

(19)



Евразийское
патентное
ведомство

(21) 201992268 (13) A1

(12) ОПИСАНИЕ ИЗОБРЕТЕНИЯ К ЕВРАЗИЙСКОЙ ЗАЯВКЕ

(43) Дата публикации заявки
2020.02.21(22) Дата подачи заявки
2018.03.28

(51) Int. Cl. C07D 403/04 (2006.01)
C07D 237/14 (2006.01)
C07D 405/04 (2006.01)
A01N 43/58 (2006.01)

(54) НОВЫЕ ПИРИДАЗИНОВЫЕ ГЕРБИЦИДЫ

(31) 62/477,685

(32) 2017.03.28

(33) US

(86) PCT/US2018/024742

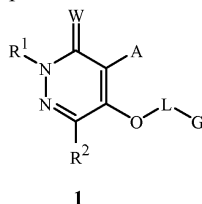
(87) WO 2018/183432 2018.10.04

(71) Заявитель:
ФМК КОРПОРЕЙШН (US)

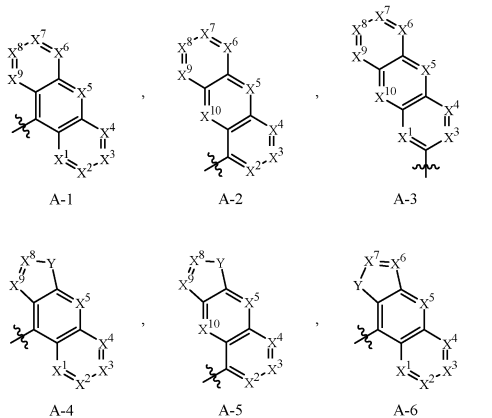
(72) Изобретатель:
Маккенн Стивен Фредерик (US)

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

(57) В описании приведены соединения формулы 1, включая все их стереоизомеры, N-оксиды и соли, содержащие их сельскохозяйственные композиции и их применение в качестве гербицидов



где R¹, R², L, G и W соответствуют определениям, приведенным в описании, а A выбрано из

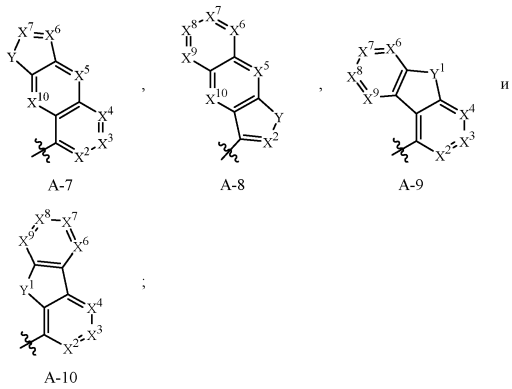


201992268

A1

A1

201992268



а $X^1, X^2, X^3, X^4, X^5, X^6, X^7, X^8, X^9, X^{10}$, Y и Y^1 соответствуют определениям, приведенным в описании.

НОВЫЕ ПИРИДАЗИНОВЫЕ ГЕРБИЦИДЫ

Область применения изобретения

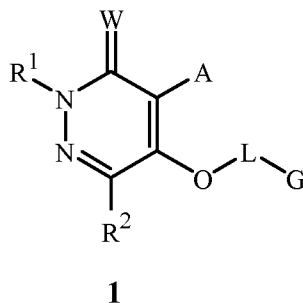
Настоящее изобретение относится к определенным пиридазиновым гербицидам, их *N*-оксидам, солям и композициям, а также к способам их применения для борьбы с нежелательной растительностью.

Предпосылки создания изобретения

Борьба с нежелательной растительностью очень важна для достижения высокой эффективности сельскохозяйственных культур. Крайне желательно обеспечить селективный контроль роста сорняков, в особенности в таких полезных сельскохозяйственных культурах, как, помимо прочих, рис, соя, сахарная свекла, кукуруза, картофель, пшеница, ячмень, томаты и плантационные сельскохозяйственные культуры. Бесконтрольный рост сорняков в таких полезных сельскохозяйственных культурах может привести к значительному снижению производительности и, таким образом, к росту стоимости для потребителя. Большое значение имеет также контроль за нежелательной растительностью в незасаемых областях. В продаже имеются множество продуктов для этих целей, но сохраняется потребность в новых соединениях, которые являются более эффективными, менее дорогостоящими, менее токсичными, более безопасными с экологической точки зрения или имеют разные места приложения действия.

Изложение сущности изобретения

Настоящее изобретение относится к соединениям формулы **1**, включая все стереоизомеры, их *N*-оксиды и соли, содержащим их сельскохозяйственным композициям и их применению в качестве гербицидов



где

W представляет собой O или S;

R¹ представляет собой H, C₁–C₇ алкил, C₃–C₈ алкилкарбонилалкил, C₃–C₈

алкоксикарбонилалкил, C₄–C₇ алкилциклоалкил, C₃–C₇ алкенил, C₃–C₇

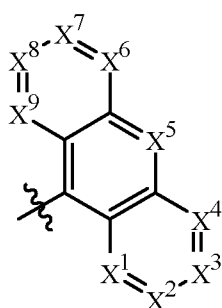
алкинил, C₃–C₇ циклоалкил, C₄–C₇ циклоалкилалкил, C₂–C₃ цианоалкил, C₁–C₄ нитроалкил, C₂–C₇ галогеналкоксиалкил, C₁–C₇ галогеналкил, C₃–C₇ галогеналкенил, C₂–C₇ алкоксиалкил, C₃–C₇ алкилтиоалкил, C₁–C₇ алкокси, бензил или фенил; или 5- или 6-членное насыщенное или частично насыщенное гетероциклическое кольцо, содержащее члены кольца, выбранные из углерода и до 1 О и 1 S;

R² представляет собой H, галоген, циано, формил, C₁–C₇ алкил, C₃–C₈ алкилкарбонилалкил, C₃–C₈ алкоксикарбонилалкил, C₂–C₄ алкилкарбонил, C₂–C₇ алкилкарбонилокси, C₄–C₇ алкилциклоалкил, C₃–C₇ алкенил, C₃–C₇ алкинил, C₁–C₄ алкилсульфинил, C₁–C₄ алкилсульфонил, C₁–C₄ алкиламино, C₂–C₈ диалкиламино, C₃–C₇ циклоалкил, C₄–C₇ циклоалкилалкил, C₂–C₃ цианоалкил, C₁–C₄ нитроалкил, C₂–C₇ галогеналкоксиалкил, C₁–C₇ галогеналкил, C₃–C₇ галогеналкенил, C₂–C₇ алкоксиалкил, C₁–C₇ алкокси, C₁–C₅ алкилтио или C₂–C₃ алкоксикарбонил; или фенил, необязательно замещенный галогеном, C₁–C₄ алкилом или C₁–C₄ галогеналкилом;

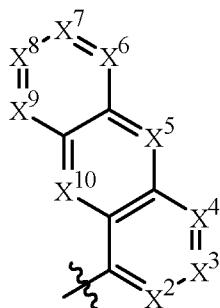
L представляет собой прямую связь, C₁–C₄ алкандиил или C₂–C₄ алкендиил;

G представляет собой H, C(=O)R⁵, C(=S)R⁵, CO₂R⁶, C(=O)SR⁶, S(O)₂R⁵, CONR⁷R⁸, S(O)₂NR⁷R⁸ или P(=O)R⁹R¹⁰; или C₁–C₄ алкил, C₂–C₄ алкенил, C₂–C₄ алкинил, C₁–C₄ галогеналкил, C₂–C₄ галогеналкенил, C₂–C₄ галогеналкинил, C₂–C₄ алкоксиалкил, C₃–C₆ циклоалкил или C₄–C₇ циклоалкилалкил; или 5- или 6-членное гетероциклическое кольцо;

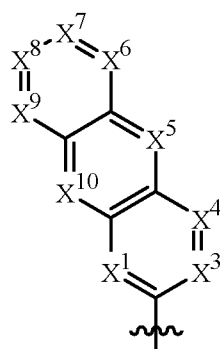
A выбран из



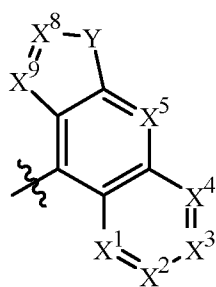
A-1



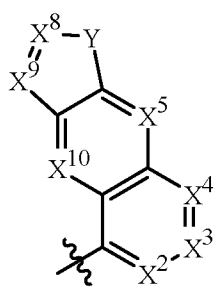
A-2



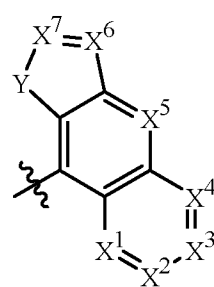
A-3



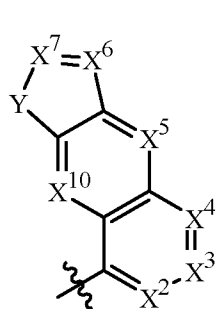
A-4



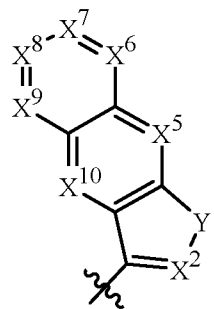
A-5



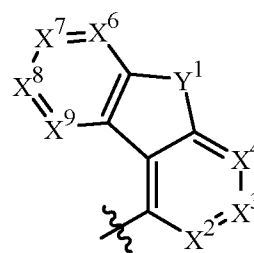
A-6



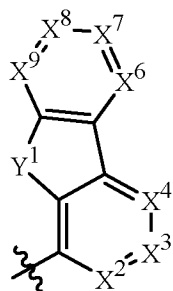
A-7



A-8



A-9



A-10

$X^1, X^2, X^3, X^4, X^5, X^6, X^7, X^8, X^9$ и X^{10} , каждый независимо, представляет собой N или CR^3 ; при условии, что не более 4 из $X^1, X^2, X^3, X^4, X^5, X^6, X^7, X^8, X^9$ и X^{10} представляют собой N;

Y представляет собой O, S или NR^4 ;

Y^1 представляет собой O, S, NR^4 или $CR^{3a}R^{3b}$;

каждый R^3 независимо представляет собой H, галоген, циано, нитро, C_1-C_5 алкил, C_2-C_5 алкенил, C_2-C_5 алкинил, C_3-C_5 циклоалкил, C_4-C_5 циклоалкилалкил, C_1-C_5 галогеналкил, C_3-C_5 галогеналкенил, C_3-C_5 галогеналкинил, C_2-C_5 алкоксиалкил, C_1-C_5 алкокси, C_1-C_5 галогеналкокси, C_1-C_5 алкилтио, C_1-C_4 алкилсульфинил, C_1-C_4 алкилсульфонил, C_1-C_5 галогеналкилтио или C_2-C_5 алкоксикарбонил;

R^{3a} представляет собой H, галоген, $-CN$, нитро, C_1-C_5 алкил, C_2-C_5 алкенил, C_2-C_5 алкинил, C_3-C_5 циклоалкил, C_4-C_5 циклоалкилалкил, C_1-C_5 галогеналкил, C_3-

- C_5 галогеналкенил, C_3-C_5 галогеналкинил, C_2-C_5 алкоксиалкил, C_1-C_5 алкокси, C_1-C_5 галогеналкокси, C_1-C_5 алкилтио, C_1-C_4 алкилсульфинил, C_1-C_4 алкилсульфонил, C_1-C_5 галогеналкилтио или C_2-C_5 алкоксикарбонил;
- R^{3b} представляет собой H, галоген, $-CN$, нитро, C_1-C_5 алкил, C_2-C_5 алкенил, C_2-C_5 алкинил, C_3-C_5 циклоалкил, C_4-C_5 циклоалкилалкил, C_1-C_5 галогеналкил, C_3-C_5 галогеналкенил, C_3-C_5 галогеналкинил, C_2-C_5 алкоксиалкил, C_1-C_5 алкокси, C_1-C_5 галогеналкокси, C_1-C_5 алкилтио, C_1-C_4 алкилсульфинил, C_1-C_4 алкилсульфонил, C_1-C_5 галогеналкилтио или C_2-C_5 алкоксикарбонил; или
- R^{3a} и R^{3b} взяты вместе как $=O$; или R^{3a} и R^{3b} взяты вместе с атомом углерода, с которым они связаны, с образованием необязательно замещенного 3–7-членного карбоциклического кольца;
- R^4 представляет собой H, C_1-C_3 алкил или C_1-C_3 галогеналкил;
- R^5 и R^7 независимо представляют собой H, C_1-C_7 алкил, C_3-C_7 алкенил, C_3-C_7 алкинил, C_3-C_7 циклоалкил, C_1-C_7 галогеналкил, C_3-C_7 галогеналкенил, C_2-C_7 алкоксиалкил или C_4-C_7 циклоалкилалкил; или фенильное, бензильное или 5–6-членное гетероциклическое кольцо, причем каждое фенильное, бензильное или гетероциклическое кольцо необязательно замещено галогеном, C_1-C_4 алкилом или C_1-C_4 галогеналкилом;
- R^6 представляет собой C_1-C_7 алкил, C_3-C_7 алкенил, C_3-C_7 алкинил, C_3-C_7 циклоалкил, C_2-C_7 галогеналкил, C_3-C_7 галогеналкенил, C_2-C_7 алкоксиалкил или C_4-C_7 циклоалкилалкил; или фенильное, бензильное или 5–6-членное гетероциклическое кольцо, причем каждое фенильное, бензильное или гетероциклическое кольцо необязательно замещено галогеном, C_1-C_4 алкилом или C_1-C_4 галогеналкилом;
- R^8 представляет собой H, C_1-C_7 алкил, C_2-C_7 алкенил, C_2-C_7 алкинил, C_3-C_7 циклоалкил, C_4-C_7 циклоалкилалкил, C_1-C_7 галогеналкил или C_2-C_7 алкоксиалкил;
- R^9 представляет собой C_1-C_7 алкил или C_1-C_7 алкокси; и
- R^{10} представляет собой C_1-C_7 алкил или C_1-C_7 алкокси.

Более конкретно настоящее изобретение относится к соединению формулы 1 (включая все стереоизомеры), его *N*-оксиду или соли. Настоящее изобретение также относится к гербицидной композиции, содержащей соединение по изобретению (т. е. в эффективном с точки зрения гербицидного действия количестве) и по меньшей мере один компонент, выбранный из группы, состоящей из поверхностно-активных веществ, твердых разбавителей и жидких разбавителей. Настоящее изобретение дополнительно

относится к способу контроля роста нежелательной растительности, включающему приведение растительности или окружающей ее среды в контакт с эффективным с точки зрения гербицидного действия количеством соединения по изобретению (например, в виде композиции, описанной в настоящем документе).

Настоящее изобретение также включает гербицидную смесь, содержащую (а) соединение, выбранное из формулы 1, его *N*-оксидов и солей, и (b) по меньшей мере один дополнительный активный ингредиент, выбранный из (b1)–(b16); и солей соединений (b1)–(b16), как описано ниже.

Подробное описание изобретения

В настоящем документе термины «содержит», «содержащий», «включает в себя», «включающий в себя», «имеет», «имеющий», «вмещает», «вмещающий», «отличающийся» или любые другие их варианты подразумевают неисключающее включение, на которое распространяется любое указанное в явной форме ограничение. Например, композиция, смесь, процесс или способ, который содержит перечень элементов, необязательно ограничен только этими элементами, но может включать в себя другие элементы, не указанные в явной форме или присущие такой композиции, смеси, процессу или способу.

Переходная фраза «состоящий из» исключает любой неуказанный элемент, стадию или ингредиент. При использовании в формуле изобретения такая фраза не позволит включать в формулу изобретения материалы, отличные от перечисленных, за исключением обычно связанных с ними примесей. При использовании фразы «состоящий из» в пункте основной части формулы изобретения, а не сразу после вводной части, она ограничивает только элемент, указанный в данном пункте; другие элементы не исключаются из формулы изобретения в целом.

Переходная фраза «состоящий по существу из» применяется для определения композиции или способа, который включает в себя материалы, стадии, признаки, компоненты или элементы в дополнение к буквально описанным, при условии, что эти дополнительные материалы, стадии, признаки, компоненты или элементы существенно не влияют на основную (-ые) и новую (-ые) характеристику (-и) заявленного изобретения. Термин «состоящий по существу из» занимает среднее положение между терминами «содержащий» и «состоящий из».

Если заявители используют в изобретении или его части открытый термин, такой как «содержащий», следует понимать, что (если не указано иное) описание также следует интерпретировать как описывающее такое изобретение с применением терминов «состоящий по существу из» или «состоящий из».

Дополнительно, если в явной форме не указано иное, союз «или» относится к включающему «или», а не к исключающему «или». Например, условие «А или В» выполняется в любой одной из следующих ситуаций: А истинно (или присутствует) и В ложно (или отсутствует), А ложно (или отсутствует) и В истинно (или присутствует), и оба элемента А и В истинны (или присутствуют).

Кроме того, употребление единственного числа при описании элемента или компонента по изобретению призвано носить не имеющий ограничительного характера в отношении числа примеров (т. е. упоминаний) элемента или компонента. Следовательно, элемент или компонент в единственном числе должен включать в себя «один» или «по меньшей мере один», и элемент или компонент в единственном числе также включает в себя множественное число, кроме случаев, когда число очевидно означает единственное.

В настоящем документе термин «проросток», применяемый по отдельности или в комбинации слов, означает молодое растение, развивающееся из зародыша семени.

В настоящем документе термин «широколиственный», применяемый отдельно или в таких словах, как «широколиственный сорняк», означает двудольное или двусемядольное растение и применяется для описания группы покрытосеменных растений, отличающихся зародышами, имеющими две семядоли.

В настоящем документе термин «алкилирование» относится к реакции, в которой нуклеофил вымещает замещаемую группу, такую как галогенид или сульфонат, из углерод-содержащего радикала. Если не указано иное, термин «алкилирование» не ограничивает углерод-содержащий радикал алкилом.

В приведенных выше перечислениях термин «алкил», применяемый как отдельно, так и в составных словах, таких как «алкилтио» или «галогеналкил», включает в себя неразветвленный или разветвленный алкил, такой как метил, этил, *n*-пропил, изопропил или разные изомеры бутила, пентила или гексила. Термин «алкенил» включает в себя неразветвленные или разветвленные алкены, такие как этенил, 1-пропенил, 2-пропенил и разные изомеры бутенила, пентенила и гексенила. Термин «алкенил» также включает в себя полиены, такие как 1,2-пропадиенил и 2,4-гексадиенил. Термин «алкинил» включает в себя неразветвленные или разветвленные алкины, такие как этинил, 1-пропинил, 2-пропинил и разные изомеры бутинила, пентинила и гексинила. Термин «алкинил» может также включать в себя молекулы, состоящие из множества тройных связей, такие как 2,5-гексадиинил.

Термин «алкокси» включает в себя, например, метокси, этокси, *n*-пропилокси, изопропилокси и разные изомеры бутокси, пентокси и гексилокси. Термин «алкоксиалкил» обозначает замещение алкокси в алкиле. Примеры «алкоксиалкила»

включают в себя CH_3OCH_2 , $\text{CH}_3\text{OCH}_2\text{CH}_2$, $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{OCH}_2$, $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{OCH}_2$ и $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{OCH}_2\text{CH}_2$. Термин «алкоксиалкокси» обозначает замещение алкокси в алкокси. Термин «алкилтио» включает в себя разветвленные или неразветвленные группы алкилтио, такие как метилтио, этилтио и разные изомеры пропилтио, бутилтио, пентилтио и гексилтио. Термин «алкилтиоалкил» обозначает замещение алкилтио в алкиле. Примеры «алкилтиоалкила» включают в себя CH_3SCH_2 , $\text{CH}_3\text{SCH}_2\text{CH}_2$, $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{SCH}_2$, $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{SCH}_2$ и $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{SCH}_2\text{CH}_2$. Термин «алкилсульфинил» включает в себя оба энантиомера алкилсульфинильной группы. Примеры «алкилсульфинила» включают в себя $\text{CH}_3\text{S(O)-}$, $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{S(O)-}$, $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{CH}_2\text{S(O)-}$, $(\text{CH}_3)_2\text{CHS(O)-}$ и разные изомеры бутилсульфинила, пентилсульфинила и гексилсульфинила. Примеры «алкилсульфонила» включают в себя $\text{H}_3\text{S(O)}_2-$, $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{S(O)}_2-$, $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{CH}_2\text{S(O)}_2-$, $(\text{CH}_3)_2\text{CHS(O)}_2-$ и разные изомеры бутилсульфонила, пентилсульфонила и гексилсульфонила. Термин «цианоалкил» обозначает алкильную группу, замещенную одной цианогруппой. Примеры «цианоалкила» включают в себя NCCH_2 и NCCH_2CH_2 (также обозначается как $\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CN}$). Термин «нитроалкил» обозначает алкильную группу, замещенную одной нитрогруппой. Примеры «нитроалкила» включают в себя O_2NCH_2 и $\text{O}_2\text{NCH}_2\text{CH}_2$ (также обозначается как $\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NO}_2$). Термин «циано» обозначает NC- , а термин «формил» обозначает HC(=O)- . Термин «алкиламино» включает в себя радикал NH , замещенный неразветвленным или разветвленным алкилом. Примеры «алкиламино» включают в себя $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{NH}$, $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NH}$ и $(\text{CH}_3)_2\text{CHCH}_2\text{NH}$. Примеры «диалкиламино» включают в себя $(\text{CH}_3)_2\text{N}$, $(\text{CH}_3\text{CH}_2\text{CH}_2)_2\text{N}$ и $\text{CH}_3\text{CH}_2(\text{CH}_3)\text{N}$.

Термин «циклоалкил» включает в себя, например, циклопропил, циклобутил, цикlopентил и циклогексил. Термин «циклоалкилалкил» обозначает циклоалкильное замещение в алкильной группе. Примеры «циклоалкилалкила» включают в себя циклопропилметил, цикlopентилэтил и другие циклоалкильные группы, связанные с неразветвленными или разветвленными алкильными группами. Термин «алкилциклоалкил» обозначает алкильную группу, связанную с циклоалкильной группой.

Термин «галоген» отдельно либо в составных словах, таких как «галогеналкил», или при применении в описаниях, таких как «алкил, замещенный галогеном», включает в себя фтор, хлор, бром или йод. Кроме того, при применении в составных словах, таких как «галогеналкил», или при применении в таких описаниях, как «алкил, замещенный галогеном», указанный алкил может быть частично или полностью замещен атомами галогена, которые могут быть одинаковыми или разными. Примеры «галогеналкила» или «алкила, замещенного галогеном» включают в себя F_3C , ClCH_2 , CF_3CH_2 и CF_3CCl_2 . Термины «галогеналкокси», «галогеналкоксиалкил», «галогеналкилтио»,

«галогеналкенил», «галогеналкинил» и т. п. определяются так, как указано, аналогично термину «галогеналкил». Примеры «галогеналкокси» включают в себя $\text{CF}_3\text{O}-$, $\text{CCl}_3\text{CH}_2\text{O}-$, $\text{HCF}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{O}-$ и $\text{CF}_3\text{CH}_2\text{O}-$. Примеры «галогеналкоксиалкила» включают в себя CF_3OCH_2- , $\text{CCl}_3\text{CH}_2\text{OCH}_2-$, $\text{HCF}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{OCH}_2-$ и $\text{CF}_3\text{CH}_2\text{OCH}_2-$. Примеры «галогеналкилтио» включают в себя $\text{CCl}_3\text{S}-$, $\text{CF}_3\text{S}-$, $\text{CCl}_3\text{CH}_2\text{S}-$ и $\text{ClCH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{S}-$. Примеры «галогеналкенила» включают в себя $(\text{Cl})_2\text{C}=\text{CHCH}_2-$ и $\text{CF}_3\text{CH}_2\text{CH}=\text{CHCH}_2-$. Примеры «галогеналкинила» включают в себя $\text{HC}\equiv\text{CCHCl}-$, $\text{CF}_3\text{C}\equiv\text{C}-$, $\text{CCl}_3\text{C}\equiv\text{C}-$ и $\text{FCH}_2\text{C}\equiv\text{CCH}_2-$.

Термин «алкилкарбонил» обозначает неразветвленную или разветвленную алкильную группу, связанную с группой $\text{C}(=\text{O})$. Примеры «алкилкарбонила» включают в себя $\text{CH}_3\text{C}(=\text{O})-$, $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{C}(=\text{O})-$, $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{CH}_2\text{C}(=\text{O})-$, $(\text{CH}_3)_2\text{CHC}(=\text{O})-$ и разные изомеры бутокси- или пентоксикарбонила. Термин «алкоксикарбонил» обозначает неразветвленные или разветвленные алкоксигруппы, связанные с группой $\text{C}(=\text{O})$. Примеры «алкоксикарбонила» включают в себя $\text{CH}_3\text{OC}(=\text{O})-$, $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{OC}(=\text{O})-$, $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{CH}_2\text{OC}(=\text{O})-$, $(\text{CH}_3)_2\text{CHOC}(=\text{O})-$ и разные изомеры бутокси- или пентоксикарбонила. Термин «алкоксикарбонилалкил» обозначает обозначает неразветвленную или разветвленную функциональную алкоксигруппу, связанную посредством алкильной группы. Термин «алкилкарбонилалкил» обозначает неразветвленную или разветвленную алкилкарбонильную группу, связанную посредством алкильной группы. Термин «алкилкарбонилокси» включает в себя алкилкарбонильную группу, связанную посредством атома кислорода. Примеры алкилкарбонилокси включают в себя $\text{CH}_3\text{C}(=\text{O})\text{O}-$, $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{C}(=\text{O})\text{O}-$, $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{CH}_2\text{C}(=\text{O})\text{O}-$ и $(\text{CH}_3)_2\text{CHC}(=\text{O})-$. Термин «алкандиил» или «алкендиил» обозначает линейную или разветвленную алкановую или алкеновую связующую цепь соответственно. Примеры алкандиила включают в себя $-\text{CH}_2-$, $-\text{CH}_2\text{CH}(\text{CH}_3)-$ или $-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2-$. Примеры алкендиила включают в себя $-\text{CH}=\text{CH}-$, $-\text{CH}_2\text{C}=\text{CH}-$ или $-\text{CH}=\text{C}(\text{CH}_3)-$. Термин «смежный» в контексте расположения заместителя обозначает «рядом с» или «непосредственно рядом с».

Общее число атомов углерода в замещающей группе указано префиксом « C_i-C_j », где i и j представляют собой числа от 1 до 7. Например, C_1-C_4 алкилсульфонил обозначает метилсульфонил, присоединенный посредством бутилсульфонила; C_2 алкоксиалкил обозначает CH_3OCH_2- ; C_3 алкоксиалкил обозначает, например $\text{CH}_3\text{CH}(\text{OCH}_3)-$, $\text{CH}_3\text{OCH}_2\text{CH}_2-$ или $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{OCH}_2-$; а C_4 алкоксиалкил обозначает различные изомеры алкильной группы, замещенной алкоксигруппой, содержащей в общей сложности четыре атома углерода, примеры включают в себя $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{CH}_2\text{OCH}_2-$ и $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{OCH}_2\text{CH}_2-$.

Если группа содержит заместитель, который может представлять собой водород,

например R^2 или R^4 , то при использовании водорода в качестве этого заместителя считается, что это эквивалентно тому, что указанная группа является незамещенной. Если указано, что одно или более положений в группе являются «незамещенными», это означает, что к ним присоединены атомы водорода, которые могут занимать любую свободную валентность. Если иным образом не указано, что он является необязательно замещенным, термин «фенил» обозначает незамещенный фенил. Если иным образом не указано, что он является необязательно замещенным, термин «бензил» обозначает незамещенный бензил.

Соединения формулы 1, в которых L представляет собой прямую связь, а G представляет собой H (т. е. заместитель «O-L-G» формулы 1 представляет собой гидроксигруппу), считаются соединениями, которые связываются с активным центром в растительном ферменте или рецепторе, имеющем гербицидный эффект на растение. Другие соединения формулы 1, в которых заместители L-G образуют группу, которая способна трансформироваться внутри растений или в окружающей среде в гидроксигруппу, обеспечивают аналогичные гербицидные эффекты и входят в объем настоящего изобретения. Следовательно, L-G может представлять собой любое известное в данной области производное, которое не подавляет гербицидную активность соединения формулы 1 и подвергается или может подвергаться гидролизу, окислению, восстановлению или иной форме метаболизма в растениях или почве для обеспечения функции карбоновой кислоты, которая в зависимости от pH находится в диссоциированной или недиссоциированной форме. Термин «кольцевая система» обозначает два или более сочлененных кольца. Термин «бициклическая кольцевая система» обозначает кольцевую систему, состоящую из двух сочлененных колец.

Соединения по настоящему изобретению могут существовать в виде одного или более стереоизомеров. Различные стереоизомеры включают в себя энантиомеры, диастереомеры, атропизомеры и геометрические изомеры. Стереоизомеры представляют собой изомеры идентичного состава, но отличаются расположением своих атомов в пространстве и включают в себя энантиомеры, диастереомеры, цис- и транс-изомеры (также известные как геометрические изомеры) и атропизомеры. Атропизомеры возникают в результате ограниченного вращения вокруг одиночных связей, где вращающийся барьер достаточно высок, чтобы обеспечить изоляцию изомерных соединений. Специалисту в данной области будет понятно, что один стереоизомер может быть более активным и/или может оказывать благоприятные эффекты, если его больше относительно другого (-их) стереоизомера (-ов) или при отделении от другого (-их) стереоизомера (-ов). Кроме того, специалисту в данной области известно, как отделять,

обогащать и/или селективно получать указанные стереоизомеры. Соединения по изобретению могут присутствовать в виде смеси стереоизомеров, отдельных стереоизомеров или в качестве оптически активной формы.

Соединения формулы **1**, как правило, существуют в более чем одной форме и, таким образом, формула **1** включает в себя все кристаллические и некристаллические формы соединений, которые они представляют. Некристаллические формы включают в себя варианты осуществления, которые представляют собой твердые вещества, такие как воски и камеди, а также варианты осуществления, которые представляют собой жидкости, такие как растворы и расплавы. Кристаллические формы включают в себя варианты осуществления, которые представляют собой по существу один тип кристаллов, и варианты осуществления, которые представляют собой смесь полиморфов (т. е. разные типы кристаллической структуры). Термин «полиморф» относится к конкретной кристаллической форме химического соединения, которая может кристаллизоваться в разные кристаллические формы, причем эти формы имеют разные конфигурации и/или конформации молекул в кристаллической решетке. Хотя полиморфы могут иметь одинаковый химический состав, они также могут отличаться по составу из-за наличия или отсутствия совместно кристаллизованной воды или других молекул, которые могут быть слабо или сильно связаны в решетке. Полиморфы могут отличаться по таким химическим, физическим и биологическим свойствам, как форма кристалла, плотность, твердость, цвет, химическая стабильность, температура плавления, гигроскопичность, суспендируемость, скорость растворения и биологическая доступность. Специалисту в данной области будет понятно, что полиморф соединения формулы **1** может оказывать благоприятные эффекты (например, обеспечивать возможность получения полезных составов, улучшенных биологических характеристик) по сравнению с другим полиморфом или смесью полиморфов того же соединения формулы **1**. Получение и выделение конкретного полиморфа соединения формулы **1** могут быть выполнены способами, известными специалистам в данной области, включая, например, кристаллизацию с применением выбранных растворителей и температур. Всестороннее описание полиморфизма см. в R. Hilfiker, Ed., *Polymorphism in the Pharmaceutical Industry*, Wiley-VCH, Weinheim, 2006.

Специалистам в данной области будет понятно, что не все азотсодержащие гетероциклы могут образовывать *N*-оксиды, поскольку азоту требуется доступная неподеленная пара для окисления в оксид; специалистам в данной области известны азотсодержащие гетероциклы, которые могут образовывать *N*-оксиды. Специалистам в данной области также будет понятно, что третичные амины могут образовывать *N*-оксиды. Специалистам в данной области хорошо известны способы синтеза для получения

N-оксидов гетероциклов и третичных аминов, включая окисление гетероциклов и третичных аминов пероксикислотами, таких как перуксусная кислота и *m*-хлорпербензойная кислота (МСПВА), перекись водорода, алкилгидропероксиды, такие как трет-бутилгидропероксид, перборат натрия и диоксираны, такие как диметилдиоксиран. Эти способы получения *N*-оксидов были подробно описаны и рассмотрены в литературе, см., например: T. L. Gilchrist in *Comprehensive Organic Synthesis*, vol. 7, pp 748–750, S. V. Ley, Ed., Pergamon Press; M. Tisler and B. Stanovnik in *Comprehensive Heterocyclic Chemistry*, vol. 3, pp 18–20, A. J. Boulton and A. McKillop, Eds., Pergamon Press; M. R. Grimmett and B. R. T. Keene in *Advances in Heterocyclic Chemistry*, vol. 43, pp 149–161, A. R. Katritzky, Ed., Academic Press; M. Tisler and B. Stanovnik in *Advances in Heterocyclic Chemistry*, vol. 9, pp 285–291, A. R. Katritzky and A. J. Boulton, Eds., Academic Press; и G. W. H. Cheeseman and E. S. G. Werstiuk in *Advances in Heterocyclic Chemistry*, vol. 22, pp 390–392, A. R. Katritzky and A. J. Boulton, Eds., Academic Press.

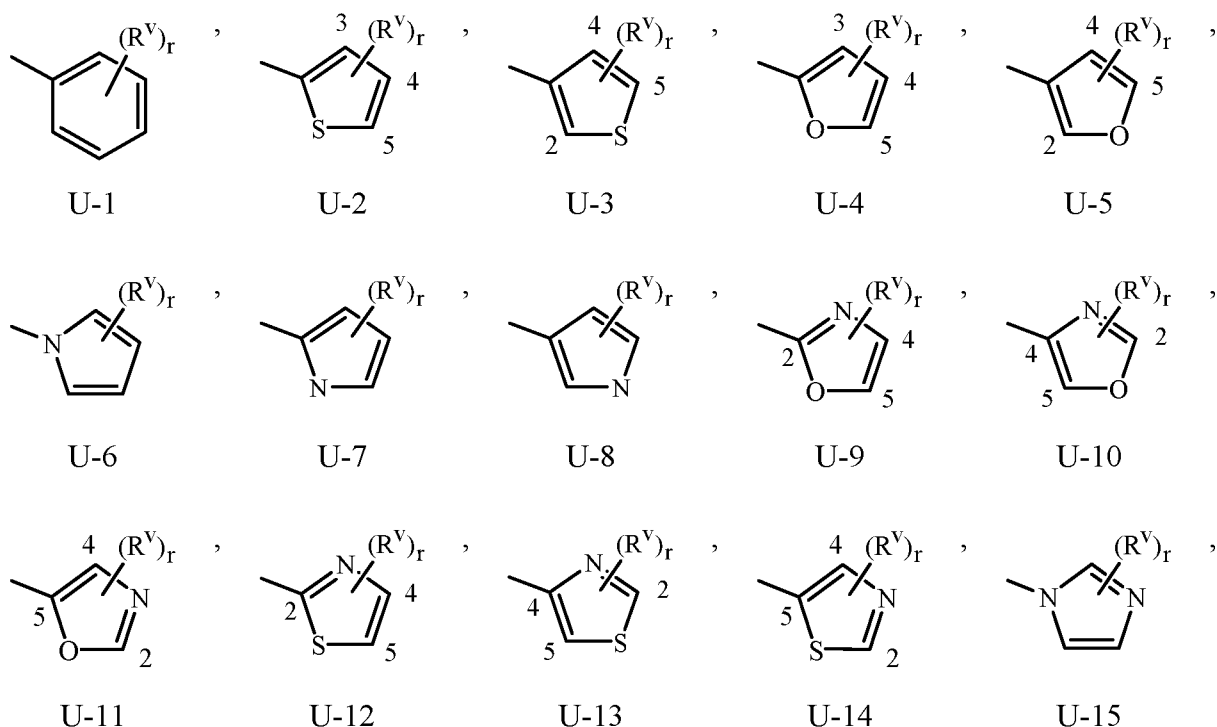
Специалисту в данной области будет понятно, что, поскольку в окружающей среде и при физиологических условиях соли химических соединений находятся в равновесии с соответствующими им несолевыми формами, соли также обладают биологической пользой несолевых форм. Таким образом, множество разнообразных солей соединения формулы **1** можно использовать для борьбы с нежелательной растительностью (т. е. они являются подходящими с точки зрения сельского хозяйства). Соли соединения формулы **1** включают в себя кислотно-аддитивные соли с неорганическими или органическими кислотами, такими как бромистоводородная, соляная, азотная, фосфорная, серная, уксусная, масляная, фумаровая, молочная, малеиновая, малоновая, щавелевая, пропионовая, салициловая, винная, 4-толуолсульфоновая или валериановая кислоты. Когда соединение формулы **1** содержит кислотную группу, такую как энольная функциональная группа (например, когда L представляет собой прямую связь, а G представляет собой H), соли также включают в себя соли, образованные органическими или неорганическими основаниями, такими как пиридин, триэтиламин или аммиак, или амидами, гидридами, гидроксидами или карбонатами натрия, калия, магния или бария. Соответственно, настоящее изобретение включает в себя соединения, выбранные из соединений формулы **1**, их *N*-оксидов и приемлемых с точки зрения сельского хозяйства солей.

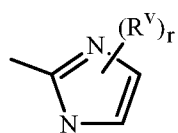
Когда R⁵, R⁶ или R⁷ представляет собой 5- или 6-членное азотсодержащее гетероциклическое кольцо, она может быть присоединена к остальной части формулы **1** посредством любого имеющегося члена кольца, представляющего собой атом углерода или азота, если не указано иное. Как указано выше, R⁵, R⁶ или R⁷ могут представлять

собой (помимо прочего) фенил, необязательно замещенный одним или более заместителями, выбранными из группы заместителей, определенных как указано в разделе «Изложение сущности изобретения». Примером фенила, необязательно замещенного заместителями в количестве от одного до пяти, является кольцо, обозначенное как U-1 в примере 1, где R^v является заместителем в R^5 , R^6 или R^7 , определенным как указано в разделе «Изложение сущности изобретения», а g представляет собой целое число.

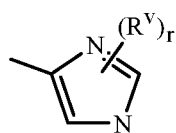
Как указано выше, R^5 , R^6 или R^7 может представлять собой (помимо прочего) 5- или 6-членное гетероциклическое кольцо, которое может быть насыщенным или ненасыщенным, необязательно замещенное одним или более заместителями, выбранными из группы заместителей, определенных как указано в разделе «Изложение сущности изобретения». Примеры 5- или 6-членного ненасыщенного ароматического гетероциклического кольца, необязательно замещенного одним или более заместителями, включают в себя кольца от U-2 до U-61, показанные в примере 1, где R^v представляет собой любой заместитель, определенный как указано в разделе «Изложение сущности изобретения», в R^5 , R^6 или R^7 (т. е. галоген, C_1 – C_4 алкил или C_1 – C_4 галогеналкил), а g представляет собой целое число от 0 до 4, ограниченное числом доступных положений в каждой группе U. Поскольку в U-29, U-30, U-36, U-37, U-38, U-39, U-40, U-41, U-42 и U-43 имеется только одно доступное положение, для этих групп U значение g ограничено целыми числами 0 или 1, причем если g равно 0, это означает, что группа U является незамещенной, а в положении, обозначенном $(R^v)_g$, находится водород.

Пример 1

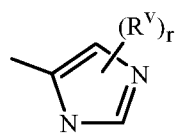




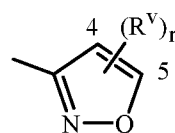
U-16



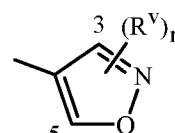
U-17



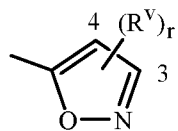
U-18



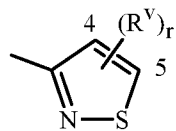
U-19



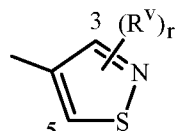
U-20



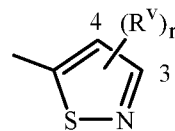
U-21



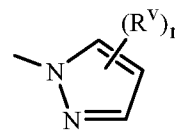
U-22



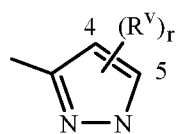
U-23



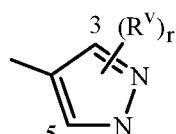
U-24



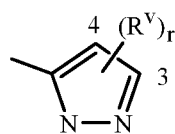
U-25



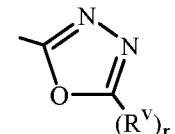
U-26



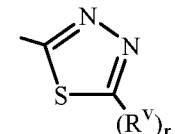
U-27



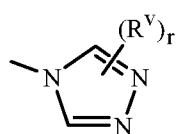
U-28



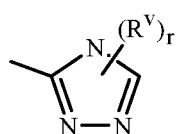
U-29



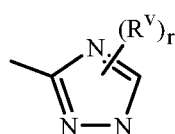
U-30



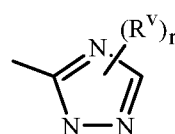
U-31



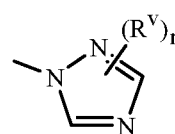
U-32



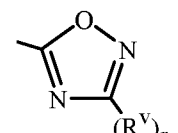
U-33



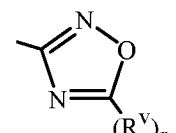
U-34



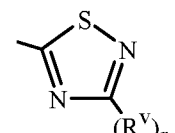
U-35



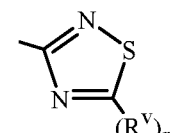
U-36



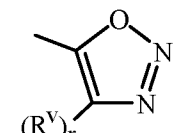
U-37



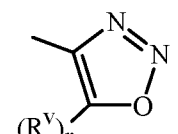
U-38



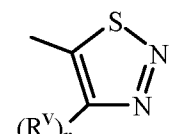
U-39



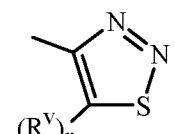
U-40



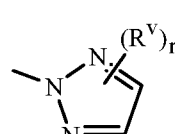
U-41



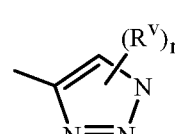
U-42



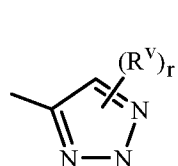
U-43



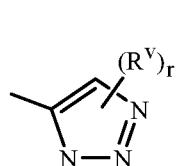
U-44



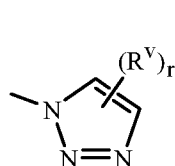
U-45



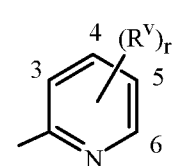
U-46



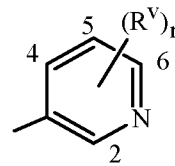
U-47



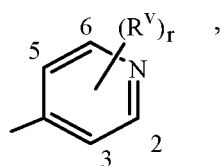
U-48



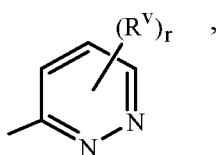
U-49



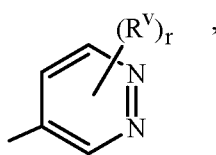
U-50



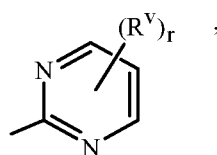
U-51



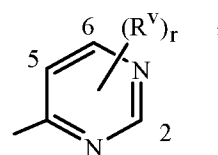
U-52



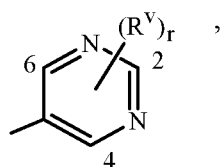
U-53



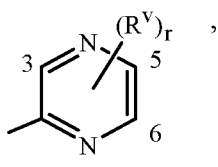
U-54



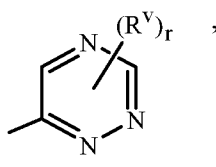
U-55



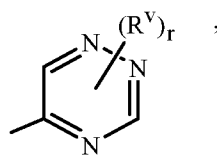
U-56



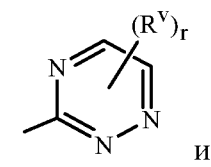
U-57



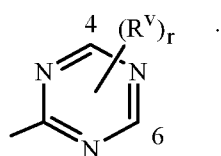
U-58



U-59



U-60



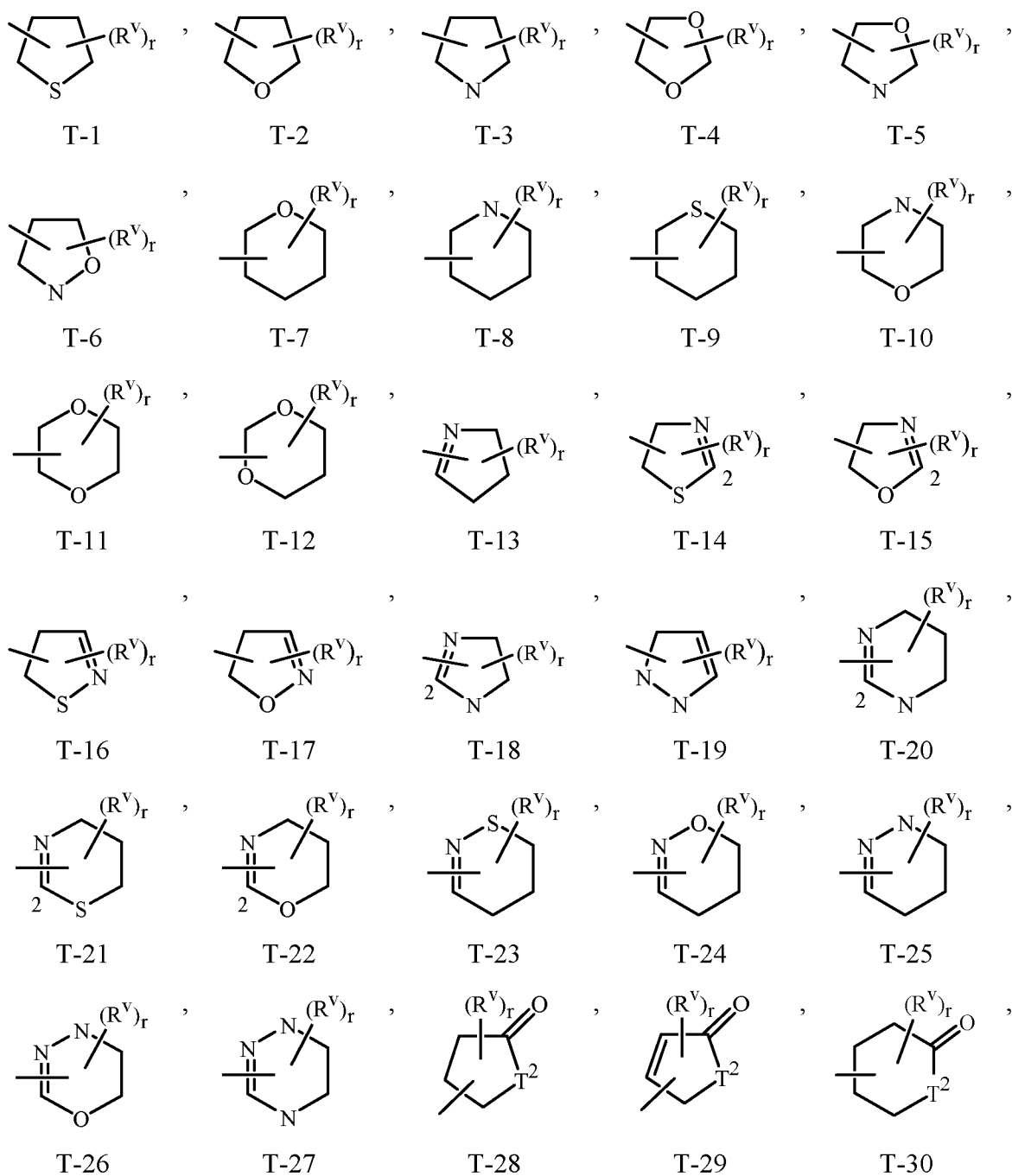
U-61

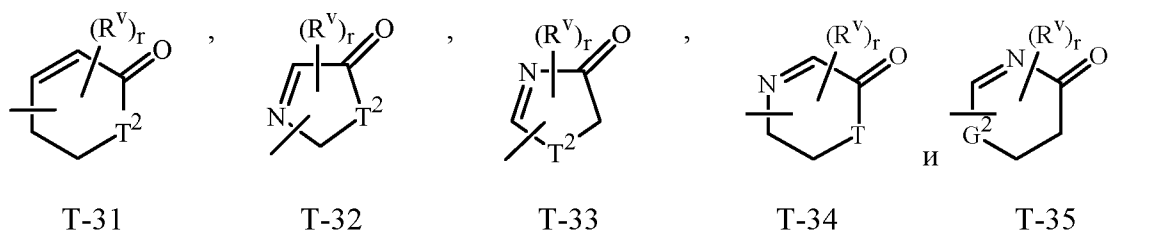
Следует отметить, что когда R^5 , R^6 или R^7 представляет собой 5- или 6-членное насыщенное или ненасыщенное неароматическое гетероциклическое кольцо, необязательно замещенное одним или более заместителями, выбранными из группы заместителей, определенных как указано в разделе «Изложение сущности изобретения», в R^5 , R^6 или R^7 , один или два члена кольца, представляющие собой атом углерода гетероцикла, могут необязательно находиться в окисленной форме карбонильной группы.

Примеры 5- или 6-членного гетероциклического кольца, которое представляет собой насыщенное или неароматическое ненасыщенное гетероциклическое кольцо, содержащее члены кольца, выбранные из одного или двух атомов О и одного или двух атомов S, и необязательно замещенные на членах кольца, представляющих собой атомы углерода, атомами галогена в количестве до пяти, включают в себя кольца от Т-1 до Т-35, как показано в примере 2. Следует отметить, что, когда точка присоединения на группе Т показана как плавающая, группа Т может быть присоединена к остальной части формулы 1 посредством любого доступного атома углерода или азота группы Т путем замены атома водорода. Дополнительные заместители, соответствующие R^V , могут быть присоединены к любому доступному атому углерода или азота путем замены атома водорода. Для этих колец Т значение r обычно представляет собой целое число от 0 до 4, ограниченное числом доступных положений в каждой группе Т. Термин «необязательно замещенный» обозначает «замещенный или незамещенный». Следует отметить, что когда T^2 представляет собой N, атом азота может заполнить свою валентность путем замещения H

или заместителями, соответствующими R^V , определенными как указано в разделе «Изложение сущности изобретения», в R^5 , R^6 или R^7 . Примеры значений для R^1 включают в себя T-1, T-2, T-7 и T-9 (т. е. когда R^1 представляет собой, помимо прочих, 5- или 6-членное насыщенное или частично насыщенное гетероциклическое кольцо, содержащее члены кольца, выбранные из углерода и до 1 O и 1 S”), а также от T-28 до T-31, где T^2 представляет собой O или S.

Пример 2





Хотя группы R^V показаны в структурах с U-1 по U-61, следует отметить, что они не обязательно должны присутствовать, поскольку являются необязательными заместителями. Следует отметить, что когда R^V представляет собой H, присоединенный к атому, это то же самое, как если бы указанный атом был незамещенным. Атомы азота, которые нуждаются в замещении для заполнения их валентности, замещены H или R^V . Следует отметить, что, когда точка присоединения между $(R^V)_r$ и группой U показана как плавающая, $(R^V)_r$ может быть присоединен к любому доступному атому углерода или атому азота группы U. Следует отметить, что, когда точка присоединения в группе U показана как плавающая, группа U может быть присоединена к остальной части формулы **1** посредством любого доступного атома углерода или азота группы U путем замены атома водорода. Следует отметить, что некоторые группы U могут быть замещены только менее чем 4 группами R^V (например, от U-2 до U-5, от U-7 до U-48 и от U-52 до U-61).

В данной области известно множество способов синтеза, позволяющих получать ароматические и неароматические гетероциклические кольца и кольцевые системы; подробные обзоры представлены в восьмитомном справочнике *Comprehensive Heterocyclic Chemistry*, A. R. Katritzky and C. W. Rees editors-in-chief, Pergamon Press, Oxford, 1984 и в двенадцатитомном справочнике *Comprehensive Heterocyclic Chemistry II*, A. R. Katritzky, C. W. Rees and E. F. V. Scriven editors-in-chief, Pergamon Press, Oxford, 1996.

Варианты осуществления настоящего изобретения, описанные в разделе «Изложение сущности изобретения», включают в себя следующие (в которых формула **1**, применяемая в следующих вариантах осуществления, включает в себя ее N-оксиды и соли).

Вариант осуществления 1. Соединение формулы **1**, его N-оксиды и соли, содержащие их композиции и способы их применения для борьбы с нежелательной растительностью, как описано в разделе «Изложение сущности изобретения».

Вариант осуществления 2. Соединение по варианту осуществления 1, в котором R^1 представляет собой H, C_1-C_7 алкил, C_3-C_8 алкилкарбонилалкил, C_3-C_8 алкоксикарбонилалкил, C_4-C_7 алкилциклоалкил, C_3-C_7 алкенил, C_3-C_7 алкинил, C_3-C_7 циклоалкил, C_4-C_7 циклоалкилалкил, C_2-C_3 цианоалкил, C_1-C_4 нитроалкил, C_2-C_7 галогеналкоксиалкил, C_1-C_7 галогеналкил, C_3-C_7 галогеналкенил, C_2-C_7 алкоксиалкил, C_3-C_7 алкилтиоалкил, C_1-C_7 алкокси, бензил или фенил.

Вариант осуществления 3. Соединение по любому одному из вариантов

осуществления 1 или 2, в котором R^1 представляет собой H, C_1-C_7 алкил, C_3-C_8 алкилкарбонилалкил, C_4-C_7 алкилциклоалкил, C_3-C_7 циклоалкил, C_4-C_7 циклоалкилалкил, C_2-C_3 цианоалкил, C_1-C_4 нитроалкил, C_2-C_7 галогеналкоксиалкил, C_1-C_7 галогеналкил, C_2-C_7 алкоксиалкил, C_3-C_7 алкилтиоалкил, C_1-C_7 алкокси или бензил.

Вариант осуществления 4. Соединение по варианту осуществления 3, в котором R^1

представляет собой C_1-C_4 алкил, C_3-C_4 циклоалкил, C_2-C_3 цианоалкил, C_1-C_3 галогеналкил или C_2-C_4 алкоксиалкил.

Вариант осуществления 5. Соединение по варианту осуществления 4, в котором R^1

представляет собой C_1-C_3 алкил, $NCCH_2CH_2-$, C_1-C_2 галогеналкил или 2-метоксиэтил.

Вариант осуществления 6. Соединение по варианту осуществления 5, в котором R^1

представляет собой метил, этил, *n*-пропил или 2-метоксиэтил.

Вариант осуществления 7. Соединение по варианту осуществления 6, в котором R^1

представляет собой метил или этил.

Вариант осуществления 8. Соединение по варианту осуществления 6, в котором R^1

представляет собой метил.

Вариант осуществления 9. Соединение по варианту осуществления 1, в котором R^1

отличается от H.

Вариант осуществления 10. Соединение по варианту осуществления 1, в котором R^1

отличается от фенила.

Вариант осуществления 11. Соединение по любому одному из вариантов

осуществления 1–10, в котором W представляет собой O.

Вариант осуществления 12. Соединение по формуле 1 или по любому одному из

вариантов осуществления 1–11, в котором A выбрано из A-1, A-4 и A-6.

Вариант осуществления 13. Соединение по формуле 1 или варианту осуществления

12, в котором A представляет собой A-1.

Вариант осуществления 14. Соединение по формуле 1 или варианту осуществления

12, в котором A представляет собой A-4.

Вариант осуществления 15. Соединение по формуле 1 или варианту осуществления

12, в котором A представляет собой A-6.

Вариант осуществления 16. Соединение по формуле 1 или варианту осуществления

12, в котором A представляет собой A-1, а каждый из X^1 , X^2 , X^3 , X^4 , X^5 , X^6 , X^7 , X^8 и X^9 независимо представляет собой CR^3 .

Вариант осуществления 17. Соединение по формуле 1 или варианту осуществления 12, в котором А представляет собой А-1, а каждый из X^1 , X^2 , X^3 , X^4 , X^5 , X^6 , X^7 , X^8 и X^9 представляет собой СН.

Вариант осуществления 18. Соединение по любому одному из вариантов осуществления 1–17, в котором R^2 представляет собой Н, галоген, циано, формил, C_1 – C_7 алкил, C_3 – C_8 алкилкарбонилалкил, C_3 – C_8 алкоксикарбонилалкил, C_2 – C_4 алкилкарбонил, C_2 – C_7 алкилкарбонилокси, C_4 – C_7 алкилциклоалкил, C_3 – C_7 алкенил, C_3 – C_7 алкинил, C_1 – C_4 алкилсульфинил, C_1 – C_4 алкилсульфонил, C_1 – C_4 алкиламино, C_2 – C_8 диалкиламино, C_3 – C_7 циклоалкил, C_4 – C_7 циклоалкилалкил, C_2 – C_3 цианоалкил, C_1 – C_4 нитроалкил, C_2 – C_7 галогеналкоксиалкил, C_1 – C_7 галогеналкил, C_3 – C_7 галогеналкенил, C_2 – C_7 алкоксиалкил, C_1 – C_7 алкокси или C_1 – C_5 алкилтио.

Вариант осуществления 19. Соединение по варианту осуществления 18, в котором R^2 представляет собой Н, галоген, циано, формил, C_1 – C_7 алкил, C_2 – C_4 алкилкарбонил, C_2 – C_7 алкилкарбонилокси, C_4 – C_7 алкилциклоалкил, C_1 – C_4 алкилсульфинил, C_1 – C_4 алкилсульфонил, C_1 – C_4 алкиламино, C_3 – C_7 циклоалкил, C_4 – C_7 циклоалкилалкил, C_2 – C_3 цианоалкил, C_1 – C_4 нитроалкил, C_2 – C_7 галогеналкоксиалкил, C_1 – C_7 галогеналкил, C_2 – C_7 алкоксиалкил или C_1 – C_7 алкокси.

Вариант осуществления 20. Соединение по варианту осуществления 19, в котором R^2 представляет собой Н, галоген, циано, C_1 – C_4 алкил, C_3 – C_5 циклоалкил, C_1 – C_3 галогеналкил, C_2 – C_4 алкоксиалкил или C_1 – C_3 алкокси.

Вариант осуществления 21. Соединение по варианту осуществления 20, в котором R^2 представляет собой Н, галоген, циано, C_1 – C_3 алкил, циклопропил, C_1 – C_2 галогеналкил, метокси или этокси.

Вариант осуществления 22. Соединение по варианту осуществления 21, в котором R^2 представляет собой Н, Cl, Br, I, циано, метил или метокси.

Вариант осуществления 23. Соединение по варианту осуществления 22, в котором R^2 представляет собой Н, Cl, метил или метокси.

Вариант осуществления 24. Соединение по варианту осуществления 23, в котором R^2 представляет собой Cl или метил.

Вариант осуществления 25. Соединение по любому одному из вариантов осуществления 1–23, в котором R^2 отличается от Н.

Вариант осуществления 26. Соединение по любому одному из вариантов осуществления 1–17, в котором R^2 отличается от фенила.

- Вариант осуществления 27. Соединение по варианту осуществления 18, в котором R^2 представляет собой галоген, C_1-C_7 алкил, C_1-C_4 алкиламино, C_2-C_8 диалкиламино или C_3-C_7 циклоалкил.
- Вариант осуществления 28. Соединение по варианту осуществления 27, в котором R^2 представляет собой C_1-C_4 алкиламино или C_2-C_8 диалкиламино.
- Вариант осуществления 29. Соединение по формуле 1 или любому одному из вариантов осуществления 1–28, в котором L представляет собой прямую связь.
- Вариант осуществления 30. Соединение по формуле 1 или любому одному из вариантов осуществления 1–28, в котором L представляет собой прямую связь, а G представляет собой H, $C(=O)R^5$, $C(=S)R^5$, CO_2R^6 , $C(=O)SR^6$, $CONR^7R^8$ или $P(=O)R^9R^{10}$; или C_1-C_4 алкил, C_2-C_4 алкенил, C_2-C_4 алкинил, C_1-C_4 галогеналкил, C_2-C_4 галогеналкенил, C_2-C_4 галогеналкинил, C_2-C_4 алкоксиалкил, C_3-C_6 циклоалкил или C_4-C_7 циклоалкилалкил.
- Вариант осуществления 31. Соединение по варианту осуществления 30, в котором G представляет собой H, $C(=O)R^5$, CO_2R^6 , $CONR^7R^8$ или $P(=O)R^9R^{10}$; или C_1-C_4 алкил, C_2-C_4 алкенил, C_1-C_4 галогеналкил, C_2-C_4 галогеналкенил, C_2-C_4 алкоксиалкил, C_3-C_6 циклоалкил или C_4-C_7 циклоалкилалкил.
- Вариант осуществления 32. Соединение по варианту осуществления 31, в котором G представляет собой H, $C(=O)R^5$, CO_2R^6 или $P(=O)R^9R^{10}$; или C_1-C_4 алкил, C_1-C_4 галогеналкил, C_2-C_4 алкоксиалкил или C_3-C_6 циклоалкил.
- Вариант осуществления 33. Соединение по варианту осуществления 32, в котором G представляет собой H, $C(=O)R^5$ или CO_2R^6 ; или C_2-C_4 алкоксиалкил или C_3-C_6 циклоалкил.
- Вариант осуществления 34. Соединение по варианту осуществления 33, в котором G представляет собой H.
- Вариант осуществления 35. Соединение по варианту осуществления 33, в котором G представляет собой $C(=O)R^5$.
- Вариант осуществления 36. Соединение по варианту осуществления 33, в котором G представляет собой CO_2R^6 .
- Вариант осуществления 37. Соединение по варианту осуществления 33, в котором G представляет собой C_2-C_4 алкоксиалкил.
- Вариант осуществления 38. Соединение по варианту осуществления 33, в котором G представляет собой C_3-C_6 циклоалкил.
- Вариант осуществления 39. Соединение по формуле 1 или любому одному из вариантов осуществления 1–28, в котором L представляет собой C_1-C_2

алкандиил или C_2-C_3 алкендиил.

Вариант осуществления 40. Соединение по варианту осуществления 39, в котором L представляет собой C_1-C_2 алкандиил.

Вариант осуществления 41. Соединение по варианту осуществления 39, в котором L представляет собой C_2-C_3 алкендиил.

Вариант осуществления 42. Соединение по варианту осуществления 39, в котором L представляет собой $-CH_2-$ или $-CH=CH-$.

Вариант осуществления 43. Соединение по варианту осуществления 42, в котором L представляет собой $-CH_2-$.

Вариант осуществления 44. Соединение по формуле 1 или любому одному из вариантов осуществления 1–43, где каждый R^3 независимо представляет собой H, галоген, C_1-C_3 алкил, C_3-C_4 циклоалкил, C_1-C_3 галогеналкил или C_1-C_3 алкокси.

Вариант осуществления 45. Соединение по варианту осуществления 44, в котором каждый R^3 независимо представляет собой H, галоген, C_1-C_2 алкил, циклопропил или C_1-C_2 галогеналкил.

Вариант осуществления 46. Соединение по варианту осуществления 45, в котором каждый R^3 независимо представляет собой H, галоген, метил, этил или CF_3 .

Вариант осуществления 47. Соединение по варианту осуществления 46, в котором каждый R^3 независимо представляет собой H, F, Cl, Br или метил.

Вариант осуществления 48. Соединение по варианту осуществления 47, в котором каждый R^3 представляет собой H.

Варианты осуществления настоящего изобретения, включая варианты осуществления 1–48 выше, а также любые другие варианты осуществления, описанные в настоящем документе, можно комбинировать любым способом, и описания переменных в вариантах осуществления относятся не только к соединениям формулы 1, но также к исходным соединениям и промежуточным соединениям, которые можно использовать для получения соединений формулы 1. Кроме того, варианты осуществления настоящего изобретения, включая варианты осуществления 1–48 выше, а также любые другие варианты осуществления, описанные в настоящем документе, и любая их комбинация относятся к композициям и способам по настоящему изобретению.

Вариант осуществления A. Соединение формулы 1, его *N*-оксиды и соли, содержащие их композиции и способы их применения для борьбы с нежелательной растительностью, в котором

R^1 представляет собой H, C_1-C_7 алкил, C_3-C_8 алкилкарбонилалкил, C_3-C_8

алкоксикарбонилалкил, C₄–C₇ алкилциклоалкил, C₃–C₇ алкенил, C₃–C₇ алкинил, C₃–C₇ циклоалкил, C₄–C₇ циклоалкилалкил, C₂–C₃ цианоалкил, C₁–C₄ нитроалкил, C₂–C₇ галогеналкоксиалкил, C₁–C₇ галогеналкил, C₃–C₇ галогеналкенил, C₂–C₇ алкоксиалкил, C₃–C₇ алкилтиоалкил, C₁–C₇ алкокси, бензил или фенил;

W представляет собой O;

A выбрано из A-1, A-4 и A-6;

L представляет собой прямую связь;

G представляет собой H, C(=O)R⁵, C(=S)R⁵, CO₂R⁶, C(=O)SR⁶, CONR⁷R⁸ или

P(=O)R⁹R¹⁰; или C₁–C₄ алкил, C₂–C₄ алкенил, C₂–C₄ алкинил, C₁–C₄ галогеналкил, C₂–C₄ галогеналкенил, C₂–C₄ галогеналкинил, C₂–C₄ алкоксиалкил, C₃–C₆ циклоалкил или C₄–C₇ циклоалкилалкил;

R² представляет собой H, галоген, циано, формил, C₁–C₇ алкил, C₃–C₈

алкилкарбонилалкил, C₃–C₈ алкоксикарбонилалкил, C₂–C₄ алкилкарбонил, C₂–C₇ алкилкарбонилокси, C₄–C₇ алкилциклоалкил, C₃–C₇ алкенил, C₃–C₇ алкинил, C₁–C₄ алкилсульфинил, C₁–C₄ алкилсульфонил, C₁–C₄ алкиламино, C₂–C₈ диалкиламино, C₃–C₇ циклоалкил, C₄–C₇ циклоалкилалкил, C₂–C₃ цианоалкил, C₁–C₄ нитроалкил, C₂–C₇ галогеналкоксиалкил, C₁–C₇ галогеналкил, C₃–C₇ галогеналкенил, C₂–C₇ алкоксиалкил, C₁–C₇ алкокси или C₁–C₅ алкилтио; и

каждый R³ независимо представляет собой H, галоген, C₁–C₃ алкил, C₃–C₄ циклоалкил, C₁–C₃ галогеналкил или C₁–C₃ алкокси.

Вариант осуществления В. Соединение по варианту осуществления А, в котором

R¹ представляет собой H, C₁–C₇ алкил, C₃–C₈ алкилкарбонилалкил, C₄–C₇

алкилциклоалкил, C₃–C₇ циклоалкил, C₄–C₇ циклоалкилалкил, C₂–C₃ цианоалкил, C₁–C₄ нитроалкил, C₂–C₇ галогеналкоксиалкил, C₁–C₇ галогеналкил, C₂–C₇ алкоксиалкил, C₃–C₇ алкилтиоалкил, C₁–C₇ алкокси или бензил;

A представляет собой A-1;

G представляет собой H, C(=O)R⁵, CO₂R⁶, CONR⁷R⁸ или P(=O)R⁹R¹⁰; или C₁–C₄ алкил,

C₂–C₄ алкенил, C₁–C₄ галогеналкил, C₂–C₄ галогеналкенил, C₂–C₄ алкоксиалкил, C₃–C₆ циклоалкил или C₄–C₇ циклоалкилалкил;

R² представляет собой H, галоген, циано, формил, C₁–C₇ алкил, C₂–C₄ алкилкарбонил,

C₂–C₇ алкилкарбонилокси, C₄–C₇ алкилциклоалкил, C₁–C₄ алкилсульфинил, C₁–C₄ алкилсульфонил, C₁–C₄ алкиламино, C₃–C₇ циклоалкил, C₄–C₇ циклоалкилалкил, C₂–C₃ цианоалкил, C₁–C₄ нитроалкил, C₂–C₇

галогеналкоксиалкил, C_1-C_7 галогеналкил, C_2-C_7 алкоксиалкил или C_1-C_7 алкокси; и

каждый R^3 независимо представляет собой H, галоген, C_1-C_2 алкил, циклопропил или C_1-C_2 галогеналкил.

Вариант осуществления С. Соединение по варианту осуществления В, в котором R^1 представляет собой C_1-C_4 алкил, C_3-C_4 циклоалкил, C_2-C_3 цианоалкил, C_1-C_3 галогеналкил или C_2-C_4 алкоксиалкил;

G представляет собой H, $C(=O)R^5$, CO_2R^6 или $P(=O)R^9R^{10}$; или C_1-C_4 алкил, C_1-C_4 галогеналкил, C_2-C_4 алкоксиалкил или C_3-C_6 циклоалкил;

R^2 представляет собой H, галоген, циано, C_1-C_4 алкил, C_3-C_5 циклоалкил, C_1-C_3 галогеналкил, C_2-C_4 алкоксиалкил или C_1-C_3 алкокси; и

каждый R^3 независимо представляет собой H, галоген, метил, этил или CF_3 .

Вариант осуществления D. Соединение по варианту осуществления С, в котором R^1 представляет собой метил, этил, *n*-пропил или 2-метоксиэтил;

G представляет собой H, $C(=O)R^5$ или CO_2R^6 ; или C_2-C_4 алкоксиалкил или C_3-C_6 циклоалкил;

R^2 представляет собой H, Cl, Br, I, $-CN$, метил или метокси; и

каждый R^3 независимо представляет собой H, F, Cl, Br или метил.

Конкретные варианты осуществления включают в себя соединения формулы 1, выбранные из группы, состоящей из:

4-(9-антраценил)-6-хлор-5-гидрокси-2-метил-3(2*H*)-пиридазинона (соединение 1);

6-хлор-4-(10-хлор-9-антраценил)-5-гидрокси-2-метил-3(2*H*)-пиридазинона (соединение 2); и

4-(10-бром-9-антраценил)-6-хлор-5-гидрокси-2-метил-3(2*H*)-пиридазинона (соединение 3).

Настоящее изобретение также относится к способу контроля роста нежелательной растительности, включающему в себя нанесение на участок растительности эффективного с точки зрения гербицидного действия количества соединений по изобретению (например, в виде композиции, описанной в настоящем документе). Заслуживают внимания варианты осуществления, относящиеся к способам применения, которые включают в себя соединения по вариантам осуществления, описанным выше. Соединения по изобретению особенно подходят для избирательной борьбы с сорняками в сельскохозяйственных культурах, таких как пшеница, ячмень, кукуруза, соя, подсолнечник, хлопок, масличный рапс и рис, а также в специализированных культурах, таких как сахарный тростник, цитрус, фрукты и орехоплодные культуры.

Также заслуживают внимания варианты осуществления, представляющие собой гербицидные композиции настоящего изобретения, содержащие соединения по вариантам осуществления, описанным выше.

Настоящее изобретение также включает в себя гербицидную смесь, содержащую (а) соединение, выбранное из формулы 1, его *N*-оксиды и соли, и (b) по меньшей мере один дополнительный активный ингредиент, выбранный из (b1) ингибиторов фотосистемы II, (b2) ингибиторов ацетогидрокси-ацидсинтазы (AHAS), (b3) ингибиторов ацетил-КоА-карбоксилазы (ACCase), (b4) миметиков ауксина, (b5) ингибиторов 5-енолпирувилшикимат-3-фосфат (EPSP) синтазы, (b6) диверторов электронов фотосистемы I, (b7) ингибиторов протопорфириногеноксидазы (PPO), (b8) ингибиторов глутаминсинтазы (GS), (b9) ингибиторов элонгазы жирных кислот с очень длинной цепью (VLCFA), (b10) ингибиторов транспорта ауксина, (b11) ингибиторов фитоендесатуразы (PDS), (b12) ингибиторов 4-гидроксифенилпируватдиоксигеназы (HPPD), (b13) ингибиторов гомогентизатсоленизилтрансферазы (HST), (b14) ингибиторов биосинтеза целлюлозы, (b15) других гербицидов, в том числе средств, прерывающих митоз, органических мышьяковистых соединений, азулама, бромбутида, цинметилина, кумилулона, дазомета, дифензоквата, димрона, этобензанида, флуренола, фосамина, фосамин-аммония, гидантоцидина, метама, метилдимрона, олеиновой кислоты, оксацикломефона, пеларгоновой кислоты и пирибутикарба, а также (b16) антидотов гербицидов; и солей соединений (b1)–(b16).

«Ингибиторы фотосистемы II» (b1) представляют собой химические соединения, которые связываются с белком D-1 в нише связывания Q_B и, следовательно, блокируют транспорт электронов от Q_A к Q_B в тилакоидных мембранах хлоропластов. Электроны, транспорт которых в фотосистеме II заблокирован, транспортируются посредством ряда реакций с образованием токсичных соединений, которые разрушают клеточные мембраны и вызывают набухание хлоропластов, просачивание через мембрану и, в конечном итоге, полное разрушение клетки. Ниша связывания Q_B имеет три разных сайта связывания: сайт связывания А связывает триазины, такие как атразин, триазины, такие как гексазинон, и урацилы, такие как бромацил, сайт связывания В связывает фенилмочевины, такие как диурон, а сайт связывания С связывает бензотиадиазолы, такие как бентазон, нитрилы, такие как бромксинил, и фенилпиридазины, такие как пиридат. Примеры ингибиторов фотосистемы II включают в себя аметрин, амикарбазон, атразин, бентазон, бромацил, бромфеноксим, бромксинил, хлорбромурон, хлоридазон, хлоротолурон, хлороксурон, кумилурон, цианазин, даимурон, десмедифам, десметрин, димефурон, диметаметрин, диурон, этидимурон, фенурон, флуометурон, гексазинон, иоксинил, изопротурон,

изоурон, ленацил, линурон, метамитрон, метабензтиазурон, метобромурон, метоксурон, метрибузин, монолинурон, небурон, пентанохлор, фенмедифам, прометон, прометрин, пропанил, пропазин, пиридафол, пиридат, сидурон, симазин, симетрин, тебутиурон, тербацил, тербуметон, тербутилазин, тербутрин и триэтазин.

«Ингибиторы АНАС» (b2) представляют собой химические соединения, которые ингибируют ацетогидрокси-ацидсинтазу (АНАС), также известную как ацетолактат-синтаза (ALS), и, следовательно, уничтожают растения посредством ингибирования продукции разветвленных алифатических аминокислот, таких как валин, лейцин и изолейцин, которые требуются для синтеза белков и роста клеток. Примеры ингибиторов АНАС включают в себя амидосульфурон, азимсульфурон, бенсульфурон-метил, биспирибак-натрий, клорансулам-метил, хлоримурон-этил, хлорсульфурон, циноссульфурон, циклосульфамурон, диклосулам, этаметсульфурон-метил, этоксисульфурон, флазасульфурон, флорасулам, флукарбазон-натрий, флуметсулам, флупирсульфурон-метил, флупирсульфурон-натрий, форамсульфурон, галосульфурон-метил, имазаметабенз-метил, имазамокс, имазапик, имазапир, имазапирин, имазеттапир, имазосульфурон, йодосульфурон-метил (в том числе натриевую соль), иофенсульфурон (2-йод-*N*-[[4-метокси-6-метил-1,3,5-триазин-2-ил)амино]карбонил]бензолсульфонамид), мезосульфурон-метил, метазосульфурон (3-хлор-4-(5,6-дигидро-5-метил-1,4,2-диоксазин-3-ил)-*N*-[[4,6-диметокси-2-пиримидинил)амино]карбонил]-1-метил-1*H*-пиразол-5-сульфонамид), метосулам, метсульфурон-метил, никосульфурон, оксасульфурон, пеноксиулам, примисульфурон-метил, пропоксикарбазон-натрий, пропирисульфурон (2-хлор-*N*-[[4,6-диметокси-2-пиримидинил)амино]карбонил]-6-пропилимидазо[1,2-*b*]пиридазин-3-сульфонамид), просульфурон, пиразосульфурон-этил, пирибензоксим, пирифталид, пириминобак-метил, пиритиобак-натрий, римсульфурон, сульфометурон-метил, сульфосульфурон, тиенкарбазон, тифенсульфурон-метил, триафамон (*N*-[2-[(4,6-диметокси-1,3,5-триазин-2-ил)карбонил]-6-фторфенил]-1,1-дифтор-*N*-метилметансульфонамид), триасульфурон, трибенурон-метил, трифлорисульфурон (в том числе натриевую соль), трифлусульфурон-метил и тритосульфурон.

«Ингибиторы АССазы» (b3) представляют собой химические соединения, которые ингибируют фермент ацетил-КоА-карбоксилазу, который отвечает за катализ на ранней стадии при синтезе липидов и жирных кислот в растениях. Липиды представляют собой основные компоненты клеточных мембран, и без них невозможна продукция новых клеток. Ингибирование ацетил-КоА-карбоксилазы и последующий дефицит продукции липидов приводит к потерям целостности клеточной мембраны, в особенности в областях активного роста, таких как меристемы. В конечном счете рост побегов и ризомы

прекращается, и меристемы побегов и почки на ризомах начинают отмирать. Примеры ингибиторов АССазы включают в себя аллоксидим, бутроксидим, клетодим, клодинафоп, циклоксидим, цигалофоп, диклофоп, феноксапроп, флуазифоп, галоксифоп, пиноксаден, профоксидим, пропаквизафоп, квизалофоп, сетоксидим, тепралоксидим и тралкоксидим, в том числе разделенные формы, такие как феноксапроп-Р, флуазифоп-Р, галоксифоп-Р и квизалофоп-Р, и сложноэфирные формы, такие как клодинафоп-пропаргил, цигалофоп-бутил, диклофоп-метил и феноксапроп-Р-этил.

Ауксин представляет собой растительный гормон, который регулирует рост многих растительных тканей. «Миметики ауксина» (b4) представляют собой химические соединения, имитирующие растительный гормон роста ауксин, таким образом вызывая неконтролируемый и неорганизованный рост, приводящий к гибели восприимчивых видов растений. Примеры миметиков ауксина включают в себя аминокислоты (6-амино-5-хлор-2-циклопропил-4-пиримидинкарбоновую кислоту) и его метиловые и этиловые сложные эфиры, а также его натриевые и калиевые соли, аминокислоты, бензозин-этил, хлорамбен, клацифос, кломепроп, клопиралид, дикамба, 2,4-D, 2,4-DB, дихлорпроп, флуороксирил, галауоксифен (4-амино-3-хлор-6-(4-хлор-2-фтор-3-метоксифенил)-2-пиридинкарбоновую кислоту), галауоксифен-метил (метил-4-амино-3-хлор-6-(4-хлор-2-фтор-3-метоксифенил)-2-пиридинкарбоксилат), МСРА, МСРВ, мекопроп, пиклорам, квинклолак, квинмерак, 2,3,6-ТВА, триклопир и метил-4-амино-3-хлор-6-(4-хлор-2-фтор-3-метоксифенил)-5-фтор-2-пиридинкарбоксилат.

«Ингибиторы EPSP-синтазы» (b5) представляют собой химические соединения, которые ингибируют фермент, 5-енолпирувилшикимат-3-фосфатсинтазу, которая участвует в синтезе ароматических аминокислот, таких как тирозин, триптофан и фенилаланин. Гербициды-ингибиторы EPSP легко абсорбируются листьями растений и переносятся по флоэме к точкам роста. Глифосат представляет собой относительно неселективный послевсходовый гербицид, который принадлежит к этой группе. Глифосат включает в себя сложные эфиры и соли, такие как аммониевая, изопропиламмониевая, калиевая, натриевая (в том числе полуторная соль натрия) и тримезиевая (альтернативно называемая сульфосатом).

«Диверторы электронов фотосистемы I» (b6) представляют собой химические соединения, которые принимают электроны от фотосистемы I и после нескольких циклов образуют гидроксильные радикалы. Эти радикалы являются чрезвычайно реакционноспособными и легко разрушают ненасыщенные липиды, включая мембранные жирные кислоты и хлорофилл. Это разрушает целостность клеточной мембраны, так что клетки и органеллы «протекают», что приводит к быстрому увяданию и обезвоживанию

листьев и в конечном итоге к гибели растения. Примеры этих ингибиторов фотосинтеза второго типа включают в себя дикват и паракват.

«Ингибиторы РРО» (b7) представляют собой химические соединения, которые ингибируют фермент протопорфириногеноксидазу, что быстро приводит к образованию в растениях чрезвычайно реакционноспособных соединений, которые разрушают клеточные мембраны, вызывая «утечку» жидкостей из клеток. Примеры ингибиторов РРО включают в себя ацифлуорфен-натрий, азафенидин, бензфендизон, бифенокс, бутафенацил, карфентразон, карфентразон-этил, хлометоксифен, цинидон-этил, флуазолат, флуфенпир-этил, флумиклорак-пентил, флумиоксазин, флуорогликофен-этил, флутиацет-метил, фомесафен, галосафен, лактофен, оксадиаргил, оксадиазон, оксифлуорфен, пентоксазон, профлуазол, пираклонил, пирафлуфен-этил, сафлуфенацил, сульфентразон, тидиазимин, трифлудимозаксин (дигидро-1,5-диметил-6-тиоксо-3-[2,2,7-трифтор-3,4-дигидро-3-оксо-4-(2-пропин-1-ил)-2*H*-1,4-бензоксазин-6-ил]-1,3,5-триазин-2,4(1*H*,3*H*)-дион) и тиафенацил (метил *N*-[2-[[2-хлор-5-[3,6-дигидро-3-метил-2,6-диоксо-4-(трифторметил)-1(2*H*)-пиримидинил]-4-фторфенил]тио]-1-оксопропил]-β-аланинат).

«Ингибиторы GS» (b8) представляют собой химические соединения, которые ингибируют активность фермента глутаминсинтетазы, который в растениях применяется для преобразования аммиака в глутамин. Следовательно, аммиак накапливается, а уровни глутамина снижаются. Повреждение растения, вероятно, происходит вследствие суммарных эффектов токсичности аммиака и дефицита аминокислот, необходимых для других метаболических процессов. Ингибиторы GS включают в себя глюфосинат и его сложные эфиры и соли, такие как глюфосинат-аммоний и другие производные фосфинотрицина, глюфосинат-Р ((2*S*)-2-амино-4-(гидроксиметилфосфинил)бутановую кислоту) и биланафос.

«Ингибиторы элонгазы VLCFA» (b9) представляют собой гербициды, содержащие широкое разнообразие химических структур, которые ингибируют элонгазу. Элонгаза представляет собой один из ферментов, расположенных в хлоропластах или рядом с ними, которые вовлечены в биосинтез кислот VLCFA. В растениях жирные кислоты с очень длинной цепью являются главными составляющими гидрофобных полимеров, которые предотвращают высыхание поверхности листьев и обеспечивают стабильность пыльцевых зерен. Такие гербициды включают в себя ацетохлор, алахлор, анилофос, бутахлор, кафенстрол, диметаклор, диметенамид, дифенамид, феноксасульфен (3-[[[(2,5-дихлор-4-этоксифенил)метил]сульфонил]-4,5-дигидро-5,5-диметилизоксазол), фентразамид, флуфенацет, инданофан, мефенацет, метазахлор, метолахлор, напроанилид, напропамид, напропамид-М ((2*R*)-*N,N*-диэтил-2-(1-нафталенилокси) пропанамид), петоксамид,

пиперофос, претилахлор, пропахлор, пропизохлор, пироксасульфен и тенилхлор, в том числе разделенные формы, такие как S-метолахлор, и хлорацетамиды, и оксиацетамиды.

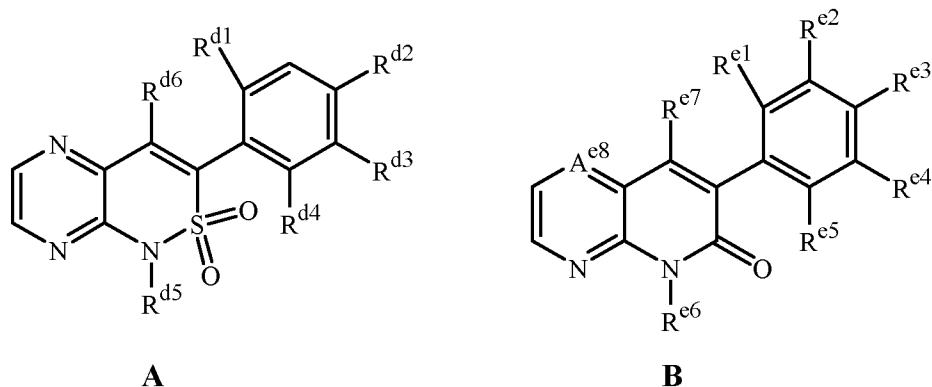
«Ингибиторы транспорта ауксина» (b10) представляют собой химические вещества, которые ингибируют транспорт ауксина в растениях, например путем связывания с белком, осуществляющим транспорт ауксина. Примеры ингибиторов транспорта ауксина включают в себя дифлуфензопир, напалам (также известный как *N*-(1-нафтил)-фталамовая кислота и 2-[(1-нафталениламино)карбонил]бензойная кислота).

«Ингибиторы PDS» (b11) представляют собой химические соединения, ингибирующие путь биосинтеза каротиноида на стадии фитоен-десатуразы. Примеры ингибиторов PDS включают в себя бифлутамид, дифлуфеникан, флуридон, флуорохлоридон, флуртамон норфлурзон и пиколинафен.

«Ингибиторы HPPD» (b12) представляют собой химические вещества, которые ингибируют биосинтез при синтезе 4-гидроксибензилпироватдиоксигеназы. Примеры ингибиторов HPPD включают в себя бензобиклон, бензофенап, бициклопирон (4-гидрокси-3-[[2-[(2-метоксиэтокси)метил]-6-(трифторметил)-3-пиридинил]карбонил]бицикло[3.2.1]окт-3-ен-2-он), фенхинотрион (2-[[8-хлор-3,4-дигидро-4-(4-метоксифенил)-3-оксо-2-хиноксалинил]карбонил]-1,3-циклогександион), изоксахлортол, изоксафлутол, мезотрион, пирасульфотол, пиразолинат, пиразоксифен, сулькотрион, тефурилтрион, темботрион, толпиралат (1-[[1-этил-4-[3-(2-метоксиэтокси)-2-метил-4-(метилсульфонил)бензоил]-1H-пиразол-5-ил]окси]этилметилкарбонат), топрамезон, 5-хлор-3-[(2-гидрокси-6-оксо-1-циклогексен-1-ил)карбонил]-1-(4-метоксифенил)-2(1*H*)-хиноксалинон, 4-(2,6-диэтил-4-метилфенил)-5-гидрокси-2,6-диметил-3(2*H*)-пиридазинон, 4-(4-фторфенил)-6-[(2-гидрокси-6-оксо-1-циклогексен-1-ил)карбонил]-2-метил-1,2,4-триазин-3,5(2*H*,4*H*)-дион, 5-[(2-гидрокси-6-оксо-1-циклогексен-1-ил)карбонил]-2-(3-метоксифенил)-3-(3-метоксипропил)-4(3*H*)-пиримидинон, 2-метил-*N*-(4-метил-1,2,5-оксадиазол-3-ил)-3-(метилсульфинил)-4-(трифторметил)бензамид и 2-метил-3-(метилсульфонил)-*N*-(1-метил-1*H*-тетразол-5-ил)-4-(трифторметил)бензамид.

«Ингибиторы HST» (b13) нарушают способность растения к преобразованию гомогентизата в 2-метил-6-соланил-1,4-бензохинон, таким образом нарушая биосинтез каротиноидов. Примеры ингибиторов HST включают в себя циклопириморат (6-хлор-3-(2-циклопропил-6-метилфенокси)-4-пиридазинил-4-морфолинкарбоксилат), галоксидин, пирихлор, 3-(2-хлор-3,6-дифторфенил)-4-гидрокси-1-метил-1,5-нафтиридин-2(1*H*)-он, 7-(3,5-дихлор-4-пиридинил)-5-(2,2-дифторэтил)-8-гидроксипиридо[2,3-*b*]пиразин-6(5*H*)-он и 4-(2,6-диэтил-4-метилфенил)-5-гидрокси-2,6-диметил-3(2*H*)-пиридазинон.

Ингибиторы HST также включают в себя соединения формул **A** и **B**



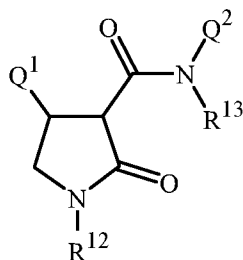
где R^{d1} представляет собой H, Cl или CF_3 ; R^{d2} представляет собой H, Cl или Br; R^{d3} представляет собой H или Cl; R^{d4} представляет собой H, Cl или CF_3 ; R^{d5} представляет собой CH_3 , CH_2CH_3 или CH_2CHF_2 ; и R^{d6} представляет собой OH или $-OC(=O)-i-Pr$; и R^{e1} представляет собой H, F, Cl, CH_3 или CH_2CH_3 ; R^{e2} представляет собой H или CF_3 ; R^{e3} представляет собой H, CH_3 или CH_2CH_3 ; R^{e4} представляет собой H, F или Br; R^{e5} представляет собой Cl, CH_3 , CF_3 , OCF_3 или CH_2CH_3 ; R^{e6} представляет собой H, CH_3 , CH_2CHF_2 или $C\equiv CH$; R^{e7} представляет собой OH, $-OC(=O)Et$, $-OC(=O)-i-Pr$ или $-OC(=O)-t-Bu$; и A^{e8} представляет собой N или CH.

«Ингибиторы биосинтеза целлюлозы» (b14) ингибируют биосинтез целлюлозы в определенных растениях. Они наиболее эффективны, когда используется предварительное нанесение или нанесение непосредственно после прорастания на молодые или быстрорастущие растения. Примеры ингибиторов биосинтеза целлюлозы включают в себя хлортиамид, дихлобенил, флупоксам, индазифлам (N^2 -[(1*R*,2*S*)-2,3-дигидро-2,6-диметил-1*H*-инден-1-ил]-6-(1-фторэтил)-1,3,5-триазин-2,4-диамин), изоксабен и триазилам.

«Другие гербициды» (b15) включают в себя гербициды, которые действуют посредством множества разных механизмов действия, как, например средства, прерывающие митоз (например, флампроп-М-метил и флампроп-М-изопропил), органические мышьяковистые соединения (например, DSMA и MSMA), ингибиторы 7,8-дигидроптероатсинтазы, ингибиторы синтеза изопреноидов в хлоропластах и ингибиторы биосинтеза клеточной стенки. Другие гербициды включают в себя такие гербициды, которые имеют неизвестные механизмы действия или не подпадают под какую-либо из категорий, перечисленных в (b1)–(b14), или которые действуют посредством комбинации вышеперечисленных механизмов действия. Примеры других гербицидов включают в себя аклонифен, асулам, амитрол, бромобутид, цинметилин, кломазон, кумилурон, даимурон, дифензокват, этобензанид, флуометурон, флуренол, фосамин, фосамин-аммоний, дазомет, димрон, ипфенкарбазон (1-(2,4-дихлорфенил)-*N*-(2,4-дифторфенил)-1,5-дигидро-*N*-(1-

метилэтил)-5-оксо-4*H*-1,2,4-триазол-4-карбоксамид), метам, метилдимрон, олеиновую кислоту, оксазикломефон, пеларгоновую кислоту, пирибутикарб и 5-[[[(2,6-дифторфенил)метокси]метил]-4,5-дигидро-5-метил-3-(3-метил-2-тиенил)изоксазол.

«Другие гербициды» (b15) также включают в себя соединение формулы (b15A)



(b15A)

где

R^{12} представляет собой H, C_1 – C_6 алкил, C_1 – C_6 галогеналкил или C_4 – C_8 циклоалкил;

R^{13} представляет собой C_1 – C_6 алкил или C_1 – C_6 алкокси;

Q^1 представляет собой необязательно замещенную кольцевую систему, выбранную из группы, состоящей из фенила, тиенила, пиридинила, бензодиоксила, нафтила, нафталенила, бензофуранила, фуранила, бензотиофенила и пиразолила, причем при замещении указанная кольцевая система содержит 1–3 R^{14} ;

Q^2 представляет собой необязательно замещенную кольцевую систему, выбранную из группы, состоящей из фенила, пиридинила, бензодиоксила, пиридинила, тиадиазолила, тиазолила и оксазолила, причем при замещении указанная кольцевая система замещается 1–3 R^{15} ;

каждый R^{14} независимо представляет собой галоген, C_1 – C_6 алкил, C_1 – C_6 галогеналкил, C_1 – C_6 алкокси, C_1 – C_6 галогеналкокси, C_3 – C_8 циклоалкил, циано, C_1 – C_6 алкилтио, C_1 – C_6 алкилсульфинил, C_1 – C_6 алкилсульфонил, SF_5 , NHR^{17} ; или фенил, необязательно замещенный 1–3 R^{16} ; или пиразолил, необязательно замещенный 1–3 R^{16} ;

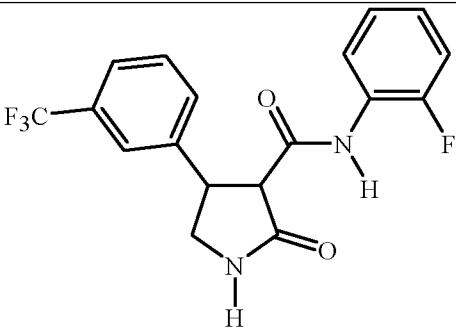
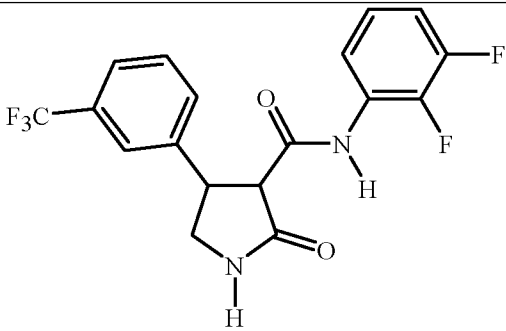
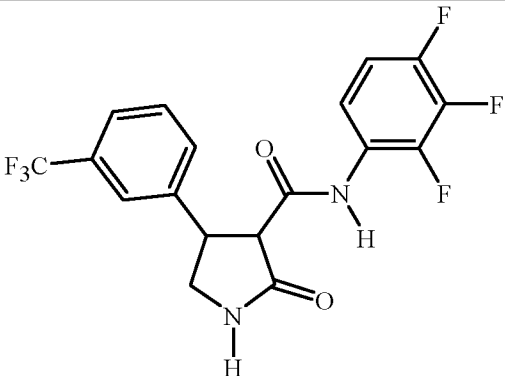
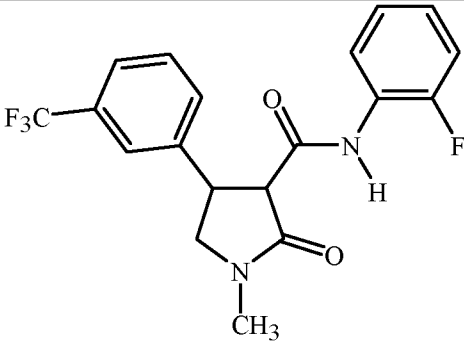
каждый R^{15} независимо представляет собой галоген, C_1 – C_6 алкил, C_1 – C_6 галогеналкил, C_1 – C_6 алкокси, C_1 – C_6 галогеналкокси, циано, нитро, C_1 – C_6 алкилтио, C_1 – C_6 алкилсульфинил, C_1 – C_6 алкилсульфонил;

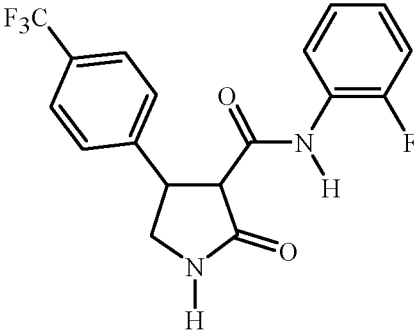
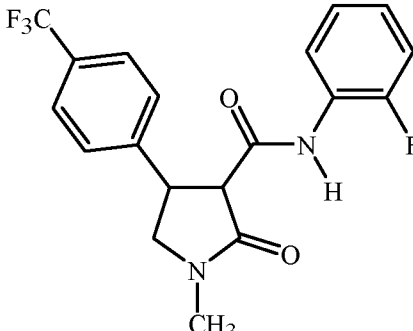
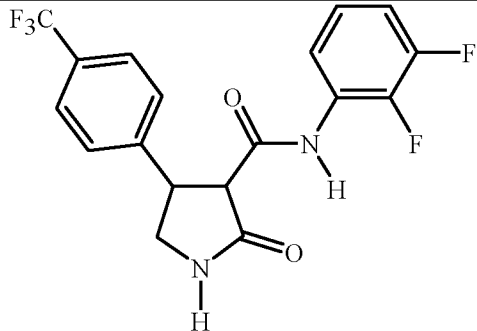
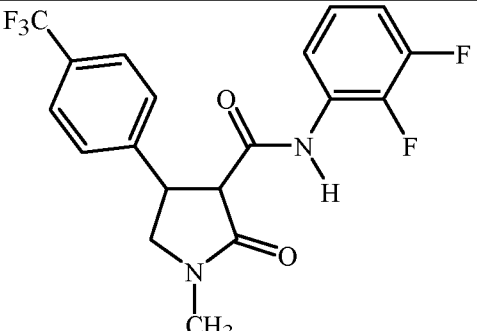
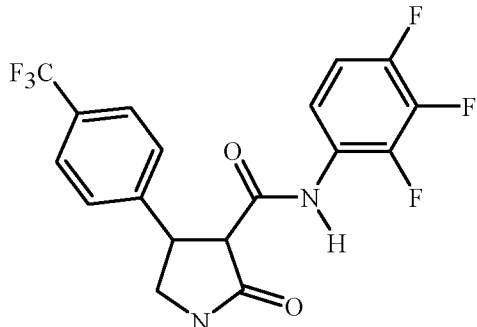
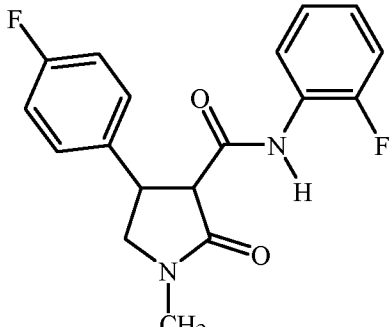
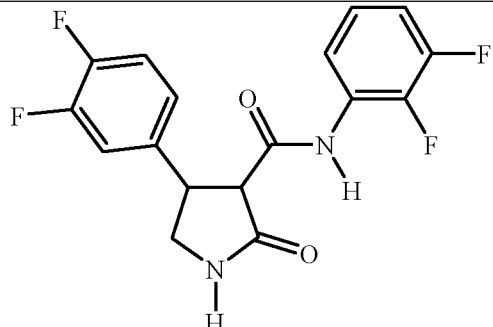
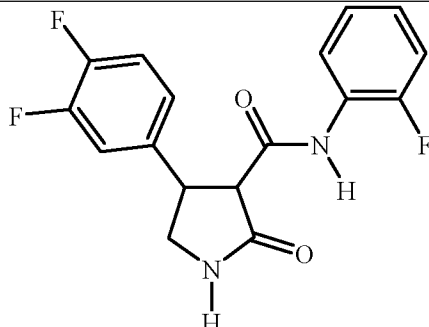
каждый R^{16} независимо представляет собой галоген, C_1 – C_6 алкил или C_1 – C_6 галогеналкил;

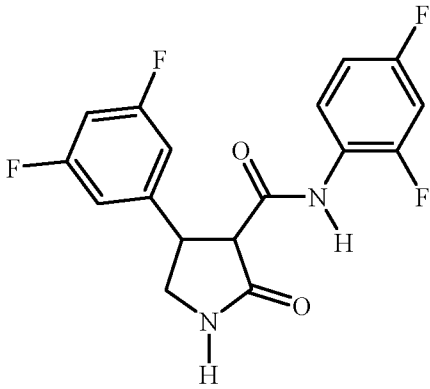
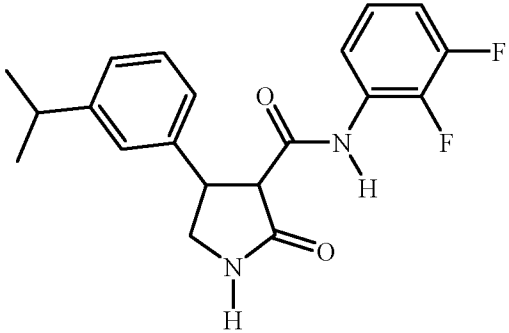
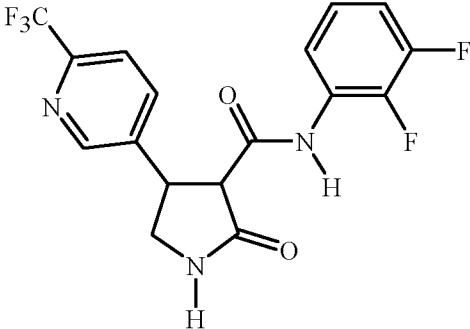
R^{17} представляет собой C_1 – C_4 алкоксикарбонил.

В одном варианте осуществления, в котором «другие гербициды» (b15) также включают в себя соединение формулы (b15A), предпочтительно R^{12} представляет собой H или C_1 – C_6

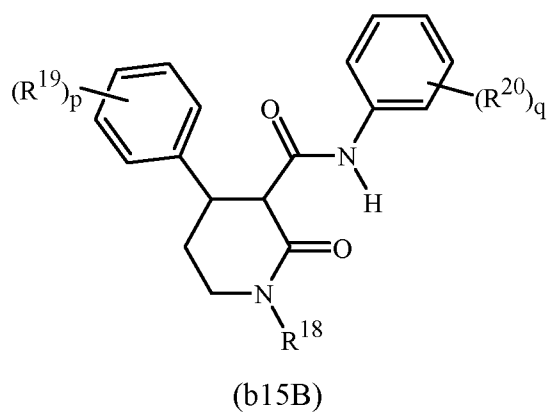
алкил; более предпочтительно R^{12} представляет собой H или метил. Предпочтительно R^{13} представляет собой H. Предпочтительно Q^1 представляет собой либо фенильное кольцо, либо пиридиныльное кольцо, причем каждое кольцо замещено 1–3 R^{14} ; более предпочтительно Q^1 представляет собой фенильное кольцо, замещенное 1–2 R^{14} . Предпочтительно Q^2 представляет собой фенильное кольцо, замещенное 1–3 R^{15} ; более предпочтительно Q^2 представляет собой фенильное кольцо, замещенное 1–2 R^{15} . Предпочтительно каждый R^{14} независимо представляет собой галоген, C_1 – C_4 алкил, C_1 – C_3 галогеналкил, C_1 – C_3 алкокси или C_1 – C_3 галогеналкокси; более предпочтительно каждый R^{14} независимо представляет собой хлор, фтор, бром, C_1 – C_2 галогеналкил, C_1 – C_2 галогеналкокси или C_1 – C_2 алкокси. Предпочтительно каждый R^{15} независимо представляет собой галоген, C_1 – C_4 алкил, C_1 – C_3 галогеналкокси; более предпочтительно каждый R^{15} независимо представляет собой хлор, фтор, бром, C_1 – C_2 галогеналкил, C_1 – C_2 галогеналкокси или C_1 – C_2 алкокси. Особенно предпочтительно в качестве «других гербицидов» (b15) любое одно из следующих соединений (b15A-1)–(b15A-15).

	
(b15A-1)	(b15A-2)
	
(b15A-3)	(b15A-4)

	
(b15A-5)	(b15A-6)
	
(b15A-7)	(b15A-8)
	
(b15A-9)	(b15A-10)
	
(b15A-11)	(b15A-12)

	
(b15A-13)	(b15A-14)
	
(b15A-15)	

«Другие гербициды» (b15) также включают в себя соединение формулы (b15B)



где

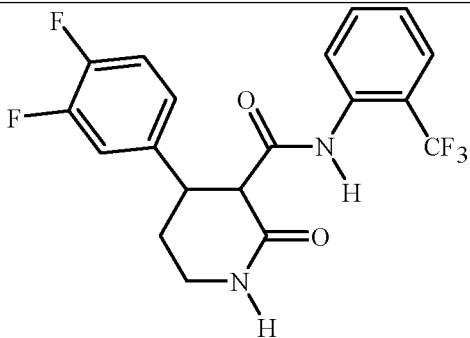
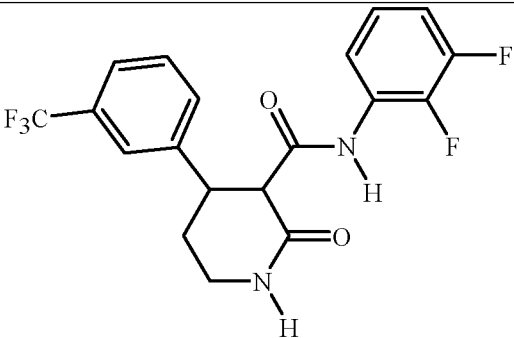
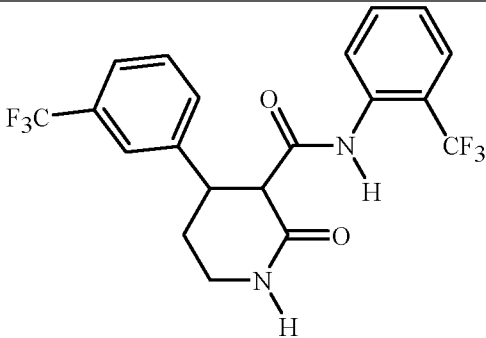
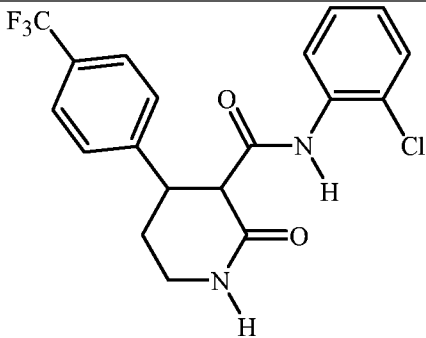
R^{18} представляет собой H, C_1 – C_6 алкил, C_1 – C_6 галогеналкил или C_4 – C_8 циклоалкил;
каждый R^{19} независимо представляет собой галоген, C_1 – C_6 галогеналкил или C_1 – C_6
галогеналкокси;

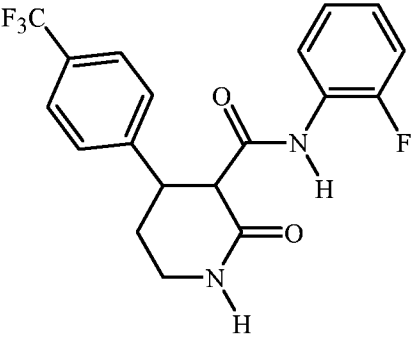
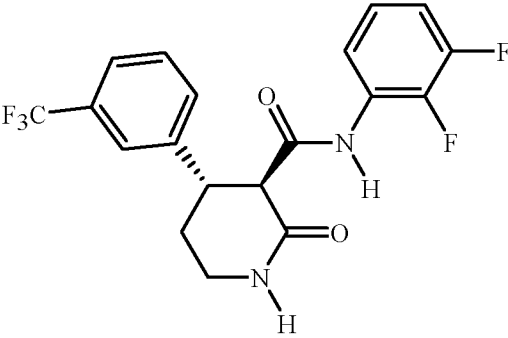
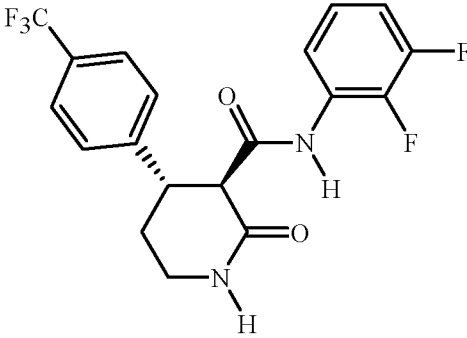
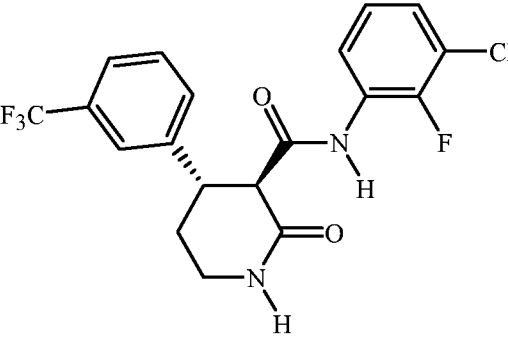
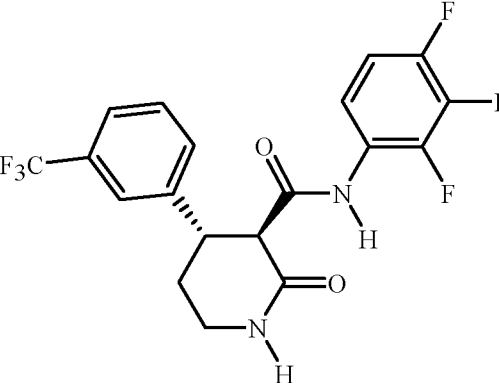
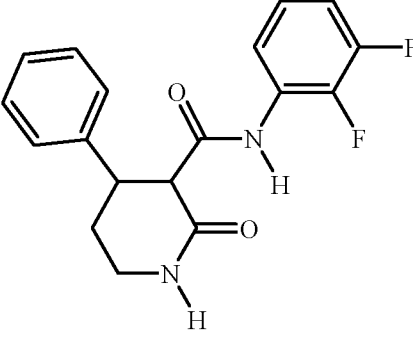
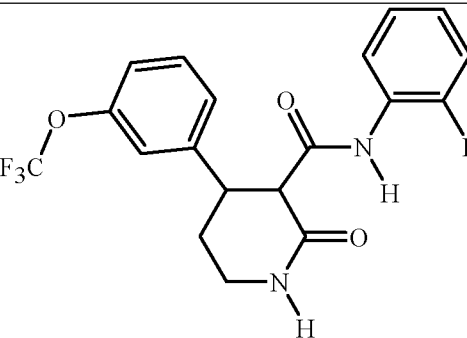
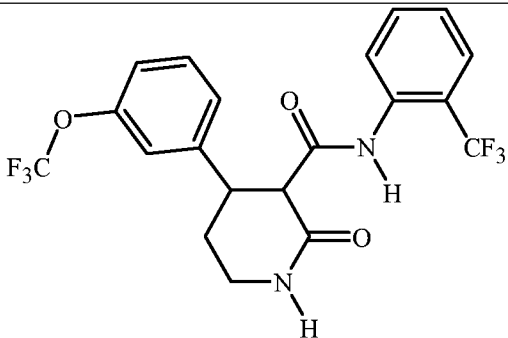
p представляет собой целое число из 0, 1, 2 или 3;

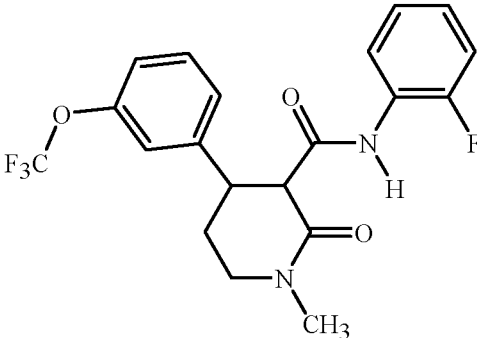
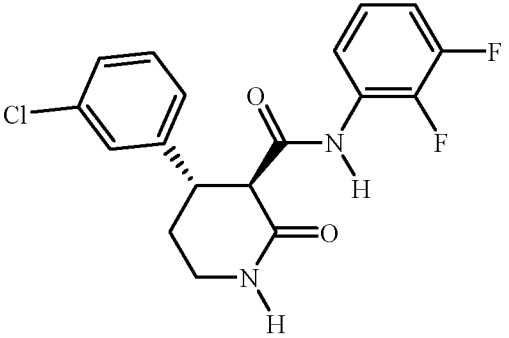
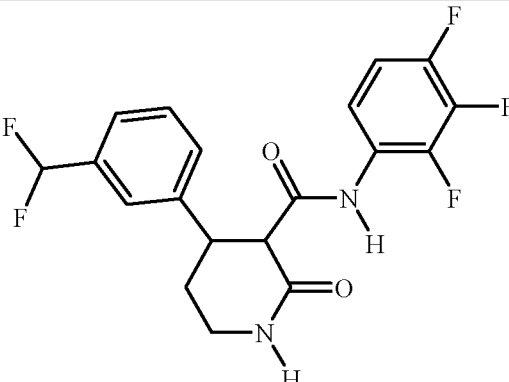
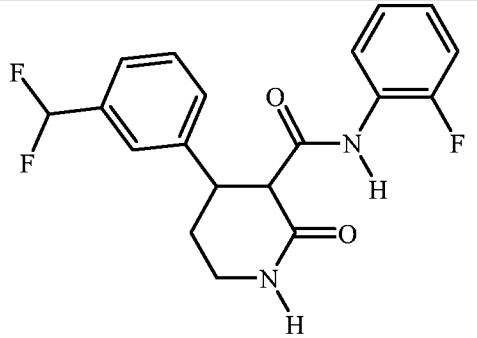
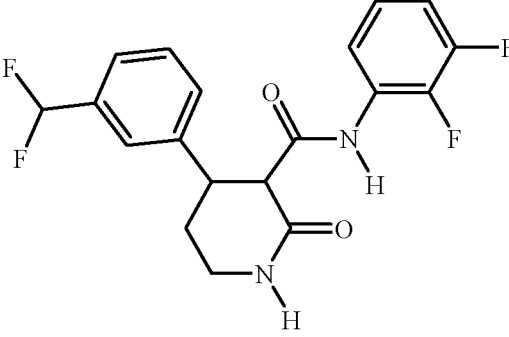
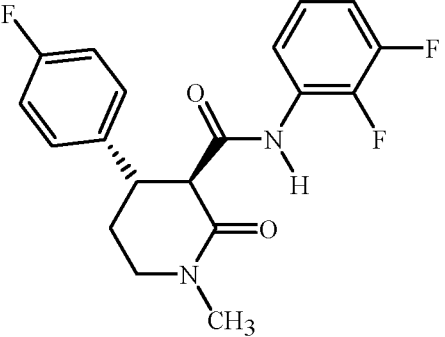
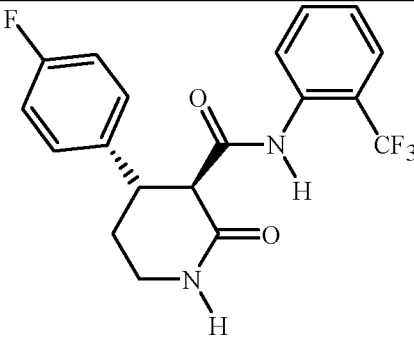
каждый R^{20} независимо представляет собой галоген, C_1 – C_6 галогеналкил или C_1 – C_6
галогеналкокси; и

q представляет собой целое число из 0, 1, 2 или 3.

В одном варианте осуществления, в котором «другие гербициды» (b15) также включают в себя соединение формулы (b15B), предпочтительно R^{18} представляет собой H, метил, этил или пропил; более предпочтительно R^{18} представляет собой H или метил; наиболее предпочтительно R^{18} представляет собой H. Предпочтительно каждый R^{19} независимо представляет собой хлор, фтор, C_1 – C_3 галогеналкил или C_1 – C_3 галогеналкокси; более предпочтительно каждый R^{19} независимо представляет собой хлор, фтор, C_1 фторалкил (т. е. фторметил, дифторметил или трифторметил) или C_1 фторалкокси (т. е. трифторметокси, дифторметокси или фторметокси). Предпочтительно каждый R^{20} независимо представляет собой хлор, фтор, C_1 галогеналкил или C_1 галогеналкокси; более предпочтительно каждый R^{20} независимо представляет собой хлор, фтор, C_1 фторалкил (т. е. фторметил, дифторметил или трифторметил) или C_1 фторалкокси (т. е. трифторметокси, дифторметокси или фторметокси). Особенно предпочтительно в качестве «других гербицидов» (b15) любое одно из следующих соединений (b15B-1)–(b15B-19).

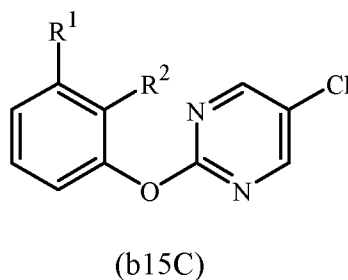
	
(b15B-1)	(b15B-2)
	
(b15B-3)	(b15B-4)

	
(b15B-5)	(b15B-6)
	
(b15B-7)	(b15B-8)
	
(b15B-9)	(b15B-10)
	
(b15B-11)	(b15B-12)

	
(b15B-13)	(b15B-14)
	
(b15B-15)	(b15B-16)
	
(b15B-17)	(b15B-18)
	
(b15B-19)	

«Антидоты гербицидов» (b16) представляют собой вещества, добавляемые к составу гербицида для устранения или снижения фитотоксических эффектов гербицида на определенные сельскохозяйственные культуры. Эти соединения защищают сельскохозяйственные культуры от травмы с помощью гербицидов, но, как правило, не мешают гербициду бороться с нежелательной растительностью. Примеры антидотов гербицидов включают в себя, без ограничений, беноксакор, клоквинтоцет-мексил, кумилурон, циометринил, ципросульфамид, даимурон, дихлормид, дициклонон, диэтолат, димепиперат, фенхлоразол-этил, фенклорим, флуразол, флуксофеним, фурилазол, изоксацифен-этил, мефенпир-диэтил, мефенат, метоксифенон, нафталиновый ангидрид, оксабетринил, *N*-(аминокарбонил)-2-метилбензолсульфонамид и *N*-(аминокарбонил)-2-фторбензолсульфонамид, 1-бром-4-[(хлорметил)сульфонил]бензол, 2-(дихлорметил)-2-метил-1,3-диоксолан (MG 191), 4-(дихлорацетил)-1-окса-4-азоспиро[4.5]декан (MON 4660), 2,2-дихлор-1-(2,2,5-триметил-3-оксазолидинил)-этанон и 2-метокси-*N*-[[4-[(метиламино)карбонил]амино]фенил]сульфонил]-бензамид.

Другой вариант осуществления, в котором «другие гербициды» (b15) также включают в себя соединение формулы (b15C)



где R^1 представляет собой Cl, Br или CN; а R^2 представляет собой $C(=O)CH_2CH_2CF_3$, $CH_2CH_2CH_2CH_2CF_3$ или 3- CHF_2 -изоксазол-5-ил.

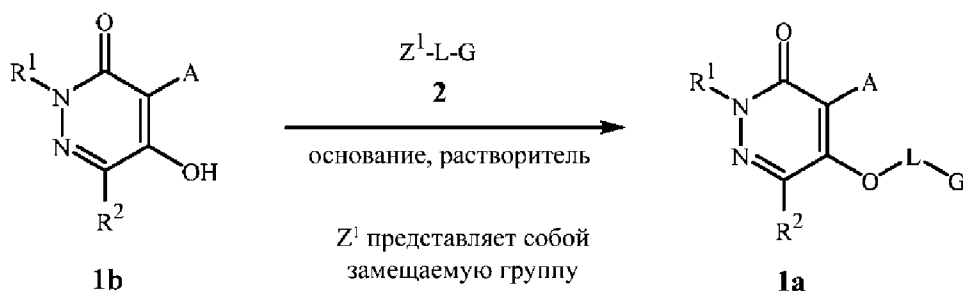
Предпочтительными для более эффективной борьбы с нежелательной растительностью (например, меньшая частота применения, например, за счет усиливающих аддитивных эффектов, более широкий спектр сорняков, борьба с которыми проводится, или повышенная безопасность сельскохозяйственной культуры) или для предотвращения развития резистентных сорняков являются смеси соединения по настоящему изобретению с гербицидом, выбранным из группы, состоящей из атразина, азимсульфурана, бифлубутамида, *S*-бифлубутамида, бензизотиазолинона, карфентразон-этила, хлоримурон-этила, хлорсульфурон-метила, кломазона, клопиралида калия, клорансулам-метила, 2-[(2,4-дихлорфенил)метил]-4,4-диметилизоксазолидинона, 2-[(2,5-дихлорфенил)метил]-4,4-диметилизоксазолидинона, этаметсульфурон-метила, флуметсулама, 4-(4-фторфенил)-6-[(2-гидрокси-6-оксо-1-циклогексен-1-ил)карбонил]-2-

метил-1,2,4-триазин-3,5-(2*H*,4*H*)-диона, флупирсульфурон-метила, флутиацет-метила, фомесафена, имазетапира, ленацила, мезотриона, метрибузина, метсульфурон-метила, петоксамида, пиклорама, пироксасульфона, квинклорака, римсульфурана, *S*-метолахлора, сульфентразона, трифенсульфурон-метила, трифлусульфурон-метила и трибенурон-метила.

Для получения соединений формулы **1** можно применять один или более из следующих способов и вариаций, описанных в схемах 1–16. Если не указано иное, группы R^1 , R^2 , W, A, L и G в соединениях формул **1–29** определены как указано выше в разделе «Изложение сущности изобретения», Формулы **1a**, **1b** и **1c** представляют собой подмножества соединений формулы **1**, и все заместители для формул **1a**, **1b** и **1c** определены как указано выше для формулы **1**, если не указано иное.

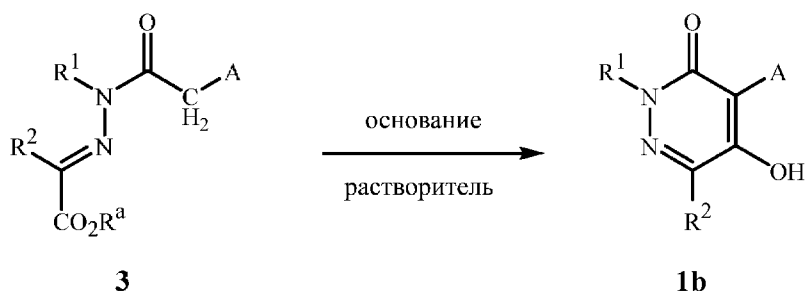
Как показано на схеме 1, пиридазины формулы **1a** (подмножество соединений формулы **1**, где W представляет собой O, а L и G определены так, как определено выше, но L отличается от прямой связи, а G отличается от водорода) можно получить в результате реакции замещенных 5-гидрокси-3(2*H*)-пиридазинов формулы **1b** (т. е. формулы **1**, в которой W представляет собой O, L представляет собой прямую связь, а G представляет собой H) с приемлемым электрофильным реагентом формулы **2** (т. е. Z^1 -L-G, где Z^1 представляет собой замещаемую группу, также называемую нуклеофугом, такую как галоген) в присутствии основания в соответствующем растворителе. Некоторые примеры классов реагентов, представляющих формулу **2**, где Z^1 представляет собой Cl, а L представляет собой прямую связь, включают в себя хлорангидриды (G представляет собой $-(C=O)R^5$), хлорформиаты (G представляет собой $-CO_2R^6$), карбамоилхлориды (G представляет собой $-CONR^7R^8$), сульфонилхлориды (G представляет собой $-S(O)_2R^5$) и хлорсульфонамиды (G представляет собой $-S(O)_2NR^7R^8$). Примеры приемлемых оснований для этой реакции включают в себя, без ограничений, карбонат калия, гидроксид натрия, гидроксид калия, гидрид натрия или трет-бутоксид калия и в зависимости от конкретного применяемого основания соответствующие растворители могут быть протонными или апротонными и могут применяться безводными или в виде водных смесей. Предпочтительными растворителями для данной реакции являются ацетонитрил, метанол, этанол, тетрагидрофуран, диэтиловый эфир, 1,2-диметоксиэтан, диоксан, дихлорметан или *N,N*-диметилформамид. Реакцию можно проводить в диапазоне температур, как правило, в диапазоне от 0°C до температуры кипения растворителя.

Схема 1



Замещенные 5-гидрокси-3(2*H*)-пиридазины формулы **1b** можно получить так, как показано на схеме 2, посредством циклизации сложных эфиров гидразида формулы **3** (где R^a представляет собой алкил, обычно метил или этил) в присутствии основания и растворителя. Приемлемые основания для данной реакции включают в себя, без ограничений, карбонат калия, гидроксид натрия, гидроксид калия, гидрид натрия, трет-бутоксид калия или 1,8-диазацикло-[5.4.0]ундец-7-ен. В зависимости от применяемого конкретного основания соответствующие растворители могут быть протонными или апротонными и могут применяться безводными или в виде водных смесей. Растворители для такой циклизации включают в себя ацетонитрил, метанол, этанол, тетрагидрофуран, диэтиловый эфир, диоксан, 1,2-диметоксиэтан, дихлорметан или *N,N*-диметилформамид. Температуры для такой циклизации по существу находятся в диапазоне от 0 °C до температуры кипения растворителя. Известные способы циклизации промежуточных соединений сложного эфира гидразида формулы $\text{CH}_3(\text{CO}_2\text{C}_2\text{H}_5)\text{C}=\text{NNCH}_3\text{C}(=\text{O})\text{CH}_2\text{Ar}$ (где Ar представляет собой замещенный фенил вместо бициклической кольцевой системы, показанной в формуле **3**) в соответствующие 4-арил-5-гидроксипиридазины описаны в патентах США № 8,541,414 и 8,470,738. Те же условия, которые указаны в данных патентах, применимы и к циклизации сложных эфиров гидразона формулы **3** в пиридазины формулы **1b**.

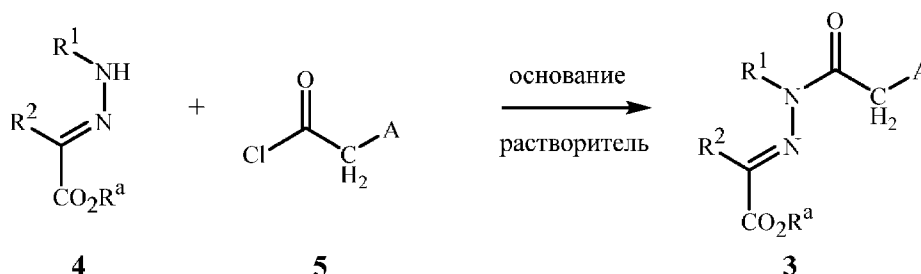
Схема 2



Замещенные сложные эфиры гидразида формулы **3** могут быть получены так, как показано на схеме 3, посредством соединения сложного эфира гидразона формулы 4 (где R^a представляет собой алкил, обычно метил или этил) с хлорангидридом формулы **5** в присутствии основания и растворителя. Предпочтительными основаниями для этой

реакции обычно являются третичные амины, такие как триэтиламин или основание Хунига, но также можно применять и другие основания, включая *N,N*-диметиламинопиридин, карбонат калия, гидроксид натрия, гидроксид калия, гидрид натрия или трет-бутоксид калия. В зависимости от применяемого конкретного основания соответствующие растворители могут быть протонными или апротонными, если реакция протекает в безводных условиях или в водных смесях в условиях Шоттена — Баумана. Растворители, применяемые для этого ацилирования по азоту, включают в себя ацетонитрил, тетрагидрофуран, диэтиловый эфир, диоксан, толуол, 1,2-диметоксиэтан, дихлорметан или *N,N*-диметилформамид. Температуры для этой реакции могут находиться в диапазоне от 0 °С до температуры кипения растворителя с обратным холодильником. Способы получения промежуточных соединений сложного эфира гидразида формулы $\text{CH}_3(\text{CO}_2\text{C}_2\text{H}_5)\text{C}=\text{NNCH}_3\text{C}(=\text{O})\text{Ar}$ (где Ar представляет собой замещенный фенил) были опубликованы в патентной литературе, см. патенты США № 8,541,414 и 8,470,738, и в опубликованной заявке на патент США 2010/0267561. Процедуры, описанные в этих патентных публикациях, непосредственно применимы к получению промежуточных продуктов, пригодных для получения настоящих соединений, как показано на схеме 3.

Схема 3

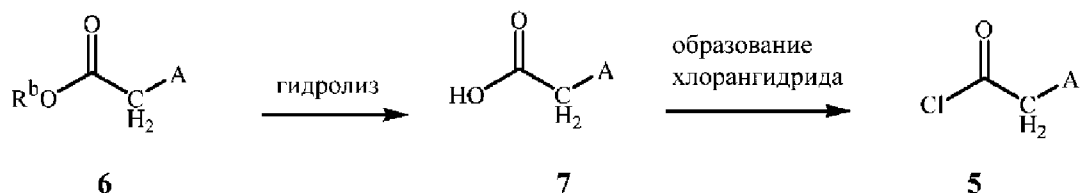


Сложные эфиры гидразона формулы 4 можно легко получать в результате реакции соответствующим образом замещенного гидразина формулы R^1NHNH_2 со сложным эфиром кетона или альдегида формулы $\text{R}^2(\text{C}=\text{O})\text{CO}_2\text{R}^a$ (где R^a обычно представляет собой метил или этил) в приемлемом растворителе, таком как этанол, метанол, ацетонитрил или диоксан или дихлорметан при температурах, по существу в диапазоне от 0 до 80 °С. В опубликованных патентных заявках 2007/0112038 и 2005/0256123 описаны процедуры формирования гидразона из метилгидразина и сложного эфира кетона $\text{CH}_3(\text{C}=\text{O})\text{CO}_2\text{C}_2\text{H}_5$.

Как показано на схеме 4, ацетилхлориды формулы 5 можно получить из соответствующих сложных эфиров уксусной кислоты формулы 6, где R^b обычно представляет собой метил или этил, посредством гидролиза сложного эфира и образования хлорангидрида. Стандартные способы такого преобразования известны в литературе. Например, гидролиз сложного эфира может быть осуществлен посредством

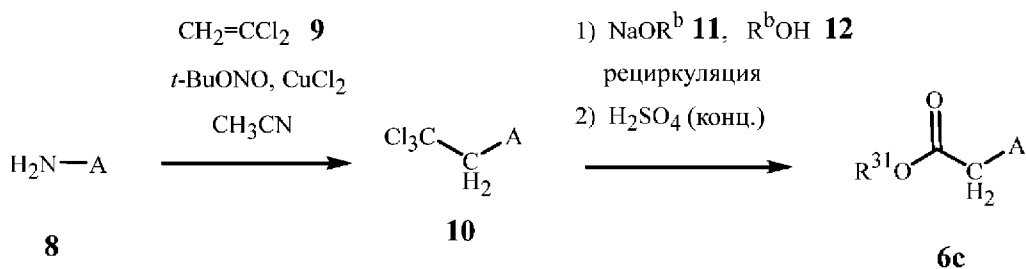
нагревания спиртового раствора сложного эфира формулы **6** с водным раствором гидроксида щелочного металла с последующим подкислением неорганической кислотой. Затем образованную карбоновую кислоту формулы **7** можно преобразовать в соответствующий ацилхлорид формулы **5** посредством обработки оксалилхлоридом и каталитическим количеством *N,N*-диметилформамида в инертном растворителе, таком как дихлорметан. В публикации *J. Heterocyclic Chem.* **1983**, 20 (6), 1697–1703. *J. Med. Chem.* **2007**, 50 (1), 40–64; и патентных публикациях PCT WO 2005/012291, WO 98/49141 и WO 98/49158 представлено описание гидролиза сложных эфиров бензофуран- и бензотиофенуксусных кислот в соответствующие уксусные кислоты. В публикации *Monatshefte für Chemie* **1968**, 99(2) 715–720 и патентных публикациях WO 2004046122, WO 2009/038974 и JP09077767 описано преобразование бензофуран- и бензотиофенуксусных кислот в соответствующие хлорангидриды.

Схема 4



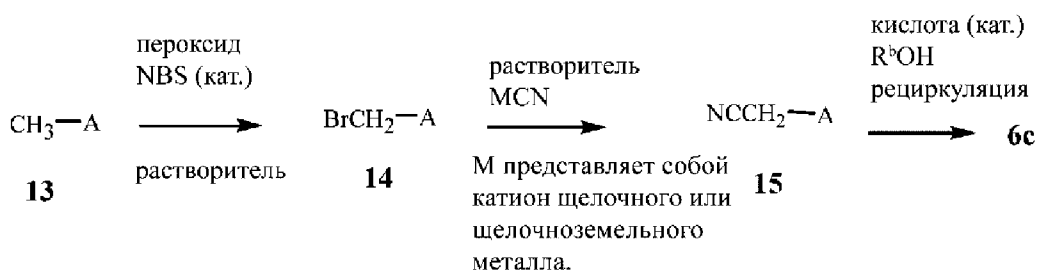
Как показано на схеме 5, производные гетероарилуксусной кислоты формулы **6с** можно получить из соответствующим образом замещенных гетероариламинов формулы **8**. В соответствии с этим способом амины формулы **8** подвергают диазотированию (предпочтительно трет-бутилнитритом в присутствии хлорида меди в ацетонитриле) в присутствии 1,1-дихлорэтена (**9**) с получением соответствующего трихлорэтилгетероцикла формулы **10**. Затем трихлорэтилгетероцикл формулы **10** нагревают с соответствующим алкоксидом щелочного или щелочноземельного металла, таким как алкоксид натрия формулы **11**, в приемлемом растворителе, таком как спирт формулы **12**, с последующим подкислением, например концентрированной серной кислотой, для получения гетероциклических сложных эфиров уксусной кислоты формулы **6с**. Этот способ описан в публикации *Pest. Manag. Sci.* **2011**, 67, 1499–1521 и патенте США № 5,376,677.

Схема 5



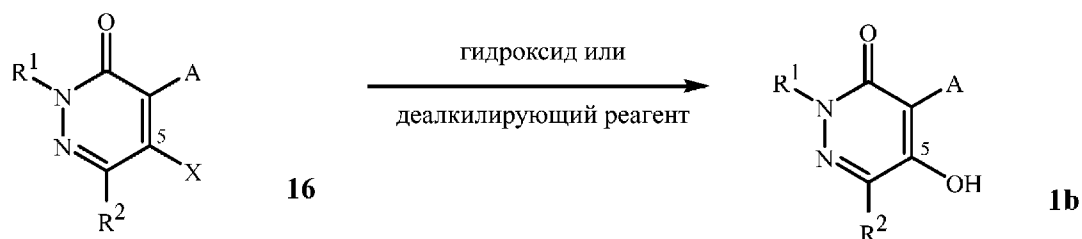
Альтернативный способ получения гетероциклических сложных эфиров уксусной кислоты формулы **6с** приведен на схеме 6. В соответствии со способом, описанным в публикации *Pest. Manag. Sci.* **2011**, 67, 1499–1521, гетероциклические соединения формулы **13** с метильными группами можно подвергнуть бромированию *N*-бромсукцинимидом (NBS) в присутствии свободных радикалов (например, бензоилпероксида в качестве катализатора) в инертном растворителе, таком как дихлорметан, дихлорэтан или тетрахлорметан, с получением гетероарилметилбромидов формулы **14**. При замещении брома цианидом посредством взаимодействия соединений формулы **14** с цианидом щелочного или щелочноземельного металла (например, цианидом калия) получают гетероарильные ацетонитрилы формулы **15**, которые можно гидролизовать этерификацией в ацетаты формулы **6с** посредством нагревания в кислом спирте (например, растворе HCl в метаноле или этаноле), по существу при температуре кипения растворителя. Спирт R^bOH представляет собой низший алканол.

Схема 6



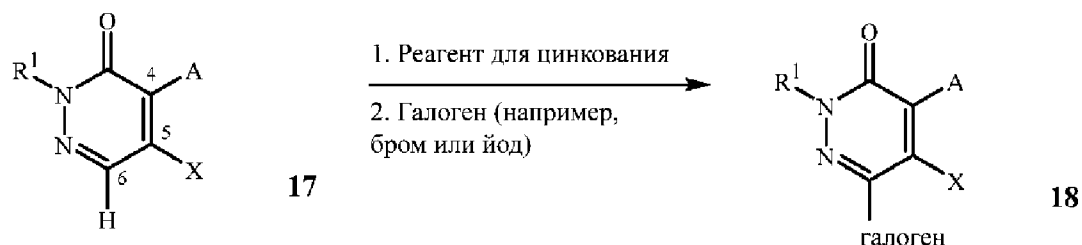
Гидролиз замещенных групп в положении 5 пиридазинонового кольца можно выполнить так, как показано на схеме 7. Если группа X представляет собой низший алкокси, низший алкилсульфид (сульфоксид или сульфон), галогенид или *N*-связанный азол, ее можно удалять посредством гидролиза с помощью щелочных реагентов, таких как гидроксид тетрабутиламмония, в растворителях, таких как тетрагидрофуран, диметоксиэтан или диоксан, при температурах от 0 до 120 °C. К другим гидроксидным реагентам, используемым для данного гидролиза, относятся гидроксид калия, лития и натрия (см., например, WO 2009/086041). Если группа X представляет собой низший алкокси, гидролиз группы X также можно осуществить с помощью деалкилирующих реагентов, таких как трибромид бора или морфолин (см., например, WO 2009/086041, WO 2013/160126 и WO 2013/050421).

Схема 7



Введение галогена в положение 6 пиридазинона может быть осуществлено посредством взаимодействия с соединениями цинка с последующей галогенизацией. Условия, реагенты и примеры цинкования пиридазинов приведены в публикации Verhelst, T., Ph.D. thesis, University of Antwerp, 2012. Пиридазинов формулы 17, как правило, обрабатывают в тетрагидрофуране раствором Zn(TMP)-LiCl или $\text{Zn(TMP)}_2\text{-MgCl}_2\text{-LiCl}$ (т. е. 2,2,6,6-бис(тетраметилпиперидин)цинка, хлорида магния, комплекса хлорида лития в толуоле/тетрагидрофуране) при температуре от -20 до 30°C с образованием цинкового реагента. Последующее добавление брома, N-бромсукцинимиды или йода приводит к получению соединений формулы 18 (где R^2 представляет собой Br или I соответственно). Реагенты, такие как трихлоризоциануровая кислота или 1,3-дихлор-5,5-диметилгидантоин, позволяют получать соединение формулы 18 (где R^2 представляет собой Cl). Этот способ показан на схеме 8. Получение различных соответствующих реагентов для цинкования описано в публикации Wunderlich, S. Ph.D. thesis, University of Munich, 2010 и приведенных в ней ссылках, а также в WO 2008/138946 и WO 2010/092096. Цинкование в положении 6 пиридазинонового кольца может быть осуществлено в присутствии ароматических/гетероароматических заместителей, алкоксизаместителей или галогена в положении 4 пиридазинонового кольца или в присутствии галогена или алкоксизаместителей в положении 5 пиридазинонового кольца.

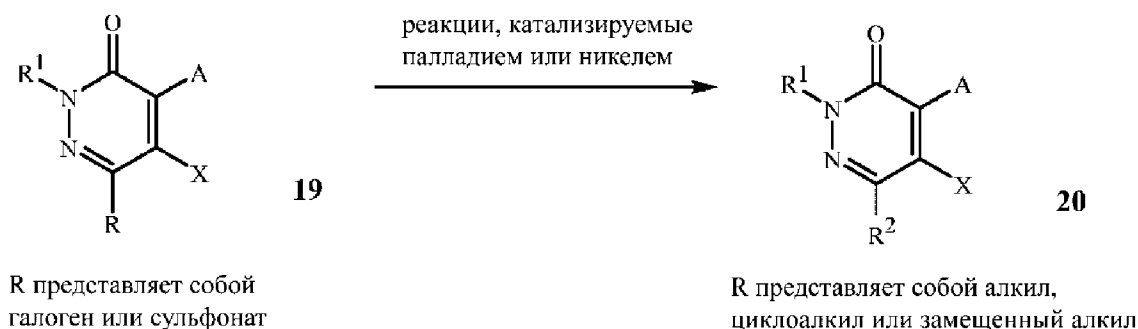
Схема 8



Заместитель R^2 соединений формулы 19 (где R^2 представляет собой галоген или сульфат) может быть дополнительно преобразован в другие функциональные группы. Соединения, в которых R^2 представляет собой алкил, циклоалкил или замещенный алкил, могут быть получены с помощью катализируемых переходными металлами реакций соединений формулы 19, как показано на схеме 9. Обзор этих типов реакций приведен в: E. Negishi, *Handbook of Organopalladium Chemistry for Organic Synthesis*, John Wiley and

Sons, Inc., New York, **2002**, N. Miyaura, *Cross-Coupling Reactions: A Practical Guide*, Springer, New York, **2002**, H. C. Brown et al., *Organic Synthesis via Boranes*, Aldrich Chemical Co., Milwaukee, Vol. 3, **2002**, Suzuki et al., *Chemical Reviews* **1995**, 95, 2457–2483 и Molander et al., *Accounts of Chemical Research* **2007**, 40, 275–286. Также см. Tetrahedron Organic Chemistry Series Vol. 26: *Palladium in Heterocyclic Chemistry*, 2nd Ed., Gribble and Li, editors, Elsevier, Amsterdam, 2007. Описание реакции Бухвальда — Хартвига см. в публикации Yudin and Hartwig, *Catalyzed Carbon-Heteroatom Bond Formation*, 2010, Wiley, New York.

Схема 9

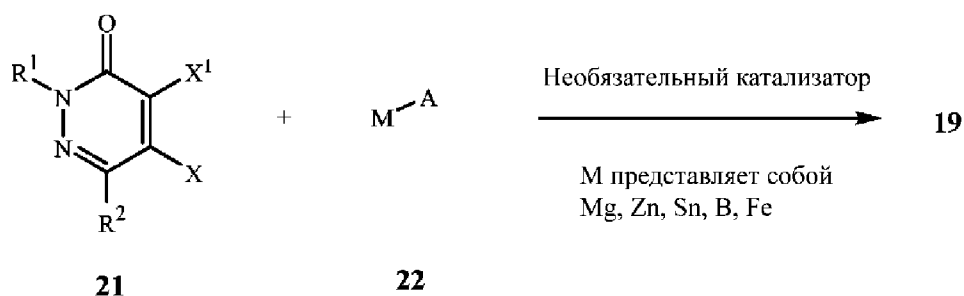


В данной области известны смежные способы синтеза для введения других функциональных групп в положении R^2 формулы **21**. Для введения группы CF_3 можно использовать реакции с медным катализатором. Полный недавний обзор реагентов для этой реакции представлен в публикации Wu, Neumann and Beller in *Chemistry: An Asian Journal*, **2012**, ASAP, а также приведенных в ней ссылок. Для введения в это положение серосодержащего заместителя см. способы, описанные в WO 2013/160126. Для введения цианогруппы см. WO 2014/031971. Для введения нитрогруппы см. *J. Am. Chem. Soc.* **2009**, 12898. Для введения фторсодержащего заместителя см. *J. Am. Chem. Soc.* **2014**, 3792.

Соединения формулы **19** могут быть получены посредством реакции металлоорганических реагентов формулы **22** с пиридазинонами формулы **21** с реакционноспособной группой в положении 4, как показано на схеме 10. В зависимости от замещаемой группы может быть желательно использовать катализатор на основе переходного металла. Если замещаемая группа представляет собой низший алкокси, *N*-связанный азол (такой как пиразол или триазол) или сульфонат, катализатор не требуется, и реакция непосредственно с магнийсодержащим реагентом или литийсодержащим реагентом может происходить в положении 4. Эту реакцию можно проводить в различных растворителях, которые не реагируют с магнийорганическими реагентами. Типичные условия реакции включают в себя тетрагидрофуран в качестве растворителя, температуру реакции от -20 до 65 °C и избыток магнийорганического или литийорганического реагента. Когда реакционноспособная группа в положении 4 представляет собой галоген, полезным является катализатор и лиганд на основе переходного металла. Можно

применять множество разных связующих партнеров, включая бор (реакция Сузуки), олово (реакция Стилле) и цинк (реакция Негиши); эти реакции могут быть катализированы катализаторами на основе палладия и никеля с широким разнообразием лигандов. Условия этих реакций известны в данной области; см., например, публикацию *Palladium-Catalyzed Coupling Reactions: Practical Aspects and Future Development* Edited by Arpad Molnar, Wiley, 2013 и приведенные в ней ссылки. Магнийорганические реагенты, применяемые в некатализируемом процессе, могут быть получены путем непосредственного введения магния в связь углерод-галоген (необязательно в присутствии галогенида лития) посредством реакции обмена Гриньяра с галогенидом *i*-пропилмагния (необязательно в присутствии галогенида лития) или путем превращения литиевого реагента посредством взаимодействия с солью магния, такой как эфират бромида магния. В этих реакциях в R² и в положении 5 пиридазинона могут присутствовать разнообразные группы, которые являются инертными по отношению к магнийорганическим реагентам. Соединения формулы **21** можно получать способами, описанными в Knochel et al. *Angew.* **2011**, *50*, 9794–9824, и *Heterocycles* **2014**, *88*, 827–844.

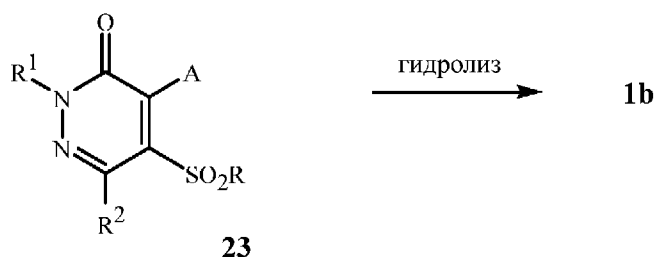
Схема 10



Соединения формулы **21** известны в данной области или могут быть получены способами, описанными Maes и Lemiere в публикации *Comprehensive Heterocyclic Chemistry III Volume 8*, Katritzky, Ramsden, Scriven and Taylor editors и приведенных в ней ссылках. См. также публикацию Verhelst, Ph.D. thesis University of Antwerp и приведенные в ней ссылки. Преобразования функциональных групп на пиридазинонах также описаны в публикации Stevenson et. al. *J. Heterocyclic Chem.* **2005**, *42*, 427; патенте США № 6,077,953; WO 2009/086041 и приведенных в этой публикации ссылках; патенте США № 2,782,195; WO 2013/160126 и WO 2013/050421.

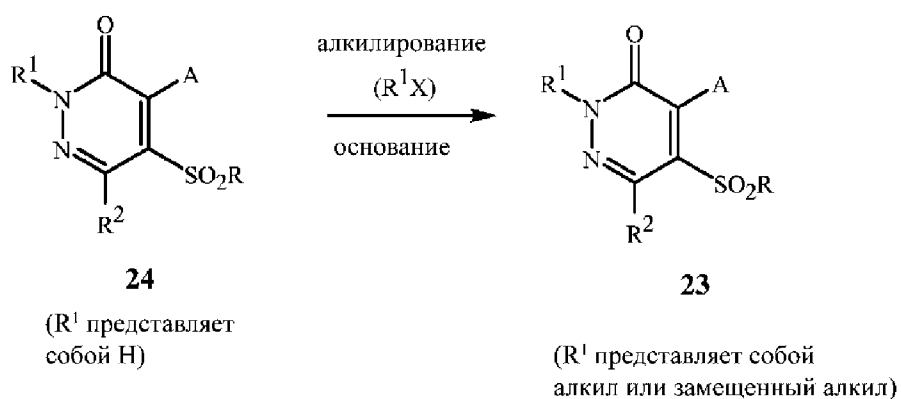
Соединения формулы **1b** также можно получать посредством гидролиза сульфонов формулы **23** в водном основании. Приемлемые основания включают в себя гидроксид натрия, калия или тетрабутиламмония. Типичные температуры реакции находятся в диапазоне от 0 до 80 °C, а типичное время реакции составляет 1–12 часов. Этот способ показан на схеме 11.

Схема 11



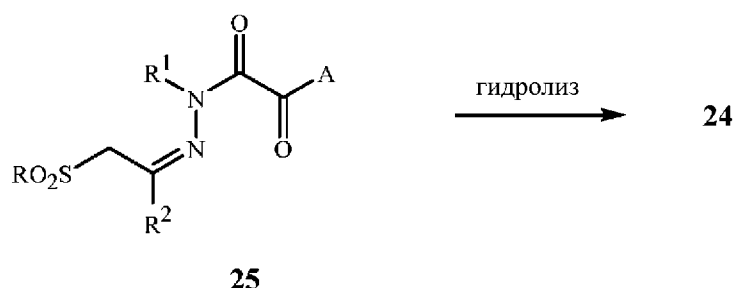
Соединения формулы **23** можно получать посредством алкилирования соединений формулы **24**, где R^1 представляет собой H с алкилгалогенидами и сульфатами. Типичными основаниями, используемыми в данном способе, являются карбонат калия, натрия или цезия. Типичными растворителями являются ацетонитрил, тетрагидрофуран или *N,N*-диметилформамид, как показано на схеме 12.

Схема 12



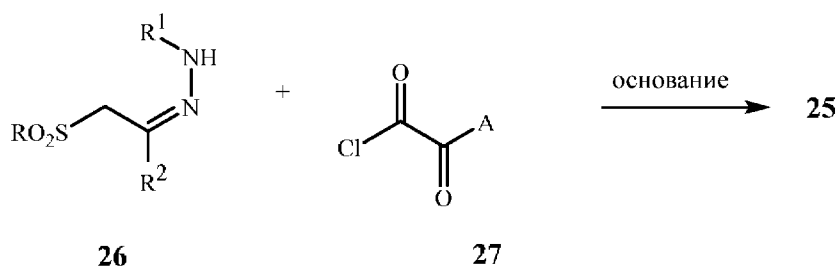
Соединения формулы **24** можно получать посредством циклизации соединений формулы **25** путем обработки основанием. Типичными основаниями, используемыми в данном способе, являются карбонат калия, натрия или цезия. Типичными растворителями являются ацетонитрил, тетрагидрофуран или *N,N*-диметилформамид, как показано на схеме 13.

Схема 13



Соединения формулы **25** можно получить способом, показанным на схеме 14. В этом способе соединения формулы **26** связываются с соединениями формулы **27** в присутствии основания. Основания, используемые в данном способе, включают в себя триэтиламин, карбонат натрия или калия, пиридин или диизопропилэтиламин.

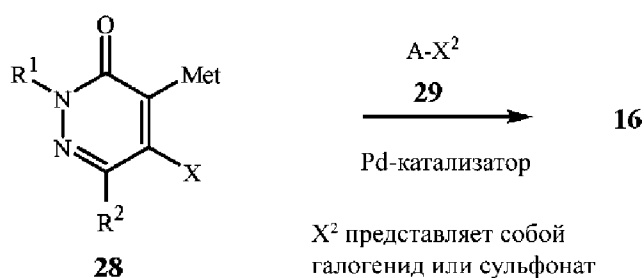
Схема 14



Соединения формулы **26** можно получить способами, известными в данной области.

Соединения формулы **16** можно получать посредством реакций связывания металлоорганических связующих партнеров пиридазинона формулы **28** с гетероарилгалогенидами и сульфонатами формулы **29**. Металлоорганический связующий партнер может представлять собой, например, цинк-, магний-, олово- или борорганический реагент. В процедурах связывания могут применяться палладиевые катализаторы, такие как тетраakis(трифенилфосфин)палладий, и катализаторы, полученные из других источников палладия, таких как Pd₂dba₃ и Pd(OAc)₂, и фосфиновый или N-гетероциклический карбеновый лиганд (Maes et al. *J. Org. Chem.* **2011**, 76, 9648–9659). Палладиевые предкатализаторы на основе диалкилбиарилфосфиновых лигандов, таких как X-Phos, S-Phos и Ru-Phos (Buchwald et al. *Angew. Chem. Int. Ed.*, **2013**, 52(2), 615–619), или предкатализаторы, полученные из N-гетероциклических карбеновых лигандов, таких как PEPPSI-i-Pr и PEPPSI-i-Pent (Organ et al. *Eur. J. Org. Chem.* 2010, 4343–4354), также могут воздействовать на эту связь. Реакцию можно проводить в таких растворителях, как тетрагидрофуран, диметоксиэтан, N-метил-2-пирролидон и диоксан. Связующие партнеры могут представлять собой гетероциклические галогениды или сульфонаты. Наиболее часто используемым классом связующих партнеров для реакции являются вещества на основе нонафлатов (OSO₂C₄F₉) гетероароматических соединений. Галогенированные гетероциклические связующие партнеры доступны в продаже или известны в литературе. Другие используемые классы гетероциклических галогенидов и пути синтеза приведены в публикации Tetrahedron Organic Chemistry Series Vol. 26: *Palladium in Heterocyclic Chemistry*, 2nd Ed., Gribble and Li, editors, Elsevier, Amsterdam, 2007.

Схема 15

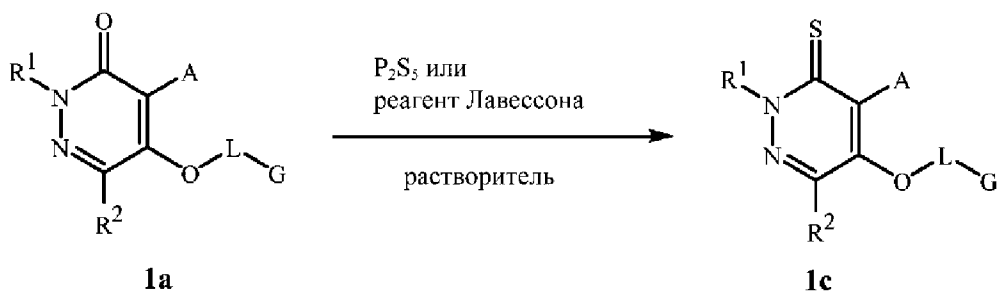


Цинкование положения 4 пиридазинона может быть осуществлено с помощью реагентов цинкования, таких как комплекс 2,2,6,6-бис(тетраметилпиперидин)цинка, хлорида магния, хлорида лития в толуоле/тетрагидрофуране (т. е. Zn(TMP)-LiCl или $\text{Zn(TMP)}_2\text{-MgCl}_2\text{-LiCl}$).

Магнирование этого положения также может осуществляться посредством обработки с использованием Mg(TMP)-LiCl . Условия металлирования пиридазинона и катализируемой палладием реакции перекрестного связывания 4-цинкованных и 4-магнированных пиридазинов см. в публикации Verhelst, T., Ph.D. thesis, University of Antwerp, 2012. Условия синтеза и реакции перекрестного связывания 4-станнилпиридазинов известны из публикации Stevenson et. al. *J. Heterocyclic Chem.* **2005**, 42, 427.

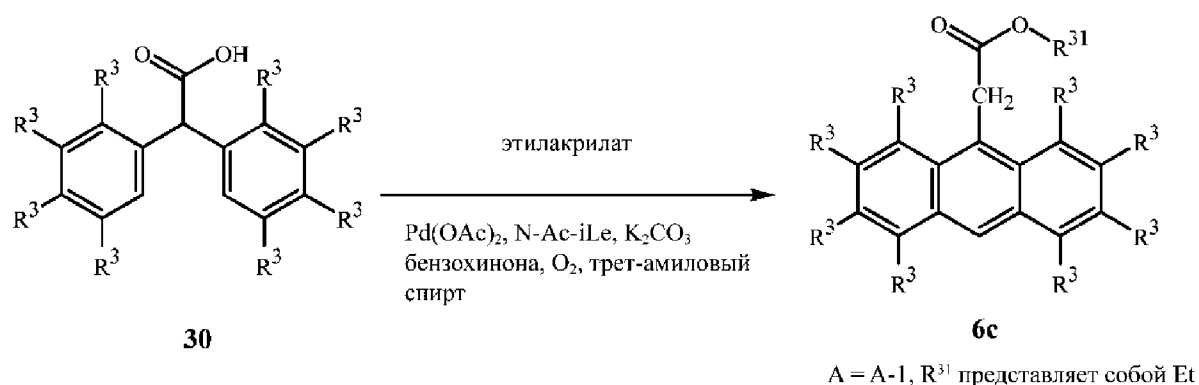
Как показано на схеме 16, пиридазины формулы **1a** (подмножество соединений формулы **1**, где W представляет собой O) могут быть подвергнуты тионированию с получением соответствующих тионов формулы **1c** (т. е. формулы **1**, в которой W представляет собой S) с помощью реагента для тионирования, который по существу представляет собой пентасульфид фосфора в пиридине или реагент Лавессона (2,4-бис-(4-метоксифенил)-1,3-дитиа-2,4-дифосфетан 2,4-дисульфид) в соответствующем растворителе (например, толуоле, тетрагидрофуране или диоксане) при температуре, по существу находящейся в диапазоне от 0°C до комнатной температуры.

Схема 16



Соединения формулы **6c**, где A = A-1 и $\text{R}^{31} = \text{Et}$, можно получать посредством реакции диарилуксусных кислот формулы **30** с этилакрилатом в присутствии ацетата палладия (II), бензохинона, N-ацетилизoleyцина и карбоната калия в трет-амиловом спирте в атмосфере кислорода, применяя процедуры, описанные в публикации *Angew. Chem. Int. Ed.*, **2016**, 55, 8652–8655, а также как показано на схеме 17.

Схема 17



Специалисту в данной области должно быть понятно, что различные функциональные группы могут быть преобразованы в другие для получения разных соединений формулы 1. В качестве полезного ресурса, иллюстрирующего взаимное преобразование функциональных групп простым и понятным способом, см. публикацию Larock, R. C., *Comprehensive Organic Transformations: A Guide to Functional Group Preparations, 2nd Ed.*, Wiley-VCH, New York, 1999. Например, промежуточные соединения для получения соединений формулы 1 могут содержать ароматические нитрогруппы, которые могут быть восстановлены до аминогрупп, а затем преобразованы посредством известных в данной области реакций, таких как реакция Зандмейера, в различные галогениды, обеспечивая соединения формулы 1. Вышеуказанные реакции также во многих случаях могут быть реализованы в альтернативном порядке.

Известно, что некоторые описанные выше реагенты и условия реакции для получения соединений формулы 1 могут быть несовместимы с определенными функциональными группами, присутствующими в промежуточных соединениях. В этих случаях включение в синтез последовательностей защиты / снятия защиты или взаимных преобразований функциональных групп поможет в получении желательных продуктов. Применение и выбор защитных групп будут очевидны специалисту в области химического синтеза (см., например публикацию Greene, T. W.; Wuts, P. G. M. *Protective Groups in Organic Synthesis*, 2nd ed.; Wiley: New York, 1991). Специалисту в данной области должно быть понятно, что в некоторых случаях после введения данного реагента, как показано на любой отдельной схеме, может потребоваться выполнить дополнительные обычные стадии синтеза, не описанные подробно, для завершения синтеза соединений формулы 1. Специалисту в данной области также должно быть понятно, что может быть необходимо выполнить комбинацию стадий, показанных в приведенных выше схемах, в порядке, отличном от порядка, подразумеваемого конкретным представленным вариантом, для получения соединений формулы 1.

Специалисту в данной области также должно быть понятно, что соединения

формулы 1 и промежуточные соединения, описанные в настоящем документе, могут быть подвергнуты различным электрофильным, нуклеофильным, радикальным, металлоорганическим, окислительным и восстановительным реакциям для добавления заместителей или модификации существующих заместителей.

Без дополнительного уточнения предполагается, что специалист в данной области, применяя предыдущее описание, может в полной мере использовать настоящее изобретение. Приведенные ниже не имеющие ограничительного характера примеры следует толковать как иллюстрирующие изобретение. Стадии следующих примеров синтеза иллюстрируют процедуру для каждой стадии в полной синтетической трансформации, и исходный материал для каждой стадии необязательно был получен конкретным способом получения, процедура которого описана в других примерах или стадиях. Процентные доли даны в расчете на массу за исключением смесей хроматографических растворителей или если не указано иное. Части и процентные доли для смесей хроматографических растворителей представлены в расчете на объем, если не указано иное. Все ЯМР-спектры представлены для CDCl_3 со сдвигом в слабое поле относительно тетраметилсилана при 500 МГц, если не указано иное, где «с» обозначает синглет, «уш. с» обозначает уширенный синглет, «д» обозначает дублет, «т» обозначает триплет, а «м» обозначает мультиплет.

ПРИМЕР СИНТЕЗА 1

Получение 4-(9-антраценил)-6-хлор-5-гидрокси-2-метил-3(2*H*)-пиридазинона (соединение 1)

Стадия А: получение 4-(9-антраценил)-6-хлор-5-метокси-2-метил-3(2*H*)-пиридазинона

К раствору комплекса 2,2,6,6-тетраметилпиперидинилмагнийхлорида и хлорида лития (1,0 М в тетрагидрофуране/толуоле, 38,0 мл, 38,0 ммоль) добавляли раствор хлорида цинка (10 мл 1,9 М раствора в 2-метилтетрагидрофуране, 19,0 ммоль) при температуре ниже 15°C с применением ледяной бани. Полученный раствор перемешивали при 5°C в течение 15 мин и при 25°C в течение 45 минут. Полученный раствор комплекса бис(2,2,6,6-тетраметилпиперидинил)цинка, хлорида лития и хлорида магния переносили в капельную воронку и добавляли по каплям к суспензии 6-хлор-5-метокси-2-метил-3(2*H*)-пиридазинона (3,0 г, 17,2 ммоль) и тетрагидрофурана (86 мл) при -40°C. Полученный раствор перемешивали при -40°C в течение 15 мин, нагревали до 5°C и перемешивали при 5°C в течение 45 минут. Раствор последовательно обрабатывали 9-бромантраценом (4,2 г, 16,3 ммоль) и предкатализатором SPhos-G2 (хлор(2-дициклогексилфосфино-2',6'-диметокси-1,1'-бифенил)[2-(2'-амино-1,1'-бифенил)]палладий (II), 1,2 г, 1,7 ммоль). Полученный темно-коричневый раствор нагревали при температуре кипения растворителя

с обратным холодильником в течение 3 ч, охлаждали до температуры окружающей среды и концентрировали. Остаток разделяли между этилацетатом и насыщенным водным раствором хлорида аммония, полученный водный слой экстрагировали этилацетатом и объединенные органические слои последовательно промывали водой и насыщенным раствором соли, сушили над безводным MgSO_4 , фильтровали и концентрировали с получением 8,63 г желтого масла. Масло очищали посредством элюирования с помощью колоночной хроматографии на силикагеле (330 г) с градиентом от 0% до 100% этилацетата в гексанах с получением 3,35 г указанного в заголовке соединения в виде маслянистого твердого вещества.

^1H ЯМР δ 8,57 (с, 1H), 8,08–8,03 (м, 2H), 7,69–7,63 (м, 2H), 7,53–7,45 (м, 4H), 3,82 (с, 3H), 3,05 (с, 3H).

Стадия В: получение 4-(9-антраценил)-6-хлор-5-гидроксид-2-метил-3(2H)-пиридазинона

Смесь 2,15 г (6,1 ммоль) продукта из стадии А и морфолина (12 мл) прогревали при 100°C в течение 2 ч. Полученную реакционную смесь концентрировали и остаток растирали с диэтиловым эфиром. После фильтрации полученное твердое вещество промывали диэтиловым эфиром и сушили на фарфоровой воронке. Полученное твердое вещество суспендировали в водном 1 н. растворе соляной кислоты (ок. 30 мл), перемешивали в течение 2 ч при температуре окружающей среды и фильтровали. Твердое вещество промывали водой и сушили под вакуумом с получением 1,50 г указанного в заголовке соединения, соединения настоящего изобретения, в виде твердого вещества светло-желтого цвета.

^1H ЯМР ($\text{DMSO}-d_6$) δ 8,70 (с, 1H), 8,15 (д, 2H), 7,68 (д, 2H), 7,52 (т, 2H), 7,45 (т, 2H), 5,75 (с, 1H), 3,67 (с, 3H).

ПРИМЕР СИНТЕЗА 2

Получение 6-хлор-4-(10-хлор-9-антраценил)-5-гидроксид-2-метил-3(2H)-пиридазинона (соединение 2)

Стадия А: получение 6-хлор-4-(10-хлор-9-антраценил)-5-метокси-2-метил-3(2H)-пиридазинона

Раствор продукта стадии А из примера 1 синтеза (143 мг, 0,41 ммоль), *N*-хлорсукцинимид (65 мг, 0,49 ммоль) и хлороформа (4 мл) перемешивали при комнатной температуре в течение 15 ч. Полученный раствор разбавляли дихлорметаном и дважды промывали водой, органический слой сушили над безводным MgSO_4 , фильтровали и концентрировали с получением 160 мг указанного в заголовке соединения в виде желтого стекла. Неочищенный продукт применяли на следующей стадии реакции без дополнительной очистки.

^1H ЯМР δ 8,60 (д, 2H), 7,69 (д, 2H), 7,62 (искаженный т, 2H), 7,53 (искаженный т, 2H), 3,82 (с, 3H), 3,09 (с, 3H).

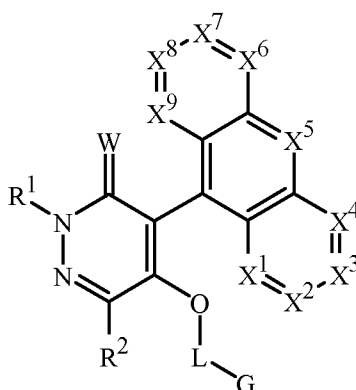
Стадия В: получение 6-хлор-4-(10-хлор-9-антраценил)-5-гидрокси-2-метил-3(2H)-пиридазинона

Суспензию 155 мг продукта стадии А и морфолина (1 мл) прогревали при 100 °С в течение 2 ч. Полученную смесь разбавляли диэтиловым эфиром (5 мл), перемешивали в течение 30 мин. и полученную надосадочную жидкость декантировали от твердого продукта. Твердое вещество разделяли между дихлорметаном и водным 1 н. раствором соляной кислоты, органический слой сушили над безводным MgSO_4 , фильтровали и концентрировали с получением 120 мг указанного в заголовке соединения, соединения настоящего изобретения, в виде желтого твердого вещества.

^1H ЯМР ($\text{DMSO}-d_6$) δ 8,52 (д, 2H), 7,61 (д, 2H), 7,74 (искаженный т, 2H), 7,56 (искаженный т, 2H), 3,67 (с, 3H).

С помощью процедур, описанных в настоящем документе, и способов, известных в данной области, можно получить следующие соединения, представленные в таблицах 1–(960). В приведенных ниже таблицах применяются следующие сокращения: *t* обозначает третичный, *s* обозначает вторичный, *n* обозначает нормальный, *i* обозначает изо, *c* обозначает цикло, Me обозначает метил, Et обозначает этил, Pr обозначает пропил, Bu обозначает бутил, *i*-Pr обозначает изопропил, *c*-Pr обозначает циклопропил, *t*-Bu обозначает третичный бутил, Ph обозначает фенил, OMe обозначает метокси, OEt обозначает этокси, SMe обозначает метилтио, –CN обозначает циано, –NO₂ обозначает нитро, TMS обозначает триметилсилил, SOMe обозначает метилсульфинил, C₂F₅ обозначает CF₂CF₃, а SO₂Me обозначает метилсульфонил.

Таблица 1



W = O, R¹ = Me, R² = Me, L-G = H, а остальные переменные определены ниже

X ¹	X ²	X ³	X ⁴	X ⁵	X ⁶	X ⁷	X ⁸	X ⁹
CH	CH	CH	CH	CH	CH	CH	CH	CH
CH	CH	CH	CH	CF	CH	CH	CH	CH

X ¹	X ²	X ³	X ⁴	X ⁵	X ⁶	X ⁷	X ⁸	X ⁹
CH	CH	CH	CH	CCl	CH	CH	CH	CH
CH	CH	CH	CH	CBr	CH	CH	CH	CH
CH	CH	CH	CH	Cl	CH	CH	CH	CH
CH	CH	CH	CH	COCH ₃	CH	CH	CH	CH
CH	CH	CH	CH	CCF ₃	CH	CH	CH	CH
CH	CH	CH	CH	COCF ₂ H	CH	CH	CH	CH
CH	CH	CH	CH	COCF ₃	CH	CH	CH	CH
CH	CH	CH	CH	CCH ₃	CH	CH	CH	CH
CH	CH	CH	CH	CCCH ₂ CH ₃	CH	CH	CH	CH
CH	CH	CH	CH	CNO ₂	CH	CH	CH	CH
CH	CH	CH	CH	N	CH	CH	CH	CH
CH	CF	CH	CH	CH	CH	CH	CH	CH
CH	CCl	CH	CH	CH	CH	CH	CH	CH
CH	CBr	CH	CH	CH	CH	CH	CH	CH
CH	Cl	CH	CH	CH	CH	CH	CH	CH
CH	COCH ₃	CH	CH	CH	CH	CH	CH	CH
CH	CCF ₃	CH	CH	CH	CH	CH	CH	CH
CH	COCF ₂ H	CH	CH	CH	CH	CH	CH	CH
CH	COCF ₃	CH	CH	CH	CH	CH	CH	CH
CH	CCH ₃	CH	CH	CH	CH	CH	CH	CH
CH	CCCH ₂ CH ₃	CH	CH	CH	CH	CH	CH	CH
CH	CNO ₂	CH	CH	CH	CH	CH	CH	CH
CH	N	CH	CH	CH	CH	CH	CH	CH
CH	CH	CH	CF	CH	CH	CH	CH	CH
CH	CH	CH	CCl	CH	CH	CH	CH	CH
CH	CH	CH	CBr	CH	CH	CH	CH	CH
CH	CH	CH	Cl	CH	CH	CH	CH	CH
CH	CH	CH	COCH ₃	CH	CH	CH	CH	CH
CH	CH	CH	CCF ₃	CH	CH	CH	CH	CH
CH	CH	CH	COCF ₂ H	CH	CH	CH	CH	CH
CH	CH	CH	COCF ₃	CH	CH	CH	CH	CH
CH	CH	CH	CCH ₃	CH	CH	CH	CH	CH
CH	CH	CH	CCCH ₂ CH ₃	CH	CH	CH	CH	CH
CH	CH	CH	CNO ₂	CH	CH	CH	CH	CH
CH	CH	CH	N	CH	CH	CH	CH	CH
CH	CF	CH	CH	CH	CH	CH	CF	CH
CH	CF	CH	CH	CH	CH	CH	CCl	CH
CH	CF	CH	CH	CH	CH	CH	CBr	CH
CH	CF	CH	CH	CH	CH	CH	Cl	CH
CH	CF	CH	CH	CH	CH	CH	COCH ₃	CH
CH	CF	CH	CH	CH	CH	CH	CCF ₃	CH
CH	CF	CH	CH	CH	CH	CH	COCF ₂ H	CH
CH	CF	CH	CH	CH	CH	CH	COCF ₃	CH
CH	CF	CH	CH	CH	CH	CH	CCH ₃	CH
CH	CF	CH	CH	CH	CH	CH	CCCH ₂ CH ₃	CH
CH	CF	CH	CH	CH	CH	CH	CNO ₂	CH
CH	CF	CH	CH	CH	CH	CH	N	CH
CH	CCl	CH	CH	CH	CH	CH	CCl	CH
CH	CCl	CH	CH	CH	CH	CH	CBr	CH
CH	CCl	CH	CH	CH	CH	CH	Cl	CH
CH	CCl	CH	CH	CH	CH	CH	COCH ₃	CH

X ¹	X ²	X ³	X ⁴	X ⁵	X ⁶	X ⁷	X ⁸	X ⁹
CH	CCl	CH	CH	CH	CH	CH	CCF ₃	CH
CH	CCl	CH	CH	CH	CH	CH	COCF ₂ H	CH
CH	CCl	CH	CH	CH	CH	CH	COCF ₃	CH
CH	CCl	CH	CH	CH	CH	CH	CCH ₃	CH
CH	CCl	CH	CH	CH	CH	CH	CCCH ₂ CH ₃	CH
CH	CCl	CH	CH	CH	CH	CH	CNO ₂	CH
CH	CCl	CH	CH	CH	CH	CH	N	CH
CH	CBr	CH	CH	CH	CH	CH	CBr	CH
CH	CBr	CH	CH	CH	CH	CH	Cl	CH
CH	CBr	CH	CH	CH	CH	CH	COCH ₃	CH
CH	CBr	CH	CH	CH	CH	CH	CCF ₃	CH
CH	CBr	CH	CH	CH	CH	CH	COCF ₂ H	CH
CH	CBr	CH	CH	CH	CH	CH	COCF ₃	CH
CH	CBr	CH	CH	CH	CH	CH	CCH ₃	CH
CH	CBr	CH	CH	CH	CH	CH	CCCH ₂ CH ₃	CH
CH	CBr	CH	CH	CH	CH	CH	CNO ₂	CH
CH	CBr	CH	CH	CH	CH	CH	N	CH
CH	Cl	CH	CH	CH	CH	CH	Cl	CH
CH	Cl	CH	CH	CH	CH	CH	COCH ₃	CH
CH	Cl	CH	CH	CH	CH	CH	CCF ₃	CH
CH	Cl	CH	CH	CH	CH	CH	COCF ₂ H	CH
CH	Cl	CH	CH	CH	CH	CH	COCF ₃	CH
CH	Cl	CH	CH	CH	CH	CH	CCH ₃	CH
CH	Cl	CH	CH	CH	CH	CH	CCCH ₂ CH ₃	CH
CH	Cl	CH	CH	CH	CH	CH	CNO ₂	CH
CH	Cl	CH	CH	CH	CH	CH	N	CH
CH	COCH ₃	CH	CH	CH	CH	CH	COCH ₃	CH
CH	COCH ₃	CH	CH	CH	CH	CH	CCF ₃	CH
CH	COCH ₃	CH	CH	CH	CH	CH	COCF ₂ H	CH
CH	COCH ₃	CH	CH	CH	CH	CH	COCF ₃	CH
CH	COCH ₃	CH	CH	CH	CH	CH	CCH ₃	CH
CH	COCH ₃	CH	CH	CH	CH	CH	CCCH ₂ CH ₃	CH
CH	COCH ₃	CH	CH	CH	CH	CH	CNO ₂	CH
CH	COCH ₃	CH	CH	CH	CH	CH	N	CH
CH	CCF ₃	CH	CH	CH	CH	CH	CCF ₃	CH
CH	CCF ₃	CH	CH	CH	CH	CH	COCF ₂ H	CH
CH	CCF ₃	CH	CH	CH	CH	CH	COCF ₃	CH
CH	CCF ₃	CH	CH	CH	CH	CH	CCH ₃	CH
CH	CCF ₃	CH	CH	CH	CH	CH	CCCH ₂ CH ₃	CH
CH	CCF ₃	CH	CH	CH	CH	CH	CNO ₂	CH
CH	CCF ₃	CH	CH	CH	CH	CH	N	CH
CH	COCF ₂ H	CH	CH	CH	CH	CH	COCF ₂ H	CH
CH	COCF ₂ H	CH	CH	CH	CH	CH	COCF ₃	CH
CH	COCF ₂ H	CH	CH	CH	CH	CH	CCH ₃	CH
CH	COCF ₂ H	CH	CH	CH	CH	CH	CCCH ₂ CH ₃	CH
CH	COCF ₂ H	CH	CH	CH	CH	CH	CNO ₂	CH
CH	COCF ₂ H	CH	CH	CH	CH	CH	N	CH
CH	COCF ₃	CH	CH	CH	CH	CH	COCF ₃	CH
CH	COCF ₃	CH	CH	CH	CH	CH	CCH ₃	CH
CH	COCF ₃	CH	CH	CH	CH	CH	CCCH ₂ CH ₃	CH
CH	COCF ₃	CH	CH	CH	CH	CH	CNO ₂	CH

X ¹	X ²	X ³	X ⁴	X ⁵	X ⁶	X ⁷	X ⁸	X ⁹
CH	COCF ₃	CH	CH	CH	CH	CH	N	CH
CH	CCH ₃	CH	CH	CH	CH	CH	CCH ₃	CH
CH	CCH ₃	CH	CH	CH	CH	CH	CCCH ₂ CH ₃	CH
CH	CCH ₃	CH	CH	CH	CH	CH	CNO ₂	CH
CH	CCH ₃	CH	CH	CH	CH	CH	N	CH
CH	CCCH ₂ CH ₃	CH	CH	CH	CH	CH	CCCH ₂ CH ₃	CH
CH	CCCH ₂ CH ₃	CH	CH	CH	CH	CH	CNO ₂	CH
CH	CCCH ₂ CH ₃	CH	CH	CH	CH	CH	N	CH
CH	CNO ₂	CH	CH	CH	CH	CH	CNO ₂	CH
CH	CNO ₂	CH	CH	CH	CH	CH	N	CH
CH	N	CH	CH	CH	CH	CH	N	CH
CH	CF	CH	CH	CCl	CH	CH	CH	CH
CH	CCl	CH	CH	CCl	CH	CH	CH	CH
CH	CBr	CH	CH	CCl	CH	CH	CH	CH
CH	Cl	CH	CH	CCl	CH	CH	CH	CH
CH	COCH ₃	CH	CH	CCl	CH	CH	CH	CH
CH	CCF ₃	CH	CH	CCl	CH	CH	CH	CH
CH	COCF ₂ H	CH	CH	CCl	CH	CH	CH	CH
CH	COCF ₃	CH	CH	CCl	CH	CH	CH	CH
CH	CCH ₃	CH	CH	CCl	CH	CH	CH	CH
CH	CCCH ₂ CH ₃	CH	CH	CCl	CH	CH	CH	CH
CH	CNO ₂	CH	CH	CCl	CH	CH	CH	CH
CH	N	CH	CH	CCl	CH	CH	CH	CH
CH	CF	CH	CH	CBr	CH	CH	CH	CH
CH	CCl	CH	CH	CBr	CH	CH	CH	CH
CH	CBr	CH	CH	CBr	CH	CH	CH	CH
CH	Cl	CH	CH	CBr	CH	CH	CH	CH
CH	COCH ₃	CH	CH	CBr	CH	CH	CH	CH
CH	CCF ₃	CH	CH	CBr	CH	CH	CH	CH
CH	COCF ₂ H	CH	CH	CBr	CH	CH	CH	CH
CH	COCF ₃	CH	CH	CBr	CH	CH	CH	CH
CH	CCH ₃	CH	CH	CBr	CH	CH	CH	CH
CH	CCCH ₂ CH ₃	CH	CH	CBr	CH	CH	CH	CH
CH	CNO ₂	CH	CH	CBr	CH	CH	CH	CH
CH	N	CH	CH	CBr	CH	CH	CH	CH
CH	CF	CH	CH	CCl	CH	CH	CF	CH
CH	CF	CH	CH	CCl	CH	CH	CCl	CH
CH	CF	CH	CH	CCl	CH	CH	CBr	CH
CH	CF	CH	CH	CCl	CH	CH	Cl	CH
CH	CF	CH	CH	CCl	CH	CH	COCH ₃	CH
CH	CF	CH	CH	CCl	CH	CH	CCF ₃	CH
CH	CF	CH	CH	CCl	CH	CH	COCF ₂ H	CH
CH	CF	CH	CH	CCl	CH	CH	COCF ₃	CH
CH	CF	CH	CH	CCl	CH	CH	CCH ₃	CH
CH	CF	CH	CH	CCl	CH	CH	CCCH ₂ CH ₃	CH
CH	CF	CH	CH	CCl	CH	CH	CNO ₂	CH
CH	CF	CH	CH	CCl	CH	CH	N	CH
CH	CCl	CH	CH	CCl	CH	CH	CCl	CH
CH	CCl	CH	CH	CCl	CH	CH	CBr	CH
CH	CCl	CH	CH	CCl	CH	CH	Cl	CH
CH	CCl	CH	CH	CCl	CH	CH	COCH ₃	CH

X ¹	X ²	X ³	X ⁴	X ⁵	X ⁶	X ⁷	X ⁸	X ⁹
CH	CCl	CH	CH	CCl	CH	CH	CCF ₃	CH
CH	CCl	CH	CH	CCl	CH	CH	COCF ₂ H	CH
CH	CCl	CH	CH	CCl	CH	CH	COCF ₃	CH
CH	CCl	CH	CH	CCl	CH	CH	CCH ₃	CH
CH	CCl	CH	CH	CCl	CH	CH	CCCH ₂ CH ₃	CH
CH	CCl	CH	CH	CCl	CH	CH	CNO ₂	CH
CH	CCl	CH	CH	CCl	CH	CH	N	CH
CH	CBr	CH	CH	CCl	CH	CH	CBr	CH
CH	CBr	CH	CH	CCl	CH	CH	Cl	CH
CH	CBr	CH	CH	CCl	CH	CH	COCH ₃	CH
CH	CBr	CH	CH	CCl	CH	CH	CCF ₃	CH
CH	CBr	CH	CH	CCl	CH	CH	COCF ₂ H	CH
CH	CBr	CH	CH	CCl	CH	CH	COCF ₃	CH
CH	CBr	CH	CH	CCl	CH	CH	CCH ₃	CH
CH	CBr	CH	CH	CCl	CH	CH	CCCH ₂ CH ₃	CH
CH	CBr	CH	CH	CCl	CH	CH	CNO ₂	CH
CH	CBr	CH	CH	CCl	CH	CH	N	CH
CH	Cl	CH	CH	CCl	CH	CH	Cl	CH
CH	Cl	CH	CH	CCl	CH	CH	COCH ₃	CH
CH	Cl	CH	CH	CCl	CH	CH	CCF ₃	CH
CH	Cl	CH	CH	CCl	CH	CH	COCF ₂ H	CH
CH	Cl	CH	CH	CCl	CH	CH	COCF ₃	CH
CH	Cl	CH	CH	CCl	CH	CH	CCH ₃	CH
CH	Cl	CH	CH	CCl	CH	CH	CCCH ₂ CH ₃	CH
CH	Cl	CH	CH	CCl	CH	CH	CNO ₂	CH
CH	Cl	CH	CH	CCl	CH	CH	N	CH
CH	COCH ₃	CH	CH	CCl	CH	CH	COCH ₃	CH
CH	COCH ₃	CH	CH	CCl	CH	CH	CCF ₃	CH
CH	COCH ₃	CH	CH	CCl	CH	CH	COCF ₂ H	CH
CH	COCH ₃	CH	CH	CCl	CH	CH	COCF ₃	CH
CH	COCH ₃	CH	CH	CCl	CH	CH	CCH ₃	CH
CH	COCH ₃	CH	CH	CCl	CH	CH	CCCH ₂ CH ₃	CH
CH	COCH ₃	CH	CH	CCl	CH	CH	CNO ₂	CH
CH	COCH ₃	CH	CH	CCl	CH	CH	N	CH
CH	CCF ₃	CH	CH	CCl	CH	CH	CCF ₃	CH
CH	CCF ₃	CH	CH	CCl	CH	CH	COCF ₂ H	CH
CH	CCF ₃	CH	CH	CCl	CH	CH	COCF ₃	CH
CH	CCF ₃	CH	CH	CCl	CH	CH	CCH ₃	CH
CH	CCF ₃	CH	CH	CCl	CH	CH	CCCH ₂ CH ₃	CH
CH	CCF ₃	CH	CH	CCl	CH	CH	CNO ₂	CH
CH	CCF ₃	CH	CH	CCl	CH	CH	N	CH
CH	COCF ₂ H	CH	CH	CCl	CH	CH	COCF ₂ H	CH
CH	COCF ₂ H	CH	CH	CCl	CH	CH	COCF ₃	CH
CH	COCF ₂ H	CH	CH	CCl	CH	CH	CCH ₃	CH
CH	COCF ₂ H	CH	CH	CCl	CH	CH	CCCH ₂ CH ₃	CH
CH	COCF ₂ H	CH	CH	CCl	CH	CH	CNO ₂	CH
CH	COCF ₂ H	CH	CH	CCl	CH	CH	N	CH
CH	COCF ₃	CH	CH	CCl	CH	CH	COCF ₃	CH
CH	COCF ₃	CH	CH	CCl	CH	CH	CCH ₃	CH
CH	COCF ₃	CH	CH	CCl	CH	CH	CCCH ₂ CH ₃	CH
CH	COCF ₃	CH	CH	CCl	CH	CH	CNO ₂	CH

X ¹	X ²	X ³	X ⁴	X ⁵	X ⁶	X ⁷	X ⁸	X ⁹
CH	COCF ₃	CH	CH	CCl	CH	CH	N	CH
CH	CCH ₃	CH	CH	CCl	CH	CH	CCH ₃	CH
CH	CCH ₃	CH	CH	CCl	CH	CH	CCCH ₂ CH ₃	CH
CH	CCH ₃	CH	CH	CCl	CH	CH	CNO ₂	CH
CH	CCH ₃	CH	CH	CCl	CH	CH	N	CH
CH	CCCH ₂ CH ₃	CH	CH	CCl	CH	CH	CCCH ₂ CH ₃	CH
CH	CCCH ₂ CH ₃	CH	CH	CCl	CH	CH	CNO ₂	CH
CH	CCCH ₂ CH ₃	CH	CH	CCl	CH	CH	N	CH
CH	C-NO ₂	CH	CH	CCl	CH	CH	CNO ₂	CH
CH	C-NO ₂	CH	CH	CCl	CH	CH	N	CH
CH	N	CH	CH	CCl	CH	CH	N	CH
CH	CF	CH	CH	CBr	CH	CH	CF	CH
CH	CF	CH	CH	CBr	CH	CH	CCl	CH
CH	CF	CH	CH	CBr	CH	CH	CBr	CH
CH	CF	CH	CH	CBr	CH	CH	Cl	CH
CH	CF	CH	CH	CBr	CH	CH	COCH ₃	CH
CH	CF	CH	CH	CBr	CH	CH	CCF ₃	CH
CH	CF	CH	CH	CBr	CH	CH	COCF ₂ H	CH
CH	CF	CH	CH	CBr	CH	CH	COCF ₃	CH
CH	CF	CH	CH	CBr	CH	CH	CCH ₃	CH
CH	CF	CH	CH	CBr	CH	CH	CCCH ₂ CH ₃	CH
CH	CF	CH	CH	CBr	CH	CH	CNO ₂	CH
CH	CF	CH	CH	CBr	CH	CH	N	CH
CH	CCl	CH	CH	CBr	CH	CH	CCl	CH
CH	CCl	CH	CH	CBr	CH	CH	CBr	CH
CH	CCl	CH	CH	CBr	CH	CH	Cl	CH
CH	CCl	CH	CH	CBr	CH	CH	COCH ₃	CH
CH	CCl	CH	CH	CBr	CH	CH	CCF ₃	CH
CH	CCl	CH	CH	CBr	CH	CH	COCF ₂ H	CH
CH	CCl	CH	CH	CBr	CH	CH	COCF ₃	CH
CH	CCl	CH	CH	CBr	CH	CH	CCH ₃	CH
CH	CCl	CH	CH	CBr	CH	CH	CCCH ₂ CH ₃	CH
CH	CCl	CH	CH	CBr	CH	CH	CNO ₂	CH
CH	CCl	CH	CH	CBr	CH	CH	N	CH
CH	CBr	CH	CH	CBr	CH	CH	CBr	CH
CH	CBr	CH	CH	CBr	CH	CH	Cl	CH
CH	CBr	CH	CH	CBr	CH	CH	COCH ₃	CH
CH	CBr	CH	CH	CBr	CH	CH	CCF ₃	CH
CH	CBr	CH	CH	CBr	CH	CH	COCF ₂ H	CH
CH	CBr	CH	CH	CBr	CH	CH	COCF ₃	CH
CH	CBr	CH	CH	CBr	CH	CH	CCH ₃	CH
CH	CBr	CH	CH	CBr	CH	CH	CCCH ₂ CH ₃	CH
CH	CBr	CH	CH	CBr	CH	CH	CNO ₂	CH
CH	CBr	CH	CH	CBr	CH	CH	N	CH
CH	Cl	CH	CH	CBr	CH	CH	Cl	CH
CH	Cl	CH	CH	CBr	CH	CH	COCH ₃	CH
CH	Cl	CH	CH	CBr	CH	CH	CCF ₃	CH
CH	Cl	CH	CH	CBr	CH	CH	COCF ₂ H	CH
CH	Cl	CH	CH	CBr	CH	CH	COCF ₃	CH
CH	Cl	CH	CH	CBr	CH	CH	CCH ₃	CH
CH	Cl	CH	CH	CBr	CH	CH	CCCH ₂ CH ₃	CH

X ¹	X ²	X ³	X ⁴	X ⁵	X ⁶	X ⁷	X ⁸	X ⁹
CH	CI	CH	CH	CBr	CH	CH	CNO ₂	CH
CH	CI	CH	CH	CBr	CH	CH	N	CH
CH	COCH ₃	CH	CH	CBr	CH	CH	COCH ₃	CH
CH	COCH ₃	CH	CH	CBr	CH	CH	CCF ₃	CH
CH	COCH ₃	CH	CH	CBr	CH	CH	COCF ₂ H	CH
CH	COCH ₃	CH	CH	CBr	CH	CH	COCF ₃	CH
CH	COCH ₃	CH	CH	CBr	CH	CH	CCH ₃	CH
CH	COCH ₃	CH	CH	CBr	CH	CH	CCCH ₂ CH ₃	CH
CH	COCH ₃	CH	CH	CBr	CH	CH	CNO ₂	CH
CH	COCH ₃	CH	CH	CBr	CH	CH	N	CH
CH	CCF ₃	CH	CH	CBr	CH	CH	CCF ₃	CH
CH	CCF ₃	CH	CH	CBr	CH	CH	COCF ₂ H	CH
CH	CCF ₃	CH	CH	CBr	CH	CH	COCF ₃	CH
CH	CCF ₃	CH	CH	CBr	CH	CH	CCH ₃	CH
CH	CCF ₃	CH	CH	CBr	CH	CH	CCCH ₂ CH ₃	CH
CH	CCF ₃	CH	CH	CBr	CH	CH	CNO ₂	CH
CH	CCF ₃	CH	CH	CBr	CH	CH	N	CH
CH	COCF ₂ H	CH	CH	CBr	CH	CH	COCF ₂ H	CH
CH	COCF ₂ H	CH	CH	CBr	CH	CH	COCF ₃	CH
CH	COCF ₂ H	CH	CH	CBr	CH	CH	CCH ₃	CH
CH	COCF ₂ H	CH	CH	CBr	CH	CH	CCCH ₂ CH ₃	CH
CH	COCF ₂ H	CH	CH	CBr	CH	CH	CNO ₂	CH
CH	COCF ₂ H	CH	CH	CBr	CH	CH	N	CH
CH	COCF ₃	CH	CH	CBr	CH	CH	COCF ₃	CH
CH	COCF ₃	CH	CH	CBr	CH	CH	CCH ₃	CH
CH	COCF ₃	CH	CH	CBr	CH	CH	CCCH ₂ CH ₃	CH
CH	COCF ₃	CH	CH	CBr	CH	CH	CNO ₂	CH
CH	COCF ₃	CH	CH	CBr	CH	CH	N	CH
CH	CCH ₃	CH	CH	CBr	CH	CH	CCH ₃	CH
CH	CCH ₃	CH	CH	CBr	CH	CH	CCCH ₂ CH ₃	CH
CH	CCH ₃	CH	CH	CBr	CH	CH	CNO ₂	CH
CH	CCH ₃	CH	CH	CBr	CH	CH	N	CH
CH	CCCH ₂ CH ₃	CH	CH	CBr	CH	CH	CCCH ₂ CH ₃	CH
CH	CCCH ₂ CH ₃	CH	CH	CBr	CH	CH	CNO ₂	CH
CH	CCCH ₂ CH ₃	CH	CH	CBr	CH	CH	N	CH
CH	CNO ₂	CH	CH	CBr	CH	CH	CNO ₂	CH
CH	CNO ₂	CH	CH	CBr	CH	CH	N	CH
CH	N	CH	CH	CBr	CH	CH	N	CH
CH	CH	CH	CF	CH	CF	CH	CH	CH
CH	CH	CH	CCl	CH	CF	CH	CH	CH
CH	CH	CH	CBr	CH	CF	CH	CH	CH
CH	CH	CH	CI	CH	CF	CH	CH	CH
CH	CH	CH	COCH ₃	CH	CF	CH	CH	CH
CH	CH	CH	CCF ₃	CH	CF	CH	CH	CH
CH	CH	CH	COCF ₂ H	CH	CF	CH	CH	CH
CH	CH	CH	COCF ₃	CH	CF	CH	CH	CH
CH	CH	CH	CCH ₃	CH	CF	CH	CH	CH
CH	CH	CH	CCCH ₂ CH ₃	CH	CF	CH	CH	CH
CH	CH	CH	CNO ₂	CH	CF	CH	CH	CH
CH	CH	CH	N	CH	CF	CH	CH	CH
CH	CH	CH	CCl	CH	CCl	CH	CH	CH

X ¹	X ²	X ³	X ⁴	X ⁵	X ⁶	X ⁷	X ⁸	X ⁹
CH	CH	CH	CBr	CH	CCl	CH	CH	CH
CH	CH	CH	Cl	CH	CCl	CH	CH	CH
CH	CH	CH	COCH ₃	CH	CCl	CH	CH	CH
CH	CH	CH	CCF ₃	CH	CCl	CH	CH	CH
CH	CH	CH	COCF ₂ H	CH	CCl	CH	CH	CH
CH	CH	CH	COCF ₃	CH	CCl	CH	CH	CH
CH	CH	CH	CCH ₃	CH	CCl	CH	CH	CH
CH	CH	CH	CCCH ₂ CH ₃	CH	CCl	CH	CH	CH
CH	CH	CH	CNO ₂	CH	CCl	CH	CH	CH
CH	CH	CH	N	CH	CCl	CH	CH	CH
CH	CH	CH	CBr	CH	CBr	CH	CH	CH
CH	CH	CH	Cl	CH	CBr	CH	CH	CH
CH	CH	CH	COCH ₃	CH	CBr	CH	CH	CH
CH	CH	CH	CCF ₃	CH	CBr	CH	CH	CH
CH	CH	CH	COCF ₂ H	CH	CBr	CH	CH	CH
CH	CH	CH	COCF ₃	CH	CBr	CH	CH	CH
CH	CH	CH	CCH ₃	CH	CBr	CH	CH	CH
CH	CH	CH	CCCH ₂ CH ₃	CH	CBr	CH	CH	CH
CH	CH	CH	CNO ₂	CH	CBr	CH	CH	CH
CH	CH	CH	N	CH	CBr	CH	CH	CH
CH	CH	CH	Cl	CH	Cl	CH	CH	CH
CH	CH	CH	COCH ₃	CH	Cl	CH	CH	CH
CH	CH	CH	CCF ₃	CH	Cl	CH	CH	CH
CH	CH	CH	COCF ₂ H	CH	Cl	CH	CH	CH
CH	CH	CH	COCF ₃	CH	Cl	CH	CH	CH
CH	CH	CH	CCH ₃	CH	Cl	CH	CH	CH
CH	CH	CH	CCCH ₂ CH ₃	CH	Cl	CH	CH	CH
CH	CH	CH	CNO ₂	CH	Cl	CH	CH	CH
CH	CH	CH	N	CH	Cl	CH	CH	CH
CH	CH	CH	COCH ₃	CH	COCH ₃	CH	CH	CH
CH	CH	CH	CCF ₃	CH	COCH ₃	CH	CH	CH
CH	CH	CH	COCF ₂ H	CH	COCH ₃	CH	CH	CH
CH	CH	CH	COCF ₃	CH	COCH ₃	CH	CH	CH
CH	CH	CH	CCH ₃	CH	COCH ₃	CH	CH	CH
CH	CH	CH	CCCH ₂ CH ₃	CH	COCH ₃	CH	CH	CH
CH	CH	CH	CNO ₂	CH	COCH ₃	CH	CH	CH
CH	CH	CH	N	CH	COCH ₃	CH	CH	CH
CH	CH	CH	CCF ₃	CH	CCF ₃	CH	CH	CH
CH	CH	CH	COCF ₂ H	CH	CCF ₃	CH	CH	CH
CH	CH	CH	COCF ₃	CH	CCF ₃	CH	CH	CH
CH	CH	CH	CCH ₃	CH	CCF ₃	CH	CH	CH
CH	CH	CH	CCCH ₂ CH ₃	CH	CCF ₃	CH	CH	CH
CH	CH	CH	CNO ₂	CH	CCF ₃	CH	CH	CH
CH	CH	CH	N	CH	CCF ₃	CH	CH	CH
CH	CH	CH	COCF ₂ H	CH	COCF ₂ H	CH	CH	CH
CH	CH	CH	COCF ₃	CH	COCF ₂ H	CH	CH	CH
CH	CH	CH	CCH ₃	CH	COCF ₂ H	CH	CH	CH
CH	CH	CH	CCCH ₂ CH ₃	CH	COCF ₂ H	CH	CH	CH
CH	CH	CH	CNO ₂	CH	COCF ₂ H	CH	CH	CH
CH	CH	CH	N	CH	COCF ₂ H	CH	CH	CH
CH	CH	CH	COCF ₃	CH	COCF ₃	CH	CH	CH

X ¹	X ²	X ³	X ⁴	X ⁵	X ⁶	X ⁷	X ⁸	X ⁹
CH	CH	CH	CCH ₃	CH	COCF ₃	CH	CH	CH
CH	CH	CH	CCCH ₂ CH ₃	CH	COCF ₃	CH	CH	CH
CH	CH	CH	CNO ₂	CH	COCF ₃	CH	CH	CH
CH	CH	CH	N	CH	COCF ₃	CH	CH	CH
CH	CH	CH	CCH ₃	CH	CCH ₃	CH	CH	CH
CH	CH	CH	CCCH ₂ CH ₃	CH	CCH ₃	CH	CH	CH
CH	CH	CH	CNO ₂	CH	CCH ₃	CH	CH	CH
CH	CH	CH	N	CH	CCH ₃	CH	CH	CH
CH	CH	CH	CCCH ₂ CH ₃	CH	CCCH ₂ CH ₃	CH	CH	CH
CH	CH	CH	CNO ₂	CH	CCCH ₂ CH ₃	CH	CH	CH
CH	CH	CH	N	CH	CCCH ₂ CH ₃	CH	CH	CH
CH	CH	CH	CNO ₂	CH	CNO ₂	CH	CH	CH
CH	CH	CH	N	CH	CNO ₂	CH	CH	CH
CH	CH	CH	N	CH	N	CH	CH	CH
CH	CF	CH	CH	CH	CF	CH	CH	CH
CH	CCl	CH	CH	CH	CF	CH	CH	CH
CH	CBr	CH	CH	CH	CF	CH	CH	CH
CH	CI	CH	CH	CH	CF	CH	CH	CH
CH	COCH ₃	CH	CH	CH	CF	CH	CH	CH
CH	CCF ₃	CH	CH	CH	CF	CH	CH	CH
CH	COCF ₂ H	CH	CH	CH	CF	CH	CH	CH
CH	COCF ₃	CH	CH	CH	CF	CH	CH	CH
CH	CCH ₃	CH	CH	CH	CF	CH	CH	CH
CH	CCCH ₂ CH ₃	CH	CH	CH	CF	CH	CH	CH
CH	CNO ₂	CH	CH	CH	CF	CH	CH	CH
CH	N	CH	CH	CH	CF	CH	CH	CH
CH	CCl	CH	CH	CH	CCl	CH	CH	CH
CH	CBr	CH	CH	CH	CCl	CH	CH	CH
CH	CI	CH	CH	CH	CCl	CH	CH	CH
CH	COCH ₃	CH	CH	CH	CCl	CH	CH	CH
CH	CCF ₃	CH	CH	CH	CCl	CH	CH	CH
CH	COCF ₂ H	CH	CH	CH	CCl	CH	CH	CH
CH	COCF ₃	CH	CH	CH	CCl	CH	CH	CH
CH	CCH ₃	CH	CH	CH	CCl	CH	CH	CH
CH	CCCH ₂ CH ₃	CH	CH	CH	CCl	CH	CH	CH
CH	CNO ₂	CH	CH	CH	CCl	CH	CH	CH
CH	N	CH	CH	CH	CCl	CH	CH	CH
CH	CBr	CH	CH	CH	CBr	CH	CH	CH
CH	CI	CH	CH	CH	CBr	CH	CH	CH
CH	COCH ₃	CH	CH	CH	CBr	CH	CH	CH
CH	CCF ₃	CH	CH	CH	CBr	CH	CH	CH
CH	COCF ₂ H	CH	CH	CH	CBr	CH	CH	CH
CH	COCF ₃	CH	CH	CH	CBr	CH	CH	CH
CH	CCH ₃	CH	CH	CH	CBr	CH	CH	CH
CH	CCCH ₂ CH ₃	CH	CH	CH	CBr	CH	CH	CH
CH	CNO ₂	CH	CH	CH	CBr	CH	CH	CH
CH	N	CH	CH	CH	CBr	CH	CH	CH
CH	CI	CH	CH	CH	CI	CH	CH	CH
CH	COCH ₃	CH	CH	CH	CI	CH	CH	CH
CH	CCF ₃	CH	CH	CH	CI	CH	CH	CH
CH	COCF ₂ H	CH	CH	CH	CI	CH	CH	CH

X ¹	X ²	X ³	X ⁴	X ⁵	X ⁶	X ⁷	X ⁸	X ⁹
CH	COCF ₃	CH	CH	CH	Cl	CH	CH	CH
CH	CCH ₃	CH	CH	CH	Cl	CH	CH	CH
CH	CCCH ₂ CH ₃	CH	CH	CH	Cl	CH	CH	CH
CH	CNO ₂	CH	CH	CH	Cl	CH	CH	CH
CH	N	CH	CH	CH	Cl	CH	CH	CH
CH	COCH ₃	CH	CH	CH	COCH ₃	CH	CH	CH
CH	CCF ₃	CH	CH	CH	COCH ₃	CH	CH	CH
CH	COCF ₂ H	CH	CH	CH	COCH ₃	CH	CH	CH
CH	COCF ₃	CH	CH	CH	COCH ₃	CH	CH	CH
CH	CCH ₃	CH	CH	CH	COCH ₃	CH	CH	CH
CH	CCCH ₂ CH ₃	CH	CH	CH	COCH ₃	CH	CH	CH
CH	CNO ₂	CH	CH	CH	COCH ₃	CH	CH	CH
CH	N	CH	CH	CH	COCH ₃	CH	CH	CH
CH	CCF ₃	CH	CH	CH	CCF ₃	CH	CH	CH
CH	COCF ₂ H	CH	CH	CH	CCF ₃	CH	CH	CH
CH	COCF ₃	CH	CH	CH	CCF ₃	CH	CH	CH
CH	CCH ₃	CH	CH	CH	CCF ₃	CH	CH	CH
CH	CCCH ₂ CH ₃	CH	CH	CH	CCF ₃	CH	CH	CH
CH	CNO ₂	CH	CH	CH	CCF ₃	CH	CH	CH
CH	N	CH	CH	CH	CCF ₃	CH	CH	CH
CH	COCF ₂ H	CH	CH	CH	COCF ₂ H	CH	CH	CH
CH	COCF ₃	CH	CH	CH	COCF ₂ H	CH	CH	CH
CH	CCH ₃	CH	CH	CH	COCF ₂ H	CH	CH	CH
CH	CCCH ₂ CH ₃	CH	CH	CH	COCF ₂ H	CH	CH	CH
CH	CNO ₂	CH	CH	CH	COCF ₂ H	CH	CH	CH
CH	N	CH	CH	CH	COCF ₂ H	CH	CH	CH
CH	COCF ₃	CH	CH	CH	COCF ₃	CH	CH	CH
CH	CCH ₃	CH	CH	CH	COCF ₃	CH	CH	CH
CH	CCCH ₂ CH ₃	CH	CH	CH	COCF ₃	CH	CH	CH
CH	CNO ₂	CH	CH	CH	COCF ₃	CH	CH	CH
CH	N	CH	CH	CH	COCF ₃	CH	CH	CH
CH	CCH ₃	CH	CH	CH	CCH ₃	CH	CH	CH
CH	CCCH ₂ CH ₃	CH	CH	CH	CCH ₃	CH	CH	CH
CH	CNO ₂	CH	CH	CH	CCH ₃	CH	CH	CH
CH	N	CH	CH	CH	CCH ₃	CH	CH	CH
CH	CCCH ₂ CH ₃	CH	CH	CH	CCCH ₂ CH ₃	CH	CH	CH
CH	CNO ₂	CH	CH	CH	CCCH ₂ CH ₃	CH	CH	CH
CH	N	CH	CH	CH	CCCH ₂ CH ₃	CH	CH	CH
CH	CNO ₂	CH	CH	CH	CNO ₂	CH	CH	CH
CH	N	CH	CH	CH	CNO ₂	CH	CH	CH
CH	N	CH	CH	CH	N	CH	CH	CH
CH	CF	CH	CF	CH	CH	CH	CH	CH
CH	CCl	CH	CF	CH	CH	CH	CH	CH
CH	CBr	CH	CF	CH	CH	CH	CH	CH
CH	Cl	CH	CF	CH	CH	CH	CH	CH
CH	COCH ₃	CH	CF	CH	CH	CH	CH	CH
CH	CCF ₃	CH	CF	CH	CH	CH	CH	CH
CH	COCF ₂ H	CH	CF	CH	CH	CH	CH	CH
CH	COCF ₃	CH	CF	CH	CH	CH	CH	CH
CH	CCH ₃	CH	CF	CH	CH	CH	CH	CH
CH	CCCH ₂ CH ₃	CH	CF	CH	CH	CH	CH	CH

X ¹	X ²	X ³	X ⁴	X ⁵	X ⁶	X ⁷	X ⁸	X ⁹
CH	CNO ₂	CH	CF	CH	CH	CH	CH	CH
CH	N	CH	CF	CH	CH	CH	CH	CH
CH	CF	CH	CCl	CH	CH	CH	CH	CH
CH	CCl	CH	CCl	CH	CH	CH	CH	CH
CH	CBr	CH	CCl	CH	CH	CH	CH	CH
CH	CI	CH	CCl	CH	CH	CH	CH	CH
CH	COCH ₃	CH	CCl	CH	CH	CH	CH	CH
CH	CCF ₃	CH	CCl	CH	CH	CH	CH	CH
CH	COCF ₂ H	CH	CCl	CH	CH	CH	CH	CH
CH	COCF ₃	CH	CCl	CH	CH	CH	CH	CH
CH	CCH ₃	CH	CCl	CH	CH	CH	CH	CH
CH	CCCH ₂ CH ₃	CH	CCl	CH	CH	CH	CH	CH
CH	CNO ₂	CH	CCl	CH	CH	CH	CH	CH
CH	N	CH	CCl	CH	CH	CH	CH	CH
CH	CF	CH	COCH ₃	CH	CH	CH	CH	CH
CH	CCl	CH	COCH ₃	CH	CH	CH	CH	CH
CH	CBr	CH	COCH ₃	CH	CH	CH	CH	CH
CH	CI	CH	COCH ₃	CH	CH	CH	CH	CH
CH	COCH ₃	CH	COCH ₃	CH	CH	CH	CH	CH
CH	CCF ₃	CH	COCH ₃	CH	CH	CH	CH	CH
CH	COCF ₂ H	CH	COCH ₃	CH	CH	CH	CH	CH
CH	COCF ₃	CH	COCH ₃	CH	CH	CH	CH	CH
CH	CCH ₃	CH	COCH ₃	CH	CH	CH	CH	CH
CH	CCCH ₂ CH ₃	CH	COCH ₃	CH	CH	CH	CH	CH
CH	CNO ₂	CH	COCH ₃	CH	CH	CH	CH	CH
CH	N	CH	COCH ₃	CH	CH	CH	CH	CH
CH	CF	CH	CCH ₃	CH	CH	CH	CH	CH
CH	CCl	CH	CCH ₃	CH	CH	CH	CH	CH
CH	CBr	CH	CCH ₃	CH	CH	CH	CH	CH
CH	CI	CH	CCH ₃	CH	CH	CH	CH	CH
CH	COCH ₃	CH	CCH ₃	CH	CH	CH	CH	CH
CH	CCF ₃	CH	CCH ₃	CH	CH	CH	CH	CH
CH	COCF ₂ H	CH	CCH ₃	CH	CH	CH	CH	CH
CH	COCF ₃	CH	CCH ₃	CH	CH	CH	CH	CH
CH	CCH ₃	CH	CCH ₃	CH	CH	CH	CH	CH
CH	CCCH ₂ CH ₃	CH	CCH ₃	CH	CH	CH	CH	CH
CH	CNO ₂	CH	CCH ₃	CH	CH	CH	CH	CH
CH	N	CH	CCH ₃	CH	CH	CH	CH	CH
CH	CF	CH	CCF ₃	CH	CH	CH	CH	CH
CH	CCl	CH	CCF ₃	CH	CH	CH	CH	CH
CH	CBr	CH	CCF ₃	CH	CH	CH	CH	CH
CH	CI	CH	CCF ₃	CH	CH	CH	CH	CH
CH	COCH ₃	CH	CCF ₃	CH	CH	CH	CH	CH
CH	CCF ₃	CH	CCF ₃	CH	CH	CH	CH	CH
CH	COCF ₂ H	CH	CCF ₃	CH	CH	CH	CH	CH
CH	COCF ₃	CH	CCF ₃	CH	CH	CH	CH	CH
CH	CCH ₃	CH	CCF ₃	CH	CH	CH	CH	CH
CH	CCCH ₂ CH ₃	CH	CCF ₃	CH	CH	CH	CH	CH
CH	CNO ₂	CH	CCF ₃	CH	CH	CH	CH	CH
CH	N	CH	CCF ₃	CH	CH	CH	CH	CH
CF	CH	CH	CH	CH	CH	CH	CH	CH

X ¹	X ²	X ³	X ⁴	X ⁵	X ⁶	X ⁷	X ⁸	X ⁹
CH	CH	CF	CH	CH	CH	CH	CH	CH
CCl	CH	CH	CH	CH	CH	CH	CH	CH
CH	CH	C-Cl	CH	CH	CH	CH	CH	CH
CCH ₃	CH	CH	CH	CH	CH	CH	CH	CH
CH	CH	CCH ₃	CH	CH	CH	CH	CH	CH
CF	CCH ₃	CH	CH	CH	CH	CH	CH	CH
CH	CCH ₃	CF	CH	CH	CH	CH	CH	CH
CCl	CCH ₃	CH	CH	CH	CH	CH	CH	CH
CH	CCH ₃	CCl	CH	CH	CH	CH	CH	CH
CBr	CCH ₃	CH	CH	CH	CH	CH	CH	CH
CCl	CCH ₃	CH	CH	CH	CH	CH	CCH ₃	CH
CCl	CCH ₃	CH	CH	CH	CH	CH	CCl	CH
CCl	CCH ₃	CH	CH	CH	CH	CH	CF	CH
CCl	CCl	CH	CH	CH	CH	CH	CCH ₃	CH
CCl	CF	CH	CH	CH	CH	CH	CCH ₃	CH
CBr	CCH ₃	CH	CH	CH	CH	CH	CCH ₃	CH
CBr	CCH ₃	CH	CH	CH	CH	CH	CCl	CH
CBr	CCH ₃	CH	CH	CH	CH	CH	CF	CH
CBr	CCl	CH	CH	CH	CH	CH	CCH ₃	CH
CBr	CF	CH	CH	CH	CH	CH	CCH ₃	CH
CF	CH	CH	CH	CCl	CH	CH	CH	CH
CH	CH	CF	CH	CCl	CH	CH	CH	CH
CCl	CH	CH	CH	CCl	CH	CH	CH	CH
CH	CH	C-Cl	CH	CCl	CH	CH	CH	CH
CCH ₃	CH	CH	CH	CCl	CH	CH	CH	CH
CH	CH	CCH ₃	CH	CCl	CH	CH	CH	CH
CF	CCH ₃	CH	CH	CCl	CH	CH	CH	CH
CH	CCH ₃	CF	CH	CCl	CH	CH	CH	CH
CCl	CCH ₃	CH	CH	CCl	CH	CH	CH	CH
CH	CCH ₃	CCl	CH	CCl	CH	CH	CH	CH
CBr	CCH ₃	CH	CH	CCl	CH	CH	CH	CH
CCl	CCH ₃	CH	CH	CCl	CH	CH	CCH ₃	CH
CCl	CCH ₃	CH	CH	CCl	CH	CH	CCl	CH
CCl	CCH ₃	CH	CH	CCl	CH	CH	CF	CH
CCl	CCl	CH	CH	CCl	CH	CH	CCH ₃	CH
CCl	CF	CH	CH	CCl	CH	CH	CCH ₃	CH
CBr	CCH ₃	CH	CH	CCl	CH	CH	CCH ₃	CH
CBr	CCH ₃	CH	CH	CCl	CH	CH	CCl	CH
CBr	CCH ₃	CH	CH	CCl	CH	CH	CF	CH
CBr	CCl	CH	CH	CCl	CH	CH	CCH ₃	CH
CBr	CF	CH	CH	CCl	CH	CH	CCH ₃	CH
CF	CH	CH	CH	CBr	CH	CH	CH	CH
CH	CH	CF	CH	CBr	CH	CH	CH	CH
CCl	CH	CH	CH	CBr	CH	CH	CH	CH
CH	CH	C-Cl	CH	CBr	CH	CH	CH	CH
CCH ₃	CH	CH	CH	CBr	CH	CH	CH	CH
CH	CH	CCH ₃	CH	CBr	CH	CH	CH	CH
CF	CCH ₃	CH	CH	CBr	CH	CH	CH	CH
CH	CCH ₃	CF	CH	CBr	CH	CH	CH	CH
CCl	CCH ₃	CH	CH	CBr	CH	CH	CH	CH
CH	CCH ₃	CCl	CH	CBr	CH	CH	CH	CH

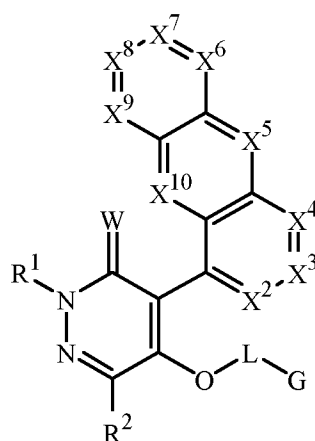
X ¹	X ²	X ³	X ⁴	X ⁵	X ⁶	X ⁷	X ⁸	X ⁹
CBr	CCH ₃	CH	CH	CBr	CH	CH	CH	CH
CCl	CCH ₃	CH	CH	CBr	CH	CH	CCH ₃	CH
CCl	CCH ₃	CH	CH	CBr	CH	CH	CCl	CH
CCl	CCH ₃	CH	CH	CBr	CH	CH	CF	CH
CCl	CCl	CH	CH	CBr	CH	CH	CCH ₃	CH
CCl	CF	CH	CH	CBr	CH	CH	CCH ₃	CH
CBr	CCH ₃	CH	CH	CBr	CH	CH	CCH ₃	CH
CBr	CCH ₃	CH	CH	CBr	CH	CH	CCl	CH
CBr	CCH ₃	CH	CH	CBr	CH	CH	CF	CH
CBr	CCl	CH	CH	CBr	CH	CH	CCH ₃	CH
CBr	CF	CH	CH	CBr	CH	CH	CCH ₃	CH

Это описание также включает в себя таблицы 2–48, в которых фраза строки заголовка в таблице 1 (т.е. «W = O, R¹ = Me, R² = Me, L-G = H») заменена на фразу строки заголовка, указанную в соответствующей таблице, а остальные переменные определены как указано в таблице 1.

ТАБЛИЦА	Фраза строки заголовка
2	W = O, R ¹ = Me, R ² = Cl, L-G = H
3	W = O, R ¹ = Me, R ² = Br, L-G = H
4	W = O, R ¹ = Me, R ² = OCH ₃ , L-G = H
5	W = O, R ¹ = Et, R ² = CH ₃ , L-G = H
6	W = O, R ¹ = Et, R ² = Cl, L-G = H
7	W = O, R ¹ = Et, R ² = Br, L-G = H
8	W = O, R ¹ = Et, R ² = OCH ₃ , L-G = H
9	W = O, R ¹ = CH ₂ CH ₂ OCH ₃ , R ² = CH ₃ , L-G = H
10	W = O, R ¹ = CH ₂ CH ₂ OCH ₃ , R ² = Cl, L-G = H
11	W = O, R ¹ = CH ₂ CH ₂ OCH ₃ , R ² = Br, L-G = H
12	W = O, R ¹ = CH ₂ CH ₂ OCH ₃ , R ² = OCH ₃ , L-G = H
13	W = O, R ¹ = Me, R ² = CH ₃ , L-G = C(O)CH ₃
14	W = O, R ¹ = Me, R ² = Cl, L-G = C(O)CH ₃
15	W = O, R ¹ = Me, R ² = Br, L-G = C(O)CH ₃
16	W = O, R ¹ = Me, R ² = OCH ₃ , L-G = C(O)CH ₃
17	W = O, R ¹ = Et, R ² = CH ₃ , L-G = C(O)CH ₃
18	W = O, R ¹ = Et, R ² = Cl, L-G = C(O)CH ₃
19	W = O, R ¹ = Et, R ² = Br, L-G = C(O)CH ₃
20	W = O, R ¹ = Et, R ² = OCH ₃ , L-G = C(O)CH ₃
21	W = O, R ¹ = CH ₂ CH ₂ OCH ₃ , R ² = CH ₃ , L-G = C(O)CH ₃
22	W = O, R ¹ = CH ₂ CH ₂ OCH ₃ , R ² = Cl, L-G = C(O)CH ₃
23	W = O, R ¹ = CH ₂ CH ₂ OCH ₃ , R ² = Br, L-G = C(O)CH ₃
24	W = O, R ¹ = CH ₂ CH ₂ OCH ₃ , R ² = OCH ₃ , L-G = C(O)CH ₃
25	W = O, R ¹ = Me, R ² = CH ₃ , L-G = C(O)CH ₂ CH ₃
26	W = O, R ¹ = Me, R ² = Cl, L-G = C(O)CH ₂ CH ₃
27	W = O, R ¹ = Me, R ² = Br, L-G = C(O)CH ₂ CH ₃
28	W = O, R ¹ = Me, R ² = OCH ₃ , L-G = C(O)CH ₂ CH ₃
29	W = O, R ¹ = Et, R ² = CH ₃ , L-G = C(O)CH ₂ CH ₃
30	W = O, R ¹ = Et, R ² = Cl, L-G = C(O)CH ₂ CH ₃
31	W = O, R ¹ = Et, R ² = Br, L-G = C(O)CH ₂ CH ₃
32	W = O, R ¹ = Et, R ² = OCH ₃ , L-G = C(O)CH ₂ CH ₃
33	W = O, R ¹ = CH ₂ CH ₂ OCH ₃ , R ² = CH ₃ , L-G = C(O)CH ₂ CH ₃

34	$W = O, R^1 = CH_2CH_2OCH_3, R^2 = Cl, L-G = C(O)CH_2CH_3$
35	$W = O, R^1 = CH_2CH_2OCH_3, R^2 = Br, L-G = C(O)CH_2CH_3$
36	$W = O, R^1 = CH_2CH_2OCH_3, R^2 = OCH_3, L-G = C(O)CH_2CH_3$
37	$W = O, R^1 = Me, R^2 = CH_3, L-G = C(O)OCH_3$
38	$W = O, R^1 = Me, R^2 = Cl, L-G = C(O)OCH_3$
39	$W = O, R^1 = Me, R^2 = Br, L-G = C(O)OCH_3$
40	$W = O, R^1 = Me, R^2 = OCH_3, L-G = C(O)OCH_3$
41	$W = O, R^1 = Et, R^2 = CH_3, L-G = C(O)OCH_3$
42	$W = O, R^1 = Et, R^2 = Cl, L-G = C(O)OCH_3$
43	$W = O, R^1 = Et, R^2 = Br, L-G = C(O)OCH_3$
44	$W = O, R^1 = Et, R^2 = OCH_3, L-G = C(O)OCH_3$
45	$W = O, R^1 = CH_2CH_2OCH_3, R^2 = CH_3, L-G = C(O)OCH_3$
46	$W = O, R^1 = CH_2CH_2OCH_3, R^2 = Cl, L-G = C(O)OCH_3$
47	$W = O, R^1 = CH_2CH_2OCH_3, R^2 = Br, L-G = C(O)OCH_3$
48	$W = O, R^1 = CH_2CH_2OCH_3, R^2 = OCH_3, L-G = C(O)OCH_3$

Таблица 49



$W = O, R^1 = CH_3, R^2 = CH_3, L-G = H$, а остальные переменные определены ниже

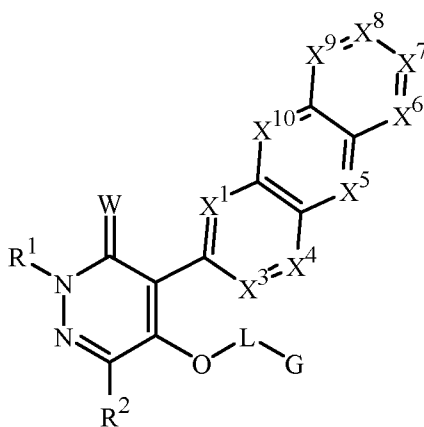
X^2	X^3	X^4	X^5	X^6	X^7	X^8	X^9	X^{10}
CH	CH	CH	CH	CH	CH	CH	CH	CH
CF	CH	CH	CH	CH	CH	CH	CH	CH
CCl	CH	CH	CH	CH	CH	CH	CH	CH
CCH ₃	CH	CH	CH	CH	CH	CH	CH	CH
CH	CH	CCl	CH	CH	CH	CH	CH	CH
CF	CH	CCl	CH	CH	CH	CH	CH	CH
CCl	CH	CCl	CH	CH	CH	CH	CH	CH
CCH ₃	CH	CCl	CH	CH	CH	CH	CH	CH
CH	CH	CBr	CH	CH	CH	CH	CH	CH
CF	CH	CBr	CH	CH	CH	CH	CH	CH
CCl	CH	CBr	CH	CH	CH	CH	CH	CH
CCH ₃	CH	CBr	CH	CH	CH	CH	CH	CH
CCH ₃	CCH ₃	CH	CH	CH	CH	CH	CH	CH
CCH ₃	CH	CCH ₃	CH	CH	CH	CH	CH	CH
CCH ₃	CH	CH	CCl	CH	CH	CH	CH	CH
CCH ₃	CH	CH	CH	CBr	CH	CH	CH	CH
CCH ₃	CH	CH	CH	CCl	CH	CH	CH	CH
CCH ₃	CH	CH	CH	CH	CBr	CH	CH	CH
CCH ₃	CH	CH	CH	CH	CCl	CH	CH	CH
CCH ₃	CH	CH	CH	CH	CH	CBr	CH	CH

CCH ₃	CH	CH	CH	CH	CH	CCl	CH	CH
CCH ₃	CH	CH	CH	CH	CH	CH	CBr	CH
CCH ₃	CH	CH	CH	CH	CH	CH	CCl	CH
CCH ₃	CH	CH	CH	CH	CH	CH	CH	CBr
CCH ₃	CH	CH	CH	CH	CH	CH	CH	CCl

Настоящее описание также включает в себя таблицы 50–56, в которых конкретная переменная, указанная в каждой таблице, заменяет соответствующую переменную во фразе строки заголовка таблицы 49. Например, в таблице 50 фраза строки заголовка представляет собой «W = O, R¹ = CH₃, R² = Cl, L-G = H», а остальные переменные определены ниже.

ТАБЛИЦА	Переменная строки заголовка
50	R ² = Cl
51	R ² = OCH ₃
52	R ¹ = CH ₂ CH ₃
53	R ¹ = CH ₂ CH ₃ , R ² = Cl
54	R ¹ = CH ₂ CH ₃ , R ² = OCH ₃
55	R ¹ = CH ₂ CH ₂ OCH ₃
56	R ¹ = CH ₂ CH ₂ OCH ₃ , R ² = Cl

Таблица 57



W = O, R¹ = CH₃, R² = CH₃, L-G = H, а остальные переменные определены ниже

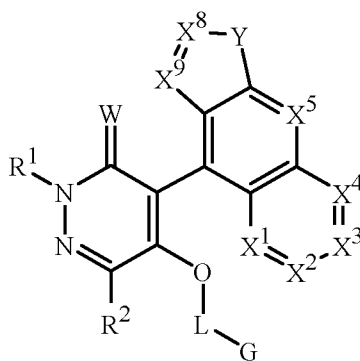
X ¹	X ³	X ⁴	X ⁵	X ⁶	X ⁷	X ⁸	X ⁹	X ¹⁰
CH	CH	CH	CH	CH	CH	CH	CH	CH
CF	CH	CH	CH	CH	CH	CH	CH	CH
CCl	CH	CH	CH	CH	CH	CH	CH	CH
CCH ₃	CH	CH	CH	CH	CH	CH	CH	CH
CH	CH	CCl	CH	CH	CH	CH	CH	CH
CF	CH	CCl	CH	CH	CH	CH	CH	CH
CCl	CH	CCl	CH	CH	CH	CH	CH	CH
CCH ₃	CH	CCl	CH	CH	CH	CH	CH	CH
CH	CH	CBr	CH	CH	CH	CH	CH	CH
CF	CH	CBr	CH	CH	CH	CH	CH	CH

CCl	CH	CBr	CH	CH	CH	CH	CH	CH
CCH ₃	CH	CBr	CH	CH	CH	CH	CH	CH
CCH ₃	CCH ₃	CH	CH	CH	CH	CH	CH	CH
CCH ₃	CH	CCH ₃	CH	CH	CH	CH	CH	CH
CCH ₃	CH	CH	CCl	CH	CH	CH	CH	CH
CCH ₃	CH	CH	CH	CBr	CH	CH	CH	CH
CCH ₃	CH	CH	CH	CCl	CH	CH	CH	CH
CCH ₃	CH	CH	CH	CH	CBr	CH	CH	CH
CCH ₃	CH	CH	CH	CH	CCl	CH	CH	CH
CCH ₃	CH	CH	CH	CH	CH	CBr	CH	CH
CCH ₃	CH	CH	CH	CH	CH	CCl	CH	CH
CCH ₃	CH	CH	CH	CH	CH	CH	CBr	CH
CCH ₃	CH	CH	CH	CH	CH	CH	CCl	CH
CCH ₃	CH	CH	CH	CH	CH	CH	CH	CBr
CCH ₃	CH	CH	CH	CH	CH	CH	CH	CCl

Настоящее описание также включает в себя таблицы 58–65, в которых конкретная переменная, указанная в каждой таблице, заменяет соответствующую переменную во фразе строки заголовка таблицы 57. Например, в таблице 58 фраза строки заголовка представляет собой «W = O, R¹ = CH₃, R² = Cl, L-G = H», а остальные переменные определены ниже.

ТАБЛИЦА	Переменная строки заголовка	ТАБЛИЦА	Переменная строки заголовка
58	R ² = Cl	62	R ¹ = CH ₂ CH ₃ , R ² = OCH ₃
59	R ² = OCH ₃	63	R ¹ = CH ₂ CH ₂ OCH ₃
60	R ¹ = CH ₂ CH ₃	64	R ¹ = CH ₂ CH ₂ OCH ₃ , R ² = Cl
61	R ¹ = CH ₂ CH ₃ , R ² = Cl	65	R ¹ = CH ₂ CH ₂ OCH ₃ , R ² = OCH ₃

Таблица 66



W = O, R¹ = CH₃, R² = CH₃, Y = O, L-G = H, а остальные переменные определены ниже

X ¹	X ²	X ³	X ⁴	X ⁵	X ⁸	X ⁹
CH	CH	CH	CH	CH	CH	CH
CH	CF	CH	CH	CH	CH	CH
CH	CCl	CH	CH	CH	CH	CH
CH	CCH ₃	CH	CH	CH	CH	CH
CH ₃	CH	CH	CH	CH	CH	CH
CH ₃	CF	CH	CH	CH	CH	CH
CH ₃	CCl	CH	CH	CH	CH	CH

ТАБЛИЦА	Переменная строки заголовка
67	$Y = S$
68	$Y = NCH_3$
69	$R^2 = Cl$
70	$R^2 = Cl, Y = S$

ТАБЛИЦА	Переменная строки заголовка
71	$R^2 = Cl, Y = NCH_3$
72	$R^2 = OCH_3$
73	$R^2 = OCH_3, Y = S$
74	$R^2 = OCH_3, Y = NCH_3$

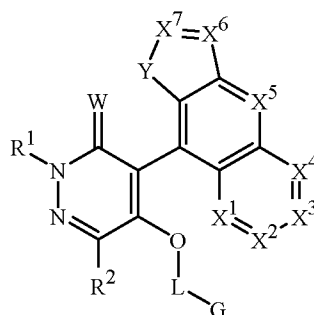
$W = O$, $R^1 = CH_3$, $R^2 = CH_3$, $Y = O$, $L-G = H$, а остальные переменные определены ниже

X^2	X^3	X^4	X^5	X^8	X^9	X^{10}
CH	CH	CH	CH	CH	CH	CH
CF	CH	CH	CH	CH	CH	CH
CCl	CH	CH	CH	CH	CH	CH
CCH ₃	CH	CH	CH	CH	CH	CH
CH	CH	CH	CCl	CH	CH	CH
CF	CH	CH	CCl	CH	CH	CH
CCl	CH	CH	CCl	CH	CH	CH
CCH ₃	CH	CH	CCl	CH	CH	CH
CH	CH	CH	CBr	CH	CH	CH
CF	CH	CH	CBr	CH	CH	CH
CCl	CH	CH	CBr	CH	CH	CH
CCH ₃	CH	CH	CBr	CH	CH	CH
CCH ₃	CCH ₃	CH	CH	CH	CH	CH
CCH ₃	CH	CH	CCH ₃	CH	CH	CH
CCH ₃	CH	CCH ₃	CH	CH	CH	CH
CCH ₃	CH	CH	CH	CCH ₃	CH	CH
CCH ₃	CH	CH	CH	CBr	CH	CH
CCH ₃	CH	CH	CH	CCl	CH	CH
CCH ₃	CH	CH	CH	CH	CBr	CH
CCH ₃	CH	CH	CH	CH	CCl	CH
CCH ₃	CH	CH	CH	CH	CCH ₃	CH
CCH ₃	CH	CH	CH	CH	CH	CBr
CCH ₃	CH	CH	CH	CH	CH	CCl
CCH ₃	CH	CH	CH	CH	CH	CCH ₃

Настоящее описание также включает в себя таблицы 76–83, в которых конкретная переменная, указанная в каждой таблице, заменяет соответствующую переменную во фразе строки заголовка таблицы 75. Например, в таблице 76 фраза строки заголовка представляет собой « $W = O$, $R^1 = CH_3$, $R^2 = CH_3$, $Y = S$, $L-G = H$ », а остальные переменные определены ниже.

ТАБЛИЦА	Переменная строки заголовка	ТАБЛИЦА	Переменная строки заголовка
76	$Y = S$	80	$R^2 = Cl$, $Y = NCH_3$
77	$Y = NCH_3$	81	$R^2 = OCH_3$
78	$R^2 = Cl$	82	$R^2 = OCH_3$, $Y = S$
79	$R^2 = Cl$, $Y = S$	83	$R^2 = OCH_3$, $Y = NCH_3$

Таблица 84



$W = O$, $R^1 = CH_3$, $R^2 = CH_3$, $Y = O$, $L-G = H$, а остальные переменные определены ниже

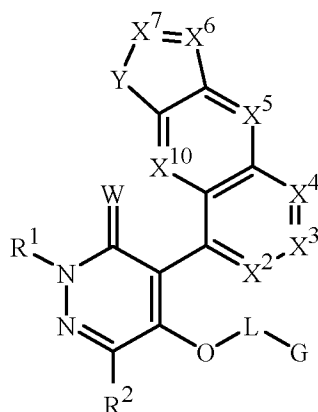
X^1	X^2	X^3	X^4	X^5	X^6	X^7
CH	CH	CH	CH	CH	CH	CH
CH	CF	CH	CH	CH	CH	CH
CH	CCl	CH	CH	CH	CH	CH
CH	CCH ₃	CH	CH	CH	CH	CH
CH ₃	CH	CH	CH	CH	CH	CH
CH ₃	CF	CH	CH	CH	CH	CH
CH ₃	CCl	CH	CH	CH	CH	CH
CH ₃	CCH ₃	CH	CH	CH	CH	CH
Cl	CH	CH	CH	CH	CH	CH
Cl	CF	CH	CH	CH	CH	CH
Cl	CCl	CH	CH	CH	CH	CH
Cl	CCH ₃	CH	CH	CH	CH	CH
CH	CH	CH	CH	CCl	CH	CH
CH	CF	CH	CH	CCl	CH	CH
CH	CCl	CH	CH	CCl	CH	CH
CH	CCH ₃	CH	CH	CCl	CH	CH
CH	CH	CH	CH	CBr	CH	CH
CH	CF	CH	CH	CBr	CH	CH
CH	CCl	CH	CH	CBr	CH	CH
CH	CCH ₃	CH	CH	CBr	CH	CH
CH	CCH ₃	CCH ₃	CH	CH	CH	CH
CH	CCH ₃	CH	CH	CCH ₃	CH	CH
CH	CCH ₃	CH	CCH ₃	CH	CH	CH
CH	CCH ₃	CH	CH	CH	CCH ₃	CH
CH	CCH ₃	CH	CH	CH	CBr	CH
CH	CCH ₃	CH	CH	CH	CCl	CH
CH	CCH ₃	CH	CH	CH	CH	CBr
CH	CCH ₃	CH	CH	CH	CH	CCl
CH	CCH ₃	CH	CH	CH	CH	CCH ₃

Настоящее описание также включает в себя таблицы 85–92, в которых конкретная переменная, указанная в каждой таблице, заменяет соответствующую переменную во фразе строки заголовка таблицы 84. Например, в таблице 85 фраза строки заголовка представляет собой « $W = O$, $R^1 = CH_3$, $R^2 = CH_3$, $Y = S$, $L-G = H$ », а остальные переменные определены ниже.

ТАБЛИЦА	Переменная строки заголовка
85	$Y = S$
86	$Y = NCH_3$
87	$R^2 = Cl$
88	$R^2 = Cl$, $Y = S$

ТАБЛИЦА	Переменная строки заголовка
89	$R^2 = Cl$, $Y = NCH_3$
90	$R^2 = OCH_3$
91	$R^2 = OCH_3$, $Y = S$
92	$R^2 = OCH_3$, $Y = NCH_3$

Таблица 93



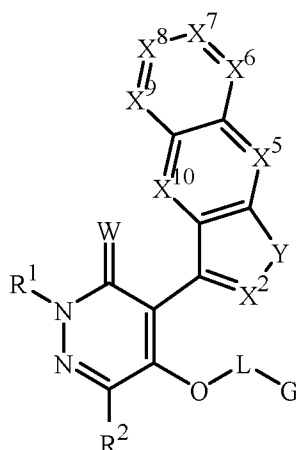
$W = O$, $R^1 = CH_3$, $R^2 = CH_3$, $L-G = H$, $Y = O$, а остальные переменные определены ниже

X^2	X^3	X^4	X^5	X^6	X^7	X^{10}
CH	CH	CH	CH	CH	CH	CH
CF	CH	CH	CH	CH	CH	CH
CCl	CH	CH	CH	CH	CH	CH
CCH ₃	CH	CH	CH	CH	CH	CH
CH	CH	CH	CCl	CH	CH	CH
CF	CH	CH	CCl	CH	CH	CH
CCl	CH	CH	CCl	CH	CH	CH
CCH ₃	CH	CH	CCl	CH	CH	CH
CH	CH	CH	CBr	CH	CH	CH
CF	CH	CH	CBr	CH	CH	CH
CCl	CH	CH	CBr	CH	CH	CH
CCH ₃	CH	CH	CBr	CH	CH	CH
CCH ₃	CCH ₃	CH	CH	CH	CH	CH
CCH ₃	CH	CH	CCH ₃	CH	CH	CH
CCH ₃	CH	CCH ₃	CH	CH	CH	CH
CCH ₃	CH	CH	CH	CCH ₃	CH	CH
CCH ₃	CH	CH	CH	CBr	CH	CH
CCH ₃	CH	CH	CH	CCl	CH	CH
CCH ₃	CH	CH	CH	CH	CBr	CH
CCH ₃	CH	CH	CH	CH	CCl	CH
CCH ₃	CH	CH	CH	CH	CCH ₃	CH
CCH ₃	CH	CH	CH	CH	CH	CBr
CCH ₃	CH	CH	CH	CH	CH	CCl
CCH ₃	CH	CH	CH	CH	CH	CCH ₃

Настоящее описание также включает в себя таблицы 94–101, в которых конкретная переменная, указанная в каждой таблице, заменяет соответствующую переменную во фразе строки заголовка таблицы 93. Например, в таблице 94 фраза строки заголовка представляет собой « $W = O$, $R^1 = CH_3$, $R^2 = CH_3$, $L-G = H$, $Y = S$ », а остальные переменные определены ниже.

ТАБЛИЦА	Переменная строки заголовка
94	$Y = S$
95	$Y = NCH_3$
96	$R^2 = Cl$
97	$R^2 = Cl, Y = S$
98	$R^2 = Cl, Y = NCH_3$
99	$R^2 = OCH_3$
100	$R^2 = OCH_3, Y = S$
101	$R^2 = OCH_3, Y = NCH_3$

Таблица 102



1

$W = O, R^1 = CH_3, R^2 = CH_3, L-G = H, Y = O$, а остальные переменные определены ниже

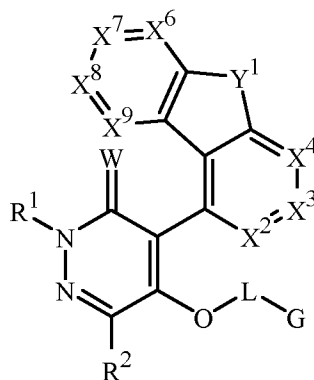
X^2	X^5	X^6	X^7	X^8	X^9	X^{10}
CH	CH	CH	CH	CH	CH	CH
CF	CH	CH	CH	CH	CH	CH
CCl	CH	CH	CH	CH	CH	CH
CCH ₃	CH	CH	CH	CH	CH	CH
CCH ₃	CCl	CH	CH	CH	CH	CH
CCH ₃	CH	CBr	CH	CH	CH	CH
CCH ₃	CH	CCl	CH	CH	CH	CH
CCH ₃	CH	CH	CBr	CH	CH	CH
CCH ₃	CH	CH	CCl	CH	CH	CH
CCH ₃	CH	CH	CH	CBr	CH	CH
CCH ₃	CH	CH	CH	CCl	CH	CH
CCH ₃	CH	CH	CH	CH	CBr	CH
CCH ₃	CH	CH	CH	CH	CCl	CH
CCH ₃	CH	CH	CH	CH	CH	CBr
CCH ₃	CH	CH	CH	CH	CH	CCl

Настоящее описание также включает в себя таблицы 103–110, в которых конкретная переменная, указанная в каждой таблице, заменяет соответствующую переменную во фразе строки заголовка таблицы 102. Например, в таблице 103 фраза строки заголовка

представляет собой « $W = O$, $R^1 = CH_3$, $R^2 = CH_3$, $L-G = H$, $Y = S$ », а остальные переменные определены ниже.

ТАБЛИЦА	Переменная строки заголовка	ТАБЛИЦА	Переменная строки заголовка
103	$Y = S$	107	$R^2 = Cl$, $Y = NCH_3$
104	$Y = NCH_3$	108	$R^2 = OCH_3$
105	$R^2 = Cl$	109	$R^2 = OCH_3$, $Y = S$
106	$R^2 = Cl$, $Y = S$	110	$R^2 = OCH_3$, $Y = NCH_3$

Таблица 111



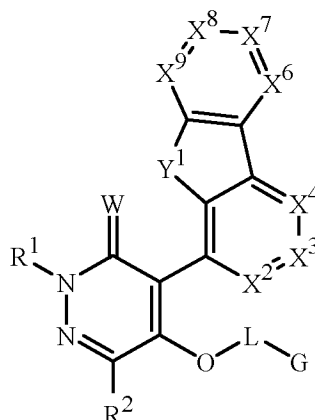
$W = O$, $R^1 = CH_3$, $R^2 = CH_3$, $L-G = H$, $Y^1 = O$, а остальные переменные определены ниже

X^2	X^3	X^4	X^6	X^7	X^8	X^9
CH	CH	CH	CH	CH	CH	CH
CF	CH	CH	CH	CH	CH	CH
CCl	CH	CH	CH	CH	CH	CH
CCH ₃	CH	CH	CH	CH	CH	CH
CH	CH	CH	CH	CH	CCl	CH
CF	CH	CH	CH	CH	CCl	CH
CCl	CH	CH	CH	CH	CCl	CH
CCH ₃	CH	CH	CH	CH	CCl	CH
CH	CH	CH	CH	CH	CBr	CH
CF	CH	CH	CH	CH	CBr	CH
CCl	CH	CH	CH	CH	CBr	CH
CCH ₃	CH	CH	CH	CH	CBr	CH
CCH ₃	CCH ₃	CH	CH	CH	CH	CH
CCH ₃	CH	CH	CH	CH	CCH ₃	CH
CCH ₃	CH	CH	CCH ₃	CH	CH	CH
CCH ₃	CH	CCH ₃	CH	CH	CH	CH
CCH ₃	CH	CBr	CH	CH	CH	CH
CCH ₃	CH	CCl	CH	CH	CH	CH
CCH ₃	CH	CH	CH	CBr	CH	CH
CCH ₃	CH	CH	CH	CCl	CH	CH
CCH ₃	CH	CH	CH	CCH ₃	CH	CH
CCH ₃	CH	CH	CH	CH	CH	CBr
CCH ₃	CH	CH	CH	CH	CH	CCl
CCH ₃	CH	CH	CH	CH	CH	CCH ₃

Настоящее описание также включает в себя таблицы 112–122, в которых конкретная переменная, указанная в каждой таблице, заменяет соответствующую переменную во фразе строки заголовка таблицы 111. Например, в таблице 112 фраза строки заголовка представляет собой « $W = O$, $R^1 = CH_3$, $R^2 = CH_3$, $L-G = H$, $Y^1 = S$ », а остальные переменные определены ниже.

ТАБЛИЦА	Переменная строки заголовка	ТАБЛИЦА	Переменная строки заголовка
112	$Y^1 = S$	118	$R^2 = Cl$, $Y^1 = C(O)$
113	$Y^1 = NCH_3$	119	$R^2 = OCH_3$
114	$Y^1 = C(O)$	120	$R^2 = OCH_3$, $Y^1 = S$
115	$R^2 = Cl$	121	$R^2 = OCH_3$, $Y^1 = NCH_3$
116	$R^2 = Cl$, $Y^1 = S$	122	$R^2 = OCH_3$, $Y^1 = C(O)$
117	$R^2 = Cl$, $Y^1 = NCH_3$		

Таблица 123



$W = O$, $R^1 = CH_3$, $R^2 = CH_3$, $L-G = H$, $Y^1 = O$, а остальные переменные определены ниже

X^2	X^3	X^4	X^6	X^7	X^8	X^9
CH	CH	CH	CH	CH	CH	CH
CF	CH	CH	CH	CH	CH	CH
CCl	CH	CH	CH	CH	CH	CH
CCH ₃	CH	CH	CH	CH	CH	CH
CH	CH	CH	CH	CH	CCl	CH
CF	CH	CH	CH	CH	CCl	CH
CCl	CH	CH	CH	CH	CCl	CH
CCH ₃	CH	CH	CH	CH	CCl	CH
CH	CH	CH	CH	CH	CBr	CH
CF	CH	CH	CH	CH	CBr	CH
CCl	CH	CH	CH	CH	CBr	CH
CCH ₃	CH	CH	CH	CH	CBr	CH
CCH ₃	CCH ₃	CH	CH	CH	CH	CH
CCH ₃	CH	CH	CH	CH	CCH ₃	CH
CCH ₃	CH	CH	CCH ₃	CH	CH	CH
CCH ₃	CH	CCH ₃	CH	CH	CH	CH
CCH ₃	CH	CBr	CH	CH	CH	CH
CCH ₃	CH	CCl	CH	CH	CH	CH
CCH ₃	CH	CH	CH	CBr	CH	CH

CCH ₃	CH	CH	CH	CCl	CH	CH
CCH ₃	CH	CH	CH	CCH ₃	CH	CH
CCH ₃	CH	CH	CH	CH	CH	CBr
CCH ₃	CH	CH	CH	CH	CH	CCl
CCH ₃	CH	CH	CH	CH	CH	CCH ₃

Настоящее описание также включает в себя таблицы 124–134, в которых конкретная переменная, указанная в каждой таблице, заменяет соответствующую переменную во фразе строки заголовка таблицы 123. Например, в таблице 124 фраза строки заголовка представляет собой «W = O, R¹ = CH₃, R² = CH₃, L-G = H, Y¹ = S», а остальные переменные определены ниже.

ТАБЛИЦА	Переменная строки заголовка	ТАБЛИЦА	Переменная строки заголовка
124	Y ¹ = S	130	R ² = Cl, Y ¹ = C(O)
125	Y ¹ = NCH ₃	131	R ² = OCH ₃
126	Y ¹ = C(O)	132	R ² = OCH ₃ , Y ¹ = S
127	R ² = Cl	133	R ² = OCH ₃ , Y ¹ = NCH ₃
128	R ² = Cl, Y ¹ = S	134	R ² = OCH ₃ , Y ¹ = C(O)
129	R ² = Cl, Y ¹ = NCH ₃		

Соединение по настоящему изобретению будет по существу применяться в виде гербицидного активного ингредиента в композиции, т. е. в составе, при этом по меньшей мере один дополнительный компонент выбран из группы, состоящей из поверхностно-активных веществ, твердых разбавителей и жидких разбавителей, которые служат в качестве носителя. Ингредиенты состава или композиции выбраны так, чтобы они соответствовали физическим свойствам активного ингредиента, способу нанесения и факторам окружающей среды, таким как тип почвы, влажность и температура.

Используемые составы включают в себя как жидкие, так и твердые композиции. Жидкие композиции включают в себя растворы (включая эмульгируемые концентраты), суспензии, эмульсии (включая микроэмульсии, эмульсии типа «масло в воде», текучие концентраты и/или суспензии) и т. п., которые необязательно могут быть загущены до получения гелей. К общим типам водных жидких композиций относятся растворимый концентрат, суспензионный концентрат, капсульная суспензия, концентрированная эмульсия, микроэмульсия, эмульсия типа «масло в воде», текучий концентрат и суспензия. Общие типы неводных жидких композиций представляют собой эмульгируемый концентрат, микроэмульгируемый концентрат, диспергируемый концентрат и масляную дисперсию.

Общие типы твердых композиций представляют собой пыли, порошки, гранулы, шарики, приллы, пастилки, таблетки, наполненные пленки (включая композиции для

покрытия семян) и т. п., которые могут быть диспергируемыми в воде («смачиваемыми») или водорастворимыми. Пленки и покрытия, образованные из пленкообразующих растворов или текучих суспензий, особенно подходят для обработки семян. Активный ингредиент может быть (микро)инкапсулирован и дополнительно сформирован с получением суспензии или твердого состава; альтернативно весь состав активного ингредиента может быть инкапсулирован (или «нанесен в виде покрытия»). Инкапсуляция может контролировать или задерживать высвобождение активного ингредиента. Эмульгируемая гранула сочетает в себе преимущества как состава эмульгируемого концентрата, так и сухого гранулированного состава. Высокопрочные композиции преимущественно применяются в качестве промежуточных соединений для дополнительного состава.

Перед распылением напыляемые составы, как правило, разбавляют в приемлемой среде. Такие жидкие и твердые составы готовят таким образом, чтобы они могли быть быстро разведены в распылительной среде, обычно в воде, но в некоторых случаях в другой приемлемой среде, такой как ароматическое или парафиновое минеральное или растительное масло. Распыляемые объемы могут находиться в диапазоне от около одного до нескольких тысяч литров на гектар, но более типично находятся в диапазоне от около десяти до нескольких сотен литров на гектар. Распыляемые составы могут быть смешаны в баке с водой или другой приемлемой средой с целью обработки листьев путем воздушного или наземного нанесения или с целью нанесения на среду для выращивания растения. Жидкие и сухие составы можно дозировать непосредственно в системы капельного орошения или дозировать в борозду во время посадки.

Составы, как правило, будут содержать эффективные количества активного ингредиента, разбавителя и поверхностно-активного вещества в следующих приблизительных диапазонах, которые доводят до 100% масс.

	<u>Весовое процентное содержание</u>		
	<u>Активный ингредиент</u>	<u>Разбавитель</u>	<u>Поверхностно- активное вещество</u>
Диспергируемые в воде и водорастворимые гранулы, таблетки и порошки	0,001–90	0–99,999	0–15
Масляные дисперсии, суспензии, эмульсии, растворы (включая эмульгируемые концентраты)	1–50	40–99	0–50
Пыли	1–25	70–99	0–5
Гранулы и шарики	0,001–99	5–99,999	0–15
Высокопрочные композиции	90–99	0–10	0–2

Твердые разбавители включают в себя, например, глины, такие как бентонит, монтмориллонит, аттапульгит и каолин, гипс, целлюлоза, диоксид титана, оксид цинка, крахмал, декстрин, сахара (например, лактоза, сахароза), кремнезем, тальк, слюда, диатомит, мочевины, карбонат кальция, карбонат натрия и бикарбонат и сульфат натрия. Типичные твердые разбавители описаны в публикации Watkins et al., *Handbook of Insecticide Dust Diluents and Carriers*, 2nd Ed., Dorland Books, Caldwell, New Jersey.

Жидкие разбавители включают в себя, например, воду, *N,N*-диметилалканамиды (например, *N,N*-диметилформамид), лимонен, диметилсульфоксид, *N*-алкилпирролидоны (например, *N*-метилпирролидон), алкилфосфаты (например, триэтилфосфат), этиленгликоль, триэтиленгликоль, пропиленгликоль, дипропиленгликоль, полипропиленгликоль, пропиленкарбонат, бутиленкарбонат, парафины (например, белые минеральные масла, нормальные парафины, изопарафины), алкилбензолы, алкилнафталины, глицерин, триацетат глицерина, сорбит, ароматические углеводороды, деароматизированные алифатические углеводороды, алкилбензолы, алкилнафталины, кетоны, такие как циклогексанон, 2-гептанон, изофорон и 4-гидрокси-4-метил-2-пентанон, ацетаты, такие как изоамилацетат, гексилацетат, гептилацетат, октилацетат, нонилацетат, тридецилацетат и изоборнилацетат, другие сложные эфиры, такие как алкилированные сложные эфиры молочной кислоты, двухосновные сложные эфиры, алкил- и арилбензоаты и γ -бутиролактон, и спирты, которые могут быть линейными, разветвленными, насыщенными или ненасыщенными, такие как метанол, этанол, *n*-пропанол, изопропиловый спирт, *n*-бутанол, изобутиловый спирт, *n*-гексанол, 2-этилгексанол, *n*-октанол, деканол, изодециловый спирт, изооктадеканол, цетиловый спирт, лауриловый спирт, тридециловый спирт, олеиловый спирт, циклогексанол, тетрагидрофурфуриловый спирт, диацетоновый спирт, крезол и бензиловый спирт. Жидкие разбавители также включают в себя сложные эфиры глицерина с насыщенными и ненасыщенными жирными кислотами (как правило, C_6-C_{22}), такие как масла семян растений и фруктов (например, оливковое, касторовое, льняное, кунжутное, кукурузное (маисовое), арахисовое, подсолнечное, виноградное, сафлоровое, хлопковое, соевое, рапсовое, кокосовое и пальмоядровое масло), животные жиры (например, говяжий жир, свиной жир, свиное сало, жир печени трески, рыбий жир) и их смеси. Жидкие разбавители также включают в себя алкилированные жирные кислоты (например, метилированные, этилированные, бутилированные), причем жирные кислоты могут быть получены путем гидролиза сложных эфиров глицерина из растительных и животных источников и могут быть очищены путем перегонки. Типичные жидкие разбавители описаны в публикации Marsden, *Solvents Guide*, 2nd Ed., Interscience, New York, 1950.

Твердые и жидкие композиции по настоящему изобретению часто включают в себя одно или более поверхностно-активных веществ. При добавлении в жидкость поверхностно-активные вещества (также известные как ПАВ) по существу изменяют, чаще всего уменьшают, поверхностное натяжение жидкости. В зависимости от природы гидрофильных и липофильных групп в молекуле поверхностно-активного вещества поверхностно-активные вещества могут использоваться в качестве смачивающих агентов, диспергирующих агентов, эмульгаторов или противовспенивающих агентов.

Поверхностно-активные вещества могут быть классифицированы как неионогенные, анионные или катионные. Неионогенные поверхностно-активные вещества, которые могут использоваться в настоящих композициях, включают в себя, без ограничений: алкоксилаты спиртов, такие как алкоксилаты спиртов на основе натуральных и синтетических спиртов (которые могут быть разветвленными или линейными), полученные из спиртов и этиленоксида, пропиленоксида, бутиленоксида или их смесей; аминэтоксилаты, алканоламиды и этоксилированные алканоламиды; алкоксилированные триглицериды, такие как этоксилированные соевое, касторовое и рапсовое масла; алкилфенольные алкоксилаты, такие как октилфенолэтоксилаты, нонилфенолэтоксилаты, динонилфенолэтоксилаты и додецилфенолэтоксилаты (полученные из фенолов и этиленоксида, пропиленоксида, бутиленоксида или их смесей); блок-полимеры, полученные из этиленоксида или пропиленоксида и обратные блок-полимеры, причем концевые блоки получены из пропиленоксида; этоксилированные жирные кислоты; этоксилированные жирные сложные эфиры и масла; этоксилированные метиловые сложные эфиры; этоксилированный тристирилфенол (включая полученные из этиленоксида, пропиленоксида, бутиленоксида или их смесей); сложные эфиры жирных кислот, сложные эфиры глицерина, производные ланолина, сложные эфиры полиэтоксилата, такие как сложные эфиры полиэтоксилированного сорбитана и жирных кислот, сложные эфиры полиэтоксилированного сорбита и жирных кислот и сложные эфиры полиэтоксилированного глицерина и жирных кислот; другие производные сорбитана, такие как сложные эфиры сорбитана; полимерные поверхностно-активные вещества, такие как статистические сополимеры, блок-сополимеры, алкидные полиэтилengликолевые смолы, привитые или гребнеобразные полимеры и звездообразные полимеры; полиэтилengликоли (ПЭГ); сложные эфиры полиэтилengликоля и жирных кислот; поверхностно-активные вещества на основе силикона; и производные сахаров, такие как сложные эфиры сахарозы, алкилполигликозиды и алкилполисахариды.

Используемые анионные поверхностно-активные вещества включают в себя, без ограничений: алкиларилсульфоновые кислоты и их соли; карбоксилированный спирт или

алкилфенолэтоксилаты; производные дифенилсульфоната; лигнин и производные лигнина, такие как лигносульфонаты; малеиновая или янтарная кислоты или их ангидриды; олефинсульфонаты; фосфатные сложные эфиры, такие как сложные эфиры фосфата и алкоксилатов спирта, сложные эфиры фосфата и алкилфенолалкоксилатов и сложные эфиры фосфата и стирилфенолэтоксилатов; поверхностно-активные вещества на основе белка; производные саркозина; стирилфенолэфирсульфат; сульфаты и сульфонаты масел и жирных кислот; сульфаты и сульфонаты этоксилированных алкилфенолов; сульфаты спиртов; сульфаты этоксилированных спиртов; сульфонаты аминов и амидов, такие как *N,N*-алкилтаураты; сульфонаты бензола, кумола, толуола, ксилола и додецил- и тридецилбензолов; сульфонаты конденсированных нафталинов; сульфонаты нафталина и алкилнафталина; сульфонаты фракционированной нефти; сульфосукцинаматы и сульфосукцинаты и их производные, такие как диалкилсульфосукцинатные соли.

Используемые катионные поверхностно-активные вещества включают в себя, без ограничений: амиды и этоксилированные амиды; амины, такие как *N*-алкилпропандиамины, трипропилентриамины и дипропилентетраамины, а также этоксилированные амины, этоксилированные диамины и пропоксилированные амины (полученные из аминов и этиленоксида, пропиленоксида, бутиленоксида или их смесей); соли аминов, такие как аминоксиды и диаминовые соли; четвертичные аммониевые соли, такие как четвертичные соли, этоксилированные четвертичные соли и дичетвертичные соли; и оксиды амина, такие как алкилдиметиламинооксиды и бис-(2-гидроксиэтил)-алкиламинооксиды.

Также в настоящих композициях могут использоваться смеси неионогенных и анионных поверхностно-активных веществ или смесей неионогенных и катионных поверхностно-активных веществ. Неионогенные, анионные и катионные поверхностно-активные вещества и их рекомендованные варианты применения описаны в разнообразных опубликованных источниках, включая *McCutcheon's Emulsifiers and Detergents*, annual American and International Editions, опубликованную McCutcheon's Division, The Manufacturing Confectioner Publishing Co.; Sisely и Wood, *Encyclopedia of Surface Active Agents*, Chemical Publ. Co., Inc., New York, 1964; а также A. S. Davidson and B. Milwidsky, *Synthetic Detergents*, Seventh Edition, John Wiley and Sons, New York, 1987.

Композиции по настоящему изобретению могут также содержать вспомогательные вещества и добавки состава, известные специалистам в данной области как вспомогательные средства состава (некоторые из которых также могут выступать в качестве твердых разбавителей, жидких разбавителей или поверхностно-активных веществ). Такие вспомогательные вещества и добавки состава могут влиять на: pH

(буферы), пенообразование во время обработки (противовспенивающие средства, такие как полиорганосилоксаны), осаждение активных ингредиентов (суспендирующие агенты), вязкость (тиксотропные загустители), рост микроорганизмов внутри контейнера (антимикробные средства), замораживание продукта (антифризы), окрашивание (красители / пигментные дисперсии), вымывание (пленкообразующие или клейкие вещества), испарение (замедлители испарения) и другие характеристики состава. Пленкообразующие вещества включают в себя, например, поливинилацетаты, сополимеры поливинилацетата, сополимер поливинилпирролидона и винилацетата, поливиниловые спирты, сополимеры поливинилового спирта и воски. Примеры вспомогательных веществ и добавок состава включают в себя перечисленные в публикации *McCutcheon's Volume 2: Functional Materials*, annual International and North American editions published by McCutcheon's Division, The Manufacturing Confectioner Publishing Co.; и публикации PCT № WO 03/024222.

Соединение формулы 1 и любых других активных ингредиентов, как правило, включают в настоящие композиции путем растворения активного ингредиента в растворителе или путем измельчения в жидком или сухом разбавителе. Растворы, включающие в себя эмульгируемые концентраты, могут быть получены простым смешиванием ингредиентов. Если растворитель жидкой композиции, предназначенный для применения в качестве эмульгируемого концентрата, не смешивается с водой, обычно для эмульгирования содержащего активный ингредиент растворителя при разбавлении водой добавляют эмульгатор. Суспензии активных ингредиентов с частицами диаметром до 2000 мкм могут быть измельчены во влажном состоянии с помощью мельниц для получения частиц со средними диаметрами менее 3 мкм. Водные суспензии могут быть преобразованы в конечные концентраты суспензий (см., например, U.S. 3,060,084) или дополнительно обработаны путем распылительной сушки с образованием диспергируемых в воде гранул. Для сухих составов, как правило, требуются процессы сухого измельчения, которые позволяют получить частицы со средним размером в диапазоне от 2 до 10 мкм. Пыли и порошки можно получить путем смешивания и, как правило, измельчения (например, с помощью молотковой мельницы или струйной мельницы). Гранулы и шарики можно получить путем распыления активного материала на предварительно сформированные гранулированные носители или методиками агломерирования. См. публикации Browning, "Agglomeration", *Chemical Engineering*, December 4, 1967, pp 147–48, *Perry's Chemical Engineer's Handbook*, 4th Ed., McGraw-Hill, New York, 1963, стр. 8–57 и далее, и WO 91/13546. Шарики можно получить так, как описано в U.S. 4,172,714. Диспергируемые в воде и водорастворимые гранулы могут быть

получены так, как описано в патентах U.S. 4,144,050, U.S. 3,920,442 и DE 3,246,493. Таблетки можно получить так, как описано в U.S. 5,180,587, U.S. 5,232,701 и U.S. 5,208,030. Пленки можно получить так, как описано в GB 2,095,558 и U.S. 3,299,566.

Для получения дополнительной информации, относящейся к техникам получения составов, см. T. S. Woods, "The Formulator's Toolbox – Product Forms for Modern Agriculture" in *Pesticide Chemistry and Bioscience, The Food-Environment Challenge*, T. Brooks and T. R. Roberts, Eds., Proceedings of the 9th International Congress on Pesticide Chemistry, The Royal Society of Chemistry, Cambridge, 1999, pp. 120–133. См. также U.S. 3,235,361, от столб. 6, строка 16, до столб. 7, строка 19, и примеры 10–41; U.S. 3,309,192, от столб. 5, строка 43, до столб. 7, строка 62, и примеры 8, 12, 15, 39, 41, 52, 53, 58, 132, 138–140, 162–164, 166, 167 и 169–182; U.S. 2,891,855, от столб. 3, строка 66, до столб. 5, строка 17, и примеры 1–4; Klingman, *Weed Control as a Science*, John Wiley and Sons, Inc., New York, 1961, pp 81–96; Hance et al., *Weed Control Handbook*, 8th Ed., Blackwell Scientific Publications, Oxford, 1989; и *Developments in formulation technology*, PJB Publications, Richmond, UK, 2000.

В приведенных ниже примерах все процентные доли являются массовыми и все составы получают стандартными способами. Номера соединений относятся к соединениям в таблице индексов А. Без дополнительного уточнения считается, что специалист в данной области, применяя предшествующее описание, сможет использовать настоящее изобретение в полной мере. Таким образом, приведенные ниже примеры необходимо рассматривать как исключительно иллюстративные, но ни в коей мере не ограничивающие изобретение. Если не указано иное, процентные доли являются массовыми.

Пример А

Высокопрочный концентрат

Соединение 1	98,5%
силикатный аэрогель	0,5%
синтетический аморфный мелкодисперсный кремнезем	1,0%

Пример В

Смачиваемый порошок

Соединение 1	65,0%
додецилфенолполиэтиленгликолевый эфир	2,0%
лигнинсульфонат натрия	4,0%
кремнийалюминат натрия	6,0%
монтмориллонит (прокаленный)	23,0%

Пример С

Гранула

Соединение 1	10,0%
гранулы аттапульгита (слаболетучее вещество,	90,0%

0,71/0,30 мм; сита U.S.S. № 25–50)

Пример DЭкструдированные шарики

Соединение 1	25,0%
безводный сульфат натрия	10,0%
неочищенный лигнинсульфонат кальция	5,0%
алкилнафталинсульфонат натрия	1,0%
бентонит кальция/магния	59,0%

Пример EЭмульгируемый концентрат

Соединение 1	10,0%
гексолеат полиоксиэтиленсорбита	20,0%
метиловый сложный эфир жирной кислоты C ₆ –C ₁₀	70,0%

Пример FМикроэмульсия

Соединение 1	5,0%
сополимер поливинилпирролидона и винилацетата	30,0%
алкилполиглизозид	30,0%
глицерилмоноолеат	15,0%
вода	20,0%

Пример GСуспензионный концентрат

Соединение 1	35%
блок-сополимер бутилполиоксиэтилена/полипропилена	4,0%
сополимер стеариновой кислоты / полиэтиленгликоля	1,0%
стирол-акриловый полимер	1,0%
ксантановая камедь	0,1%
пропиленгликоль	5,0%
силиконовый противовспенивающий агент	0,1%
1,2-бензизотиазолин-3-он	0,1%
вода	53,7%

Пример HЭмульсия в воде

Соединение 1	10,0%
блок-сополимер бутилполиоксиэтилена/полипропилена	4,0%
сополимер стеариновой кислоты / полиэтиленгликоля	1,0%
стирол-акриловый полимер	1,0%
ксантановая камедь	0,1%
пропиленгликоль	5,0%
силиконовый противовспенивающий агент	0,1%
1,2-бензизотиазолин-3-он	0,1%
ароматический углеводород на основе нефти	20,0
вода	58,7%

Пример IМасляная дисперсия

Соединение 1	25%
гексолеат полиоксиэтиленсорбита	15%
органически модифицированная бентонитовая глина	2,5%
метиловый сложный эфир жирной кислоты	57,5%

Настоящее описание также содержит приведенные выше примеры А–І, за исключением того, что «соединение 1» заменено на «соединение 2», «соединение 3», «соединение 4», «соединение 5», «соединение 6», «соединение 7», «соединение 8», «соединение 9» или «соединение 10».

Результаты испытаний показывают, что соединения по настоящему изобретению являются очень активными довсходовыми и/или послевсходовыми гербицидами и/или регуляторами роста растений. Соединения по изобретению по существу демонстрируют наивысшую активность в отношении послевсходовой борьбы с сорняками (т. е. наносятся после прорастания сорняков из почвы) и довсходовой борьбы с сорняками (т. е. наносятся до прорастания сорняков из почвы). Многие из них используются для до- и/или послевсходовой борьбы с широким спектром сорняков в тех областях, где требуется полный контроль над всей растительностью, например вокруг резервуаров для хранения топлива, промышленных складских областей, парковок, автокинотеатров, аэродромов, по берегам рек, ирригационных и другие водных путей, вокруг рекламных щитов и автодорожных и железнодорожных структур. Многие из соединений по настоящему изобретению в силу избирательного метаболизма в сельскохозяйственных культурах в сравнении с сорняками, или избирательной активности на участке физиологического ингибирования в сельскохозяйственных культурах и сорняках, или посредством избирательного помещения на или внутри среды смеси сельскохозяйственных культур и сорняков могут использоваться для избирательной борьбы со злаковыми и широколиственными сорняками в смеси сельскохозяйственная культура / сорняки. Специалисту в данной области должно быть понятно, что предпочтительную комбинацию этих факторов избирательности в пределах соединения или группы соединений можно легко определить посредством выполнения стандартных биологических и/или биохимических анализов. Соединения по настоящему изобретению могут демонстрировать толерантность к важным агрономическим культурам, включая, без ограничений, люцерну, ячмень, хлопок, пшеницу, рапс, сахарную свеклу, кукурузу (маис), сорго, сою, рис, овес, арахис, овощи, томаты, картофель, многолетние плантационные культуры, включая кофе, какао, масличную пальму, каучук, сахарный тростник, цитрус, виноград, фруктовые деревья, орехоплодные деревья, банан, овощной банан, ананас, хмель, чай, и леса, такие как эвкалиптовые и хвойные (например, сосна ладанная), и различные виды дерна (например, мятлик луговой, узкобороздник однобокий, овсяница тростниковая и свиной пальчатый). Соединения по настоящему изобретению могут применяться в сельскохозяйственных культурах, генетически модифицированных или выведенных путем скрещивания таким образом, чтобы они имели устойчивость к

гербицидам, экспрессировали белки, токсичные для беспозвоночных вредителей (таких как токсин *Bacillus thuringiensis*), и/или экспрессировали другие полезные признаки. Специалистам в данной области будет понятно, что не все соединения одинаково эффективны в отношении всех сорняков. Альтернативно соединения по предмету изобретения можно использовать для модификации роста растения.

Поскольку соединения по изобретению имеют как довсходовую, так и послевсходовую гербицидную активность для борьбы с нежелательной растительностью посредством уничтожения или повреждения растительности или уменьшения ее роста, соединения можно использовать для нанесения различными способами, включающими в себя приведение в контакт эффективного с точки зрения гербицидного действия количества соединения по изобретению или композиции, содержащей указанное соединение, и по меньшей мере одно из поверхностно-активного вещества, твердого разбавителя или жидкого разбавителя, с листьями или другой частью нежелательной растительности или с окружающей нежелательную растительность средой, такой как почва или вода, в которой нежелательная растительность растет или которая окружает семена или другие ростки нежелательной растительности. Нежелательная растительность включает в себя по меньшей мере одну, выбранную из группы, состоящей из злаковых сорняков и широколистных сорняков. Нежелательная растительность выбрана из группы, состоящей из мятлика однолетнего, коммелины бенгальской, лисохвоста мышехвостниковидного, паслена черного, ветвянки широколиственной, бодяка полевого, костера, дурнишника обыкновенного (*Xanthium pensylvanicum*), амброзии полыннолистной, мака-самосейки, фиалки полевой, щетинника крупноколосого, подмаренника цепкого, щетинника зеленого, проса гвинейского, череды волосистой, устойчивого к гербицидам лисохвоста мышехвостниковидного, мелколепестничка канадского, райграсса итальянского, дурмана обыкновенного, джонсовой травы (*Sorgho halepense*), росички кроваво-красной, канареечника малого, ипомеи, горца пенсильванского, ипомеи ямчатой, сиды колючей, пырея ползучего, амаранта колосистого, сорго травянистого, пастушьей сумки обыкновенной, мятлицы обыкновенной, подсолнечника (в качестве сорняка в картофеле), горца вьюнкового (*Polygonum convolvulus*), горчицы полевой (*Brassica kaber*), овсюга (*Avena fatua*), молочая разнолистного, щетинника желтого и сыти съедобной (*Cyperus esculentus*).

Эффективное с точки зрения гербицидного действия количество соединений по настоящему изобретению определяется рядом факторов. К этим факторам относятся: выбранный состав, способ нанесения, количество и тип присутствующей растительности, условия роста и т. д. В целом эффективное с точки зрения гербицидного действия

количество соединений по настоящему изобретению составляет от около 0,001 до 20 кг/га, причем предпочтительный диапазон составляет от около 0,004 до 1 кг/га. Специалист в данной области может легко определить эффективное с точки зрения гербицидного действия количество, необходимое для достижения желательного уровня борьбы с сорняками.

В одном общем варианте осуществления соединение по изобретению наносят, как правило, в составе композиции на участок, содержащий желательную растительность (например, сельскохозяйственные культуры) и нежелательную растительность (т. е. сорняки), обе из которых могут представлять собой семена, проростки и/или более крупные растения, в контакте со средой для выращивания (например, почвой). В этом участке композицию, содержащую соединение по изобретению, можно непосредственно наносить на растение или его часть, в частности на нежелательную растительность и/или на среду для выращивания в контакте с растением.

Хотя чаще всего соединения по изобретению применяются для борьбы с нежелательной растительностью, приведение в контакт желательной растительности на обработанном участке произрастания с соединениями по изобретению может привести к сверхаддитивным или усиленным эффектам с генетическими признаками желательной растительности, в том числе с признаками, введенными с помощью генетической модификации. Например, резистентность к растительоядным насекомым-вредителям или болезням растений, устойчивость к биотическим/абиотическим стрессам или стабильность при хранении могут быть больше ожидаемых вследствие генетических признаков в желательной растительности.

Соединения по настоящему изобретению также можно смешивать с одним или более биологически активными соединениями или агентами, включающими в себя гербициды, антитоксичные гербицидов, фунгициды, инсектициды, нематоциды, бактерициды, акарициды, регуляторы роста, такие как ингибиторы линьки насекомых и стимуляторы укоренения, химические стерилизаторы, семиохимические вещества, репелленты, аттрактанты, феромоны, стимуляторы поедания, питательные вещества для растений, другие биологически активные соединения или энтомопатогенные бактерии, вирус или грибы, с образованием многокомпонентного пестицида, обеспечивающего еще более широкий спектр защиты сельскохозяйственных растений. Смеси соединений по изобретению с другими гербицидами могут расширять спектр активности в отношении дополнительных видов сорняков и подавлять пролиферацию любых резистентных биотипов. Таким образом, настоящее изобретение также относится к композиции, содержащей соединение формулы 1 (в эффективном с точки зрения гербицидного действия количестве) и по

меньшей мере одно дополнительное биологически активное соединение или агент (в биологически эффективном количестве), и может дополнительно содержать по меньшей мере одно из поверхностно-активного вещества, твердого разбавителя или жидкого разбавителя. Другие биологически активные соединения или агенты могут быть составлены в виде композиций, содержащих по меньшей мере одно из поверхностно-активного вещества, твердого или жидкого разбавителя. Для смесей по настоящему изобретению одно или более других биологически активных соединений или агентов могут быть составлены вместе с соединением формулы 1 с образованием премикса или одно или более других биологически активных соединений или агентов могут быть составлены отдельно от соединения формулы 1, и составы объединяют вместе перед нанесением (например, в распылительном баке) или альтернативно наносят последовательно.

Особенно эффективно для борьбы с сорняками может использоваться смесь одного или более из перечисленных ниже гербицидов с соединением по настоящему изобретению: ацетохлор, ацифлуорофен и его натриевая соль, аклонифен, акролеин (2-пропеналь), алахлор, аллоксидим, аметрин, амикарбазон, амидосульфурон, аминоклопирахлор и его сложные эфиры (например, метиловый, этиловый) и соли (например, натриевая, калиевая), аминокипиралид, амитрол, сульфамат аммония, анилофос, асулам, атразин, азимсульфурон, бифлутамид, беназолин, беназолин-этил, бенкарбазон, бенфлуралин, бенфуресат, бенсульфурон-метил, бенсулид, бентазон, бензобициклон, бензофенап, бициклопирон, бифенокс, биланафос, биспирибак и его натриевая соль, бромацил, бромбутид, бромофеноксим, бромоксинил, бромоксинила октаноат, бутаклор, бутафенацил, бутаифос, бутралин, бутроксидим, бутилат, кафенстрол, карбетамид, карфентразон-этил, катехин, хлоретоксифен, хлорамбен, хлорбромурон, хлорфлуренол-метил, хлоридазон, хлоримурон-этил, хлоротолурон, хлорпрофам, хлорсульфурон, хлортал-диметил, хлортиамид, цинидон-этил, цинметилин, циносульфурон, клацифос, клефоксидим, клетодим, клодинафоп-пропаргил, кломазон, клемеппроп, клопиралид, клопиралид-оламин, клорансулам-метил, кумилурон, цианазин, циклоат, циклопириморат, циклосульфамурон, циклоксидим, цигалофоп-бутил, 2,4-D и его бутотиловый, бутиловый, изоктиловый и изопропиловый сложные эфиры, его диметиламмониевая, диоламиновая и троламиновая соли, даимурон, далапон, далапон-натрий, дазомет, 2,4-DB и его диметиламмониевая, калиевая и натриевая соли, десмедифам, десметрин, дикамба и ее дигликольаммониевая, диметиламмониевая, калиевая и натриевая соли, дихлобенил, дихлорпроп, дихлофоп-метил, диклосулам, дифензоквата метилсульфат, дифлуфеникан, дифлуфензопир, димефурон, димепиперат, диметаклор, диметаметрин, диметенамид,

диметенамид-Р, диметипин, диметиларсиновая кислота и ее натриевая соль, динитрамин, динотерб, дифенамид, диквата дибромид, дитиопир, диурон, динитро-о-крезол (DNOC), эндотал, этил-N, N-ди-н-пропилтиокарбамат (ЕРТС), эспрокарб, эталфлуралин, этаметсульфурон-метил, этиозин, этофумесат, этоксифен, этокисульфурон, этобензанид, феноксапроп-этил, феноксапроп-Р-этил, феноксасульфен, фенхинотрион, фентразамид, фенурон, фенурон-ТСА, флампроп-метил, флампроп-М-изопропил, флампроп-М-метил, флазасульфурон, флорасулам, флуазифоп-бутил, флуазифоп-Р-бутил, флуазолат, флукарбазон, флуцетосульфурон, флухлоралин, флуфенацет, флуфенпир, флуфенпир-этил, флуметсулам, флумиклорак-пентил, флумиоксазин, флуометурон, фторгликофен-этил, флупоксам, флупирсульфурон-метил и его натриевая соль, флуренол, флуренол-бутил, флуридон, флуорохлоридон, флуороксибир, флуртамон, флутиацет-метил, фомесафен, форамсульфурон, фосамин-аммоний, глюфосинат, глюфосинат-аммоний, глюфосинат-Р, глифосат и его соли, такие как аммониевая, изопропиламмониевая, калиевая, натриевая (включая полуторную натриевую соль) и тримезиевая (альтернативно называемая сульфосатом) соль, галауксифен, галауксифен-метил, галосульфурон-метил, галоксифоп-этотил, галоксифоп-метил, гексазинон, гидантоцидин, имазаметабенз-метил, имазамокс, имазапик, имазапир, имазахин, имазахин-аммоний, имазетапир, имазетапир-аммоний, имазосульфурон, инданофан, индазифлам, иофенсульфурон, йодосульфурон-метил, иоксинил, иоксинила октаноат, иоксинил-натрий, ипфенкарбазон, изопротурон, изоурон, изоксабен, изоксафлутол, изоксахлортол, лактофен, ленацил, линурон, малеиновый гидразид, МСРА и ее соли (например, МСРА-диметиламмоний, МСРА-калий и МСРА-натрий, сложные эфиры (например, МСРА-2-этилгексил, МСРА-бутотил) и тиоэфиры (например, МСРА-тиоэтил), МСРВ и ее соли (например, МСРВ-натрий) и сложные эфиры (например, МСРВ-этил), мекопроп, мекопроп-Р, мефенацет, мефлуидид, мезосульфурон-метил, мезотрион, метам-натрий, метамифоп, метамитрон, метазахлор, метазосульфурон, метабентиазулон, метиларсиновая кислота и ее кальциевая, моноаммониевая, мононатриевая и динатриевая соли, метилдимрон, метобензулон, метобромурон, метолахлор, S-метолахлор, метосулам, метоксурон, метрибузин, метсульфурон-метил, молинат, монолинулон, напроанилид, напропамид, напропамид-М, напталам, небурон, никосульфурон, норфлуразон, орбенкарб, ортосульфамурон, оризалин, оксадиаргил, оксадиазон, оксасульфурон, оксацикломефон, оксифлуорфен, параквата дихлорид, пебулат, пеларгоновая кислота, пендиметалин, пеноксулам, пентанохлор, пентоксазон, перфлуидон, петоксамид, петоксиамид, фенмедифам, пиклорам, пиклорам-калий, пиколинафен, пиноксаден, пиперофос, претилахлор, примисульфурон-метил, продиамин, профоксидим, прометон, прометрин, пропахлор, пропанил, пропаквизафоп,

пропазин, профам, пропизохлор, пропоксикарбазон, пропирисульфурон, пропизамид, просульфокарб, просульфулон, пираклонил, пирафлуфен-этил, пирасульфотол, пиразогил, пиразолинат, пиразоксифен, пиразосульфулон-этил, пирибензоксим, пирибутикарб, пиридат, пирифталид, пириминобак-метил, пиримисульфат, пиригиобак, пиригиобак-натрий, пироксасульфат, пироксулам, квинклолак, квинмерак, квинокламин, квизалофоп-этил, квизалофоп-Р-этил, квизалофоп-Р-тефурил, римсульфурон, сафлуфенацил, сетоксидим, сидурон, симазин, симетрин, сулкотрион, сульфентразон, сульфометурон-метил, сульфосульфулон, 2,3,6-трихлорбензойная кислота (ТВА), трихлоруксусная кислота (ТСА), натриевая соль ТСА, тебутам, тебутиурон, тефурилтрион, темботрион, тепралоксидим, тербацил, тербуметон, тербутилазин, тербутрин, тенилхлор, тиазопир, тиенкарбазон, тифенсульфурон-метил, тиобенкарб, тиафенацил, тиокарбазил, толпиралат, топрамезон, тралкоксидим, триаллат, триафамон, триасульфулон, триазифлам, трибенурон-метил, триклопир, триклопир-бутотил, триклопир-триэтиламмоний, тридифан, триэтазин, трифлорисульфулон, трифлудимоксазин, трифлуралин, трифлосульфулон-метил, тритосульфулон, вернолат, 3-(2-хлор-3,6-дифторфенил)-4-гидрокси-1-метил-1,5-нафтиридин-2(1*H*)-он, 5-хлор-3-[(2-гидрокси-6-оксо-1-циклогексен-1-ил)карбонил]-1-(4-метоксифенил)-2(1*H*)-хиноксалинон, 2-хлор-*N*-(1-метил-1*H*-тетразол-5-ил)-6-(трифторметил)-3-пиридинкарбоксамид, 7-(3,5-дихлор-4-пиридинил)-5-(2,2-дифторэтил)-8-гидроксипиридо[2,3-*b*]пиазин-6(5*H*)-он), 4-(2,6-диэтил-4-метилфенил)-5-гидрокси-2,6-диметил-3(2*H*)-пиридазинон), 5-[(2,6-дифторфенил)метокси]метил]-4,5-дигидро-5-метил-3-(3-метил-2-тиенил)изоксазол (ранее — метиоксолин), 4-(4-фторфенил)-6-[(2-гидрокси-6-оксо-1-циклогексен-1-ил)карбонил]-2-метил-1,2,4-триазин-3,5(2*H*,4*H*)-дион, метил 4-амино-3-хлор-6-(4-хлор-2-фтор-3-метоксифенил)-5-фтор-2-пиридинкарбоксилат, 2-метил-3-(метилсульфонил)-*N*-(1-метил-1*H*-тетразол-5-ил)-4-(трифторметил)бензамид и 2-метил-*N*-(4-метил-1,2,5-оксадиазол-3-ил)-3-(метилсульфинил)-4-(трифторметил)бензамид. Другие гербициды также включают в себя биогербициды, такие как *Alternaria destruens* Simmons, *Colletotrichum gloeosporioides* (Penz.) Penz. & Sacc., *Drechslera monoceras* (MTB-951), *Myrothecium verrucaria* (Albertini & Schweinitz) Ditmar: Fries, *Phytophthora palmivora* (Butl.) Butl. и *Puccinia thlaspeos* Schub.

Предпочтительными для более эффективной борьбы с нежелательной растительностью (например, меньшая частота применения, например за счет усиленных эффектов, более широкий спектр сорняков, с которыми осуществляется борьба, или повышенная безопасность сельскохозяйственной культуры) или для предотвращения развития резистентных сорняков являются смеси соединения по настоящему изобретению с гербицидом, выбранным из группы, состоящей из атразина, азимсульфулона, *S*-

бефлубутамида, бензизотиазолинона, карфентразон-этила, хлоримурон-этила, хлорсульфурон-метила, кломазона, клопиралида калия, клорансулам-метила, 2-[(2,4-дихлорфенил)метил]-4,4-диметил-3-изоксазолидинона, 2-[(2,5-дихлорфенил)метил]-4,4-диметил-3-изоксазолидинона, этаметсульфурон-метила, флуметсулама, 4-(4-фторфенил)-6-[(2-гидрокси-6-оксо-1-циклогексен-1-ил)карбонил]-2-метил-1,2,4-триазин-3,5-(2*H*,4*H*)-диона, флупирсульфурон-метила, флутиацет-метила, фомесафена, имазетапира, ленацила, мезотриона, метрибузина, метсульфурон-метила, петоксамида, пиклорама, пироксасульфона, квинклорака, римсульфурана, *S*-метолахлора, сульфентразона, трифенсульфурон-метила, трифлусульфурон-метила и трибенурон-метила.

Соединения по настоящему изобретению также можно применять в комбинации с регуляторами роста растений, такими как авиглицин, *N*-(фенилметил)-1*H*-пурин-6-амин, эпохолеон, гибберелловая кислота, гиббереллин А₄ и А₇, белок гарпин, мепиквата хлорид, прогексадион кальция, прогидрожасмон, нитрофенолят натрия и тринексапак-метил, и модифицирующими рост растений организмами, такими как *Bacillus cereus* штамма ВР01.

Общие ссылки на сельскохозяйственные средства защиты (например, гербициды, антидоты гербицидов, инсектициды, фунгициды, нематоциды, акарициды и биологические агенты) включают в себя публикации *The Pesticide Manual, 13th Edition*, C. D. S. Tomlin, Ed., British Crop Protection Council, Farnham, Surrey, U.K., 2003 и *The BioPesticide Manual, 2nd Edition*, L. G. Copping, Ed., British Crop Protection Council, Farnham, Surrey, U.K., 2001.

В вариантах осуществления, в которых применяются один или более из этих различных вариантов смешивания, компоненты смеси, как правило, применяются в количествах, аналогичных количествам, обычно применяемым при использовании этих компонентов смеси по отдельности. Более конкретно в смесях активные ингредиенты зачастую наносят с частотой нанесения в диапазоне от половины до полной частоты нанесения, указанной на этикетках продуктов в отношении применения активного ингредиента в отдельности. Эти количества перечислены в справочных материалах, таких как *The Pesticide Manual* и *The BioPesticide Manual*. Массовое соотношение этих различных компонентов смеси (в совокупности) и соединения формулы 1, как правило, находится в диапазоне от около 1 : 3000 до около 3000 : 1. Заслуживают внимания массовые соотношения от около 1 : 300 до около 300 : 1 (например, соотношения от около 1 : 30 до около 30 : 1). Специалист в данной области может легко определять с помощью простых экспериментов биологически эффективные количества активных ингредиентов, необходимых для достижения желательного спектра биологической активности. Будет очевидно, что включение этих дополнительных компонентов может расширять спектр

подавляемых сорняков по сравнению со спектром сорняков, борьба с которыми осуществляется только с помощью соединения формулы 1.

В определенных случаях комбинации соединения по настоящему изобретению с другими биологически активными (в частности, гербицидными) соединениями или агентами (т. е. активными ингредиентами) могут приводить к усиливающему аддитивному (т. е. улучшенному) эффекту в отношении сорняков и/или к ослабляющему аддитивному эффекту (т. е. повышению безопасности) в отношении сельскохозяйственных культур или других желательных растений. Уменьшение количества активных ингредиентов, высвобождаемых в окружающую среду, с одновременным обеспечением эффективной борьбы с вредителями всегда желательно. Также желательно применять более высокие количества активных ингредиентов для обеспечения более эффективной борьбы с сорняками без чрезмерного повреждения сельскохозяйственных культур. Если активные ингредиенты гербицидных смесей оказывают на сорняки улучшенный эффект с частотами нанесения, обеспечивающими удовлетворительные с агрономической точки зрения уровни борьбы с сорняками, такие комбинации могут иметь преимущество для снижения стоимости производства сельскохозяйственных культур и нагрузки на окружающую среду. Если гербицидные активные ингредиенты оказывают меньшее влияние на сельскохозяйственные культуры, такие комбинации могут быть предпочтительными для усиления защиты сельскохозяйственных культур путем снижения конкуренции с сорняками.

Заслуживает внимания комбинация соединения по изобретению с по меньшей мере одним другим гербицидным активным ингредиентом. Особого внимания заслуживает такая комбинация, где другой гербицидный активный ингредиент имеет другое место приложения действия соединения по изобретению. В определенных случаях комбинация с по меньшей мере одним другим гербицидным активным ингредиентом, имеющим аналогичный спектр подавления, но другое место приложения действия, будет особенно преимущественной для предотвращения развития устойчивости. Таким образом, композиция по настоящему изобретению может дополнительно содержать (в эффективном с точки зрения гербицидного действия количестве) по меньшей мере один дополнительный гербицидный активный ингредиент, имеющий аналогичный спектр подавления, но другое место приложения действия.

Соединения по настоящему изобретению также можно применять в комбинации с антидотами гербицидов, такими как аллидохлор, беноксакор, клоквинтоцет-мексил, кумилурон, циометринил, ципросульфонамид, даимурон, дихлормид, дициклонон, диэтолят, димепиперат, фенхлоразол-этил, фенклорим, флуразол, флуксофеним,

фурилазол, изоксацифен-этил, мефенпир-диэтил, мефенат, метоксифенон нафталинового ангидрида (1,8-нафталиновый ангидрид), оксабетринил, *N*-(аминокарбонил)-2-метилбензолсульфонамид, *N*-(аминокарбонил)-2-фторбензолсульфонамид, 1-бром-4-[(хлорметил)-сульфонил]-бензол (BCS), 4-(дихлорацетил)-1-окса-4-азоспиро[4.5]декан (MON 4660), 2-(дихлорметил)-2-метил-1,3-диоксолан (MG 191), этил 1,6-дигидро-1-(2-метоксифенил)-6-оксо-2-фенил-5-пиримидинкарбоксилат, 2-гидрокси-*N,N*-диметил-6-(трифторметил)пиридин-3-карбоксаимид и 3-оксо-1-циклогексен-1-ил 1-(3,4-диметилфенил)-1,6-дигидро-6-оксо-2-фенил-5-пиримидинкарбоксилат, 2,2-дихлор-1-(2,2,5-триметил-3-оксазолидинил)-этанон и 2-метокси-*N*-[[4-[[[(метиламино)карбонил]амино]фенил]сульфонил]-бензамид, для повышения безопасности определенных сельскохозяйственных культур. Эффективные с точки зрения антидотного действия количества антидотов гербицидов можно наносить одновременно с соединениями по настоящему изобретению или наносить в виде средств для обработки семян. Таким образом, аспект настоящего изобретения относится к гербицидной смеси, содержащей соединение по настоящему изобретению и эффективное с точки зрения антидотного действия количество антидота гербицида. Обработка семян особенно полезна для избирательной борьбы с сорняками, поскольку она физически ограничивает антидотное действие сельскохозяйственными растениями. Таким образом, особенно полезным вариантом осуществления настоящего изобретения является способ избирательного подавления роста нежелательной растительности в сельскохозяйственной культуре, включающий в себя приведение в контакт участка сельскохозяйственной культуры с эффективным с точки зрения гербицидного действия количеством соединения по настоящему изобретению, причем семена, из которых выращена сельскохозяйственная культура, обрабатывают эффективным с точки зрения антидотного действия количеством антидота. Эффективные с точки зрения антидотного действия количества антидотов могут быть легко определены специалистом в данной области путем простого экспериментирования.

Соединения по изобретению также можно смешивать с: (1) полинуклеотидами, включая, без ограничений, ДНК, РНК и/или химически модифицированные нуклеотиды, влияющие на количество конкретной мишени посредством понижающей регуляции, интерференции, супрессии или подавления экспрессии генетически модифицированного транскрипта, которые имеют гербицидный эффект; или (2) полинуклеотидами, включая, без ограничений, ДНК, РНК и/или химически модифицированные нуклеотиды, влияющие на количество конкретной мишени посредством понижающей регуляции, интерференции, супрессии или подавления экспрессии генетически модифицированного транскрипта,

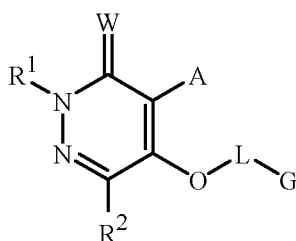
которые имеют антидотный эффект.

Заслуживает внимания композиция, содержащая соединение по изобретению (в эффективном с точки зрения гербицидного действия количестве), по меньшей мере один дополнительный активный ингредиент, выбранный из группы, состоящей из других гербицидов и антидотов гербицидов (в эффективном количестве), и по меньшей мере один компонент, выбранный из группы, состоящей из поверхностно-активных веществ, твердых разбавителей и жидких разбавителей.

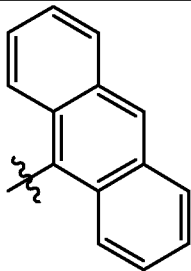
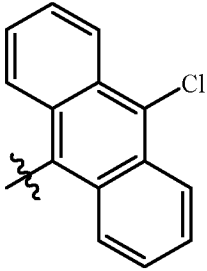
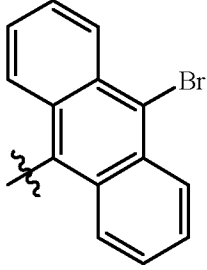
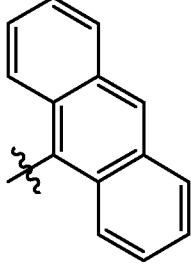
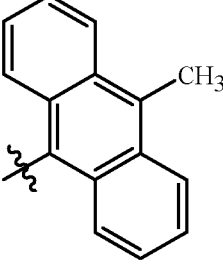
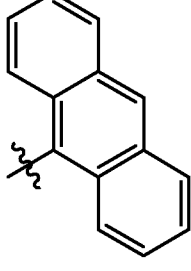
Предпочтительными для лучшей борьбы с нежелательной растительностью (например, меньшая рабочая концентрация, например в результате усиленных эффектов, более широкий спектр сорняков, с которыми ведется борьба, или повышенная безопасность для сельскохозяйственной культуры) или для предотвращения развития устойчивых сорняков являются смеси соединения по настоящему изобретению с гербицидом, выбранным из группы, состоящей из хлоримурон-этила, никосульфурона, мезотриона, тифенсульфурон-метила, флупирсульфурон-метила, трибенулона, пироксасульфона, пиноксадена, темботриона, пироксулама, метолахлора и S-метолахлора.

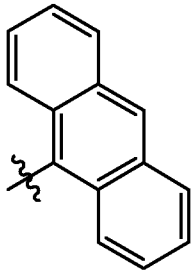
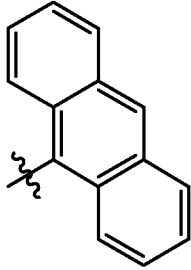
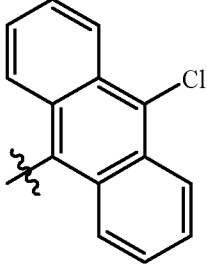
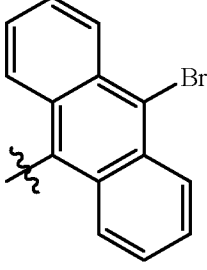
Представленные ниже испытания демонстрируют эффективность борьбы соединений по настоящему изобретению в отношении конкретных сорняков. Однако борьба с сорняками, обеспечиваемая композицией, не ограничена этими видами. В таблице А приведены описания соединений. В приведенной ниже таблице индексов используются следующие сокращения: «соед. №» обозначает «соединение номер», «прим.» обозначает «пример», а после него следует число, указывающее, в каком примере получено соединение. Спектры ЯМР ^1H представлены в ppm в сторону слабого поля от тетраметилсилана в растворе ДМСО- d_6 , если не указано иное; «с» обозначает синглет, «д» обозначает дуплет, «т» обозначает триплет, а «м» обозначает мультиплет.

Таблица индексов А



W представляет собой O

Соед. №	R ¹	R ²	L	G	A	T. пл. (°C)
1 (прим. 1)	Me	Cl	прямая связь	H		236–238 *
2 (прим. 2)	Me	Cl	прямая связь	H		*
3	Me	Cl	прямая связь	H		*
4	Me	Cl	прямая связь	CH ₃		*
5	Me	Cl	прямая связь	H		*
6	Me	Cl	прямая связь	C(=O)CH ₃		*

7	Me	Cl	прямая связь	Н (соль морфолина)		*
8	Me	Me	прямая связь	Н		*
9	Me	Me	прямая связь	Н		*
10	Me	Me	прямая связь	Н		*

* Данные ^1H ЯМР или масс-спектрометрии приведены в таблице индексов В.

Таблица индексов В

Соед. № Данные ^1H ЯМР (раствор ДМСО- d_6 , если не указано иное)^а и данные масс-спектрометрии

- | | |
|---|--|
| 1 | δ 8,70 (с, 1H), 8,15 (д, 2H), 7,68 (д, 2H), 7,52 (т, 2H), 7,45 (т, 2H), 5,75 (с, 1H), 3,67 (с, 3H). |
| 2 | δ 8,52 (д, 2H), 7,61 (д, 2H), 7,74 (искаженный т, 2H), 7,56 (искаженный т, 2H), 3,67 (с, 3H). |
| 3 | δ 8,53 (д, 2H), 7,80 (д, 2H), 7,74–7,71 (м, 2H), 7,56–7,53 (м, 2H), 3,67 (с, 3H). |
| 4 | (CDCl ₃) δ 8,57 (с, 1H), 8,08–8,04 (м, 2H), 7,68–7,64 (м, 2H), 7,51–7,46 (м, 4H), 3,82 (с, 3H), 3,05 (с, 3H). |
| 5 | δ 11,05 (уш. с, 1H), 8,44 (д, 2H), 7,70 (д, 2H), 7,58 (т, 2H), 7,47 (т, 2H), 3,68 (с, 3H), 3,16 (с, 3H). |
| 6 | (CDCl ₃) δ 8,55 (с, 1H), 8,03 (искаженный д, 2H), 7,60 (искаженный д, 2H), 7,49–7,42 (м, 4H), 3,91 (с, 3H), 1,68 (с, 3H). |
| 7 | 335 (M–1). |
| 8 | δ 10,12 (с, 1H), 8,69 (с, 1H), 8,13 (д, 2H), 7,60 (д, 2H), 7,51 (т, 2H), 7,42 (т, 2H), 3,65 (с, 3H), 2,33 (с, 3H). |

- 9 δ 10,23 (с, 1H), 8,52 (д, 2H), 7,74–7,70 (м, 4H), 7,57–7,52 (м, 2H), 3,65 (с, 3H), 2,32 (с, 3H).
- 10 δ 10,25 (с, 1H), 8,53 (д, 2H), 7,76–7,69 (м, 4H), 7,54 (дд, 2H), 3,65 (с, 3H), 2,32 (с, 3H).

^a Данные ¹H ЯМР приведены в ppm в сторону слабого поля от тетраметилсилана. Связи обозначены как (с) — синглет, (д) — дублет, (т) — триплет, (м) — мультиплет.

БИОЛОГИЧЕСКИЕ ПРИМЕРЫ ИЗОБРЕТЕНИЯ

ИСПЫТАНИЕ А

Семена видов растений, выбранных из ежовника обыкновенного (*Echinochloa crus-galli*), кохии (*Kochia scoparia*), амброзии (амброзия полыннолистная, *Ambrosia elatior*), плевела итальянского (итальянский плевел, *Lolium multiflorum*), щетинника зеленого (зеленый щетинник, *Setaria viridis*) и амаранта (*Amaranthus retroflexus*), высевали в смесь суглинистой почвы и песка и обрабатывали до всхода направленными брызгами грунта с использованием испытываемых химических соединений, находящихся в составе нефитотоксичной смеси растворителя, которая включала в себя поверхностно-активное вещество

В то же время растения, выбранные из этих видов сорняков, а также пшеницу (*Triticum aestivum*), кукурузу (*Zea mays*), лисохвост мышехвостниковидный (*Alopecurus myosuroides*) и подмаренник (подмаренник цепкий, *Galium aparine*) высевали в горшки, содержащие ту же смесь суглинистой почвы и песка, и обрабатывали после всхода путем нанесения испытываемых химических веществ, приготовленных аналогичным образом. При выполнении послевсходовой обработки растения имели высоту от 2 до 10 см и находились на стадии от одного до двух листьев. Обработанные растения и необработанные контроли выдерживали в теплице в течение приблизительно 10 дней, после чего все обработанные растения сравнивали с необработанными контролями и визуально оценивали на наличие повреждений. Результаты оценки растений, приведенные в таблице А, основаны на шкале от 0 до 100, где 0 указывает на отсутствие эффекта, а 100 представляет собой полный контроль. Результат (–) обозначает отсутствие результата испытания.

Таблица А 125 г а.и./га	Соединения						
	1	2	3	5	6	7	8
После всхода							
Ежовник обыкновенный	20	20	60	30	10	0	50
Лисохвост мышехвостниковидный	10	60	70	0	0	10	30
Кукуруза	0	0	10	20	0	10	10
Щетинник крупноколосый	–	–	–	–	20	10	60
Щетинник зеленый	50	60	90	30	–	–	–
Подмаренник 90	100	90	70	100	100	90	

Кохия	20	70	50	0	20	10	10
Амарант	100	100	100	90	100	100	100
Амброзия	90	90	90	20	90	100	90
Плевел итальянский	40	80	50	50	70	60	100
Пшеница	10	30	60	0	10	0	0
Таблица А	Соединения						
31 г а.и./га	1	2	3	5	6	7	8
После всхода							
Ежовник обыкновенный	0	0	20	0	0	0	10
Лисохвост	0	0	10	0	0	0	0
мышехвостниковидный							
Кукуруза	0	0	0	10	0	10	10
Щетинник крупноколосый	–	–	–	–	0	0	10
Щетинник зеленый	10	10	40	0	–	–	–
Подмаренник	70	20	90	20	80	70	80
Кохия	10	10	10	0	0	0	0
Амарант	90	100	100	50	100	100	90
Амброзия	80	90	80	10	90	90	90
Плевел итальянский	20	50	40	0	20	10	90
Пшеница	0	0	20	0	10	0	0
Таблица А	Соединения						
125 г а.и./га	1	2	3	5	6	7	8
До всхода							
Ежовник обыкновенный	0	0	50	0	0	0	10
Щетинник крупноколосый	–	–	10	0	10		
Щетинник зеленый	0	90	80	0	–	–	–
Кохия	20	10	50	0	0	0	0
Амарант	100	100	100	60	100	100	100
Амброзия	100	100	100	0	100	40	90
Плевел итальянский	30	70	80	0	30	0	50
Таблица А	Соединения						
31 г а.и./га	1	2	3	5	6	7	8
До всхода							
Ежовник обыкновенный	0	0	0	0	0	0	0
Щетинник крупноколосый	–	–	–	–	0	0	0
Щетинник зеленый	0	0	10	0	–	–	–
Кохия	0	0	0	0	0	0	0
Амарант	100	100	100	0	80	60	100
Амброзия	70	80	20	0	40	0	40
Плевел итальянский	20	20	20	0	30	0	10

ИСПЫТАНИЕ В

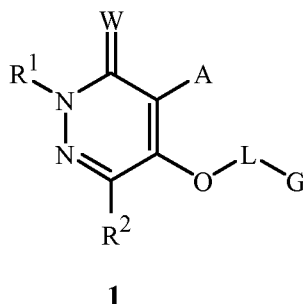
Растения в испытании с затопленной рисовой культурой, выбранной из риса (*Oryza sativa*), осоки, сыти (сыть разнородная, *Cyperus difformis*), утино́го салата (*Heteranthera limosa*) и ежовника (*Echinochloa crus-galli*), выращивали до стадии 2 листьев с целью испытания. На момент обработки горшки в испытании заполняли водой на 3 см над поверхностью почвы, обрабатывали посредством нанесения испытываемых соединений непосредственно в воду с рисовой культурой, а затем выдерживали на этой глубине воды

в течение всего периода испытания. Обработанные растения и контроли выдерживали в теплице в течение 13–15 дней, после чего все виды сравнивали с контролями и визуально оценивали. Результаты оценки растений, приведенные в таблице В, основаны на шкале от 0 до 100, где 0 указывает на отсутствие эффекта, а 100 представляет собой полный контроль. Результат (–) обозначает отсутствие результата испытания.

Таблица В	Соединения					
250 г а.и./га	1	2	5	6	7	8
Затопление						
Ежевник обыкновенный	20	0	0	0	0	15
Утиный салат	85	80	90	85	100	90
Рис	0	0	0	0	0	15
Осока, сыть	90	75	95	95	100	90

ФОРМУЛА ИЗОБРЕТЕНИЯ

1. Соединение формулы 1, его стереоизомеры, *N*-оксиды и соли



где

W представляет собой O или S;

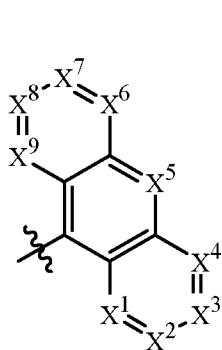
R¹ представляет собой H, C₁–C₇ алкил, C₃–C₈ алкилкарбонилалкил, C₃–C₈ алкоксикарбонилалкил, C₄–C₇ алкилциклоалкил, C₃–C₇ алкенил, C₃–C₇ алкинил, C₃–C₇ циклоалкил, C₄–C₇ циклоалкилалкил, C₂–C₃ цианоалкил, C₁–C₄ нитроалкил, C₂–C₇ галогеналкоксиалкил, C₁–C₇ галогеналкил, C₃–C₇ галогеналкенил, C₂–C₇ алкоксиалкил, C₃–C₇ алкилтиоалкил, C₁–C₇ алкокси, бензил или фенил; или 5- или 6-членное насыщенное или частично насыщенное гетероциклическое кольцо, содержащее члены кольца, выбранные из углерода и до 1 O и 1 S;

R² представляет собой H, галоген, циано, формил, C₁–C₇ алкил, C₃–C₈ алкилкарбонилалкил, C₃–C₈ алкоксикарбонилалкил, C₂–C₄ алкилкарбонил, C₂–C₇ алкилкарбонилокси, C₄–C₇ алкилциклоалкил, C₃–C₇ алкенил, C₃–C₇ алкинил, C₁–C₄ алкилсульфинил, C₁–C₄ алкилсульфонил, C₁–C₄ алкиламино, C₂–C₈ диалкиламино, C₃–C₇ циклоалкил, C₄–C₇ циклоалкилалкил, C₂–C₃ цианоалкил, C₁–C₄ нитроалкил, C₂–C₇ галогеналкоксиалкил, C₁–C₇ галогеналкил, C₃–C₇ галогеналкенил, C₂–C₇ алкоксиалкил, C₁–C₇ алкокси, C₁–C₅ алкилтио или C₂–C₃ алкоксикарбонил; или фенил, необязательно замещенный галогеном, C₁–C₄ алкилом или C₁–C₄ галогеналкилом;

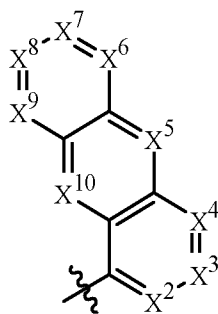
L представляет собой прямую связь, C₁–C₄ алкандиил или C₂–C₄ алкендиил;

G представляет собой H, C(=O)R⁵, C(=S)R⁵, CO₂R⁶, C(=O)SR⁶, S(O)₂R⁵, CONR⁷R⁸, S(O)₂NR⁷R⁸ или P(=O)R⁹R¹⁰; или C₁–C₄ алкил, C₂–C₄ алкенил, C₂–C₄ алкинил, C₁–C₄ галогеналкил, C₂–C₄ галогеналкенил, C₂–C₄ галогеналкинил, C₂–C₄ алкоксиалкил, C₃–C₆ циклоалкил или C₄–C₇ циклоалкилалкил; или 5- или 6-членное гетероциклическое кольцо;

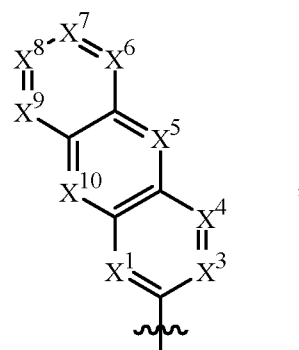
A выбран из



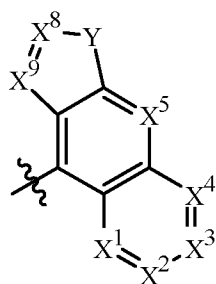
A-1



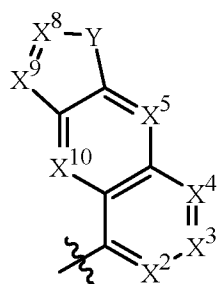
A-2



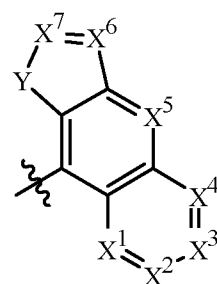
A-3



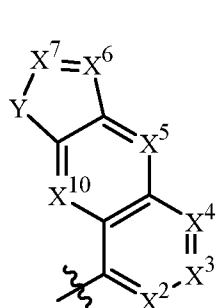
A-4



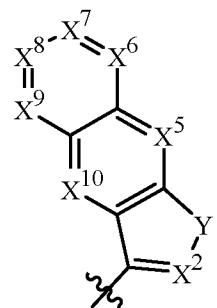
A-5



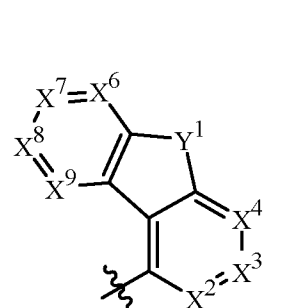
A-6



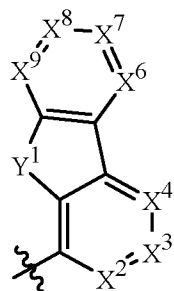
A-7



A-8



A-9



A-10

$X^1, X^2, X^3, X^4, X^5, X^6, X^7, X^8, X^9$ и X^{10} , каждый независимо, представляет собой N или CR^3 ; при условии, что не более 4 из $X^1, X^2, X^3, X^4, X^5, X^6, X^7, X^8, X^9$ и X^{10} представляют собой N;

Y представляет собой O, S или NR^4 ;

Y^1 представляет собой O, S, NR^4 или $CR^{3a}R^{3b}$;

каждый R^3 независимо представляет собой H, галоген, циано, нитро, C_1-C_5 алкил, C_2-C_5 алкенил, C_2-C_5 алкинил, C_3-C_5 циклоалкил, C_4-C_5 циклоалкилалкил, C_1-C_5 галогеналкил, C_3-C_5 галогеналкенил, C_3-C_5 галогеналкинил, C_2-C_5 алкоксиалкил, C_1-C_5 алкокси, C_1-C_5 галогеналкокси, C_1-C_5 алкилтио, C_1-C_4 алкилсульфинил, C_1-C_4 алкилсульфонил, C_1-C_5 галогеналкилтио или C_2-C_5 алкоксикарбонил;

R^{3a} представляет собой H, галоген, $-CN$, нитро, C_1-C_5 алкил, C_2-C_5 алкенил, C_2-C_5 алкинил, C_3-C_5 циклоалкил, C_4-C_5 циклоалкилалкил, C_1-C_5 галогеналкил, C_3-C_5 галогеналкенил, C_3-C_5 галогеналкинил, C_2-C_5 алкоксиалкил, C_1-C_5 алкокси, C_1-C_5 галогеналкокси, C_1-C_5 алкилтио, C_1-C_4 алкилсульфинил, C_1-C_4 алкилсульфонил, C_1-C_5 галогеналкилтио или C_2-C_5 алкоксикарбонил;

R^{3b} представляет собой H, галоген, $-CN$, нитро, C_1-C_5 алкил, C_2-C_5 алкенил, C_2-C_5 алкинил, C_3-C_5 циклоалкил, C_4-C_5 циклоалкилалкил, C_1-C_5 галогеналкил, C_3-C_5 галогеналкенил, C_3-C_5 галогеналкинил, C_2-C_5 алкоксиалкил, C_1-C_5 алкокси, C_1-C_5 галогеналкокси, C_1-C_5 алкилтио, C_1-C_4 алкилсульфинил, C_1-C_4 алкилсульфонил, C_1-C_5 галогеналкилтио или C_2-C_5 алкоксикарбонил; или

R^{3a} и R^{3b} взяты вместе как $=O$; или R^{3a} и R^{3b} взяты вместе с атомом углерода, с которым они связаны, с образованием необязательно замещенного 3–7-членного карбоциклического кольца;

R^4 представляет собой H, C_1-C_3 алкил или C_1-C_3 галогеналкил;

R^5 и R^7 независимо представляют собой H, C_1-C_7 алкил, C_3-C_7 алкенил, C_3-C_7 алкинил, C_3-C_7 циклоалкил, C_1-C_7 галогеналкил, C_3-C_7 галогеналкенил, C_2-C_7 алкоксиалкил или C_4-C_7 циклоалкилалкил; или фенильное, бензильное или 5–6-членное гетероциклическое кольцо, причем каждое фенильное, бензильное или гетероциклическое кольцо необязательно замещено галогеном, C_1-C_4 алкилом или C_1-C_4 галогеналкилом;

R^6 представляет собой C_1-C_7 алкил, C_3-C_7 алкенил, C_3-C_7 алкинил, C_3-C_7 циклоалкил, C_2-C_7 галогеналкил, C_3-C_7 галогеналкенил, C_2-C_7 алкоксиалкил или C_4-C_7 циклоалкилалкил; или фенильное, бензильное или 5–6-членное гетероциклическое кольцо, причем каждое фенильное, бензильное или гетероциклическое кольцо необязательно замещено галогеном, C_1-C_4 алкилом или C_1-C_4 галогеналкилом;

R^8 представляет собой H, C_1-C_7 алкил, C_2-C_7 алкенил, C_2-C_7 алкинил, C_3-C_7 циклоалкил, C_4-C_7 циклоалкилалкил, C_1-C_7 галогеналкил или C_2-C_7

алкоксиалкил;

R^9 представляет собой C_1-C_7 алкил или C_1-C_7 алкокси; и

R^{10} представляет собой C_1-C_7 алкил или C_1-C_7 алкокси.

2. Соединение по п. 1, в котором

R^1 представляет собой H, C_1-C_7 алкил, C_3-C_8 алкилкарбонилалкил, C_3-C_8 алкоксикарбонилалкил, C_4-C_7 алкилциклоалкил, C_3-C_7 алкенил, C_3-C_7 алкинил, C_3-C_7 циклоалкил, C_4-C_7 циклоалкилалкил, C_2-C_3 цианоалкил, C_1-C_4 нитроалкил, C_2-C_7 галогеналкоксиалкил, C_1-C_7 галогеналкил, C_3-C_7 галогеналкенил, C_2-C_7 алкоксиалкил, C_3-C_7 алкилтиоалкил, C_1-C_7 алкокси, бензил или фенил;

W представляет собой O;

A выбрано из A-1, A-4 и A-6;

L представляет собой прямую связь;

G представляет собой H, $C(=O)R^5$, $C(=S)R^5$, CO_2R^6 , $C(=O)SR^6$, $CONR^7R^8$ или $P(=O)R^9R^{10}$; или C_1-C_4 алкил, C_2-C_4 алкенил, C_2-C_4 алкинил, C_1-C_4 галогеналкил, C_2-C_4 галогеналкенил, C_2-C_4 галогеналкинил, C_2-C_4 алкоксиалкил, C_3-C_6 циклоалкил или C_4-C_7 циклоалкилалкил;

R^2 представляет собой H, галоген, циано, формил, C_1-C_7 алкил, C_3-C_8 алкилкарбонилалкил, C_3-C_8 алкоксикарбонилалкил, C_2-C_4 алкилкарбонил, C_2-C_7 алкилкарбонилокси, C_4-C_7 алкилциклоалкил, C_3-C_7 алкенил, C_3-C_7 алкинил, C_1-C_4 алкилсульфинил, C_1-C_4 алкилсульфонил, C_1-C_4 алкиламино, C_2-C_8 диалкиламино, C_3-C_7 циклоалкил, C_4-C_7 циклоалкилалкил, C_2-C_3 цианоалкил, C_1-C_4 нитроалкил, C_2-C_7 галогеналкоксиалкил, C_1-C_7 галогеналкил, C_3-C_7 галогеналкенил, C_2-C_7 алкоксиалкил, C_1-C_7 алкокси или C_1-C_5 алкилтио; и

каждый R^3 независимо представляет собой H, галоген, C_1-C_3 алкил, C_3-C_4 циклоалкил, C_1-C_3 галогеналкил или C_1-C_3 алкокси.

3. Соединение по п. 2, в котором

$R1$ представляет собой H, C_1-C_7 алкил, C_3-C_8 алкилкарбонилалкил, C_4-C_7 алкилциклоалкил, C_3-C_7 циклоалкил, C_4-C_7 циклоалкилалкил, C_2-C_3 цианоалкил, C_1-C_4 нитроалкил, C_2-C_7 галогеналкоксиалкил, C_1-C_7 галогеналкил, C_2-C_7 алкоксиалкил, C_3-C_7 алкилтиоалкил, C_1-C_7 алкокси или бензил;

A представляет собой A-1;

G представляет собой H, $C(=O)R^5$, CO_2R^6 , $CONR^7R^8$ или $P(=O)R^9R^{10}$; или C_1-C_4 алкил, C_2-C_4 алкенил, C_1-C_4 галогеналкил, C_2-C_4 галогеналкенил, C_2-C_4

алкоксиалкил, C₃–C₆ циклоалкил или C₄–C₇ циклоалкилалкил;

R² представляет собой H, галоген, циано, формил, C₁–C₇ алкил, C₂–C₄ алкилкарбонил, C₂–C₇ алкилкарбонилокси, C₄–C₇ алкилциклоалкил, C₁–C₄ алкилсульфинил, C₁–C₄ алкилсульфонил, C₁–C₄ алкиламино, C₃–C₇ циклоалкил, C₄–C₇ циклоалкилалкил, C₂–C₃ цианоалкил, C₁–C₄ нитроалкил, C₂–C₇ галогеналкоксиалкил, C₁–C₇ галогеналкил, C₂–C₇ алкоксиалкил или C₁–C₇ алкокси; и

каждый R³ независимо представляет собой H, галоген, C₁–C₂ алкил, циклопропил или C₁–C₂ галогеналкил.

4. Соединение по п. 3, в котором

R¹ представляет собой C₁–C₄ алкил, C₃–C₄ циклоалкил, C₂–C₃ цианоалкил, C₁–C₃ галогеналкил или C₂–C₄ алкоксиалкил;

G представляет собой H, C(=O)R⁵, CO₂R⁶ или P(=O)R⁹R¹⁰; или C₁–C₄ алкил, C₁–C₄ галогеналкил, C₂–C₄ алкоксиалкил или C₃–C₆ циклоалкил;

R² представляет собой H, галоген, циано, C₁–C₄ алкил, C₃–C₅ циклоалкил, C₁–C₃ галогеналкил, C₂–C₄ алкоксиалкил или C₁–C₃ алкокси; и

каждый R³ независимо представляет собой H, галоген, метил, этил или CF₃.

5. Соединение по п. 4, в котором

R¹ представляет собой метил, этил, н-пропил или 2-метоксиэтил;

G представляет собой H, C(=O)R⁵ или CO₂R⁶; или C₂–C₄ алкоксиалкил или C₃–C₆ циклоалкил;

R² представляет собой H, Cl, Br, I, –CN, метил или метокси; и

каждый R³ независимо представляет собой H, F, Cl, Br или метил.

6. Соединение по п. 6, выбранное из группы, состоящей из

4-(9-антраценил)-6-хлор-5-гидрокси-2-метил-3(2*H*)-пиридазинона;

6-хлор-4-(10-хлор-9-антраценил)-5-гидрокси-2-метил-3(2*H*)-пиридазинона; и

4-(10-бром-9-антраценил)-6-хлор-5-гидрокси-2-метил-3(2*H*)-пиридазинона.

7. Гербицидная композиция, включающая соединение по п. 1 и по меньшей мере один компонент, выбранный из группы, состоящей из поверхностно-активных веществ, твердых разбавителей и жидких разбавителей.

8. Гербицидная композиция, включающая соединение по п. 1, по меньшей мере один дополнительный активный ингредиент, выбранный из группы, состоящей из других гербицидов и антидотов гербицидов, и по меньшей мере один компонент, выбранный из группы, состоящей из поверхностно-активных веществ, твердых разбавителей и жидких разбавителей.

9. Гербицидная смесь, содержащая (а) соединение по п. 1 и (b) по меньшей мере один дополнительный активный ингредиент, выбранный из (b1) ингибиторов фотосистемы II, (b2) ингибиторов ацетогидрокси-ацидсинтазы (AHAS), (b3) ингибиторов ацетил-КоА-карбоксилазы (ACCase), (b4) миметиков ауксина, (b5) ингибиторов 5-енолпирувилшикимат-3-фосфат (EPSP) синтазы, (b6) диверторов электронов фотосистемы I, (b7) ингибиторов протопорфириногеноксидазы (PPO), (b8) ингибиторов глутаминсинтетазы (GS), (b9) ингибиторов элонгазы жирных кислот с очень длинной цепью (VLCFA), (b10) ингибиторов транспорта ауксина, (b11) ингибиторов фитоендесатуразы (PDS), (b12) ингибиторов 4-гидроксифенилпируватдиоксигеназы (HPPD), (b13) ингибиторов гомогентизатсоленизилтрансферазы (HST), (b14) ингибиторов биосинтеза целлюлозы, (b15) других гербицидов, в том числе средств, прерывающих митоз, органических мышьяковистых соединений, азулама, бромбутида, цинметилина, кумилулона, дазомета, дифензоквата, димрона, этобензанида, флуренола, фосамина, фосамин-аммония, гидантоцидина, метама, метилдимрона, олеиновой кислоты, оксазикломефона, пеларгоновой кислоты и пирибутикарба, а также (b16) антидотов гербицидов; и солей соединений (b1)–(b16).

10. Способ контроля роста нежелательной растительности, включающий приведение растительности или окружающей ее среды в контакт с эффективным с точки зрения гербицидного действия количеством соединения по п. 1.