂)	Me	O	O
IV-92	Ph(2,6-Me ₂)	Me	O	O
IV-93	Ph(3,4-(OMe) ₂)	Me	O	O
IV-94	Ph(3,5-(OMe) ₂)	Me	O	O
IV-95	Ph(2,3-(OMe) ₂)	Me	O	O
IV-96	Ph(2,4-(OMe) ₂)	Me	O	O
IV-97	Ph(2,5-(OMe) ₂)	Me	O	O
IV-98	Ph(2,6-(OMe) ₂)	Me	O	O
IV-99	Ph(3-F-4-OMe)	Me	O	O
IV-100	Ph(3-F-5-OMe)	Me	O	O
IV-101	Ph(2-F-3-OMe)	Me	O	O
IV-102	Ph(2-F-4-OMe)	Me	O	O
IV-103	Ph(2-F-5-OMe)	Me	O	O
IV-104	Ph(2-F-6-OMe)	Me	O	O
IV-105	Ph(3-F-4-Me)	Me	O	O
IV-106	Ph(3-F-5-Me)	Me	O	O
IV-107	Ph(2-F-3-Me)	Me	O	O
IV-108	Ph(2-F-4-Me)	Me	O	O
IV-109	Ph(2-F-5-Me)	Me	O	O
IV-110	Ph(2-F-6-Me)	Me	O	O
IV-111	Ph(3-OMe-4-F)	Me	O	O
IV-112	Ph(2-OMe-3-F)	Me	O	O
IV-113	Ph(2-OMe-4-F)	Me	O	O
IV-114	Ph(2-OMe-5-F)	Me	O	O

Таблица 47

№ соединения	R ¹	R ²	Y	Z
IV-115	Ph(3-Me-4-F)	Me	0	0
IV-116	Ph(2-Me-3-F)	Me	0	0
IV-117	Ph(2-Me-4-F)	Me	0	0
IV-118	Ph(2-Me-5-F)	Me	0	0
IV-119	Ph(3-Cl-4-OMe)	Me	0	0
IV-120	Ph(3-Cl-5-OMe)	Me	0	0
IV-121	Ph(2-Cl-3-OMe)	Me	0	0
IV-122	Ph(2-Cl-4-OMe)	Me	0	0
IV-123	Ph(2-Cl-5-OMe)	Me	0	0
IV-124	Ph(2-Cl-6-OMe)	Me	0	0
IV-125	Ph(3-Cl-4-Me)	Me	0	0
IV-126	Ph(3-Cl-5-Me)	Me	0	0
IV-127	Ph(2-Cl-3-Me)	Me	0	0
IV-128	Ph(2-Cl-4-Me)	Me	0	0
IV-129	Ph(2-Cl-5-Me)	Me	0	0
IV-130	Ph(2-Cl-6-Me)	Me	0	0
IV-131	Ph(3-OMe-4-Cl)	Me	0	0
IV-132	Ph(2-OMe-3-Cl)	Me	0	0
IV-133	Ph(2-OMe-4-Cl)	Me	0	0
IV-134	Ph(2-OMe-5-Cl)	Me	0	0
IV-135	Ph(3-Me-4-Cl)	Me	0	0
IV-136	Ph(2-Me-3-Cl)	Me	0	0
IV-137	Ph(2-Me-4-Cl)	Me	0	0
IV-138	Ph(2-Me-5-Cl)	Me	0	0
IV-139	Ph(3-F-4-Cl)	Me	0	0
IV-140	Ph(3-F-5-Cl)	Me	0	0
IV-141	Ph(2-F-3-Cl)	Me	0	0
IV-142	Ph(2-F-4-Cl)	Me	0	0
IV-143	Ph(2-F-5-Cl)	Me	0	0
IV-144	Ph(2-F-6-Cl)	Me	0	0
IV-145	Ph(3-Cl-4-F)	Me	0	0
IV-146	Ph(2-Cl-3-F)	Me	0	0
IV-147	Ph(2-Cl-4-F)	Me	0	0
IV-148	Ph(2-Cl-5-F)	Me	0	0
IV-149	Ph(3-Me-4-OMe)	Me	0	0
IV-150	Ph(3-Me-5-OMe)	Me	0	0
IV-151	Ph(2-Me-3-OMe)	Me	0	0
IV-152	Ph(2-Me-4-OMe)	Me	0	0
IV-153	Ph(2-Me-5-OMe)	Me	0	0

Таблица 48

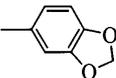
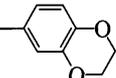
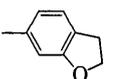
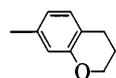
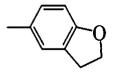
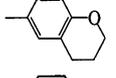
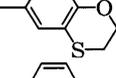
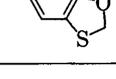
№ соединения	R ¹	R ²	Y	Z
IV-154	Ph(2-Me-6-OMe)	Me	O	O
IV-155	Ph(3-OMe-4-Me)	Me	O	O
IV-156	Ph(2-OMe-3-Me)	Me	O	O
IV-157	Ph(2-OMe-4-Me)	Me	O	O
IV-158	Ph(2-OMe-5-Me)	Me	O	O
IV-159	Ph(3-CN-4-OMe)	Me	O	O
IV-160	Ph(3-OMe-4-CN)	Me	O	O
IV-161	Ph(3-Me-4-CN)	Me	O	O
IV-162	Ph(3-CN-4-Me)	Me	O	O
IV-163	Ph(3-NO ₂ -4-OMe)	Me	O	O
IV-164	Ph(3-OMe-4-NO ₂)	Me	O	O
IV-165	Ph(3-Me-4-NO ₂)	Me	O	O
IV-166	Ph(3-NO ₂ -4-Me)	Me	O	O
IV-167	Ph(3,5-F ₂ -5-OMe)	Me	O	O
IV-168	Ph(3,5-F ₂ -5-Me)	Me	O	O
IV-169	Ph(3,4,5-(OMe) ₃)	Me	O	O
IV-170		Me	O	O
IV-171		Me	O	O
IV-172		Me	O	O
IV-173		Me	O	O
IV-174		Me	O	O
IV-175		Me	O	O
IV-176		Me	O	O
IV-177		Me	O	O

Таблица 49

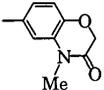
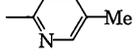
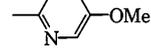
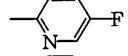
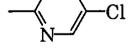
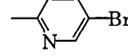
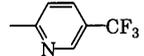
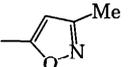
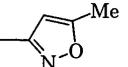
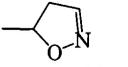
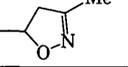
№ соединения	R ¹	R ²	Y	Z
IV-178		Me	O	O
IV-179		Me	O	O
IV-180		Me	O	O
IV-181		Me	O	O
IV-182		Me	O	O
IV-183		Me	O	O
IV-184		Me	O	O
IV-185		Me	O	O
IV-186		Me	O	O
IV-187		Me	O	O
IV-188		Me	O	O
IV-189		Me	O	O
IV-190		Me	O	O
IV-191		Me	O	O

Таблица 50

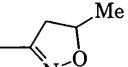
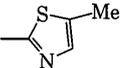
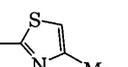
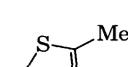
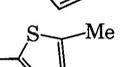
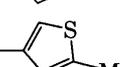
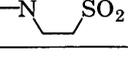
№ соединения	R ¹	R ²	Y	Z
IV-192		Me	O	O
IV-193		Me	O	O
IV-194		Me	O	O
IV-195		Me	O	O
IV-196		Me	O	O
IV-197		Me	O	O
IV-198		Me	O	O
IV-199		Me	O	O
IV-200		Me	O	O
IV-201		Me	O	O
IV-202		Me	O	O
IV-203		Me	O	O
IV-204		Me		O

Таблица 51

№ соединения	R ¹	R ²	Y	Z
IV-205	CH ₂ Ph	Me	0	0
IV-206	CH ₂ CH ₂ Ph	Me	0	0
IV-207	CH ₂ CH ₂ CH ₂ Ph	Me	0	0
IV-208	CH ₂ CH=CHPh	Me	0	0
IV-209	CH ₂ C≡CPh	Me	0	0
IV-210	CH ₂ CH=NOMe	Me	0	0
IV-211	CH ₂ CH=NOEt	Me	0	0
IV-212	CH ₂ CH=NOPr-n	Me	0	0
IV-213	CH ₂ CH=NOPh	Me	0	0
IV-214	CH ₂ CH(OMe) ₂	Me	0	0
IV-215	CH ₂ CHO	Me	0	0
IV-216	NH ₂	Me	0	0
IV-217	NHMe	Me	0	0
IV-218	NHEt	Me	0	0
IV-219	NHPr-n	Me	0	0
IV-220	NHPr-i	Me	0	0
IV-221	NHBU-n	Me	0	0
IV-222	NHBU-i	Me	0	0
IV-223	NHBU-s	Me	0	0
IV-224	NHCH ₂ Pr-c	Me	0	0
IV-225	NHPen-n	Me	0	0
IV-226	NHHex-n	Me	0	0
IV-227	NHCH ₂ CH ₂ CH ₂ Cl	Me	0	0
IV-228	NHCH ₂ CH ₂ CH ₂ F	Me	0	0
IV-229	NHCH ₂ CH ₂ OMe	Me	0	0
IV-230	NMe ₂	Me	0	0
IV-231	NEt ₂	Me	0	0
IV-232	N(Pr-n) ₂	Me	0	0
IV-233	N(BU-n) ₂	Me	0	0
IV-234	N(Me)Et	Me	0	0
IV-235	N(Me)CH ₂ CH ₂ OMe	Me	0	0
IV-236	NHPh	Me	0	0
IV-237	NHCH ₂ Ph	Me	0	0
IV-238	N=CMe ₂	Me	0	0
IV-239	N=CEt ₂	Me	0	0
IV-240	N=CHNMe ₂	Me	0	0
IV-241	NHC(=O)Me	Me	0	0
IV-242	N[C(=O)Me] ₂	Me	0	0
IV-243	NHC(=O)OMe	Me	0	0
IV-244	N[C(=O)OMe] ₂	Me	0	0
IV-245	NHSO ₂ Me	Me	0	0

Таблица 52

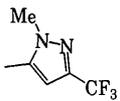
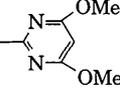
№ соединения	R ¹	R ²	Y	Z
IV-246	NHSO ₂ Ph	Me	O	O
IV-247	NHSO ₂ CH ₂ Ph	Me	O	O
IV-248	OMe	Me	O	O
IV-249	OEt	Me	O	O
IV-250	OPr-n	Me	O	O
IV-251	OPr-i	Me	O	O
IV-252	OCH ₂ Pr-c	Me	O	O
IV-253	OCH ₂ Cl	Me	O	O
IV-254	OCHCl ₂	Me	O	O
IV-255	OCCL ₃	Me	O	O
IV-256	OCH ₂ F	Me	O	O
IV-257	OCHF ₂	Me	O	O
IV-258	OCF ₃	Me	O	O
IV-259	Ph	Et	O	O
IV-260	Ph	Pr-i	O	O
IV-261	Ph	CHF ₂	O	O
IV-262	Ph	Ph	O	O
IV-263	Ph	Me	O	S
IV-264	Ph	Me	S	S
IV-265	Me	Me	O	S
IV-266	Me	Me	S	S
IV-267	Ph	Me	O	O
IV-268	Ph(4-OEt)	Me	O	O
IV-269	Ph(2-Ph)	Me	O	O
IV-270	Ph(3-Ph)	Me	O	O
IV-271	Ph(4-Ph)	Me	O	O
IV-272		Me	O	O
IV-273		Me	O	O
IV-274	Me		O	O
IV-275	Et		O	O
IV-276		Me	O	O

Таблица 53

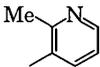
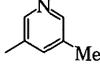
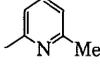
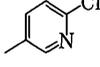
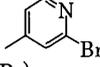
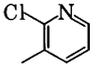
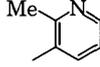
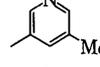
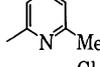
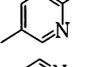
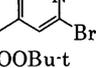
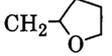
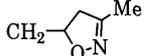
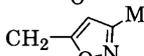
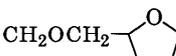
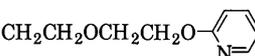
№ соединения	R ¹	R ²	Y	Z
IV-277		Me	O	O
IV-278		Me	O	O
IV-279		Me	O	O
IV-280		Me	O	O
IV-281		Me	O	O
IV-282	Ph(2-Me-4-Br)		O	O
IV-283	Ph(2-Me-4-I)	Me	O	O
IV-284	Ph(2-Me-4-CF ₃)	Me	O	O
IV-285	Ph(2-Me-4-OCF ₃)	Me	O	O
IV-286	Ph(2-Pr-i)	Me	O	O
IV-287		Me	O	O
IV-288	Ph(2-Et)	Me	O	O
IV-289		Me	O	O
IV-290		Me	O	O
IV-291		Me	O	S
IV-292		Me	O	O
IV-293		Me	O	O
IV-294	CH ₂ COOBu ^t	Me	O	O
IV-295	(C ₇ H ₁₄)CH ₃	Me	O	O
IV-296	(C ₉ H ₁₈)CH ₃	Me	O	O
IV-297	Ph(2-F,4-Cl,5-OMe)	Me	O	O
IV-298	Ph(2,3,4-(OMe) ₃)	Me	O	O
IV-299	Ph(3,5-Cl ₂ -4-OMe)	Me	O	O
IV-300	Ph(3,5-Cl ₂ -4-SMe)	Me	O	O

Таблица 54

№ соединения	R ¹	R ²	Y	Z
IV-301	Ph(3,5-Cl ₂ -4-SO ₂ Me)	Me	O	O
IV-302	Ph(3,4,5-F ₃)	Me	O	O
IV-303		Me	O	O
IV-304		Me	O	O
IV-305		Me	O	O
IV-306	Bu-n		O	O
IV-307	CH ₂ CH(CH ₃) ₂		O	O
IV-308	Ph	Pen-n	O	O
IV-309	H	Me	O	O
IV-310	CH ₂ C≡CF	Me	O	O
IV-311		Me	O	O
IV-312		Me	O	O
IV-313	CH ₂ NH ₂	Me	O	O
IV-314	CH ₂ NO ₂	Me	O	O
IV-315	CH ₂ NHCH ₃	Me	O	O
IV-316	CH ₂ N(CH ₃) ₂	Me	O	O
IV-317	CH ₂ SCH ₂ CF ₃	Me	O	O
IV-318	CH ₂ SOCH ₂ CF ₃	Me	O	O
IV-319	CH ₂ SO ₂ CH ₂ CF ₃	Me	O	O
IV-320	CH ₂ OH	Me	O	O
IV-321	CH ₂ OBn	Me	O	O
IV-322	CH ₂ OCH ₂ Pr-c	Me	O	O
IV-323	CH ₂ OPh	Me	O	O
IV-324	CH ₂ SPh	Me	O	O
IV-325	CH ₂ SOPh	Me	O	O
IV-326	CH ₂ SO ₂ Ph	Me	O	O
IV-327	CH ₂ CON(CH ₃) ₂	Me	O	O
IV-328	CH ₂ COCH ₃	Me	O	O
IV-329	CH ₂ OCOCH ₃	Me	O	O

Таблица 55

№ соединения	R ¹	R ²	Y	Z
IV-330	CH ₂ ON=CHCH ₃	Me	O	O
IV-331	C ₂ H ₄ OC ₂ H ₄ SCH ₃	Me	O	O
IV-332	C ₂ H ₄ OC ₂ H ₄ SOCH ₃	Me	O	O
IV-333	C ₂ H ₄ OC ₂ H ₄ SO ₂ CH ₃	Me	O	O
IV-334	CH ₂ OCH ₂ CN	Me	O	O
IV-335	CH ₂ CN	Me	O	O
IV-336	OCH ₂ CH=CH ₂	Me	O	O
IV-337	OCH ₂ C≡CH	Me	O	O
IV-338	OPr-c	Me	O	O
IV-339		Me	O	O
IV-340		Me	O	O
IV-341		Me	O	O
IV-342		Me	O	O
IV-343		Me	O	O
IV-344	Ph	H	O	O
IV-345	Ph	CH ₂ CH=CH ₂	O	O
IV-346	Ph	CH ₂ C≡CH	O	O
IV-347	Ph	Pr-c	O	O
IV-348	Ph	CH ₂ CH=CF ₂	O	O
IV-349	Ph	CH ₂ C≡CF	O	O
IV-350	Ph	C ₂ H ₄ OCH ₃	O	O
IV-351	Ph	C ₂ H ₄ OC ₂ H ₅	O	O
IV-352	Ph	CH(Me)OEt	O	O
IV-353	Ph	CH ₂ OPr-c	O	O
IV-354	Ph	CH(OCH ₃) ₂	O	O
IV-355	Ph	CH ₂ Ph	O	O
IV-356	Ph	CH=CH·Ph	O	O
IV-357	Ph	C≡C·Ph	O	O

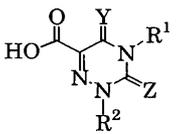
				
№ соединения	R ¹	R ²	Y	Z
V-1	Me	Me	O	O
V-2	Et	Me	O	O
V-3	Pr-n	Me	O	O
V-4	Pr-i	Me	O	O
V-5	Bu-n	Me	O	O
V-6	Bu-i	Me	O	O
V-7	Bu-s	Me	O	O
V-8	Bu-t	Me	O	O
V-9	Hex-n	Me	O	O
V-10	CH ₂ CF ₃	Me	O	O
V-11	CH ₂ CH=CH ₂	Me	O	O
V-12	CH ₂ C(Me)=CH ₂	Me	O	O
V-13	CH ₂ CH ₂ CH=CMe ₂	Me	O	O
V-14	CH ₂ C≡CH	Me	O	O
V-15	CH ₂ C≡CCH ₃	Me	O	O
V-16	Pr-c	Me	O	O
V-17	Bu-c	Me	O	O
V-18	Pen-c	Me	O	O
V-19	Hex-c	Me	O	O
V-20	CH ₂ Pr-c	Me	O	O
V-21	CH ₂ Bu-c	Me	O	O
V-22	CH ₂ Pen-c	Me	O	O
V-23	CH ₂ Hex-c	Me	O	O
V-24	CH ₂ CH=CCl ₂	Me	O	O
V-25	CH ₂ CCl=CHCl	Me	O	O
V-26	CH ₂ CH ₂ CH=CCl ₂	Me	O	O
V-27	CH ₂ CH ₂ C(Me)=CF ₂	Me	O	O
V-28	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ C(Me)=CF ₂	Me	O	O
V-29	CH ₂ CH=CF ₂	Me	O	O
V-30	CH ₂ CH ₂ OMe	Me	O	O
V-31	CH ₂ CH ₂ OEt	Me	O	O
V-32	CH(Me)CH ₂ OMe	Me	O	O
V-33	CH ₂ CH ₂ OCH ₂ CH ₂ OMe	Me	O	O
V-34	CH ₂ CH ₂ OPr-n	Me	O	O
V-35	CH ₂ CH ₂ OPr-i	Me	O	O
V-36	CH ₂ CH ₂ OPr-c	Me	O	O
V-37	CH ₂ CH ₂ OBu-c	Me	O	O
V-38	CH ₂ CH ₂ OPen-c	Me	O	O

Таблица 57

№ соединения	R ¹	R ²	Y	Z
V-39	CH ₂ CH ₂ OH _{Hex-c}	Me	0	0
V-40	CH ₂ CH ₂ OCH ₂ CF ₃	Me	0	0
V-41	CH ₂ CH ₂ CH ₂ OMe	Me	0	0
V-42	CH=CHMe	Me	0	0
V-43	CH ₂ SMe	Me	0	0
V-44	CH ₂ SPr-n	Me	0	0
V-45	CH ₂ CH ₂ SMe	Me	0	0
V-46	CH ₂ SOMe	Me	0	0
V-47	CH ₂ SO ₂ Me	Me	0	0
V-48	CH ₂ CH ₂ CH ₂ SMe	Me	0	0
V-49	CH ₂ CH ₂ CH ₂ SO ₂ Me	Me	0	0
V-50	Ph	Me	0	0
V-51	Ph(2-Cl)	Me	0	0
V-52	Ph(3-Cl)	Me	0	0
V-53	Ph(4-Cl)	Me	0	0
V-54	Ph(2-F)	Me	0	0
V-55	Ph(3-F)	Me	0	0
V-56	Ph(4-F)	Me	0	0
V-57	Ph(2-Me)	Me	0	0
V-58	Ph(3-Me)	Me	0	0
V-59	Ph(4-Me)	Me	0	0
V-60	Ph(2-OMe)	Me	0	0
V-61	Ph(3-OMe)	Me	0	0
V-62	Ph(4-OMe)	Me	0	0
V-63	Ph(2-CF ₃)	Me	0	0
V-64	Ph(3-CF ₃)	Me	0	0
V-65	Ph(4-CF ₃)	Me	0	0
V-66	Ph(2-NO ₂)	Me	0	0
V-67	Ph(3-NO ₂)	Me	0	0
V-68	Ph(4-NO ₂)	Me	0	0
V-69	Ph(2-OCF ₃)	Me	0	0
V-70	Ph(3-OCF ₃)	Me	0	0
V-71	Ph(4-OCF ₃)	Me	0	0
V-72	Ph(2-CN)	Me	0	0
V-73	Ph(3-CN)	Me	0	0
V-74	Ph(4-CN)	Me	0	0
V-75	Ph(3,4-F ₂)	Me	0	0
V-76	Ph(3,5-F ₂)	Me	0	0
V-77	Ph(2,3-F ₂)	Me	0	0
V-78	Ph(2,4-F ₂)	Me	0	0

Таблица 58

№ соединения	R ¹	R ²	Y	Z
V-79	Ph(2,5-F ₂)	Me	0	0
V-80	Ph(2,6-F ₂)	Me	0	0
V-81	Ph(3,4-Cl ₂)	Me	0	0
V-82	Ph(3,5-Cl ₂)	Me	0	0
V-83	Ph(2,3-Cl ₂)	Me	0	0
V-84	Ph(2,4-Cl ₂)	Me	0	0
V-85	Ph(2,5-Cl ₂)	Me	0	0
V-86	Ph(2,6-Cl ₂)	Me	0	0
V-87	Ph(3,4-Me ₂)	Me	0	0
V-88	Ph(3,5-Me ₂)	Me	0	0
V-89	Ph(2,3-Me ₂)	Me	0	0
V-90	Ph(2,4-Me ₂)	Me	0	0
V-91	Ph(2,5-Me ₂)	Me	0	0
V-92	Ph(2,6-Me ₂)	Me	0	0
V-93	Ph(3,4-(OMe) ₂)	Me	0	0
V-94	Ph(3,5-(OMe) ₂)	Me	0	0
V-95	Ph(2,3-(OMe) ₂)	Me	0	0
V-96	Ph(2,4-(OMe) ₂)	Me	0	0
V-97	Ph(2,5-(OMe) ₂)	Me	0	0
V-98	Ph(2,6-(OMe) ₂)	Me	0	0
V-99	Ph(3-F-4-OMe)	Me	0	0
V-100	Ph(3-F-5-OMe)	Me	0	0
V-101	Ph(2-F-3-OMe)	Me	0	0
V-102	Ph(2-F-4-OMe)	Me	0	0
V-103	Ph(2-F-5-OMe)	Me	0	0
V-104	Ph(2-F-6-OMe)	Me	0	0
V-105	Ph(3-F-4-Me)	Me	0	0
V-106	Ph(3-F-5-Me)	Me	0	0
V-107	Ph(2-F-3-Me)	Me	0	0
V-108	Ph(2-F-4-Me)	Me	0	0
V-109	Ph(2-F-5-Me)	Me	0	0
V-110	Ph(2-F-6-Me)	Me	0	0
V-111	Ph(3-OMe-4-F)	Me	0	0
V-112	Ph(2-OMe-3-F)	Me	0	0
V-113	Ph(2-OMe-4-F)	Me	0	0
V-114	Ph(2-OMe-5-F)	Me	0	0
V-115	Ph(3-Me-4-F)	Me	0	0
V-116	Ph(2-Me-3-F)	Me	0	0
V-117	Ph(2-Me-4-F)	Me	0	0

Таблица 59

№ соединения	R ¹	R ²	Y	Z
V-118	Ph(2-Me-5-F)	Me	O	O
V-119	Ph(3-Cl-4-OMe)	Me	O	O
V-120	Ph(3-Cl-5-OMe)	Me	O	O
V-121	Ph(2-Cl-3-OMe)	Me	O	O
V-122	Ph(2-Cl-4-OMe)	Me	O	O
V-123	Ph(2-Cl-5-OMe)	Me	O	O
V-124	Ph(2-Cl-6-OMe)	Me	O	O
V-125	Ph(3-Cl-4-Me)	Me	O	O
V-126	Ph(3-Cl-5-Me)	Me	O	O
V-127	Ph(2-Cl-3-Me)	Me	O	O
V-128	Ph(2-Cl-4-Me)	Me	O	O
V-129	Ph(2-Cl-5-Me)	Me	O	O
V-130	Ph(2-Cl-6-Me)	Me	O	O
V-131	Ph(3-OMe-4-Cl)	Me	O	O
V-132	Ph(2-OMe-3-Cl)	Me	O	O
V-133	Ph(2-OMe-4-Cl)	Me	O	O
V-134	Ph(2-OMe-5-Cl)	Me	O	O
V-135	Ph(3-Me-4-Cl)	Me	O	O
V-136	Ph(2-Me-3-Cl)	Me	O	O
V-137	Ph(2-Me-4-Cl)	Me	O	O
V-138	Ph(2-Me-5-Cl)	Me	O	O
V-139	Ph(3-F-4-Cl)	Me	O	O
V-140	Ph(3-F-5-Cl)	Me	O	O
V-141	Ph(2-F-3-Cl)	Me	O	O
V-142	Ph(2-F-4-Cl)	Me	O	O
V-143	Ph(2-F-5-Cl)	Me	O	O
V-144	Ph(2-F-6-Cl)	Me	O	O
V-145	Ph(3-Cl-4-F)	Me	O	O
V-146	Ph(2-Cl-3-F)	Me	O	O
V-147	Ph(2-Cl-4-F)	Me	O	O
V-148	Ph(2-Cl-5-F)	Me	O	O
V-149	Ph(3-Me-4-OMe)	Me	O	O
V-150	Ph(3-Me-5-OMe)	Me	O	O
V-151	Ph(2-Me-3-OMe)	Me	O	O
V-152	Ph(2-Me-4-OMe)	Me	O	O
V-153	Ph(2-Me-5-OMe)	Me	O	O
V-154	Ph(2-Me-6-OMe)	Me	O	O
V-155	Ph(3-OMe-4-Me)	Me	O	O
V-156	Ph(2-OMe-3-Me)	Me	O	O

Таблица 60

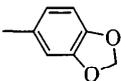
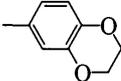
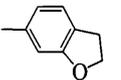
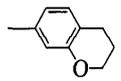
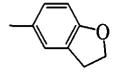
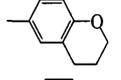
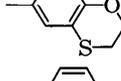
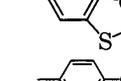
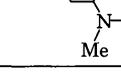
№ соединения	R ¹	R ²	Y	Z
V-157	Ph(2-OMe-4-Me)	Me	O	O
V-158	Ph(2-OMe-5-Me)	Me	O	O
V-159	Ph(3-CN-4-OMe)	Me	O	O
V-160	Ph(3-OMe-4-CN)	Me	O	O
V-161	Ph(3-Me-4-CN)	Me	O	O
V-162	Ph(3-CN-4-Me)	Me	O	O
V-163	Ph(3-NO ₂ -4-OMe)	Me	O	O
V-164	Ph(3-OMe-4-NO ₂)	Me	O	O
V-165	Ph(3-Me-4-NO ₂)	Me	O	O
V-166	Ph(3-NO ₂ -4-Me)	Me	O	O
V-167	Ph(3,5-F ₂ -4-OMe)	Me	O	O
V-168	Ph(3,5-F ₂ -4-Me)	Me	O	O
V-169	Ph(3,4,5-(OMe) ₃)	Me	O	O
V-170		Me	O	O
V-171		Me	O	O
V-172		Me	O	O
V-173		Me	O	O
V-174		Me	O	O
V-175		Me	O	O
V-176		Me	O	O
V-177		Me	O	O
V-178		Me	O	O

Таблица 61

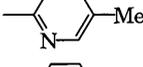
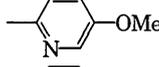
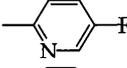
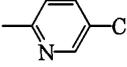
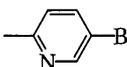
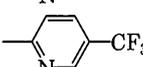
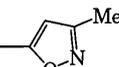
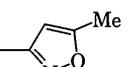
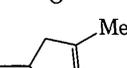
№ соединения	R ¹	R ²	Y	Z
V-179		Me	O	O
V-180		Me	O	O
V-181		Me	O	O
V-182		Me	O	O
V-183		Me	O	O
V-184		Me	O	O
V-185		Me	O	O
V-186		Me	O	O
V-187		Me	O	O
V-188		Me	O	O
V-189		Me	O	O
V-190		Me	O	O
V-191		Me	O	O
V-192		Me	O	O

Таблица 62

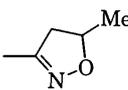
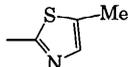
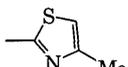
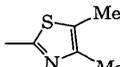
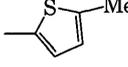
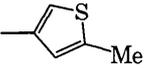
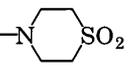
№ соединения	R ¹	R ²	Y	Z
V-193		Me	O	O
V-194		Me	O	O
V-195		Me	O	O
V-196		Me	O	O
V-197		Me	O	O
V-198		Me	O	O
V-199		Me	O	O
V-200		Me	O	O
V-201		Me	O	O
V-202		Me	O	O
V-203		Me	O	O
V-204		Me	O	O
V-205	CH ₂ Ph	Me	O	O
V-206	CH ₂ CH ₂ Ph	Me	O	O
V-207	CH ₂ CH ₂ CH ₂ Ph	Me	O	O
V-208	CH ₂ CH=CHPh	Me	O	O
V-209	CH ₂ C≡CPh	Me	O	O
V-210	CH ₂ CH=NOMe	Me	O	O

Таблица 63

№ соединения	R ¹	R ²	Y	Z
V-211	CH ₂ CH=NOEt	Me	0	0
V-212	CH ₂ CH=NOPr-n	Me	0	0
V-213	CH ₂ CH=NOPh	Me	0	0
V-214	CH ₂ CH(OMe) ₂	Me	0	0
V-215	CH ₂ CHO	Me	0	0
V-216	NH ₂	Me	0	0
V-217	NHMe	Me	0	0
V-218	NHEt	Me	0	0
V-219	NHPr-n	Me	0	0
V-220	NHPr-i	Me	0	0
V-221	NHBu-n	Me	0	0
V-222	NHBU-i	Me	0	0
V-223	NHBu-s	Me	0	0
V-224	NHCH ₂ Pr-c	Me	0	0
V-225	NHPen-n	Me	0	0
V-226	NHHex-n	Me	0	0
V-227	NHCH ₂ CH ₂ CH ₂ Cl	Me	0	0
V-228	NHCH ₂ CH ₂ CH ₂ F	Me	0	0
V-229	NHCH ₂ CH ₂ OMe	Me	0	0
V-230	NMe ₂	Me	0	0
V-231	NEt ₂	Me	0	0
V-232	N(Pr-n) ₂	Me	0	0
V-233	N(Bu-n) ₂	Me	0	0
V-234	N(Me)Et	Me	0	0
V-235	N(Me)CH ₂ CH ₂ OMe	Me	0	0
V-236	NHPh	Me	0	0
V-237	NHCH ₂ Ph	Me	0	0
V-238	N=CMe ₂	Me	0	0
V-239	N=CEt ₂	Me	0	0
V-240	N=CHNMe ₂	Me	0	0
V-241	NHC(=O)Me	Me	0	0
V-242	N[C(=O)Me] ₂	Me	0	0
V-243	NHC(=O)OMe	Me	0	0
V-244	N[C(=O)OMe] ₂	Me	0	0
V-245	NHSO ₂ Me	Me	0	0
V-246	NHSO ₂ Ph	Me	0	0
V-247	NHSO ₂ CH ₂ Ph	Me	0	0
V-248	OMe	Me	0	0
V-249	OEt	Me	0	0
V-250	OPr-n	Me	0	0
V-251	OPr-i	Me	0	0
V-252	OCH ₂ Pr-c	Me	0	0
V-253	OCH ₂ Cl	Me	0	0
V-254	OCHCl ₂	Me	0	0

Таблица 64

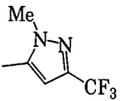
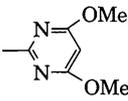
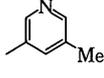
№ соединения	R ¹	R ²	Y	Z
V-255	OCCL ₃	Me	O	O
V-256	OCH ₂ F	Me	O	O
V-257	OCHF ₂	Me	O	O
V-258	OCF ₃	Me	O	O
V-259	Ph	Et	O	O
V-260	Ph	Pr-i	O	O
V-261	Ph	CHF ₂	O	O
V-262	Ph	Ph	O	O
V-263	Ph	Me	O	S
V-264	Ph	Me	S	S
V-265	Me	Me	O	S
V-266	Me	Me	S	S
V-267	Ph	Me	O	O
V-268	Ph(4-OEt)	Me	O	O
V-269	Ph(2-Ph)	Me	O	O
V-270	Ph(3-Ph)	Me	O	O
V-271	Ph(4-Ph)	Me	O	O
V-272		Me	O	O
V-273		Me	O	O
V-274	Me		O	O
V-275	Et		O	O
V-276		Me	O	O
V-277		Me	O	O
V-278		Me	O	O
V-279		Me	O	O

Таблица 65

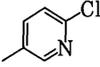
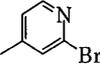
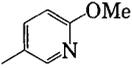
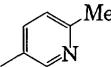
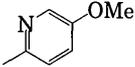
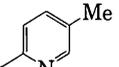
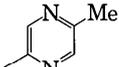
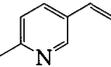
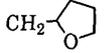
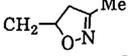
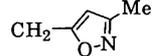
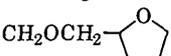
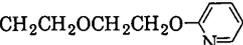
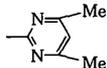
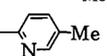
№ соединения	R ¹	R ²	Y	Z
V-280		Me	O	O
V-281		Me	O	O
V-282	Ph(2-Me-4-Br)	Me	O	O
V-283	Ph(2-Me-5-I)	Me	O	O
V-284	Ph(2-Me-5-CF ₃)	Me	O	O
V-285	Ph(2-Me-6-OCF ₃)	Me	O	O
V-286	Ph(2-Pr-i)	Me	O	O
V-287		Me	O	O
V-288	Ph(2-Et)	Me	O	O
V-289		Me	O	O
V-290		Me	O	O
V-291		Me	O	S
V-292		Me	O	O
V-293		Me	O	O
V-294	CH ₂ COOBu-t	Me	O	O
V-295	(C ₇ H ₁₄)CH ₃	Me	O	O
V-296	(C ₉ H ₁₈)CH ₃	Me	O	O
V-297	Ph(2-F,4-Cl,5-OMe)	Me	O	O
V-298	Ph(2,3,4-(OMe) ₃)	Me	O	O
V-299	Ph(3,5-Cl ₂ -4-OMe)	Me	O	O
V-300	Ph(3,5-Cl ₂ -4-SMe)	Me	O	O
V-301	Ph(3,5-Cl ₂ -4-SO ₂ Me)	Me	O	O
V-302	Ph(3,4,5-F ₃)	Me	O	O
V-303		Me	O	O

Таблица 66

№ соединения	R ¹	R ²	Y	Z
V-304		Me	0	0
V-305		Me	0	0
V-306	Bu·n		0	0
V-307	CH ₂ CH(CH ₃) ₂		0	0
V-308	Ph	Pen·n	0	0
V-309	H	Me	0	0
V-310	CH ₂ C≡CF	Me	0	0
V-311		Me	0	0
V-312		Me	0	0
V-313	CH ₂ NH ₂	Me	0	0
V-314	CH ₂ NO ₂	Me	0	0
V-315	CH ₂ NHCH ₃	Me	0	0
V-316	CH ₂ N(CH ₃) ₂	Me	0	0
V-317	CH ₂ SCH ₂ CF ₃	Me	0	0
V-318	CH ₂ SOCH ₂ CF ₃	Me	0	0
V-319	CH ₂ SO ₂ CH ₂ CF ₃	Me	0	0
V-320	CH ₂ OH	Me	0	0
V-321	CH ₂ OBn	Me	0	0
V-322	CH ₂ OCH ₂ Pr·c	Me	0	0
V-323	CH ₂ OPh	Me	0	0
V-324	CH ₂ SPh	Me	0	0
V-325	CH ₂ SOPh	Me	0	0
V-326	CH ₂ SO ₂ Ph	Me	0	0
V-327	CH ₂ CON(CH ₃) ₂	Me	0	0
V-328	CH ₂ COCH ₃	Me	0	0
V-329	CH ₂ OCOCH ₃	Me	0	0
V-330	CH ₂ ON=CHCH ₃	Me	0	0
V-331	C ₂ H ₄ OC ₂ H ₄ SCH ₃	Me	0	0
V-332	C ₂ H ₄ OC ₂ H ₄ SOCH ₃	Me	0	0
V-333	C ₂ H ₄ OC ₂ H ₄ SO ₂ CH ₃	Me	0	0

Таблица 67

№ соединения	R ¹	R ²	Y	Z
V-334	CH ₂ OCH ₂ CN	Me	0	0
V-335	CH ₂ CN	Me	0	0
V-336	OCH ₂ CH=CH ₂	Me	0	0
V-337	OCH ₂ C≡CH	Me	0	0
V-338	OPr-c	Me	0	0
V-339		Me	0	0
V-340		Me	0	0
V-341		Me	0	0
V-342		Me	0	0
V-343		Me	0	0
V-344	Ph	H	0	0
V-345	Ph	CH ₂ CH=CH ₂	0	0
V-346	Ph	CH ₂ C≡CH	0	0
V-347	Ph	Pr-c	0	0
V-348	Ph	CH ₂ CH=CF ₂	0	0
V-349	Ph	CH ₂ C≡CF	0	0
V-350	Ph	C ₂ H ₄ OCH ₃	0	0
V-351	Ph	C ₂ H ₄ OC ₂ H ₅	0	0
V-352	Ph	CH(Me)OEt	0	0
V-353	Ph	CH ₂ OPr-c	0	0
V-354	Ph	CH(OCH ₃) ₂	0	0
V-355	Ph	CH ₂ Ph	0	0
V-356	Ph	CH=CH·Ph	0	0
V-357	Ph	C≡C·Ph	0	0
V-358	Ph(3,4,5-Cl)	Me	0	0
V-359	N(Me)Ph	Me	0	0
V-360		Me	0	0
V-361		Me	0	0
V-362	CH ₂ CO(Bu-t)	Me	0	0
V-363	Ph(2,3,5,6-F ₄)	Me	0	0
V-364	Ph[(3,5-(CF ₃) ₂)]	Me	0	0
V-365	CH ₂ C(Me)=NOMe	Me	0	0
V-366	Ph(2,4,6-Me ₃)	Me	0	0
V-367	Ph(2,3,4,5,6-F ₅)	Me	0	0
V-368	N(Et)Ph	Me	0	0
V-369	N(Pr-i)Ph	Me	0	0
V-370	N(Me)Ph(4-F)	Me	0	0
V-371	CH ₂ C(Me)=NOEt	Me	0	0

Соединения изобретения обладают превосходной гербицидной активностью и некоторые из них проявляют превосходную селективность в отношении действия на сельскохозяйственные культуры и сорняки и являются применимыми в качестве агрохимической композиции для сельскохозяйственных угодий, особенно в качестве гербицидов. Другими словами, соединения изобретения обладают гербицидной активностью в отношении различных сорняков во время обработки листьев, обработки почвы, обработки для протравливания семян, смешанной обработки почвы, обработки почвы перед посевом, обработки во время посева, обработки почвы после посева, обработки для заделки семян в почву и смешанной обработки почвы во время посева и обработки почвы до и после посева для беспашотного земледелия на поле для культивирования сельскохозяйственных и садовых растений.

Ниже в контексте указываются примеры сорняков, но изобретение не ограничивается ими:

сорняки семейства Onagraceae: *Oenothera erythrosepala*,
Oenothera laciniata;
сорняки семейства Ranunculaceae: *Ranunculus muricatus*,
Ranunculus sardous;
сорняки семейства Polygonaceae: *Polygonum convolvulus*,
Polygonum lapathifolium, *Polygonum pensylvanicum*, *Polygonum*
persicaria, *Rumex crispus*, *Rumex obtusifolius*, *Polygonum*
cuspidatum, *Polygonum pensylvanicum*, *Persicaria longiseta*,
Persicaria lapathifolia, *Persicaria nepalensis*;
сорняки семейства Portulacaceae: *Portulaca oleracea*;
сорняки семейства Caryophyllaceae: *Stellaria media*,
Cerastium glomeratum, *Stellaria alsine*, *Spergula arvensis*,
Stellaria aquatica;
сорняки семейства Chenopodiaceae: *Chenopodium album*, *Kochia*
scoparia, *Chenopodium album*, *Chenopodium ficifolium*;
сорняки семейства Amaranthaceae: *Amaranthus retroflexus*,
Amaranthus hybridus, *Amaranthus palmeri*, *Amaranthus spinosus*,
Amaranthus rudis, *Amaranthus albus*, *Amaranthus viridus*,
Amaranthus lividus;
сорняки семейства Brassicaceae: *Raphanus raphanistrum*,
Sinapis arvensis, *Capsella bursa-pastoris*, *Lepidium virginicum*,
Thlaspi arvense, *Descuraria sophia*, *Rorippa indica*, *Rorippa*

islandica, *Sisymbrium officinale*, *Cardamine flexuosa*, *Nasturtium officinale*, *Draba nemorosa*;

сорняки семейства Fabaceae: *Sesbania exaltata*, *Cassia obtusifolia*, *Desmodium tortuosum*, *Trifolium repens*, *Vicia sativa*, *Medicago lupulina*, *Vicia hirsuta*; *Kummerowia striata*, *Medicago polymorpha*, *Vicia angustifolia*, *Aeschynomene indica*;

сорняки семейства Malvaceae: *Abutilon theophrasti*, *Sida spinosa*;

сорняки семейства Violet: *Viola arvensis*, *Viola tricolor*;

сорняки семейства Rubiaceae: *Galium aparine*;

сорняки семейства Convolvulaceae: *Ipomoea hederacea*, *Ipomoea purpurea*, *Ipomoea hederacea* var. *integriuscula*, *Ipomoea lacunosa*, *Convolvulus arvensis*, *Ipomoea indica*, *Ipomoea coccinea*, *Ipomoea triloba*;

сорняки семейства Lamiaceae: *Lamium purpureum*, *Lamium amplexicaule*, *Stachys arvensis*;

сорняки семейства Solanaceae: *Datura stramonium*, *Solanum nigrum*, *Physalis angulata*, *Solanum americanum*, *Solanum carolinense*;

сорняки семейства Scrophulariaceae: *Veronica persica*, *Veronica arvensis*, *Veronica hederifolia*;

сорняки семейства Asteraceae: *Xanthium pensylvanicum*, *Helianthus annuus*, *Matricaria chamomilla*, *Matricaria perforata* или *inodora*, *Chrysanthemum segetum*, *Matricaria matricarioides*, *Ambrosia artemisiifolia*, *Ambrosia trifida*, *Erigeron canadensis*, *Artemisia princeps*, *Solidago altissima*, *Taraxacum officinale*, *Anthemis cotula*, *Breca setosa*, *Sonchus oleraceus*, *Helianthus tuberosus*, *Cirsium arvense*, *Bidens frondosa*, *Bidens pilosa*, *Centurea cyanus*, *Cirsium vulgare*, *Lactuca scariola*, *Rudbeckia hirta*, *Rudbeckia laciniata*, *Rudbeckia laciniata* var. *hortensis* Bailey, *Senecio vulgaris*, *Silybum marianum*, *Sonchus asper*, *Sonchus arvensis*, *Salsola kali*, *Bidens frondosa*, *Eclipta prostrata*, *Bidens bipartita*, *Senecio madagascariensis*, *Coreopsis lanceolata*, *Rudbeckia laciniata*;

сорняки семейства Boraginaceae: *Myosotis arvensis*;

сорняки семейства Asclepiadaceae: *Asclepias syriaca*;

сорняки семейства Euphorbiaceae: *Euphorbia helioscopia*,
Euphorbia maculata, *Acalypha australis*;

сорняки семейства Geraniaceae: *Geranium carolinianum*;

сорняки семейства Oxalidaceae: *Oxalis corymbosa*;

сорняки семейства Cucurbitaceae: *Sicyos angulatus*;

сорняки семейства Poaceae: *Echinochloa crus-galli*, *Setaria viridis*, *Setaria faberi*, *Digitaria sanguinalis*, *Eleusine indica*,
Poa annua, *Alopecurus myosuroides*, *Avena fatua*, *Sorghum halepense*, *Agropyron repens*, *Bromus tectorum*, *Cynodone dactylon*,
Panicum dichotomiflorum, *Panicum texanum*, *Sorghum vulgare*,
Alopecurus geniculatus, *Lolium multiflorum*, *Lolium rigidum*,
Setaria glauca, *Beckmannia syzigachne*;

сорняки семейства Commelinaceae: *Commelina communis*;

сорняки семейства Equisetaceae: *Equisetum arvense*;

сорняки семейства Papaveraceae: *Papaver rhoeas*;

сорняки семейства Cyperaceae: *Cyperus iria*, *Cyperus rotundus*, *Cyperus esculentus*.

Соединения изобретения не проявляют никакой фитотоксичность, которая создает проблему для основных сельскохозяйственных культур, таких как *Zea mays*, *Triticum aestivum*, *Hordeum vulgare*, *Oryza sativa*, *Sorghum bicolor*, *Glycine max*, *Gossypium spp.*, *Beta vulgaris*, *Arachis hypogaea*, *Helianthus annuus*, *Brassica napus*, buck wheat, сахарный тростник и табак, и садовых культур, таких как цветы, и овощных культур.

Кроме того, соединения изобретения являются применимыми для эффективного уничтожения различных сорняков, которые вызывают затруднение при беспашотном выращивании сои культурной, кукурузы и пшеницы, и не проявляют никакой создающую проблему фитотоксичность для сельскохозяйственных культур.

При многих способах обработки, таких как обработка почвы перед культивированием, обработка почвы после культивирования, но перед или после посева; обработка почвы после боронования, но перед или после посева, или обработка перед или после пересадки проростков; обработка во время пересадки проростков; обработка для обессоливания после пересадки проростков и обработка листьев, соединения изобретения могут проявлять гербицидную активность в отношении многих проблематичных сорняков в рисовом поле, которые описаны ниже.

Ниже в контексте указываются примеры сорняков, но изобретение не ограничивается ими:

сорняки семейства Poaceae: *Echinochloa oryzicola*;
Echinochloa crus-galli, *Leptochloa chinensis*, *Isachne globosa*,
Paspalum distichum, *Leersia sayanuka*, *Leersia oryzoides*;

сорняки семейства Scrophulariaceae: *Lindernia procumbens*,
Lindernia dubia, *Dopatrium junceum*, *Gratiola japonica*, *Lindernia angustifolia*, *Limnophila sessiliflora*;

сорняки семейства Lythraceae: *Rotala indica*, *Ammannia multiflora*;

сорняки семейства Elatinaceae: *Elatine triandra*;

сорняки семейства Cyperaceae: *Cyperus difformis*, *Scirpus hotarui*, *Eleocharis acicularis*, *Cyperus serotinus*, *Eleocharis kuroguwai*, *Fimbristylis miliacea*, *Cyperus flaccidus*, *Cyperus globosus*, *Scirpus juncoides*, *Scirpus wallichii*, *Scirpus nipponicus*, *Fimbristylis autumnalis*, *Scirpus tabernaemontani*, *Scirpus juncoides* Roxb., *Scirpus lineolatus* Franch. et Savat., *Cyperus orthostachyus* Franch. et Savat., *Cyperus orthostachyus* Franch. et Savat., *Eleocharis congesta* D. Don, *Scirpus planiculmis* Fr. Schm.;

сорняки семейства Pontederiaceae: *Monochoria vaginalis*, *Monochoria korsakowii*, *Heteranthera limosa*;

сорняки семейства Alismataceae: *Sagittaria pygmaea*, *Sagittaria trifolia*, *Alisma canaliculatum*, *Sagittaria aginashi*;

сорняки семейства Potamogetonaceae: *Potamogeton distinctus*;

сорняки семейства Eruocaulaceae: *Eriocaulon cinereum*;

сорняки семейства Apiaceae: *Oenanthe javanica*;

сорняки семейства Asteraceae: *Eclipta prostrata*, *Bidens tripartita*;

сорняки семейства Commelinaceae: *Murdannia keisak*;

сорняки семейства Characeae: *Chara braunii*;

сорняки семейства Lemnaceae: *Spirodela polyrhiza*;

Неритикае: *Ricciocarpus natans*;

Zygnemataceae: *Spirogyra arcla*.

Кроме того, соединения изобретения не проявляют фитотоксичность для риса-падди при любом способе культивирования, включающему в себя посев семенами в грунт или высадку рассады риса-падди с последующим культивированием.

Кроме того, соединения изобретения можно применять для борьбы с сорняками широкого спектра, бурно разрастающимися на участке для промышленного сооружения, такого как склон дамбы, дно реки, кромка и откос дорожного полотна, участок железной дороги, площади парков, grand (большие лесные городские массивы), стоянка автомобилей, аэропорт, фабрика и складское сооружение, земли, не занятые под сельскохозяйственной культурой, такие как паровые поля и свободные участки земли в городе, которые требуют борьбы с сорняками, или фруктовый сад, пастбище, сенокосное угодье, облесенная земля и т.д.

Кроме того, при обработке листовой поверхности, нанесении на водную поверхность и т.д. соединения изобретения могут проявлять гербицидную активность в отношении водных сорняков, растущих в реке, водном пути, канале, резервуаре и т.д., где водные сорняки включают в себя семейство Pontederiaceae:

Eichhornia crassipes; семейства *Salvinia natans*: *Azolla imbricata*, *Azolla japonica*, *Salvinia natans*; семейства *Araceae*: *Pistia stratiotes*; семейства *Haloragaceae*: *Myriophyllum brasiliense*, *Myriophyllum verticillatum*; *Myriophyllum spicatum*; *Myriophyllum matogrossense*; семейства *Azollaceae*: *Azolla cristata*; семейства *Scrophulariaceae*: *Veronica anagallis-aquatica*; семейства *Amaranthaceae*: *Alternanthera philoxeroides*; *Gymnocoronis spilanthoides*; семейства *Poaceae*: *Spartina anglica*; семейства *Apiaceae*: *Hydrocotyle ranunculoides*; семейства *Hydrocharitaceae*: *Hydrilla verticillata*, *Egeria densa*; семейства *Cabombaceae*: *Cabomba caroliniana* и семейства *Lemnaceae*: *Wolffia globosa*.

Сельскохозяйственные и садовые растения, описанные в изобретении, включают в себя такие сельскохозяйственные культуры, как кукуруза, рис, пшеница, ячмень, рожь, сорго, хлопчатник, соя, арахис, пшеница бук, сахарная свекла, рапс, подсолнечник, сахарный тростник и табак; такие овощные культуры, как культуры *Solanaceae* (баклажаны, томаты, сладкий перец, перец, картофель и т.д.), овощные культуры *Cucurbitaceae* (огурцы, тыква, цукини, арбуз, дыня и т.д.) овощные культуры *Cuciferae* (редька японская, турнепс, хрен обыкновенный, кольраби, капуста китайская, капуста, горчица, брокколи, капуста цветная и т.д.), овощные культуры *Compositae* (лопух, цикорий, артишок, латук и т.д.), овощные культуры *Liliaceae* (лук-шалот, лук, чеснок, спаржа и т.д.), овощные культуры *Ariaceae* (морковь, петрушка, сельдерей, пастернак и т.д.), овощные культуры *Chenopodiaceae* (шпинат, свекла листовая и т.д.), овощные культуры *Lamiaceae* (печеночница, мята, базилик и т.д.), растительные культуры, такие как земляника, сладкий картофель, ямс и таро; плоды с зернышками (яблоня, груша западная, груша японская, айва китайская, айва и т.д.), косточковые плоды (персик, слива, нектарин, абрикос японский, вишня, абрикос, слива домашняя и т.д.), мандарины благородные (тангерин, апельсин, лимон, лайм настоящий, виноградные фрукты и т.д.), орехи (каштан настоящий, орех, лещина рогатая, миндаль, фисташка обыкновенная, анакардия обыкновенная, орех макадамия и т.д.), ягоды (черника, клюква, ежевика, малина и т.д.), фрукты, такие как виноград, хурма, маслина, локва, банан, кофе, финик, кокос и масличный орех; деревья, другие, чем фруктовое дерево, такие как чайные, тутовые, придорожные деревья (ясень, береза, кизил флоридский, эвкалипт, гинкго, сирень, клен, дуб, тополь, церцис, ликвидамбар смолоносный, клен белый, дзельква граболистная, туя японская, ель японская, тсуга канадская, можжевельник, сирень обыкновенная, ель, тис, вяз, каштан конский и т.д.), коралл, сосна *Buddist*, кедр, кипарис японский, кротон, бересклет европейский, *Photinia glabra* и т.д.; травы, такие как дерн (газон, золотистый дерн и т.д.), бермудские травы (*Cynodon dactylon* и т.д.), жестковолосистые травы (полевица болотная, *Agrostis alba* L., *Agrostis capillaries* и т.д.), мятлики (мятник луговой, *Poa trivialis* L., и т.д.), овсяницы (высокорослая овсяница, овсяница скученная, *Festuca rubra* L. и т.д.), плевелы (*Lolium temulentum* L., *Lolium perenne* L. и т.д.), ежа сборная, тимофеевка и т.д.; масличные культуры, такие как кокосовая пальма, ятрофа куркас и т.д.; цветы (роза, гвоздика, тун, горечавка, обычные фитоценозы на известняках, гербера, бархатцы, *salvia*, петуния, вербена, тюльпан, астра садовая, горечавка *scabra* var. *buergeri*, лилия, фиалка, цикламен, орхидея, лилия долин, лаванда, левкой, капуста цветная, примула, цезальпиния, гладиолус, кэтлея, маргаритка, вербена, орхидея цимбидиум, бегония и т.д.); лиственное растение и т.д., но изобретение не ограничивается ими.

Сельскохозяйственные и садовые растения, описанные в изобретении, включают в себя растение, которому придана устойчивость к ингибитору HPPD, такому как изоксафлутол, ALS-ингибитору, такому как имазетафир и тифенсульфурон метил, ингибитору EPSP-синтазы, такому как глифосат, ингибитору глутаминсинтазы, такому как глюофосинат, ингибитору ацетил-СоА-карбоксилазы, такому как сетоксидим, ингибитору PPO, такому как флумиоксазин, и гербицидам, таким как бромоксинил, дикамба и 2,4-D, способом классической селекции или способом генетической рекомбинации.

Примеры "сельскохозяйственного и садового растения", которому придана устойчивость классической селекцией, включают в себя рапс, пшеницу, подсолнечник, рис и кукурузу, которые являются устойчивыми к ингибитору ALS на основе имидазолинона, такому как имазетафир, и они уже являются коммерчески доступными под названием клеарфильд (фирменное наименование).

Аналогично этому, имеется соя, устойчивая к действию ингибитора ALS на основе сульфонилмочевины, такого как тифенсульфурон метил, полученная способом классической селекции и уже коммерчески доступная под фирменным наименованием соя STS. Аналогично этому, примеры "сельскохозяйственного и садового растения", которому придана устойчивость к ингибитору ацетил-СоА-карбоксилазы, такому как гербициды на основе оксима триона или на основе арилоксифеноксипропионовой кислоты, способом классической селекции, включают в себя кукурузу SR. Сельскохозяйственное и садовое растение, которому придана устойчивость к действию ацетил-СоА-карбоксилазы, описано в трудах the Na-

tional Academy of Sciences of the United States of America (Proc. Natl. Acad. Sci. USA), Vol. 87, pages 7175 to 7179 (1990) и т.д. Кроме того, мутантная ацетил-CoA-карбоксилаза, которая устойчива к действию ингибитора ацетил-CoA-карбоксилазы, описана в Weed Science Vol. 53, pages 728 to 746 (2005), и введением мутантного гена ацетил-CoA-карбоксилазы растению способом генетической рекомбинации или введением мутации для придания устойчивости к ацетил-CoA-карбоксилазе сельскохозяйственным культурам, можно получить растение, которое устойчиво к ингибитору ацетил-CoA-карбоксилазы. Кроме того, посредством сайт-специфичной мутации в виде замены аминокислоты на гене сельскохозяйственных растений, основанной на введении нуклеиновой кислоты с мутацией в виде замены основания, в клетку растения, как представлено способом химерапластики (Gura T. 1999. Repairing the Genome's Spelling Mistakes. Science 285: 316-318), можно получить растение, которое является устойчивым к ингибитору ацетил-CoA-карбоксилазы/гербицидам.

Примеры "сельскохозяйственных и садовых растений", которым придана устойчивость способом генетической рекомбинации, включают в себя кукурузу, сою, хлопчатник, рапс и сахарную свеклу, которые являются устойчивыми к глифосату, и они уже являются коммерчески доступными под названием RoundupReady (фирменное наименование), AgrisureGT и т.д. Аналогично этому, имеются сорта кукурузы, сои, хлопчатника и рапса, которым придана устойчивость к глюфосинату способом генетической рекомбинации, и они уже являются коммерчески доступными под названием LibertyLink (фирменное наименование), и т.д. Аналогично этому, хлопчатник, обладающий устойчивостью к бромоксинилу, также делают доступным способом генетической рекомбинации, и он уже является коммерчески доступным под фирменным наименованием BXN.

"Сельскохозяйственное и садовое растение" включает в себя растение, которое получают способом генетической рекомбинации так, чтобы оно синтезировало, например, селективный токсин, такой как *Bacillus spp.*

Примеры инсектицидного токсина, экспрессируемого в полученном генной инженерией растении, включают в себя инсектицидный белок, происходящий из *Bacillus cereus* или *Bacillus popilliae*; 5-эндотоксин, происходящий из *Bacillus thuringiensis*, такой как Cry1Ab, Cry1Ac, Cry1F, Cry1Fa2, Cry2Ab, Cry3A, Cry3b1 и Cry9C, и инсектицидные белки, такие как VIP1, VIP2, VIP3 и VIP3A; инсектицидные белки, происходящие из нематоды; продуцируемые животными токсины, такие как токсин скорпиона, токсин паука, токсин пчелы и специфичный для насекомых нейротоксин; токсин нитеобразного гриба; лектин растений; агглютинин; ингибитор протеазы, такой как трипсин; ингибитор сериновой протеазы, пататина, цистатина и папаина; инактивирующие рибосомы белки (RIP), такие как лизин, cogn-RIP, абрин, сапорин и бриодин; ферменты для метаболизма стероидов, такие как 3-гидроксистероидоксидаза, экидстероид-UDP-гликозилтрансфераза и холестериноксидаза; ингибитор эдизона; HMG-CoA-редуктаза; ингибиторы ионных каналов, такие как ингибитор натриевых каналов и ингибитор калиевых каналов; эстераза ювенильного гормона; рецептор натрийуретического гормона; стильбенсинтаза; дибензилсинтаза; хитиназа и глюканаза.

Примеры токсинов, экспрессируемых в генетически сконструированном растении, включают в себя гибридный токсин, частично исключенный токсин и модифицированный токсин инсектицидного белка, такого как 5-эндотоксин, включающий в себя Cry1Ab, Cry1Ac, Cry1F, Cry1Fa2, Cry2Ab, Cry3A, Cry3b1 и Cry9C, и инсектицидные белки, включающие в себя VIP1, VIP2, VIP3 и VIP3A. Гибридный токсин продуцируется новой комбинацией доменов, обеспечивающих образование различных белков на основе способа рекомбинации. Примеры частично делецированного токсина включают в себя Cry1Ab, у которого часть аминокислотной последовательности исключена. У модифицированного токсина одна или несколько аминокислот токсина природного типа заменены другими аминокислотами.

Примеры токсинов и рекомбинантных растений, способных продуцировать токсины, описаны в EP-A-0374753, WO93/07278, WO95/34656, EP-A-0427529, EP-A-451878 и WO03/052073 и т.д.

Токсины, содержащиеся в таком рекомбинантном растении, могут обеспечить растение устойчивостью к вредным насекомым Coleoptera, вредным насекомым Diptera и вредным насекомым Lepidoptera.

Генетически сконструированные растения, которые содержат один или несколько пестицидных, придающих устойчивость к вредным насекомым генов и экспрессируют один или несколько токсинов, являются известными и некоторые из них уже являются коммерчески доступными. Примеры генетически сконструированных растений включают в себя YieldGard (фирменное наименование) (разновидность кукурузы, которая экспрессирует токсин Cry1Ab), YieldGard Rootworm (фирменное наименование) (разновидность кукурузы, которая экспрессирует токсин Cry3b1), YieldGard Plus (фирменное наименование) (разновидность кукурузы, которая экспрессирует токсин Cry1Ab и токсин Cry3b1), Herculex I (фирменное наименование) (разновидность кукурузы, которая экспрессирует фосфинотрицин-N-ацетилтрансферазу (PAT), которая придает устойчивость к токсину Cry1Fa2 и глюфосинату), NuCOTN33B (фирменное наименование) (разновидность хлопчатника, которая экспрессирует токсин Cry1Ac), Bollgard I (фирменное наименование) (разновидность хлопчатника, которая экспрессирует токсин Cry1Ac), Bollgard II (фирменное наименование) (разновидность хлопчатника, которая экспрессирует токсины Cry1Ac и Cry2Ab), VIPCOT (фирменное наименование) (разновидность хлопчатника, которая экспрессирует токсин VIP), NewLeaf (фирменное наименование) (разновидность картофеля, которая экс-

прессирует токсин Cry3A), NatureGard (фирменное наименование), Agrisure (фирменное наименование) GT Advantage (признак устойчивости к GA21-глифосату), Agrisure (фирменное наименование) CB Advantage (признак устойчивости к BtII мотыльку кукурузному (CB)) и Protecta (фирменное наименование).

"Сельскохозяйственное и садовое растение" включает в себя растение, которое получают генной инженерией так, чтобы оно обладало способностью продуцировать антипатогенное вещество, обладающее селективной активностью.

Примеры антипатогенного вещества включают в себя белки PR (PRP, описанные в EP-A-0392225); ингибиторы ионных каналов, такие как ингибитор натриевого канала и ингибитор кальциевого канала (известны токсины KP1, KP4, KP6, которые продуцируются вирусами); стильбенсинтазу; дибензилсинтазу; хитиназу; глюканазу и вещества, продуцируемые микроорганизмом, такие как пептидные антибиотики, антибиотики, имеющие гетероцикл, и белковый фактор, связанный с устойчивостью к болезни растений (называемый "геном устойчивости растения к болезни" и описанный в WO03/000906). Такие антипатогенные вещества и растения, сконструированные генетической инженерией для продуцирования таких веществ, описаны в EP-A-0392225, W095/33818 и EP-A-0353191 и т.д.

"Сельскохозяйственное и садовое растение" включает в себя растение, которому придают полезные признаки, такие как признак обладания модифицированными масляными компонентами или признак продуцирования повышенного количества аминокислоты, способом генетической рекомбинации. Примеры его включают в себя VISTIVE (фирменное наименование) (соя, имеющая масло с пониженным содержанием линоленовой кислоты) или кукуруза с высоким содержанием лизина (высоким содержанием масла), (кукуруза, имеющая повышенное количество лизина или масла).

Кроме того, имеется также "стэк"-разновидность, у которой имеется сочетание множества признаков классического гербицидного признака или ген устойчивости к гербицидам, ген устойчивости к пестицидам для насекомых, ген продуцирования антипатогенного вещества и полезных признаков, таких как признак наличия модифицированных масляных компонентов или признак продуцирования повышенного количества аминокислоты.

Агрохимическая композиция изобретения содержит производное триазина изобретения или его соль и приемлемый для сельского хозяйства носитель. Агрохимическая композиция изобретения, если необходимо, может содержать дополнительные компоненты, которые обычно применяют для агрохимических препаратов.

Примеры дополнительных компонентов включают в себя носители, такие как твердый носитель и жидкий носитель, поверхностно-активное вещество, связывающее вещество, агент, придающий липкость, загуститель, окрашивающий агент, агент для распределения препарата по поверхности, агент, придающий вязкость, антифризный агент, агент против слеживания, агент, нарушающий целостность препарата, ингибитор разложения и тому подобное.

Если необходимо, в качестве дополнительных компонентов можно также применять антисептический агент, измельченное растение (порошок сои, порошок табака, порошок ореха, порошок пшеницы, порошок древесины, шелуху, шелуху пшеницы, наружную шелуху, опилки, хлопья пульпы, стебли кукурузы, скорлупу орехов, измельченную сердцевину плодов и т.д.) и тому подобное.

Эти дополнительные компоненты можно применять по отдельности или в виде комбинации двух или более типов таких компонентов.

Указанные выше дополнительные компоненты будут описаны конкретно.

Примеры твердого носителя включают в себя природные минералы, такие как кварц, глина, каолинит, пирофиллит, серицит, тальк, бентонит, кислая глина, аттапульгит, цеолит и диатомит; неорганические соли, такие как карбонат кальция, сульфат аммония, сульфат натрия и хлорид калия; органические твердые носители, такие как синтетическая кремниевая кислота, синтетический силикат, крахмал, целлюлоза и порошок растений; пластиковые носители, такие как полиэтилен, полипропилен и поливинилденхлорид, и тому подобное. Их можно применять по отдельности или в виде комбинации двух или более типов таких носителей.

Примеры жидкого носителя включают в себя спирты, широко классифицированные на одноатомные спирты, такие как метанол, этанол, пропанол, изопропанол и бутанол, и многоатомные спирты, такие как этиленгликоль, диэтиленгликоль, пропиленгликоль, гексилгликоль, полиэтиленгликоль, полипропиленгликоль и глицерин; производные многоатомных спиртов, такие как простой эфир на основе пропиленгликоля, кетоны, такие как ацетон, метилэтилкетон, метилизобутилкетон, диизобутилкетон и циклогексанон; простые эфиры, такие как диэтиловый эфир, диоксан, целлозольв, дипропиловый эфир и тетрагидрофуран; алифатические углеводороды, такие как n-парафин, нафтен, изопарафин, керосин и минеральное масло; ароматические углеводороды, такие как бензол, толуол, ксилол, растворитель нафта и алкилнафталин; галогенированные углеводороды, такие как дихлорэтан, хлороформ и тетрагидрофуран; сложные эфиры, такие как этилацетат, диизопропилфталат, дибутилфталат, диоктилфталат и диметиладипат; лактоны, такие как γ -бутиролактон; амиды, такие как N,N-диметилформамид, N,N-диэтилформамид, N,N-диметилацетамид и N-алкилпирролидинон; нитрилы, такие как ацетонитрил; серосодержащие соединения, такие как диметилсульфоксид; растительные масла, такие как соевое масло, масло канолы, хлопковое масло и касторовое масло; воду и тому подобное. Их можно применять в от-

дельности или в виде комбинации двух или более типов таких носителей.

Поверхностно-активное вещество конкретно не ограничивается, но предпочтительными являются поверхностно-активные вещества, которые либо превращаются в гель в воде, либо обладают свойствами набухания. Примеры их включают в себя неионогенные поверхностно-активные вещества, такие как эфир сорбитана и жирной кислоты, эфир полиоксиэтиленсорбитана и жирной кислоты, эфир сахарозы и жирной кислоты, эфир полиоксиэтилена и жирной кислоты, эфир полиоксиэтилена и смоляных кислот, диэфир полиоксиэтилена и жирной кислоты, алкиловый простой эфир полиоксиэтилена, алкилфениловый простой эфир полиоксиэтилена, диалкилфениловый простой эфир полиоксиэтилена, конденсат алкилфенилового простого эфира полиоксиэтилена и формальдегида, блоксополимер полиоксиэтилена и полиоксипропилена, блоксополимер алкилового простого эфира полиоксиэтилена и полипропилена, полиоксиэтиленалкиламин, амид полиоксиэтиленжирной кислоты, бисфениловый простой эфир полиоксиэтиленжирной кислоты, полиалкиленбензилфениловый простой эфир, полиоксиалкиленстирилфениловый простой эфир, ацетилендиол, ацетилендиол, конденсированный с полиоксиалкиленом, полиоксиэтиленовый простой эфир силикона, сложный эфир силикона, поверхностно-активное вещество на основе фтора, полиоксиэтилированное касторовое масло и полиоксиэтилированное и гидrogenизированное касторовое масло; анионогенные поверхностно-активные вещества, такие как алкилсульфат, сульфат алкилового простого эфира полиоксиэтилена, сульфат алкилфенилового простого эфира полиоксиэтилена, сульфат стирилфенилового простого эфира полиоксиэтилена, алкилбензолсульфонат, лигнинсульфонат, алкилсульфосукцинат, нафталинсульфонат, алкилнафталинсульфонат, соль конденсата нафталинсульфоновой кислоты и формальдегида, соль конденсата алкилнафталинсульфоновой кислоты и формальдегида, соль жирной кислоты, поликарбоксилат, саркозинат N-метилжирной кислоты, соль смоляных кислот, фосфат алкилового простого эфира полиоксиэтилена и фосфат алкилфенилового простого эфира полиоксиэтилена; катионогенные поверхностно-активные вещества, такие как гидрохлорид лаурилами́на, гидрохлорид стеариламина, гидрохлорид олеиламина, ацетат стеариламина, ацетат стеариламинопропиламина, хлорид алкилтриметиламмония и хлорид алкилдиметилбензалкония; амфотерные поверхностно-активные вещества типа аминокислот или бетаинов и тому подобное.

Эти поверхностно-активные вещества можно применять по отдельности или в виде комбинации двух или более их типов.

Примеры связывающего вещества или вещества для повышения клейкости включают в себя карбоксиметилцеллюлозу и ее соль, декстрин, водорастворимый крахмал, ксантановую камедь, гуаровую камедь, сахарозу, поливинилпирролидон, арабийскую камедь, поливиниловый спирт, поливинилацетат, полиакрилат натрия, полиэтиленгликоль, имеющий среднюю молекулярную массу от 6000 до 20000, полиэтиленоксид, имеющий среднюю молекулярную массу от 100000 до 5000000, природные фосфолипиды (например, цефаловую кислоту, лецитин) и тому подобное.

Примеры загущающего агента включают в себя водорастворимые полимеры, такие как ксантановая камедь, гуаровая камедь, карбоксиметилцеллюлоза, поливинилпирролидон, карбоксивиниловый полимер, акриловый полимер, производное крахмала и полисахарид; тонкоизмельченные неорганические порошки, такие как бентонит высокой чистоты и белая сажа, и тому подобное.

Примеры окрашивающего агента включают в себя неорганические пигменты, такие как оксид железа, оксид титана и берлинская лазурь; органические красители, такие как ализариновый краситель, азо-краситель и краситель фталоцианин металла и тому подобное.

Примеры агента-наполнителя включают в себя силиконовое поверхностно-активное вещество, порошок целлюлозы, декстрин, обработанный крахмал, хелатное соединение полиаминокарбоновой кислоты, сшитый поливинилпирролидон, сополимер малеиновой кислоты, стирола и метакриловой кислоты, сложный полуэфир полимера многоатомного спирта и ангидрида дикарбоновой кислоты, водорастворимую соль полистиролсульфоната и тому подобное.

Примеры агента для распределения препарата по поверхности включают в себя различные поверхностно-активные вещества, такие как натриевая соль сульфодиакилсукцината, алкиловый простой эфир полиоксиэтилена, алкилфениловый простой эфир полиоксиэтилена и эфир полиоксиэтилена и жирной кислоты, парафин, терпен, полиамидная смола, полиакрилат, полиоксиэтилен, воск, поливинилалкиловый простой эфир, конденсат алкилфенола и формальдегида, эмульсия синтетической смолы и тому подобное.

Примеры антизамерзающего агента включают в себя многоатомные спирты, такие как этиленгликоль, диэтиленгликоль, пропиленгликоль, глицерин и тому подобное.

Примеры средства против слеживания включают в себя полисахариды, такие как крахмал, альгиновая кислота, манноза и галактоза, поливинилпирролидон, белая сажа, сложноэфирная камедь, кумаронинденевая смола и тому подобное.

Примеры агента, нарушающего целостность препарата, включают в себя триполифосфат натрия, гексаметафосфат натрия, стеарат металла, порошок целлюлозы, декстрин, сополимер эфира метакриловой кислоты, поливинилпирролидон, хелатное соединение полиаминокарбоновой кислоты, сополимер сульфированного стирола, изобутилена и малеинового ангидрида, привитой сополимер крахмала и полиакрилонитрила и тому подобное.

Примеры ингибитора разложения включают в себя дессиканты, такие как цеолит, известь и оксид магния; антиоксиданты, которые основаны на феноле, аminer, сере и фосфорной кислоте; поглотители ультрафиолетовых лучей, которые основаны на салициловой кислоте, бензофеноне или т.д., и тому подобное.

Примеры антисептического агента включают в себя сорбат калия, 1,2-бензтиазолин-3-он и тому подобное.

В агрохимической композиции изобретения в случае, когда в нее включены описанные выше дополнительные компоненты, содержание носителя (на основе массы) обычно выбирают от 5 до 95%, предпочтительно от 20 до 90%, содержание поверхностно-активного вещества обычно выбирают от 0,1 до 30%, предпочтительно от 0,5 до 10% и содержание других добавок выбирают от 0,1 до 30%, предпочтительно от 0,5 до 10%.

Агрохимическую композицию изобретения можно применять в любых формах, таких как жидкий препарат, эмульгируемый концентрат, смачиваемый порошок, dust, раствор в масле, диспергируемые в воде гранулы, текучий препарат, гранулы, препарат Jumbo и суспензия.

Иногда при применении агрохимическую композицию можно разбрызгивать после разбавления до адекватной концентрации или можно применять непосредственно.

Агрохимическую композицию изобретения можно применять для нанесения на листья, нанесения на почву, нанесения на поверхность воды или т.д. Агрохимическую композицию изобретения, в частности гербицид, применяют для обработки почв, т.е. сельскохозяйственного угодья полей и рисовых полей, на которых культивируют сельскохозяйственные и садовые растения.

Для агрохимической композиции изобретения смешиваемое количество активного компонента согласно изобретению выбирают произвольно, как необходимо. В случае dusta, гранул и тому подобного смешиваемое количество активного компонента следует произвольно выбирать из от 0,01 до 10 мас.%, предпочтительно от 0,05 до 5 мас.%. В случае эмульгируемого концентрата, смачиваемого порошка и тому подобного смешиваемое количество следует произвольно выбирать от 1 до 50 мас.%, предпочтительно от 5 до 30 мас.%. Кроме того, в случае текучего состава или тому подобного смешиваемое количество следует произвольно выбирать от 1 до 40 мас.%, предпочтительно от 5 до 30 мас.%.

Наносимое количество агрохимической композиции согласно изобретению изменяется в зависимости от типа применяемого соединения, сорняка, который нужно уничтожить, особенности культивирования, условий окружающей среды, применяемого препарата или тому подобного. В случае непосредственного применения dusta, гранул или тому подобного количество следует произвольно выбирать от 1 г до 50 кг, предпочтительно от 10 г до 10 кг на 1 г, в расчете на активный компонент. Далее, в случае применения жидкой формы, например, в случае эмульгируемого концентрата, смачиваемого порошка, текучего состава или тому подобного количество следует произвольно выбирать от 0,1 до 50000 м.д., предпочтительно от 10 до 10000 м.д. на 1 г.

Агрохимическая композиция изобретения обладает превосходной гербицидной активностью и поэтому является применимой, в частности, в качестве гербицида.

Согласно цели применения агрохимическую композицию изобретения можно изготовить, смешать или применять в комбинации по меньшей мере с одним дополнительным агрохимически активным компонентом, например компонентом для борьбы с болезнью растений, пестицидным компонентом, акарицидным компонентом, нематоцидным компонентом, синергическим компонентом, приманивающим компонентом, репеллентным компонентом, гербицидным компонентом, предохранительным компонентом, микробным пестицидным компонентом, компонентом регулирования роста растений, компонентом-удобрением, агентом, улучшающим почву, и т.д.

Когда композицию применяют в комбинации с другим агрохимически активным компонентом или удобрением, препарат каждого индивидуального компонента можно смешать с другими во время применения. Кроме того, каждый препарат индивидуального компонента можно применять по порядку или можно применять с интервалами несколько дней. Когда препараты применяют с интервалом нескольких дней, их можно наносить, например, с интервалом от 1 дня до 40 дней, хотя интервал может изменяться в зависимости от каждого применяемого компонента.

Согласно агрохимической композиции изобретения, когда применяют смесь по меньшей мере одного соединения, выбранного из производных триазина, представленных формулой [1], и их солей, и по меньшей мере одного соединения, выбранного из других агрохимически активных компонентов, их обычно применяют в массовом отношении от 100:1 до 1:100, предпочтительно от 20:1 до 1:20 и особенно от 10:1 до 1:10.

Среди других агрохимически активных компонентов, которые можно смешать или применять в комбинации с соединением изобретения в агрохимической композиции изобретения, примеры известных гербицидов или агентов регулирования роста растений описаны ниже, но изобретение не ограничивается ими.

Гербициды.

A1. Гербициды ингибирования ацетил-CoA-карбоксилазы (АССазы).

(A1-1) Соединение на основе арилоксифеноксипропионовой кислоты: клодинафоп-пропаргил, ци-

галофоп-бутил, диклофоп-метил, диклофоп-Р-метил, феноксапроп-Р-этил, флуазифоп-бутил, флуазифоп-Р-бутил, галоксифоп, галоксифоп-этиол, галоксифоп-Р, метамифоп, пропахизафоп, хизалофоп-этил, хизалофоп-Р-этил, хизалофоп-Р-тефурил и фентиапроп-этил.

(A1-2) Соединение на основе циклогександиона: аллоксидим, бутроксидим, клетодим, циклоксидим, профоксидим, зетоксидим, тепралоксидим и тралкоксидим.

(A1-3) Соединение на основе фенилпиразолина: аминопиралид и пиноксаден.

В. Гербициды ингибирования ацетолактатсинтазы (ALS).

(B-1) Соединение на основе имидазолинона: имазаметабенз-метил, имазамокс, имазапик (в том числе соли с амином или тому подобным), имазапир (в том числе соли с изопропиламином или тому подобным), имазахин и имазетапир.

(B-2) Соединение на основе пиримидинилоксибензойной кислоты: биспирибак-натрий, пирибензоксим, пирифталид, пириминобак-метил, пиритиобак-натрий и пиримисульфат.

(B-3) Соединения на основе сульфониламинокарбонилтриазинона: флукарбазон-натрий, тиенокарбазон (в том числе натриевая соль, метиловый эфир или тому подобное), пропоксикарбазон-натрий, прокарбазон-натрий.

(B-4) Соединение на основе сульфонилмочевины: амидосульфурон, азимосульфурон, беносульфурон-метил, хлоримурон-этил, хлоросульфурон, циноосульфурон, циклосульфамурон, этаметосульфурон-метил, этоксисульфурон, флазасульфурон, флупиросульфурон-метил-натрий, форамосульфурон, галосульфурон-метил, имазосульфурон, иодосульфурон-метил-натрий, мезосульфурон-метил, метосульфурон-метил, никосульфурон, оксасульфурон, примисульфурон-метил, просульфурон, пиразосульфурон-этил, римосульфурон, сульфометурон-метил, сульфосульфурон, тифеносульфурон-метил, триасульфурон, трибенурон-метил, трифлоросульфурон-натрий, трифлосульфурон-метил, тритосульфурон, ортосульфамурон, пропирисульфурон, метазосульфурон и флуцетосульфурон.

(B-5) Соединение на основе триазолопиримидина: клорансулам-метил, диклосулам, флорасулам, флуметсулам, метосулам, пенксулам, пироксулам и HNPC-C-9908 (номер кода).

C1. Гербициды 1 ингибирования фотосинтеза фотосистемы II.

(C1-1) Соединение на основе фенилкарбамата: десмедифам и фенмедифам.

(C1-2) Соединение на основе пиридазинона: хлоридазон и бромпиразон.

(C1-3) Соединение на основе триазина: аметрин, атразин, цианазин, десметрин, диметаметрин, эглиназин-этил, прометон, прометрин, пропазин, симазин, симетрин, тербуметон, тербутилазин, тербутрин и триэтазин.

(C1-4) Соединение на основе триазинона: метамитрон и метрибузин.

(C1-5) Соединение на основе триазинона: амикарбазон.

(C1-6) Соединение на основе урацила: бромацил, ленацил и тербацил.

C2. Гербициды 2 ингибирования фотосинтеза фотосистемы II

(C2-1) Соединение на основе амида: пентанохлор и пропанил.

(C2-2) Соединение на основе мочевины: хлорбромурон, хлортолурун, хлороксурон, димефурон, диурон, этидимурон, фенурон, флуометурон, изопротурон, изоурон, линурон, метабензтиазурон, метобромурон, метоксурон, монолинурон, небурон, сидурон, тебутиурон и метобензурун.

C3 Гербициды 3 ингибирования фотосинтеза фотосистемы II.

(C3-1) Соединение на основе бензотиадиазинона: бентазон.

(C3-2) Соединение на основе нитрила: бромфеноксим, бромоксинил (в том числе форма эфира с масляной кислотой, октановой кислотой и гептановой кислотой) и иоксинил.

(C3-3) Гербицидное соединение на основе фенилпиразина: пиридафол и пиридат.

D. Гербициды генерации радикала фотосистемы I.

(D-1) Соединение на основе дипиридиния: дикват- и паракватдихлорид.

E. Гербициды ингибирования протопорпириногенаоксидазы (PPO).

(E-1) Соединение на основе дифенилового простого эфира: ацифлуорфен-натрий, бифенокс, хлометоксифен, этоксифен-этил, флуорогликофен-этил, фомезафен, лактофен и оксифлуорфен.

(E-2) Соединение на основе N-фенилфтальмида: цинидон-этил, флумиклорак-пентил, флумиоксазин и хлорфтальмид.

(E-3) Соединение на основе оксидазола: оксадиаргил и оксадиазон.

(E-4) Соединение на основе оксазолидиндиона: пентоксазон.

(E-5) Соединение на основе фенилпиразола: флуазолат и пирафлуфен-этил.

(E-6) Соединение на основе пиримидиндиона: бензфендизон, бутафенацил и сафлуфенацил.

(E-7) Соединение на основе тиadiaзола: флутиацет-метил и тидиазимин.

(E-8) Соединение на основе триазинона: азафенидин, карфентразон-этил, сульфентразон и бенкарбазон.

(E-9) Другие соединения: флуфенпир-этил, профлуазол, пираклонил, SYP-298 (номер кода) и SYP-300 (номер кода).

F1. Гербициды ингибирования фитоендесатуразы (PDS).

(F1-1) Соединение на основе пиридазинона: норфлуразон.

- (F1-2) Соединение на основе карбоксамина пиримидина: дифлуфеникан и пиколинафен.
 (F1-3) Другие соединения: бифлубутамид, флуридон, флуорхлоридон и флуртамон.
 F2. Гербициды ингибирования 4-гидроксибензилпируватдеоксигеназы (HPPD).
 (F2-1) Соединение на основе каллистемона: мезотрион.
 (F2-2) Соединение на основе изоксазола: пирасульфотол, изоксафлутол и изоксахлортол.
 (F2-3) Соединение на основе пиразола: бензофенап, пиразолинат и пиразоксифен.
 (F2-4) Соединение на основе трикетона: сулкотрион, тефурилтрион, темботрион, пирасульфотол, топразезон, бициклопирон и 4-хлор-5-(1,3-диоксоциклогекса-2-ил)карбонил-2,3-дигидробензотиофен-1,1-диоксид.
 F3. Гербициды типа ингибирования биосинтеза каротиноидов (мишень неизвестна).
 (F3-1) Соединение на основе дифенилового простого эфира: аклонифен.
 (F3-2) Соединение на основе изоксазолидинона: кломазон.
 (F3-3) Соединение на основе триазола: амитрол.
 G. Гербициды ингибирования синтеза EPSP-синтазы (ингибирование биосинтеза ароматических аминокислот)
 (G-1) Соединение на основе глицина: глифосат (в том числе его соли натрия, амина, пропиламина, изопропиламина, диметиламина и тримезия).
 H. Гербициды ингибирования синтеза глутамина.
 (H-1) Соединение на основе фосфиновой кислоты: биланафос, глюфосинат (в том числе его соли амина и натрия).
 I. Гербициды ингибирования дигидроптероевой кислоты (DHP).
 (I-1) Соединение на основе карбамата: азулам.
 K1. Гербициды ингибирования ассоциации микротрубочек.
 (K1-1) Соединение на основе бензамида: пропизамид и тебутам.
 (K1-2) Соединение на основе бензойной кислоты: хлортал-диметил.
 (K1-3) Соединение на основе динитроанилина: бенфлуралин, бутралин, динитрамин, эталфлуралин, флухлоралин, оризалин, пендиметалин, продиамин и трифлуралин.
 (K1-4) Соединение на основе фосфоамида: ампрофос-метил и бутамифос.
 (K1-5) Соединение на основе пиридина: дитиопир и тиазопир.
 K2. Гербициды ингибирования митоза/образования ткани микротрубочек.
 (K2-1) Соединение на основе карбамата: карбетамид, хлорпрофам, профам, свеп и карбутилат.
 K3. Гербициды ингибирования синтазы жирных кислот с очень длинной цепью (VLCFA).
 (K3-1) Соединение на основе ацетамида: дифенамид, напропамид и напроанилид.
 (K3-2) Соединение на основе хлорацетамида: ацетохлор, алахлор, бутахлор, бутенахлор, диэтил-этил, диметахлор, диметенамид, диметенамид-Р, метазахлор, метолахлор, петоксамид, претилахлор, пропахлор, пропизохлор, S-метолахлор и тенилхлор.
 (K3-3) Соединение на основе оксиацетамида: флуфенацет и мифенацет.
 (K3-4) Соединение на основе тетразолинона: фентразамид.
 (K3-5) Другие соединения: анилофос, бромбутид, кафенстрол, инданофан, пиперофос, фенокса-сульфон, пироксасульфен и ипфенкарбазон.
 L. Гербициды ингибирования синтеза целлюлозы.
 (L-1) Соединение на основе бензамида: изоксабен.
 (L-2) Соединение на основе нитрила: дихлобенил, хлортиамид.
 (L-3) Соединение на основе триазолокарбоксамида: флупоксам.
 M. Гербициды расщепляющих агентов (деструкции клеточных мембран).
 (M-1) Соединение на основе динитрофенола: динотерб и DNOC (в том числе его соли амина или натрия).
 N. Гербициды ингибирования биосинтеза липидов (в том числе ингибирование АССазы).
 (N-1) Соединение на основе бензофурана: бенфурезат и этофумезат.
 (N-2) Соединение на основе галогенированных карбоновых кислот: далапон, флупропанат и ТСА (в том числе соли натрия, калия или аммония).
 (N-3) Соединение на основе фосфородитиоата: бенсулид.
 (N-4) Соединение на основе тиокарбамата: бутилат, циклоат, димепиперат, ЕРТС, эспрокарб, молинат, орбенкарб, пебулат, просульфоккарб, тиобенкарб, тиокарбазил, триаллат и вернолат.
 O. Гербициды ингибирования синтеза ауксина.
 (O-1) Соединение на основе бензойной кислоты: хлорамбен, 2,3,6-ТВА и дикамба (в том числе соли амина, диэтиламина, триэтаноламина, изопропиламина, натрия или лития).
 (O-2) Соединение на основе феноксикарбоновой кислоты: 2,4,5-Т, 2,4-Д (в том числе соли амина, диэтиламина, изопропиламина, дигликольамина, натрия или лития), 2,4-ДВ, кломепроп, дихлорпроп, дихлорпроп-Р, МСРА, МСРА-тиоэтил, МСРВ (в том числе соль натрия и этиловый эфир), мекопроп (в том числе соли натрия, калия, изопропиламина, триэтаноламина и диметиламина) и мекопроп-Р.
 (O-3) Соединение на основе пиридинкарбоновой кислоты: клопиралид, флуороксибир, пиклорам,

триклопир и триклопир-бутотил.

(O-4) Соединение на основе хинолинкарбоновой кислоты: хинклорак и хинмерак.

(O-5) Другие соединения: беназолин.

P. Гербициды ингибирования переноса ауксина.

(P-1) Соединение на основе фталаматов: напалам (в том числе соли натрия).

(P-2) Соединение на основе семикарбазона: дифлуфензопир.

Z. Гербициды с неизвестным способом действия:

флампроп-М (в том числе метиловый, этиловый и изопропиловый сложный эфир), флампроп (в том числе метиловый, этиловый и изопропиловый сложный эфир), хлорфлуренол-метил, цинметилин, кумилурон, даймурон, метилдимурон, дифензокват, этобензанид, фосамин, пирибутикарб, оксазикломефон, акролеин, АЕ-F-150944 (номер кода), аминоклопирахлор, цианамид, гептамалоксисилоглюкан, индазифлам, триазифлам, хинокламин, эндотал-динатрий, фенизофам, BDPT, ВАU-9403 (номер кода), SYN-523 (номер кода), SYP-249 (номер кода), JS-913 (номер кода), IR-6396 (номер кода), метиозолин, триафамон, HW-02 (номер кода) и ВСS-AA10579 (номер кода).

Соединения, регулирующие рост растений: 1-метилциклопропен, 1-нафтилацетамид, 2,6-диизопропилнафталин, 4-CPA, бензиламинопурин, анцимидол, авиглицин, карвон, хлормекват, клопроп, клоксифонак, клоксифонак-калий, цикланилид, цитокинины, даминодид, дикегулак, диметипин, этефон, этихлозат, флуметралин, флуренол, флурпримидол, форхлорфенурон, гиббереллиновая кислота, инабенфид, индолуксусная кислота, индолмасляная кислота, гидразид малеиновой кислоты, мефлуидид, мепикват хлорид, н-деканол, паклобутразол, прогексадион-кальций, прогидрожасмон, синтофен, тидиазурон, триаконтанол, тринексапак-этил, униканазол, униканазол-Р и эколист.

Ниже в контексте указываются в качестве примеров известные предохранительные средства, которые можно смешать или применять в комбинации с соединением изобретения, но изобретение не ограничивается такими соединениями: беноксакор, фурилазол, дихлормид, дициклонон, DKA-24 (N¹,N²-диаллил-N²-дихлорацетилглицинамид), AD-67 (4-дихлорацетил-1-окса-4-азаспиро[4.5]декан), PPG-1292 (2,2-дихлор-N-(1,3-диоксан-2-илметил)-N-(2-пропенил)ацетамид), R-29148 (3-дихлорацетил-2,2,5-триметил-1,3-оксазолидин), клохинтет-мексил, нафталевый ангидрид (1,8-нафталевый ангидрид), мефенпир-диэтил, мефенпир, мефенпир-этил, фенхлоразол-О-этил, фенклорим, MG-191 (2-дихлорметил-2-метил-1,3-диоксан), циометринил, флуразол, флуксофеним, изоксадифен, изоксадифен-этил, мекопроп, МСРА, даймурон, 2,4-D, MON4660 (номер кода), оксабетринил, ципросульфамид, бензойная кислота, замещенная низшим алкилом, и TI-35 (номер кода).

Среди других гербицидно активных соединений, которые можно смешать или применять в комбинации с соединением изобретения, ниже описаны известные агенты для борьбы с болезнями растений, но изобретение не ограничивается ими.

1. Ингибитор биосинтеза нуклеиновой кислоты:

ацилаланиновое соединение; беналаксил, беналаксил-М, фуралаксил, металаксил и металаксил-М;

соединение на основе оксазолидинона: оксадиксил;

соединение на основе бутилоллактона: клозилаккон и офурац;

соединение на основе гидрокси-(2-амино)пиримидина: бупиримат, диметиримол и этиримол;

соединение на основе изоксазола: химексазол; соединение на основе изотахиазолона: октилинон;

соединение на основе карбоновой кислоты: оксолиновая кислота.

2. Ингибитор митоза и дифференциации клеток:

соединение на основе бензимидазола: беномил, карбендазим, фуберидазол и тиабендазол;

соединение на основе тиофаната: тиофанат и тиофанат-метил; соединение на основе N-фенилкарбамата: дизтофенкарб; соединение на основе толуамида: зоксамид; соединение на основе фенилмочевины: пенцикурон; соединение на основе пиридинилметилбензамида: флуопиколоид.

3. Ингибитор дыхания:

соединение на основе пиримидинамина: дифлуметорим;

соединение на основе карбоксамида: беноданил, флутоланил, мепронил, флуопирам, фенфурам, карбоксин, оксикарбоксин, тифлузамид, биксафен, фураметпир, изопиразам, пенфлуфен, пентипирад, зедаксан и боскалид;

соединение на основе метоксиакрилата: азоксистробин, энестробурин, пикоксистробин и пираокси-стробин;

соединение на основе метоксикарбамата: пиракlostробин, пираметостробин;

оксииминоацетатное соединение: крезоксим-метил и

трифлуксистробин;

соединение на основе оксииминоацетамида: димоксистробин, метоминостробин и оризастробин;

соединение на основе оксазолидиндиола: фамоксадон;

соединение на основе дигидродиоксидаина: флуоксастробин;

соединение на основе имидазолинона: фенамидон;

соединение на основе бензилкарбамата: пирибенкарб;

соединение на основе цианоимидазола: циазофамид;

- соединение на основе сульфамилтриазола: амисулбром;
- соединение на основе динитрофенилкротоновой кислоты: бинапакрил, мептилдинокап и динокап;
- соединение на основе 2,6-динитроанилина: флуазинам;
- соединение на основе гидразона пиримидинона: феримзон;
- соединение на основе трифенилолова: ТРТА, ТРТС, ТРТН; соединение на основе тиофенкарбоксамид: силтиофам; соединение на основе триазолопиримидиламина: аметоктрадин;
4. Ингибитор синтеза аминокислоты и белка:
- соединение на основе анилинопиримидина: ципродинил, мепанипирим и пириметанил;
- антибиотики на основе енопирануриновой кислоты: бластицидин-S и милдиомицин;
- антибиотики на основе гексопиранозила: казугамицин;
- антибиотики на основе глюкопиранозила: стрептомицин;
- антибиотики на основе тетрациклина: окситетрациклин;
- другие антибиотики: гентамицин.
5. Препарат, действующий на путь трансдукции сигнала:
- соединение на основе хинолина: хиноксифен; соединение на основе хиназолина: прохиназид;
- соединение на основе фенилпиррола: фенпиклонил и флудиоксонил;
- соединение на основе дикарбоксиимида: хлозолинат, ипродион, процимидон и винклозолин.
6. Ингибитор синтеза липида и клеточной мембраны:
- соединение на основе фосфоротиората: эдифенфос, ипробенфос и пиразофос;
- соединение на основе дитиола: изопротиолан;
- соединение на основе ароматического углеводорода: дифенил, хлоронеб, диклоран, хинтозен, текназен и толклофос-метил;
- соединение на основе 1,2,4-тиадиазола: этридазол;
- соединение на основе карбамата: иодокарб, пропамокарб-гидрохлорид и протиокарб;
- соединение на основе амида коричной кислоты: диметоморф и флуморф;
- соединение на основе карбамата амида валина: бентиаваликарб-изопропил, ипроваликарб и валифеналат;
- соединение на основе амида миндальной кислоты: мандипропамид;
- Bacillus subtilis* и бактериальный липопептидный продукт: *Bacillus subtilis* (штамм: QST 713).
7. Ингибитор синтеза стерина:
- соединение на основе пиперазина: трифорин;
- соединение на основе пиридина: пирифенокс;
- соединение на основе пиримидина: фенаримол и нуаримол;
- соединение на основе имидазола: имазалил, окспоконазол-фумарат, пефуразоат, прохлораз и трифлумизол;
- соединение на основе триазола: азаконазол, битертанол, бромуконазол, ципроконазол, дифеноконазол, диниконазол, диниконазол-М, эпоксиконазол, этаконазол, фенбуконазол, флухинконазол, флусилазол, флутриафол, гексаконазол, имибенконазол, ипконазол, метконазол, миклобутанил, пенконазол, пропиконазол, протиоконазол, симеконазол, тебуконазол, тетраконазол, триадимефон, триадименол, трипиконазол, фурсоназол, фурконазол-цис и хинконазол;
- соединение на основе морфолина: алдиморф, додеморф, фенпропиморф и тридеморф;
- соединение на основе пиперидина: фенпропидин и пипералин;
- соединение на основе спирокетальамина: спирокамин;
- соединение на основе гидроксанилида: фенгексамид;
- соединение на основе тиокарбамата: пирибутикарб;
- соединение на основе ариламина: нафтифин и тербинафин.
8. Ингибитор биосинтеза тьюкана: антибиотики на основе глюкопиранозила: валидамицин; пептидпиримидиннуклеотидное соединение: полиоксин.
9. Ингибитор синтеза меланина:
- соединение на основе изобензофуранона: фталид;
- соединение на основе пирролохинолина: пирохилон;
- соединение на основе триазолобензотиазола: трициклазол;
- соединение на основе карбоксамид: карпропамид, диклоцимет;
- соединение на основе пропионамида: феноксанил.
10. Препарат для индуцирования устойчивости к болезни растений:
- соединение на основе бензотиадиазола: ацибензолар-S-метил;
- соединение на основе бензоизотиазола: пробеназол;
- соединение на основе тиадиазолкарбоксамид: тиадинил и изотианил;
- природный продукт: ламинарии.
11. Препарат с неизвестным способом действия или многими способами действия:
- соединение меди: гидроксид меди, диоктаноат меди, оксихлорид меди, сульфат меди, оксид меди(I), оксин-медь, смесь Bordeaux и нонилфенолсульфонат меди;

серасодержащее соединение: сера;
соединение на основе дитиокарбамата: фербам, манкозеп, манеб, метирам, пропинеб, тирам, зинеб, зирам и суфранеб;

соединение на основе фталимида: каптан, фолпет и каптафол;

соединение на основе хлорнитрила: хлороталонил;

соединение на основе сульфида: дихлофлуанид, толилфлуанид;

соединение на основе гуанидина: гуазатин, иминоктадин-албезилат и иминоктадин-триацетат, долин;

другие соединения: анилазин, дитианон, цимоксанил, вфосетил (алюминий, кальций и натрий), фосфористая кислота и ее соли, теклофталам, триазоксид, флулсульфамид, дикломезин, метасульфокарб, этабоксам, цифлупенамид, метрафенон, бикарбонат калия, бикарбонат натрия, BAF-045 (номер кода), BAG-010 (номер кода), бентиазол, бронопол, карвон, хинометионат, дазомет, DBEDC, дебакарб, дихлорофен, дифензокват-метилсульфат, диметилдисульфид, дифениламин, этоксихин, флуметовер, фторимид, флутианил, флуксапироксад, фуранкарбоновая кислота, мета, наба, натамицин, нитрапирин, нитротал-изопропил, о-фенилфенол, оксазинилазол, оксихинолина сульфат, феназина оксид, поликарбамат, пирioфенон, S-2188 (номер кода), серебро, SYP-Z-048 (номер кода), тебуфлорин, толнифанид, трихлорамид, минеральные масла и органические масла.

12. Микроорганизмы и продукты микроорганизмов: *Agrobacterium radiobacter*, ферментированный продукт из *Aspergillus* spp., *Bacillus* spp., белок Harpin, *Erwinia carotovora*, *Fusarium oxysporum*, *Gliocladium* spp., Laccase, *Pseudomonas* spp., *Talaromyces* spp., *Trichoderma* spp., экстракт грибов и бактериофаг.

Среди других гербицидно активных компонентов, которые можно смешать или применять в комбинации с соединением изобретения, ниже описаны известные пестициды, акарициды, нематоциды и синергические агенты, но изобретение не ограничивается ими.

Пестициды, акарициды и нематоциды.

1. Ингибитор ацетилхолинэстеразы:

(1A) карбаматное соединение: аланикарб, алдикарб, алдоксикарб, бендиокарб, бенфуракарб, буткарбоксим, бутоксикарбоксим, карбарил, карбофуран, карбосульфат, этиофенкарб, фенобукарб, формтанат, фуратиокарб, изопрокарб, метиокарб, метомил, метолкарб, оксамил, пиримикарб, пропоксур, тиодикарб, тиофанокс, триазамат, триметакарб, 3,5-ксилилметилкарбамат (ХМС) и ксилкарб;

(1B) фосфорорганическое соединение: ацефат, азаметифос, азинфос-этил, азинфос-метил, кадусафос, хлорэтоксифос, хлорфенвинфос, хлормефос, хлорпирифос, хлорпирифос-метил, кумафос, цианофос, деметон-S-метил, диамидафос, диазинон, дихлорвос, дикротофос, диметоат, диметилвинфос, диоксабензофос, дисульфотон, DSP, EPN, этион, этопрофос, этримфос, фамфур, фенамифос, фенитротрион, фентион, фонофос, фостиазат, фоститан, гептенофос, изамидофос, изазофос, изофенфос-метил, изопропил-О-(метоксиаминотиофосфорил)салицилат, изоксатион, малатион, мекарбам, метамидофос, метидатион, мевинфос, монокротофос, налед, ометоат, оксидеметон-метил, оксидепрофос, паратион, паратион-метил, фентоат, форт, форталон, фосмет, фосфамидон, фоксим, пиримифос-метил, профенофос, пропатафос, пропатамфос, протиофос, пираклофос, пиридафентион, хиналфос, сульфотеп, тебупиримфос, темефос, тербуфос, тетраклорвинфос, тиометон, тионазин, триазофос, трихлорфон, вамидотион, дихлофентион, имицифос, изокарбофос, мезульфенфос и флупирозофос.

2. Ингибитор рецептора GABA (хлоридного канала):

(2A) соединение на основе циклодиенового органического хлорида: хлордан, эндосульфат и гамма-BCH;

(2B) соединение на основе фенилпиразола: ацетопрол, этипрол, фипронил, пирафлупрол, пирипрол и RZI-02-003 (номер кода).

3. Препарат, действующий на натриевый канал:

(3A) соединение на основе пиретроида: акринатрин, аллетрин [в том числе d-цис-транс и d-транс-изомеры], бифентрин, биоаллетрин, биоаллетрин-S-циклопентенил, биоресметрин, циклопротрин и цифлутрин [в том числе бета-изомер] циглотрин [в том числе гамма- и лямбда-изомеры], циперметрин [в том числе альфа-, бета-, тета- и зета-изомеры], цифенотрин [в том числе (1R)-транс-изомеры], дельтаметрин, эмперетрин, эсфенвалерат, этофенпрокс, фенпропатрин, фенвалерат, флуцитринат, флуметрин и тау-флувалинат [в том числе тау-], галфенпрокс, имипротрин, метофлутрин, перметрин и фенотрин [в том числе (1R)-транс-изомер], праллетрин, профлутрин, пиретрин, резметрин, RU1552 5 (номер кода), силафлуофен, тефлутрин, тетраметрин, тралометрин, трансфлутрин, ZXI8901 (номер кода), флувалинат, тетраметилфлутрин и меперфлутрин;

(3B) соединение на основе DDT, метоксиклор.

4. Агонист/антагонист рецептора никотинового ацетилхолина (4A).

Соединение на основе неоникотиноида: ацетамиприд, клотианидин, динотефуран, имидаклоприд, нитенпирам, тиаклоприд и тиаметоксам.

(4B) Соединение на основе никотина: никотин-сульфат.

5. Аллостерический активатор рецептора никотинового ацетилхолина: соединение на основе спиносина: спинеторам и спиносад.

6. Препарат, активирующий хлоридный канал: авермектин, соединение на основе милбемицина: абамектин, бензоат эмабектина, лепимектин, милбемектин, ивермектин и полинактины.

7. Препарат ювенильного гормона: диофенолан, гидропрен, кинопрен, метотрин, феноксикарб и пирпроксифен.

8. Препарат с неспецифическим способом действия (многочисленными способами действия): 1,3-дихлорпропен, DCIP, этилендибромид, метилбромид, хлорпикрин и сульфурилфторид.

9. Ингибитор питания: пиметрозин, флониамид и пирифлухиазон.

10. Агент, подавляющий рост клещей: клофентезин, дифлоvidaзин, гекситиазокс и этоксазол.

11. Препарат для разрушения интимы насекомых: препарат ВТ.

12. Ингибитор биосинтеза АТФ ферментов: диафентиурон; оловоорганическое соединение: азоциклоолово, цигексаолово и фенбутаоловооксид; пропаргит, тетрадифон.

13. Расщепляющий агент хлорфенапир и DНОС.

14. Препарат для блокирования канала никотинового ацетилхолина:

соединение на основе нереизтоксина: бенсултап, картап, тиоциклам и тиосултап.

15. Ингибитор биосинтеза хитина (тип 0):

соединение на основе бензоилмочевины: бистрифлурон, хлорфлуазурон, дифлубензурон, флуциклоксурон, флуфеноксурон, гексафлумурон, луфенурон, новалурон, новифлумурон, тефлубензурон, трифлумурон и флуазурон.

16. Ингибитор биосинтеза хитина (типа 1): бупрофезин.

17. Ингибитор линьки (для Diptera (двукрылых насекомых)): циромазин.

18. Агонист экдизона (гормона линьки) (для стимуляции линьки):

соединение на основе диацилгидразина: хромафенозид, галофенозид, метоксифенозид и тебуфенозид.

19. Агонист октопамина амитраз.

20. Ингибитор цепи переноса митохондриальных электронов (комплекс III): цифлуметофен, гидраметилнон, ацехиноцил, флаукрипирим и циенопирафен.

21. Ингибитор цепи переноса митохондриальных электронов (комплекс I): акарициды METI: феназахин, фенипроксимат, пиридабен, пиримидифен, тебуфенпирад и толфенпирад, другие: ротенон.

22. Ингибитор натриевых каналов индоксикарб и метафлумизон.

23. Ингибитор биосинтеза липидов: инсектициды/акарициды на основе тетроника: спиродиклофен, спиромезифен и спиротетрамат.

24. Ингибитор цепи переноса митохондриальных электронов (комплекс IV): фосфид алюминия, фосфин, фосфид цинка, цианид кальция и фосфин.

25. Препарат нейронального ингибитора (неизвестный способ действия): бифеназат.

26. Ингибитор аконитазы: фторацетат натрия.

27. Препарат, действующий на рецептор рианодина: хлорантранилипрол, флубендиамид и циантранилипрол.

28. Другие препараты (неизвестный способ действия): азадирахтин, амидофлумет, бенклотиаз, бензоксимат, бромпропилат, хинометионат, CL900167 (номер кода), криолит, дикофол, дицикланил, диенохлор, динобутон, фенбутатина оксид, фенотиокарб, флуенсульфон, флуфенерим, флусульфамид, каранин, метам, метопрен, метоксифенозид, метилизотиоцианат, пиридалил, пирифлухиазон, сулкофурон-натрий, сульфирамид и сульфоксафлор.

29. Синергический агент: пиперонилбутоксид и DEF.

Далее в контексте будут подробно описаны способы получения соединения формулы [1] согласно изобретению, примеры препаратов и применения с обращением к указанным ниже примерам. Однако изобретение никоим образом не ограничивается этими примерами. Ниже в описании "%" означает "массовый процент" и "части" означают "массовые части".

Пример 1. Получение 6-(2-гидрокси-6-охоциклогекса-1-енкарбонил)-2-метил-4-фенил-1,2,4-триазин-3,5(2Н,4Н)-диона (соединение № I-50).

(1) Получение 2-метил-3,5-диоксо-4-фенил-2,3,4,5-тетрагидро-1,2,4-триазин-6-карбонилхлорида.

0,93 г (3,76 ммоль)-2-метил-3,5-диоксо-4-фенил-2,3,4,5-тетрагидро-1,2,4-триазин-6-карбоновой кислоты и 0,72 г (5,64 ммоль) оксалилхлорида растворяли в дихлорметане (20 мл). К смеси добавляли каплю N,N-диметилформамида и смесь перемешивали при комнатной температуре в течение 2 ч. Реакционный раствор концентрировали, получая при этом 2-метил-3,5-диоксо-4-фенил-2,3,4,5-тетрагидро-1,2,4-триазин-6-карбонилхлорид в виде бледно-желтого маслянистого вещества.

(2) Получение 6-(2-гидрокси-6-охоциклогекса-1-енкарбонил)-2-метил-4-фенил-1,2,4-триазин-3,5(2Н,4Н)-диона.

0,63 г (5,64 ммоль) 1,3-циклогександиона и 0,57 г (5,64 ммоль) триэтиламина растворяли в дихлорметане (20 мл) при охлаждении льдом. К смеси медленно добавляли по каплям раствор в дихлорметане (10 мл) 2-метил-3,5-диоксо-4-фенил-2,3,4,5-тетрагидро-1,2,4-триазин-6-карбонилхлорид, полученный из указанного выше (1), и смесь перемешивали в течение 30 мин при охлаждении льдом. Реакционную смесь экстрагировали хлороформом и органический слой промывали водой, сушили над сульфатом маг-

ния и концентрировали при пониженном давлении. Полученные остатки растворяли в ацетонитриле (20 мл), добавляли 0,57 г (5,64 ммоль) триэтиламина и 0,03 г (0,38 ммоль) цианогидрина ацетона и смесь кипятили с обратным холодильником в течение 30 мин при нагревании. После концентрирования при пониженном давлении остатки растворяли в воде и раствор промывали этилацетатом. Водный слой подкисляли лимонной кислотой, экстрагировали хлороформом, сушили над сульфатом магния и концентрировали при пониженном давлении. Полученные кристаллы промывали метанолом, получая при этом 0,36 г требуемого соединения (выход 28%).

Точка плавления: 182-185°C.

Пример 2. Получение 6-(5-гидрокси-1-метил-1H-пиразол-4-карбонил)-2-метил-4-фенил-1,2,4-триазин-3,5(2H,4H)-диона (соединение № II-50).

1,50 г (6,07 ммоль) 2-метил-3,5-диоксо-4-фенил-2,3,4,5-тетрагидро-1,2,4-триазин-6-карбоновой кислоты и 1,16 г (9,10 ммоль) оксалилхлорида растворяли в дихлорметане (30 мл). К смеси добавляли каплю N,N-диметилформамида и смесь перемешивали при комнатной температуре в течение 2 ч. Реакционный раствор концентрировали при пониженном давлении, получая при этом 2-метил-3,5-диоксо-4-фенил-2,3,4,5-тетрагидро-1,2,4-триазин-6-карбонилхлорид в виде бледно-желтого маслянистого вещества.

Затем к дихлорметану (30 мл) при охлаждении льдом добавляли 1,22 г (9,10 ммоль) гидрохлорида 1-метил-5-гидроксипиразола и 1,53 г (15,17 ммоль) триэтиламина. К смеси медленно по каплям добавляли раствор в дихлорметане (15 мл) 2-метил-3,5-диоксо-4-фенил-2,3,4,5-тетрагидро-1,2,4-триазин-6-карбонилхлорида и перемешивали в течение 30 мин. Реакционную смесь экстрагировали хлороформом и органический слой промывали водой, сушили над сульфатом магния и концентрировали при пониженном давлении. Полученные остатки растворяли в ацетонитриле (30 мл), добавляли 0,92 г (9,10 ммоль) триэтиламина и 0,05 г (0,61 ммоль) цианогидрина ацетона и смесь кипятили с обратным холодильником в течение 30 мин при нагревании. Реакционную смесь концентрировали при пониженном давлении, и затем остатки растворяли в воде и промывали этилацетатом. Водный слой подкисляли при помощи лимонной кислоты, экстрагировали хлороформом, сушили над сульфатом магния и концентрировали при пониженном давлении. Полученные кристаллы промывали метанолом, получая при этом 0,40 г требуемого соединения (выход 20%).

Точка плавления: 197-199°C.

Пример 3. Получение 6-(2-гидрокси-4-оксобицикло[3.2.1]окта-2-енилкарбонил]-2-метил-4-фенил-1,2,4-триазин-3,5(2H,4H)-диона (соединение № III-50).

1,00 г (4,04 ммоль) 2-метил-3,5-диоксо-4-фенил-2,3,4,5-тетрагидро-1,2,4-триазин-6-карбоновой кислоты и 1,03 г (8,09 ммоль) оксалилхлорида растворяли в дихлорметане (20 мл). К смеси добавляли каплю N,N-диметилформамида и смесь перемешивали при комнатной температуре в течение 2 ч. Реакционный раствор концентрировали при пониженном давлении, получая при этом 2-метил-3,5-диоксо-4-фенил-2,3,4,5-тетрагидро-1,2,4-триазин-6-карбонилхлорид в виде бледно-желтого маслянистого вещества.

Затем 0,83 г (6,07 ммоль) бицикло[3.2.1]октан-2,4-диона и 0,61 г (6,07 ммоль) триэтиламина растворяли в дихлорметане (20 мл) при охлаждении льдом. К раствору медленно по каплям добавляли раствор в дихлорметане (10 мл) 2-метил-3,5-диоксо-4-фенил-2,3,4,5-тетрагидро-1,2,4-триазин-6-карбонилхлорида, который получали предварительно. После перемешивания в течение 30 мин при охлаждении льдом реакционную смесь экстрагировали хлороформом и органический слой промывали водой, сушили над сульфатом магния и концентрировали при пониженном давлении. Полученные остатки растворяли в ацетонитриле (20 мл), добавляли 0,61 г (6,07 ммоль) триэтиламина и 0,03 г (0,4 ммоль) цианогидрина ацетона и смесь кипятили с обратным холодильником в течение 30 мин при нагревании. Реакционную смесь концентрировали при пониженном давлении, и затем остатки растворяли в воде и раствор промывали этилацетатом. Водный слой подкисляли при помощи лимонной кислоты, экстрагировали хлороформом, сушили над сульфатом магния и концентрировали при пониженном давлении. Полученные кристаллы промывали метанолом, получая при этом 0,70 г требуемого соединения (выход 47%).

Точка плавления: 163-165°C.

Пример 4. Получение 1-изопропил-4-(2-метил-3,5-диоксо-4-фенил-2,3,4,5-тетрагидро-1,2,4-триазин-6-илкарбонил)-1H-пиразол-5-илпропан-1-сульфоната (соединение № II-267).

0,85 г (2,60 ммоль) 6-(5-гидрокси-1-изопропил-1H-пиразол-4-илкарбонил)-2-метил-4-фенил-1,2,4-триазин-3,5(2H,4H)-диона растворяли в 20 мл дихлорметана. К раствору при комнатной температуре добавляли 0,27 г (2,60 ммоль) триэтиламина и 0,37 г (2,60 ммоль) 1-пропансульфонилхлорида и раствор перемешивали на протяжении ночи. Реакционную смесь концентрировали при пониженном давлении и остатки очищали колоночной хроматографией на силикагеле (гексан:этилацетат = 1:1), получая при этом 0,71 г требуемого соединения (выход 63%).

Точка плавления: 51-53°C.

Пример 5. Получение 2-метил-3,5-диоксо-4-(4-хлорфенил)-2,3,4,5-тетрагидро-1,2,4-триазин-6-карбоновой кислоты (соединение № V-53).

(1) Получение диэтил-2-(2-метилгидразо)малоната.

5,00 г (0,0287 моль) диэтилкетомалоната растворяли в 30 мл этанола. К раствору добавляли 1,45 г (0,0316 моль) метилгидразина и смесь перемешивали в течение 7 ч при 60°C с последующим дополнительным перемешиванием на протяжении ночи при комнатной температуре. Реакционную смесь концентрировали при пониженном давлении и экстрагировали этилацетатом. Органический слой промывали водой, сушили над сульфатом магния и концентрировали при пониженном давлении. Образовавшиеся остатки очищали колоночной хроматографией на силикагеле (гексан:этилацетат = 1:1), получая при этом 5,28 г требуемого соединения (выход 91%).

(2) Получение этилового эфира 4-(4-хлорфенил)-2-метил-3,5-диоксо-2,3,4,5-тетрагидро-1,2,4-триазин-6-карбоновой кислоты.

2,00 г (9,89 ммоль) диэтил-2-(2-метилгидразино)малоната и 1,50 г (9,89 ммоль) DBU растворяли в 50 мл тетрагидрофурана. К раствору по каплям медленно при комнатной температуре добавляли раствор в тетрагидрофуране (10 мл) 4-хлорфенилизоцианата (3,34 г, 21,7 ммоль) и смесь перемешивали на протяжении ночи. Реакционную смесь концентрировали при пониженном давлении, и остатки экстрагировали этилацетатом, промывали водой, сушили над сульфатом магния и концентрировали при пониженном давлении. Образовавшиеся остатки очищали колоночной хроматографией на силикагеле (гексан:этилацетат = 7:1), получая при этом 2,00 г требуемого соединения (выход 65%).

(3) Получение 2-метил-3,5-диоксо-4-(4-хлорфенил)-2,3,4,5-тетрагидро-1,2,4-триазин-6-карбоновой кислоты.

2,00 г (6,46 ммоль) этилового эфира 2-метил-4-(4-хлорфенил)-2,3,4,5-тетрагидро-1,2,4-триазин-6-карбоновой кислоты перемешивали при комнатной температуре в течение 2 дней в смешанном растворителе из уксусной кислоты (30 мл) и концентрированной хлористоводородной кислоты (30 мл). Реакционную смесь концентрировали при пониженном давлении, получая при этом 1,88 г требуемого соединения (выход количественный).

Точка плавления: 234-236°C.

Пример 6. Получение 2,4-диметил-3,5-диоксо-2,3,4,5-тетрагидро-1,2,4-триазин-6-карбоновой кислоты (соединение № V-1).

(1) Получение 2-метилсемикарбазида.

13 г (282,1 ммоль) метилгидразина растворяли в 60 мл тетрагидрофурана. К раствору медленно по каплям при 0°C добавляли 25 г (217 ммоль) триметилсилилизоцианата и дополнительно перемешивали в течение 1 часа. К реакционной смеси добавляли 40 мл метанола и смесь перемешивали в течение 5 ч при 40°C. Реакционную смесь концентрировали, получая при этом 18 г 2-метилсемикарбазида в виде бледно-желтого твердого вещества (выход 93%).

¹H-ЯМР (CDCl₃, TMC) δ (м.д.): 3,15 (3H, с), 3,80 (2H, ушир.), 5,61 (2H, ушир.).

(2) Получение этилового эфира 2-метил-3,5-диоксо-2,3,4,5-тетрагидро-1,2,4-триазин-6-карбоновой кислоты.

35,2 г (202 ммоль) диэтилкетомалоната и 18 г (202 ммоль) 2-метилсемикарбазида растворяли в 200 мл этанола и раствор затем кипятили с обратным холодильником при нагревании в течение 36 ч. Реакционный раствор концентрировали, получая при этом 31 г этилового эфира 2-метил-3,5-диоксо-2,3,4,5-тетрагидро-1,2,4-триазин-6-карбоновой кислоты в виде белого твердого вещества (выход 78%).

¹H-ЯМР (CDCl₃, TMC) δ (м.д.): 1,39 (3H, т, J=7,1 Гц), 3,72 (3H, с), 4,42 (2H, кв., J=7,1 Гц), 9,38 (1H, ушир.).

(3) Получение этилового эфира 2,4-диметил-3,5-диоксо-2,3,4,5-тетрагидро-1,2,4-триазин-6-карбоновой кислоты.

2,0 г (10,0 ммоль) этилового эфира 2-метил-3,5-диоксо-2,3,4,5-тетрагидро-1,2,4-триазин-6-карбоновой кислоты, 1,9 г (13,5 ммоль) карбоната калия и 1,8 г (12,5 ммоль) метилиодида добавляли к 20 мл N,N-диметилформамида и смесь перемешивали в течение 2 ч при 60°C. После завершения реакции к реакционному раствору добавляли воду и затем экстрагировали этилацетатом. Полученный органический слой сушили над безводным сульфатом магния и концентрировали, получая при этом 1,8 г этилового эфира 2,4-диметил-3,5-диоксо-2,3,4,5-тетрагидро-1,2,4-триазин-6-карбоновой кислоты (выход 86%).

¹H ЯМР (CDCl₃, TMC) δ (м.д.): 1,40 (3H, т, J=7,1 Гц), 3,38 (3H, с), 3,74 (3H, с), 4,42 (2H, кв., J=7,1 Гц).

(4) Получение 2,4-диметил-3,5-диоксо-2,3,4,5-тетрагидро-1,2,4-триазин-6-карбоновой кислоты.

1,8 г (8,41 ммоль) этилового эфира 2,4-диметил-3,5-диоксо-2,3,4,5-тетрагидро-1,2,4-триазин-6-карбоновой кислоты перемешивали при комнатной температуре в течение 24 ч в смешанном растворителе из уксусной кислоты (30 мл) и концентрированной хлористоводородной кислоты (30 мл). Реакционный раствор концентрировали, получая при этом 1,40 г 2,4-диметил-3,5-диоксо-2,3,4,5-тетрагидро-1,2,4-триазин-6-карбоновую кислоту в виде белого твердого вещества (выход 90%).

Точка плавления: 220-223°C.

¹H-ЯМР (CDCl₃, TMC) δ (м.д.): 3,48 (3H, с), 3,88 (3H, с).

Пример 7. Получение 2-этил-3,5-диоксо-4-фенил-2,3,4,5-тетрагидро-1,2,4-триазин-6-карбоновой кислоты (соединение № V-259).

(1) Получение этилового эфира 3,5-диоксо-4-фенил-2,3,4,5-тетрагидро-1,2,4-триазин-6-карбоновой кислоты.

9,0 г (0,0517 моль) диэтилкетомалоната и 7,81 г (0,0517 моль) 2-фенилсемикарбазида перемешивали в 50 мл ксилола в течение 1 ч при 100°C. Реакционную смесь кипятили с обратным холодильником при нагревании и реакцию завершали добавлением небольшими порциями метоксида натрия (8,37 г, 0,155 моль). После охлаждения до комнатной температуры реакционную смесь нейтрализовали 1 н водным раствором хлористоводородной кислоты, экстрагировали этилацетатом и сушили над сульфатом магния. Реакционную смесь концентрировали при пониженном давлении и остатки выделяли и очищали колоночной хроматографией на силикагеле (гексан:этилацетат = 2:1), получая при этом 6,18 г требуемого соединения (выход 46%).

(2) Получение этилового эфира 2-этил-3,5-диоксо-4-фенил-2,3,4,5-тетрагидро-1,2,4-триазин-6-карбоновой кислоты.

1,50 г (5,74 ммоль) этилового эфира 3,5-диоксо-4-фенил-2,3,4,5-тетрагидро-1,2,4-триазин-6-карбоновой кислоты растворяли в 30 мл N,N-диметилформамида, добавляли к раствору 60% гидрид натрия (0,23 г, 5,74 ммоль) при охлаждении льдом и дополнительно перемешивали в течение 30 мин. К смеси добавляли этилиодид (0,90 г, 5,74 ммоль) и смесь перемешивали. После достижения комнатной температуры добавляли водный раствор хлорида аммония для завершения реакции. Образовавшуюся смесь экстрагировали диэтиловым эфиром, сушили над хлоридом магния и концентрировали при пониженном давлении. Остатки очищали колоночной хроматографией на силикагеле, получая при этом 1,33 г требуемого соединения (выход 80%).

(3) Получение 2-этил-3,5-диоксо-4-фенил-2,3,4,5-тетрагидро-1,2,4-триазин-6-карбоновой кислоты.

1,30 г (4,49 ммоль) этилового эфира 2-этил-3,5-диоксо-4-фенил-2,3,4,5-тетрагидро-1,2,4-триазин-6-карбоновой кислоты растворяли в 30 мл этанола, к раствору добавляли 25% водный раствор гидроксида натрия (1,29 г, 8,09 ммоль) и перемешивали на протяжении ночи. После разбавления добавлением воды водный слой промывали диэтиловым эфиром. Водный слой подкисляли добавлением 6 н водного раствора хлористоводородной кислоты и затем экстрагировали этилацетатом. После сушки над сульфатом магния и концентрирования при пониженном давлении получали 1,10 г требуемого соединения (выход 94%).

Пример 8. Получение 2,4-диметил-5-оксо-3-тиоксо-2,3,4,5-тетрагидро-1,2,4-триазин-6-карбоновой кислоты (соединение № V-265).

(1) Получение этилового эфира 2,4-диметил-5-оксо-3-тиоксо-2,3,4,5-тетрагидро-1,2,4-триазин-6-карбоновой кислоты.

2,00 г (9,89 ммоль) диэтил-2-(2-метилгидразоно)малоната и 1,50 г (9,89 ммоль) 1,8-диазабицикло[5.4.0]ундец-7-ена (DBU) растворяли в 50 мл тетрагидрофурана. К раствору медленно по каплям добавляли раствор в тетрагидрофуране (10 мл) метилизотиоцианата (1,58 г, 21,7 ммоль) и смесь перемешивали на протяжении ночи. Реакционную смесь концентрировали при пониженном давлении, экстрагировали этилацетатом, промывали водой и сушили над сульфатом магния. Полученные после концентрирования при пониженном давлении остатки очищали колоночной хроматографией на силикагеле (гексан:этилацетат = 3:1), получая при этом 2,20 г требуемого соединения (выход 97%).

(2) Получение 2,4-диметил-5-оксо-3-тиоксо-2,3,4,5-тетрагидро-1,2,4-триазин-6-карбоновой кислоты.

2,30 г (0,01 моль) этилового эфира 2,4-диметил-5-оксо-3-тиоксо-2,3,4,5-тетрагидро-1,2,4-триазин-6-карбоновой кислоты перемешивали на протяжении ночи при комнатной температуре в смешанном растворителе из уксусной кислоты (30 мл) и концентрированной хлористоводородной кислоты (30 мл). Реакционную смесь концентрировали при пониженном давлении, получая при этом 2,01 г требуемого соединения (выход количественный).

Пример 9. Получение 2-метил-3,5-диоксо-4-(2-цианофенил)-2,3,4,5-тетрагидро-1,2,4-триазин-6-карбоновой кислоты (соединение № V-72).

(1) Получение этилового эфира 2-метил-3,5-диоксо-4-(2-цианофенил)-2,3,4,5-тетрагидро-1,2,4-триазин-6-карбоновой кислоты.

2,0 г (9,89 ммоль) диэтил-2-(2-метилгидразоно)малоната и 3,3 г (21,8 ммоль) 1,8-диазабицикло[5.4.0]ундец-7-ена (DBU) растворяли в 20 мл тетрагидрофурана. К раствору при комнатной температуре добавляли 4,9 г (20,8 ммоль) фенил-2-цианофенилкарбамата и смесь перемешивали в течение 1 ч при такой же температуре. После этого смесь кипятили с обратным холодильником при нагревании в течение 3 ч. Реакционный раствор концентрировали, и остатки экстрагировали этилацетатом. Полученный органический слой последовательно промывали водой и водным раствором лимонной кислотой, сушили над безводным сульфатом магния и концентрировали при пониженном давлении. Остатки очищали колоночной хроматографией на силикагеле (гексан:этилацетат = 2:1), получая при этом 2,3 г этилового эфира 2-метил-3,5-диоксо-4-(2-цианофенил)-2,3,4,5-тетрагидро-1,2,4-триазин-6-карбоновой кислоты (выход 78%).

^1H -ЯМР (CDCl_3 , TMC) δ (ppm): 1,40 (3H, т, $J=7,1$ Гц), 3,81 (3H, с), 4,45 (2H, кв., $J=7,1$ Гц), 7,39 (1H, д, $J=8,0$ Гц), 7,60-7,64 (1H, м), 7,75-7,80 (1H, м), 7,85 (1H, д, $J=7,6$ Гц).

(2) Получение 2-метил-3,5-диоксо-4-(2-цианофенил)-2,3,4,5-тетрагидро-1,2,4-триазин-6-карбоновой кислоты.

2,3 г (7,65 ммоль) этилового эфира 2-метил-3,5-диоксо-4-(2-цианофенил)-2,3,4,5-тетрагидро-1,2,4-триазин-6-карбоновой кислоты перемешивали в течение 24 ч при комнатной температуре в смешанном растворителе из уксусной кислоты (30 мл) и концентрированной хлористоводородной кислоты (30 мл). Реакционный раствор концентрировали при пониженном давлении, получая при этом 1,8 г 2-метил-3,5-диоксо-4-(2-цианофенил)-2,3,4,5-тетрагидро-1,2,4-триазин-6-карбоновой кислоты в виде белого твердого вещества (выход 90%).

Точка плавления: 213-215°C.

^1H -ЯМР (DMCO-d_6 , TMC) δ (м.д.): 3,65 (3H, с), 7,67 (1H, д, $J=8,0$ Гц), 7,70-7,75 (1H, м), 7,90-7,96 (1H, м), 8,09 (1H, д, $J=7,4$ Гц), 14,02 (1H, ушир.).

Пример 10. Получение 2-метил-3,5-диоксо-4-фенил-2,3,4,5-тетрагидро-1,2,4-триазин-6-карбоновой кислоты (соединение № V-50).

(1) Получение этилового эфира 2-метил-3,5-диоксо-4-фенил-2,3,4,5-тетрагидро-1,2,4-триазин-6-карбоновой кислоты.

2,0 г (9,89 ммоль) диэтил-2-оксомалоната и 0,04 г (0,2 ммоль) п-толуолсульфоновой кислоты растворяли в 50 мл толуола. К раствору при комнатной температуре добавляли 2,5 г (15,2 ммоль) 1-метил-N-фенилгидразинкарбоксиамида и затем раствор перемешивали в течение 2 ч с кипячением с обратным холодильником при нагревании. Реакционную смесь охлаждали до комнатной температуры и добавляли к ней 0,08 г (0,5 ммоль) 1,8-диазабицикло[5.4.0]ундец-7-ена (DBU) с последующим перемешиванием при комнатной температуре в течение 2 ч. Реакционный раствор промывали водой и сушили над сульфатом магния. Растворитель отгоняли, получая при этом этиловый эфир 2-метил-3,5-диоксо-4-фенил-2,3,4,5-тетрагидро-1,2,4-триазин-6-карбоновой кислоты.

(2) Получение 2-метил-3,5-диоксо-4-фенил-2,3,4,5-тетрагидро-1,2,4-триазин-6-карбоновой кислоты.

Этиловый эфир 2-метил-3,5-диоксо-4-фенил-2,3,4,5-тетрагидро-1,2,4-триазин-6-карбоновой кислоты, полученной выше в (1), перемешивали в течение 24 ч при комнатной температуре в смешанном растворителе из уксусной кислоты (30 мл) и концентрированной хлористоводородной кислоты (30 мл). Реакционную смесь концентрировали при пониженном давлении, экстрагировали насыщенным водным раствором гидрокарбоната натрия, промывали этилацетатом и затем pH регулировали до слабокислотной реакции при помощи разбавленной хлористоводородной кислоты. После этого смесь экстрагировали этилацетатом и сушили над сульфатом магния и растворитель отгоняли, получая при этом 2,6 г 2-метил-3,5-диоксо-4-фенил-2,3,4,5-тетрагидро-1,2,4-триазин-6-карбоновой кислоты в виде белого твердого вещества (выход после двух стадий 70%).

Точка плавления: 195-198°C.

^1H -ЯМР (DMCO-d_6 , TMC) δ (м.д.): 3,59 (3H, с), 7,29-7,31 (2H, м), 7,43-7,54 (3H, м), 13,64 (1H, ушир.).

Величины физических свойств (точку плавления или показатель преломления) соединения изобретения, представленного формулой [1], которое было синтезировано согласно указанным выше примерам, показаны в табл. 68-70, включающих в себя указанные выше примеры. В контексте знак * означает показатель преломления.

Таблица 68

№ соединения	Точка плавления (°С) или показатель преломления (n_D^{20})
I-2	87-89
I-3	1.5530*
I-5	1.5630*
I-9	1.5380*
I-10	124-125
I-11	97-98
I-14	126-129
I-16	116-118
I-19	132-134
I-27	1.5460*
I-41	1.5495*
I-43	98-101
I-47	155-157
I-50	182-185
I-51	184-185
I-52	187-190
I-53	182-183
I-54	174-176
I-55	209-212
I-56	181-183
I-57	135-136
I-58	198-199
I-59	190-193
I-60	190-191
I-61	186-187
I-62	137-139
I-63	166-169
I-64	89-92
I-65	184-187
I-66	151-152
I-67	174-177
I-68	208-210
I-71	130-131
I-72	166-169
I-73	181-184
I-74	108-111
I-75	173-176
I-76	242-245
I-77	192-194
I-78	149-151
I-79	161-163
I-80	98-101
I-81	158-161
I-82	212-215

035195

I-83	191-194
I-84	124-127
I-85	235-238
I-86	199-202
I-87	197-198
I-88	160-163
I-89	190-193
I-90	164-166
I-91	89-91
I-92	245-247
I-93	168-169
I-94	155-157
I-96	151-153
I-98	155-157
I-99	178-181
I-105	186-188
I-106	228-231
I-107	212-215
I-108	167-169
I-109	166-168
I-110	151-152
I-111	196-199
I-115	144-147
I-116	176-179
I-117	140-143
I-118	140-143
I-119	191-194
I-120	191-194
I-125	148-151
I-126	126-129
I-127	237-240
I-128	217-220
I-129	155-158
I-131	204-205
I-134	215-217
I-135	152-154
I-136	156-157
I-137	154-157
I-138	123-126
I-149	175-178
I-155	196-199
I-167	183-185
I-169	178-180
I-170	213-215

Таблица 69

№ соединения	Точка плавления (°С) или показатель преломления (n_D^{20})
I-179	215-218
I-182	159-161
I-183	138-141
I-184	100-103
I-185	108-111
I-187	180-183
I-189	190-193
I-198	135-137
I-199	169-170
I-202	161-162
I-203	188-191
I-204	201-204
I-205	87-90
I-259	150-153
I-260	152-154
I-261	190-193
I-262	103-106
I-263	174-176
I-265	164-167
I-268	201-204
I-269	112-115
I-270	172-175
I-271	251-254
I-272	204-207
I-274	101-103
I-275	89-92
I-276	167-170
I-277	96-99
I-278	98-101
I-279	218-220
I-280	168-171
I-281	146-147
I-282	148-151
I-283	172-175
I-284	160-162
I-285	149-152
I-286	88-91
I-287	155-158
I-288	94-97
I-289	215-218
I-290	138-141
I-291	194-197
I-292	167-169

I-293	158-160
I-294	113-115
I-295	1.5360*
I-296	1.5300*
I-297	89-92
I-298	148-150
I-299	212-215
I-300	203-205
I-301	274-277
I-302	222-224
I-303	62-65
I-304	148-151
I-307	58-61
I-328	58-61
I-463	131-134
I-464	168-170
I-465	211-213
I-466	89-92
I-467	211-214
I-468	128-130
I-469	172-174
I-470	147-148
I-471	1.5620*
I-472	162-164
I-473	143-146
I-474	70-73
I-475	83-86
I-476	191-193
I-477	149-151
I-478	1.5270*
I-479	1.5450*
I-480	179-181
II-50	197-199
II-267	51-53
III-50	163-165
III-62	158-159
VI-1	151-154
VI-5	145-148
VI-6	145-146
VI-7	163-166
VI-65	93-96
VI-97	158-160

Номер соединения и данные ^1H -ЯМР (стандарт; TMC, величина δ (м.д.)) указаны ниже. Данные без названия растворителя измерены с применением CDCl_3 .

Соединение № I-1.

2,04-2,10 (2H, м), 2,45-2,49 (2H, м), 2,76-2,80 (2H, м), 3,56 (3H, с), 3,65 (3H, с), 16,05 (1H, ушир.).

Соединение № I-3.

0,92 (3H, т, J=6,00 Гц), 1,69 (2H, кв., J=6, 00 Гц), 2,03-2,11 (2H, м), 2,45-2,49 (2H, м), 2,75-2,79 (2H, м), 3,64 (3H, с), 3,89 (2H, т, J=6,00 Гц), 16,05 (1H, ушир.).

Соединение № I-4.

1,49 (6H, d, J=6,00 Гц), 2,03-2,11 (2H, м), 2,44-2,49 (2H, м), 2,74-2,79 (2H, м), 3,61 (3H, с), 5,07 (1H, септ. J=6,00 Гц), 16,08 (1H, ушир.).

Соединение № I-5.

0,95 (3H, т, J=7,2 Гц), 1,32-1,43 (2H, м), 1,59-1,68 (2H, м), 2,03-2,10 (2H, м), 2,45-2,49 (2H, м), 2,75-2,79 (2H, м), 3,64 (3H, с), 3,92 (2H, т, J=6,9 Гц), 16,05 (1H, ушир.).

Соединение № I-9.

0,88 (3H, т, J=6,6 Гц), 1,20-1,40 (6H, м), 1,58-1,64 (2H, м), 2,03-2,12 (2H, м), 2,44-2,48 (2H, м), 2,75-2,79 (2H, м), 3,64 (3H, с), 3,89-3,94 (2H, м), 16,04 (1H, ушир.).

Соединение № I-27.

1,65 (3H, т, J=3,00 Гц), 2,03-2,09 (2H, м), 2,31-2,36 (2H, м), 2,44-2,49 (2H, м), 2,74-2,79 (2H, м), 3,64 (3H, с), 4,01 (2H, т, J=6,00), 16,00 (1H, ушир.).

Соединение № I-41.

1,89-1,97 (2H, м), 2,04-2,11 (2H, м), 2,44-2,48 (2H, м), 3,31 (3H, с), 3,44 (2H, т, J=6,0 Гц), 3,64 (3H, с), 4,03 (2H, т, J=7,0 Гц), 16,04 (1H, ушир.).

Соединение № I-75.

2,05-2,11 (2H, м), 2,45-2,49 (2H, м), 2,75-2,80 (2H, м), 3,69 (3H, с), 7,05-7,09 (1H, м), 7,14-7,21 (1H, м), 7,24-7,33 (1H, м), 15,99 (1H, с).

Соединение № I-76.

2,04-2,09 (2H, м), 2,46-2,50 (2H, м), 2,75-2,80 (2H, м), 3,69 (3H, с), 6,88-6,96 (3H, м), 15,97 (1H, с).

Соединение № I-77.

2,03-2,09 (2H, м), 2,45-2,49 (2H, м), 2,75-2,78 (2H, м), 3,71 (3H,с), 7,11-7,14 (1H, м), 7,18-7,33 (2H, м), 15,95 (1H, с).

Соединение № I-79.

2,04-2,10 (2H, м), 2,45-2,50 (2H, м), 2,75-2,79 (2H, м), 3,70 (3H, с), 7,10-7,24 (3H, м), 15,96 (1H, с).

Соединение № I-80.

2,01-2,08 (2H, м), 2,46-2,49 (2H, м), 2,75-2,78 (2H, м), 3,71 (3H, с), 7,05-7,08 (2H, м), 7,40-7,48 (1H, м), 15,93 (1H, с).

Соединение № I-81.

2,05-2,08 (2H, м), 2,45-2,50 (2H, м), 2,75-2,80 (2H, м), 3,69 (3H, с), 7,14-7,19 (1H, м), 7,43 (1H, д, J=2,5), 7,57 (1H, д, J=8,5), 15,97 (1H, с).

Соединение № I-2 95.

0,85-0,89 (3H, м), 1,26-1,32 (10H, м), 1,57-1,65 (2H, м), 2,05-2,12 (2H, м), 2,44-2,49 (2H, м), 2,75-2,79 (2H, м), 3,64 (3H, с), 3,88-3,93 (2H, м), 16,04 (1H, ушир.).

Соединение № I-296.

0,85-0,90 (3H, м), 1,25-1,36 (14H, м), 1,59-1,69 (2H, м), 2,05-2,09 (2H, м), 2,44-2,49 (2H, м), 2,74-2,79 (2H, м), 3,64 (3H, с), 3,88-3,93 (2H, м), 16,04 (1H, ушир.).

Соединение № I-306.

0,96 (3H, т, J=7,15), 1,39-1,46 (2H, м), 1,69-1,71 (2H, м), 2,05-2,09 (2H, м), 2,44-2,48 (2H, м), 4,01 (2H, т, J=7,69), 7,32-7,36 (2H, м), 7,56-7,59 (1H, м), 7,83-7,88 (1H, м), 8,61-8,63 (1H, м), 16,05 (1H, ушир.).

Соединение № I-308.

0,88-0,92 (3H, м), 0,35-0,37 (4H, м), 0,79-1,82 (2H, м), 2,03-2,07 (2H, м), 2,44-2,49 (2H, м), 2,73-2,78 (2H, м), 4,01 (2H, т, J=7,69), 7,28-7,30 (2H, м), 7,43-7,53 (3H, м), 16,06 (1H, ушир.).

Соединение № I-339.

1,84-2,11 (4H, м), 2,44-2,48 (2H, м), 2,74-2,78 (2H, м), 3,64 (3H, с), 3,69-3,92 (3H, м), 4,07-4,34 (2H, м), 16,04 (1H, ушир.).

Соединение № I-462.

1,30 (3H, т, J=7,66), 2,03-2,07 (2H, м), 2,45-2,49 (2H, м), 2,69-2,77 (4H, м), 3,68 (3H, с), 7,28-7,30 (1H, м), 7,77-7,73 (1H, м), 8,51 (1H, с), 16,03 (1H, ушир.).

Величины физических свойств промежуточных продуктов получения 13а и 3б приводятся в табл. 70 и табл. 71.

Таблица 70

№ соединения	Точка плавления (°С)
IV-116	111-114
IV-117	100-102
IV-118	118-121
IV-136	131-133
IV-137	102-105
IV-138	122-125
IV-182	107-108
IV-185	50-53
IV-197	122-125
IV-259	84-86
IV-260	107-109
IV-261	132-135
IV-275	102-103
IV-276	46-49
IV-278	171-172
IV-280	137-140
IV-284	136-137
IV-285	112-114
IV-287	140-142
IV-288	101-102
IV-290	124-127
IV-291	137-138

Таблица 71

№ соединения	Точка плавления (°C)
V-1	220-223
V-2	165-168
V-3	113-115
V-4	122-125
V-5	98-100
V-9	99-102
V-10	127-129
V-11	82-84
V-14	142-144
V-16	155-158
V-27	114-117
V-41	90-91
V-43	145-146
V-47	144-147
V-50	195-198
V-51	154-157
V-52	118-120
V-53	234-236
V-54	95-98
V-55	95-98
V-56	212-215
V-57	150-152
V-58	196-199
V-60	145-146
V-61	173-174
V-66	164-166
V-67	200-203
V-68	206-209
V-72	213-215
V-73	221-224
V-87	162-165
V-88	227-230
V-89	184-186
V-90	156-159
V-91	179-181
V-92	207-210
V-93	220-223
V-99	166-169
V-105	169-171
V-106	231-234
V-107	166-169
V-108	153-156
V-109	197-198
V-110	194-197
V-111	187-190
V-115	188-191
V-119	205-208
V-125	173-175
V-127	135-138
V-128	186-188
V-129	198-201

V-131	201-204
V-135	224-227
V-149	216-218
V-155	229-231
V-167	211-212
V-169	199-202
V-170	177-180
V-179	237-240
V-184	158-161
V-189	200-201
V-202	200-203
V-203	164-167
V-204	199-202
V-268	201-204
V-269	155-157
V-270	184-187
V-271	208-211
V-272	100-102
V-273	202-205
V-275	166-169
V-282	193-196
V-283	186-189
V-291	175-178
V-294	204-207
V-295	105-107
V-296	106-108
V-297	176-179
V-298	145-146
V-299	241-244
V-300	245-248
V-301	259-261
V-302	211-212
V-303	152-155
V-304	140-143
V-305	166-167
V-328	143-146
V-358	240-243
V-359	91-94
V-360	240-242
V-361	155-158
V-362	148-151
V-363	189-192
V-364	213-216
V-365	75-78
V-366	218-221
V-367	192-195
V-368	153-156
V-369	111-113
V-370	100-103
V-371	80-83

Номер соединения и данные ^1H -ЯМР (стандарт; TMS, величина δ (м.д.)) для промежуточных продуктов получения указаны ниже.

Данные без названия растворителя измерены с применением CDCl_3 .

Соединение № IV-19.

1,19-1,41 (3H, м), 1,39 (3H, т, J=5,3 Гц), 1,56-1,66 (3H, м), 1,83-1,87 (2H, м), 2,37 (2H, дкв., J=3,3 Гц, 12,1 Гц), 3,68 (3H, с), 4,41 (2H, кв., J=7,1 Гц), 4,73 (1H, тт, J=3,3 Гц, 12,1 Гц).

Соединение № IV-50.

1,39 (3H, т, J=7,1 Гц), 3,71 (3H, с), 4,43 (2H, кв., J=7,1 Гц), 7,24-7,26 (2H, м), 7,49-7,57 (3H, м).

Соединение № IV-53.

1,39 (3H, т, J=5,3 Гц), 3,77 (3H, с), 4,43 (2H, кв., J=5,3 Гц), 7,18 (2H, д, J=6,4 Гц), 7,49 (2H, д, J=6,4 Гц).

Соединение № IV-56.

1,39 (3H, т, J=7,1 Гц), 3,77 (3H, с), 4,43 (2H, кв., J=7,1 Гц), 7,20-7,22 (4H, м).

Соединение № IV-59.

1,39 (3H, т, J=7,1 Гц), 2,41 (3H, с), 3,77 (3H, с), 4,42 (2H, кв., J=7,1 Гц), 7,10 (2H, д, J=8,3 Гц), 7,31 (2H, д, J=8,3 Гц).

Соединение № IV-62.

1,39 (3H, т, J=7,1 Гц), 3,76 (3H, с), 3,84 (3H, с), 4,43 (2H, кв., J=7,1 Гц), 7,01 (2H, д, J=9,0 Гц), 7,14 (2H, д, J=9,0 Гц).

Соединение № IV-63.

1,39 (3Н, т, J=7,1 Гц), 3,78 (3Н, с), 4,43 (2Н, кв., J=7,1 Гц), 7,30 (1Н, д, J=7,7 Гц), 7,67 (1Н, т, J=7,7), 7,74 (1Н, дт, J=1,1 Гц, 7,7 Гц), 7,84 (1Н, дд, J=1,1 Гц, 7,7 Гц).

Соединение № IV-64.

1,40 (3Н, т, J=7,1 Гц), 3,78 (3Н, с), 4,44 (2Н, кв., J=7,1 Гц), 7,44 (1Н, д, J=8,0 Гц), 7,54 (1Н, с), 7,66 (1Н, т, J=8,0 Гц), 7,75 (1Н, д, J=8,0 Гц).

Соединение № IV-65.

1,40 (3Н, т, J=5,3 Гц), 3,79 (3Н, с), 4,44 (2Н, кв., J=5,3 Гц), 7,39 (2Н, д, J=6,2 Гц), 7,79 (2Н, д, J=6,2 Гц).

Соединение № IV-71.

1,39 (3Н, т, J=7,1 Гц), 3,78 (3Н, с), 4,43 (2Н, кв., J=7,1 Гц), 7,28 (2Н, д, J=8,5 Гц), 7,36 (2Н, д, J=8,5 Гц).

Соединение № IV-74.

1,39 (3Н, т, J=7,1 Гц), 3,78 (3Н, с), 4,44 (2Н, кв., J=7,1 Гц), 7,39 (2Н, дд, J=1,9 Гц, 6,6 Гц), 7,82 (2Н, дд, J=1,9 Гц, 6,6 Гц).

Соединение № IV-78.

1,40 (3Н, т, J=7,1 Гц), 3,79 (3Н, с), 4,43 (2Н, кв., J=7,1 Гц), 6,99-7,05 (2Н, м), 7,22-7,28 (1Н, м).

Соединение № IV-93.

1,39 (3Н, т, J=7,1 Гц), 3,77 (3Н, с), 3,78 (6Н, с), 4,43 (2Н, кв., J=7,1 Гц), 6,35 (2Н, д, J=2,2 Гц), 6,55 (1Н, т, J=2,2 Гц).

Соединение № IV-96.

1,39 (3Н, т, J=7,1 Гц), 3,76 (6Н, с), 3,83 (3Н, с), 4,42 (2Н, кв., J=7,1 Гц), 6,55-6,59 (2Н, м), 7,05 (1Н, д, J=9,1 Гц).

Соединение № IV-134.

1,40 (3Н, т, J=5,3 Гц), 3,77 (3Н, с), 3,79 (3Н, с), 4,43 (2Н, кв., J=5,3 Гц), 6,97 (1Н, д, J=6,8 Гц), 7,17 (1Н, д, J=2,0 Гц), 7,41 (1Н, дд, J=2,0 Гц, 6,8 Гц).

Соединение № IV-179.

1,39 (3Н, т, J=5,3 Гц), 3,77 (3Н, с), 4,43 (2Н, кв., J=5,3 Гц), 7,32 (1Н, д, J=5,7 Гц), 7,46 (1Н, дд, J=5,7 Гц, 3,7 Гц), 7,92 (1Н, дт, J=1,1 Гц, 5,7 Гц), 8,68 (1Н, дт, J=3,7 Гц, 1,1 Гц).

Соединение № IV-198.

1,40 (3Н, т, J=5,3 Гц), 3,78 (3Н, с), 4,43 (2Н, кв., J=5,3 Гц), 7,07-7,12 (2Н, м), 7,42 (1Н, дд, J=1,1 Гц, 4,0 Гц).

Соединение № IV-259.

1,39 (3Н, т, J=7,1 Гц), 1,43 (3Н, т, J=7,1 Гц), 4,17 (2Н, кв., J=7,1 Гц), 4,43 (2Н, кв., J=7,1 Гц), 7,21-7,26 (2Н, м), 7,44-7,55 (3Н, м).

Соединение № IV-260.

1,39 (3Н, т, J=7,1 Гц), 1,43 (6Н, д, J=6,8 Гц), 4,42 (2Н, кв., J=7,1 Гц), 5,01 (1Н, п, J=6,8 Гц), 7,22-7,26 (2Н, м), 7,46-7,55 (3Н, м).

Соединение № IV-261.

1,40 (3Н, т, J=7,1 Гц), 4,46 (2Н, кв., J=7,1 Гц), 7,23-7,26 (2Н, м), 7,47 (1Н, т, J=57,8 Гц), 7,51-7,66 (3Н, м).

Соединение № IV-262.

1,39 (3Н, т, J=7,1 Гц), 4,44 (2Н, кв., J=7,1 Гц), 7,26-7,60 (10Н, м).

Соединение № IV-265.

1,40 (3Н, т, J=7,1 Гц), 3,71 (3Н, с), 4,05 (3Н, с), 4,44 (2Н, кв., J=7,1 Гц).

Соединение № IV-286.

1,19-1,17 (6Н, дд, J=7,0 Гц, J=2,2 Гц), 1,41-1,37 (3Н, т, J=7,0 Гц), 2,65-2,58 (1Н, септ., J=7,0 Гц), 3,78 (3Н, с), 4,46-4,39 (2Н, кв., J=7,0 Гц), 7,05-7,03 (1Н, д, J=8,0 Гц), 7,33-7,29 (1Н, м), 7,47-7,46 (2Н, д, J=4,0 Гц).

Соединение № V-19: (растворитель для измерения: ДМСО-d₆).

1,09-1,34 (3Н, м), 1,59-1,64 (2Н, м), 1,76-1,80 (2Н, м), 2,22 (2Н, дкв., J=3,3 Гц, 12,3 Гц), 3,51 (3Н, с), 4,54 (1Н, тт, J=3,3 Гц, 12,3 Гц), 13,53 (1Н, ушир. с).

Соединение № V-50: (растворитель для измерения: ДМСО-d₆).

3,59 (3Н, с), 7,29-7,31 (2Н, м), 7,43-7,54 (3Н, м), 13,64 (1Н, ушир. с).

Соединение № V-53: (растворитель для измерения: ДМСО-d₆).

3,59 (3Н, с), 7,35 (2Н, дд, J=1,6 Гц, 5,0 Гц), 7,59 (2Н, дд, J=1,6 Гц, 5,0 Гц), 13,66 (1Н, ушир. с).

Соединение № V-56: (растворитель для измерения: ДМСО-d₆).

3,59 (3Н, с), 7,34-7,37 (4Н, м), 13,65 (1Н, ушир. с).

Соединение № V-59: (растворитель для измерения: ДМСО-d₆).

2,36 (3Н, с), 3,58 (3Н, с), 7,17 (2Н, д, J=8,3 Гц), 7,30 (2Н, д, J=8,3 Гц), 13,62 (1Н, ушир. с).

Соединение № V-62: (растворитель для измерения: ДМСО-d₆).

3,39 (3Н, с), 3,74 (3Н, с), 6,93 (2Н, д, J=9,0), 7,39 (2Н, д, J=9,0 Гц), 9,54 (1Н, ушир. с).

- Соединение № V-63: (растворитель для измерения: ДМСО-d₆).
3,62 (3Н, с), 7,64 (1Н, д, J=7,7 Гц), 7,75 (1Н, т, J=7,68 Гц), 7,87-7,94 (2Н, м), 13,90 (1Н, ушир. с).
- Соединение № V-64: (растворитель для измерения: ДМСО-d₆).
3,41 (3Н, с), 7,46 (1Н, д, J=6,0 Гц), 7,60 (1Н, т, J=6,0 Гц), 7,82 (1Н, д, J=6,0 Гц), 7,97 (1Н, с), 9,90 (1Н, ушир. с).
- Соединение № V-65: (растворитель для измерения: ДМСО-d₆).
3,60 (3Н, с), 7,58 (2Н, д, J=8,3 Гц), 7,92 (2Н, д, J=8,3 Гц), 13,69 (1Н, ушир. с).
- Соединение № V-71: (растворитель для измерения: ДМСО-d₆).
3,59 (3Н, с), 7,47 (2Н, дт, J=9,3 Гц, 2,2 Гц), 7,54 (2Н, д, J=9,3 Гц), 13,67 (1Н, ушир. с).
- Соединение № V-75.
3,92 (3Н, с), 7,03-7,06 (1Н, м), 7,13-7,18 (1Н, м), 7,35-7,41 (1Н, м).
- Соединение № V-76.
3,92 (3Н, с), 7,85-7,87 (2Н, м), 7,00-7,12 (1Н, м).
- Соединение № V-77.
3,94 (3Н, с), 7,07-7,11 (1Н, м), 7,29-7,31 (1Н, м), 7,38-7,42 (1Н, м).
- Соединение № V-78: (растворитель для измерения: ДМСО-d₆).
3,61 (3Н, с), 7,25-7,31 (1Н, м), 7,49-7,58 (2Н, м), 13,79 (1Н, ушир. с).
- Соединение № V-79.
3,94 (3Н, с), 7,05-7,07 (1Н, м), 7,27-7,32 (2Н, м).
- Соединение № V-80.
3,94 (3Н, с), 7,12-7,18 (2Н, м), 7,52-7,61 (1Н, м).
- Соединение № V-81: (растворитель для измерения: ДМСО-d₆).
3,60 (3Н, с), 7,37 (1Н, д, J=8,5 Гц), 7,69 (1Н, с), 7,82 (1Н, д, J=7,7 Гц).
- Соединение № V-82.
3,92 (3Н, с), 7,20 (2Н, с), 7,56 (1Н, с).
- Соединение № V-83.
3,93 (3Н, с), 7,25 (1Н, д, J=10,4), 7,44 (1Н, т, J=8,0), 7,68 (1Н, д, J=11,7).
- Соединение № V-84.
3,93 (3Н, с), 7,21 (1Н, д, J=15,6), 7,45-7,48 (1Н, м), 7,68 (1Н, д, J=2,4 Гц).
- Соединение № V-85.
3,93 (3Н, с), 7,33 (1Н, д, J=5,7), 7,49-7,58 (2Н, м).
- Соединение № V-86.
3,95 (3Н, с), 7,45-7,56 (2Н, м).
- Соединение № V-93: (растворитель для измерения: ДМСО-d₆).
3,58 (3Н, с), 3,74 (6Н, с), 7,52 (2Н, д, J=2,2 Гц), 6,59 (1Н, т, J=2,2 Гц), 13,63 (1Н, ушир. с).
- Соединение № V-96: (растворитель для измерения: ДМСО-d₆).
3,59 (3Н, с), 3,73 (3Н, с), 3,82 (3Н, с), 7,62 (1Н, дд, J=2,5 Гц, 8,8 Гц), 6,71 (1Н, с), 7,16 (1Н, д, J=8,5 Гц), 13,76 (1Н, ушир. с).
- Соединение № V-134: (растворитель для измерения: ДМСО-d₆).
3,60 (3Н, с), 3,76 (3Н, с), 7,23 (1Н, д, J=9,1 Гц), 7,43 (1Н, д, J=2,8 Гц), 7,54 (1Н, дд, J=2,8 Гц, 9,1 Гц), 13,84 (1Н, ушир. с).
- Соединение № V-170: (растворитель для измерения: ДМСО-d₆).
3,58 (3Н, с), 6,10 (2Н, с), 6,78 (1Н, дд, J=1,0 Гц, 6,2 Гц), 6,89 (1Н, д, J=1,0 Гц), 7,01 (1Н, д, J=6,2 Гц), 13,63 (1Н, ушир. с).
- Соединение № V-179: (растворитель для измерения: ДМСО-d₆).
3,60 (3Н, с), 7,49 (1Н, д, J=7,7 Гц), 7,55 (1Н, дд, J=1,1 Гц, 5,0 Гц, 7,7 Гц), 8,05 (1Н, дт, J=1,9 Гц, 7,7 Гц), 8,62 (1Н, дд, J=1,1 Гц, 5,0 Гц).
- Соединение № V-198: (растворитель для измерения: ДМСО-d₆).
3,57 (3Н, с), 7,07-7,10 (2Н, м), 7,63 (1Н, дд, J=1,9 Гц, 5,2 Гц).
- Соединение № V-259: (растворитель для измерения: ДМСО-d₆).
1,09 (3Н, т, J=5,3 Гц), 3,96 (2Н, кв., J=5,3 Гц), 7,32-7,37 (2Н, м), 7,45-7,54 (3Н, м), 9,51 (1Н, ушир. с).
- Соединение № V-261: (растворитель для измерения: ДМСО-d₆).
7,36-7,53 (5Н, м), 7,82 (1Н, т, J=42,9 Гц).
- Соединение № V-265: (растворитель для измерения: ДМСО-d₆).
3,53 (3Н, с), 3,90 (3Н, с).
- Соединение № V-268: (растворитель для измерения: ДМСО-d₆).
1,45 (3Н, т), 3,91 (3Н, с), 4,09 (2Н, кв.), 7,04 (2Н, д), 7,15 (2Н, д).

Пример 1 препарата. Смачиваемый порошок.

10 частей соединения (I-1), 0,5 части октилфенилового простого эфира полиоксиэтилена, 0,5 части продукта конденсации β-нафталинсульфоната натрия и формалина, 20 частей диатомовой земли и 69 частей глины смешивали и распыляли, получая при этом смачиваемый порошок.

Пример 2 препарата. Сыпучий агент.

20 частей грубо измельченного соединения (I-1) диспергировали в 69 частях воды и добавляли 200 м.ч. силикона AF-118N (фирменное наименование, изготовлен Asahi Kasei Corporation) при одновременном добавлении 4 частей сульфоната стирилфенилового простого эфира полиоксиэтилена и 7 частей этиленгликоля. После перемешивания в течение 30 мин высокоскоростной мешалкой смесь распрыскивали с применением пульверизатора влажного типа, получая при этом сыпучий агент.

Пример 3 препарата. Эмульгируемый концентрат.

30 частей соединения (I-1), 60 частей смеси ксилола и изофорона (смесь 1:1) и 10 частей смеси алкилата полиоксиэтиленсорбитана, полиоксиэтиленалкиларилового полимера и алкиларилсульфоната хорошо перемешивали, получая при этом эмульгируемый концентрат.

Пример 4 препарата. Гранулы.

К 10 частям соединения (I-1), 80 частям наполнителя, в котором тальк и бентонит смешаны в отношении 1 к 3, 5 частям белой сажи и 5 частям смеси алкилата полиоксиэтиленсорбитана, полиоксиэтиленалкиларилового полимера и алкиларилсульфоната добавляли 10 частей воды. После хорошего разминания образовавшуюся пасту экструдировали через сито (диаметр 0,7 мм) с последующей сушкой. Разрезанием высушенного продукта получали гранулы длиной 0,5-1 мм.

Действие соединений изобретения показали посредством следующих примеров испытания.

Пример 1 испытания. Испытание для определения гербицидной активности обработкой почвы рисового поля.

Широкий пластиковый сосуд на 100 см² наполняли почвой рисового поля, после полива и перемешивания, засевали семена каждого из растений *Echinochloa oryzicola*, *Monochoria vaginalis* и *Scirpus juncooides* Roxb. и почву поливали до глубины 3 см. На следующий день смачиваемый порошок, полученный согласно примеру 1 препарата, разбавляли водой и наносили на поверхность воды. Применяемым количеством было 1000 г эффективного компонента на 1 г. После этого растения культивировали в теплице и на 21 день после обработки оценку проводили по критериям табл. 72 для определения гербицидной активности. Результаты показаны в табл. 73-76.

Таблица 72

Величина индекса	Гербицидные действия
10	100% гербицидные действия (полная гибель)
9	90% или более и менее 100% гербицидных действий
8	80% или более и менее 90% гербицидных действий
7	70% или более и менее 80% гербицидных действий
6	60% или более и менее 70% гербицидных действий
5	50% или более и менее 60% гербицидных действий
4	40% или более и менее 50% гербицидных действий
3	30% или более и менее 40% гербицидных действий
2	20% или более и менее 30% гербицидных действий
1	10% или более и менее 20% гербицидных действий
0	0% или более и менее 10% гербицидных действий

Таблица 73

№ соединения	<i>Echinochloa oryzicola</i>						
I-1	10	I-83	10	I-187	10	I-328	10
I-2	10	I-84	10	I-198	8	I-339	10
I-3	10	I-85	10	I-199	9	I-463	10
I-4	9	I-86	10	I-202	10	I-464	10
I-5	10	I-87	9	I-203	10	I-465	10
I-9	8	I-88	10	I-205	7	I-466	8
I-10	10	I-89	10	I-259	10	I-468	10
I-11	10	I-90	9	I-260	10	I-469	10
I-14	10	I-91	10	I-261	8	I-470	10
I-16	9	I-92	10	I-263	10	I-471	10
I-19	10	I-93	8	I-265	10	I-473	8
I-27	10	I-96	8	I-268	10	I-474	10
I-41	8	I-99	10	I-269	8	I-475	10
I-43	10	I-105	10	I-270	8	I-476	10
I-50	10	I-106	10	I-271	8	I-477	10
I-51	10	I-107	10	I-272	7	I-478	10
I-52	10	I-108	10	I-273	9	I-479	10
I-53	10	I-109	10	I-274	8	I-480	10
I-54	10	I-110	10	I-275	9	III-50	10
I-55	10	I-111	10	I-276	8	III-62	8
I-56	10	I-115	10	I-277	9	VI-1	10
I-57	10	I-116	10	I-278	8	VI-5	10
I-58	10	I-117	10	I-279	8	VI-6	10
I-59	10	I-118	10	I-280	10	VI-7	10
I-60	10	I-119	9	I-281	10	VI-65	10
I-61	8	I-120	8	I-282	10	VI-97	10
I-63	10	I-125	10	I-283	10	V-300	10
I-64	10	I-126	10	I-284	10	V-358	10
I-65	10	I-127	10	I-285	10	V-359	8
I-66	10	I-128	8	I-286	10	V-362	10
I-67	10	I-129	10	I-287	10	V-363	10
I-68	10	I-131	9	I-288	10	V-364	10
I-71	10	I-134	10	I-289	10	V-365	10
I-72	10	I-135	10	I-292	10	V-367	8
I-73	10	I-136	9	I-294	9	V-368	10
I-74	10	I-137	10	I-297	10	V-369	10
I-75	10	I-138	10	I-298	10	V-370	10
I-76	10	I-149	9	I-299	10	V-371	10
I-77	10	I-155	10	I-300	10		
I-78	10	I-169	10	I-301	10		
I-79	10	I-170	10	I-302	10		
I-80	10	I-179	10	I-303	10		
I-81	10	I-184	10	I-304	10		
I-82	8	I-185	8	I-307	8		

Таблица 74

№ соединения	<i>Monochoria vaginalis</i>	№ соединения	<i>Monochoria vaginalis</i>	№ соединения	<i>Monochoria vaginalis</i>
I-1	10	I-82	10	I-183	10
I-2	10	I-83	10	I-184	10
I-3	10	I-84	10	I-185	9
I-4	9	I-85	10	I-187	10
I-5	10	I-86	10	I-189	10
I-9	8	I-87	10	I-198	10
I-10	10	I-88	10	I-199	8
I-11	10	I-89	10	I-202	10
I-14	10	I-90	10	I-203	10
I-16	9	I-91	10	I-204	8
I-19	10	I-92	10	I-205	10
I-27	10	I-93	10	I-259	10
I-41	8	I-94	10	I-260	10
I-43	10	I-96	10	I-261	10
I-47	10	I-99	10	I-262	8
I-50	10	I-105	10	I-263	10
I-51	10	I-106	10	I-265	10
I-52	10	I-107	10	I-268	10
I-53	7	I-108	10	I-269	8
I-54	10	I-109	10	I-270	8
I-55	10	I-110	10	I-271	8
I-56	10	I-111	10	I-272	8
I-57	10	I-115	10	I-273	9
I-58	10	I-116	10	I-274	8
I-59	10	I-117	10	I-275	10
I-60	10	I-118	10	I-276	8
I-61	10	I-119	10	I-277	9
I-62	8	I-120	10	I-278	9
I-63	10	I-125	10	I-279	8
I-64	10	I-126	10	I-280	10
I-65	10	I-127	10	I-281	10
I-66	10	I-128	9	I-282	10
I-67	10	I-129	10	I-283	10
I-68	10	I-131	10	I-284	10
I-71	10	I-134	10	I-285	10
I-72	10	I-135	10	I-286	10
I-73	10	I-136	10	I-287	10
I-74	10	I-137	10	I-288	10
I-75	10	I-138	10	I-289	10
I-76	10	I-149	10	I-290	10
I-77	10	I-155	10	I-291	10
I-78	10	I-169	10	I-292	10
I-79	10	I-170	10	I-293	10
I-80	10	I-179	10	I-294	9
I-81	10	I-182	8	I-297	10

Таблица 75

№ соединения	<i>Monochoria vaginalis</i>
I-298	10
I-299	10
I-300	10
I-301	10
I-302	10
I-303	10
I-304	10
I-306	9
I-307	9
I-308	8
I-328	10
I-339	10
I-462	10
I-463	10
I-464	10
I-465	10
I-466	10
I-467	10
I-468	10
I-469	10
I-470	10
I-471	10
I-472	10
I-473	10
I-474	10
I-475	10
I-476	10
I-477	10
I-478	10
I-479	10
II-50	8
II-267	8
III-50	10
III-62	10
VI-1	10
VI-5	10
VI-6	10
VI-7	10
VI-65	10
VI-97	10
V-291	8
V-300	10
V-358	10
V-359	10
V-360	10
V-361	10
V-362	10
V-363	10
V-364	10
V-365	10
V-366	10
V-367	10
V-368	10
V-369	10
V-370	10
V-371	10

Таблица 76

№ соединения	<i>S. juncooides</i> Roxb.						
I-1	10	I-84	10	I-187	10	I-304	10
I-2	10	I-85	10	I-189	10	I-307	8
I-3	10	I-86	10	I-198	10	I-328	10
I-4	10	I-87	10	I-199	9	I-339	10
I-5	10	I-88	10	I-202	10	I-462	10
I-9	8	I-89	10	I-203	10	I-463	10
I-10	10	I-90	10	I-205	10	I-464	10
I-11	10	I-91	10	I-259	10	I-465	10
I-14	10	I-92	10	I-260	10	I-466	10
I-16	10	I-93	10	I-261	8	I-467	10
I-19	10	I-94	10	I-263	10	I-468	10
I-27	10	I-96	10	I-265	10	I-469	10
I-41	10	I-99	10	I-268	10	I-470	10
I-43	10	I-105	10	I-269	10	I-471	10
I-47	10	I-106	10	I-270	8	I-472	8
I-50	10	I-107	10	I-271	10	I-473	8
I-51	10	I-108	10	I-272	8	I-474	10
I-52	10	I-109	10	I-273	10	I-475	10
I-53	10	I-110	10	I-274	4	I-476	10
I-54	10	I-111	10	I-275	8	I-477	10
I-55	10	I-115	10	I-276	9	I-478	9
I-56	10	I-116	10	I-277	10	I-479	10
I-57	10	I-117	10	I-278	10	I-480	10
I-58	10	I-118	10	I-279	10	II-50	7
I-59	10	I-119	10	I-280	10	III-50	10
I-60	10	I-120	10	I-281	10	III-62	10
I-61	10	I-125	10	I-282	10	VI-1	10
I-63	10	I-126	10	I-283	10	VI-5	10
I-64	10	I-127	10	I-284	10	VI-6	10
I-65	10	I-128	10	I-285	10	VI-7	10
I-66	10	I-129	10	I-286	9	VI-65	10
I-67	10	I-131	10	I-287	10	VI-97	10
I-68	10	I-134	10	I-288	10	V-300	10
I-71	10	I-135	10	I-289	10	V-358	10
I-72	10	I-136	10	I-290	10	V-359	10
I-73	10	I-137	10	I-291	10	V-360	10
I-74	10	I-138	10	I-292	10	V-361	10
I-75	10	I-149	10	I-293	10	V-362	10
I-76	10	I-155	10	I-294	9	V-363	10
I-77	10	I-169	10	I-297	10	V-364	10
I-78	10	I-170	10	I-298	10	V-365	10
I-79	10	I-179	10	I-299	10	V-366	8
I-80	10	I-182	9	I-300	10	V-367	8
I-81	10	I-183	10	I-301	10	V-368	10
I-82	10	I-184	10	I-302	10	V-369	10
I-83	10	I-185	9	I-303	10	V-370	10
						V-371	9

Пример 2 испытания. Испытание для определения гербицидной активности обработкой почвы поля.

Широкий пластиковый сосуд на 80 см² наполняли почвой поля и засеивали каждым из растений *Echinochloa crus-galli*, foxtail, Indian millet и *A. retroflexus* и затем покрывали почвой. Смачиваемый порошок, полученный согласно примеру 1 препарата, разбавляли водой и наносили на поверхность почвы с помощью маленького опрыскивателя в количестве 1000 л на 1 г, так чтобы количество эффективного компонента составляло 1000 г на 1 г. После этого растения культивировали в теплице и на 21 день после обработки оценку проводили по критериям табл. 72 для определения гербицидной активности. Результаты показаны в табл. 77-80.

Таблица 77

№ соединения	<i>Echinochloa crus-galli</i>
I-1	8
I-2	10
I-3	10
I-4	9
I-5	10
I-9	7
I-10	10
I-11	10
I-14	10
I-16	9
I-19	8
I-27	10
I-41	9
I-43	10
I-50	10
I-51	10
I-52	10
I-53	8
I-54	10
I-55	10
I-56	10
I-57	10
I-58	10
I-60	10
I-61	8
I-63	10
I-64	10
I-65	10
I-66	10
I-67	10
I-68	10
I-71	10
I-72	9
I-73	9
I-74	10
I-75	9
I-76	10
I-77	9
I-78	10
I-79	9
I-80	9
I-81	9
I-82	9
I-83	9
I-84	9
I-85	9
I-86	10
I-87	9
I-88	8
I-89	9
I-90	8
I-91	9

I-92	9
I-93	7
I-98	7
I-99	8
I-105	9
I-106	10
I-107	8
I-109	9
I-110	7
I-111	9
I-115	9
I-116	10
I-117	10
I-118	10
I-119	8
I-120	8
I-125	7
I-127	10
I-128	8
I-129	9
I-131	9
I-134	10
I-135	9
I-137	10
I-138	9
I-149	8
I-167	8
I-169	10
I-179	10
I-182	7
I-184	8
I-185	9
I-187	7
I-198	7
I-199	9
I-202	10
I-203	9
I-259	10
I-260	10
I-265	10
I-269	8
I-270	8
I-271	10
I-273	9
I-274	7
I-275	8
I-276	9
I-277	8
I-278	9
I-279	7
I-280	9
I-281	9

I-282	10
I-283	9
I-284	10
I-285	10
I-286	10
I-287	10
I-288	10
I-289	9
I-292	7
I-294	9
I-297	10
I-298	7
I-299	9
I-302	7
I-303	9
I-304	10
I-307	7
I-339	8
I-471	7
I-474	7
I-475	7
I-476	7
I-477	9
I-478	9
I-479	9
I-480	8
VI-5	8
VI-7	10
V-300	7
V-365	7
V-368	7
V-369	7
V-370	7
V-371	9

Таблица 78

№ соединения	<i>Setaria viridis</i>
I-1	7
I-2	7
I-3	10
I-4	9
I-5	7
I-10	10
I-11	7
I-14	10
I-16	9
I-19	8
I-41	7
I-50	10
I-51	10
I-52	10
I-54	10
I-55	10
I-56	10
I-57	10
I-58	8
I-63	10
I-66	10
I-67	10
I-68	10
I-71	6
I-72	10
I-73	8
I-74	7
I-75	7
I-76	9
I-77	9
I-79	10
I-80	9
I-81	7
I-82	9
I-83	9

I-84	9
I-85	9
I-86	9
I-87	6
I-89	8
I-91	10
I-92	9
I-93	6
I-98	7
I-99	6
I-105	7
I-109	6
I-111	7
I-116	9
I-117	7
I-118	9
I-127	8
I-128	9
I-129	10
I-131	7
I-134	10
I-136	8
I-137	9
I-155	7
I-169	10
I-179	10
I-202	9
I-260	5
I-265	10
I-269	9
I-270	7
I-271	10
I-276	9
I-277	8
I-278	9
I-280	8
I-281	9
I-282	10
I-283	8
I-284	8
I-285	10
I-286	9
I-288	9
I-289	7
I-294	7
I-297	9
I-298	7
I-299	10
I-303	9
I-304	9
VI-7	10
VI-65	7

Таблица 79

№ соединения	<i>Abutilon theophrasti</i>						
I-1	9	I-83	10	I-167	10	I-294	9
I-2	10	I-84	10	I-169	9	I-297	9
I-3	10	I-85	10	I-170	10	I-298	10
I-4	9	I-86	9	I-179	10	I-299	10
I-5	10	I-87	9	I-182	10	I-300	10
I-10	10	I-88	10	I-183	10	I-302	10
I-11	9	I-89	10	I-184	10	I-303	9
I-14	10	I-90	10	I-185	10	I-304	10
I-16	9	I-91	10	I-187	9	I-306	7
I-27	10	I-92	10	I-189	10	I-307	9
I-41	8	I-93	10	I-198	10	I-339	10
I-50	10	I-94	10	I-199	10	I-462	10
I-51	10	I-96	10	I-202	9	I-463	10
I-52	10	I-98	7	I-259	8	I-465	10
I-53	10	I-99	9	I-260	10	I-470	7
I-54	10	I-105	9	I-261	10	I-471	10
I-55	10	I-106	10	I-263	8	I-474	10
I-56	10	I-107	10	I-265	10	I-475	7
I-57	10	I-108	8	I-268	8	I-476	10
I-58	10	I-109	10	I-269	9	I-477	10
I-59	10	I-110	10	I-271	10	I-478	10
I-60	10	I-111	9	I-273	7	I-479	10
I-61	10	I-115	9	I-274	8	I-480	10
I-63	10	I-116	10	I-275	10	VI-1	10
I-64	10	I-117	10	I-276	10	VI-5	10
I-65	10	I-118	9	I-277	7	VI-6	9
I-66	10	I-119	9	I-279	10	VI-7	10
I-67	10	I-120	9	I-280	9	VI-65	10
I-68	10	I-125	8	I-281	9	V-61	8
I-71	10	I-126	10	I-282	9	V-300	9
I-72	10	I-127	10	I-283	9	V-358	10
I-73	10	I-128	10	I-284	9	V-361	10
I-74	10	I-129	10	I-285	10	V-364	7
I-75	10	I-131	9	I-286	9	V-365	10
I-76	10	I-134	10	I-287	9	V-368	10
I-77	10	I-135	9	I-288	9	V-369	7
I-78	10	I-136	9	I-289	9	V-370	10
I-79	10	I-137	10	I-290	10	V-371	10
I-80	9	I-138	9	I-291	10		
I-81	10	I-149	10	I-292	9		
I-82	9	I-155	10	I-293	10		

Таблица 80

№ соединения	<i>Amaranthus retroflexus</i>						
I-1	10	I-82	10	I-179	9	I-302	10
I-2	10	I-83	10	I-182	10	I-303	10
I-3	10	I-84	10	I-183	8	I-304	10
I-4	10	I-85	10	I-184	10	I-306	10
I-5	10	I-86	10	I-185	10	I-307	10
I-9	10	I-87	9	I-187	10	I-308	10
I-10	10	I-88	10	I-189	10	I-339	10
I-11	10	I-89	10	I-198	10	I-462	9
I-14	10	I-90	10	I-199	10	I-463	7
I-16	10	I-91	10	I-202	10	I-464	7
I-19	8	I-92	10	I-203	7	I-465	10
I-27	10	I-93	10	I-259	10	I-468	7
I-41	10	I-94	10	I-260	10	I-470	8
I-43	10	I-96	10	I-263	10	I-471	10
I-47	10	I-99	10	I-265	10	I-474	10
I-50	10	I-105	10	I-268	10	I-475	7
I-51	10	I-106	10	I-269	10	I-476	10
I-52	10	I-107	10	I-270	10	I-477	10
I-53	10	I-108	10	I-271	10	I-478	10
I-54	10	I-109	10	I-272	8	I-479	10
I-55	10	I-110	10	I-273	10	I-480	10
I-56	9	I-111	10	I-274	7	VI-1	10
I-57	10	I-115	9	I-275	10	VI-5	10
I-58	10	I-116	10	I-276	10	VI-6	10
I-59	10	I-117	10	I-277	8	VI-7	10
I-60	10	I-118	10	I-278	10	VI-65	10
I-61	10	I-119	10	I-279	10	V-300	10
I-63	10	I-120	10	I-280	10	V-358	10
I-64	10	I-125	10	I-281	10	V-361	8
I-65	10	I-126	10	I-282	10	V-362	7
I-66	10	I-127	10	I-283	10	V-364	8
I-67	10	I-128	10	I-284	10	V-365	10
I-68	10	I-129	10	I-285	10	V-368	10
I-71	10	I-131	10	I-286	10	V-369	7
I-72	10	I-134	10	I-287	10	V-370	10
I-73	10	I-135	10	I-288	10	V-371	10
I-74	10	I-136	9	I-289	10		
I-75	10	I-137	10	I-290	8		
I-76	10	I-138	10	I-291	8		
I-77	10	I-149	10	I-294	10		
I-78	10	I-155	10	I-297	10		
I-79	10	I-167	10	I-298	10		
I-80	10	I-169	10	I-299	10		
I-81	10	I-170	10	I-300	10		

Пример 3 испытания. Испытание для определения гербицидной активности обработкой полевых растений.

Широкий пластиковый сосуд на 80 см² наполняли почвой поля и засеивали каждым из растений Indian millet и *A. Retroflexus* и затем культивировали в течение 2 недель в теплице. Смачиваемый порошок, полученный согласно примеру 1 препарата, разбавляли водой и наносили по воздуху на все тело растения в качестве обработки растения с помощью маленького опрыскивателя в количестве 1000 л/га, так чтобы количество эффективного компонента составляло 1000 г/га. После этого растения культивировали в теплице и на 14 день после обработки оценку проводили по критериям табл. 72 для определения гербицидной активности. Результаты показаны в табл. 81-84.

Таблица 81

№ соединения	<i>Echinochloa crus-galli</i>
I-1	8
I-2	9
I-3	9
I-4	9
I-5	10
I-9	10
I-10	8
I-11	9
I-14	9
I-16	9
I-19	10
I-27	9
I-41	10
I-43	8
I-50	10
I-51	10
I-52	10
I-53	8
I-54	10
I-55	10
I-56	10
I-57	10
I-58	10
I-59	7
I-60	10
I-61	9
I-63	10
I-64	10
I-65	8
I-66	10
I-67	10
I-68	10
I-71	10
I-72	10
I-73	10
I-74	9
I-75	10
I-76	10
I-77	10
I-78	10
I-79	10
I-80	10

I-81	10
I-82	10
I-83	10
I-84	9
I-85	9
I-86	9
I-87	9
I-88	8
I-89	9
I-90	8
I-91	9
I-92	10
I-93	9
I-96	7
I-98	7
I-99	9
I-105	10
I-106	10
I-107	7
I-109	10
I-110	9
I-111	10
I-115	10
I-116	9
I-117	9
I-118	9
I-119	9
I-120	9
I-125	10
I-126	9
I-127	10
I-128	9
I-129	10
I-131	10
I-134	10
I-135	10
I-136	9
I-137	10
I-138	8
I-149	8
I-155	9
I-167	10

I-169	9
I-170	10
I-179	10
I-182	8
I-184	10
I-185	10
I-187	8
I-198	10
I-199	10
I-202	9
I-203	6
I-259	10
I-260	8
I-263	9
I-265	8
I-268	7
I-269	10
I-270	9
I-271	10
I-272	6
I-273	10
I-274	9
I-275	9
I-276	10
I-277	10
I-278	10
I-279	9
I-280	9
I-281	9
I-282	8
I-283	8
I-284	9
I-285	9
I-286	10
I-287	8
I-288	9
I-289	9
I-292	8
I-294	9
I-297	9
I-298	10
I-299	8

I-300	9
I-302	10
I-303	8
I-304	10
I-328	7
I-339	9
I-463	7
I-465	8
I-467	8
I-468	9
I-469	10
I-470	8
I-471	9
I-474	7
I-475	9
I-476	7
I-477	9
I-478	8
I-479	9
I-480	9
III-50	10
VI-1	10
VI-5	10
VI-6	8
VI-7	10
VI-65	9
VI-97	7
V-300	8
V-358	8
V-360	8
V-362	9
V-363	10
V-364	8
V-365	9
V-368	7
V-369	9
V-370	7
V-371	8

Таблица 82

№ соединения	<i>Setaria viridis</i>
I-1	8
I-2	10
I-3	9
I-4	9
I-5	10
I-10	7
I-11	9
I-14	10
I-16	9
I-19	10
I-27	6
I-41	10
I-43	8
I-50	10
I-51	10
I-52	10
I-54	10
I-55	10
I-56	10
I-57	10
I-58	10
I-60	9
I-63	10
I-66	10
I-67	10
I-68	8
I-71	9
I-72	10
I-73	10
I-74	9
I-75	10
I-76	9
I-77	10
I-78	10
I-79	10
I-80	7
I-81	10
I-82	10
I-83	10
I-84	10
I-85	10

I-86	9
I-89	10
I-90	7
I-91	10
I-92	10
I-93	9
I-105	7
I-109	7
I-116	9
I-117	9
I-118	10
I-126	7
I-127	10
I-128	10
I-129	9
I-134	10
I-136	9
I-137	10
I-138	8
I-155	7
I-167	8
I-169	9
I-179	10
I-184	8
I-185	9
I-187	8
I-199	8
I-202	9
I-261	7
I-263	9
I-265	9
I-269	8
I-271	7
I-274	8
I-275	8
I-276	10
I-277	9
I-278	10
I-281	7
I-282	7
I-284	7

I-285	9
I-286	10
I-288	10
I-289	7
I-297	9
I-298	8
I-302	10
I-303	10
I-304	10
I-328	7
I-463	7
I-464	7
I-465	10
I-468	9
I-469	10
I-470	9
I-471	10
I-475	7
I-479	7
VI-1	10
VI-5	10
VI-6	10
VI-7	10
VI-65	7
VI-97	10
V-300	8
V-358	10
V-362	9
V-363	10
V-364	9
V-365	10
V-369	7

Таблица 83

№ соединения	<i>Abutilon theophrasti</i>						
I-1	9	I-85	10	I-189	9	I-307	10
I-2	10	I-86	10	I-198	10	I-308	8
I-3	9	I-87	9	I-199	9	I-328	10
I-4	9	I-88	9	I-202	9	I-339	10
I-5	10	I-89	10	I-203	9	I-462	10
I-9	10	I-90	9	I-205	10	I-463	9
I-10	9	I-91	10	I-259	10	I-464	10
I-11	9	I-92	10	I-260	10	I-465	10
I-14	10	I-93	10	I-261	10	I-466	10
I-16	9	I-94	10	I-263	10	I-467	7
I-19	10	I-96	9	I-265	9	I-468	10
I-27	9	I-98	9	I-268	9	I-469	10
I-41	10	I-99	10	I-269	9	I-470	10
I-43	9	I-105	10	I-270	9	I-471	10
I-47	9	I-106	9	I-271	9	I-472	7
I-50	10	I-107	9	I-272	9	I-473	10
I-51	10	I-108	9	I-273	9	I-474	9
I-52	10	I-109	9	I-274	8	I-475	8
I-53	10	I-110	9	I-275	9	I-476	9
I-54	10	I-111	10	I-276	9	I-477	9
I-55	10	I-115	10	I-277	9	I-478	9
I-56	10	I-116	9	I-278	9	I-479	9
I-57	10	I-117	9	I-279	10	I-480	10
I-58	10	I-118	10	I-280	9	II-50	8
I-59	10	I-119	9	I-281	9	II-267	9
I-60	10	I-120	9	I-282	9	III-50	10
I-61	10	I-125	10	I-283	8	III-62	10
I-62	9	I-126	9	I-284	8	VI-1	10
I-63	10	I-127	9	I-285	7	VI-5	10
I-64	10	I-128	10	I-286	9	VI-6	10
I-65	10	I-129	9	I-287	9	VI-7	10
I-66	10	I-131	10	I-288	10	VI-65	10
I-67	10	I-134	10	I-289	9	VI-97	10
I-68	10	I-135	10	I-290	9	V-300	9
I-71	9	I-136	9	I-291	9	V-358	10
I-72	10	I-137	10	I-292	10	V-359	10
I-73	10	I-138	9	I-293	8	V-360	7
I-74	9	I-149	10	I-294	7	V-361	9
I-75	10	I-155	10	I-295	9	V-362	10
I-76	10	I-167	10	I-297	8	V-363	10
I-77	10	I-169	9	I-298	9	V-364	10
I-78	10	I-170	10	I-299	9	V-365	10
I-79	10	I-179	10	I-300	8	V-366	7
I-80	9	I-182	9	I-301	7	V-367	10
I-81	10	I-183	9	I-302	10	V-368	9
I-82	10	I-184	9	I-303	9	V-369	8
I-83	10	I-185	9	I-304	9	V-370	9
I-84	10	I-187	9	I-306	9	V-371	9

Таблица 84

№ соединения	<i>Amaranthus retroflexus</i>						
I-1	10	I-85	10	I-189	10	I-306	7
I-2	10	I-86	10	I-198	10	I-307	9
I-3	9	I-87	10	I-199	9	I-328	10
I-4	9	I-88	10	I-202	9	I-339	10
I-5	10	I-89	10	I-203	10	I-462	10
I-9	10	I-90	10	I-204	7	I-463	10
I-10	10	I-91	10	I-205	10	I-464	10
I-11	10	I-92	10	I-259	10	I-465	10
I-14	10	I-93	10	I-260	10	I-466	10
I-16	10	I-94	10	I-261	10	I-467	10
I-19	10	I-96	10	I-263	10	I-468	10
I-27	9	I-98	8	I-265	10	I-469	10
I-41	10	I-99	10	I-268	10	I-470	10
I-43	10	I-105	10	I-269	10	I-471	10
I-47	10	I-106	10	I-270	10	I-472	10
I-50	10	I-107	10	I-271	10	I-473	3
I-51	10	I-108	10	I-272	10	I-474	9
I-52	10	I-109	9	I-273	10	I-475	9
I-53	10	I-110	9	I-274	9	I-476	10
I-54	10	I-111	10	I-275	9	I-477	10
I-55	10	I-115	10	I-276	10	I-478	10
I-56	10	I-116	8	I-277	10	I-479	10
I-57	10	I-117	8	I-278	10	I-480	10
I-58	10	I-118	10	I-279	10	II-50	10
I-59	10	I-119	10	I-280	10	III-50	10
I-60	10	I-120	10	I-281	9	III-62	10
I-61	10	I-125	10	I-282	8	VI-1	10
I-62	10	I-126	10	I-283	8	VI-5	10
I-63	10	I-127	10	I-284	9	VI-6	10
I-64	10	I-128	10	I-285	8	VI-7	10
I-65	10	I-129	10	I-286	10	VI-65	10
I-66	10	I-131	10	I-287	10	VI-97	10
I-67	10	I-134	10	I-288	10	V-300	10
I-68	10	I-135	10	I-289	10	V-358	10
I-71	10	I-136	10	I-290	10	V-359	10
I-72	10	I-137	10	I-291	10	V-360	10
I-73	10	I-138	10	I-292	10	V-361	10
I-74	10	I-149	10	I-293	10	V-362	10
I-75	10	I-155	10	I-294	8	V-363	10
I-76	10	I-167	10	I-295	8	V-364	10
I-77	10	I-169	8	I-297	8	V-365	10
I-78	10	I-170	10	I-298	10	V-366	10
I-79	10	I-179	10	I-299	10	V-368	9
I-80	10	I-182	9	I-300	10	V-369	9
I-81	10	I-183	10	I-301	10	V-370	10
I-82	10	I-184	10	I-302	10	V-371	10
I-83	10	I-185	10	I-303	10		
I-84	10	I-187	10	I-304	10		

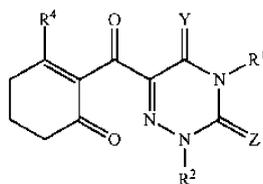
В результате испытаний было обнаружено, что соединения изобретения обладают превосходной гербицидной активностью.

ФОРМУЛА ИЗОБРЕТЕНИЯ

1. Способ подавления роста нежелательных сорняков, включающий нанесение агрохимической композиции на сорняки или почвы, в которых сорняки разрастаются,

где сорняки принадлежат к семейству, выбранному из группы, состоящей из семейства Onagraceae, семейства Ranunculaceae, семейства Polygonaceae, семейства Portulacaceae, семейства Caryophyllaceae, семейства Chenopodiaceae, семейства Amaranthaceae, семейства Brassicaceae, семейства Fabaceae, семейства Malvaceae, семейства Violet, семейства Rubiaceae, семейства Convolvulaceae, семейства Lamiaceae, семейства Scrophulariaceae, семейства Asteraceae, семейства Boraginaceae, семейства Asclepiadaceae, семейства Euphorbiaceae, семейства Geraniaceae, семейства Oxalidaceae, семейства Cucurbitaceae, семейства Poaceae, семейства Commelinaceae, семейства Equisetaceae, семейства Papaveraceae, семейства Superaceae, семейства Lythraceae, семейства Elatinaceae, семейства Superaceae, семейства Alismataceae, семейства Potamogetonaceae, семейства Erucaulaceae, семейства Asteraceae, семейства Commelinaceae, семейства Characeae, семейства Pontederiaceae, семейства Salvinia natans, семейства Araceae, семейства Haloragaceae, семейства Azollaceae, семейства Ariaceae, семейства Hydrocharitaceae, семейства Sabrbaceae и семейства Lemnaceae; и

агрохимическая композиция содержит эффективное количество производного триазина или его соли и приемлемый для сельского хозяйства носитель, где производное триазина представлено формулой II



Формула II,

где R^1 и R^2 независимо выбраны из C_1 - C_6 алкильной группы или фенильной группы, замещенной одним или несколькими заместителями, выбранными из атомов галогена;

R^4 представляет собой гидроксильную группу и

Y и Z оба представляют собой атом кислорода.

2. Способ по п.1,

где R^1 представляет собой фенил, замещенный 1-5 атомами галогена, выбранными из хлора и фтора; и

R^2 представляет собой метил, этил или пропил.

3. Способ по п.1,

где R^1 представляет собой фенил, замещенный на любом атоме углерода фенильного кольца фтором; и

R^2 представляет собой метил.

4. Способ по п.1, где агрохимическая композиция содержит дополнительный агрохимически активный компонент, который является гербицидом, выбранным из группы, включающей гербицид ингибирования ацетил-СоА-карбоксилазы (АССазы), гербицид ингибирования ацетолактатсинтазы (ALS), гербицид 1 ингибирования фотосинтеза фотосистемы II, гербицид 2 ингибирования фотосинтеза фотосистемы II, гербицид генерации радикала фотосистемы I, гербицид ингибирования протопорпириногеноксидазы (PPO), гербицид ингибирования фитоендесатуразы (PDS), гербицид ингибирования биосинтеза каротиноидов, гербицид ингибирования синтеза EPSP-синтазы (ингибирование биосинтеза ароматических аминокислот), гербицид ингибирования синтеза глутамина, гербицид ингибирования дигидроптероевой кислоты (DHP), гербицид ингибирования ассоциации микротрубочек, гербицид ингибирования митоза/образования ткани микротрубочек, гербицид ингибирования синтазы жирных кислот с очень длинной цепью (VLCFA), гербицид ингибирования синтеза целлюлозы, гербицид расщепляющих агентов (деструкции клеточных мембран), гербицид ингибирования биосинтеза липидов (в том числе ингибирование АССазы), гербицид ингибирования синтеза ауксина и гербицид ингибирования транспорта ауксина.

5. Способ по п.1, где агрохимическая композиция содержит дополнительный агрохимически активный компонент, который является соединением, регулирующим рост растений, выбранным из группы, включающей 1-метилциклопропен, 1-нафтилацетамид, 2,6-диизопропилнафталин, (4-хлорфеноксид)уксусную кислоту (4-CPA), бензиламинопуридин, анцимидол, авиглицин, карвон, хлормекват, клопроп, клоксифонак, клоксифонак-калий, цикланилид, цитокинины, даминозид, дикегулак, диметипин, этефон, этихлозат, флуметралин, флуренол, флурпримидол, форхлорфенурон, гиббереллиновую кислоту, инабенфид, индолуксусную кислоту, индолмасляную кислоту, гидразид малеиновой кислоты, мефлуидид, мепикват хлорид, н-деканол, паклобутразол, прогексадион-кальций, прогидрожасмон, синтофен, тидиазурон, триаконтанол, тринексапак-этил, униканазол, униканазол-Р и эколист.

6. Способ по п.1, где агрохимическая композиция содержит дополнительный агрохимически активный компонент, который является антидотом, выбранным из группы, состоящей из беноксакора, фурилазола, дихлормида, дициклонона, ДКА-24 (N^1, N^2 -диаллил- N^2 -дихлорацетилглицинамид), AD-67 (4-дихлорацетил-1-окса-4-азаспиро[4.5]декан), PPG-1292 (2,2-дихлор-N-(1,3-диоксан-2-илметил)-N-(2-пропенил)ацетамид), R-29148 (3-дихлорацетил-2,2,5-триметил-1,3-оксазолидин), клохинтцет-мексила, нафталевого ангидрида (1,8-нафталевоый ангидрид), мефенпир-диэтила, мефенпира, мефенпир-этила, фенхлоразол-этила, фенклорима, MG-191 (2-дихлорметил-2-метил-1,3-диоксан), циометринила, флуразола, флуксофенима, изоксадифена, изоксадифен-этила, мекопропа, МСРА (4-хлор-о-толилоксиуксусная кислота), даймуруна, 2,4-D ((2,4-дихлорфенокси)уксусная кислота), MON4660 (дихлорацетил-1-окса-4-азаспиро(4,5)декан), оксабетринила, ципросульфамида и (1-(дихлороацетил)гексагидро-1H-азепина).

7. Способ по п.1, где агрохимическая композиция содержит дополнительный агрохимически активный компонент, который является агентом для борьбы с болезнями растений, выбранным из группы, включающей ингибитор биосинтеза нуклеиновой кислоты, ингибитор митоза и дифференциации клеток, ингибитор дыхания, ингибитор синтеза аминокислоты и белка, препарат, действующий на путь трансдукции сигнала, ингибитор синтеза липида и клеточной мембраны, ингибитор биосинтеза стерина, ингибитор биосинтеза глюкогена, ингибитор синтеза меланина, препарат для индуцирования устойчивости к болезни растений, микроорганизмы и продукты микроорганизмов.

8. Способ по п.1, где агрохимическая композиция содержит дополнительный агрохимически активный компонент, который является пестицидом, акарицидом или нематоцидом, выбранным из группы, включающей ингибитор ацетилхолинэстеразы, ингибитор рецептора GABA (хлоридного канала), препа-

рат, действующий на натриевый канал, агонист/антагонист рецептора никотинового ацетилхолина, аллостерический активатор рецептора никотинового ацетилхолина, препарат, активирующий хлоридный канал, препарат ювенильного гормона, ингибитор питания, агент, подавляющий рост клещей, ингибитор биосинтеза АТФ ферментов, расщепляющий агент, препарат для блокирования канала никотинового ацетилхолина, ингибитор биосинтеза хитина, ингибитор линьки, агонист экдизона, агонист октопамина, ингибитор цепи переноса митохондриальных электронов (комплекс III), ингибитор цепи переноса митохондриальных электронов (комплекс I), ингибитор натриевых каналов, ингибитор биосинтеза липидов, ингибитор цепи переноса митохондриальных электронов (комплекс IV), препарат нейронального ингибитора, ингибитор аконитазы и препарат, действующий на рецептор рианодина.

9. Способ по п.1, где сорняки являются водными сорняками и принадлежат к семейству, выбранному из группы, включающей семейства Pontederiaceae, семейства *Salvinia natans*, семейства *Araceae*, семейства *Nalagagaceae*, семейства *Azollaceae*, семейства *Scrophulariaceae*, семейства *Amaranthaceae*, семейства *Poaceae*, семейства *Ariaceae*, семейства *Hydrocharitaceae*, семейства *Cabrmbaseae* и семейства *Lemnaceae*.

10. Способ по п.1, где сорняки расположены на площади, выбранной из группы, включающей склон дамбы, дно реки, кромку и откос дорожного полотна, участок железной дороги, площади парков, большие лесные городские массивы, стоянки автомобилей, аэропорт, фабрику и складское сооружение, земли, не занятые под сельскохозяйственной культурой, и свободные участки земли в городе или фруктовый сад, пастбище, сенокосное угодье, лесные угодья.

11. Способ по п.1, где агрохимическая композиция применяется на местности, где выращиваются сельскохозяйственные и садовые растения.

12. Способ по п.11, где сельскохозяйственные и садовые растения выращиваются на сельскохозяйственных землях.

13. Способ по п.11, где сельскохозяйственные и садовые растения выращиваются на поле или на затопляемом рисовом поле.

14. Способ по п.11, где агрохимическая композиция применяется для обработки листьев, обработки почвы, обработки для протравливания семян, смешанной обработки почвы, обработки почвы перед посевом, обработки во время посева, обработки почвы после посева, обработки для заделки семян в почву и смешанной обработки почвы во время посева и обработки почвы до и после посева для беспашотного земледелия на поле для культивирования сельскохозяйственных и садовых растений.

15. Способ по п.11, где сельскохозяйственные и садовые растения выбирают из группы, включающей сельскохозяйственную культуру, овощные культуры, фруктовые растения, мандарины, орехи, ягоды, деревья, траву, масленичную культуру, цветы, овсяницу и листовые растения.

16. Способ по п.11, где сельскохозяйственные и садовые растения являются растениями, которым придана устойчивость к гербициду.

17. Способ по п.16, где сельскохозяйственные и садовые растения обладают устойчивостью к ингибитору HPPD, ингибитору ацетолактатсинтазы (ALS), ингибитору EPSP-синтазы, ингибитору глутаминсинтазы, ингибитору ацетил-CoA-карбоксилазы или ингибитору протопорпириногенаксидазы (PPO).

18. Способ по п.16, где сельскохозяйственные и садовые растения обладают одним или несколькими признаками, такими как гербицидно-устойчивым геном, пестицидно-инсектицидным устойчивым геном, способностью продуцировать антипатогенное вещество, модифицированными масляными компонентами или признаком продуцирования повышенного количества аминокислоты.

