

(19)



Евразийское
патентное
ведомство

(21) 202091468 (13) A1

(12) ОПИСАНИЕ ИЗОБРЕТЕНИЯ К ЕВРАЗИЙСКОЙ ЗАЯВКЕ

(43) Дата публикации заявки
2020.10.19

(22) Дата подачи заявки
2018.12.17

(51) Int. Cl. C07D 403/12 (2006.01)
A01N 43/54 (2006.01)
C07D 401/12 (2006.01)
C07D 405/12 (2006.01)
C07D 239/54 (2006.01)
C07D 413/12 (2006.01)
A01P 13/00 (2006.01)
A01P 21/00 (2006.01)

(54) ЗАМЕЩЕННЫЕ ТИОФЕНИЛУРАЦИДЫ, ИХ СОЛИ И ИХ ПРИМЕНЕНИЕ В КАЧЕСТВЕ ГЕРБИЦИДНЫХ СРЕДСТВ

(31) 17208493.1

(32) 2017.12.19

(33) EP

(86) PCT/EP2018/085262

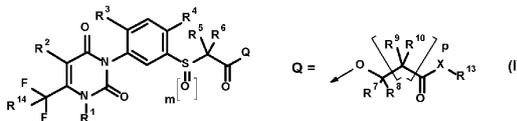
(87) WO 2019/121543 2019.06.27

(71) Заявитель:
ЗИНГЕНТА КРОП ПРОТЕКШН АГ
(CH)

(72) Изобретатель:
Хайнеман Инес, Фраккенполь Йенс,
Вильмс Лотар, Беффа Роланд,
Дитрих Хансйорг, Гатцвайлер
Эльмар, Мачеттира Ану Бхеэманах,
Розингер Кристофер Хью, Люммен
Петер, Асмус Элизабет (DE)

(74) Представитель:
Веселицкая И.А., Веселицкий М.Б.,
Кузенкова Н.В., Каксис Р.А., Белоусов
Ю.В., Куликов А.В., Кузнецова Е.В.,
Соколов Р.А., Кузнецова Т.В. (RU)

(57) Настоящее изобретение относится к замещенным тиофенилурацилам общей формулы (I) или их солям (I), где группы в общей формуле (I) являются такими, как определено в описании, а также к их применению в качестве гербицидов, в частности для контроля сорняков и/или сорных трав в сельскохозяйственных культурах выращиваемых растений, и/или в качестве регуляторов роста растений для влияния на рост сельскохозяйственных культур выращиваемых растений.



A1

202091468

202091468

A1

ЗАМЕЩЕННЫЕ ТИОФЕНИЛУРАЦИЛЫ, ИХ СОЛИ И ИХ ПРИМЕНЕНИЕ В КАЧЕСТВЕ ГЕРБИЦИДНЫХ СРЕДСТВ

5

Настоящее изобретение относится к области техники, касающейся продуктов для защиты сельскохозяйственных культур, в частности гербицидов для селективного контроля сорняков и сорных трав в сельскохозяйственных культурах полезных растений.

10

Конкретно, настоящее изобретение относится к замещенным тиофенилурацилам и их солям, к способам их получения и к их применению в качестве гербицидов, в частности для контроля сорняков и/или сорных трав в сельскохозяйственных культурах полезных растений, и/или в качестве регуляторов роста растений для влияния на рост

15

сельскохозяйственных культур полезных растений.

20

Известные на сегодняшний день продукты для защиты сельскохозяйственных культур для селективного контроля вредоносных растений в сельскохозяйственных культурах полезных растений или активные ингредиенты для контроля роста нежелательных растений обладают некоторыми недостатками при их использовании, которые заключаются в том, что либо они (а) не имеют гербицидного действия в отношении конкретных вредоносных растений или в противном случае их действие является недостаточным, либо (b) имеют слишком малый спектр вредоносных растений,

25

которые могут контролироваться активным ингредиентом, либо (с) имеют слишком низкую селективность в сельскохозяйственных культурах полезных растений и/или (d) имеют нежелательный профиль с точки зрения токсикологии. Кроме того, некоторые активные ингредиенты, которые можно применять в качестве регуляторов роста растений для некоторых полезных растений, приводят к нежелательному снижению урожайности других полезных растений, или они являются совместимыми с

30

культурным растением только в пределах узкого диапазона значений нормы применения, если это вообще имеет место. Некоторые из известных активных ингредиентов не могут быть получены экономичным способом в промышленном масштабе вследствие сложности с получением предшественников и реагентов, или они обладают всего лишь недостаточными показателями химической стабильности. Для

других активных ингредиентов эффект также в значительной степени зависит от условий окружающей среды, таких как погода и почвенные условия.

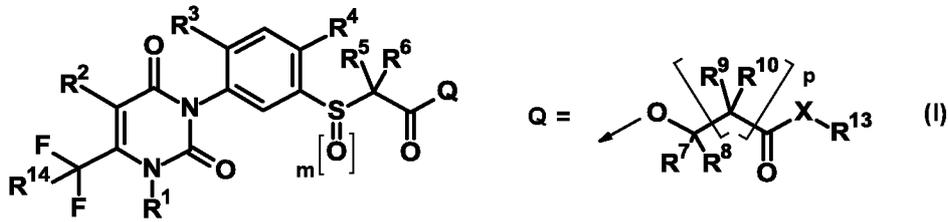
5 Остается необходимость в улучшении гербицидного действия таких известных соединений, особенно при низких нормах применения, и их совместимости с культурными растениями.

10 Из различных документов известно, что конкретные замещенные N-арилаурацилы могут использоваться в качестве активных гербицидных ингредиентов (см. EP408382, EP473551, EP648749, US4943309, US5084084, US5127935, WO91/00278, WO95/29168, WO95/30661, WO96/35679, WO97/01541, WO98/25909, WO1801/39597). Однако многие известные арилаурацилы имеют ряд недостатков в их действии, в частности в отношении однодольных сорняков. Ряд комбинаций активных гербицидных ингредиентов на основе N-арилаурацилов подобным образом стали известными (см. 15 DE4437197, EP714602, WO96/07323, WO96/08151, JP11189506). Однако свойства таких комбинаций активных ингредиентов также не были удовлетворительными во всех аспектах.

20 Вместе с тем известно, что конкретные N-арилаурацилы, необязательно содержащие дополнительно замещенные группы молочной кислоты, также могут применяться в качестве активных гербицидных ингредиентов (см. JP1800/302764, JP1801/172265, US6403534, EP408382). Дополнительно известно, что N-арилаурацилы, необязательно содержащие дополнительно замещенные группы тиомолочной кислоты, подобным образом демонстрируют гербицидные эффекты (см. WO2010/038953, KR2011110420).

25 Замещенные тиофенилаурацилы, необязательно содержащие дополнительно замещенные группы сложных эфиров тиоуксусной кислоты, напротив, по сути еще не описаны. В данной работе было неожиданно обнаружено, что конкретные замещенные тиофенилаурацилы или их соли обладают надлежащей пригодностью в качестве 30 гербицидов и особенно преимущественно могут применяться в качестве активных ингредиентов для контроля однодольных и двудольных сорняков в сельскохозяйственных культурах полезных растений.

Таким образом, настоящее изобретение предусматривает замещенные тиофенилурацилы общей формулы (I) или их соли,



5 в которых

R^1 представляет собой (C_1-C_8) -алкил, amino, бис[(C_1-C_8) -алкил]амино,

R^2 представляет собой водород, (C_1-C_8) -алкил,

10

R^3 представляет собой водород, галоген, (C_1-C_8) -алкокси,

R^4 представляет собой галоген, циано, NO_2 , $C(O)NH_2$, $C(S)NH_2$, (C_1-C_8) -галогеналкил, (C_2-C_8) -алкинил,

15

R^5 и R^6 независимо представляют собой водород, галоген, (C_1-C_8) -алкил, (C_3-C_8) -циклоалкил, (C_3-C_8) -циклоалкил- (C_1-C_8) -алкил, (C_2-C_8) -алкенил, (C_2-C_8) -алкинил, (C_1-C_{10}) -галогеналкил, (C_2-C_8) -галогеналкенил, (C_2-C_8) -галогеналкинил, (C_3-C_{10}) -галогенциклоалкил, (C_4-C_{10}) -циклоалкенил, (C_4-C_{10}) -галогенциклоалкенил, (C_1-C_8) -алкокси, (C_1-C_8) -алкокси- (C_1-C_8) -алкил, (C_1-C_8) -алкокси- (C_1-C_8) -галогеналкил, (C_1-C_8) -галогеналкокси- (C_1-C_8) -галогеналкил, (C_1-C_8) -галогеналкокси- (C_1-C_8) -алкил, арил, арил- (C_1-C_8) -алкил, гетероарил, гетероарил- (C_1-C_8) -алкил, (C_4-C_{10}) -циклоалкенил- (C_1-C_8) -алкил, гетероциклил, гетероциклил- (C_1-C_8) -алкил, (C_1-C_8) -алкилтио- (C_1-C_8) -алкил, (C_1-C_8) -галогеналкилтио- (C_1-C_8) -алкил, (C_1-C_8) -алкилкарбонил- (C_1-C_8) -алкил, $C(O)OR^{17}$, $C(O)NR^{15}R^{16}$, $C(O)R^{17}$, $R^{17}O(O)C-(C_1-C_8)$ -алкил, $R^{15}R^{16}N(O)C-(C_1-C_8)$ -алкил, $R^{15}R^{16}N-(C_1-C_8)$ -алкил, или

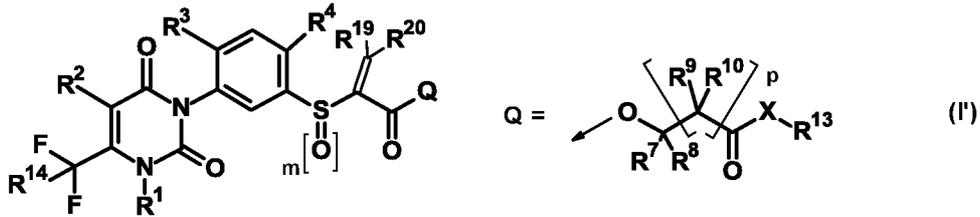
20

R^5 и R^6 вместе с атомом углерода, с которым они связаны, образуют полностью насыщенное или частично насыщенное 3-10-членное моноциклическое или

30

бициклическое кольцо, необязательно прерываемое гетероатомами и необязательно включающее дополнительное замещение, или

5 R^5 и R^6 вместе с атомом углерода, с которым они связаны, образуют двойную связь, необязательно дополнительно замещенную R^{19} и R^{20} , в соответствии с формулой (I') ниже,



10 m равняется 0, 1, 2,

p равняется 0, 1, 2, 3, 4, 5,

15 X представляет собой O (кислород) или фрагменты $N-R^{11}$ или $N-O-R^{12}$, и при этом R^{11} и R^{12} во фрагментах $N-R^{11}$ и $N-O-R^{12}$ независимо имеют значения в соответствии с определениями ниже,

20 R^7 , R^8 , R^9 и R^{10} независимо представляют собой водород, фтор, (C_1-C_8) -алкил, (C_3-C_8) -циклоалкил, (C_3-C_8) -циклоалкил- (C_1-C_8) -алкил, (C_2-C_8) -алкенил, (C_2-C_8) -алкинил, (C_1-C_{10}) -галогеналкил, (C_2-C_8) -галогеналкенил, (C_2-C_8) -галогеналкинил, (C_3-C_{10}) -галогенциклоалкил, (C_4-C_{10}) -циклоалкенил, (C_4-C_{10}) -галогенциклоалкенил, (C_1-C_8) -алкокси- (C_1-C_8) -галогеналкил, (C_1-C_8) -галогеналкокси- (C_1-C_8) -галогеналкил, арил, арил- (C_1-C_8) -алкил, гетероарил, гетероарил- (C_1-C_8) -алкил, (C_4-C_{10}) -циклоалкенил- (C_1-C_8) -алкил, гетероцикл, гетероцикл- (C_1-C_8) -алкил, $R^{17}O$ - (C_1-C_8) -алкил, $R^{18}S$ - (C_1-C_8) -алкил, (C_1-C_8) -алкилкарбонил- (C_1-C_8) -алкил, $C(O)OR^{17}$, $C(O)NR^{15}R^{16}$, $C(O)R^{17}$, $R^{17}O(O)C$ - (C_1-C_8) -алкил, $R^{15}R^{16}N(O)C$ - (C_1-C_8) -алкил, $R^{15}R^{16}N$ - (C_1-C_8) -алкил, или

30 R^5 и R^7 вместе с атомами углерода, с которыми они связаны, образуют полностью насыщенное или частично насыщенное 3-8-членное моноциклическое или

бициклическое кольцо, необязательно прерываемое гетероатомами и необязательно включающее дополнительное замещение, или

5 R^7 и R^8 вместе с атомом углерода, с которым они связаны, образуют полностью насыщенное или частично насыщенное 3-10-членное моноциклическое или бициклическое кольцо, необязательно прерываемое гетероатомами и необязательно включающее дополнительное замещение, или

10 R^9 и R^{10} вместе с атомом углерода, с которым они связаны, образуют полностью насыщенное или частично насыщенное 3-10-членное моноциклическое или бициклическое кольцо, необязательно прерываемое гетероатомами и необязательно включающее дополнительное замещение, или

15 R^9 и R^{10} вместе с атомом углерода, с которым они связаны, образуют экзометиленовую группу, или

20 R^7 и R^9 вместе с атомами углерода, с которыми они связаны, образуют полностью насыщенное или частично насыщенное 3-10-членное моноциклическое или бициклическое кольцо, необязательно прерываемое гетероатомами и необязательно включающее дополнительное замещение,

25 R^{11} представляет собой водород, (C₁-C₈)-алкил, (C₃-C₈)-циклоалкил, циано-(C₁-C₈)-алкил, (C₃-C₈)-циклоалкил-(C₁-C₈)-алкил, (C₁-C₈)-алкилсульфонил, арилсульфонил, гетероарилсульфонил, (C₃-C₈)-циклоалкилсульфонил, гетероциклилсульфонил, арил-(C₁-C₈)-алкилсульфонил, (C₁-C₈)-алкилкарбонил, арилкарбонил, гетероарилкарбонил, (C₃-C₈)-циклоалкилкарбонил, гетероциклилкарбонил, (C₁-C₈)-алкоксикарбонил, (C₁-C₈)-алкокси, (C₂-C₈)-алкенилокси, арил-(C₁-C₈)-алкоксикарбонил, (C₁-C₈)-галогеналкилкарбонил, (C₂-C₈)-алкенил, (C₂-C₈)-алкинил, (C₁-C₈)-галогеналкил, галоген-(C₂-C₈)-алкинил, галоген-(C₂-C₈)-алкенил, (C₁-C₈)-алкокси-(C₁-C₈)-алкил, amino, (C₁-C₈)-алкиламино, бис[(C₁-C₈)-алкил]амино, (C₁-C₈)-алкокси-(C₁-C₈)-алкокси-(C₁-C₈)-алкил, гетероарил-(C₁-C₈)-алкилсульфонил, гетероциклил-(C₁-C₈)-алкилсульфонил, (C₂-C₈)-алкенилоксикарбонил, (C₂-C₈)-алкинилоксикарбонил,

30

(C₁-C₈)-алкиламинокарбонил, (C₃-C₈)-циклоалкиламинокарбонил, бис-[(C₁-C₈)-алкил]аминокарбонил,

5 R¹² представляет собой водород, (C₁-C₈)-алкил, (C₃-C₈)-циклоалкил-(C₁-C₈)-алкил, (C₂-C₈)-алкенил, (C₂-C₈)-алкинил, (C₁-C₈)-алкокси-(C₁-C₈)-алкил, арил, арил-(C₁-C₈)-алкил, R¹⁷O(O)C-(C₁-C₈)-алкил, R¹⁵R¹⁶N(O)C-(C₁-C₈)-алкил,

10 R¹³ представляет собой водород, (C₁-C₈)-алкил, (C₁-C₈)-галогеналкил, (C₃-C₈)-циклоалкил, (C₃-C₈)-циклоалкил-(C₁-C₈)-алкил, (C₂-C₈)-алкенил, (C₂-C₈)-алкинил, (C₁-C₈)-алкокси-(C₁-C₈)-алкил, (C₁-C₈)-галогеналкокси-(C₁-C₈)-алкил, арил, арил-(C₁-C₈)-алкил, гетероарил, гетероарил-(C₁-C₈)-алкил, гетероцикл, гетероцикл-(C₁-C₈)-алкил, (C₁-C₈)-алкилтио-(C₁-C₈)-алкил, (C₁-C₈)-галогеналкилтио-(C₁-C₈)-алкил, (C₁-C₈)-алкилкарбонил-(C₁-C₈)-алкил, R¹⁷O(O)C-(C₁-C₈)-алкил, R¹⁵R¹⁶N(O)C-(C₁-C₈)-алкил, R¹⁵R¹⁶N-(C₁-C₈)-алкил, или

15 R⁷ и R¹³ вместе с атомами, с которыми они связаны, образуют полностью насыщенное или частично насыщенное 3-10-членное моноциклическое или бициклическое кольцо, необязательно прерываемое гетероатомами и необязательно включающее дополнительное замещение, или

20 R⁹ и R¹³ вместе с атомами, с которыми они связаны, образуют полностью насыщенное или частично насыщенное 3-10-членное моноциклическое или бициклическое кольцо, необязательно прерываемое гетероатомами и необязательно включающее дополнительное замещение, или

25 R¹¹ и R¹³, если X представляет собой N-R¹¹, вместе с атомом азота, с которым они связаны, образуют 4-10-членное моноциклическое или бициклическое кольцо, которое является полностью насыщенным или необязательно прерываемым гетероатомами и необязательно включает дополнительное замещение, или

30 R¹² и R¹³, если X представляет собой N-O-R¹², вместе с атомом азота, с которым они связаны, образуют полностью насыщенное и необязательно дополнительно замещенное 4-10-членное моноциклическое или бициклическое кольцо,

R¹⁴ представляет собой водород, фтор, хлор, бром, (C₁-C₅)-галогеналкил, (C₁-C₈)-алкокси,

R¹⁵ и R¹⁶ являются одинаковыми или различными и независимо представляют собой
 5 водород, (C₁-C₈)-алкил, (C₂-C₈)-алкенил, (C₂-C₈)-алкинил, (C₁-C₈)-цианоалкил, (C₁-C₁₀)-галогеналкил, (C₂-C₈)-галогеналкенил, (C₂-C₈)-галогеналкинил, (C₃-C₁₀)-циклоалкил, (C₃-C₁₀)-галогенциклоалкил, (C₄-C₁₀)-циклоалкенил, (C₄-C₁₀)-галогенциклоалкенил, (C₁-C₈)-алкокси-(C₁-C₈)-алкил, (C₁-C₈)-галогеналкокси-(C₁-C₈)-алкил, (C₁-C₈)-алкилтио-(C₁-C₈)-алкил, (C₁-C₈)-галогеналкилтио-(C₁-C₈)-
 10 алкил, (C₁-C₈)-алкокси-(C₁-C₈)-галогеналкил, арил, арил-(C₁-C₈)-алкил, гетероарил, гетероарил-(C₁-C₈)-алкил, (C₃-C₈)-циклоалкил-(C₁-C₈)-алкил, (C₄-C₁₀)-циклоалкенил-(C₁-C₈)-алкил, COR¹⁷, SO₂R¹⁸, (C₁-C₈)-алкил-HNO₂S-, (C₃-C₈)-циклоалкил-HNO₂S-, гетероциклил, (C₁-C₈)-алкоксикарбонил-(C₁-C₈)-алкил, (C₁-C₈)-алкоксикарбонил, арил-(C₁-C₈)-алкоксикарбонил-(C₁-C₈)-алкил, арил-(C₁-
 15 C₈)-алкоксикарбонил, гетероарил-(C₁-C₈)-алкоксикарбонил, (C₂-C₈)-алкенилоксикарбонил, (C₂-C₈)-алкинилоксикарбонил, гетероциклил-(C₁-C₈)-алкил,

R¹⁷ представляет собой водород, (C₁-C₈)-алкил, (C₂-C₈)-алкенил, (C₂-C₈)-алкинил,
 20 (C₁-C₈)-цианоалкил, (C₁-C₁₀)-галогеналкил, (C₂-C₈)-галогеналкенил, (C₂-C₈)-галогеналкинил, (C₃-C₁₀)-циклоалкил, (C₃-C₁₀)-галогенциклоалкил, (C₄-C₁₀)-циклоалкенил, (C₄-C₁₀)-галогенциклоалкенил, (C₁-C₈)-алкокси-(C₁-C₈)-алкил, (C₁-C₈)-алкокси-(C₁-C₈)-галогеналкил, арил, арил-(C₁-C₈)-алкил, гетероарил, гетероарил-(C₁-C₈)-алкил, (C₃-C₈)-циклоалкил-(C₁-C₈)-алкил, (C₄-C₁₀)-циклоалкенил-(C₁-C₈)-алкил, (C₁-
 25 C₈)-алкоксикарбонил-(C₁-C₈)-алкил, (C₂-C₈)-алкенилоксикарбонил-(C₁-C₈)-алкил, арил-(C₁-C₈)-алкоксикарбонил-(C₁-C₈)-алкил, гидроксикарбонил-(C₁-C₈)-алкил, гетероциклил, гетероциклил-(C₁-C₈)-алкил,

R¹⁸ представляет собой водород, (C₁-C₈)-алкил, (C₂-C₈)-алкенил, (C₂-C₈)-алкинил,
 30 (C₁-C₈)-цианоалкил, (C₁-C₁₀)-галогеналкил, (C₂-C₈)-галогеналкенил, (C₂-C₈)-галогеналкинил, (C₃-C₁₀)-циклоалкил, (C₃-C₁₀)-галогенциклоалкил, (C₄-C₁₀)-циклоалкенил, (C₄-C₁₀)-галогенциклоалкенил, (C₁-C₈)-алкокси-(C₁-C₈)-алкил, (C₁-C₈)-алкокси-(C₁-C₈)-галогеналкил, арил, арил-(C₁-C₈)-алкил, гетероарил,

гетероарил-(C₁-C₈)-алкил, гетероциклил-(C₁-C₈)-алкил, (C₃-C₈)-циклоалкил-(C₁-C₈)-алкил, (C₄-C₁₀)-циклоалкенил-(C₁-C₈)-алкил, NR¹⁵R¹⁶

и

5

R¹⁹ и R²⁰ независимо представляют собой водород, галоген, (C₁-C₈)-алкил, (C₃-C₈)-циклоалкил, (C₂-C₈)-алкенил, (C₂-C₈)-алкинил, (C₁-C₁₀)-галогеналкил, арил или

10

R¹⁹ и R²⁰ вместе с атомом углерода, с которым они связаны, образуют 3-10-членное моноциклическое или бициклическое кольцо, которое является насыщенным или необязательно прерываемым гетероатомами и необязательно включает дополнительное замещение.

15

Соединения общей формулы (I) могут образовывать соли в результате добавления подходящей неорганической или органической кислоты, например минеральных кислот, например, HCl, HBr, H₂SO₄, H₃PO₄ или HNO₃, или органических кислот, например карбоновых кислот, таких как муравьиная кислота, уксусная кислота, пропионовая кислота, щавелевая кислота, молочная кислота или салициловая кислота, или сульфоновых кислот, например п-толуолсульфоновой кислоты, к основной группе, например амина, алкиламина, диалкиламина, пиперидино, морфолино или пиридино. В таком случае такие соли содержат сопряженное основание для кислоты в качестве аниона. Подходящие заместители в депротонированной форме, например сульфоновые кислоты, в частности сульфонамиды или карбоновые кислоты, могут образовывать внутренние соли с группами, которые в свою очередь способны к протонированию, такими как аминогруппы. Соли также можно образовывать посредством воздействия основания на соединения общей формулы (I). Подходящие основания представляют собой, например, органические амины, такие как триалкиламины, морфолин, пиперидин и пиридин, и гидроксиды, карбонаты и гидрокарбонаты аммония, щелочных металлов или щелочноземельных металлов, в частности, гидроксид натрия и гидроксид калия, карбонат натрия и карбонат калия и гидрокарбонат натрия и гидрокарбонат калия. Такие соли представляют собой соединения, в которых кислотный водород заменен подходящим с точки зрения сельского хозяйства катионом, например, соли металлов, в частности, соли щелочных металлов или соли щелочноземельных металлов, в частности, соли натрия и калия, или еще соли аммония, соли с

30

органическими аминами или соли четвертичного аммония, например с катионами формулы $[NR^aR^bR^cR^d]^+$, в которой каждый из R^a - R^d независимо представляет собой органический радикал, в частности, алкил, арил, аралкил или алкиларил. Также пригодны соли алкилсульфония и алкилсульфоксония, такие как соли (C₁-C₄)-триалкилсульфония и (C₁-C₄)-триалкилсульфоксония.

Соединения формулы (I), применяемые в соответствии с настоящим изобретением, и их соли далее в данном документе называются "соединениями общей формулы (I)".

10 Настоящее изобретение предпочтительно предусматривает соединения общей формулы (I), в которой

R^1 представляет собой (C₁-C₇)-алкил, amino, бис[(C₁-C₇)-алкил]амино,

15 R^2 представляет собой водород, (C₁-C₇)-алкил,

R^3 представляет собой водород, галоген, (C₁-C₇)-алкокси,

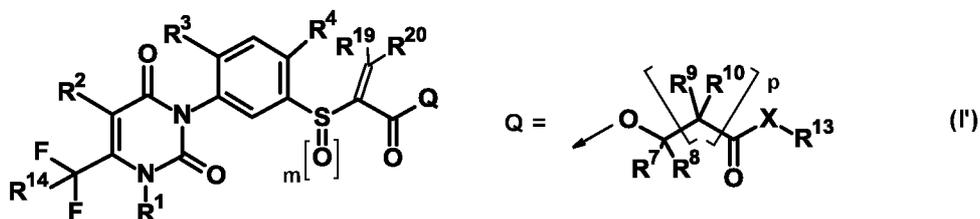
20 R^4 представляет собой галоген, циано, NO₂, C(O)NH₂, C(S)NH₂, (C₁-C₇)-галогеналкил, (C₂-C₇)-алкинил,

R^5 и R^6 независимо представляют собой водород, галоген, (C₁-C₇)-алкил, (C₃-C₇)-циклоалкил, (C₃-C₇)-циклоалкил-(C₁-C₇)-алкил, (C₂-C₇)-алкенил, (C₂-C₇)-алкинил, (C₁-C₁₀)-галогеналкил, (C₂-C₇)-галогеналкенил, (C₂-C₇)-галогеналкинил, (C₃-C₁₀)-галогенциклоалкил, (C₄-C₁₀)-циклоалкенил, (C₄-C₁₀)-галогенциклоалкенил, (C₁-C₇)-алкокси, (C₁-C₇)-алкокси-(C₁-C₇)-алкил, (C₁-C₇)-алкокси-(C₁-C₇)-галогеналкил, (C₁-C₇)-галогеналкокси-(C₁-C₇)-галогеналкил, (C₁-C₇)-галогеналкокси-(C₁-C₇)-алкил, арил, арил-(C₁-C₇)-алкил, гетероарил, гетероарил-(C₁-C₇)-алкил, (C₄-C₁₀)-циклоалкенил-(C₁-C₇)-алкил, гетероциклил, гетероциклил-(C₁-C₇)-алкил, (C₁-C₇)-алкилтио-(C₁-C₇)-алкил, (C₁-C₇)-галогеналкилтио-(C₁-C₇)-алкил, (C₁-C₇)-алкилкарбонил-(C₁-C₇)-алкил, C(O)OR¹⁷, C(O)NR¹⁵R¹⁶, C(O)R¹⁷, R¹⁷O(O)C-(C₁-C₇)-алкил, R¹⁵R¹⁶N(O)C-(C₁-C₇)-алкил, R¹⁵R¹⁶N-(C₁-C₇)-алкил, или

R^5 и R^6 вместе с атомом углерода, с которым они связаны, образуют полностью насыщенное или частично насыщенное 3-10-членное моноциклическое или бициклическое кольцо, необязательно прерываемое гетероатомами и необязательно включающее дополнительное замещение, или

5

R^5 и R^6 вместе с атомом углерода, с которым они связаны, образуют двойную связь, необязательно дополнительно замещенную R^{19} и R^{20} , в соответствии с формулой (I') ниже,



10

m равняется 0, 1, 2,

p равняется 0, 1, 2, 3,

15

X представляет собой O (кислород), N (азот) или фрагменты $N-R^{11}$ или $N-O-R^{12}$, и при этом R^{11} и R^{12} во фрагментах $N-R^{11}$ и $N-O-R^{12}$ независимо имеют значения в соответствии с определениями ниже,

R^7 , R^8 , R^9 и R^{10} независимо представляют собой водород, фтор, (C_1-C_7) -алкил, (C_3-C_7) -циклоалкил, (C_3-C_7) -циклоалкил- (C_1-C_7) -алкил, (C_2-C_7) -алкенил, (C_2-C_7) -алкинил, (C_1-C_{10}) -галогеналкил, (C_2-C_7) -галогеналкенил, (C_2-C_7) -галогеналкинил, (C_3-C_{10}) -галогенциклоалкил, (C_4-C_{10}) -циклоалкенил, (C_4-C_{10}) -галогенциклоалкенил, (C_1-C_7) -алкокси- (C_1-C_7) -галогеналкил, (C_1-C_7) -галогеналкокси- (C_1-C_7) -галогеналкил, арил, арил- (C_1-C_7) -алкил, гетероарил, гетероарил- (C_1-C_7) -алкил, (C_4-C_{10}) -циклоалкенил- (C_1-C_7) -алкил, гетероциклил, гетероциклил- (C_1-C_7) -алкил, $R^{17}O-(C_1-C_7)$ -алкил, $R^{18}S-(C_1-C_7)$ -алкил, (C_1-C_7) -алкилкарбонил- (C_1-C_7) -алкил, $C(O)OR^{17}$, $C(O)NR^{15}R^{16}$, $C(O)R^{17}$, $R^{17}O(O)C-(C_1-C_7)$ -алкил, $R^{15}R^{16}N(O)C-(C_1-C_7)$ -алкил, $R^{15}R^{16}N-(C_1-C_7)$ -алкил, или

30

R^5 и R^7 вместе с атомами углерода, с которыми они связаны, образуют полностью насыщенное или частично насыщенное 3-8-членное моноциклическое или бициклическое кольцо, необязательно прерываемое гетероатомами и необязательно включающее дополнительное замещение, или

5 R^7 и R^8 вместе с атомом углерода, с которым они связаны, образуют полностью насыщенное или частично насыщенное 3-10-членное моноциклическое или бициклическое кольцо, необязательно прерываемое гетероатомами и необязательно включающее дополнительное замещение, или

10 R^9 и R^{10} вместе с атомом углерода, с которым они связаны, образуют полностью насыщенное или частично насыщенное 3-10-членное моноциклическое или бициклическое кольцо, необязательно прерываемое гетероатомами и необязательно включающее дополнительное замещение, или

15 R^9 и R^{10} вместе с атомом углерода, с которым они связаны, образуют экзометиленовую группу, или

20 R^7 и R^9 вместе с атомами углерода, с которыми они связаны, образуют полностью насыщенное или частично насыщенное 3-10-членное моноциклическое или бициклическое кольцо, необязательно прерываемое гетероатомами и необязательно включающее дополнительное замещение,

25 R^{11} представляет собой водород, (C_1-C_7) -алкил, (C_3-C_7) -циклоалкил, циано- (C_1-C_7) -алкил, (C_3-C_7) -циклоалкил- (C_1-C_7) -алкил, (C_1-C_7) -алкилсульфонил, арилсульфонил, гетероарилсульфонил, (C_3-C_7) -циклоалкилсульфонил, гетероциклилсульфонил, арил- (C_1-C_7) -алкилсульфонил, (C_1-C_7) -алкилкарбонил, арилкарбонил, гетероарилкарбонил, (C_3-C_7) -циклоалкилкарбонил, гетероциклилкарбонил, (C_1-C_7) -алкоксикарбонил, (C_1-C_7) -алкокси, (C_2-C_7) -алкенилокси, арил- (C_1-C_7) -алкоксикарбонил, (C_1-C_7) -галогеналкилкарбонил, (C_2-C_7) -алкенил, (C_2-C_7) -алкинил, (C_1-C_7) -галогеналкил, галоген- (C_2-C_7) -алкинил, галоген- (C_2-C_7) -алкенил, (C_1-C_7) -алкокси- (C_1-C_7) -алкил, амино, (C_1-C_7) -алкиламино, бис[(C_1-C_7) -алкил]амино, (C_1-C_7) -алкокси- (C_1-C_7) -алкокси- (C_1-C_7) -алкил, гетероарил- (C_1-C_7) -алкилсульфонил, гетероциклил- (C_1-C_7) -

30

алкилсульфонил, (C₂-C₇)-алкенилоксикарбонил, (C₂-C₇)-алкинилоксикарбонил, (C₁-C₇)-алкиламинокарбонил, (C₃-C₇)-циклоалкиламинокарбонил, бис-[(C₁-C₇)-алкил]аминокарбонил,

5 R¹² представляет собой водород, (C₁-C₇)-алкил, (C₃-C₇)-циклоалкил-(C₁-C₇)-алкил, (C₂-C₇)-алкенил, (C₂-C₇)-алкинил, (C₁-C₇)-алкокси-(C₁-C₇)-алкил, арил, арил-(C₁-C₇)-алкил, R¹⁷O(O)C-(C₁-C₇)-алкил, R¹⁵R¹⁶N(O)C-(C₁-C₇)-алкил,

10 R¹³ представляет собой водород, (C₁-C₇)-алкил, (C₁-C₇)-галогеналкил, (C₃-C₇)-циклоалкил, (C₃-C₇)-циклоалкил-(C₁-C₇)-алкил, (C₂-C₇)-алкенил, (C₂-C₇)-алкинил, (C₁-C₇)-алкокси-(C₁-C₇)-алкил, (C₁-C₇)-галогеналкокси-(C₁-C₇)-алкил, арил, арил-(C₁-C₇)-алкил, гетероарил, гетероарил-(C₁-C₇)-алкил, гетероциклил, гетероциклил-(C₁-C₇)-алкил, (C₁-C₇)-алкилтио-(C₁-C₇)-алкил, (C₁-C₇)-галогеналкилтио-(C₁-C₇)-алкил, (C₁-C₇)-алкилкарбонил-(C₁-C₇)-алкил, R¹⁷O(O)C-(C₁-C₇)-алкил, R¹⁵R¹⁶N(O)C-(C₁-C₇)-алкил, R¹⁵R¹⁶N-(C₁-C₇)-алкил, или

15

R⁷ и R¹³ вместе с атомами, с которыми они связаны, образуют полностью насыщенное или частично насыщенное 3-10-членное моноциклическое или бициклическое кольцо, необязательно прерываемое гетероатомами и необязательно

20

включающее дополнительное замещение, или

R⁹ и R¹³ вместе с атомами, с которыми они связаны, образуют полностью насыщенное или частично насыщенное 3-10-членное моноциклическое или бициклическое кольцо, необязательно прерываемое гетероатомами и необязательно

25

включающее дополнительное замещение, или

R¹¹ и R¹³, если X представляет собой N-R¹¹, вместе с атомом азота, с которым они связаны, образуют 4-10-членное моноциклическое или бициклическое кольцо, которое является полностью насыщенным или необязательно прерываемым

30

гетероатомами и необязательно включает дополнительное замещение, или

R¹² и R¹³, если X представляет собой N-O-R¹², вместе с атомом азота, с которым они связаны, образуют полностью насыщенное и необязательно дополнительно замещенное 4-10-членное моноциклическое или бициклическое кольцо,

- R^{14} представляет собой водород, фтор, хлор, бром, (C_1-C_5) -галогеналкил, (C_1-C_7) -алкокси,
- 5 R^{15} и R^{16} являются одинаковыми или различными и независимо представляют собой водород, (C_1-C_7) -алкил, (C_2-C_7) -алкенил, (C_2-C_7) -алкинил, (C_1-C_7) -цианоалкил, (C_1-C_{10}) -галогеналкил, (C_2-C_7) -галогеналкенил, (C_2-C_7) -галогеналкинил, (C_3-C_{10}) -циклоалкил, (C_3-C_{10}) -галогенциклоалкил, (C_4-C_{10}) -циклоалкенил, (C_4-C_{10}) -галогенциклоалкенил, (C_1-C_7) -алкокси- (C_1-C_7) -алкил, (C_1-C_7) -галогеналкокси-
- 10 (C_1-C_7) -алкил, (C_1-C_7) -алкилтио- (C_1-C_7) -алкил, (C_1-C_7) -галогеналкилтио- (C_1-C_7) -алкил, (C_1-C_7) -алкокси- (C_1-C_7) -галогеналкил, арил, арил- (C_1-C_7) -алкил, гетероарил, гетероарил- (C_1-C_7) -алкил, (C_3-C_7) -циклоалкил- (C_1-C_7) -алкил, (C_4-C_{10}) -циклоалкенил- (C_1-C_7) -алкил, COR^{17} , SO_2R^{18} , (C_1-C_7) -алкил- HNO_2S- , (C_3-C_7) -циклоалкил- HNO_2S- , гетероциклил, (C_1-C_7) -алкоксикарбонил- (C_1-C_7) -алкил, $(C_1-$
- 15 $C_7)$ -алкоксикарбонил, арил- (C_1-C_7) -алкоксикарбонил- (C_1-C_7) -алкил, арил- (C_1-C_7) -алкоксикарбонил, гетероарил- (C_1-C_7) -алкоксикарбонил, (C_2-C_7) -алкенилоксикарбонил, (C_2-C_7) -алкинилоксикарбонил, гетероциклил- (C_1-C_7) -алкил,
- 20 R^{17} представляет собой водород, (C_1-C_7) -алкил, (C_2-C_7) -алкенил, (C_2-C_7) -алкинил, (C_1-C_7) -цианоалкил, (C_1-C_7) -галогеналкил, (C_2-C_7) -галогеналкенил, (C_2-C_7) -галогеналкинил, (C_3-C_{10}) -циклоалкил, (C_3-C_{10}) -галогенциклоалкил, (C_4-C_{10}) -циклоалкенил, (C_4-C_{10}) -галогенциклоалкенил, (C_1-C_7) -алкокси- (C_1-C_7) -алкил, (C_1-C_7) -алкокси- (C_1-C_7) -галогеналкил, арил, арил- (C_1-C_7) -алкил, гетероарил,
- 25 гетероарил- (C_1-C_7) -алкил, (C_3-C_7) -циклоалкил- (C_1-C_7) -алкил, (C_4-C_{10}) -циклоалкенил- (C_1-C_7) -алкил, (C_1-C_7) -алкоксикарбонил- (C_1-C_7) -алкил, (C_2-C_7) -алкенилоксикарбонил- (C_1-C_7) -алкил, арил- (C_1-C_7) -алкоксикарбонил- (C_1-C_7) -алкил, гидроксикарбонил- (C_1-C_7) -алкил, гетероциклил, гетероциклил- (C_1-C_7) -алкил,
- 30 и
- R^{18} представляет собой водород, (C_1-C_7) -алкил, (C_2-C_7) -алкенил, (C_2-C_7) -алкинил, (C_1-C_7) -цианоалкил, (C_1-C_{10}) -галогеналкил, (C_2-C_7) -галогеналкенил, (C_2-C_7) -

5 галогеналкинил, (C₃-C₁₀)-циклоалкил, (C₃-C₁₀)-галогенциклоалкил, (C₄-C₁₀)-
циклоалкенил, (C₄-C₁₀)-галогенциклоалкенил, (C₁-C₇)-алкокси-(C₁-C₇)-алкил,
(C₁-C₇)-алкокси-(C₁-C₇)-галогеналкил, арил, арил-(C₁-C₇)-алкил, гетероарил,
гетероарил-(C₁-C₇)-алкил, гетероциклил-(C₁-C₇)-алкил, (C₃-C₇)-циклоалкил-(C₁-
C₇)-алкил, (C₄-C₁₀)-циклоалкенил-(C₁-C₇)-алкил, NR¹⁵R¹⁶,

и

10 R¹⁹ и R²⁰ независимо представляют собой водород, галоген, (C₁-C₇)-алкил, (C₃-C₇)-
циклоалкил, (C₂-C₇)-алкенил, (C₂-C₇)-алкинил, (C₁-C₇)-галогеналкил, арил или

15 R¹⁹ и R²⁰ вместе с атомом углерода, с которым они связаны, образуют 3-10-членное
моноциклическое или бициклическое кольцо, которое является насыщенным
или необязательно прерываемым гетероатомами и необязательно включает
дополнительное замещение.

Настоящее изобретение более предпочтительно предусматривает соединения общей
формулы (I), в которой

20 R¹ представляет собой (C₁-C₆)-алкил, amino, бис[(C₁-C₆)-алкил]амино,

R² представляет собой водород, (C₁-C₆)-алкил,

25 R³ представляет собой водород, галоген, (C₁-C₆)-алкокси,

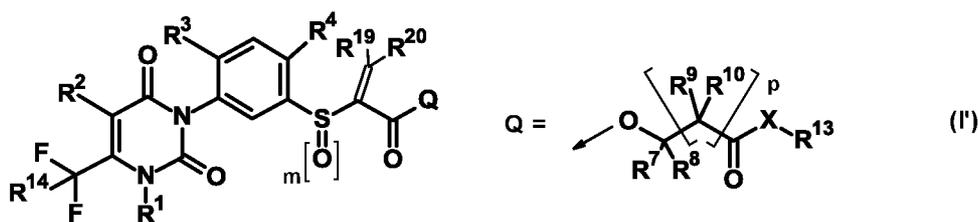
R⁴ представляет собой галоген, циано, NO₂, C(O)NH₂, C(S)NH₂, (C₁-C₆)-
галогеналкил, (C₂-C₆)-алкинил,

30 R⁵ и R⁶ независимо представляют собой водород, галоген, (C₁-C₆)-алкил, (C₃-C₆)-
циклоалкил, (C₃-C₆)-циклоалкил-(C₁-C₆)-алкил, (C₂-C₆)-алкенил, (C₂-C₆)-
алкинил, (C₁-C₁₀)-галогеналкил, (C₂-C₆)-галогеналкенил, (C₂-C₆)-галогеналкинил,
(C₃-C₁₀)-галогенциклоалкил, (C₄-C₁₀)-циклоалкенил, (C₄-C₁₀)-
галогенциклоалкенил, (C₁-C₆)-алкокси, (C₁-C₆)-алкокси-(C₁-C₆)-алкил, (C₁-C₆)-
алкокси-(C₁-C₆)-галогеналкил, (C₁-C₆)-галогеналкокси-(C₁-C₆)-галогеналкил, (C₁-

С₆)-галогеналкокси-(С₁-С₆)-алкил, арил, арил-(С₁-С₆)-алкил, гетероарил, гетероарил-(С₁-С₆)-алкил, (С₄-С₁₀)-циклоалкенил-(С₁-С₆)-алкил, гетероциклил, гетероциклил-(С₁-С₆)-алкил, (С₁-С₆)-алкилтио-(С₁-С₆)-алкил, (С₁-С₆)-галогеналкилтио-(С₁-С₆)-алкил, (С₁-С₆)-алкилкарбонил-(С₁-С₆)-алкил, С(О)ОR¹⁷, С(О)NR¹⁵R¹⁶, С(О)R¹⁷, R¹⁷О(О)С-(С₁-С₆)-алкил, R¹⁵R¹⁶N(О)С-(С₁-С₆)-алкил, R¹⁵R¹⁶N-(С₁-С₆)-алкил, или

R⁵ и R⁶ вместе с атомом углерода, с которым они связаны, образуют полностью насыщенное или частично насыщенное 3-10-членное моноциклическое или бициклическое кольцо, необязательно прерываемое гетероатомами и необязательно включающее дополнительное замещение, или

R⁵ и R⁶ вместе с атомом углерода, с которым они связаны, образуют двойную связь, необязательно дополнительно замещенную R¹⁹ и R²⁰, в соответствии с формулой (I') ниже,



m равняется 0, 1, 2,

p равняется 0, 1, 2, 3,

X представляет собой О (кислород), N (азот) или фрагменты N-R¹¹ или N-O-R¹², и при этом R¹¹ и R¹² во фрагментах N-R¹¹ и N-O-R¹² независимо имеют значения в соответствии с определениями ниже,

R⁷, R⁸, R⁹ и R¹⁰ независимо представляют собой водород, фтор, (С₁-С₆)-алкил, (С₃-С₆)-циклоалкил, (С₃-С₆)-циклоалкил-(С₁-С₆)-алкил, (С₂-С₆)-алкенил, (С₂-С₆)-алкинил, (С₁-С₁₀)-галогеналкил, (С₂-С₆)-галогеналкенил, (С₂-С₆)-галогеналкинил, (С₃-С₁₀)-галогенциклоалкил, (С₄-С₁₀)-циклоалкенил, (С₄-С₁₀)-галогенциклоалкенил, (С₁-С₆)-алкокси-(С₁-С₆)-галогеналкил, (С₁-С₆)-

галогеналкокси-(C₁-C₆)-галогеналкил, арил, арил-(C₁-C₆)-алкил, гетероарил, гетероарил-(C₁-C₆)-алкил, (C₄-C₁₀)-циклоалкенил-(C₁-C₆)-алкил, гетероцикл, гетероцикл-(C₁-C₆)-алкил, R¹⁷O-(C₁-C₆)-алкил, R¹⁸S-(C₁-C₆)-алкил, (C₁-C₆)-алкилкарбонил-(C₁-C₆)-алкил, C(O)OR¹⁷, C(O)NR¹⁵R¹⁶, C(O)R¹⁷, R¹⁷O(O)C-(C₁-C₆)-алкил, R¹⁵R¹⁶N(O)C-(C₁-C₆)-алкил, R¹⁵R¹⁶N-(C₁-C₆)-алкил, или

5

R⁵ и R⁷ вместе с атомами углерода, с которыми они связаны, образуют полностью насыщенное или частично насыщенное 3-8-членное моноциклическое или бициклическое кольцо, необязательно прерываемое гетероатомами и необязательно включающее дополнительное замещение, или

10

R⁷ и R⁸ вместе с атомом углерода, с которым они связаны, образуют полностью насыщенное или частично насыщенное 3-10-членное моноциклическое или бициклическое кольцо, необязательно прерываемое гетероатомами и необязательно включающее дополнительное замещение, или

15

R⁹ и R¹⁰ вместе с атомом углерода, с которым они связаны, образуют полностью насыщенное или частично насыщенное 3-10-членное моноциклическое или бициклическое кольцо, необязательно прерываемое гетероатомами и необязательно включающее дополнительное замещение, или

20

R⁹ и R¹⁰ вместе с атомом углерода, с которым они связаны, образуют экзометиленовую группу, или

25

R⁷ и R⁹ вместе с атомами углерода, с которыми они связаны, образуют полностью насыщенное или частично насыщенное 3-10-членное моноциклическое или бициклическое кольцо, необязательно прерываемое гетероатомами и необязательно включающее дополнительное замещение,

30

R¹¹ представляет собой водород, (C₁-C₆)-алкил, (C₃-C₆)-циклоалкил, циано-(C₁-C₆)-алкил, (C₃-C₆)-циклоалкил-(C₁-C₆)-алкил, (C₁-C₆)-алкилсульфонил, арилсульфонил, гетероарилсульфонил, (C₃-C₆)-циклоалкилсульфонил, гетероциклсульфонил, арил-(C₁-C₆)-алкилсульфонил, (C₁-C₆)-алкилкарбонил, арилкарбонил, гетероарилкарбонил, (C₃-C₆)-циклоалкилкарбонил,

- гетероциклилкарбонил, (C₁-C₆)-алкоксикарбонил, (C₁-C₆)-алкокси, (C₂-C₆)-алкенилокси, арил-(C₁-C₆)-алкоксикарбонил, (C₁-C₆)-галогеналкилкарбонил, (C₂-C₆)-алкенил, (C₂-C₆)-алкинил, (C₁-C₆)-галогеналкил, галоген-(C₂-C₆)-алкинил, галоген-(C₂-C₆)-алкенил, (C₁-C₆)-алкокси-(C₁-C₆)-алкил, amino, (C₁-C₆)-алкиламино, бис[(C₁-C₆)-алкил]амино, (C₁-C₆)-алкокси-(C₁-C₆)-алкокси-(C₁-C₆)-алкил, гетероарил-(C₁-C₆)-алкилсульфонил, гетероциклил-(C₁-C₆)-алкилсульфонил, (C₂-C₆)-алкенилоксикарбонил, (C₂-C₆)-алкинилоксикарбонил, (C₁-C₆)-алкиламинокарбонил, (C₃-C₆)-циклоалкиламинокарбонил, бис-[(C₁-C₆)-алкил]аминокарбонил,
- 5
- 10 R¹² представляет собой водород, (C₁-C₆)-алкил, (C₃-C₆)-циклоалкил-(C₁-C₆)-алкил, (C₂-C₆)-алкенил, (C₂-C₆)-алкинил, (C₁-C₆)-алкокси-(C₁-C₆)-алкил, арил, арил-(C₁-C₆)-алкил, R¹⁷O(O)C-(C₁-C₆)-алкил, R¹⁵R¹⁶N(O)C-(C₁-C₆)-алкил,
- 15 R¹³ представляет собой водород, (C₁-C₆)-алкил, (C₁-C₆)-галогеналкил, (C₃-C₆)-циклоалкил, (C₃-C₆)-циклоалкил-(C₁-C₆)-алкил, (C₂-C₆)-алкенил, (C₂-C₆)-алкинил, (C₁-C₆)-алкокси-(C₁-C₆)-алкил, (C₁-C₆)-галогеналкокси-(C₁-C₆)-алкил, арил, арил-(C₁-C₆)-алкил, гетероарил, гетероарил-(C₁-C₆)-алкил, гетероциклил, гетероциклил-(C₁-C₆)-алкил, (C₁-C₆)-алкилтио-(C₁-C₆)-алкил, (C₁-C₆)-галогеналкилтио-(C₁-C₆)-алкил, (C₁-C₆)-алкилкарбонил-(C₁-C₆)-алкил, R¹⁷O(O)C-(C₁-C₆)-алкил, R¹⁵R¹⁶N(O)C-(C₁-C₆)-алкил, R¹⁵R¹⁶N-(C₁-C₆)-алкил, или
- 20
- R⁷ и R¹³ вместе с атомами, с которыми они связаны, образуют полностью насыщенное или частично насыщенное 3-10-членное моноциклическое или бициклическое
- 25 кольцо, необязательно прерываемое гетероатомами и необязательно включающее дополнительное замещение, или
- R⁹ и R¹³ вместе с атомами, с которыми они связаны, образуют полностью насыщенное или частично насыщенное 3-10-членное моноциклическое или бициклическое
- 30 кольцо, необязательно прерываемое гетероатомами и необязательно включающее дополнительное замещение, или
- R¹¹ и R¹³, если X представляет собой N-R¹¹, вместе с атомом азота, с которым они связаны, образуют 4-10-членное моноциклическое или бициклическое кольцо,

которое является полностью насыщенным или необязательно прерываемым гетероатомами и необязательно включает дополнительное замещение, или

R^{12} и R^{13} , если X представляет собой $N-O-R^{12}$, вместе с атомом азота, с которым они
5 связаны, образуют полностью насыщенное и необязательно дополнительно замещенное 4-10-членное моноциклическое или бициклическое кольцо,

R^{14} представляет собой водород, фтор, хлор, бром, (C_1-C_5) -галогеналкил, (C_1-C_6) -алкокси,
10

R^{15} и R^{16} являются одинаковыми или различными и независимо представляют собой водород, (C_1-C_6) -алкил, (C_2-C_6) -алкенил, (C_2-C_6) -алкинил, (C_1-C_6) -цианоалкил, (C_1-C_{10}) -галогеналкил, (C_2-C_6) -галогеналкенил, (C_2-C_6) -галогеналкинил, (C_3-C_{10}) -циклоалкил, (C_3-C_{10}) -галогенциклоалкил, (C_4-C_{10}) -циклоалкенил, (C_4-C_{10}) -галогенциклоалкенил, (C_1-C_6) -алкокси- (C_1-C_6) -алкил, (C_1-C_6) -галогеналкокси- (C_1-C_6) -алкил, (C_1-C_6) -алкилтио- (C_1-C_6) -алкил, (C_1-C_6) -галогеналкилтио- (C_1-C_6) -алкил, (C_1-C_6) -алкокси- (C_1-C_6) -галогеналкил, арил, арил- (C_1-C_6) -алкил, гетероарил, гетероарил- (C_1-C_6) -алкил, (C_3-C_6) -циклоалкил- (C_1-C_6) -алкил, (C_4-C_{10}) -циклоалкенил- (C_1-C_6) -алкил, COR^{17} , SO_2R^{18} , (C_1-C_6) -алкил- HNO_2S- , (C_3-C_6) -циклоалкил- HNO_2S- , гетероциклил, (C_1-C_6) -алкоксикарбонил- (C_1-C_6) -алкил, (C_1-C_6) -алкоксикарбонил, арил- (C_1-C_6) -алкоксикарбонил- (C_1-C_6) -алкил, арил- (C_1-C_6) -алкоксикарбонил, гетероарил- (C_1-C_6) -алкоксикарбонил, (C_2-C_6) -алкенилоксикарбонил, (C_2-C_6) -алкинилоксикарбонил, гетероциклил- (C_1-C_6) -алкил,
15
20

R^{17} представляет собой водород, (C_1-C_6) -алкил, (C_2-C_6) -алкенил, (C_2-C_6) -алкинил, (C_1-C_6) -цианоалкил, (C_1-C_6) -галогеналкил, (C_2-C_6) -галогеналкенил, (C_2-C_6) -галогеналкинил, (C_3-C_{10}) -циклоалкил, (C_3-C_{10}) -галогенциклоалкил, (C_4-C_{10}) -циклоалкенил, (C_4-C_{10}) -галогенциклоалкенил, (C_1-C_6) -алкокси- (C_1-C_6) -алкил, (C_1-C_6) -алкокси- (C_1-C_6) -галогеналкил, арил, арил- (C_1-C_6) -алкил, гетероарил, гетероарил- (C_1-C_6) -алкил, (C_3-C_6) -циклоалкил- (C_1-C_6) -алкил, (C_4-C_{10}) -циклоалкенил- (C_1-C_6) -алкил, (C_1-C_6) -алкоксикарбонил- (C_1-C_6) -алкил, (C_2-C_6) -алкенилоксикарбонил- (C_1-C_6) -алкил, арил- (C_1-C_6) -алкоксикарбонил- (C_1-C_6) -
25
30

алкил, гидроксикарбонил-(C₁-C₆)-алкил, гетероциклил, гетероциклил-(C₁-C₆)-алкил,

и

5

R¹⁸ представляет собой водород, (C₁-C₆)-алкил, (C₂-C₆)-алкенил, (C₂-C₆)-алкинил, (C₁-C₆)-цианоалкил, (C₁-C₁₀)-галогеналкил, (C₂-C₆)-галогеналкенил, (C₂-C₆)-галогеналкинил, (C₃-C₁₀)-циклоалкил, (C₃-C₁₀)-галогенциклоалкил, (C₄-C₁₀)-циклоалкенил, (C₄-C₁₀)-галогенциклоалкенил, (C₁-C₆)-алкокси-(C₁-C₆)-алкил, (C₁-C₆)-алкокси-(C₁-C₆)-галогеналкил, арил, арил-(C₁-C₆)-алкил, гетероарил, гетероарил-(C₁-C₆)-алкил, гетероциклил-(C₁-C₆)-алкил, (C₃-C₆)-циклоалкил-(C₁-C₆)-алкил, (C₄-C₁₀)-циклоалкенил-(C₁-C₆)-алкил, NR¹⁵R¹⁶,

10

и

15

R¹⁹ и R²⁰ независимо представляют собой водород, фтор, хлор, бром, (C₁-C₆)-алкил, (C₃-C₆)-циклоалкил, (C₂-C₆)-алкенил, (C₂-C₆)-алкинил, (C₁-C₆)-галогеналкил, арил или

20

R¹⁹ и R²⁰ вместе с атомом углерода, с которым они связаны, образуют 3-10-членное моноциклическое или бициклическое кольцо, которое является насыщенным или необязательно прерываемым гетероатомами и необязательно включает дополнительное замещение.

25

Настоящее изобретение еще более предпочтительно предусматривает соединения общей формулы (I), в которой

30

R¹ представляет собой метил, этил, н-пропил, 1-метилэтил, н-бутил, 1-метилпропил, 2-метилпропил, 1,1-диметилэтил, н-пентил, 1-метилбутил, 2-метилбутил, 3-метилбутил, 1,1-диметилпропил, 1,2-диметилпропил, 2,2-диметилпропил, 1-этилпропил, н-гексил, 1-метилпентил, 2-метилпентил, 3-метилпентил, 4-метилпентил, 1,1-диметилбутил, 1,2-диметилбутил, 1,3-диметилбутил, 2,2-диметилбутил, 2,3-диметилбутил, 3,3-диметилбутил, 1-этилбутил, 2-этилбутил, 1,1,2-триметилпропил, 1,2,2-триметилпропил, 1-этил-1-

метилпропил, 1-этил-2-метилпропил, амина, диметиламино, диэтиламино, метил(этил)амино, метил(н-пропил)амино,

- 5 R^2 представляет собой водород, метил, этил, н-пропил, изопропил,
- R^3 представляет собой водород, фтор, хлор, бром, метокси, этокси,
- 10 R^4 представляет собой галоген, циано, NO_2 , $C(O)NH_2$, $C(S)NH_2$, дифторметил, трифторметил, этинил, пропин-1-ил, 1-бутин-1-ил, пентин-1-ил, гексин-1-ил,
- R^5 и R^6 независимо представляют собой водород, фтор, метил, этил, н-пропил, 1-метилэтил, н-бутил, 1-метилпропил, 2-метилпропил, 1,1-диметилэтил, н-пентил, 1-метилбутил, 2-метилбутил, 3-метилбутил, 1,1-диметилпропил, 1,2-диметилпропил, 2,2-диметилпропил, 1-этилпропил, н-гексил, 1-метилпентил, 2-метилпентил, 3-метилпентил, 4-метилпентил, 1,1-диметилбутил, 1,2-диметилбутил, 1,3-диметилбутил, 2,2-диметилбутил, 2,3-диметилбутил, 3,3-диметилбутил,
- 1-этилбутил, 2-этилбутил, 1,1,2-триметилпропил, 1,2,2-триметилпропил, 1-этил-1-метилпропил, 1-этил-2-метилпропил, циклопропил, циклобутил, циклопентил, циклогексил, спиро[2.2]пент-1-ил, спиро[2.3]гекс-1-ил, спиро[2.3]гекс-4-ил, 3-спиро[2.3]гекс-5-ил, бицикло[1.1.0]бутан-1-ил, бицикло[1.1.0]бутан-2-ил, бицикло[2.1.0]пентан-1-ил, бицикло[1.1.1]пентан-1-ил, бицикло[2.1.0]пентан-2-ил, бицикло[2.1.0]пентан-5-ил, бицикло[2.1.1]гексил, 1-метилциклопропил, 2-метилциклопропил, 2,2-диметилциклопропил, 2,3-диметилциклопропил, 1,1'-би(циклопропил)-1-ил, 1,1'-би(циклопропил)-2-ил, 2'-метил-1,1'-би(циклопропил)-2-ил, 1-цианоциклопропил, 2-цианоциклопропил, 1-метилциклобутил, 2-метилциклобутил, 3-метилциклобутил, 3,3-диметилциклобут-1-ил, 1-цианоциклобутил, 2-цианоциклобутил, 3-цианоциклобутил, 3,3-дифторциклобут-1-ил, 3-фторциклобут-1-ил, 2,2-дифторциклопроп-1-ил, 1-фторциклопроп-1-ил, 2-фторциклопроп-1-ил, 1-аллилциклопропил, 1-винилциклобутил, 1-винилциклопропил,
- 1-этилциклопропил, 1-метилциклогексил, 2-метилциклогексил, 3-метилциклогексил, 1-метоксициклогексил, 2-метоксициклогексил, 3-метоксициклогексил, 2-фторциклопроп-1-ил, 4-фторциклогексил, 4,4-дифторциклогексил,

циклопропилметил, циклобутилметил, циклопентилметил, циклогексилметил, этенил, 1-пропенил, 2-пропенил, 1-метилэтенил, 1-бутенил, 2-бутенил, 3-бутенил, 1-метил-1-пропенил, 2-метил-1-пропенил, 1-метил-2-пропенил, 2-метил-2-пропенил, 1-пентенил, 2-пентенил, 3-пентенил, 4-пентенил, 1-метил-1-бутенил, 2-метил-1-бутенил, 3-метил-1-бутенил, 1-метил-2-бутенил, 2-метил-2-бутенил, 3-метил-2-бутенил, 1-метил-3-бутенил, 2-метил-3-бутенил, 3-метил-3-бутенил, 1,1-диметил-2-пропенил, 1,2-диметил-1-пропенил, 1,2-диметил-2-пропенил, 1-этил-1-пропенил, 1-этил-2-пропенил, 1-гексенил, 2-гексенил, 3-гексенил, 4-гексенил, 5-гексенил, 1-метил-1-пентенил, 2-метил-1-пентенил, 3-метил-1-пентенил, 4-метил-1-пентенил, 1-метил-2-пентенил, 2-метил-2-пентенил, 3-метил-2-пентенил, 4-метил-2-пентенил, 1-метил-3-пентенил, 2-метил-3-пентенил, 3-метил-3-пентенил, 4-метил-3-пентенил, 1-метил-4-пентенил, 2-метил-4-пентенил, 3-метил-4-пентенил, 4-метил-4-пентенил, 1,1-диметил-2-бутенил, 1,1-диметил-3-бутенил, 1,2-диметил-1-бутенил, 1,2-диметил-2-бутенил, 1,2-диметил-3-бутенил, 1,3-диметил-1-бутенил, 1,3-диметил-2-бутенил, 1,3-диметил-3-бутенил, 2,2-диметил-3-бутенил, 2,3-диметил-1-бутенил, 2,3-диметил-2-бутенил, 2,3-диметил-3-бутенил, 3,3-диметил-1-бутенил, 3,3-диметил-2-бутенил, 1-этил-1-бутенил, 1-этил-2-бутенил, 1-этил-3-бутенил, 2-этил-1-бутенил, 2-этил-2-бутенил, 2-этил-3-бутенил, 1,1,2-триметил-2-пропенил, 1-этил-1-метил-2-пропенил, 1-этил-2-метил-1-пропенил, 1-этил-2-метил-2-пропенил, этинил, 1-пропинил, 2-пропинил, 1-бутинил, 2-бутинил, 3-бутинил, 1-метил-2-пропинил, 1-пентинил, 2-пентинил, 3-пентинил, 4-пентинил, 1-метил-2-бутинил, 1-метил-3-бутинил, 2-метил-3-бутинил, 3-метил-1-бутинил, 1,1-диметил-2-пропинил, 1-этил-2-пропинил, 1-гексинил, 2-гексинил, 3-гексинил, 4-гексинил, 5-гексинил, 1-метил-2-пентинил, 1-метил-3-пентинил, 1-метил-4-пентинил, 2-метил-3-пентинил, 2-метил-4-пентинил, 3-метил-1-пентинил, 3-метил-4-пентинил, 4-метил-1-пентинил, 4-метил-2-пентинил, 1,1-диметил-2-бутинил, 1,1-диметил-3-бутинил, 1,2-диметил-3-бутинил, 2,2-диметил-3-бутинил, 3,3-диметил-1-бутинил, 1-этил-2-бутинил, 1-этил-3-бутинил, 2-этил-3-бутинил, 1-этил-1-метил-2-пропинил, трифторметил, пентафторэтил, 1,1,2,2-тетрафторэтил, гептафторпропил, нонафторбутил, хлордифторметил,

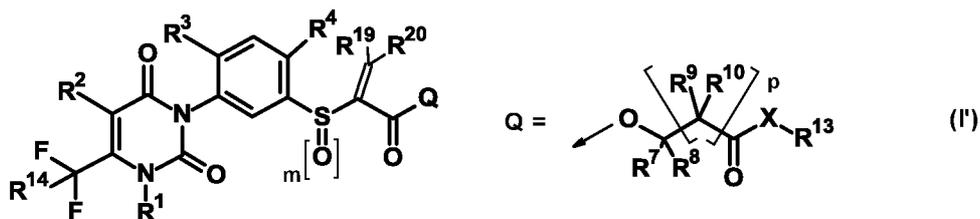
- бромдифторметил, дихлорфторметил, йоддифторметил, бромфторметил, 1-фторэтил, 2-фторэтил, фторметил, дифторметил, 2,2-дифторэтил, 2,2,2-трифторэтил, дифтор-трет-бутил, хлорметил, бромметил, метокси, этокси, н-пропилокси, изопрпилокси, н-бутилокси, трет-бутилокси, метоксиметил, этоксиметил, н-пропилоксиметил, изопрпилоксиметил, метоксиэтил, этоксиэтил, н-пропилоксиэтил, изопрпилоксиэтил, метокси-н-пропил, метоксидифторметил, этоксидифторметил, н-пропилоксидифторметил, н-бутилоксидифторметил, трифторметоксиметил, трифторметоксиэтил, трифторметокси-н-пропил, фенил, 2-фторфенил, 3-фторфенил, 4-фторфенил, 2,4-дифторфенил, 2,5-дифторфенил, 2,6-дифторфенил, 2,3-дифторфенил, 3,4-дифторфенил, 3,5-дифторфенил, 2,4,5-трифторфенил, 3,4,5-трифторфенил, 2-хлорфенил, 3-хлорфенил, 4-хлорфенил, 2,4-дихлорфенил, 2,5-дихлорфенил, 2,6-дихлорфенил, 2,3-дихлорфенил, 3,4-дихлорфенил, 3,5-дихлорфенил, 2,4,5-трихлорфенил, 3,4,5-трихлорфенил, 2,4,6-трихлорфенил, 2-бромфенил, 3-бромфенил, 4-бромфенил, 2-йодфенил, 3-йодфенил, 4-йодфенил, 2-бром-4-фторфенил, 2-бром-4-хлорфенил, 3-бром-4-фторфенил, 3-бром-4-хлорфенил, 3-бром-5-фторфенил, 3-бром-5-хлорфенил, 2-фтор-4-бромфенил, 2-хлор-4-бромфенил, 3-фтор-4-бромфенил, 3-хлор-4-бромфенил, 2-хлор-4-фторфенил, 3-хлор-4-фторфенил, 2-фтор-3-хлорфенил, 2-фтор-4-хлорфенил, 2-фтор-5-хлорфенил, 3-фтор-4-хлорфенил, 3-фтор-5-хлорфенил, 2-фтор-6-хлорфенил, 2-метилфенил, 3-метилфенил, 4-метилфенил, 2,4-диметилфенил, 2,5-диметилфенил, 2,6-диметилфенил, 2,3-диметилфенил, 3,4-диметилфенил, 3,5-диметилфенил, 2,4,5-триметилфенил, 3,4,5-триметилфенил, 2,4,6-триметилфенил, 2-метоксифенил, 3-метоксифенил, 4-метоксифенил, 2,4-диметоксифенил, 2,5-диметоксифенил, 2,6-диметоксифенил, 2,3-диметоксифенил, 3,4-диметоксифенил, 3,5-диметоксифенил, 2,4,5-триметоксифенил, 3,4,5-триметоксифенил, 2,4,6-триметоксифенил, 2-трифторметоксифенил, 3-трифторметоксифенил, 4-трифторметоксифенил, 2-дифторметоксифенил, 3-дифторметоксифенил, 4-дифторметоксифенил, 2-трифторметилфенил, 3-трифторметилфенил, 4-трифторметилфенил, 2-дифторметилфенил, 3-дифторметилфенил, 4-дифторметилфенил, 3,5-бис(трифторметил)фенил, 3-трифторметил-5-фторфенил, 3-трифторметил-5-хлорфенил, 3-метил-5-

- фторфенил, 3-метил-5-хлорфенил, 3-метокси-5-фторфенил, 3-метокси-5-хлорфенил, 3-трифторметокси-5-хлорфенил, 2-этоксифенил, 3-этоксифенил, 4-этоксифенил, 2-метилтиофенил, 3-метилтиофенил, 4-метилтиофенил, 2-трифторметилтиофенил,
- 5 3-трифторметилтиофенил, 4-трифторметилтиофенил, 2-этилфенил, 3-этилфенил, 4-этилфенил, 2-метоксикарбонилфенил, 3-метоксикарбонилфенил, 4-метоксикарбонилфенил, 2-этоксикарбонилфенил, 3-этоксикарбонилфенил, 4-этоксикарбонилфенил, пиридин-2-ил, пиридин-3-ил, пиридин-4-ил, пиазин-2-ил, пиридазин-3-ил, пиридазин-4-ил, пиримидин-2-ил, пиримидин-5-ил,
- 10 пиримидин-4-ил, пиридазин-3-илметил, пиридазин-4-илметил, пиримидин-2-илметил,
- пиримидин-5-илметил, пиримидин-4-илметил, пиазин-2-илметил, 3-хлорпиазин-2-ил, 3-бромпиазин-2-ил, 3-метоксипиазин-2-ил, 3-этоксипиазин-2-ил, 3-трифторметилпиазин-2-ил, 3-цианопиазин-2-ил, нафт-2-ил, нафт-1-ил,
- 15 хинолин-4-ил, хинолин-6-ил, хинолин-8-ил, хинолин-2-ил, хиноксалин-2-ил, 2-нафтилметил, 1-нафтилметил, хинолин-4-илметил,
- хинолин-6-илметил, хинолин-8-илметил, хинолин-2-илметил, хиноксалин-2-илметил, пиазин-2-илметил, 4-хлорпиазин-2-ил, 3-хлорпиазин-4-ил, 2-хлорпиазин-3-ил, 2-хлорпиазин-4-ил, 2-хлорпиазин-5-ил, 2,6-дихлорпиазин-4-ил, 3-хлорпиазин-5-ил, 3,5-дихлорпиазин-2-ил,
- 20 3-хлор-5-трифторметилпиазин-2-ил, (4-хлорпиазин-2-ил)метил, (3-хлорпиазин-4-ил)метил, (2-хлорпиазин-3-ил)метил, (2-хлорпиазин-4-ил)метил, (2-хлорпиазин-5-ил)метил, (2,6-дихлорпиазин-4-ил)метил, (3-хлорпиазин-5-ил)метил, (3,5-дихлорпиазин-2-ил)метил, тиофен-2-ил, тиофен-3-ил, 5-метилтиофен-2-ил, 5-этилтиофен-2-ил, 5-хлортиофен-2-ил, 5-бромтиофен-2-ил, 4-метилтиофен-2-ил, 3-метилтиофен-2-ил, 5-флортиофен-3-ил, 3,5-диметилтиофен-2-ил, 3-этилтиофен-2-ил, 4,5-диметилтиофен-2-ил, 3,4-диметилтиофен-2-ил, 4-хлортиофен-2-ил, фуран-2-ил, 5-метилфуран-2-ил, 5-этилфуран-2-ил, 5-метоксикарбонилфуран-2-ил, 5-хлорфуран-2-ил, 5-бромфуран-2-ил,
- 30 тиофан-2-ил, тиофан-3-ил, сульфолан-2-ил, сульфолан-3-ил, тетрагидротиопиран-4-ил, тетрагидропиран-4-ил, тетрагидрофуран-2-ил, тетрагидрофуран-3-ил, 1-(4-метилфенил)этил, 1-(3-метилфенил)этил, 1-(2-метилфенил)этил, 1-(4-

хлорфенил)этил, 1-(3-хлорфенил)этил, 1-(2-хлорфенил)этил, бензил, (4-
 фторфенил)метил, (3-фторфенил)метил,
 (2-фторфенил)метил, (2,4-дифторфенил)метил, (3,5-дифторфенил)метил, (2,5-
 дифторфенил)метил, (2,6-дифторфенил)метил, (2,4,5-трифторфенил)метил,
 5 (2,4,6-трифторфенил)метил, (4-хлорфенил)метил, (3-хлорфенил)метил, (2-
 хлорфенил)метил, (2,4-дихлорфенил)метил, (3,5-дихлорфенил)метил,
 (2,5-дихлорфенил)метил, (2,6-дихлорфенил)метил, (2,4,5-трихлорфенил)метил, (2,4,6-
 трихлорфенил)метил, (4-бромфенил)метил, (3-бромфенил)метил, (2-
 бромфенил)метил, (4-йодфенил)метил, (3-йодфенил)метил, (2-йодфенил)метил,
 10 (3-хлор-5-трифторметилпиридин-2-ил)метил, (2-бром-4-фторфенил)метил, (2-
 бром-4-хлорфенил)метил, (3-бром-4-фторфенил)метил, (3-бром-4-
 хлорфенил)метил,
 (3-бром-5-фторфенил)метил, (3-бром-5-хлорфенил)метил, (2-фтор-4-бромфенил)метил,
 (2-хлор-4-бромфенил)метил, (3-фтор-4-бромфенил)метил, (3-хлор-4-
 15 бромфенил)метил, (2-хлор-4-фторфенил)метил, (3-хлор-4-фторфенил)метил,
 (2-фтор-3-хлорфенил)метил, (2-фтор-4-хлорфенил)метил, (2-фтор-5-хлорфенил)метил,
 (3-фтор-4-хлорфенил)метил, (3-фтор-5-хлорфенил)метил, (2-фтор-6-
 хлорфенил)метил, 2-фенилэт-1-ил, 3-трифторметил-4-хлорфенил, 3-хлор-4-
 трифторметилфенил, 2-хлор-4-трифторметилфенил, 3,5-дифторпиридин-2-ил,
 20 (3,6-дихлорпиридин-2-ил)метил, (4-трифторметилфенил)метил, (3-
 трифторметилфенил)метил, (2-трифторметилфенил)метил,
 (4-трифторметоксифенил)метил, (3-трифторметоксифенил)метил, (2-
 трифторметоксифенил)метил, (4-метоксифенил)метил, (3-метоксифенил)метил,
 (2-метоксифенил)метил, (4-метилфенил)метил, (3-метилфенил)метил, (2-
 25 метилфенил)метил, (4-цианофенил)метил, (3-цианофенил)метил, (2-
 цианофенил)метил, (2,4-диэтилфенил)метил, (3,5-диэтилфенил)метил, (3,4-
 диметилфенил)метил,
 (3,5-диметоксифенил)метил, 1-фенилэт-1-ил, 1-(о-хлорфенил)эт-1-ил, 1,3-тиазол-2-ил,
 4-метил-1,3-тиазол-2-ил, 1,3-тиазол-2-ил, метилтиометил, этилтиометил,
 30 этилтиоэтил, метилтиоэтил, н-пропилтиометил, изопротилтиометил,
 трифторметилтиометил, трифторметилтиоэтил, метилкарбонилметил,
 этилкарбонилметил, н-пропилкарбонилметил, изопротилкарбонилметил,
 метилкарбонилэтил, гидроксикарбонил, метоксикарбонил,

- этоксикарбонил, н-пропилоксикарбонил, изопропилоксикарбонил, н-бутилоксикарбонил, трет-бутилоксикарбонил, аллилоксикарбонил, бензилоксикарбонил, аминокарбонил, метиламинокарбонил, этиламинокарбонил, н-пропиламинокарбонил, изопропиламинокарбонил, диметиламинокарбонил, диэтиламинокарбонил, метил(этил)аминокарбонил, циклопропиламинокарбонил, циклобутиламинокарбонил, циклопентиламинокарбонил, циклогексиламинокарбонил, аллиламинокарбонил, бензиламинокарбонил, трет-бутилоксикарбониламинокарбонил, гидроксикарбонилметил, метоксикарбонилметил, этоксикарбонилметил, н-пропилоксикарбонилметил, изопропилоксикарбонилметил, н-бутилоксикарбонилметил, трет-бутилоксикарбонилметил, аллилоксикарбонилметил, бензилоксикарбонилметил, аминокарбонилметил, метиламинокарбонилметил, этиламинокарбонилметил, н-пропиламинокарбонилметил, изопропиламинокарбонилметил, диметиламинокарбонилметил, диэтиламинокарбонилметил, метил(этил)аминокарбонилметил, циклопропиламинокарбонилметил, циклобутиламинокарбонилметил, циклопентиламинокарбонилметил, циклогексиламинокарбонилметил, аллиламинокарбонилметил, бензиламинокарбонилметил, 1-(гидроксикарбонил)эт-1-ил, 1-(метоксикарбонил)эт-1-ил, 1-(этоксикарбонил)эт-1-ил, 1-(трет-бутилоксикарбонил)эт-1-ил, 1-(бензилоксикарбонил)эт-1-ил, 2-(гидроксикарбонил)эт-1-ил, 2-(метоксикарбонил)эт-1-ил, 2-(этоксикарбонил)эт-1-ил, 2-(трет-бутилоксикарбонил)эт-1-ил, 2-(бензилоксикарбонил)эт-1-ил, 1-(гидроксикарбонил)проп-1-ил, 1-(метоксикарбонил)проп-1-ил, 1-(этоксикарбонил)проп-1-ил, 1-(трет-бутилоксикарбонил)проп-1-ил, 1-(бензилоксикарбонил)проп-1-ил, 2-(гидроксикарбонил)проп-1-ил, 2-(метоксикарбонил)проп-1-ил, 2-(этоксикарбонил)проп-1-ил, 2-(трет-бутилоксикарбонил)проп-1-ил, 2-(бензилоксикарбонил)проп-1-ил, 1-(гидроксикарбонил)проп-2-ил, 1-(метоксикарбонил)проп-2-ил, 1-(этоксикарбонил)проп-2-ил, 1-(трет-бутилоксикарбонил)проп-2-ил, 1-(бензилоксикарбонил)проп-2-ил, 3-(гидроксикарбонил)проп-1-ил, 3-(метоксикарбонил)проп-1-ил, 3-(этоксикарбонил)проп-1-ил, 3-(трет-бутилоксикарбонил)проп-1-ил, 3-

- (бензилоксикарбонил)проп-1-ил, аминометил, 2-аминоэт-1-ил, 1-аминоэт-1-ил, 1-аминопроп-1-ил, 3-аминопроп-1-ил, метиламинметил, диметиламинметил, диэтиламинметил, этиламинметил, изопропиламинметил, циклопропиламинметил, циклобутиламинметил, циклопентиламинметил, циклогексиламинметил, метоксикарбониламинметил, 5 этоксикарбониламинметил, трет-бутилоксикарбониламинметил, метилкарбониламинметил, этилкарбониламинметил, н-пропилкарбониламинметил, изопропилкарбониламинметил, 2-(метиламино)эт-1-ил, 2-(диэт-1-иламино)эт-1-ил, 2-(диэтиламино)эт-1-ил, 2-(этиламино)эт-1-ил, 2-(изопропиламино)эт-1-ил, 2-(циклопропиламино)эт-1-ил, 2-(циклобутиламино)эт-1-ил, 2-(циклопентиламино)эт-1-ил, 2-(циклогексиламино)эт-1-ил, 2-(метоксикарбониламино)эт-1-ил, 2-(этоксикарбониламино)эт-1-ил, 2-(трет-бутилоксикарбониламино)эт-1-ил, 2-(метилкарбониламино)эт-1-ил, 2-(этилкарбониламино)эт-1-ил, 2-(н-пропилкарбониламино)эт-1-ил, 2-(изопропилкарбониламино)эт-1-ил, 1-(метиламино)эт-1-ил, 1-(диэт-1-иламино)эт-1-ил, 1-(диэтиламино)эт-1-ил, 1-(этиламино)эт-1-ил, 1-(изопропиламино)эт-1-ил, 1-(циклопропиламино)эт-1-ил, 1-(циклобутиламино)эт-1-ил, 1-(циклопентиламино)эт-1-ил, 1-(циклогексиламино)эт-1-ил, 1-(метоксикарбониламино)эт-1-ил, 1-(этоксикарбониламино)эт-1-ил, 1-(трет-бутилоксикарбониламино)эт-1-ил, 1-(метилкарбониламино)эт-1-ил, 1-(этилкарбониламино)эт-1-ил, 1-(н-пропилкарбониламино)эт-1-ил, 1-(изопропилкарбониламино)эт-1-ил, или
- 20
- 25 R^5 и R^6 вместе с атомом углерода, с которым они связаны, образуют полностью насыщенное или частично насыщенное 3-10-членное моноциклическое или бициклическое кольцо, необязательно прерываемое гетероатомами и необязательно включающее дополнительное замещение, или
- 30 R^5 и R^6 вместе с атомом углерода, с которым они связаны, образуют двойную связь, необязательно дополнительно замещенную R^{19} и R^{20} , в соответствии с формулой (I') ниже,



R^{14} представляет собой водород, фтор, хлор, бром, трифторметил, метокси, этокси, н-пропилокси, н-бутилокси,

5

m равняется 0, 1, 2,

R^{19} и R^{20} независимо представляют собой водород, фтор, хлор, бром, метил, этил, н-пропил, 1-метилэтил, н-бутил, 1-метилпропил, 2-метилпропил, 1,1-диметилэтил, н-пентил, 1-метилбутил, 2-метилбутил, 3-метилбутил, 1,1-диметилпропил, 1,2-диметилпропил, 2,2-диметилпропил, 1-этилпропил, н-гексил, циклопропил, циклобутил, циклопентил, циклогексил, трифторметил, дифторметил, пентафторэтил, этенил, 1-пропенил, 1-метилэтенил, 1-бутенил, фенил или

10

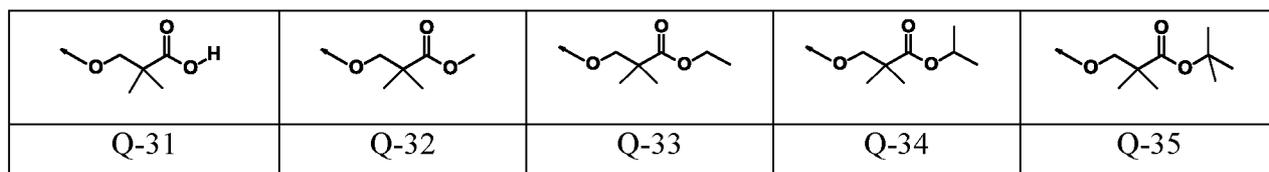
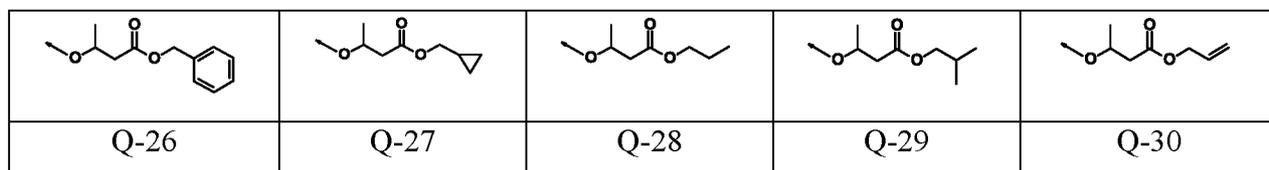
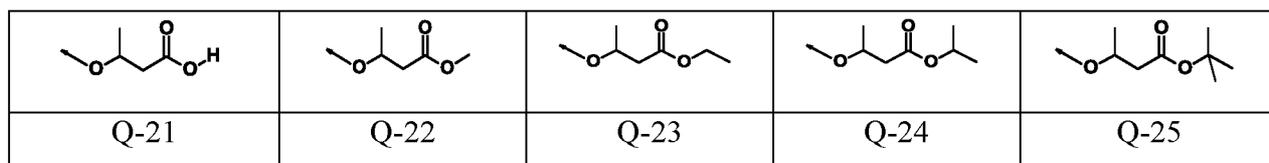
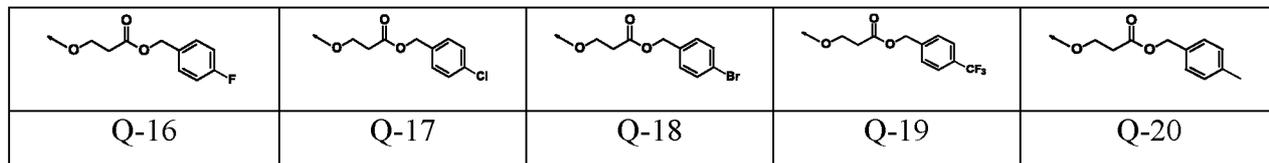
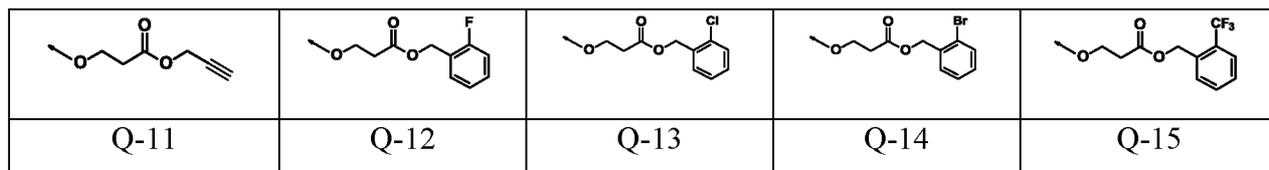
R^{19} и R^{20} вместе с атомом углерода, с которым они связаны, образуют 3-10-членное моноциклическое или бициклическое кольцо, которое является насыщенным или необязательно прерываемым гетероатомами и необязательно включает дополнительное замещение,

15

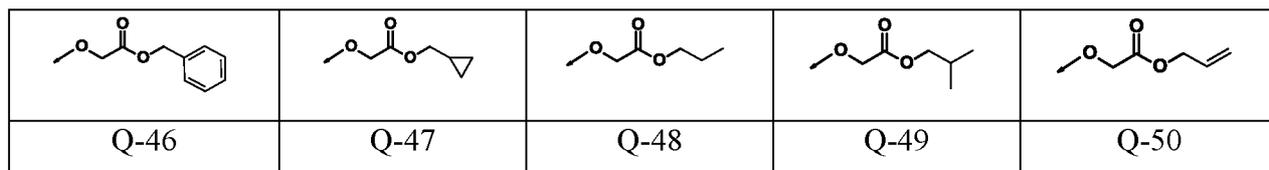
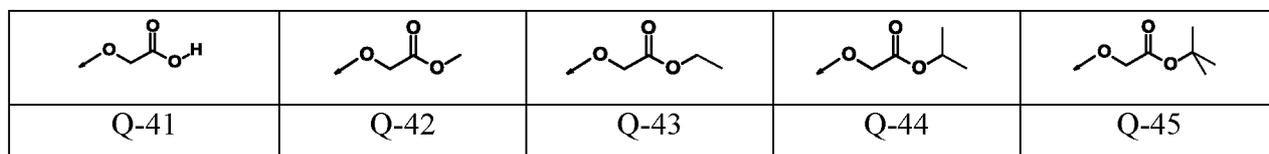
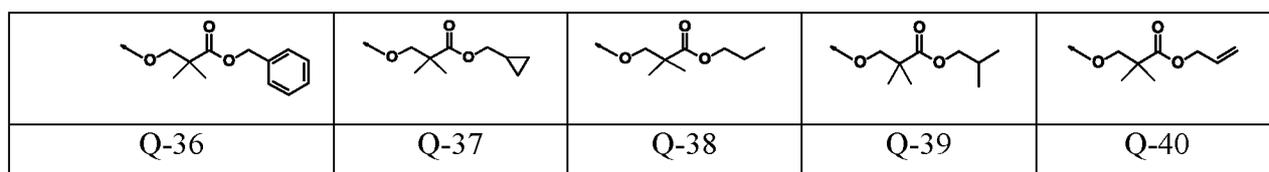
и Q представляет собой один из фрагментов Q-1 - Q-300, указанных ниже:

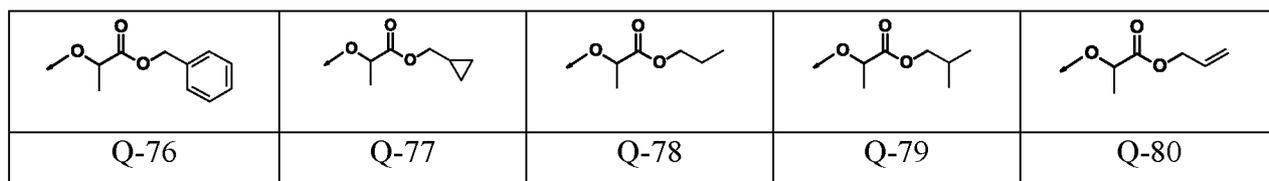
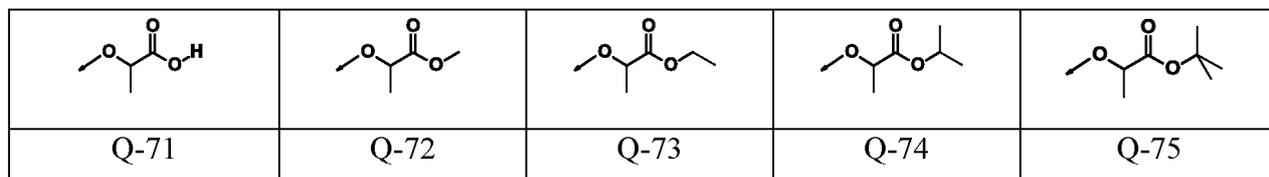
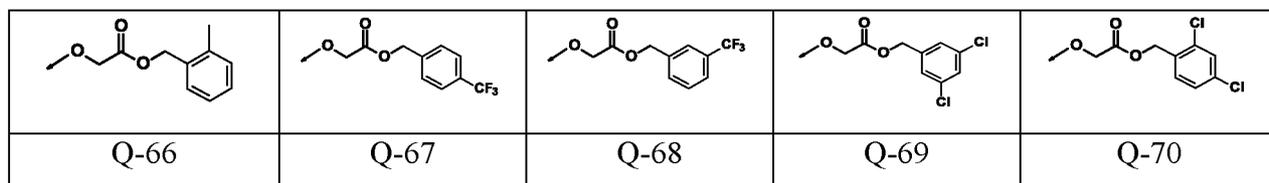
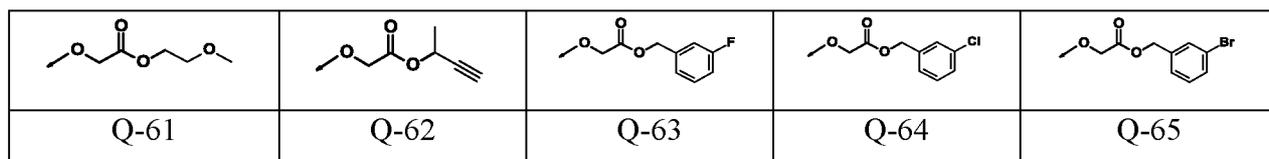
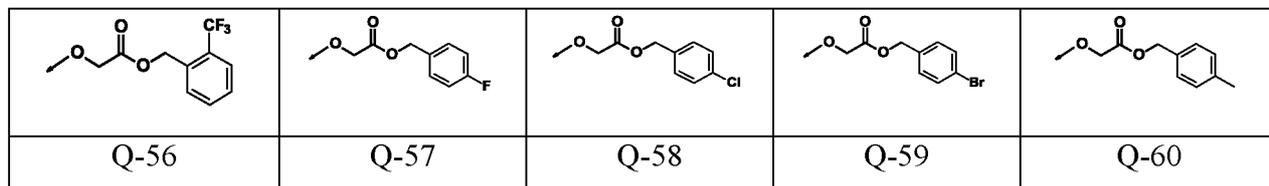
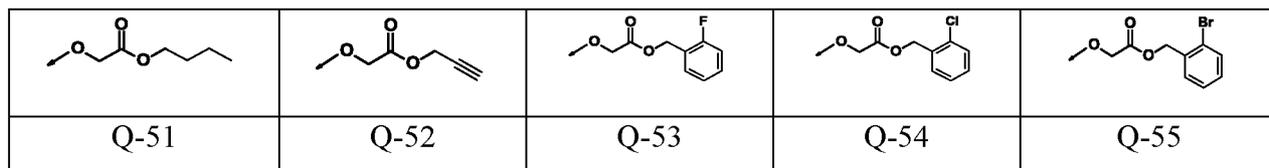
20

Q-1	Q-2	Q-3	Q-4	Q-5
Q-6	Q-7	Q-8	Q-9	Q-10

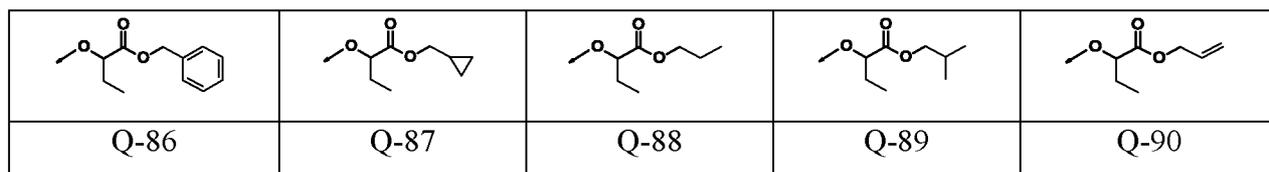
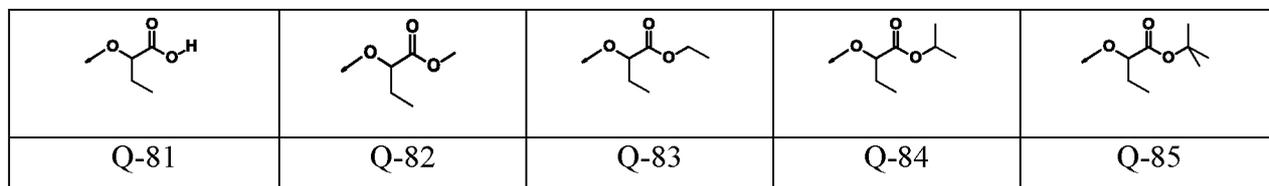


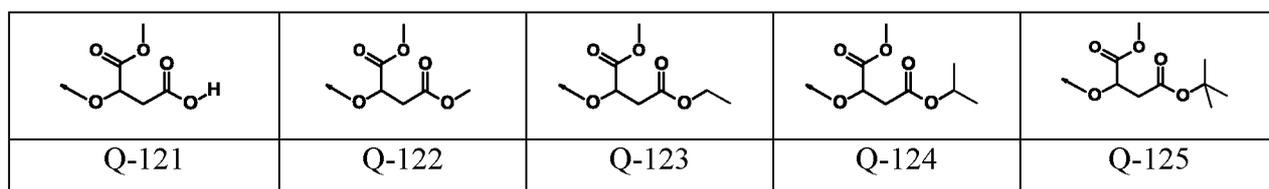
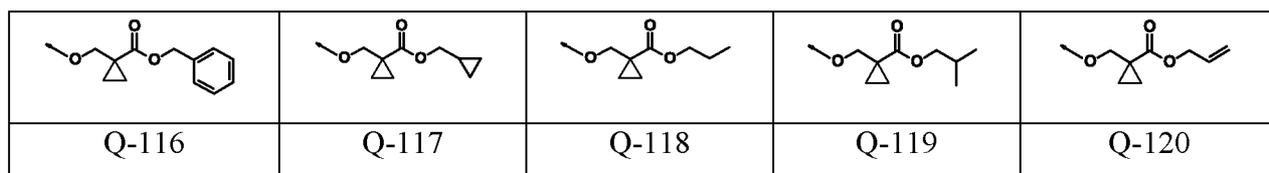
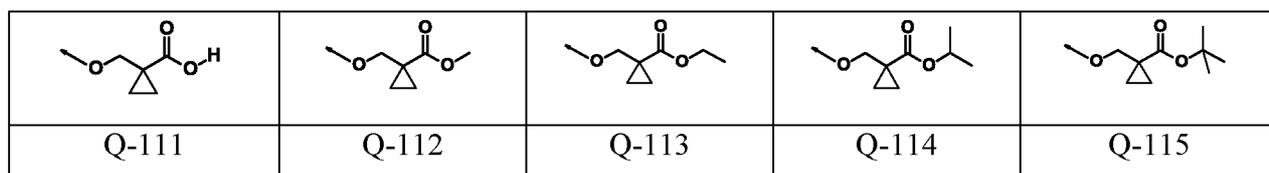
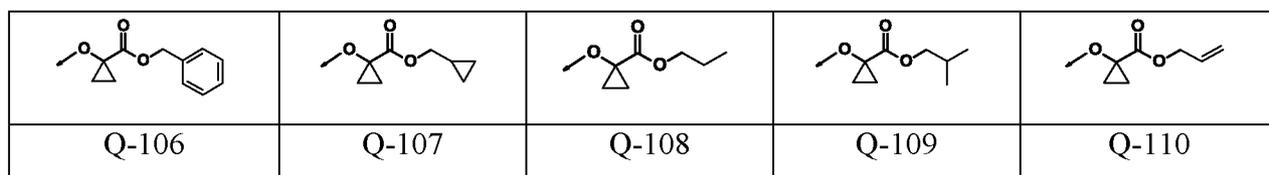
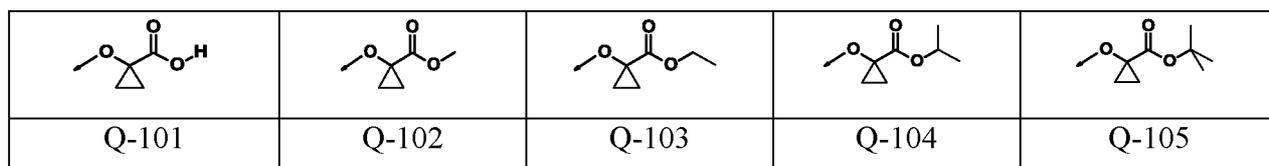
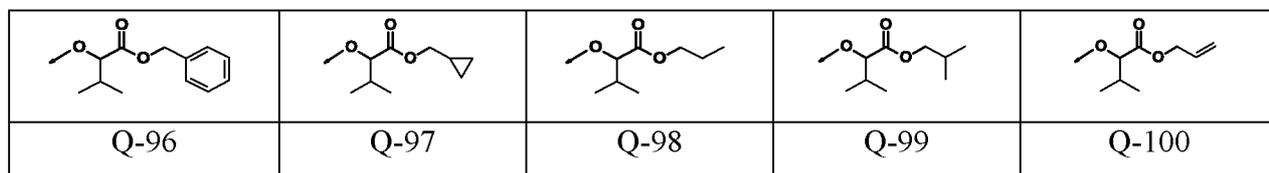
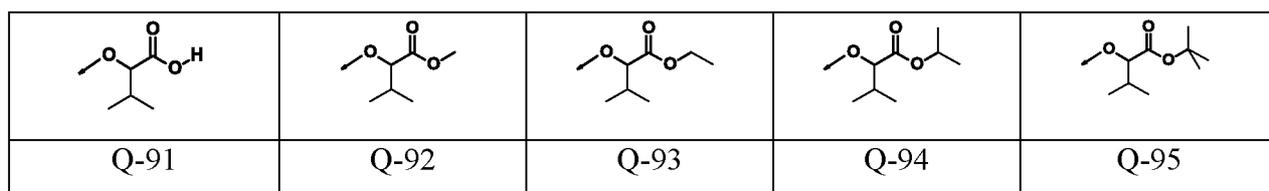
5



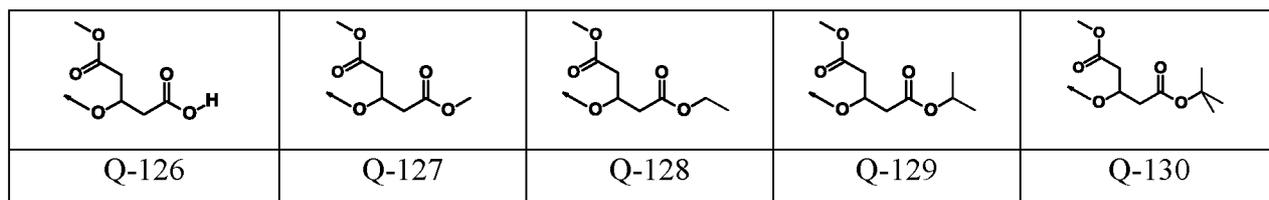


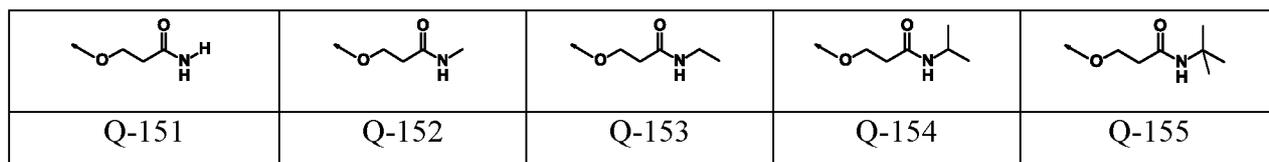
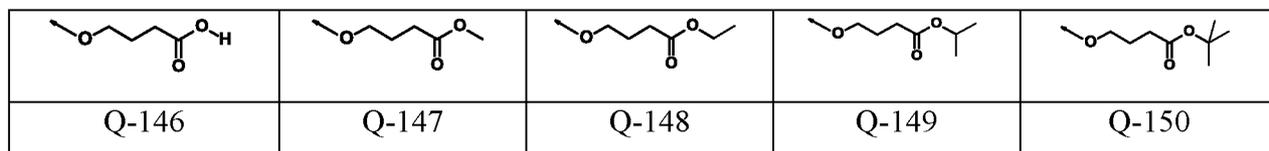
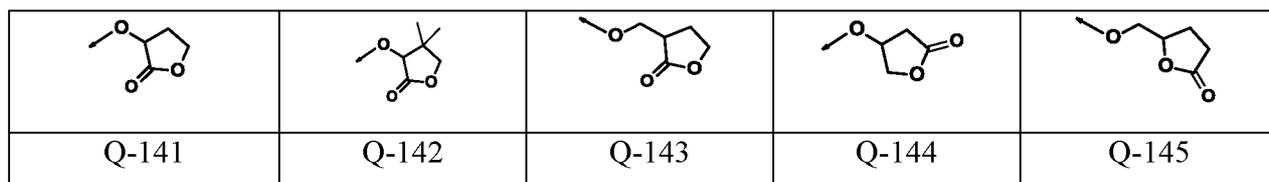
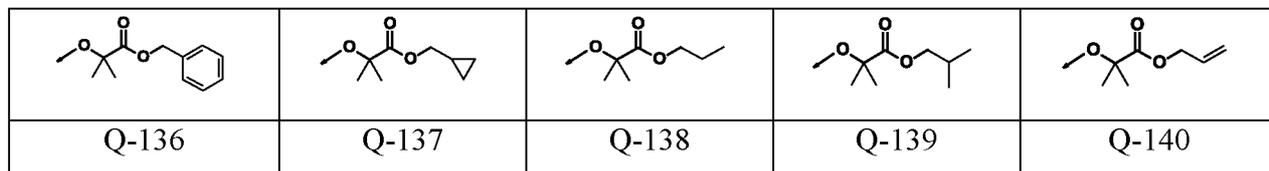
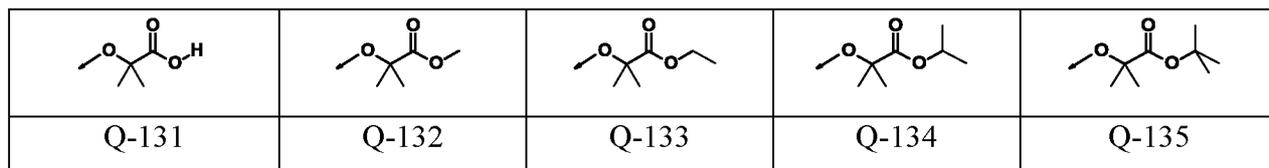
5



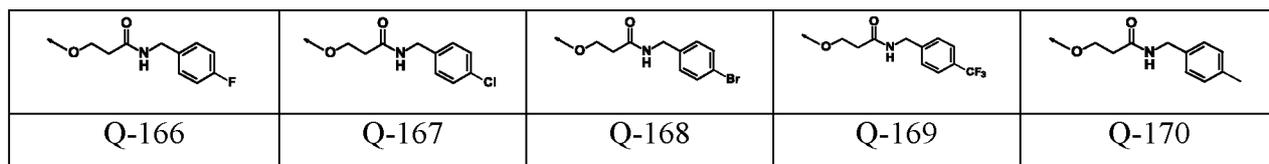
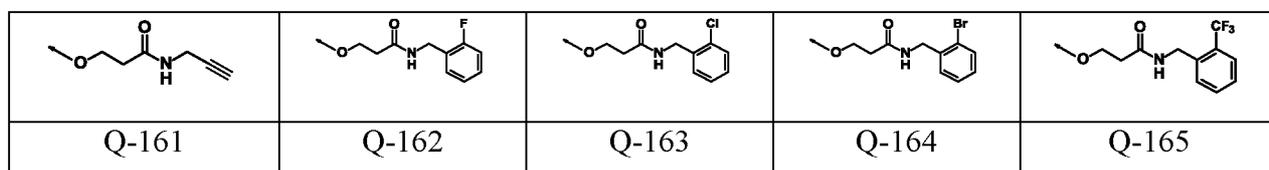
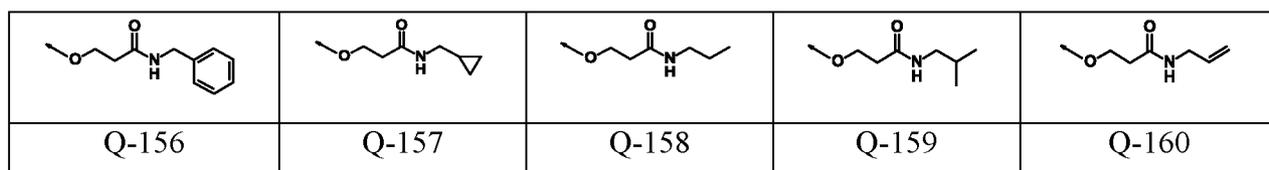


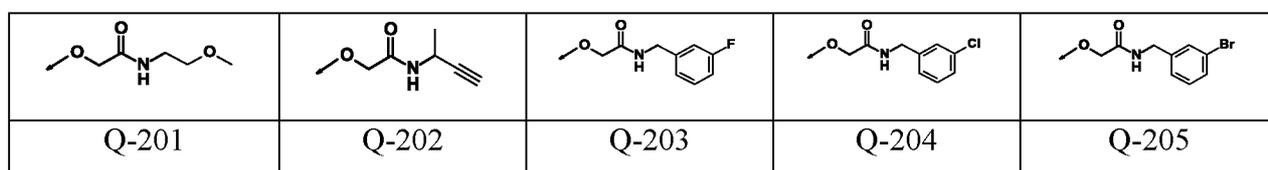
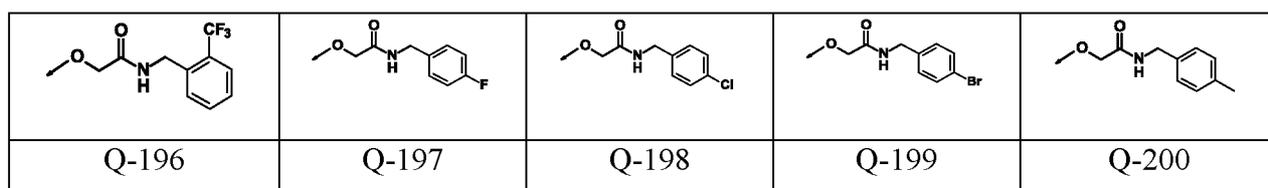
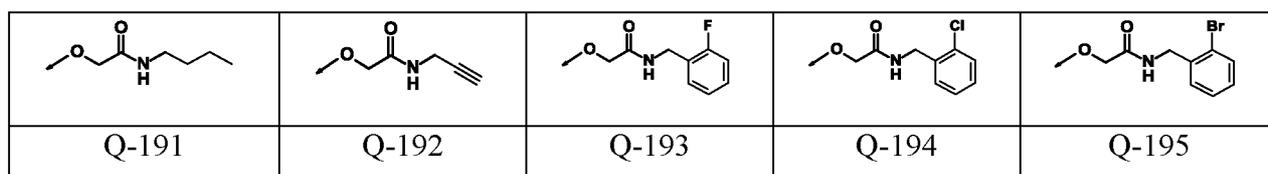
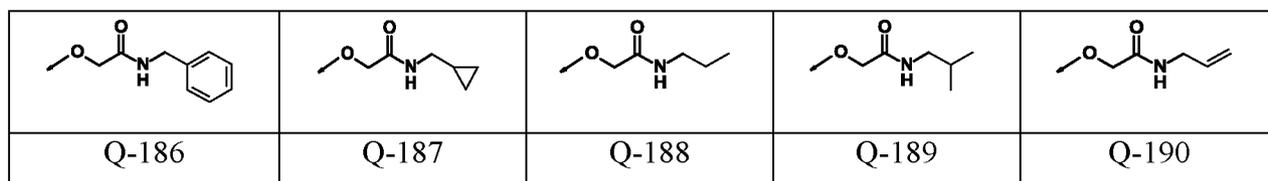
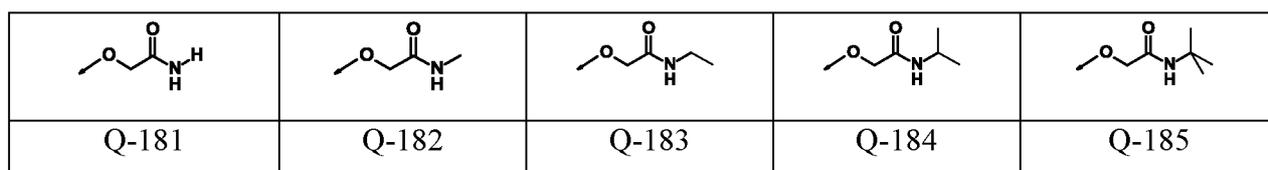
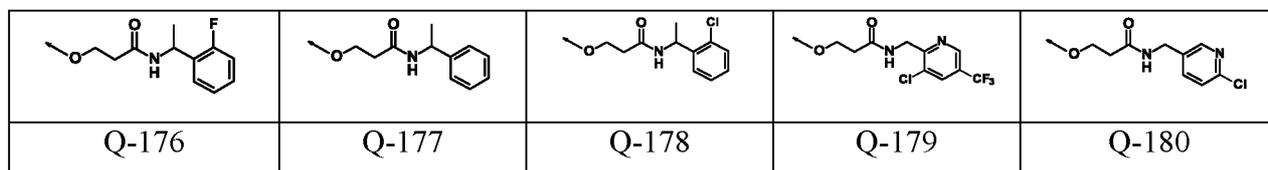
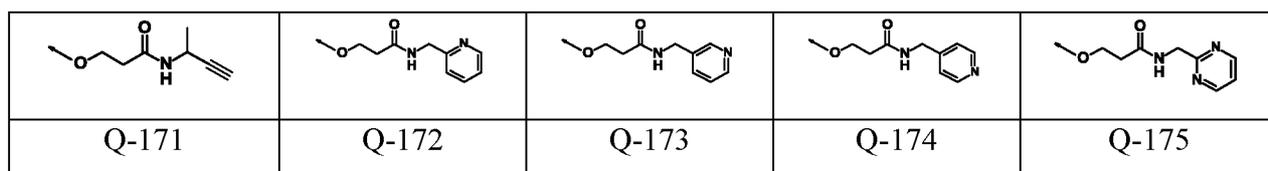
5



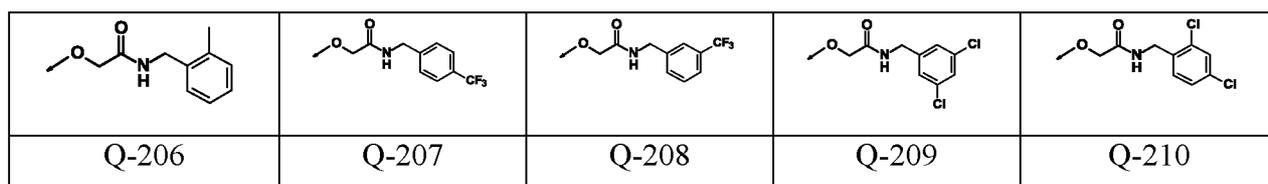


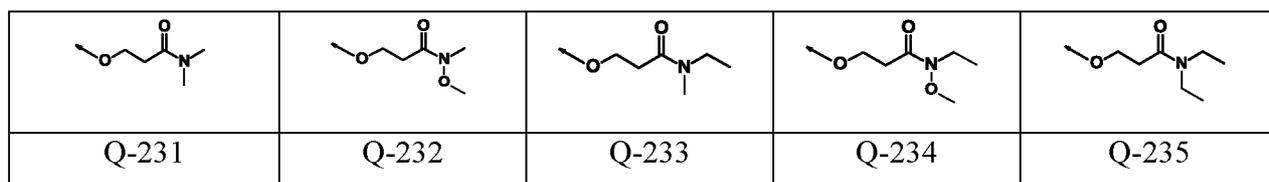
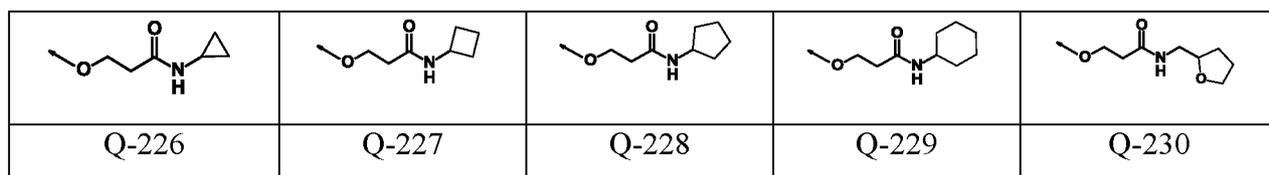
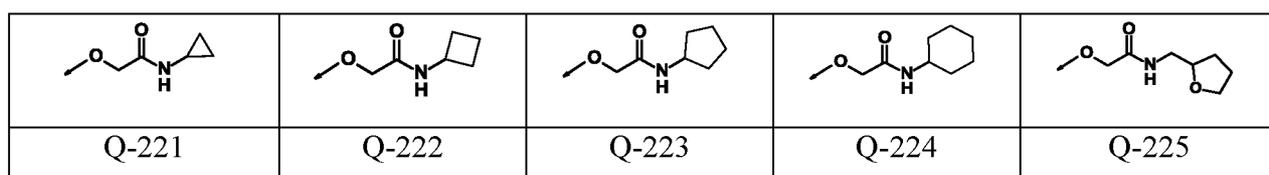
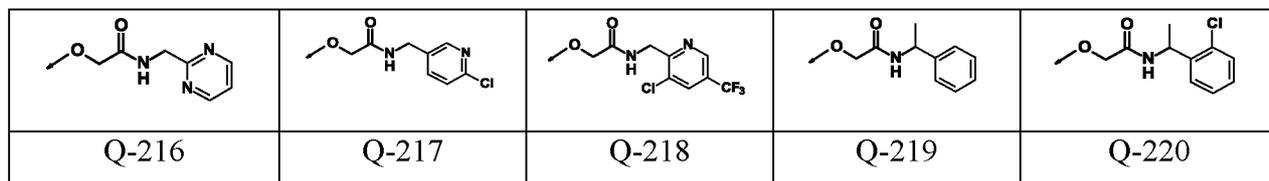
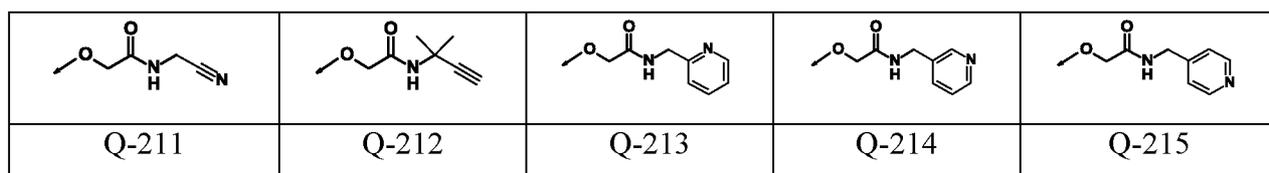
5



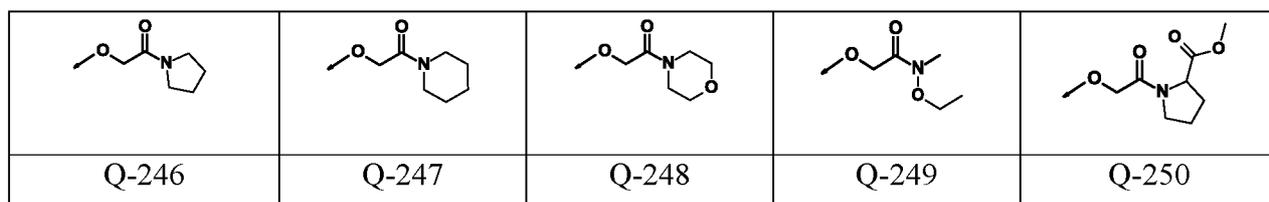
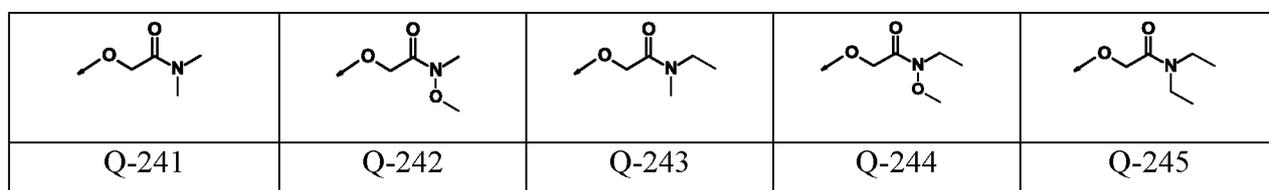
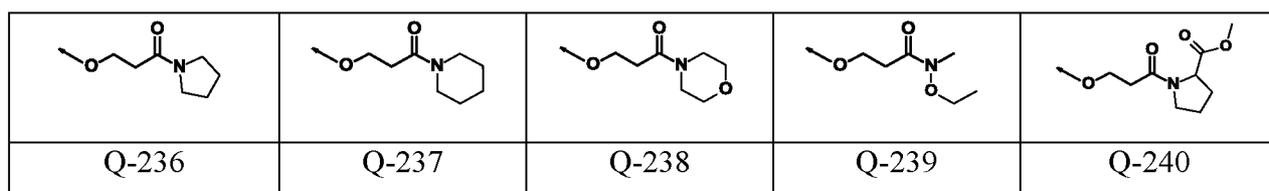


5

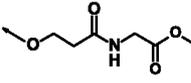
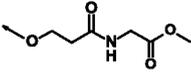
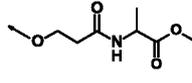
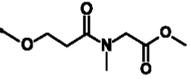
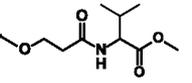


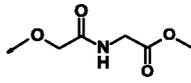
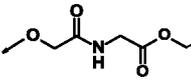
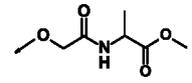
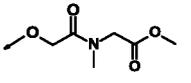
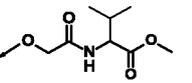


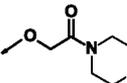
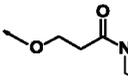
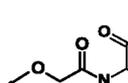
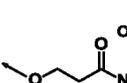
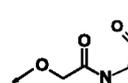
5



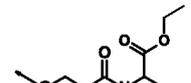
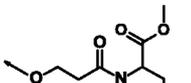
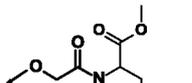
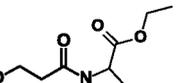
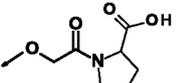
				
Q-251	Q-252	Q-253	Q-254	Q-255

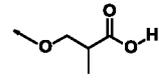
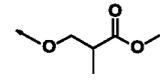
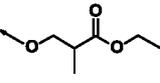
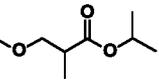
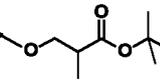
				
Q-256	Q-257	Q-258	Q-259	Q-260

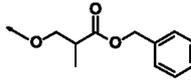
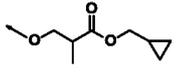
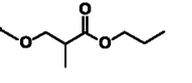
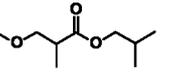
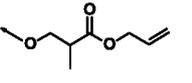
				
Q-261	Q-262	Q-263	Q-264	Q-265

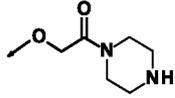
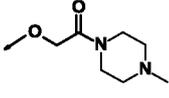
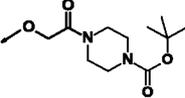
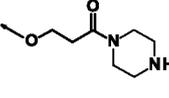
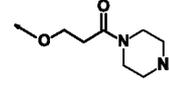
				
Q-266	Q-267	Q-268	Q-269	Q-270

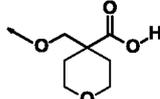
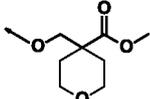
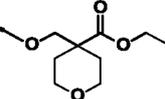
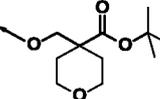
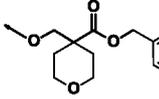
5

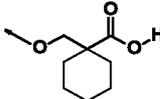
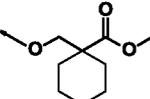
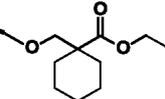
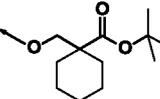
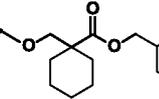
				
Q-271	Q-272	Q-273	Q-274	Q-275

				
Q-276	Q-277	Q-278	Q-279	Q-280

				
Q-281	Q-282	Q-283	Q-284	Q-285

				
Q-286	Q-287	Q-288	Q-289	Q-290

				
Q-291	Q-292	Q-293	Q-294	Q-295

				
Q-296	Q-297	Q-298	Q-299	Q-300

Настоящее изобретение особенно предпочтительно предусматривает соединения общей формулы (I), в которой

- 5 R^1 представляет собой метил, этил, н-пропил, 1-метилэтил, н-бутил, 1-метилпропил, 2-метилпропил, 1,1-диметилэтил, н-пентил, amino, диметиламино, диэтиламино,
- 10 R^2 представляет собой водород, метил, этил, н-пропил, изопропил,
- R^3 представляет собой водород, фтор, хлор, бром, метокси, этокси,
- 15 R^4 представляет собой галоген, циано, $C(O)NH_2$, $C(S)NH_2$, дифторметил, трифторметил, этинил, пропин-1-ил,
- 20 R^5 и R^6 независимо представляют собой водород, фтор, метил, этил, н-пропил, 1-метилэтил, н-бутил, 1-метилпропил, 2-метилпропил, 1,1-диметилэтил, н-пентил, 1-метилбутил, 2-метилбутил, 3-метилбутил, 1,1-диметилпропил, 1,2-диметилпропил, 2,2-диметилпропил, 1-этилпропил, н-гексил, 1-метилпентил, 2-метилпентил, 3-метилпентил, 4-метилпентил, 1,1-диметилбутил,

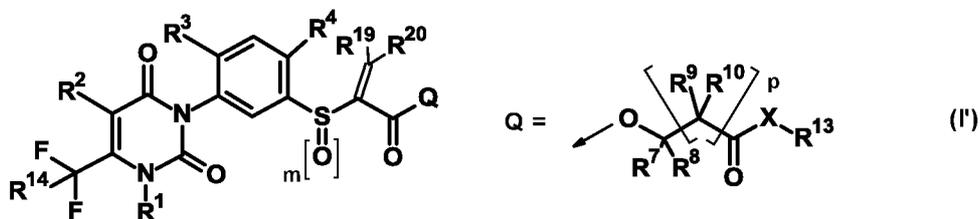
1,2-диметилбутил, 1,3-диметилбутил, 2,2-диметилбутил, 2,3-диметилбутил, 3,3-
 диметилбутил, 1-этилбутил, 2-этилбутил, 1,1,2-триметилпропил, 1,2,2-
 триметилпропил, 1-этил-1-метилпропил, 1-этил-2-метилпропил, циклопропил,
 циклобутил, циклопентил, циклогексил, циклопропилметил,
 5 циклобутилметил, циклопентилметил, циклогексилметил, этенил, 1-пропенил, 2-
 пропенил, 1-метилэтенил, 1-бутенил, 2-бутенил, 3-бутенил, 1-метил-1-пропенил,
 2-метил-1-пропенил, 1-метил-2-пропенил, 2-метил-2-пропенил, 1-пентенил, 2-
 пентенил, 3-пентенил, 4-пентенил, 1-метил-1-бутенил, 2-метил-1-бутенил, 3-
 метил-1-бутенил, 1-метил-2-бутенил, 2-метил-2-бутенил, 3-метил-2-бутенил, 1-
 10 метил-3-бутенил, 2-метил-3-бутенил, 3-метил-3-бутенил, 1,1-диметил-2-
 пропенил, 1,2-диметил-1-пропенил, 1,2-диметил-2-пропенил, 1-этил-1-пропенил,
 1-этил-2-пропенил, этинил, 1-пропинил, 2-пропинил, 1-бутинил, 2-бутинил, 3-бутинил,
 1-метил-2-пропинил, 1-пентинил, 2-пентинил, 3-пентинил, 4-пентинил, 1-метил-
 2-бутинил, 1-метил-3-бутинил, 2-метил-3-бутинил, 3-метил-1-бутинил, 1,1-
 15 диметил-2-пропинил, 1-этил-2-пропинил, трифторметил, пентафторэтил, 1,1,2,2-
 тетрафторэтил, гептафторпропил, нонафторбутил,
 хлордифторметил, бромдифторметил, дихлорфторметил, йоддифторметил,
 бромфторметил, 1-фторэтил, 2-фторэтил, фторметил, дифторметил, 2,2-
 дифторэтил, 2,2,2-трифторэтил, дифтор-трет-бутил, метокси, этокси, н-
 20 пропилокси,
 изопрпилокси, н-бутилокси, трет-бутилокси, метоксиметил, этоксиметил, н-
 пропилоксиметил, изопрпилоксиметил, метоксиэтил, этоксиэтил, н-
 пропилоксиэтил, изопрпилоксиэтил, метокси-н-пропил, метоксидифторметил,
 этоксидифторметил, н-пропилоксидифторметил, н-бутилоксидифторметил,
 25 трифторметоксиметил, трифторметоксиэтил, трифторметокси-н-пропил, фенил,
 2-фторфенил, 3-фторфенил, 4-фторфенил, 2,4-дифторфенил,
 2,5-дифторфенил, 2,6-дифторфенил, 2,3-дифторфенил, 3,4-дифторфенил, 3,5-
 дифторфенил, 2,4,5-трифторфенил, 3,4,5-трифторфенил, 2-хлорфенил, 3-
 хлорфенил, 4-хлорфенил, 2,4-дихлорфенил, 2,5-дихлорфенил, 2,6-дихлорфенил,
 30 2,3-дихлорфенил, 3,4-дихлорфенил, 3,5-дихлорфенил, 2,4,5-трихлорфенил, 3,4,5-
 трихлорфенил, 2,4,6-трихлорфенил, пиридин-2-ил, пиридин-3-ил, пиридин-4-ил,
 тиофен-2-ил, тиофен-3-ил,

- фуран-2-ил, тетрагидрофуран-2-ил, тетрагидрофуран-3-ил, 1-(4-метилфенил)этил, 1-(3-метилфенил)этил, 1-(2-метилфенил)этил, 1-(4-хлорфенил)этил, 1-(3-хлорфенил)этил,
- 5 1-(2-хлорфенил)этил, бензил, (4-фторфенил)метил, (3-фторфенил)метил, (2-фторфенил)метил, (2,4-дифторфенил)метил, (3,5-дифторфенил)метил, (2,5-дифторфенил)метил, (2,6-дифторфенил)метил, (2,4,5-трифторфенил)метил, (2,4,6-трифторфенил)метил, (4-хлорфенил)метил, (3-хлорфенил)метил, (2-хлорфенил)метил, (2,4-дихлорфенил)метил, (3,5-дихлорфенил)метил, (2,5-дихлорфенил)метил, (2,6-дихлорфенил)метил, (2,4,5-трихлорфенил)метил,
- 10 (2,4,6-трихлорфенил)метил, метилтиометил, этилтиометил, этилтиоэтил, метилтиоэтил, н-пропилтиометил, изопропилтиометил, трифторметилтиометил, трифторметилтиоэтил, метилкарбонилметил, этилкарбонилметил, н-пропилкарбонилметил, изопропилкарбонилметил, метилкарбонилэтил, гидроксикарбонил, метоксикарбонил,
- 15 этоксикарбонил, н-пропилоксикарбонил, изопропилоксикарбонил, н-бутилоксикарбонил, трет-бутилоксикарбонил, аллилоксикарбонил, бензилоксикарбонил, аминокарбонил, метиламинокарбонил, этиламинокарбонил, н-пропиламинокарбонил, изопропиламинокарбонил, диметиламинокарбонил,
- 20 диэтиламинокарбонил, метил(этил)аминокарбонил, циклопропиламинокарбонил, циклобутиламинокарбонил, циклопентиламинокарбонил, циклогексиламинокарбонил, аллиламинокарбонил, бензиламинокарбонил, трет-бутилоксикарбониламинокарбонил,
- гидроксикарбонилметил, метоксикарбонилметил, этоксикарбонилметил, н-пропилоксикарбонилметил, изопропилоксикарбонилметил, н-бутилоксикарбонилметил, трет-бутилоксикарбонилметил, аллилоксикарбонилметил, бензилоксикарбонилметил, аминокарбонилметил, метиламинокарбонилметил, этиламинокарбонилметил, н-пропиламинокарбонилметил, изопропиламинокарбонилметил, диметиламинокарбонилметил,
- 25 диэтиламинокарбонилметил, метил(этил)аминокарбонилметил, циклопропиламинокарбонилметил, циклобутиламинокарбонилметил, циклопентиламинокарбонилметил,
- 30 циклогексиламинокарбонилметил, аллиламинокарбонилметил, бензиламинокарбонилметил, 1-(гидроксикарбонил)эт-1-ил, 1-

- (метоксикарбонил)эт-1-ил, 1-(этоксикарбонил)эт-1-ил, 1-(трет-бутилоксикарбонил)эт-1-ил, 1-(бензилоксикарбонил)эт-1-ил, 2-(гидроксикарбонил)эт-1-ил, 2-(метоксикарбонил)эт-1-ил, 2-(этоксикарбонил)эт-1-ил, 2-(трет-бутилоксикарбонил)эт-1-ил,
- 5 2-(бензилоксикарбонил)эт-1-ил, 1-(гидроксикарбонил)проп-1-ил, 1-(метоксикарбонил)проп-1-ил, 1-(этоксикарбонил)проп-1-ил, 1-(трет-бутилоксикарбонил)проп-1-ил, 1-(бензилоксикарбонил)проп-1-ил, 2-(гидроксикарбонил)проп-1-ил, 2-(метоксикарбонил)проп-1-ил, 2-(этоксикарбонил)проп-1-ил,
- 10 2-(трет-бутилоксикарбонил)проп-1-ил, 2-(бензилоксикарбонил)проп-1-ил, 1-(гидроксикарбонил)проп-2-ил, 1-(метоксикарбонил)проп-2-ил, 1-(этоксикарбонил)проп-2-ил, 1-(трет-бутилоксикарбонил)проп-2-ил, 1-(бензилоксикарбонил)проп-2-ил, 3-(гидроксикарбонил)проп-1-ил, 3-(метоксикарбонил)проп-1-ил,
- 15 3-(этоксикарбонил)проп-1-ил, 3-(трет-бутилоксикарбонил)проп-1-ил, 3-(бензилоксикарбонил)проп-1-ил, аминометил, 2-аминоэт-1-ил, 1-аминоэт-1-ил, 1-аминопроп-1-ил, 3-аминопроп-1-ил, метиламинометил, диметиламинометил, диэтиламинометил, этиламинометил, изопропиламинометил, циклопропиламинометил, циклобутиламинометил, циклопентиламинометил,
- 20 циклогексиламинометил, метоксикарбониламинометил, этоксикарбониламинометил, трет-бутилоксикарбониламинометил, метилкарбониламинометил, этилкарбониламинометил, н-пропилкарбониламинометил, изопропилкарбониламинометил, 2-(метиламино)эт-1-ил, 2-(диэт-1-иламино)эт-1-ил, 2-(диэтиламино)эт-1-ил, 2-
- 25 (этиламино)эт-1-ил, 2-(изопропиламино)эт-1-ил, 2-(циклопропиламино)эт-1-ил, 2-(циклобутиламино)эт-1-ил, 2-(циклопентиламино)эт-1-ил, 2-(циклогексиламино)эт-1-ил, 2-(метоксикарбониламино)эт-1-ил, 2-(этоксикарбониламино)эт-1-ил, 2-(трет-бутилоксикарбониламино)эт-1-ил, 2-(метилкарбониламино)эт-1-ил, 2-(этилкарбониламино)эт-1-ил, 2-(н-пропилкарбониламино)эт-1-ил, 2-
- 30 (изопропилкарбониламино)эт-1-ил, 1-(метиламино)эт-1-ил, 1-(диэт-1-иламино)эт-1-ил, 1-(диэтиламино)эт-1-ил, 1-(этиламино)эт-1-ил, 1-(изопропиламино)эт-1-ил, 1-(циклопропиламино)эт-1-ил, 1-(циклобутиламино)эт-1-ил, 1-(циклопентиламино)эт-1-ил, 1-(циклогексиламино)эт-1-ил, 1-(метоксикарбониламино)эт-1-ил, 1-(этоксикарбониламино)эт-1-ил, 1-

(трет-бутилоксикарбониламино)эт-1-ил, 1-(метилкарбониламино)эт-1-ил, 1-(этилкарбониламино)эт-1-ил, 1-(н-пропилкарбониламино)эт-1-ил, 1-(изопропилкарбониламино)эт-1-ил, или

- 5 R^5 и R^6 вместе с атомом углерода, с которым они связаны, образуют полностью насыщенное или частично насыщенное 3-10-членное моноциклическое или бициклическое кольцо, необязательно прерываемое гетероатомами и необязательно включающее дополнительное замещение, или
- 10 R^5 и R^6 вместе с атомом углерода, с которым они связаны, образуют двойную связь, необязательно замещенную R^{19} и R^{20} , в соответствии с формулой (I') ниже,



- 15 R^{14} представляет собой водород, фтор, хлор, бром, трифторметил, метокси, этокси, н-пропилокси, н-бутилокси,
- m равняется 0, 1, 2,
- 20 R^{19} и R^{20} независимо представляют собой водород, фтор, хлор, бром, метил, этил, н-пропил, 1-метилэтил, н-бутил, 1-метилпропил, 2-метилпропил, 1,1-диметилэтил, н-пентил, 1-метилбутил, 2-метилбутил, 3-метилбутил, 1,1-диметилпропил, 1,2-диметилпропил, 2,2-диметилпропил, 1-этилпропил, н-гексил, циклопропил, циклобутил, циклопентил, циклогексил, трифторметил, дифторметил,
- 25 пентафторэтил, этенил, 1-пропенил, 1-метилэтенил, 1-бутенил, фенил или
- R^{19} и R^{20} вместе с атомом углерода, с которым они связаны, образуют 3-10-членное моноциклическое или бициклическое кольцо, которое является насыщенным или необязательно прерываемым гетероатомами и необязательно включает
- 30 дополнительное замещение,

и

Q представляет собой один из фрагментов Q-1 - Q-300, указанных выше.

5

Настоящее изобретение особенно предпочтительно предусматривает соединения общей формулы (I), в которой

10 R^1 представляет собой метил, этил, н-пропил, 1-метилэтил, н-бутил, 1-метилпропил, 2-метилпропил, 1,1-диметилэтил, amino, диметиламино,

R^2 представляет собой водород, метил, этил, н-пропил, изопропил,

15 R^3 представляет собой водород, фтор, хлор, бром, метокси, этокси,

R^4 представляет собой фтор, хлор, бром, циано, $C(O)NH_2$, $C(S)NH_2$, дифторметил, трифторметил, этинил, пропин-1-ил,

20 R^5 и R^6 независимо представляют собой водород, фтор, метил, этил, н-пропил, 1-метилэтил, н-бутил, 1-метилпропил, 2-метилпропил, 1,1-диметилэтил, н-пентил, 1-метилбутил, 2-метилбутил, 3-метилбутил, 1,1-диметилпропил, 1,2-диметилпропил, 2,2-диметилпропил, 1-этилпропил, н-гексил, 1-метилпентил, 2-метилпентил, 3-метилпентил, 4-метилпентил, 1,1-диметилбутил,

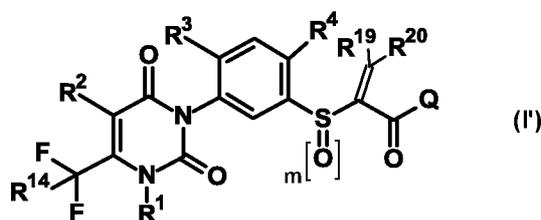
25 1,2-диметилбутил, 1,3-диметилбутил, 2,2-диметилбутил, 2,3-диметилбутил, 3,3-диметилбутил, 1-этилбутил, 2-этилбутил, 1,1,2-триметилпропил, 1,2,2-триметилпропил, 1-этил-1-метилпропил, 1-этил-2-метилпропил, циклопропил, циклобутил, циклопентил, циклогексил, циклопропилметил,

30 циклобутилметил, циклопентилметил, циклогексилметил, этенил, 1-пропенил, 2-пропенил, 1-метилэтенил, 1-бутенил, 2-бутенил, 3-бутенил, 1-метил-1-пропенил, 2-метил-1-пропенил, 1-метил-2-пропенил, 2-метил-2-пропенил, 1-пентенил, 2-пентенил, 3-пентенил, 4-пентенил, 1-метил-1-бутенил, 2-метил-1-бутенил, 3-метил-1-бутенил, 1-метил-2-бутенил, 2-метил-2-бутенил, 3-метил-2-бутенил, 1-метил-3-бутенил, 2-метил-3-бутенил, 3-метил-3-бутенил,

1,1-диметил-2-пропенил, 1,2-диметил-1-пропенил, 1,2-диметил-2-пропенил, 1-этил-1-пропенил, 1-этил-2-пропенил, этинил, 1-пропинил, 2-пропинил, 1-бутинил, 2-бутинил, 3-бутинил, 1-метил-2-пропинил, 1-пентинил, 2-пентинил, 3-пентинил, 4-пентинил, 1-метил-2-бутинил, 1-метил-3-бутинил, 2-метил-3-бутинил, 3-метил-1-бутинил, 1,1-диметил-2-пропинил, 1-этил-2-пропинил, трифторметил, пентафторэтил, 1,1,2,2-тетрафторэтил, гептафторпропил, дифторметил, 2,2-дифторэтил, 2,2,2-трифторэтил, метокси, этокси, н-пропилокси, изопрпилокси, н-бутилокси, метоксиметил, этоксиметил, н-пропилоксиметил, изопрпилоксиметил, метоксиэтил, этоксиэтил, н-пропилоксиэтил, изопрпилоксиэтил, метокси-н-пропил, трифторметоксиметил, трифторметоксиэтил, трифторметокси-н-пропил, фенил, пиридин-2-ил, пиридин-3-ил, пиридин-4-ил, тиофен-2-ил, тиофен-3-ил, фуран-2-ил, тетрагидрофуран-2-ил, тетрагидрофуран-3-ил, бензил, метилтиометил, этилтиометил, этилтиоэтил, метилтиоэтил, н-пропилтиометил, изопрпилтиометил, трифторметилтиометил, трифторметилтиоэтил, или

R^5 и R^6 вместе с атомом углерода, с которым они связаны, образуют полностью насыщенное или частично насыщенное 3-10-членное моноциклическое или бициклическое кольцо, необязательно прерываемое гетероатомами и необязательно включающее дополнительное замещение, или

R^5 и R^6 вместе с атомом углерода, с которым они связаны, образуют двойную связь, необязательно замещенную R^{19} и R^{20} , в соответствии с формулой (I) ниже,



R^{14} представляет собой водород, фтор, хлор, бром, трифторметил, метокси, этокси,

m равняется 0, 1, 2,

R^{19} и R^{20} независимо представляют собой водород, фтор, хлор, бром, метил, этил, н-пропил, 1-метилэтил, н-бутил, 1-метилпропил, 2-метилпропил, 1,1-диметилэтил, н-пентил, 1-метилбутил, 2-метилбутил, 3-метилбутил, 1,1-диметилпропил, 1,2-диметилпропил, 2,2-диметилпропил, 1-этилпропил, н-гексил, циклопропил, циклобутил, циклопентил, циклогексил, трифторметил, дифторметил, пентафторэтил, этенил, 1-пропенил, 1-метилэтенил, 1-бутенил, фенил или

R^{19} и R^{20} вместе с атомом углерода, с которым они связаны, образуют 3-10-членное моноциклическое или бициклическое кольцо, которое является насыщенным или необязательно прерываемым гетероатомами и необязательно включает дополнительное замещение,

и

Q представляет собой один из фрагментов Q-1, Q-2, Q-3, Q-4, Q-5, Q-6, Q-7, Q-8, Q-10, Q-11, Q-12, Q-16, Q-17, Q-18, Q-19, Q-20, Q-21, Q-22, Q-23, Q-31, Q-32, Q-33, Q-41, Q-42, Q-43, Q-44, Q-45, Q-46, Q-47, Q-48, Q-49, Q-50, Q-51, Q-52, Q-53, Q-57, Q-61, Q-71, Q-72, Q-73, Q-74, Q-75, Q-76, Q-102, Q-103, Q-127, Q-132, Q-133, Q-141, Q-142, Q-144, Q-145, Q-146, Q-147, Q-148, Q-151, Q-152, Q-153, Q-154, Q-155, Q-156, Q-160, Q-161, Q-166, Q-167, Q-181, Q-182, Q-183, Q-184, Q-185, Q-186, Q-187, Q-188, Q-189, Q-190, Q-191, Q-192, Q-201, Q-211, Q-231, Q-232, Q-233, Q-241, Q-242, Q-251, Q-254, Q-255, Q-292, Q-293, указанных выше.

Определения радикалов, приведенные в общем виде или перечисленные в предпочтительных областях выше, применимы как к конечным продуктам формулы (I), так и, соответственно, к исходным материалам или промежуточным соединениям, необходимым в каждом случае для получения. Такие определения радикалов можно объединять друг с другом, по желанию, т. е. в том числе в виде комбинации между указанными предпочтительными диапазонами.

В основном по причинам более высокой гербицидной активности, лучшей селективности и/или лучшей легкости в получении конкретный интерес связан с соединениями указанной формулы (I) в соответствии с настоящим изобретением или их солями, или их применением в соответствии с настоящим изобретением, у которых

отдельные радикалы имеют одно из предпочтительных значений, уже указанных или указанных далее в данном документе, или, в частности, с таковыми, у которых одно или несколько предпочтительных значений, уже указанных или указанных далее в данном документе, имеют место в комбинации.

5

Если соединения могут образовывать, в результате смещения атома водорода, таутомеры, характеризующиеся структурами, которые не будут охватываться формулой (I) в формальном смысле, такие таутомеры, тем не менее, охватываются определением соединений формулы (I) в соответствии с настоящим изобретением, если не рассматривается конкретный таутомер. Например, многие карбонильные соединения могут находиться либо в кето-форме, либо в енольной форме, обе формы охватываются определением соединения формулы (I).

10

В зависимости от природы заместителей и способа их присоединения соединения общей формулы (I) могут существовать в виде стереоизомеров. Все возможные стереоизомеры, определенные их конкретной трехмерной формой, такие как энантиомеры, диастереомеры и Z- и E-изомеры, охватываются формулой (I). Например, если присутствуют одна или несколько алкенильных групп, могут образовываться диастереомеры (Z- и E-изомеры). Например, если присутствуют один или несколько асимметричных атомов углерода, могут образовываться энантиомеры и диастереомеры. Стереоизомеры можно получать из смесей, полученных при подготовке, с помощью традиционных способов разделения. Хроматографическое разделение можно осуществлять либо в аналитическом масштабе для определения энантиомерного избытка или диастереомерного избытка, либо в препаративном масштабе для получения тестовых образцов для биологического тестирования. Подобным образом, можно выборочно получать стереоизомеры путем применения стереоселективных реакций с применением оптически активных исходных материалов и/или вспомогательных средств. Таким образом, настоящее изобретение также относится ко всем стереоизомерам, которые охватываются общей формулой (I), но не определены с помощью их конкретной стереомерной формы, и к их смесям.

20

25

30

Если соединения получают в твердой форме, также можно осуществлять очистку путем перекристаллизации или расщепления. Если отдельные соединения (I) нельзя получить удовлетворительным образом с помощью путей, описанных далее в данном документе,

их можно получить путем дериватизации других соединений (I).

5 Применимые способы выделения, очистки и разделения стереоизомеров для соединений формулы (I) включают способы, известные в общем виде специалисту в данной области техники из аналогичных случаев, например, с помощью физических 5 способов, таких как кристаллизация, способов хроматографии, в частности, колоночной хроматографии и HPLC (жидкостная хроматография под высоким давлением), перегонки, необязательно при пониженном давлении, экстракции и других 10 способов; любые оставшиеся смеси, как правило, можно разделить посредством хроматографического разделения, например на твердых хиральных фазах. Для препаративных количеств или в промышленном масштабе применимые способы 15 включают кристаллизацию, например, диастереомерных солей, которые можно получать из смесей диастереомеров с оптически активными кислотами и, если необходимо, в присутствии кислотных групп, с оптически активными основаниями.

15 Касательно соединений по настоящему изобретению обозначения, применяемые выше и далее ниже, разъясняются. Они знакомы специалисту в данной области техники и, в частности, имеют значения, разъясняемые далее в данном документе.

20 Если не определено иначе, как правило, в случае обозначения химических групп связывание с остовом или остальной частью молекулы происходит посредством последнего структурного элемента, указанного в рассматриваемой химической группе, т. е., например, посредством атома кислорода в случае (C₂-C₈)-алкенилокси, и 25 посредством соответствующего атома углерода алкильной группы в случае гетероциклил-(C₁-C₈)-алкила или R¹⁷O(O)C-(C₁-C₈)-алкила.

В соответствии с настоящим изобретением "алкилсульфонил", отдельно или как часть 30 химической группы, представляет собой алкилсульфонил с прямой или разветвленной цепью, предпочтительно содержащий 1-8 или содержащий 1-6 атомов углерода, например (без ограничения) (C₁-C₆)-алкилсульфонил, такой как метилсульфонил, этилсульфонил, пропилсульфонил, 1-метилэтилсульфонил, бутилсульфонил, 1-метилпропилсульфонил, 2-метилпропилсульфонил, 1,1-диметилэтилсульфонил, пентилсульфонил, 1-метилбутилсульфонил, 2-метилбутилсульфонил, 3-метилбутилсульфонил, 1,1-диметилпропилсульфонил, 1,2-диметилпропилсульфонил,

2,2-диметилпропилсульфонил, 1-этилпропилсульфонил, гексилсульфонил, 1-метилпентилсульфонил, 2-метилпентилсульфонил, 3-метилпентилсульфонил, 4-метилпентилсульфонил, 1,1-диметилбутилсульфонил, 1,2-диметилбутилсульфонил, 1,3-диметилбутилсульфонил, 2,2-диметилбутилсульфонил, 2,3-диметилбутилсульфонил, 3,3-диметилбутилсульфонил, 1-этилбутилсульфонил, 2-этилбутилсульфонил, 1,1,2-триметилпропилсульфонил, 1,2,2-триметилпропилсульфонил, 1-этил-1-метилпропилсульфонил и 1-этил-2-метилпропилсульфонил.

В соответствии с настоящим изобретением "гетероарилсульфонил" представляет собой необязательно замещенный пиридилсульфонил, пиримидинилсульфонил, пиазинилсульфонил или необязательно замещенный полициклический гетероарилсульфонил, в данном документе, в частности, необязательно замещенный хинолинилсульфонил, например, замещенный фтором, хлором, бромом, йодом, циано-, нитро- или алкильной, галогеналкильной, галогеналкоксии-, амино-, алкиламино-, алкилкарбониламино-, диалкиламино- или алкоксигруппами.

В соответствии с настоящим изобретением "алкилтио", отдельно или как часть химической группы, представляет собой S-алкил с прямой или разветвленной цепью, предпочтительно содержащий 1-8 или содержащий 1-6 атомов углерода, такой как (C₁-C₁₀)-, (C₁-C₆)- или (C₁-C₄)-алкилтио, например (без ограничения) (C₁-C₆)-алкилтио, такой как метилтио, этилтио, пропилтио, 1-метилэтилтио, бутилтио, 1-метилпропилтио, 2-метилпропилтио, 1,1-диметилэтилтио, пентилтио, 1-метилбутилтио, 2-метилбутилтио, 3-метилбутилтио, 1,1-диметилпропилтио, 1,2-диметилпропилтио, 2,2-диметилпропилтио, 1-этилпропилтио, гексилтио, 1-метилпентилтио, 2-метилпентилтио, 3-метилпентилтио, 4-метилпентилтио, 1,1-диметилбутилтио, 1,2-диметилбутилтио, 1,3-диметилбутилтио, 2,2-диметилбутилтио, 2,3-диметилбутилтио, 3,3-диметилбутилтио, 1-этилбутилтио, 2-этилбутилтио, 1,1,2-триметилпропилтио, 1,2,2-триметилпропилтио, 1-этил-1-метилпропилтио и 1-этил-2-метилпропилтио.

В соответствии с настоящим изобретением "алкенилтио" означает алкенильный радикал, связанный посредством атома серы, алкинилтио означает алкинильный радикал, связанный посредством атома серы, циклоалкилтио означает циклоалкильный радикал, связанный посредством атома серы, и циклоалкенилтио означает циклоалкенильный радикал, связанный посредством атома серы.

"Алкилсульфинил (алкил-S(=O)-)", если не определено иначе где-либо еще, в соответствии с настоящим изобретением представляет собой алкильные радикалы, связанные с остовом посредством -S(=O)-, такие как (C₁-C₁₀)-, (C₁-C₆)- или (C₁-C₄)- алкилсульфинил, например (без ограничения) (C₁-C₆)-алкилсульфинил, такой как метилсульфинил, этилсульфинил, пропилсульфинил, 1-метилэтилсульфинил, 5 бутилсульфинил, 1-метилпропилсульфинил, 2-метилпропилсульфинил, 1,1-диметилэтилсульфинил, пентилсульфинил, 1-метилбутилсульфинил, 2-метилбутилсульфинил, 3-метилбутилсульфинил, 1,1-диметилпропилсульфинил, 1,2-диметилпропилсульфинил, 2,2-диметилпропилсульфинил, 1-этилпропилсульфинил, 10 гексилсульфинил, 1-метилпентилсульфинил, 2-метилпентилсульфинил, 3-метилпентилсульфинил, 4-метилпентилсульфинил, 1,1-диметилбутилсульфинил, 1,2-диметилбутилсульфинил, 1,3-диметилбутилсульфинил, 2,2-диметилбутилсульфинил, 2,3-диметилбутилсульфинил, 3,3-диметилбутилсульфинил, 1-этилбутилсульфинил, 2-этилбутилсульфинил, 1,1,2-триметилпропилсульфинил, 1,2,2-триметилпропилсульфинил, 1-этил-1-метилпропилсульфинил и 1-этил-2-метилпропилсульфинил.

Аналогично "алкенилсульфинил" и "алкинилсульфинил" соответственно определены в соответствии с настоящим изобретением как алкенильные и алкинильные радикалы, 20 связанные с остовом посредством -S(=O)-, такие как (C₂-C₁₀)-, (C₂-C₆)- или (C₂-C₄)- алкенилсульфинил и (C₃-C₁₀)-, (C₃-C₆)- или (C₃-C₄)-алкинилсульфинил.

Аналогично "алкенилсульфонил" и "алкинилсульфонил" соответственно определены в соответствии с настоящим изобретением как алкенильные и алкинильные радикалы, 25 связанные с остовом посредством -S(=O)₂-, такие как (C₂-C₁₀)-, (C₂-C₆)- или (C₂-C₄)- алкенилсульфонил и (C₃-C₁₀)-, (C₃-C₆)- или (C₃-C₄)-алкинилсульфонил.

"Алкокси" означает алкильный радикал, связанный посредством атома кислорода, 30 например (без ограничения) (C₁-C₆)-алкокси, такой как метокси, этокси, пропокси, 1-метилэтокси, бутокси, 1-метилпропокси, 2-метилпропокси, 1,1-диметилэтокси, пентокси, 1-метилбутокси, 2-метилбутокси, 3-метилбутокси, 1,1-диметилпропокси, 1,2-диметилпропокси, 2,2-диметилпропокси, 1-этилпропокси, гексокси, 1-метилпентокси, 2-метилпентокси, 3-метилпентокси, 4-метилпентокси, 1,1-диметилбутокси, 1,2-

диметилбутоксиды, 1,3-диметилбутоксиды, 2,2-диметилбутоксиды, 2,3-диметилбутоксиды, 3,3-диметилбутоксиды, 1-этилбутоксиды, 2-этилбутоксиды, 1,1,2-триметилпропоксиды, 1,2,2-триметилпропоксиды, 1-этил-1-метилпропоксиды и 1-этил-2-метилпропоксиды. Алкенилокси означает алкенильный радикал, связанный посредством атома кислорода, алкинилокси

5 означает алкинильный радикал, связанный посредством атома кислорода, например $(C_2-C_{10})-$, $(C_2-C_6)-$ или $(C_2-C_4)-$ -алкенилокси или $(C_3-C_{10})-$, $(C_3-C_6)-$ или $(C_3-C_4)-$ -алкинилокси.

"Циклоалкилокси" означает циклоалкильный радикал, связанный посредством атома

10 кислорода, и циклоалкенилокси означает циклоалкенильный радикал, связанный посредством атома кислорода.

"Алкилкарбонил" ($алкил-C(=O)-$), если не определено иначе где-либо еще, в соответствии с настоящим изобретением представляет собой алкильные радикалы,

15 связанные с остовом посредством $-C(=O)-$, например $(C_1-C_{10})-$, $(C_1-C_6)-$ или $(C_1-C_4)-$ -алкилкарбонил. Число атомов углерода относится в данном случае к алкильному радикалу в алкилкарбонильной группе.

Аналогично, "алкенилкарбонил" и "алкинилкарбонил", если не определено иначе где-

20 либо еще, в соответствии с настоящим изобретением соответственно представляют собой алкенильные и алкинильные радикалы, связанные с остовом посредством $-C(=O)-$, такие как $(C_2-C_{10})-$, $(C_2-C_6)-$ или $(C_2-C_4)-$ -алкенилкарбонил и $(C_2-C_{10})-$, $(C_2-C_6)-$ или $(C_2-C_4)-$ -алкинилкарбонил. Число атомов углерода относится в данном случае к алкенильному или алкинильному радикалу в алкенил- или алкинилкарбонильной

25 группе.

"Алкоксикарбонил ($алкил-O-C(=O)-$)", если не определено иначе где-либо еще, представляет собой алкильные радикалы, связанные с остовом посредством $-O-C(=O)-$,

30 например $(C_1-C_{10})-$, $(C_1-C_6)-$ или $(C_1-C_4)-$ -алкоксикарбонил. Число атомов углерода относится в данном случае к алкильному радикалу в алкоксикарбонильной группе.

Аналогично, "алкенилоксикарбонил" и "алкинилоксикарбонил", если не определено иначе где-либо еще, в соответствии с настоящим изобретением соответственно представляют собой алкенильные и алкинильные радикалы, связанные с остовом посредством $-O-C(=O)-$, такие как $(C_2-C_{10})-$, $(C_2-C_6)-$ или $(C_2-C_4)-$ -алкенилоксикарбонил

и (C₃-C₁₀)-, (C₃-C₆)- или (C₃-C₄)-алкинилоксикарбонил. Число атомов углерода относится в данном случае к алкенильному или алкинильному радикалу в алкенил- или алкинилоксикарбонильной группе.

- 5 В соответствии с настоящим изобретением термин "алкилкарбонилокси" (алкил-C(=O)-O-), если не определено иначе где-либо еще, обозначает алкильные радикалы, связанные с остовом посредством карбонилосигруппы (-C(=O)-O-) с помощью кислорода, например (C₁-C₁₀)-, (C₁-C₆)- или (C₁-C₄)-алкилкарбонилокси. Число атомов углерода относится в данном случае к алкильному радикалу в алкилкарбонилоксигруппе.

- 10 Аналогично "алкенилкарбонилокси" и "алкинилкарбонилокси" соответственно определены в соответствии с настоящим изобретением как алкенильные и алкинильные радикалы, связанные с остовом посредством (-C(=O)-O-) с помощью кислорода, например (C₂-C₁₀)-, (C₂-C₆)- или (C₂-C₄)-алкенилкарбонилокси и (C₂-C₁₀)-, (C₂-C₆)- или (C₂-C₄)-алкинилкарбонилокси. Число атомов углерода относится в данном случае к алкенильному или алкинильному радикалу в алкенил- или алкинилкарбонилоксигруппе.

- 20 В сокращенных формах, таких как C(O)R¹⁷, C(O)OR¹⁷, OC(O)NR¹⁵R¹⁶ или C(O)NR¹⁵R¹⁶, например, сокращение O, приведенное в скобках, представляет собой атом кислорода, связанный со смежным атомом углерода посредством двойной связи.

- 25 В сокращенных формах, таких как OC(S)OR¹⁷, OC(S)SR¹⁸, OC(S)NR¹⁵R¹⁶, например, сокращение S, приведенное в скобках, представляет собой атом серы, связанный со смежным атомом углерода посредством двойной связи.

- 30 Термин "арил" означает необязательно замещенную моно-, би- или полициклическую ароматическую систему, предпочтительно содержащую 6-14, в частности 6-10, атомов углерода в кольце, например, фенил, нафтил, антрил, фенантренил и т. п., предпочтительно фенил.

Термин "необязательно замещенный арил" также включает полициклические системы, такие как тетрагидронафтил, инденил, инданил, флуоренил, бифенилил, где место

связывания находится на ароматической системе. В систематическом контексте "арил", как правило, также охватывается термином "необязательно замещенный фенил".

Предпочтительными заместителями арила в данном случае являются, например, водород, галоген, алкил, циклоалкил, циклоалкилалкил, циклоалкенил,

5 галогенциклоалкил, алкенил, алкинил, арил, арилалкил, арилалкенил, гетероарил, гетероарилалкил, гетероциклил, гетероциклилалкил, алкоксиалкил, алкилтио, галогеналкилтио, галогеналкил, алкокси, галогеналкокси, циклоалкокси, циклоалкилалкокси, арилокси, гетероарилокси, алкоксиалкокси, алкинилалкокси, алкенилокси,

10 бисалкиламиноалкокси, трис[алкил]силил, бис[алкил]арилсилил, бис[алкил]алкилсилил, трис[алкил]силилалкинил, арилалкинил, гетероарилалкинил, алкилалкинил, циклоалкилалкинил, галогеналкилалкинил, гетероциклил-N-алкокси, нитро, циано, amino, алкиламино, бисалкиламино, алкилкарбониламино, циклоалкилкарбониламино, арилкарбониламино, алкоксикарбониламино, алкоксикарбонилалкиламино, арилалкоксикарбонилалкиламино, гидроксикарбонил, алкоксикарбонил, аминокарбонил, алкиламинокарбонил, циклоалкиламинокарбонил, бисалкиламинокарбонил, гетероарилалкокси, арилалкокси.

Гетероциклический радикал (гетероцикл) содержит по меньшей мере одно гетероциклическое кольцо (= карбоциклическое кольцо, в котором по меньшей мере один атом углерода заменен гетероатомом, предпочтительно гетероатомом из группы, состоящей из N, O, S, P), которое является насыщенным, ненасыщенным, частично насыщенным или гетероароматическим и может быть незамещенным или замещенным, где место связывания расположено на атоме кольца. Если гетероциклический радикал или гетероциклическое кольцо являются необязательно замещенными, они могут быть конденсированными с другими карбоциклическими или гетероциклическими кольцами. В случае необязательно замещенного гетероциклила также включены полициклические системы, например, 8-азабицикло[3.2.1]октанил, 8-азабицикло[2.2.2]октанил или 1-азабицикло[2.2.1]гептил. В случае необязательно замещенного гетероциклила также включены спироциклические системы, например 1-окса-5-азаспиро[2.3]гексил. Если не определено иначе, гетероциклическое кольцо предпочтительно содержит 3-9 атомов кольца, в частности 3-6 атомов кольца, и один или несколько, предпочтительно 1-4, в частности 1, 2 или 3, гетероатомов в гетероциклическом кольце, предпочтительно из группы, состоящей из N, O и S, хотя

два атома кислорода не должны быть непосредственно смежными, например с одним гетероатомом из группы, состоящей из N, O и S: 1-, или 2-, или 3-пирролидинил, 3,4-дигидро-2Н-пиррол-2- или 3-ил, 2,3-дигидро-1Н-пиррол-1-, или 2-, или 3-, или 4-, или 5-ил; 2,5-дигидро-1Н-пиррол-1-, или 2-, или 3-ил, 1-, или 2-, или 3-, или 4-пиперидинил;

5 2,3,4,5-тетрагидропиридин-2-, или 3-, или 4-, или 5-ил, или 6-ил; 1,2,3,6-тетрагидропиридин-1-, или 2-, или 3-, или 4-, или 5-, или 6-ил; 1,2,3,4-тетрагидропиридин-1-, или 2-, или 3-, или 4-, или 5-, или 6-ил; 1,4-дигидропиридин-1-, или 2-, или 3-, или 4-ил; 2,3-дигидропиридин-2-, или 3-, или 4-, или 5-, или 6-ил; 2,5-дигидропиридин-2-, или 3-, или 4-, или 5-, или 6-ил, 1-, или 2-, или 3-, или 4-

10 азепанил; 2,3,4,5-тетрагидро-1Н-азепин-1-, или 2-, или 3-, или 4-, или 5-, или 6-, или 7-ил; 2,3,4,7-тетрагидро-1Н-азепин-1-, или 2-, или 3-, или 4-, или 5-, или 6-, или 7-ил; 2,3,6,7-тетрагидро-1Н-азепин-1-, или 2-, или 3-, или 4-ил; 3,4,5,6-тетрагидро-2Н-азепин-2-, или 3-, или 4-, или 5-, или 6-, или 7-ил; 4,5-дигидро-1Н-азепин-1-, или 2-, или 3-, или 4-ил; 2,5-дигидро-1Н-азепин-1-, или -2-, или 3-, или 4-, или 5-, или 6-, или 7-ил; 2,7-

15 дигидро-1Н-азепин-1-, или -2-, или 3-, или 4-ил; 2,3-дигидро-1Н-азепин-1-, или -2-, или 3-, или 4-, или 5-, или 6-, или 7-ил; 3,4-дигидро-2Н-азепин-2-, или 3-, или 4-, или 5-, или 6-, или 7-ил; 3,6-дигидро-2Н-азепин-2-, или 3-, или 4-, или 5-, или 6-, или 7-ил; 5,6-дигидро-2Н-азепин-2-, или 3-, или 4-, или 5-, или 6-, или 7-ил; 4,5-дигидро-3Н-азепин-2-, или 3-, или 4-, или 5-, или 6-, или 7-ил; 1Н-азепин-1-, или -2-, или 3-, или 4-,

20 или 5-, или 6-, или 7-ил; 2Н-азепин-2-, или 3-, или 4-, или 5-, или 6-, или 7-ил; 3Н-азепин-2-, или 3-, или 4-, или 5-, или 6-, или 7-ил; 4Н-азепин-2-, или 3-, или 4-, или 5-, или 6-, или 7-ил, 2- или 3-оксоланил (= 2- или 3-тетрагидрофуранил); 2,3-дигидрофуран-2-, или 3-, или 4-, или 5-ил; 2,5-дигидрофуран-2- или 3-ил, 2-, или 3-, или 4-оксанил (= 2-, или 3-, или 4-тетрагидропиранил); 3,4-дигидро-2Н-пиран-2-, или 3-,

25 или 4-, или 5-, или 6-ил; 3,6-дигидро-2Н-пиран-2-, или 3-, или 4-, или 5-, или 6-ил; 2Н-пиран-2-, или 3-, или 4-, или 5-, или 6-ил; 4Н-пиран-2-, или 3-, или 4-ил, 2-, или 3-, или 4-оксепанил; 2,3,4,5-тетрагидрооксепин-2-, или 3-, или 4-, или 5-, или 6-, или 7-ил; 2,3,4,7-тетрагидрооксепин-2-, или 3-, или 4-, или 5-, или 6-, или 7-ил; 2,3,6,7-тетрагидрооксепин-2-, или 3-, или 4-ил; 2,3-дигидрооксепин-2-, или 3-, или 4-, или 5-,

30 или 6-, или 7-ил; 4,5-дигидрооксепин-2-, или 3-, или 4-ил; 2,5-дигидрооксепин-2-, или 3-, или 4-, или 5-, или 6-, или 7-ил; оксепин-2-, или 3-, или 4-, или 5-, или 6-, или 7-ил; 2- или 3-тетрагидротиофенил; 2,3-дигидротиофен-2-, или 3-, или 4-, или 5-ил; 2,5-дигидротиофен-2- или 3-ил; тетрагидро-2Н-тиопиран-2-, или 3-, или 4-ил; 3,4-дигидро-2Н-тиопиран-2-, или 3-, или 4-, или 5-, или 6-ил; 3,6-дигидро-2Н-тиопиран-2-, или 3-,

или 4-, или 5-, или 6-ил; 2Н-тиопиран-2-, или 3-, или 4-, или 5-, или 6-ил; 4Н-тиопиран-2-, или 3-, или 4-ил.

Предпочтительные 3- и 4-членные гетероциклические кольца представляют собой, например, 1- или 2-азиридинил, оксиранил, тиранил, 1-, или 2-, или 3-азетидинил, 2- или 3-оксетанил, 2- или 3-тиетанил, 1,3-диоксетан-2-ил. Дополнительные примеры "гетероциклила" представляют собой частично или полностью гидрогенизированный гетероциклический радикал, содержащий два гетероатома из группы, состоящей из N, O и S, например, 1-, или 2-, или 3-, или 4-пиразолидинил; 4,5-дигидро-3Н-пиразол-3-, или 4-, или 5-ил; 4,5-дигидро-1Н-пиразол-1-, или 3-, или 4-, или 5-ил; 2,3-дигидро-1Н-пиразол-1-, или 2-, или 3-, или 4-, или 5-ил; 1-, или 2-, или 3-, или 4-имидазолидинил; 2,3-дигидро-1Н-имидазол-1-, или 2-, или 3-, или 4-ил; 2,5-дигидро-1Н-имидазол-1-, или 2-, или 4-, или 5-ил; 4,5-дигидро-1Н-имидазол-1-, или 2-, или 4-, или 5-ил; гексагидропиридазин-1-, или 2-, или 3-, или 4-ил; 1,2,3,4-тетрагидропиридазин-1-, или 2-, или 3-, или 4-, или 5-, или 6-ил; 1,2,3,6-тетрагидропиридазин-1-, или 2-, или 3-, или 4-, или 5-, или 6-ил; 1,4,5,6-тетрагидропиридазин-1-, или 3-, или 4-, или 5-, или 6-ил; 3,4,5,6-тетрагидропиридазин-3-, или 4-, или 5-ил; 4,5-дигидропиридазин-3- или 4-ил; 3,4-дигидропиридазин-3-, или 4-, или 5-, или 6-ил; 3,6-дигидропиридазин-3- или 4-ил; 1,6-дигидропиридазин-1-, или 3-, или 4-, или 5-, или 6-ил;

гексагидропиримидин-1-, или 2-, или 3-, или 4-ил; 1,4,5,6-тетрагидропиримидин-1-, или 2-, или 4-, или 5-, или 6-ил; 1,2,5,6-тетрагидропиримидин-1-, или 2-, или 4-, или 5-, или 6-ил; 1,2,3,4-тетрагидропиримидин-1-, или 2-, или 3-, или 4-, или 5-, или 6-ил; 1,6-дигидропиримидин-1-, или 2-, или 4-, или 5-, или 6-ил; 1,2-дигидропиримидин-1-, или 2-, или 4-, или 5-, или 6-ил; 2,5-дигидропиримидин-2-, или 4-, или 5-ил; 4,5-дигидропиримидин-4-, или 5-, или 6-ил; 1,4-дигидропиримидин-1-, или 2-, или 4-, или 5-, или 6-ил; 1-, или 2-, или 3-пиперазинил;

1,2,3,6-тетрагидропиразин-1-, или 2-, или 3-, или 5-, или 6-ил; 1,2,3,4-тетрагидропиразин-1-, или 2-, или 3-, или 4-, или 5-, или 6-ил; 1,2-дигидропиразин-1-, или 2-, или 3-, или 5-, или 6-ил; 1,4-дигидропиразин-1-, или 2-, или 3-ил; 2,3-дигидропиразин-2-, или 3-, или 5-, или 6-ил; 2,5-дигидропиразин-2- или 3-ил; 1,3-диоксолан-2-, или 4-, или 5-ил; 1,3-диоксол-2- или 4-ил; 1,3-диоксан-2-, или 4-, или 5-ил; 4Н-1,3-диоксин-2-, или 4-, или 5-, или 6-ил; 1,4-диоксан-2-, или 3-, или 5-, или 6-ил; 2,3-дигидро-1,4-диоксин-2-, или 3-, или 5-, или 6-ил; 1,4-диоксин-2- или 3-ил; 1,2-дитиолан-3- или 4-ил; 3Н-1,2-дитиол-3-, или 4-, или 5-ил; 1,3-дитиолан-2- или 4-ил; 1,3-

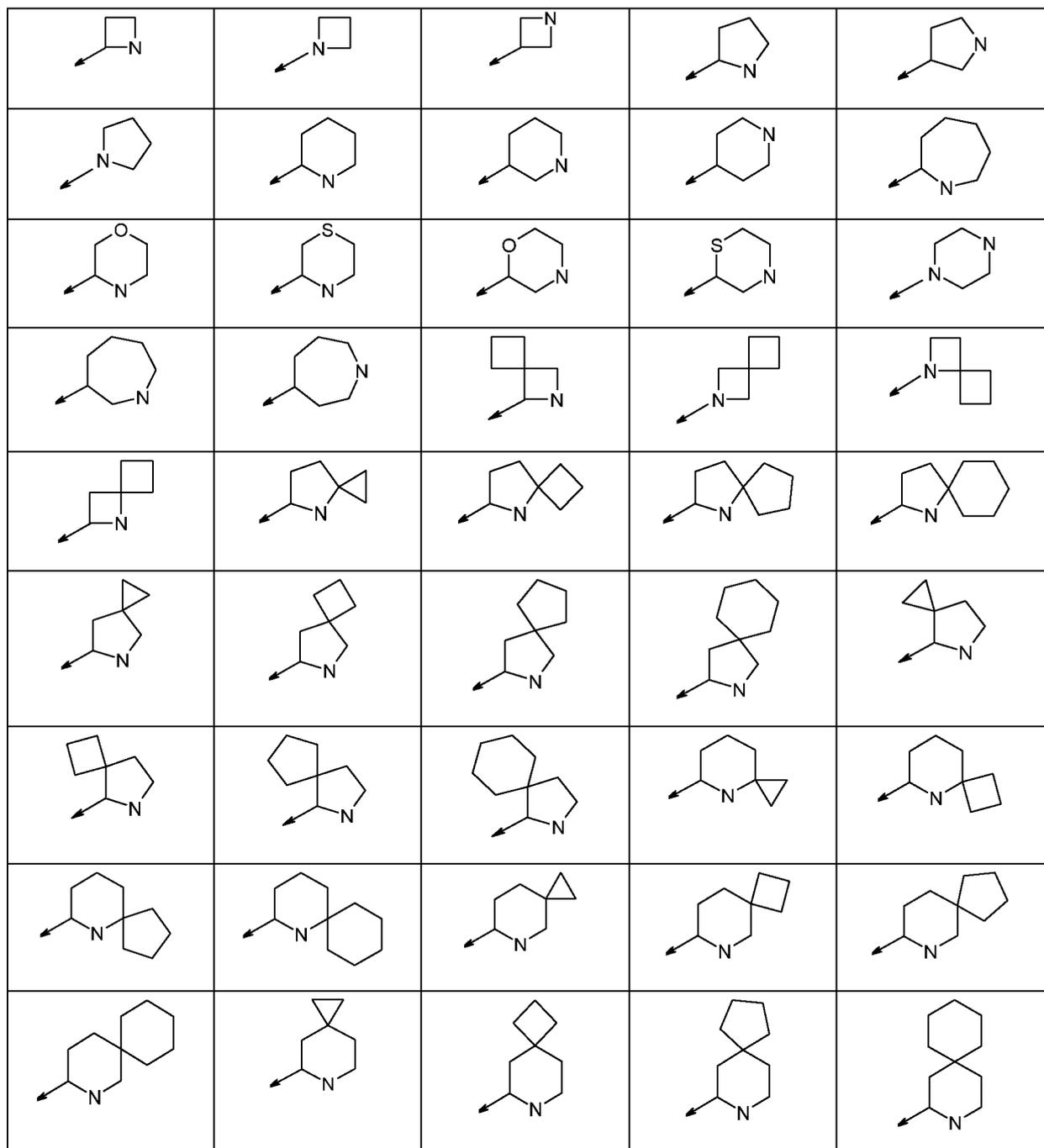
- дитиол-2- или 4-ил; 1,2-дитиан-3- или 4-ил; 3,4-дигидро-1,2-дитиин-3-, или 4-, или 5-, или 6-ил; 3,6-дигидро-1,2-дитиин-3- или 4-ил; 1,2-дитиин-3- или 4-ил; 1,3-дитиан-2-, или 4-, или 5-ил; 4Н-1,3-дитиин-2-, или 4-, или 5-, или 6-ил;
- 5 изоксазолидин-2-, или 3-, или 4-, или 5-ил; 2,3-дигидроизоксазол-2-, или 3-, или 4-, или 5-ил; 2,5-дигидроизоксазол-2-, или 3-, или 4-, или 5-ил; 4,5-дигидроизоксазол-3-, или 4-, или 5-ил; 1,3-оксазолидин-2-, или 3-, или 4-, или 5-ил; 2,3-дигидро-1,3-оксазол-2-, или 3-, или 4-, или 5-ил; 2,5-дигидро-1,3-оксазол-2-, или 4-, или 5-ил; 4,5-дигидро-1,3-оксазол-2-, или 4-, или 5-ил; 1,2-оксазинан-2-, или 3-, или 4-, или 5-, или 6-ил; 3,4-дигидро-2Н-1,2-оксазин-2-, или 3-, или 4-, или 5-, или 6-ил;
- 10 3,6-дигидро-2Н-1,2-оксазин-2-, или 3-, или 4-, или 5-, или 6-ил; 5,6-дигидро-2Н-1,2-оксазин-2-, или 3-, или 4-, или 5-, или 6-ил; 5,6-дигидро-4Н-1,2-оксазин-3-, или 4-, или 5-, или 6-ил; 2Н-1,2-оксазин-2-, или 3-, или 4-, или 5-, или 6-ил; 6Н-1,2-оксазин-3-, или 4-, или 5-, или 6-ил; 4Н-1,2-оксазин-3-, или 4-, или 5-, или 6-ил; 1,3-оксазинан-2-, или 3-, или 4-, или 5-, или 6-ил; 3,4-дигидро-2Н-1,3-оксазин-2-, или 3-, или 4-, или 5-, или 6-
- 15 ил;
- 3,6-дигидро-2Н-1,3-оксазин-2-, или 3-, или 4-, или 5-, или 6-ил; 5,6-дигидро-2Н-1,3-оксазин-2-, или 4-, или 5-, или 6-ил; 5,6-дигидро-4Н-1,3-оксазин-2-, или 4-, или 5-, или 6-ил; 2Н-1,3-оксазин-2-, или 4-, или 5-, или 6-ил; 6Н-1,3-оксазин-2-, или 4-, или 5-, или 6-ил; 4Н-1,3-оксазин-2-, или 4-, или 5-, или 6-ил; морфолин-2-, или 3-, или 4-ил; 3,4-
- 20 дигидро-2Н-1,4-оксазин-2-, или 3-, или 4-, или 5-, или 6-ил; 3,6-дигидро-2Н-1,4-оксазин-2-, или 3-, или 5-, или 6-ил; 2Н-1,4-оксазин-2-, или 3-, или 5-, или 6-ил; 4Н-1,4-оксазин-2- или 3-ил; 1,2-оксазепан-2-, или 3-, или 4-, или 5-, или 6-, или 7-ил;
- 2,3,4,5-тетрагидро-1,2-оксазепин-2-, или 3-, или 4-, или 5-, или 6-, или 7-ил; 2,3,4,7-тетрагидро-1,2-оксазепин-2-, или 3-, или 4-, или 5-, или 6-, или 7-ил; 2,3,6,7-тетрагидро-
- 25 1,2-оксазепин-2-, или 3-, или 4-, или 5-, или 6-, или 7-ил; 2,5,6,7-тетрагидро-1,2-оксазепин-2-, или 3-, или 4-, или 5-, или 6-, или 7-ил;
- 4,5,6,7-тетрагидро-1,2-оксазепин-3-, или 4-, или 5-, или 6-, или 7-ил; 2,3-дигидро-1,2-оксазепин-2-, или 3-, или 4-, или 5-, или 6-, или 7-ил; 2,5-дигидро-1,2-оксазепин-2-, или 3-, или 4-, или 5-, или 6-, или 7-ил; 2,7-дигидро-1,2-оксазепин-2-, или 3-, или 4-, или 5-, или 6-, или 7-ил; 4,5-дигидро-1,2-оксазепин-3-, или 4-, или 5-, или 6-, или 7-ил; 4,7-
- 30 дигидро-1,2-оксазепин-3-, или 4-, или 5-, или 6-, или 7-ил; 6,7-дигидро-1,2-оксазепин-3-, или 4-, или 5-, или 6-, или 7-ил; 1,2-оксазепин-3-, или 4-, или 5-, или 6-, или 7-ил;
- 1,3-оксазепан-2-, или 3-, или 4-, или 5-, или 6-, или 7-ил; 2,3,4,5-тетрагидро-1,3-оксазепин-2-, или 3-, или 4-, или 5-, или 6-, или 7-ил; 2,3,4,7-тетрагидро-1,3-оксазепин-

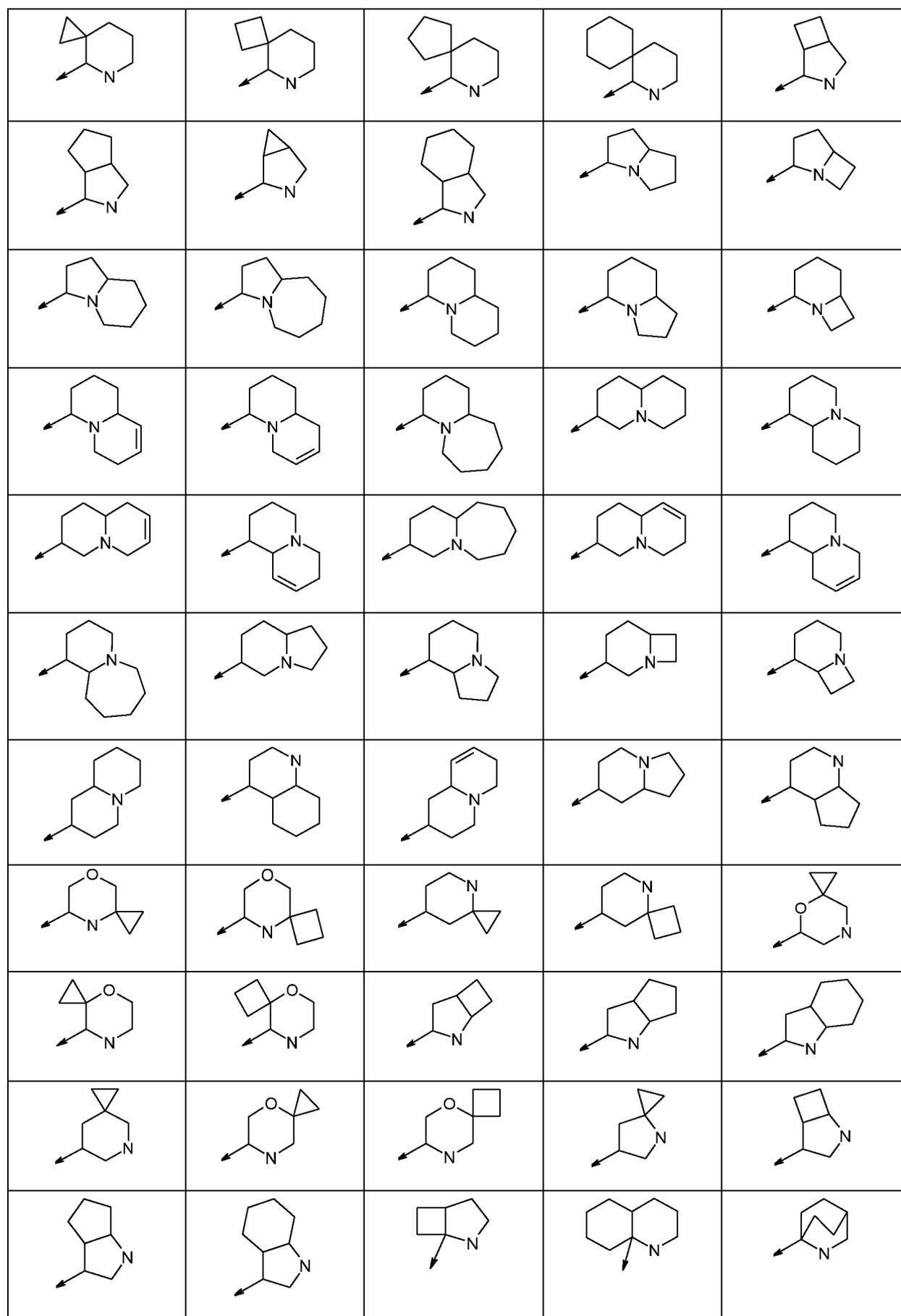
- 2-, или 3-, или 4-, или 5-, или 6-, или 7-ил; 2,3,6,7-тетрагидро-1,3-оксазепин-2-, или 3-, или 4-, или 5-, или 6-, или 7-ил;
- 2,5,6,7-тетрагидро-1,3-оксазепин-2-, или 4-, или 5-, или 6-, или 7-ил; 4,5,6,7-тетрагидро-1,3-оксазепин-2-, или 4-, или 5-, или 6-, или 7-ил; 2,3-дигидро-1,3-оксазепин-2-, или 3-, или 4-, или 5-, или 6-, или 7-ил; 2,5-дигидро-1,3-оксазепин-2-, или 4-, или 5-, или 6-, или 7-ил; 2,7-дигидро-1,3-оксазепин-2-, или 4-, или 5-, или 6-, или 7-ил; 4,5-дигидро-1,3-оксазепин-2-, или 4-, или 5-, или 6-, или 7-ил; 4,7-дигидро-1,3-оксазепин-2-, или 4-, или 5-, или 6-, или 7-ил; 6,7-дигидро-1,3-оксазепин-2-, или 4-, или 5-, или 6-, или 7-ил; 1,3-оксазепин-2-, или 4-, или 5-, или 6-, или 7-ил; 1,4-оксазепан-2-, или 3-, или 5-, или 6-, или 7-ил;
- 2,3,4,5-тетрагидро-1,4-оксазепин-2-, или 3-, или 4-, или 5-, или 6-, или 7-ил; 2,3,4,7-тетрагидро-1,4-оксазепин-2-, или 3-, или 4-, или 5-, или 6-, или 7-ил; 2,3,6,7-тетрагидро-1,4-оксазепин-2-, или 3-, или 5-, или 6-, или 7-ил; 2,5,6,7-тетрагидро-1,4-оксазепин-2-, или 3-, или 5-, или 6-, или 7-ил; 4,5,6,7-тетрагидро-1,4-оксазепин-2-, или 3-, или 4-, или 5-, или 6-, или 7-ил; 2,3-дигидро-1,4-оксазепин-2-, или 3-, или 5-, или 6-, или 7-ил; 2,5-дигидро-1,4-оксазепин-2-, или 3-, или 5-, или 6-, или 7-ил; 2,7-дигидро-1,4-оксазепин-2-, или 3-, или 5-, или 6-, или 7-ил;
- 4,5-дигидро-1,4-оксазепин-2-, или 3-, или 4-, или 5-, или 6-, или 7-ил; 4,7-дигидро-1,4-оксазепин-2-, или 3-, или 4-, или 5-, или 6-, или 7-ил; 6,7-дигидро-1,4-оксазепин-2-, или 3-, или 5-, или 6-, или 7-ил; 1,4-оксазепин-2-, или 3-, или 5-, или 6-, или 7-ил;
- изотиазолидин-2-, или 3-, или 4-, или 5-ил; 2,3-дигидроизотиазол-2-, или 3-, или 4-, или 5-ил; 2,5-дигидроизотиазол-2-, или 3-, или 4-, или 5-ил; 4,5-дигидроизотиазол-3-, или 4-, или 5-ил; 1,3-тиазолидин-2-, или 3-, или 4-, или 5-ил; 2,3-дигидро-1,3-тиазол-2-, или 3-, или 4-, или 5-ил; 2,5-дигидро-1,3-тиазол-2-, или 4-, или 5-ил;
- 4,5-дигидро-1,3-тиазол-2-, или 4-, или 5-ил; 1,3-тиазинан-2-, или 3-, или 4-, или 5-, или 6-ил; 3,4-дигидро-2Н-1,3-тиазин-2-, или 3-, или 4-, или 5-, или 6-ил; 3,6-дигидро-2Н-1,3-тиазин-2-, или 3-, или 4-, или 5-, или 6-ил; 5,6-дигидро-2Н-1,3-тиазин-2-, или 4-, или 5-, или 6-ил; 5,6-дигидро-4Н-1,3-тиазин-2-, или 4-, или 5-, или 6-ил; 2Н-1,3-тиазин-2-, или 4-, или 5-, или 6-ил; 6Н-1,3-тиазин-2-, или 4-, или 5-, или 6-ил;
- 4Н-1,3-тиазин-2-, или 4-, или 5-, или 6-ил. Дополнительные примеры "гетероциклила" представляют собой частично или полностью гидрогенизированный гетероциклический радикал, содержащий 3 гетероатома из группы, состоящей из N, O и S, например, 1,4,2-диоксазолидин-2-, или 3-, или 5-ил; 1,4,2-диоксазол-3- или 5-ил; 1,4,2-диоксазинан-2-, или -3-, или 5-, или 6-ил; 5,6-дигидро-1,4,2-диоксазин-3-, или 5-,

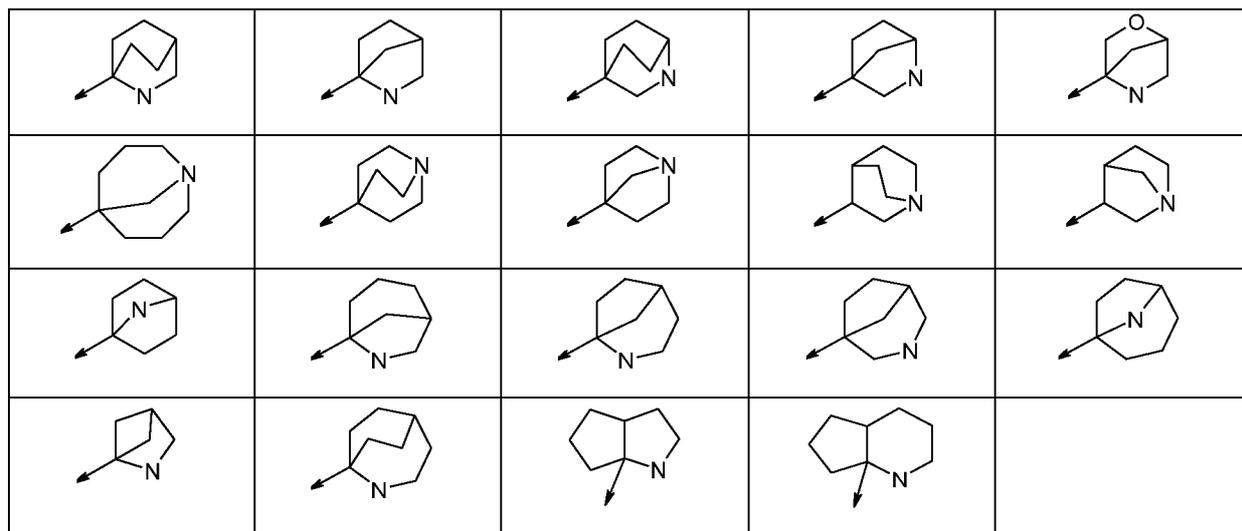
или 6-ил; 1,4,2-диоксазин-3-, или 5-, или 6-ил; 1,4,2-диоксазепан-2-, или 3-, или 5-, или 6-, или 7-ил; 6,7-дигидро-5Н-1,4,2-диоксазепин-3-, или 5-, или 6-, или 7-ил;

2,3-дигидро-7Н-1,4,2-диоксазепин-2-, или 3-, или 5-, или 6-, или 7-ил; 2,3-дигидро-5Н-1,4,2-диоксазепин-2-, или 3-, или 5-, или 6-, или 7-ил; 5Н-1,4,2-диоксазепин-3-, или 5-,

5 или 6-, или 7-ил; 7Н-1,4,2-диоксазепин-3-, или 5-, или 6-, или 7-ил. Примеры структуры необязательно дополнительно замещенных гетероциклов также перечислены ниже.







- Гетероциклы, перечисленные выше, предпочтительно замещены, например, водородом, галогеном, алкилом, галогеналкилом, гидроксигруппой, алкоксигруппой, циклоалкоксигруппой, арилоксигруппой, алкоксиалкилом, алкоксиалкоксигруппой, циклоалкилом, галогенциклоалкилом, арилом, арилалкилом, гетероарилом, гетероциклилом, алкенилом, алкилкарбонилгруппой, циклоалкилкарбонилгруппой, арилкарбонилгруппой, гетероарилкарбонилгруппой, алкоксикарбонилгруппой, гидроксикарбонилгруппой, циклоалкоксикарбонилгруппой, циклоалкилалкоксикарбонилгруппой, алкоксикарбонилалкилом, арилалкоксикарбонилгруппой, арилалкоксикарбонилалкилом, алкинилом, алкинилалкилом, алкилалкинилом, трисалкилсилилалкинилом, нитрогруппой, аминогруппой, цианогруппой, галогеналкоксигруппой, галогеналкилтиогруппой, алкилтиогруппой, гидротиигруппой, гидроксикарбонилгруппой, оксогруппой, гетероарилалкоксигруппой, арилалкоксигруппой, гетероциклилалкоксигруппой, гетероциклилалкилтиогруппой, гетероциклилоксигруппой, гетероциклилтиогруппой, гетероарилоксигруппой, бисалкиламиногруппой, алкиламиногруппой, циклоалкиламиногруппой, гидроксикарбонилалкиламиногруппой, алкоксикарбонилалкиламиногруппой, арилалкоксикарбонилалкиламиногруппой, алкоксикарбонилалкил(алкил)аминогруппой, аминокарбонилгруппой, алкиламинокарбонилгруппой, бисалкиламинокарбонилгруппой, циклоалкиламинокарбонилгруппой, гидроксикарбонилалкиламинокарбонилгруппой, алкоксикарбонилалкиламинокарбонилгруппой, арилалкоксикарбонилалкиламинокарбонилгруппой.
- Если основная структура замещена "одним или несколькими радикалами" из перечня радикалов (= группа) или в целом определенной группы радикалов, данное в каждом случае включает одновременное замещение несколькими идентичными и/или структурно различными радикалами.

В случае частично или полностью насыщенного содержащего азот гетероцикла он может быть присоединен к остальной части молекулы либо посредством углерода, либо посредством азота.

5 Применимые заместители для замещенного гетероциклического радикала включают заместители, указанные далее ниже, а также дополнительно оксо и тиоксо. Оксогруппа как заместитель при атоме углерода в кольце в таком случае означает, например, карбонильную группу в гетероциклическом кольце. В результате лактоны и лактамы предпочтительно также охвачены. Оксогруппа может также присутствовать при
 10 гетероатомах кольца, которые могут существовать в разных степенях окисления, например, в случае N и S, и в таком случае образуют, например, двухвалентные группы N(O), S(O) (также SO для краткости) и S(O)₂ (также SO₂ для краткости) в гетероциклическом кольце. В случае групп –N(O)- и –S(O)- оба энантиомера охватываются в каждом случае.

15 В соответствии с настоящим изобретением выражение "гетероарил" указывает на гетероароматические соединения, т. е. полностью ненасыщенные ароматические гетероциклические соединения, предпочтительно 5-7-членные кольца, содержащие от 1 до 4, предпочтительно 1 или 2, идентичных или различных гетероатомов,
 20 предпочтительно O, S или N. Гетероарилы в соответствии с настоящим изобретением представляют собой, например, 1H-пиррол-1-ил; 1H-пиррол-2-ил; 1H-пиррол-3-ил; фуран-2-ил; фуран-3-ил; тиен-2-ил; тиен-3-ил, 1H-имидазол-1-ил; 1H-имидазол-2-ил; 1H-имидазол-4-ил; 1H-имидазол-5-ил; 1H-пиразол-1-ил; 1H-пиразол-3-ил; 1H-пиразол-4-ил; 1H-пиразол-5-ил, 1H-1,2,3-триазол-1-ил, 1H-1,2,3-триазол-4-ил,
 25 1H-1,2,3-триазол-5-ил, 2H-1,2,3-триазол-2-ил, 2H-1,2,3-триазол-4-ил, 1H-1,2,4-триазол-1-ил, 1H-1,2,4-триазол-3-ил, 4H-1,2,4-триазол-4-ил, 1,2,4-оксадиазол-3-ил, 1,2,4-оксадиазол-5-ил, 1,3,4-оксадиазол-2-ил, 1,2,3-оксадиазол-4-ил, 1,2,3-оксадиазол-5-ил, 1,2,5-оксадиазол-3-ил, азепинил, пиридин-2-ил, пиридин-3-ил, пиридин-4-ил, пиразин-2-ил, пиразин-3-ил, пиримидин-2-ил, пиримидин-4-ил, пиримидин-5-ил, пиридазин-3-ил, пиридазин-4-ил, 1,3,5-триазин-2-ил, 1,2,4-триазин-3-ил, 1,2,4-триазин-5-ил, 1,2,4-триазин-6-ил, 1,2,3-триазин-4-ил, 1,2,3-триазин-5-ил, 1,2,4-, 1,3,2-, 1,3,6- и 1,2,6-оксазинил, изоксазол-3-ил, изоксазол-4-ил, изоксазол-5-ил,
 30 1,3-оксазол-2-ил, 1,3-оксазол-4-ил, 1,3-оксазол-5-ил, изотиазол-3-ил, изотиазол-4-ил, изотиазол-5-ил, 1,3-тиазол-2-ил, 1,3-тиазол-4-ил, 1,3-тиазол-5-ил, оксепинил, тиепинил,

1,2,4-триазолонил и 1,2,4-дiazепинил, 2H-1,2,3,4-тетразол-5-ил, 1H-1,2,3,4-тетразол-5-ил, 1,2,3,4-оксатриазол-5-ил, 1,2,3,4-тиатриазол-5-ил, 1,2,3,5-оксатриазол-4-ил, 1,2,3,5-тиатриазол-4-ил. Гетероарильные группы по настоящему изобретению также могут быть замещены одним или несколькими идентичными или различными радикалами.

- 5 Если два смежных атома углерода являются частью дополнительного ароматического кольца, это приводит к образованию конденсированных гетероароматических систем, таких как бензоконденсированные или поликонденсированные гетероароматические вещества. Предпочтительными примерами являются хинолины (например, хинолин-2-ил, хинолин-3-ил, хинолин-4-ил,
- 10 хинолин-5-ил, хинолин-6-ил, хинолин-7-ил, хинолин-8-ил); изохинолины (например, изохинолин-1-ил, изохинолин-3-ил, изохинолин-4-ил, изохинолин-5-ил, изохинолин-6-ил, изохинолин-7-ил, изохинолин-8-ил); хиноксалин; хиназолин; циннолин; 1,5-нафтиридин; 1,6-нафтиридин; 1,7-нафтиридин; 1,8-нафтиридин; 2,6-нафтиридин; 2,7-нафтиридин; фталазин; пиридопиразины; пиридопиримидины;
- 15 пиридопиридазины; птеридины; пиримидопиримидины. Примерами гетероарила являются также 5- или 6-членные бензоконденсированные кольца из группы 1H-индол-1-ила, 1H-индол-2-ила, 1H-индол-3-ила, 1H-индол-4-ила, 1H-индол-5-ила, 1H-индол-6-ила, 1H-индол-7-ила, 1-бензофуран-2-ила, 1-бензофуран-3-ила, 1-бензофуран-4-ила, 1-бензофуран-5-ила, 1-бензофуран-6-ила, 1-бензофуран-7-ила, 1-бензотиофен-2-ила, 1-
- 20 бензотиофен-3-ила,
- 1-бензотиофен-4-ила, 1-бензотиофен-5-ила, 1-бензотиофен-6-ила, 1-бензотиофен-7-ила, 1H-индазол-1-ила, 1H-индазол-3-ила, 1H-индазол-4-ила, 1H-индазол-5-ила, 1H-индазол-6-ила, 1H-индазол-7-ила, 2H-индазол-2-ила, 2H-индазол-3-ила, 2H-индазол-4-ила, 2H-индазол-5-ила, 2H-индазол-6-ила, 2H-индазол-7-ила, 2H-изоиндол-2-ила, 2H-изоиндол-1-ила, 2H-изоиндол-3-ила, 2H-изоиндол-4-ила, 2H-изоиндол-5-ила, 2H-изоиндол-6-ила;
- 25 2H-изоиндол-7-ила, 1H-бензимидазол-1-ила, 1H-бензимидазол-2-ила, 1H-бензимидазол-4-ила, 1H-бензимидазол-5-ила, 1H-бензимидазол-6-ила, 1H-бензимидазол-7-ила, 1,3-бензоксазол-2-ила, 1,3-бензоксазол-4-ила, 1,3-бензоксазол-5-ила, 1,3-бензоксазол-6-ила, 1,3-бензоксазол-7-ила, 1,3-бензотиазол-2-ила, 1,3-
- 30 бензотиазол-4-ила, 1,3-бензотиазол-5-ила, 1,3-бензотиазол-6-ила, 1,3-бензотиазол-7-ила, 1,2-бензизоксазол-3-ила, 1,2-бензизоксазол-4-ила, 1,2-бензизоксазол-5-ила, 1,2-бензизоксазол-6-ила, 1,2-бензизоксазол-7-ила, 1,2-бензизотиазол-3-ила, 1,2-

бензизотиазол-4-ила, 1,2-бензизотиазол-5-ила, 1,2-бензизотиазол-6-ила, 1,2-бензизотиазол-7-ила.

5 Термин "галоген" означает, например, фтор, хлор, бром или йод. Если термин применяют в отношении радикала, "галоген" означает, например, атом фтора, хлора, брома или йода.

10 В соответствии с настоящим изобретением "алкил" означает насыщенный гидрокарбильный радикал с прямой или разветвленной цепью, с открытой цепью, который является необязательно моно- или полизамещенным, и в последнем случае называется "замещенным алкилом". Предпочтительными заместителями являются атомы галогенов или алкокси-, галогеналкокси-, циано-, алкилтио-, галогеналкилтио-, амино- или нитрогруппы, более предпочтительно – метокси, метил, фторалкил, циано, нитро, фтор, хлор, бром или йод. Приставка "бис" также включает комбинацию
15 различных алкильных радикалов, например, метил(этил) или этил(метил).

"Галогеналкил", "-алкенил" и "-алкинил" соответственно означают алкил, алкенил и алкинил, частично или полностью замещенные идентичными или различными атомами галогенов, например, моногалогеналкил, например $\text{CH}_2\text{CH}_2\text{Cl}$, $\text{CH}_2\text{CH}_2\text{Br}$, CHClCH_3 , CH_2Cl , CH_2F ; пергалогеналкил, например, CCl_3 , CClF_2 , CFCl_2 , CF_2CClF_2 , $\text{CF}_2\text{CClFCF}_3$; полигалогеналкил, например, CH_2CHFCl , CF_2CClFH , CF_2CBrFH , CH_2CF_3 ; термин пергалогеналкил также включает термин перфторалкил.

25 "Частично фторированный алкил" означает насыщенный углеводород с прямой или разветвленной цепью, моно- или полизамещенный фтором, где соответствующие атомы фтора могут присутствовать в качестве заместителей при одном или нескольких различных атомах углерода в углеводороде с прямой цепью или разветвленной цепью, например CHFCH_3 , $\text{CH}_2\text{CH}_2\text{F}$, $\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CF}_3$, CHF_2 , CH_2F , $\text{CHFCH}_2\text{CF}_3$.

30 "Частично фторированный галогеналкил" означает насыщенный углеводород с прямой или разветвленной цепью, замещенный различными атомами галогенов и по меньшей мере одним атомом фтора, где любые другие присутствующие атомы галогенов выбраны из группы, состоящей из фтора, хлора или брома, йода. Соответствующие атомы галогенов могут присутствовать в данном случае в качестве заместителей при

одном или нескольких различных атомах углерода углеводорода с прямой цепью или разветвленной цепью. Частично фторированный галогеналкил также включает полное замещение алкила с прямой цепью или разветвленной цепью галогеном с вовлечением по меньшей мере одного атома фтора.

5

"Галогеналкокси" представляет собой, например, OCF_3 , OCHF_2 , OCH_2F , OCF_2CF_3 , OCH_2CF_3 и $\text{OCH}_2\text{CH}_2\text{Cl}$; то же применимо к галогеналкенилу и другим замещенным галогеном радикалам.

10 Выражение "(C₁-C₄)-алкил", упоминаемое в качестве примера в данном документе, является кратким обозначением алкила с прямой или разветвленной цепью, содержащего от одного до 4 атомов углерода в соответствии с указанным диапазоном для атомов углерода, т. е. включает радикалы, представляющие собой метил, этил, 1-пропил, 2-пропил, 1-бутил, 2-бутил, 2-метилпропил или трет-бутил. Алкильные
15 радикалы в общем виде, содержащие больший указанный диапазон атомов углерода, например "(C₁-C₆)-алкил", также соответственно включают алкильные радикалы с прямой или разветвленной цепью, содержащие большее число атомов углерода, т. е. в качестве примера также алкильные радикалы, содержащие 5 и 6 атомов углерода.

20 Если не указано конкретно, в случае гидрокарбильных радикалов, таких как алкильные, алкенильные и алкинильные радикалы, предпочтение также отдается низшим углеродным остовам в сложных радикалах, например, содержащим 1-6 атомов углерода или, в случае ненасыщенных групп, содержащим 2-6 атомов углерода. Алкильные радикалы, включенные в сложные радикалы, такие как алкокси, галогеналкил и т. д.,
25 представляют собой, например, метил, этил, н- или изопропил, н-, изо-, трет- или 2-бутил, пентилы, гексилы, такие как н-гексил, изогексил и 1,3-диметилбутил, гептилы, такие как н-гептил, 1-метилгексил и 1,4-диметилпентил; алкенильные и алкинильные радикалы определены как возможные ненасыщенные радикалы, соответствующие алкильным радикалам, где присутствует по меньшей мере одна двойная связь/тройная
30 связь. Предпочтение отдается радикалам, содержащим одну двойную связь/тройную связь.

Термин "алкенил", в частности, также включает гидрокарбильные радикалы с прямой или разветвленной цепью, с открытой цепью, содержащие более одной двойной связи,

такие как 1,3-бутадиенил и 1,4-пентадиенил, но также алленильные или кумуленильные радикалы, содержащие одну или несколько сопряженных двойных связей, например алленил (1,2-пропадиенил), 1,2-бутадиенил и 1,2,3-пентатриенил. Алкенил представляет собой, например, винил, который необязательно может быть замещен

5 дополнительными алкильными радикалами, например (без ограничения) (C₂-C₆)-алкенил, такой как этенил, 1-пропенил, 2-пропенил, 1-метилэтенил, 1-бутенил, 2-бутенил, 3-бутенил, 1-метил-1-пропенил, 2-метил-1-пропенил, 1-метил-2-пропенил, 2-метил-2-пропенил, 1-пентенил, 2-пентенил, 3-пентенил, 4-пентенил, 1-метил-1-бутенил, 2-метил-1-бутенил, 3-метил-1-бутенил, 1-метил-2-бутенил, 2-метил-2-бутенил, 3-метил-

10 2-бутенил, 1-метил-3-бутенил, 2-метил-3-бутенил, 3-метил-3-бутенил, 1,1-диметил-2-пропенил,

1,2-диметил-1-пропенил, 1,2-диметил-2-пропенил, 1-этил-1-пропенил, 1-этил-2-пропенил, 1-гексенил, 2-гексенил, 3-гексенил, 4-гексенил, 5-гексенил, 1-метил-1-пентенил, 2-метил-1-пентенил, 3-метил-1-пентенил, 4-метил-1-пентенил, 1-метил-2-

15 пентенил, 2-метил-2-пентенил, 3-метил-2-пентенил,

4-метил-2-пентенил, 1-метил-3-пентенил, 2-метил-3-пентенил, 3-метил-3-пентенил, 4-метил-3-пентенил, 1-метил-4-пентенил, 2-метил-4-пентенил, 3-метил-4-пентенил, 4-метил-4-пентенил, 1,1-диметил-2-бутенил, 1,1-диметил-3-бутенил, 1,2-диметил-1-бутенил, 1,2-диметил-2-бутенил,

20 1,2-диметил-3-бутенил, 1,3-диметил-1-бутенил, 1,3-диметил-2-бутенил, 1,3-диметил-3-бутенил, 2,2-диметил-3-бутенил, 2,3-диметил-1-бутенил, 2,3-диметил-2-бутенил, 2,3-диметил-3-бутенил, 3,3-диметил-1-бутенил, 3,3-диметил-2-бутенил, 1-этил-1-бутенил, 1-этил-2-бутенил, 1-этил-3-бутенил, 2-этил-1-бутенил, 2-этил-2-бутенил, 2-этил-3-

25 бутенил, 1,1,2-триметил-2-пропенил, 1-этил-1-метил-2-пропенил, 1-этил-2-метил-1-пропенил и 1-этил-2-метил-2-пропенил.

Термин "алкинил", в частности, также включает гидрокарбильные радикалы с прямой или разветвленной цепью, с открытой цепью, содержащие более одной тройной связи или, в противном случае, содержащие одну или несколько тройных связей и одну или

30 несколько двойных связей, например 1,3-бутатриенил или 3-пентен-1-ин-1-ил. (C₂-C₆)-Алкинил представляет собой, например, этинил, 1-пропинил, 2-пропинил, 1-бутинил, 2-бутинил, 3-бутинил, 1-метил-2-пропинил, 1-пентинил, 2-пентинил, 3-пентинил, 4-пентинил, 1-метил-2-бутинил, 1-метил-3-бутинил, 2-метил-3-бутинил, 3-метил-1-

бутинил, 1,1-диметил-2-пропинил, 1-этил-2-пропинил, 1-гексинил, 2-гексинил, 3-гексинил, 4-гексинил, 5-гексинил,

1-метил-2-пентинил, 1-метил-3-пентинил, 1-метил-4-пентинил, 2-метил-3-пентинил, 2-метил-4-пентинил, 3-метил-1-пентинил, 3-метил-4-пентинил, 4-метил-1-пентинил, 4-метил-2-пентинил, 1,1-диметил-2-бутинил, 1,1-диметил-3-бутинил, 1,2-диметил-3-бутинил, 2,2-диметил-3-бутинил, 3,3-диметил-1-бутинил, 1-этил-2-бутинил, 1-этил-3-бутинил, 2-этил-3-бутинил и 1-этил-1-метил-2-пропинил.

Термин "циклоалкил" означает карбоциклическую насыщенную кольцевую систему, предпочтительно содержащую 3-8 атомов углерода в кольце, например, циклопропил, циклобутил, циклопентил или циклогексил, и необязательно включающую дополнительное замещение, предпочтительно водородом, алкилом, алкокси, циано, нитро, алкилтио, галогеналкилтио, галогеном, алкенилом, алкинилом, галогеналкилом, амина, алкиламино, бисалкиламино, алкоксикарбонилем, гидроксикарбонилем, арилалкоксикарбонилем, аминокарбонилем, алкиламинокарбонилем, циклоалкиламинокарбонилем. В случае необязательно замещенного циклоалкила включены циклические системы, содержащие заместители, также включающие заместители, имеющие двойную связь при циклоалкильном радикале, например, алкилиденовую группу, такую как метилиден. В случае необязательно замещенного циклоалкила полициклические алифатические системы также включают, например, бицикло[1.1.0]бутан-1-ил, бицикло[1.1.0]бутан-2-ил, бицикло[2.1.0]пентан-1-ил, бицикло[1.1.1]пентан-1-ил, бицикло[2.1.0]пентан-2-ил, бицикло[2.1.0]пентан-5-ил, бицикло[2.1.1]гексил, бицикло[2.2.1]гепт-2-ил, бицикло[2.2.2]октан-2-ил, бицикло[3.2.1]октан-2-ил, бицикло[3.2.2]нонан-2-ил, адамантан-1-ил и адамантан-2-ил, а также такие системы, как например, 1,1'-би(циклопропил)-1-ил, 1,1'-би(циклопропил)-2-ил. Выражение "(C₃-C₇)-циклоалкил" является кратким обозначением для циклоалкила, содержащего от трех до 7 атомов углерода в соответствии с указанным диапазоном для атомов углерода.

В случае замещенного циклоалкила также включены спироциклические алифатические системы, например, спиро[2.2]пент-1-ил, спиро[2.3]гекс-1-ил, спиро[2.3]гекс-4-ил, 3-спиро[2.3]гекс-5-ил, спиро[3.3]гепт-1-ил, спиро[3.3]гепт-2-ил.

- "Циклоалкенил" означает карбоциклическую, неароматическую, частично ненасыщенную кольцевую систему, содержащую предпочтительно 4-8 атомов углерода, например, 1-циклобутенил, 2-циклобутенил, 1-циклопентенил, 2-циклопентенил, 3-циклопентенил или 1-циклогексенил, 2-циклогексенил, 3-циклогексенил, 1,3-циклогексадиенил или 1,4-циклогексадиенил, также включающую заместители, имеющие двойную связь при циклоалкенильном радикале, например, алкилиденовую группу, такую как метилиден. В случае необязательно замещенного циклоалкенила соответственно применимы пояснения для замещенного циклоалкила.
- 10 Термин "алкилиден", например, включая в форме (C₁-C₁₀)-алкилидена, означает остальную часть гидрокарбильного радикала с прямой или разветвленной цепью, с открытой цепью, связанного посредством двойной связи. Возможные места связывания для алкилидена обычно включают исключительно положения на основной структуре, где два атома водорода могут быть заменены двойной связью; при этом радикалы
- 15 представляют собой, например, =CH₂, =CH-CH₃, =C(CH₃)-CH₃, =C(CH₃)-C₂H₅ или =C(C₂H₅)-C₂H₅. Циклоалкилиден представляет собой карбоциклический радикал, связанный посредством двойной связи.
- "Циклоалкилалкилокси" означает циклоалкилалкильный радикал, связанный посредством атома кислорода, и "арилалкилокси" означает арилалкильный радикал, связанный посредством атома кислорода.
- 20 "Алкоксиалкил" представляет собой алкокси-радикал, связанный посредством алкильной группы, и "алкоксиалкокси" означает алкоксиалкильный радикал, связанный посредством атома кислорода, например (без ограничения), метоксиметокси, метоксиэтокси, этоксиэтокси, метокси-н-пропилокси.
- 25 "Алкилтиоалкил" представляет собой алкилтио-радикал, связанный посредством алкильной группы, и "алкилтиоалкилтио" означает алкилтиоалкильный радикал, связанный посредством атома кислорода.
- 30 "Арилалкоксиалкил" представляет собой арилокси-радикал, связанный посредством алкильной группы, и "гетероарилоксиалкил" означает гетероарилокси-радикал, связанный посредством алкильной группы.

"Галогеналкоксиалкил" представляет собой связанный галогеналкокси-радикал, и "галогеналкилтиоалкил" означает галогеналкилтио-радикал, связанный посредством алкильной группы.

5

"Арилалкил" представляет собой арильный радикал, связанный посредством алкильной группы, "гетероарилалкил" означает гетероарильный радикал, связанный посредством алкильной группы, и "гетероциклилалкил" означает гетероциклильный радикал, связанный посредством алкильной группы.

10

"Циклоалкилалкил" представляет собой циклоалкильный радикал, связанный посредством алкильной группы, например (без ограничения), циклопропилметил, циклобутилметил, циклопентилметил, циклогексилметил, 1-циклопропилэт-1-ил, 2-циклопропилэт-1-ил, 1-циклопропилпроп-1-ил, 3-циклопропилпроп-1-ил.

15

"Арилалкенил" представляет собой арильный радикал, связанный посредством алкенильной группы, "гетероарилалкенил" представляет собой гетероарильный радикал, связанный посредством алкенильной группы, и "гетероциклилалкенил" означает гетероциклильный радикал, связанный посредством алкенильной группы.

20

"Арилалкинил" представляет собой арильный радикал, связанный посредством алкинильной группы, "гетероарилалкинил" представляет собой гетероарильный радикал, связанный посредством алкинильной группы, и "гетероциклилалкинил" означает гетероциклильный радикал, связанный посредством алкинильной группы.

25

В соответствии с настоящим изобретением "галогеналкилтио", отдельно или как часть химической группы, представляет собой S-галогеналкил с прямой или разветвленной цепью, предпочтительно содержащий 1-8 или содержащий 1-6 атомов углерода, такой как (C₁-C₈)-, (C₁-C₆)- или (C₁-C₄)-галогеналкилтио, например (без ограничения), трифторметилтио, пентафторэтилтио, дифторметил, 2,2-дифторэт-1-илтио, 2,2,2-дифторэт-1-илтио, 3,3,3-проп-1-илтио.

30

"Галогенциклоалкил" и "галогенциклоалкенил" означают циклоалкил или циклоалкенил, частично или полностью замещенные идентичными или различными

атомами галогенов, например, F, Cl и Br, или галогеналкилом, например, трифторметилом или дифторметилом, например, 1-фторциклопроп-1-ил, 2-фторциклопроп-1-ил, 2,2-дифторциклопроп-1-ил, 1-фторциклобут-1-ил, 1-трифторметилциклопроп-1-ил, 2-трифторметилциклопроп-1-ил, 1-хлорциклопроп-1-ил, 2-хлорциклопроп-1-ил, 2,2-дихлорциклопроп-1-ил, 3,3-дифторциклобутил.

В соответствии с настоящим изобретением "триалкилсилил", отдельно или как часть химической группы, представляет собой Si-алкил с прямой или разветвленной цепью, предпочтительно содержащий 1-8 или содержащий 1-6 атомов углерода, такой как три-
 10 [(C₁-C₈)-, (C₁-C₆)- или (C₁-C₄)-алкил]силил, например (без ограничения), триметилсилил, триэтилсилил, три-(н-пропил)силил, три(изопропил)силил, три(н-бутил)силил, три(1-метилпроп-1-ил)силил, три-(2-метилпроп-1-ил)силил, три(1,1-диметилэт-1-ил)силил, три(2,2-диметилэт-1-ил)силил.

15 "Триалкилсилилалкинил" представляет собой триалкилсилильный радикал, связанный посредством алкинильной группы.

Синтез замещенных тиофенилурацилов общей формулы (I)

20 Замещенные тиофенилурацилы общей формулы (I) в соответствии с настоящим изобретением можно получить с помощью известных способов. Пути синтеза, применяемые и рассматриваемые, осуществляют с помощью коммерчески доступных или легко получаемых гетероароматических аминов и соответствующим образом замещенных сложных гидроксиэфиров. Фрагменты Q, W, R¹, R², R³, R⁴, R⁵, R⁶ и R¹⁴ в
 25 общей формуле (I) на схемах ниже имеют значения, определенные выше, но только если даны иллюстративные, а не ограничивающие определения.

Первое ключевое промежуточное соединение, получаемое для синтеза соединений общей формулы (I) в соответствии с настоящим изобретением, представляет собой необязательно дополнительно замещенный меркаптофенил-1Н-пиримидин-2,4-дион. В
 30 качестве примера, а не ограничения, это показано для синтеза 3-(4-хлор-2-фтор-5-меркаптофенил)-1-метил-6-трифторметил-1Н-пиримидин-2,4-диона (IIa) (схема 1). Для данной цели подходящий замещенный анилин, 2-фтор-4-хлоранилин в качестве примера, а не ограничения, превращают в соответствующий изоцианат с помощью подходящего реагента (например, трифосгена) в подходящем полярном апротонном

растворителе (например, дихлорметане), и изоцианат превращают на следующей стадии с помощью реакции с подходящим сложным аминокриловым эфиром с применением подходящего основания (например, гидрида натрия или трет-бутоксиды калия) в подходящем полярном апротонном растворителе (например, N,N-

5 диметилформамиде) в соответствующий, необязательно дополнительно замещенный пиримидин-2,4-дион, в качестве примера, а не ограничения, 3-(4-хлор-2-фторфенил)-1-метил-6-трифторметил-1Н-пиримидин-2,4-дион (схема 1).

Посредством последующего сульфохлорирования с помощью подходящего реагента (например, хлорсульфоновой кислоты) с последующим восстановлением с помощью

10 подходящего восстановителя (например, Zn в EtOH и HCl, гидрата хлорида олова(II) или трифенилфосфина), можно получить необходимый дополнительно замещенный меркаптофенил-1Н-пиримидин-2,4-дион, в качестве примера, а не ограничения, 3-(4-хлор-2-фтор-5-меркаптофенил)-1-метил-6-трифторметил-1Н-пиримидин-2,4-дион (IIa) (см. KR1345394; EP1122244; EP408382; WO2003/029226; WO2010/038953;

15 US2011/0224083; KR2011/110420).

На схеме 1 ниже W в качестве примера, а не ограничения, представляет собой O, R¹ в качестве примера, а не ограничения, представляет собой CH₃, R² в качестве примера, а не ограничения, представляет собой водород, R³ в качестве примера, а не ограничения, представляет собой фтор, R⁴ в качестве примера, а не ограничения, представляет собой

20 хлор, и R¹⁴ в качестве примера, а не ограничения, представляет собой фтор.

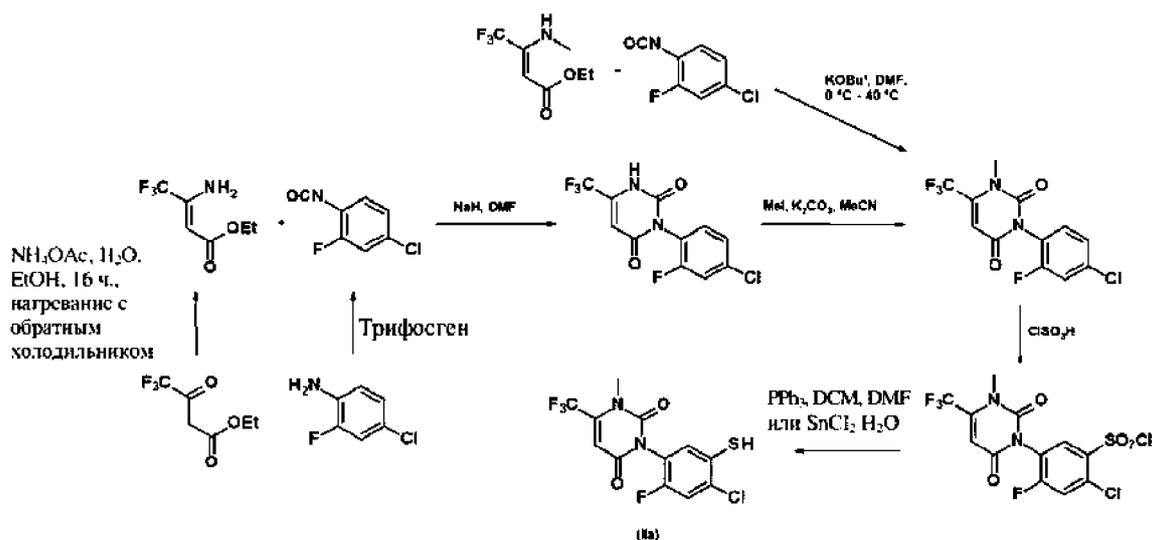
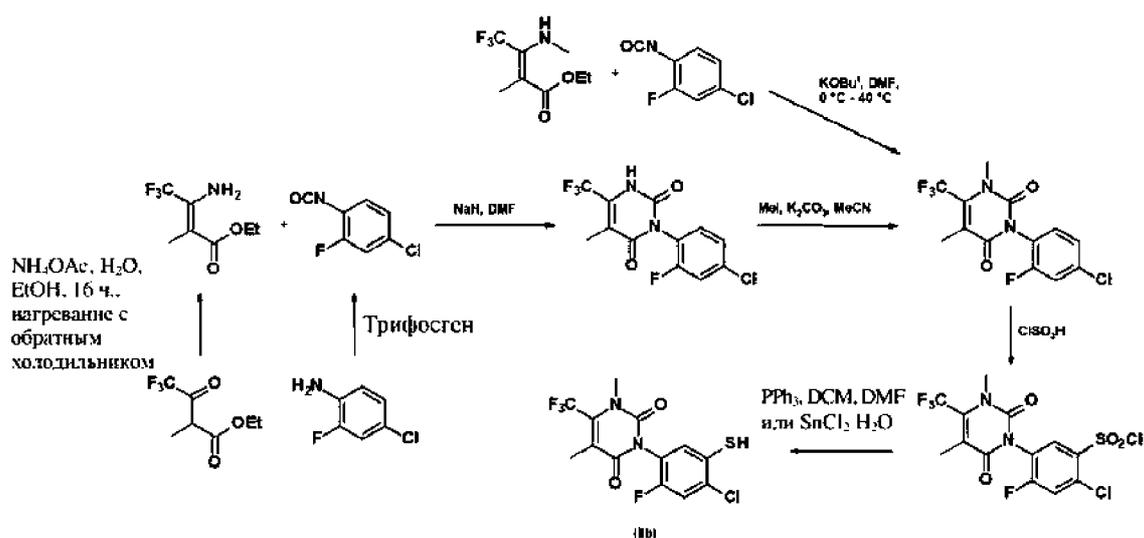


Схема 1

Синтез ключевого промежуточного соединения (IIa), описанный на схеме 1, также можно применять для получения подобных промежуточных соединений, например 3-(4-хлор-2-фтор-5-меркаптофенил)-1,5-диметил-6-трифторметил-1Н-пиримидин-2,4-диона (IIb). На схеме 2 ниже R¹ в качестве примера, а не ограничения, представляет собой CH₃, R² в качестве примера, а не ограничения, представляет собой метил, R³ в качестве примера, а не ограничения, представляет собой фтор, R⁴ в качестве примера, а не ограничения, представляет собой хлор, и R¹⁴ в качестве примера, а не ограничения, представляет собой фтор.



10 Схема 2

Синтез ключевого промежуточного соединения (IIa), описанный на схеме 1, можно дополнительно применять для получения промежуточных соединений, в которых группа R¹ представляет собой аминогруппу, например 3-(4-хлор-2-фтор-5-меркаптофенил)-1,5-диметил-6-трифторметил-1Н-пиримидин-2,4-диона (IIc). Подходящий фталимид применяют в данном случае в качестве защитной группы для аминогруппы. На схеме 3 ниже R¹ в качестве примера, а не ограничения, представляет собой NH₂, R² в качестве примера, а не ограничения, представляет собой водород, R³ в качестве примера, а не ограничения, представляет собой фтор, R⁴ в качестве примера, а не ограничения, представляет собой хлор, и R¹⁴ в качестве примера, а не ограничения, представляет собой фтор.

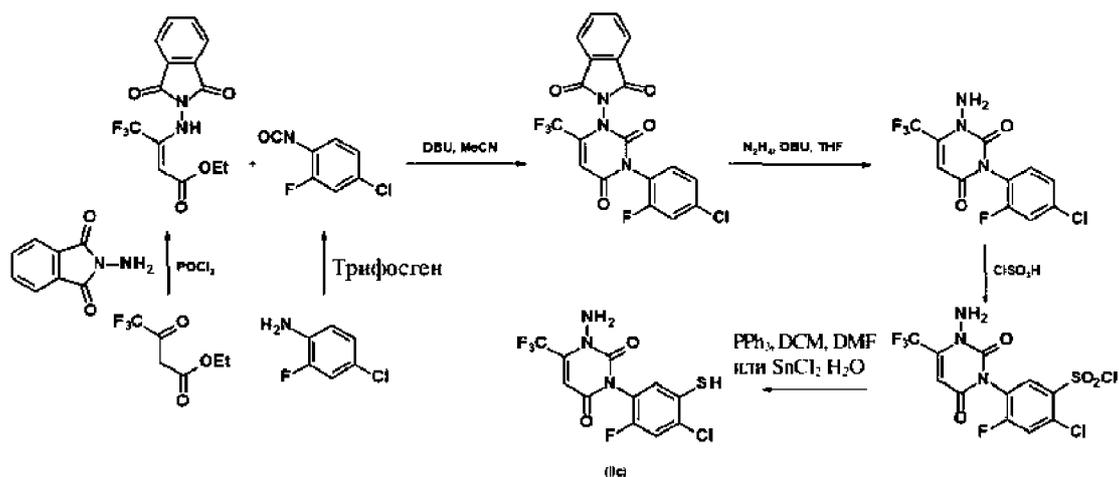


Схема 3

Рассматриваемые промежуточные, дополнительно замещенные 5-меркаптофенил-1Н-
 5 пириимидин-2,4-дионы (II) затем можно превращать в необходимые соединения общей
 формулы (I) в соответствии с настоящим изобретением с помощью двух разных путей
 (схема 4): (i) путем реакции с подходящим, необязательно дополнительно замещенным
 сложным эфиром 2-галогенуксусной кислоты (III) с применением подходящего
 основания (например, карбоната калия, карбоната цезия или карбоната натрия) в
 10 подходящем полярном апротонном растворителе, или (ii) путем реакции
 промежуточных соединений (II) с подходящей, необязательно дополнительно
 замещенной 2-галогенуксусной кислотой с получением соответствующего
 промежуточного соединения (IV), представляющего собой тиоуксусную кислоту, с
 применением подходящего основания (например, карбоната калия, карбоната цезия) и
 15 последующего проведения реакции соответствующего промежуточного соединения
 (IV) с подходящим, необязательно дополнительно замещенным сложным
 гидроксиэфиром с применением подходящих реагентов для реакции сочетания
 (например, HOBT = 1-гидроксибензотриазола, EDC = 1-этил-3-(3-
 20 диметиламинопропил)карбодиимида, HATU = O-(7-азабензотриазол-1-ил)-N,N,N',N'-
 тетраметилуруния гексафторфосфата, ТЗР = 2,4,6-трипропил-1,3,5,2,4,6-
 триоксатрифосфоринан-2,4,6-триоксида) и подходящих оснований (например,
 диизопропилэтиламина, триэтиламина) в подходящем полярном апротонном
 растворителе (например, дихлорметане, хлороформе). На схеме 4 ниже R² и R⁶ в
 качестве примера, а не ограничения, представляют собой водород, и Q в качестве
 25 примера, а не ограничения, представляет собой фрагменты Q-2 и Q-42.

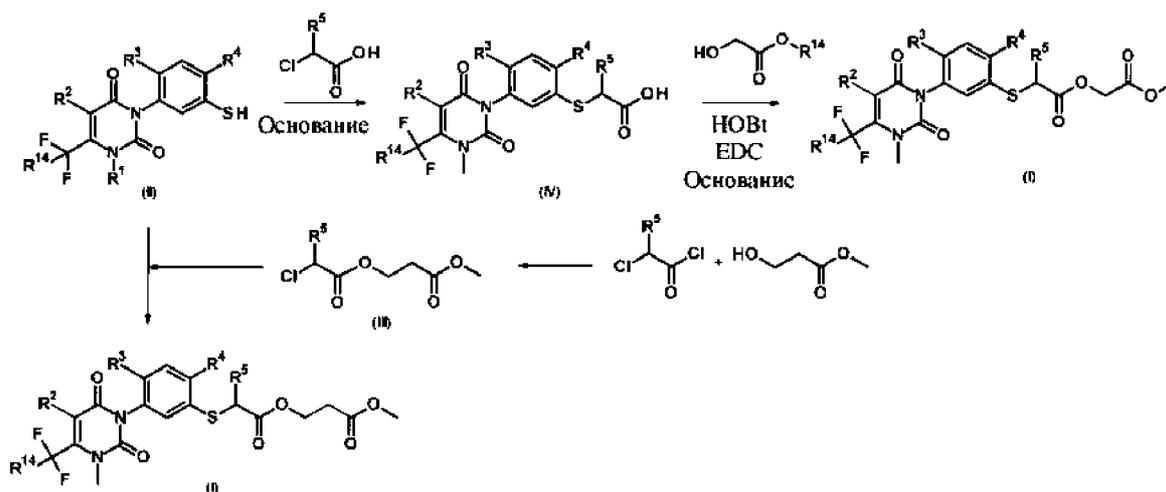
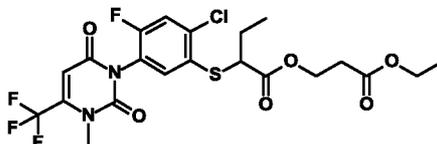


Схема 4

Выбранные подробные примеры синтеза для соединений общей формулы (I) в соответствии с настоящим изобретением приведены ниже. Указанные номера примеров соответствуют нумерации, приведенной в таблицах I.1-I.50 ниже. Данные ¹H ЯМР-, ¹³C ЯМР- и ¹⁹F ЯМР-спектроскопии, приведенные для химических примеров, описанных в следующих абзацах (400 МГц в случае ¹H ЯМР, и 150 МГц в случае ¹³C ЯМР, и 375 МГц в случае ¹⁹F ЯМР, растворитель: CDCl₃, CD₃OD или d₆-DMSO, внутренний стандарт: тетраметилсилан δ = 0,00 ppm), получали с помощью прибора Bruker, и определенные сигналы имеют следующие определения: br = широкий; s = синглет, d = дублет, t = триплет, dd = дублет дублетов, ddd = дублет дублета дублетов, m = мультиплет, q = квартет, квинт. = квинтет, секст. = секстет, септ. = септет, dq = дублет квартетов, dt = дублет триплетов. В случае смесей диастереомеров приведены либо соответствующие значимые сигналы для обоих диастереомеров, либо характеристический сигнал основного диастереомера. Сокращения, применяемые для химических групп, имеют следующие значения, например, Me = CH₃, Et = CH₂CH₃, t-Hex = C(CH₃)₂CH(CH₃)₂, t-Bu = C(CH₃)₃, n-Bu = неразветвленный бутил, n-Pr = неразветвленный пропил, i-Pr = разветвленный пропил, c-Pr = циклопропил, c-Hex = циклогексил.

Примеры синтеза

№ I.2-3. 3-Этоксипропил-2-({2-хлор-4-фтор-5-[3-метил-2,6-диоксо-4-(трифторметил)-3,6-дигидропиримидин-1(2H)-ил]фенил}сульфанил)бутаноат



5

2-Фтор-4-хлоранилин (145 г, 996 ммоль) и триэтиламин (202 г, 2000 ммоль) осторожно последовательно добавляли к раствору трифосгена (119 г, 401 ммоль) в абс.

дихлорметане (1000 мл) таким образом, что температура полученной реакционной смеси оставалась на уровне ниже 20°C. После завершения добавления реакционную смесь перемешивали при комнатной температуре в течение ночи и затем промывали водой (3 × 500 мл) и 1 н. хлористоводородной кислотой (500 мл), высушивали над сульфатом натрия, фильтровали и концентрировали при пониженном давлении.

Полученный таким образом 2-фтор-4-хлорфенилизотиоцианат применяли на следующей стадии без дополнительной очистки. Гидрид натрия (5,60 г, 140 ммоль, 60% дисперсия в минеральном масле) суспендировали в абс. N,N-диметилформамиде и добавляли этил-(2E)-3-амино-4,4,4-трифторбут-2-еноат (14,2 г, 77,5 ммоль). Реакционную смесь перемешивали при комнатной температуре в течение 1 ч., затем охлаждали до температуры, составляющей -30°C, и добавляли 2-фтор-4-хлорфенилизотиоцианат (12,0 г, 70,0 ммоль).

По завершении добавления полученную реакционную смесь перемешивали при комнатной температуре в течение дополнительных 4 ч. и затем добавляли в смесь воды со льдом. После добавления этилацетата и подкисления с помощью 1 н.

хлористоводородной кислоты водную фазу тщательно экстрагировали этилацетатом. Объединенные органические фазы промывали водой, высушивали над сульфатом натрия, фильтровали и концентрировали при пониженном давлении. Таким способом получали 3-(4-хлор-2-фторфенил)-6-(трифторметил)пиримидин-2,4(1H,3H)-дион (15,2 г, 50,2 ммоль, 65%), который применяли на следующей стадии без дополнительной очистки. Также можно было успешно повторить данную стадию реакции в большем масштабе. К раствору 3-(4-хлор-2-фторфенил)-6-

30

(трифторметил)пиримидин-2,4(1Н,3Н)-диона (238 г, 770 ммоль) в абс. N,N-диметилформамиде (800 мл) добавляли карбонат калия (117 г, 850 ммоль). После этого добавляли раствор метилиодида (120 г, 850 ммоль) в абс. N,N-диметилформамиде (100 мл) и полученную реакционную смесь перемешивали при 5 комнатной температуре в течение дополнительного 1 ч. По завершении превращения реакционную смесь охлаждали до температуры, составляющей 0°C, осторожно добавляли воду (2000 мл) и затем смесь тщательно экстрагировали дихлорметаном. Объединенные органические фазы высушивали над сульфатом натрия, фильтровали и концентрировали при пониженном давлении. Таким способом получали 3-(4-хлор-2-фторфенил)-1-метил-6-(трифторметил)пиримидин-2,4(1Н,3Н)-дион (241 г, 747 ммоль, 97% от теоретического), который преобразовывали на следующей стадии без 10 дополнительной очистки. 3-(4-Хлор-2-фторфенил)-1-метил-6-(трифторметил)пиримидин-2,4(1Н,3Н)-дион (100 г, 310 ммоль) затем постепенно добавляли к хлорсульфоновой кислоте в нагретой круглодонной колбе. 15 Затем полученную реакционную смесь перемешивали при температуре, составляющей 110°C, в течение 20 ч. и после охлаждения до комнатной температуры добавляли в смесь воды со льдом и несколько раз экстрагировали этилацетатом (3 × 300 мл). Объединенные органические фазы высушивали над сульфатом натрия, фильтровали и концентрировали при пониженном давлении. Это обеспечивало получение 2-хлор-4-фтор-5-[3-метил-2,6-диоксо-4-(трифторметил)-3,6-дигидропиримидин-1(2Н)-ил]бензолсульфонилхлорида (75,0 г, 178 ммоль, 57% от теоретического), который 20 применяли на следующей стадии без дополнительной очистки. К исходной загрузке в виде 2-хлор-4-фтор-5-[3-метил-2,6-диоксо-4-(трифторметил)-3,6-дигидропиримидин-1(2Н)-ил]сульфонилхлорида (100,0 г, 237 ммоль) в круглодонной 25 колбе последовательно добавляли хлористоводородную кислоту (500 мл), уксусную кислоту (500 мл) и дигидрат дихлорида олова (270 г, 1197 ммоль). Полученную реакционную смесь перемешивали при температуре, составляющей 100°C, в течение 10 ч., после охлаждения до комнатной температуры добавляли в смесь воды со льдом и тщательно экстрагировали дихлорметаном (3 × 400 мл). 30 Объединенные органические фазы высушивали над сульфатом натрия, фильтровали и концентрировали при пониженном давлении. Конечная очистка посредством колоночной хроматографии обеспечивала получение 3-(4-хлор-2-фтор-5-сульфанилфенил)-1-метил-6-(трифторметил)пиримидин-2,4(1Н,3Н)-диона (73,0 г, 206 ммоль, 83% от теоретического) в виде бесцветного твердого вещества. 2-

Хлорбутанкарбоновую кислоту (691 мг, 5,64 ммоль) растворяли в абс. ацетонитриле в атмосфере аргона в нагретой круглодонной колбе и затем добавляли карбонат цезия (3,67 г, 11,28 ммоль) и 3-(4-хлор-2-фтор-5-сульфанилфенил)-1-метил-6-(трифторметил)пиримидин-2,4(1H,3H)-дион (2,0 г, 5,64 ммоль).

5 Полученную реакционную смесь перемешивали при температуре, составляющей 50°C, в течение 1 ч. и после охлаждения до комнатной температуры смешивали с водой и дихлорметаном и тщательно экстрагировали. Водную фазу затем подкисляли с помощью 10% хлористоводородной кислоты и снова несколько раз экстрагировали дихлорметаном. Объединенные органические фазы высушивали над сульфатом натрия, 10 фильтровали и концентрировали при пониженном давлении.

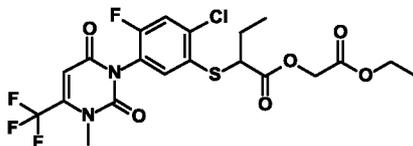
Затем неочищенный продукт очищали посредством колоночной хроматографии (градиент этилацетат/гептан) и получали 2-({2-хлор-4-фтор-5-[3-метил-2,6-диоксо-4-(трифторметил)-3,6-дигидропиримидин-1(2H)-ил]фенил}сульфанил)бутановую кислоту (2,0 г, 80% от теоретического) в виде бесцветного твердого вещества. ¹H-ЯМР (CDCl₃ δ, ppm) 7,53 (d, 1H), 7,38 (d, 1H), 6,36 (d, 1H), 3,68 (m, 1H), 3,55 (s, 3H), 2,05-1,95 (m, 1H), 1,93-1,82 (m, 1H), 1,09 (t, 3H). 2-({2-Хлор-4-фтор-5-[3-метил-2,6-диоксо-4-(трифторметил)-3,6-дигидропиримидин-1(2H)-ил]фенил}сульфанил)бутановую кислоту (100 мг, 0,23 ммоль), 1-гидрокси-1H-бензотриазол (40 мг, 0,29 ммоль) и 1-(3-диметиламинопропил)-3-этилкарбодиимида гидрохлорид (57 мг, 0,29 ммоль) 20 растворяли в абс. дихлорметане в нагретой круглодонной колбе в атмосфере аргона и после перемешивания при комнатной температуре в течение 5 минут добавляли этил-3-гидроксипропаноат (35 мг, 0,29 ммоль) и триэтиламин (0,08 мл, 0,57 ммоль).

Полученную реакционную смесь перемешивали при комнатной температуре в течение 6 ч., затем смешивали с водой и дихлорметаном и тщательно экстрагировали 25 дихлорметаном.

Объединенные органические фазы высушивали над сульфатом натрия, фильтровали и концентрировали при пониженном давлении.

Затем неочищенный продукт очищали посредством колоночной хроматографии (градиент этилацетат/гептан) и получали 3-этокси-3-оксопропил-2-({2-хлор-4-фтор-5-[3-метил-2,6-диоксо-4-(трифторметил)-3,6-дигидропиримидин-1(2H)-ил]фенил}сульфанил)бутаноат (44 мг, 36% от теоретического) в виде высоковязкого бесцветного масла. ¹H-ЯМР (CDCl₃ δ, ppm) 7,53 (m, 1H), 7,36 (m, 1H), 6,35 (d, 1H), 4,36-4,27 (m, 2H), 4,17-4,10 (m, 2H), 3,71-3,64 (m, 1H), 3,55 (s, 3H), 2,59-2,52 (m, 2H), 2,02-1,91 (m, 1H), 1,89-1,80 (m, 1H), 1,24 (t, 3H), 1,05 (t, 3H).

№ I.2-43. 2-Этоксипропан-2-ил-2-((2-хлор-4-фтор-5-[3-метил-2,6-диоксо-4-(трифторметил)-3,6-дигидропиримидин-1(2H)-ил]фенил)сульфанил)бутаноат



5

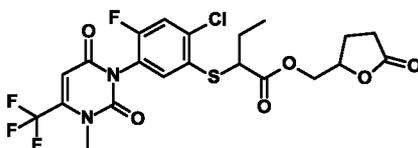
2-((2-Хлор-4-фтор-5-[3-метил-2,6-диоксо-4-(трифторметил)-3,6-дигидропиримидин-1(2H)-ил]фенил)сульфанил)бутановую кислоту (100 мг, 0,23 ммоль), 1-гидрокси-1H-бензотриазол (40 мг, 0,29 ммоль) и 1-(3-диметиламинопропил)-3-этилкарбодиимида гидрохлорид (57 мг, 0,29 ммоль) растворяли в абс. дихлорметане в нагретой круглодонной колбе в атмосфере аргона и после перемешивания при комнатной температуре в течение 5 минут добавляли этилгидроксиацетат (31 мг, 0,29 ммоль) и триэтиламин (0,08 мл, 0,57 ммоль). Полученную реакцию смесь перемешивали при комнатной температуре в течение 6 ч., затем смешивали с водой и дихлорметаном и тщательно экстрагировали дихлорметаном.

15

Объединенные органические фазы высушивали над сульфатом натрия, фильтровали и концентрировали при пониженном давлении. Затем неочищенный продукт очищали посредством колоночной хроматографии (градиент этилацетат/гептан) и получали 2-этоксипропан-2-ил-2-((2-хлор-4-фтор-5-[3-метил-2,6-диоксо-4-(трифторметил)-3,6-дигидропиримидин-1(2H)-ил]фенил)сульфанил)бутаноат (60 мг, 50% от теоретического) в виде высоковязкого бесцветного масла. $^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 , δ , ppm) 7,58 (m, 1H), 7,36 (m, 1H), 6,34 (m, 1H), 4,63-4,53 (m, 2H), 4,19-4,12 (m, 2H), 3,77-3,72 (m, 1H), 3,55 (s, 3H), 2,09-1,99 (m, 1H), 1,93-1,84 (m, 1H), 1,25 (t, 3H), 1,12 (t, 3H).

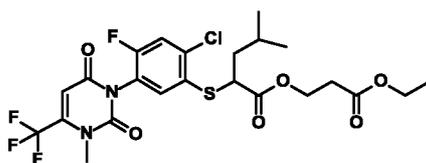
20

№ I.2-145. (5-Оксотетрагидрофуран-2-ил)метил-2-((2-хлор-4-фтор-5-[3-метил-2,6-диоксо-4-(трифторметил)-3,6-дигидропиримидин-1(2H)-ил]фенил)сульфанил)бутаноат



25

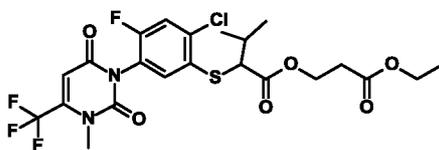
- 2-({2-Хлор-4-фтор-5-[3-метил-2,6-диоксо-4-(трифторметил)-3,6-дигидропиримидин-1(2Н)-ил]фенил}сульфанил)бутановую кислоту (90 мг, 0,20 ммоль), 1-гидрокси-1Н-бензотриазол (36 мг, 0,27 ммоль) и 1-(3-диметиламинопропил)-3-этилкарбодиимида гидрохлорид (51 мг, 0,27 ммоль) растворяли в абс. дихлорметане в нагретой
- 5 круглодонной колбе в атмосфере аргона и, после перемешивания при комнатной температуре в течение 5 минут, добавляли 5-(гидроксиметил)дигидрофуран-2(3Н)-он (31 мг, 0,27 ммоль) и триэтиламин (0,08 мл, 0,57 ммоль). Полученную реакцию смесь перемешивали при комнатной температуре в течение 2 ч., затем смешивали с водой и дихлорметаном и тщательно экстрагировали дихлорметаном.
- 10 Объединенные органические фазы высушивали над сульфатом натрия, фильтровали и концентрировали при пониженном давлении. Затем неочищенный продукт очищали посредством колоночной хроматографии (градиент этилацетат/гептан) и получали (5-оксотетрагидрофуран-2-ил)метил-2-({2-хлор-4-фтор-5-[3-метил-2,6-диоксо-4-
- 15 (трифторметил)-3,6-дигидропиримидин-1(2Н)-ил]фенил}сульфанил)бутаноат (73 мг, 66% от теоретического) в виде высоковязкого бесцветного масла. ¹Н-ЯМР (CDCl₃ δ, ppm) 7,54 (m, 1H), 7,38 (m, 1H), 6,33 (m, 1H), 4,64-4,57 (m, 1H), 4,29-4,21 (m, 1H), 4,10-4,04 (m, 1H), 3,82-3,76 (m, 1H), 3,56 (s, 3H), 2,58-2,48 (m, 2H), 2,33-2,20 (m, 1H), 2,06-1,97 (m, 1H), 1,93-1,78 (m, 2H), 1,11-1,06 (m, 3H).
- 20 № I.4-3. 3-Этоксипропил-2-({2-хлор-4-фтор-5-[3-метил-2,6-диоксо-4-
- (трифторметил)-3,6-дигидропиримидин-1(2Н)-ил]фенил}сульфанил)-4-метилпентаноат



- 25 2-Хлор-4-метилпентанкарбовую кислоту (849 мг, 5,64 ммоль) растворяли в абс. ацетонитриле в атмосфере аргона в нагретой круглодонной колбе и затем добавляли карбонат цезия (3,67 г, 11,28 ммоль) и 3-(4-хлор-2-фтор-5-сульфанилфенил)-1-метил-6-
- (трифторметил)пиримидин-2,4(1Н,3Н)-дион (2,0 г, 5,64 ммоль). Полученную реакцию смесь перемешивали при температуре, составляющей 50°C, в течение 1 ч.
- 30 и после охлаждения до комнатной температуры смешивали с водой и дихлорметаном и

тщательно экстрагировали. Водную фазу затем подкисляли с помощью 10% хлористоводородной кислоты и снова несколько раз экстрагировали дихлорметаном. Объединенные органические фазы высушивали над сульфатом натрия, фильтровали и концентрировали при пониженном давлении. Затем неочищенный продукт очищали
5 посредством колоночной хроматографии (градиент этилацетат/гептан) и получали 2-({2-хлор-4-фтор-5-[3-метил-2,6-диоксо-4-(трифторметил)-3,6-дигидропиримидин-1(2H)-ил]фенил}сульфанил)-4-метилпентановую кислоту (1,62 г, 61% от теоретического) в виде бесцветного твердого вещества. $^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 , δ , ppm) 7,53 (d, 1H), 7,37 (d, 1H), 6,37 (m, 1H), 3,82-3,78 (m, 1H), 3,55 (s, 3H), 1,90-1,78 (m, 2H), 1,73-1,65
10 (m, 1H), 0,99-0,92 (m, 6H). 2-({2-Хлор-4-фтор-5-[3-метил-2,6-диоксо-4-(трифторметил)-3,6-дигидропиримидин-1(2H)-ил]фенил}сульфанил)-4-метилпентановую кислоту (100 мг, 0,21 ммоль), 1-гидрокси-1H-бензотриазол (38 мг, 0,28 ммоль) и 1-(3-диметиламинопропил)-3-этилкарбодиимида гидрохлорид (53 мг, 0,28 ммоль) растворяли в абс. дихлорметане в нагретой круглодонной колбе в атмосфере аргона и,
15 после перемешивания при комнатной температуре в течение 5 минут, добавляли этил-3-гидроксипропаноат (33 мг, 0,28 ммоль) и триэтиламин (0,07 мл, 0,51 ммоль). Полученную реакционную смесь перемешивали при комнатной температуре в течение 6 ч., затем смешивали с водой и дихлорметаном и тщательно экстрагировали дихлорметаном. . Объединенные органические фазы высушивали над сульфатом
20 натрия, фильтровали и концентрировали при пониженном давлении. Затем неочищенный продукт очищали посредством колоночной хроматографии (градиент этилацетат/гептан) и получали 3-этокси-3-оксопропил-2-({2-хлор-4-фтор-5-[3-метил-2,6-диоксо-4-(трифторметил)-3,6-дигидропиримидин-1(2H)-ил]фенил}сульфанил)-4-метилпентаноат (43 мг, 35% от теоретического) в виде высоковязкого бесцветного
25 масла. $^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 , δ , ppm) 7,47 (m, 1H), 7,35 (m, 1H), 6,35 (d, 1H), 4,37-4,30 (m, 1H), 4,28-4,22 (m, 1H), 4,14-4,09 (q, 2H), 3,84-3,80 (m, 1H), 3,55 (s, 3H), 2,58-2,51 (m, 2H), 1,89-1,83 (m, 1H), 1,80-1,72 (m, 1H), 1,69-1,62 (m, 1H), 1,25 (t, 3H), 0,94 (d, 3H), 0,92 (d, 3H).

№ I.6-3. 3-Этоксипропил-2-({2-хлор-4-фтор-5-[3-метил-2,6-диоксо-4-(трифторметил)-3,6-дигидропиримидин-1(2H)-ил]фенил}сульфанил)-3-метилбутаноат



5

2-({2-Хлор-4-фтор-5-[3-метил-2,6-диоксо-4-(трифторметил)-3,6-дигидропиримидин-1(2H)-ил]фенил}сульфанил)-3-метилбутановую кислоту (100 мг, 0,22 ммоль), 1-гидрокси-1H-бензотриазол (39 мг, 0,29 ммоль) и 1-(3-диметиламинопропил)-3-этилкарбодиимида гидрохлорид (55 мг, 0,29 ммоль) растворяли в абс. дихлорметане в нагретой круглодонной колбе в атмосфере аргона и, после перемешивания при комнатной температуре в течение 5 минут, добавляли этил-3-гидроксипропаноат (34 мг, 0,29 ммоль) и триэтиламин (0,07 мл, 0,53 ммоль).

10

Полученную реакционную смесь перемешивали при комнатной температуре в течение 6 ч., затем смешивали с водой и дихлорметаном и тщательно экстрагировали

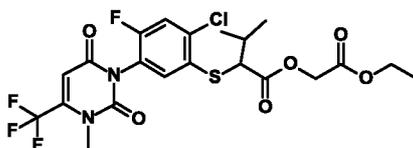
15

дихлорметаном. Объединенные органические фазы высушивали над сульфатом натрия, фильтровали и концентрировали при пониженном давлении. Затем неочищенный продукт очищали посредством колоночной хроматографии (градиент этилацетат/гептан) и получали 3-этоксипропил-2-({2-хлор-4-фтор-5-[3-метил-2,6-диоксо-4-(трифторметил)-3,6-дигидропиримидин-1(2H)-ил]фенил}сульфанил)-3-метилбутаноат (45 мг, 37% от теоретического) в виде высоковязкого бесцветного масла. ¹H-ЯМР (CDCl₃ δ, ppm) 7,45 (m, 1H), 7,34 (m, 1H), 6,35 (m, 1H), 4,37-4,23 (m, 2H), 4,15-4,09 (m, 2H), 3,55 (s, 3H), 3,52 (m, 1H), 2,58-2,54 (m, 2H), 2,24-2,16 (m, 1H), 1,19 (t, 3H), 1,07 (t, 3H).

20

25

№ I.6-43. 2-Этоксипропил-2-({2-хлор-4-фтор-5-[3-метил-2,6-диоксо-4-(трифторметил)-3,6-дигидропиримидин-1(2H)-ил]фенил}сульфанил)-3-метилбутаноат

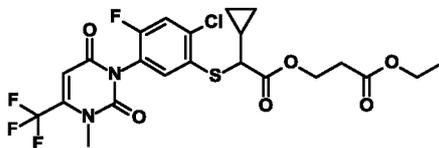


2-Хлор-3-метилбутанкарбоновую кислоту (770 мг, 5,64 ммоль) растворяли в абс. ацетонитриле в атмосфере аргона в нагретой круглодонной колбе и затем добавляли карбонат цезия (3,67 г, 11,28 ммоль) и 3-(4-хлор-2-фтор-5-сульфанилфенил)-1-метил-6-(трифторметил)пиримидин-2,4(1Н,3Н)-дион (2,0 г, 5,64 ммоль). Полученную
5 реакцию смесь перемешивали при температуре, составляющей 50°C, в течение 1 ч. и после охлаждения до комнатной температуры смешивали с водой и дихлорметаном и тщательно экстрагировали.

Водную фазу затем подкисляли с помощью 10% хлористоводородной кислоты и снова несколько раз экстрагировали дихлорметаном. Объединенные органические фазы
10 высушивали над сульфатом натрия, фильтровали и концентрировали при пониженном давлении. Затем неочищенный продукт очищали посредством колоночной хроматографии (градиент этилацетат/гептан) и получали 2-({2-хлор-4-фтор-5-[3-метил-2,6-диоксо-4-(трифторметил)-3,6-дигидропиримидин-1(2Н)-ил]фенил}сульфанил)-3-метилбутановую кислоту (0,47 г, 21% от теоретического) в виде бесцветного твердого
15 вещества. ¹Н-ЯМР (CDCl₃ δ, ppm) 7,49 (d, 1H), 7,37 (d, 1H), 6,33 (m, 1H), 3,58-3,48 (m, 1H), 3,53 (s, 3H), 2,25-2,17 (m, 1H), 1,18 (d, 3H), 1,11 (d, 3H). 2-({2-Хлор-4-фтор-5-[3-метил-2,6-диоксо-4-(трифторметил)-3,6-дигидропиримидин-1(2Н)-ил]фенил}сульфанил)-3-метилбутановую кислоту (100 мг, 0,22 ммоль), 1-гидрокси-1Н-бензотриазол (39 мг, 0,29 ммоль) и 1-(3-диметиламинопропил)-3-этилкарбодиимида
20 гидрохлорид (55 мг, 0,29 ммоль) растворяли в абс. дихлорметане в нагретой круглодонной колбе в атмосфере аргона и после перемешивания при комнатной температуре в течение 5 минут добавляли этил-3-гидроксиацетат (30 мг, 0,29 ммоль) и триэтиламин (0,07 мл, 0,53 ммоль).

Полученную реакцию смесь перемешивали при комнатной температуре в течение
25 6 ч., затем смешивали с водой и дихлорметаном и тщательно экстрагировали дихлорметаном. Объединенные органические фазы высушивали над сульфатом натрия, фильтровали и концентрировали при пониженном давлении. Затем неочищенный продукт очищали посредством колоночной хроматографии (градиент
30 этилацетат/гептан) и получали 2-этокси-2-оксоэтил-2-({2-хлор-4-фтор-5-[3-метил-2,6-диоксо-4-(трифторметил)-3,6-дигидропиримидин-1(2Н)-ил]фенил}сульфанил)-3-метилбутаноат (54 мг, 45% от теоретического) в виде высоковязкого бесцветного масла. ¹Н-ЯМР (CDCl₃ δ, ppm) 7,56 (m, 1H), 7,36 (m, 1H), 6,34 (m, 1H), 4,60-4,50 (m, 2H), 4,17-4,12 (m, 1H), 3,64-3,58 (m, 1H), 3,54 (s, 3H), 2,32-2,24 (m, 1H), 1,26 (t, 3H), 1,20 (d, 3H), 1,16 (d, 3H).

№ I.44-3. Этил-3-[2-({2-хлор-4-фтор-5-[3-метил-2,6-диоксо-4-(трифторметил)-3,6-дигидропиримидин-1(2H)-ил]фенил}сульфанил)(циклопропил)ацетокси]пропаноат



5

Этил-хлор(циклопропил)ацетат (409 мг, 1,97 ммоль) растворяли в абс. ацетонитриле в атмосфере аргона в нагретой круглодонной колбе и затем добавляли карбонат цезия (273 мг, 1,97 ммоль) и 3-(4-хлор-2-фтор-5-сульфанилфенил)-1-метил-6-(трифторметил)пиримидин-2,4(1H,3H)-дион (700 мг, 1,97 ммоль). Полученную реакционную смесь перемешивали при температуре, составляющей 50°C, в течение 2 ч. и после охлаждения до комнатной температуры смешивали с водой и дихлорметаном и тщательно экстрагировали. Водную фазу затем подкисляли с помощью 10% хлористоводородной кислоты и снова несколько раз экстрагировали дихлорметаном.

Объединенные органические фазы высушивали над сульфатом натрия, фильтровали и концентрировали при пониженном давлении.

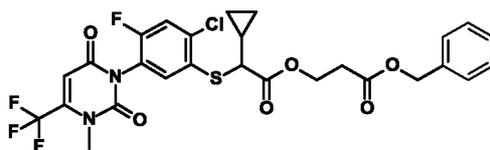
Затем неочищенный продукт очищали посредством колоночной хроматографии (градиент этилацетат/гептан) и получали этил-({2-хлор-4-фтор-5-[3-метил-2,6-диоксо-4-(трифторметил)-3,6-дигидропиримидин-1(2H)-ил]фенил}сульфанил)(циклопропил)ацетат (940 мг, 99% от теоретического) в виде бесцветного твердого вещества. ¹H-ЯМР (CDCl₃ δ, ppm) 7,51 (d, 1H), 7,35 (d, 1H), 6,34 (s, 1H), 4,18-4,05 (m, 2H), 3,53 (s, 3H), 3,13-3,10 (m, 1H), 1,33-1,26 (m, 1H), 1,15 (t, 3H), 0,75-0,66 (m, 2H), 0,48-0,44 (m, 1H), 0,42-0,36 (m, 1H). Этил-({2-хлор-4-фтор-5-[3-метил-2,6-диоксо-4-(трифторметил)-3,6-дигидропиримидин-1(2H)-ил]фенил}сульфанил)(циклопропил)ацетат (160 мг, 0,33 ммоль) затем растворяли в этилацетате и добавляли 6 н. HCl. Полученную реакционную смесь перемешивали при температуре, составляющей 100°C, в течение 3 ч., после охлаждения до комнатной температуры смешивали с водой и тщательно экстрагировали с помощью абс. дихлорметана.

Объединенные органические фазы высушивали над сульфатом натрия, фильтровали и концентрировали при пониженном давлении. Затем неочищенный продукт очищали

30

посредством колоночной хроматографии (градиент этилацетат/гептан) и получали ({2-хлор-4-фтор-5-[3-метил-2,6-диоксо-4-(трифторметил)-3,6-дигидропиримидин-1(2H)-ил]фенил}сульфанил)(циклопропил)уксусную кислоту (120 мг, 79% от теоретического) в виде бесцветного твердого вещества. ¹H-ЯМР (CDCl₃ δ, ppm) 7,54 (dd, 1H), 7,36 (d, 1H), 6,34 (m, 1H), 3,55 (s, 3H), 3,11-3,08 (m, 1H), 1,32-1,24 (m, 1H), 0,77-0,69 (m, 2H), 0,52-0,38 (m, 2H). ({2-Хлор-4-фтор-5-[3-метил-2,6-диоксо-4-(трифторметил)-3,6-дигидропиримидин-1(2H)-ил]фенил}сульфанил)(циклопропил)уксусную кислоту (120 мг, 0,27 ммоль), 1-гидрокси-1H-бензотриазол (47 мг, 0,35 ммоль) и 1-(3-диметиламинопропил)-3-этилкарбодиимида гидрохлорид (66 мг, 0,35 ммоль) растворяли в абс. дихлорметане в нагретой круглодонной колбе в атмосфере аргона и, после перемешивания при комнатной температуре в течение 5 минут, добавляли этил-3-гидроксипропионат (41 мг, 0,35 ммоль) и триэтиламин (0,09 мл, 0,64 ммоль). Полученную реакционную смесь перемешивали при комнатной температуре в течение 2 ч., затем смешивали с водой и дихлорметаном и тщательно экстрагировали дихлорметаном. Объединенные органические фазы высушивали над сульфатом натрия, фильтровали и концентрировали при пониженном давлении. Затем неочищенный продукт очищали посредством колоночной хроматографии (градиент этилацетат/гептан) и получали этил-3-[2-({2-хлор-4-фтор-5-[3-метил-2,6-диоксо-4-(трифторметил)-3,6-дигидропиримидин-1(2H)-ил]фенил}сульфанил)(циклопропил)ацетокси]пропаноат (81 мг, 54% от теоретического) в виде высоковязкого бесцветного масла. ¹H-ЯМР (d₆-DMSO δ, ppm) 7,83 (d, 1H), 7,68 (m, 1H), 6,62 (m, 1H), 4,27-4,18 (m, 1H), 4,17-4,10 (m, 1H), 4,07-3,98 (m, 2H), 3,52-3,48 (m, 1H), 3,41 (s, 3H), 2,71-2,58 (m, 2H) 1,23-1,11 (m, 4H), 0,72-0,56 (m, 2H), 0,49-0,34 (m, 2H).

№ I.44-6. Бензил-3-[2-({2-хлор-4-фтор-5-[3-метил-2,6-диоксо-4-(трифторметил)-3,6-дигидропиримидин-1(2H)-ил]фенил}сульфанил)(циклопропил)ацетокси]пропаноат

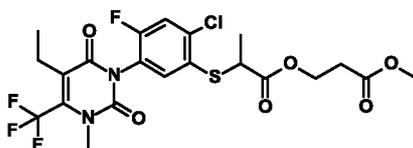


({2-Хлор-4-фтор-5-[3-метил-2,6-диоксо-4-(трифторметил)-3,6-дигидропиримидин-1(2Н)-ил]фенил}сульфанил)(циклопропил)уксусную кислоту (120 мг, 0,27 ммоль), 1-гидрокси-1Н-бензотриазол (47 мг, 0,35 ммоль) и 1-(3-диметиламинопропил)-3-этилкарбодиимида гидрохлорид (66 мг, 0,35 ммоль) растворяли в абс. дихлорметане в нагретой круглодонной колбе в атмосфере аргона и после перемешивания при комнатной температуре в течение 5 минут добавляли бензил-3-гидроксипропионат (62 мг, 0,35 ммоль) и триэтиламин (0,09 мл, 0,64 ммоль).

Полученную реакционную смесь перемешивали при комнатной температуре в течение 2 ч., затем смешивали с водой и дихлорметаном и тщательно экстрагировали дихлорметаном. Объединенные органические фазы высушивали над сульфатом натрия, фильтровали и концентрировали при пониженном давлении. Затем неочищенный продукт очищали посредством колоночной хроматографии (градиент этилацетат/гептан) и получали бензил-3-[2-({2-хлор-4-фтор-5-[3-метил-2,6-диоксо-4-(трифторметил)-3,6-дигидропиримидин-1(2Н)-

ил]фенил}сульфанил)(циклопропил)ацетокси]пропаноат (76 мг, 45% от теоретического) в виде высоковязкого бесцветного масла. ^1H -ЯМР (d_6 -DMSO δ , ppm) 7,83 (d, 1H), 7,67 (m, 1H), 6,60 (m, 1H), 5,09 (s, 2H), 4,30-4,23 (m, 1H), 4,21-4,15 (m, 1H), 3,41 (s, 3H), 3,39-3,31 (m, 1H), 2,72-2,57 (m, 2H), 1,18-1,09 (m, 1H), 0,68-0,53 (m, 2H), 0,40-0,34 (m, 2H).

№ I.48-2. 3-Метокси-3-оксопропил-2-({2-хлор-5-[5-этил-3-метил-2,6-диоксо-4-(трифторметил)-3,6-дигидропиримидин-1(2Н)-ил]-4-фторфенил}сульфанил)пропаноат



Аналогично синтезу примера № I.12-72 раствор н-бутиллития в гексане добавляли к охлажденному до -10°C раствору диизопропиламина в абс. тетрагидрофуране.

Полученную реакционную смесь перемешивали при температуре, составляющей -10°C , в течение 40 минут и затем дополнительно охлаждали до -78°C . Затем осторожно добавляли этилбутаноат. Реакционную смесь перемешивали при -78°C в течение 1 ч., добавляли подходящее количество 2,2,2-трифторэтилтрифторацетата и, наконец, смесь

перемешивали при комнатной температуре в течение ночи. По завершении превращения смесь подкисляли с помощью разб. хлористоводородной кислоты (1 М) и несколько раз тщательно экстрагировали этилацетатом.

5 Данные объединенные органические фазы высушивали над сульфатом натрия, фильтровали и концентрировали при пониженном давлении и полученный таким образом этил-4,4,4-трифтор-2-этил-3-оксобутаноат (67% от теоретического) без дополнительной очистки растворяли в толуоле в круглодонной колбе и смешивали с ацетатом аммония и уксусной кислотой.

10 Полученную реакционную смесь перемешивали в условиях нагревания с обратным холодильником с применением отделителя воды в течение нескольких часов до того момента, когда вода больше не отделялась. После охлаждения до комнатной температуры реакционную смесь концентрировали при пониженном давлении и затем остаток поглощали с помощью этилацетата и воды.

15 Затем водную фазу тщательно экстрагировали этилацетатом и объединенные органические фазы высушивали над сульфатом натрия, фильтровали и концентрировали при пониженном давлении. Дистилляционная очистка полученного остатка обеспечивала получение этил-(2Z)-3-амино-4,4,4-трифтор-2-этилбут-2-еноата (58% от теоретического). 2-Фтор-4-хлоранилин и триэтиламин осторожно последовательно добавляли к раствору трифосгена в абс. дихлорметане таким образом, что температура полученной реакционной смеси оставалась на уровне ниже 20°C.

20 После завершения добавления реакционную смесь перемешивали при комнатной температуре в течение ночи и затем промывали водой и 1 н хлористоводородной кислотой, высушивали над сульфатом натрия, фильтровали и концентрировали при пониженном давлении. Полученный таким образом 2-фтор-4-хлорфенилизотиоцианат применяли на следующей стадии без дополнительной очистки. Гидрид натрия (60% дисперсия в минеральном масле) суспендировали в абс. N,N-диметилформамиде и добавляли этил-(2Z)-3-амино-4,4,4-трифтор-2-этилбут-2-еноат.

25 Реакционную смесь перемешивали при комнатной температуре в течение 1 ч., затем охлаждали до температуры, составляющей -30°C, и добавляли 2-фтор-4-хлорфенилизотиоцианат. По завершении добавления полученную реакционную смесь перемешивали при комнатной температуре в течение дополнительных 4 ч. и затем добавляли в смесь воды со льдом. После добавления этилацетата и подкисления с помощью 1 н. хлористоводородной кислоты водную фазу тщательно экстрагировали этилацетатом.

Объединенные органические фазы промывали водой, высушивали над сульфатом натрия, фильтровали и концентрировали при пониженном давлении. Таким способом получали 3-(4-хлор-2-фторфенил)-5-этил-6-(трифторметил)пиримидин-2,4(1H,3H)-дион (66%), который применяли на следующей стадии без дополнительной очистки. К раствору 3-(4-хлор-2-фторфенил)-5-метил-6-(трифторметил)пиримидин-2,4(1H,3H)-диона (1 экв.) в абс. N,N-диметилформамиде добавляли карбонат калия (1,2 экв.). После этого добавляли раствор метилиодида (1,2 экв.) в абс. N,N-диметилформамиде и полученную реакционную смесь перемешивали при комнатной температуре в течение дополнительного 1 ч. По завершении превращения реакционную смесь охлаждали до температуры, составляющей 0°C, осторожно добавляли воду и затем смесь тщательно экстрагировали дихлорметаном. Объединенные органические фазы высушивали над сульфатом натрия, фильтровали и концентрировали при пониженном давлении. Таким способом получали 3-(4-хлор-2-фторфенил)-5-этил-1-метил-6-(трифторметил)пиримидин-2,4(1H,3H)-дион (97% от теоретического), который преобразовывали на следующей стадии без дополнительной очистки. 3-(4-Хлор-2-фторфенил)-5-этил-1-метил-6-(трифторметил)пиримидин-2,4(1H,3H)-дион затем постепенно добавляли к хлорсульфоновой кислоте в нагретой круглодонной колбе. Затем полученную реакционную смесь перемешивали при температуре, составляющей 110°C, в течение 20 ч. и после охлаждения до комнатной температуры добавляли в смесь воды со льдом и несколько раз экстрагировали этилацетатом. Объединенные органические фазы высушивали над сульфатом натрия, фильтровали и концентрировали при пониженном давлении. Это обеспечивало получение 2-хлор-4-фтор-5-[5-этил-3-метил-2,6-диоксо-4-(трифторметил)-3,6-дигидропиримидин-1(2H)-ил]бензолсульфонилхлорида (54% от теоретического), который применяли на следующей стадии без дополнительной очистки.

К исходной загрузке в виде 2-хлор-4-фтор-5-[5-этил-3-метил-2,6-диоксо-4-(трифторметил)-3,6-дигидропиримидин-1(2H)-ил]сульфонилхлорида (1 экв.) в круглодонной колбе последовательно добавляли хлористоводородную кислоту (2 мл/ммоль), уксусную кислоту (2,5 мл/ммоль) и дигидрат дихлорида олова (3 экв.).

Полученную реакционную смесь перемешивали при температуре, составляющей 100°C, в течение 10 ч., после охлаждения до комнатной температуры добавляли в смесь воды со льдом и тщательно экстрагировали дихлорметаном. Объединенные органические фазы высушивали над сульфатом натрия, фильтровали и концентрировали при пониженном давлении.

Конечная очистка посредством колоночной хроматографии обеспечивала получение 3-(4-хлор-2-фтор-5-сульфанилфенил)-5-этил-1-метил-6-(трифторметил)пиримидин-2,4(1H,3H)-диона (84% от теоретического) в виде бесцветного твердого вещества. 2-Хлорпропанкарбоновую кислоту (567 мг, 5,23 ммоль) растворяли в абс. ацетонитриле в атмосфере аргона в нагретой круглодонной колбе и затем добавляли карбонат цезия (3,41 г, 10,45 ммоль) и 3-(4-хлор-2-фтор-5-сульфанилфенил)-5-этил-1-метил-6-(трифторметил)пиримидин-2,4(1H,3H)-дион (2,0 г, 5,23 ммоль).

Полученную реакционную смесь перемешивали при температуре, составляющей 50°C, в течение 1 ч. и после охлаждения до комнатной температуры смешивали с водой и дихлорметаном и тщательно экстрагировали. Водную фазу затем подкисляли с помощью 10% хлористоводородной кислоты и снова несколько раз экстрагировали дихлорметаном. Объединенные органические фазы высушивали над сульфатом натрия, фильтровали и концентрировали при пониженном давлении.

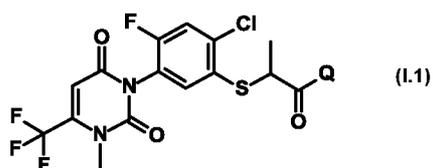
Затем неочищенный продукт очищали посредством колоночной хроматографии (градиент этилацетат/гептан) и получали 2-({2-хлор-5-[5-этил-3-метил-2,6-диоксо-4-(трифторметил)-3,6-дигидропиримидин-1(2H)-ил]-4-фторфенил}сульфанил)пропановую кислоту (1,30 г, 54% от теоретического) в виде бесцветного твердого вещества. ¹H-ЯМР (CDCl₃ δ, ppm) 7,54 (d, 1H), 7,39 (d, 1H), 3,90-3,83 (m, 1H), 3,54 (s, 3H), 2,72-2,69 (m, 2H), 1,55 (d, 3H), 1,13 (t, 3H). 2-({2-Хлор-5-[5-этил-3-метил-2,6-диоксо-4-(трифторметил)-3,6-дигидропиримидин-1(2H)-ил]-4-фторфенил}сульфанил)пропановую кислоту (110 мг, 0,24 ммоль), 1-гидрокси-1H-бензотриазол (42 мг, 0,31 ммоль) и 1-(3-диметиламинопропил)-3-этилкарбодиимида гидрохлорид (60 мг, 0,31 ммоль) растворяли в абс. дихлорметане в нагретой круглодонной колбе в атмосфере аргона и после перемешивания при комнатной температуре в течение 5 минут добавляли метил-3-гидроксипропаноат (33 мг, 0,31 ммоль) и триэтиламин (0,08 мл, 0,61 ммоль).

Полученную реакционную смесь перемешивали при комнатной температуре в течение 6 ч., затем смешивали с водой и дихлорметаном и тщательно экстрагировали дихлорметаном. Объединенные органические фазы высушивали над сульфатом натрия, фильтровали и концентрировали при пониженном давлении.

Затем неочищенный продукт очищали посредством колоночной хроматографии (градиент этилацетат/гептан) и получали 3-метокси-3-оксопропил-2-({2-хлор-5-[5-этил-3-метил-2,6-диоксо-4-(трифторметил)-3,6-дигидропиримидин-1(2H)-ил]-4-фторфенил}сульфанил)пропаноат (61 мг, 45% от теоретического) в виде высоковязкого

бесцветного масла. ^1H -ЯМР (CDCl_3 δ , ppm) 7,49 (d, 1H), 7,37 (d, 1H), 4,37-4,25 (m, 2H), 3,92-3,87 (m, 1H), 3,67 (s, 3H), 3,54 (s, 3H), 2,74-2,68 (m, 2H), 2,60-2,53 (m, 2H), 1,51 (t, 3H), 1,12 (t, 3H).

- 5 Аналогично вышеуказанным примерам получения, которые были указаны в соответствующем пункте, и учитывая общие подробности получения замещенных тиофенилурацилов, получали соединения, указанные ниже. Если структурный элемент в таблице 1 определяется структурной формулой, содержащей пунктирную линию, данная пунктирная линия означает, что группа, о которой идет речь, присоединена к
- 10 остальной части молекулы в этом положении. Если структурный элемент в таблице 1 определяется структурной формулой, содержащей стрелку, стрелка представляет собой связь соответствующей группы Q с карбонильной группой в общей формуле (I).



- 15 Таблица I.1. Предпочтительные соединения формулы (I.1) представляют собой соединения I.1-1 - I.1-300, в которых Q имеет определения из таблицы 1, которые приведены в соответствующей строке. Соединения I.1-1 - I.1-300 из таблицы I.1, таким образом, определены значением соответствующих записей № 1-300 для Q из таблицы 1.

20

Таблица 1

№	Q
1	Q-1
2	Q-2
3	Q-3
4	Q-4
5	Q-5
6	Q-6
7	Q-7
8	Q-8

№	Q
9	Q-9
10	Q-10
11	Q-11
12	Q-12
13	Q-13
14	Q-14
15	Q-15
16	Q-16
17	Q-17
18	Q-18
19	Q-19
20	Q-20
21	Q-21
22	Q-22
23	Q-23
24	Q-24
25	Q-25
26	Q-26
27	Q-27
28	Q-28
29	Q-29
30	Q-30
31	Q-31
32	Q-32
33	Q-33
34	Q-34
35	Q-35
36	Q-36
37	Q-37
38	Q-38
39	Q-39

№	Q
40	Q-40
41	Q-41
42	Q-42
43	Q-43
44	Q-44
45	Q-45
46	Q-46
47	Q-47
48	Q-48
49	Q-49
50	Q-50
51	Q-51
52	Q-52
53	Q-53
54	Q-54
55	Q-55
56	Q-56
57	Q-57
58	Q-58
59	Q-59
60	Q-60
61	Q-61
62	Q-62
63	Q-63
64	Q-64
65	Q-65
66	Q-66
67	Q-67
68	Q-68
69	Q-69
70	Q-70

№	Q
71	Q-71
72	Q-72
73	Q-73
74	Q-74
75	Q-75
76	Q-76
77	Q-77
78	Q-78
79	Q-79
80	Q-80
81	Q-81
82	Q-82
83	Q-83
84	Q-84
85	Q-85
86	Q-86
87	Q-87
88	Q-88
89	Q-89
90	Q-90
91	Q-91
92	Q-92
93	Q-93
94	Q-94
95	Q-95
96	Q-96
97	Q-97
98	Q-98
99	Q-99
100	Q-100
101	Q-101

№	Q
102	Q-102
103	Q-103
104	Q-104
105	Q-105
106	Q-106
107	Q-107
108	Q-108
109	Q-109
110	Q-110
111	Q-111
112	Q-112
113	Q-113
114	Q-114
115	Q-115
116	Q-116
117	Q-117
118	Q-118
119	Q-119
120	Q-120
121	Q-121
122	Q-122
123	Q-123
124	Q-124
125	Q-125
126	Q-126
127	Q-127
128	Q-128
129	Q-129
130	Q-130
131	Q-131
132	Q-132

№	Q
133	Q-133
134	Q-134
135	Q-135
136	Q-136
137	Q-137
138	Q-138
139	Q-139
140	Q-140
141	Q-141
142	Q-142
143	Q-143
144	Q-144
145	Q-145
146	Q-146
147	Q-147
148	Q-148
149	Q-149
150	Q-150
151	Q-151
152	Q-152
153	Q-153
154	Q-154
155	Q-155
156	Q-156
157	Q-157
158	Q-158
159	Q-159
160	Q-160
161	Q-161
162	Q-162
163	Q-163

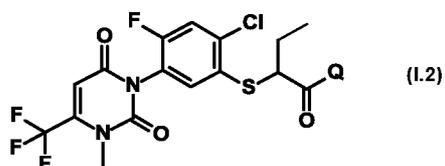
№	Q
164	Q-164
165	Q-165
166	Q-166
167	Q-167
168	Q-168
169	Q-169
170	Q-170
171	Q-171
172	Q-172
173	Q-173
174	Q-174
175	Q-175
176	Q-176
177	Q-177
178	Q-178
179	Q-179
180	Q-180
181	Q-181
182	Q-182
183	Q-183
184	Q-184
185	Q-185
186	Q-186
187	Q-187
188	Q-188
189	Q-189
190	Q-190
191	Q-191
192	Q-192
193	Q-193
194	Q-194

№	Q
195	Q-195
196	Q-196
197	Q-197
198	Q-198
199	Q-199
200	Q-200
201	Q-201
202	Q-202
203	Q-203
204	Q-204
205	Q-205
206	Q-206
207	Q-207
208	Q-208
209	Q-209
210	Q-210
211	Q-211
212	Q-212
213	Q-213
214	Q-214
215	Q-215
216	Q-216
217	Q-217
218	Q-218
219	Q-219
220	Q-220
221	Q-221
222	Q-222
223	Q-223
224	Q-224
225	Q-225

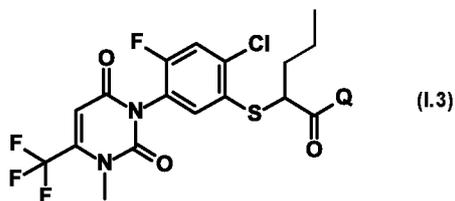
№	Q
226	Q-226
227	Q-227
228	Q-228
229	Q-229
230	Q-230
231	Q-231
232	Q-232
233	Q-233
234	Q-234
235	Q-235
236	Q-236
237	Q-237
238	Q-238
239	Q-239
240	Q-240
241	Q-241
242	Q-242
243	Q-243
244	Q-244
245	Q-245
246	Q-246
247	Q-247
248	Q-248
249	Q-249
250	Q-250
251	Q-251
252	Q-252
253	Q-253
254	Q-254
255	Q-255
256	Q-256

№	Q
257	Q-257
258	Q-258
259	Q-259
260	Q-260
261	Q-261
262	Q-262
263	Q-263
264	Q-264
265	Q-265
266	Q-266
267	Q-267
268	Q-268
269	Q-269
270	Q-270
271	Q-271
272	Q-272
273	Q-273
274	Q-274
275	Q-275
276	Q-276
277	Q-277
278	Q-278
279	Q-279
280	Q-280
281	Q-281
282	Q-282
283	Q-283
284	Q-284
285	Q-285
286	Q-286
287	Q-287

№	Q
288	Q-288
289	Q-289
290	Q-290
291	Q-291
292	Q-292
293	Q-293
294	Q-294
295	Q-295
296	Q-296
297	Q-297
298	Q-298
299	Q-299
300	Q-300



5 Таблица I.2. Предпочтительные соединения формулы (I.2) представляют собой соединения I.2-1 - I.2-300, в которых Q имеет определения из таблицы 1, которые приведены в соответствующей строке. Соединения I.2-1 - I.2-300 из таблицы I.2, таким образом, определены значением соответствующих записей № 1-300 для Q из таблицы 1.



10 Таблица I.3. Предпочтительные соединения формулы (I.3) представляют собой соединения I.3-1 - I.3-300, в которых Q имеет определения из таблицы 1, которые приведены в соответствующей строке. Соединения I.3-1 - I.3-300 из таблицы I.3, таким образом, определены значением соответствующих записей № 1-300 для Q из таблицы 1.

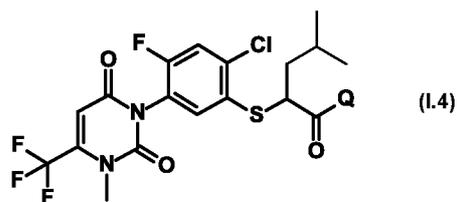


Таблица I.4. Предпочтительные соединения формулы (I.4) представляют собой соединения I.4-1 - I.4-300, в которых Q имеет определения из таблицы 1, которые
 5 приведены в соответствующей строке. Соединения I.4-1 - I.4-300 из таблицы I.4, таким образом, определены значением соответствующих записей № 1-300 для Q из таблицы 1.

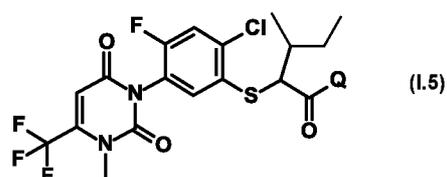


Таблица I.5. Предпочтительные соединения формулы (I.5) представляют собой соединения I.5-1 - I.5-300, в которых Q имеет определения из таблицы 1, которые
 10 приведены в соответствующей строке. Соединения I.5-1 - I.5-300 из таблицы I.5, таким образом, определены значением соответствующих записей № 1-300 для Q из таблицы 1.

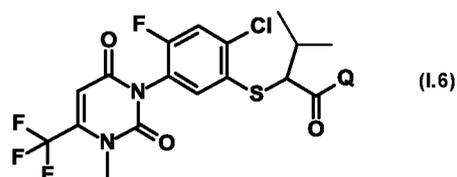


Таблица I.6. Предпочтительные соединения формулы (I.6) представляют собой соединения I.6-1 - I.6-300, в которых Q имеет определения из таблицы 1, которые
 15 приведены в соответствующей строке. Соединения I.6-1 - I.6-300 из таблицы I.6, таким образом, определены значением соответствующих записей № 1-300 для Q из таблицы 1.

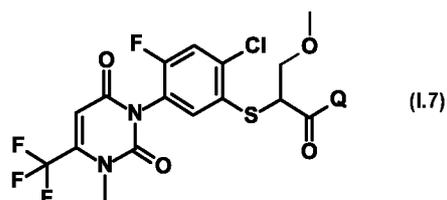
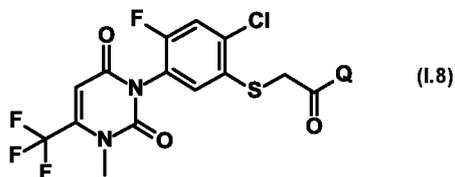


Таблица I.7. Предпочтительные соединения формулы (I.7) представляют собой соединения I.7-1 - I.7-300, в которых Q имеет определения из таблицы 1, которые приведены в соответствующей строке. Соединения I.7-1 - I.7-300 из таблицы I.7, таким образом, определены значением соответствующих записей № 1-300 для Q из таблицы 1.



5

Таблица I.8. Предпочтительные соединения формулы (I.8) представляют собой соединения I.8-1 - I.8-300, в которых Q имеет определения из таблицы 1, которые приведены в соответствующей строке. Соединения I.8-1 - I.8-300 из таблицы I.8, таким образом, определены значением соответствующих записей № 1-300 для Q из таблицы 1.

10

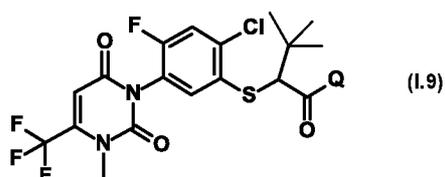


Таблица I.9. Предпочтительные соединения формулы (I.9) представляют собой соединения I.9-1 - I.9-300, в которых Q имеет определения из таблицы 1, которые приведены в соответствующей строке. Соединения I.9-1 - I.9-300 из таблицы I.9, таким образом, определены значением соответствующих записей № 1-300 для Q из таблицы 1.

15

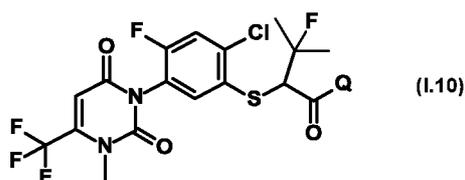
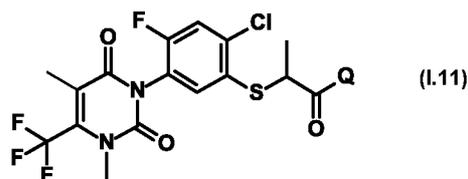
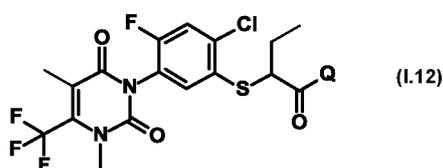


Таблица I.10. Предпочтительные соединения формулы (I.10) представляют собой соединения I.10-1 - I.10-300, в которых Q имеет определения из таблицы 1, которые приведены в соответствующей строке. Соединения I.10-1 - I.10-300 из таблицы I.10, таким образом, определены значением соответствующих записей № 1-300 для Q из таблицы 1.

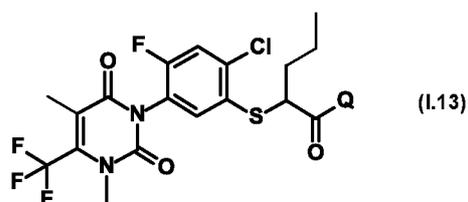
20



5 Таблица I.11. Предпочтительные соединения формулы (I.11) представляют собой соединения I.11-1 - I.11-300, в которых Q имеет определения из таблицы 1, которые приведены в соответствующей строке. Соединения I.11-1 - I.11-300 из таблицы I.11, таким образом, определены значением соответствующих записей № 1-300 для Q из таблицы 1.



10 Таблица I.12. Предпочтительные соединения формулы (I.12) представляют собой соединения I.12-1 - I.12-300, в которых Q имеет определения из таблицы 1, которые приведены в соответствующей строке. Соединения I.12-1 - I.12-300 из таблицы I.12, таким образом, определены значением соответствующих записей № 1-300 для Q из таблицы 1.



15
20 Таблица I.13. Предпочтительные соединения формулы (I.13) представляют собой соединения I.13-1 - I.13-300, в которых Q имеет определения из таблицы 1, которые приведены в соответствующей строке. Соединения I.13-1 - I.13-300 из таблицы I.13, таким образом, определены значением соответствующих записей № 1-300 для Q из таблицы 1.

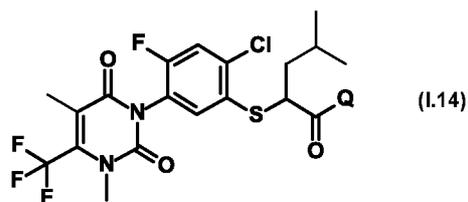
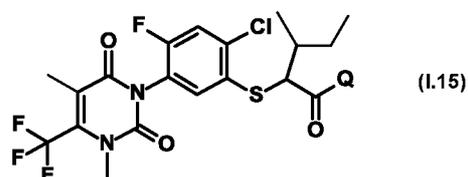
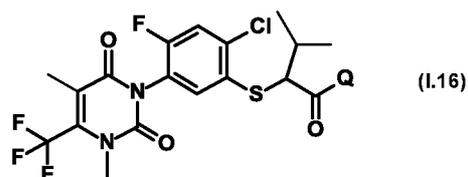


Таблица I.14. Предпочтительные соединения формулы (I.14) представляют собой соединения I.14-1 - I.14-300, в которых Q имеет определения из таблицы 1, которые
 5 приведены в соответствующей строке. Соединения I.14-1 - I.14-300 из таблицы I.14, таким образом, определены значением соответствующих записей № 1-300 для Q из таблицы 1.



10 Таблица I.15. Предпочтительные соединения формулы (I.15) представляют собой соединения I.15-1 - I.15-300, в которых Q имеет определения из таблицы 1, которые приведены в соответствующей строке. Соединения I.15-1 - I.15-300 из таблицы I.15, таким образом, определены значением соответствующих записей № 1-300 для Q из
 15 таблицы 1.



20 Таблица I.16. Предпочтительные соединения формулы (I.16) представляют собой соединения I.16-1 - I.16-300, в которых Q имеет определения из таблицы 1, которые приведены в соответствующей строке. Соединения I.16-1 - I.16-300 из таблицы I.16, таким образом, определены значением соответствующих записей № 1-300 для Q из
 25 таблицы 1.

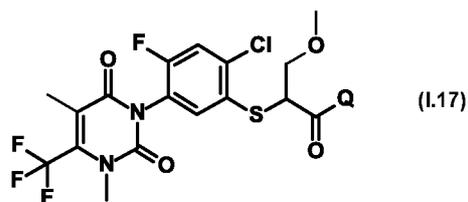
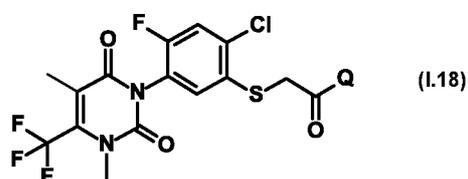
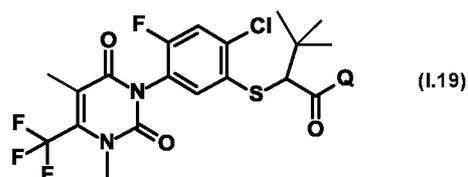


Таблица I.17. Предпочтительные соединения формулы (I.17) представляют собой соединения I.17-1 - I.17-300, в которых Q имеет определения из таблицы 1, которые
5 приведены в соответствующей строке. Соединения I.17-1 - I.17-300 из таблицы I.17, таким образом, определены значением соответствующих записей № 1-300 для Q из таблицы 1.



10 Таблица I.18. Предпочтительные соединения формулы (I.18) представляют собой соединения I.18-1 - I.18-300, в которых Q имеет определения из таблицы 1, которые приведены в соответствующей строке. Соединения I.18-1 - I.18-300 из таблицы I.18, таким образом, определены значением соответствующих записей № 1-300 для Q из
15 таблицы 1.



15 Таблица I.19. Предпочтительные соединения формулы (I.19) представляют собой соединения I.19-1 - I.19-300, в которых Q имеет определения из таблицы 1, которые приведены в соответствующей строке. Соединения I.19-1 - I.19-300 из таблицы I.19, таким образом, определены значением соответствующих записей № 1-300 для Q из
20 таблицы 1.

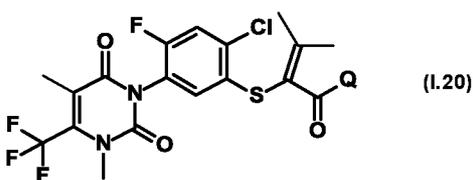


Таблица I.20. Предпочтительные соединения формулы (I.20) представляют собой соединения I.20-1 - I.20-300, в которых Q имеет определения из таблицы 1, которые приведены в соответствующей строке. Соединения I.20-1 - I.20-300 из таблицы I.20, таким образом, определены значением соответствующих записей № 1-300 для Q из

5 таблицы 1.

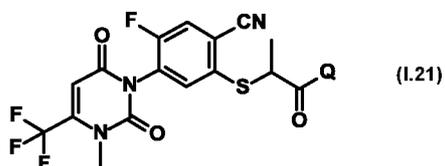


Таблица I.21. Предпочтительные соединения формулы (I.21) представляют собой соединения I.21-1 - I.21-300, в которых Q имеет определения из таблицы 1, которые приведены в соответствующей строке. Соединения I.21-1 - I.21-300 из таблицы I.21, таким образом, определены значением соответствующих записей № 1-300 для Q из

10 таблицы 1.

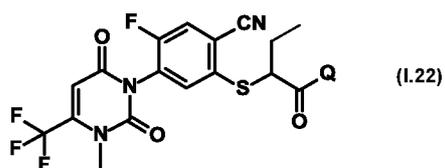


Таблица I.22. Предпочтительные соединения формулы (I.22) представляют собой соединения I.22-1 - I.22-300, в которых Q имеет определения из таблицы 1, которые приведены в соответствующей строке. Соединения I.22-1 - I.22-300 из таблицы I.22, таким образом, определены значением соответствующих записей № 1-300 для Q из

15 таблицы 1.

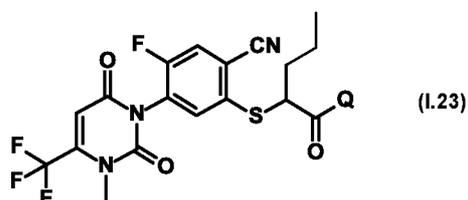
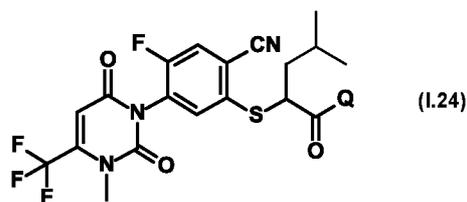


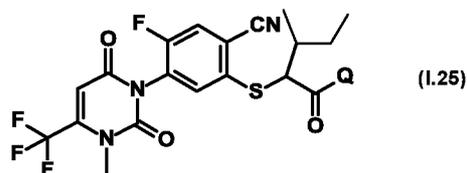
Таблица I.23. Предпочтительные соединения формулы (I.23) представляют собой соединения I.23-1 - I.23-300, в которых Q имеет определения из таблицы 1, которые приведены в соответствующей строке. Соединения I.23-1 - I.23-300 из таблицы I.23,

20

таким образом, определены значения соответствующих записей № 1-300 для Q из таблицы 1.



5 Таблица I.24. Предпочтительные соединения формулы (I.24) представляют собой соединения I.24-1 - I.24-300, в которых Q имеет определения из таблицы 1, которые приведены в соответствующей строке. Соединения I.24-1 - I.24-300 из таблицы I.24, таким образом, определены значения соответствующих записей № 1-300 для Q из таблицы 1.



10

Таблица I.25. Предпочтительные соединения формулы (I.25) представляют собой соединения I.25-1 - I.25-300, в которых Q имеет определения из таблицы 1, которые приведены в соответствующей строке. Соединения I.25-1 - I.25-300 из таблицы I.25, таким образом, определены значения соответствующих записей № 1-300 для Q из

15 таблицы 1.

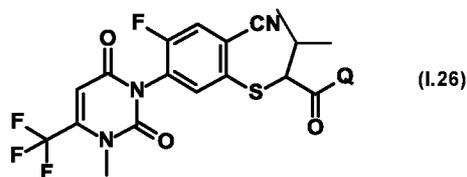


Таблица I.26. Предпочтительные соединения формулы (I.26) представляют собой

20 соединения I.26-1 - I.26-300, в которых Q имеет определения из таблицы 1, которые приведены в соответствующей строке. Соединения I.26-1 - I.26-300 из таблицы I.26, таким образом, определены значения соответствующих записей № 1-300 для Q из

таблицы 1.

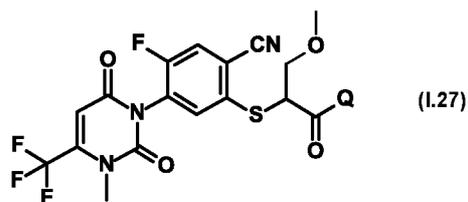
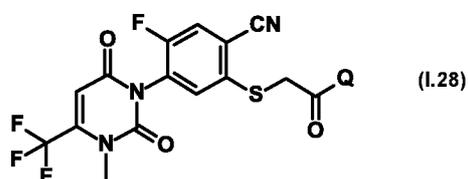
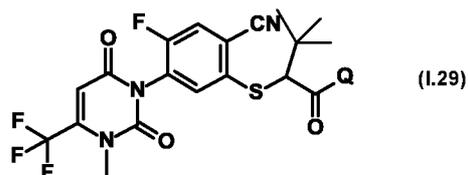


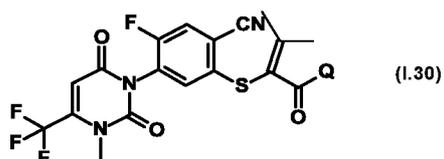
Таблица I.27. Предпочтительные соединения формулы (I.27) представляют собой соединения I.27-1 - I.27-300, в которых Q имеет определения из таблицы 1, которые
 5 приведены в соответствующей строке. Соединения I.27-1 - I.27-300 из таблицы I.27, таким образом, определены значением соответствующих записей № 1-300 для Q из таблицы 1.



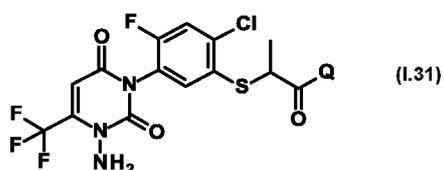
10 Таблица I.28. Предпочтительные соединения формулы (I.28) представляют собой соединения I.28-1 - I.28-300, в которых Q имеет определения из таблицы 1, которые приведены в соответствующей строке. Соединения I.28-1 - I.28-300 из таблицы I.28, таким образом, определены значением соответствующих записей № 1-300 для Q из
 15 таблицы 1.



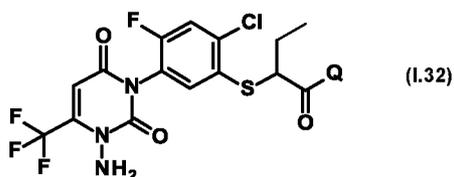
15 Таблица I.29. Предпочтительные соединения формулы (I.29) представляют собой соединения I.29-1 - I.29-300, в которых Q имеет определения из таблицы 1, которые
 20 приведены в соответствующей строке. Соединения I.29-1 - I.29-300 из таблицы I.29, таким образом, определены значением соответствующих записей № 1 - 300 для Q из
 25 таблицы 1.



5 Таблица I.30. Предпочтительные соединения формулы (I.30) представляют собой соединения I.30-1 - I.30-300, в которых Q имеет определения из таблицы 1, которые приведены в соответствующей строке. Соединения I.30-1 - I.30-300 из таблицы I.30, таким образом, определены значением соответствующих записей № 1-300 для Q из таблицы 1.



10 Таблица I.31. Предпочтительные соединения формулы (I.31) представляют собой соединения I.31-1 - I.31-300, в которых Q имеет определения из таблицы 1, которые приведены в соответствующей строке. Соединения I.31-1 - I.31-300 из таблицы I.31, таким образом, определены значением соответствующих записей № 1 - 300 для Q из таблицы 1.



15
20 Таблица I.32. Предпочтительные соединения формулы (I.32) представляют собой соединения I.32-1 - I.32-300, в которых Q имеет определения из таблицы 1, которые приведены в соответствующей строке. Соединения I.32-1 - I.32-300 из таблицы I.32, таким образом, определены значением соответствующих записей № 1-300 для Q из таблицы 1.

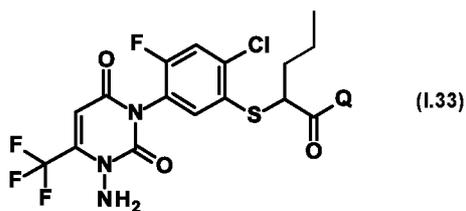
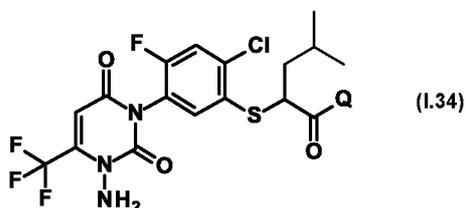
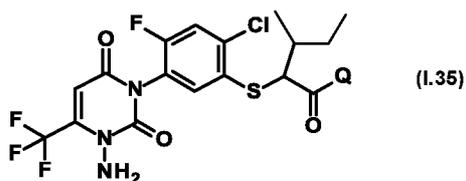


Таблица I.33. Предпочтительные соединения формулы (I.33) представляют собой соединения I.33-1 - I.33-300, в которых Q имеет определения из таблицы 1, которые
5 приведены в соответствующей строке. Соединения I.33-1 - I.33-300 из таблицы I.33, таким образом, определены значением соответствующих записей № 1-300 для Q из таблицы 1.



10 Таблица I.34. Предпочтительные соединения формулы (I.34) представляют собой соединения I.34-1 - I.34-300, в которых Q имеет определения из таблицы 1, которые приведены в соответствующей строке. Соединения I.34-1 - I.34-300 из таблицы I.34, таким образом, определены значением соответствующих записей № 1-300 для Q из
15 таблицы 1.



15 Таблица I.35. Предпочтительные соединения формулы (I.35) представляют собой соединения I.35-1 - I.35-300, в которых Q имеет определения из таблицы 1, которые приведены в соответствующей строке. Соединения I.35-1 - I.35-300 из таблицы I.35, таким образом, определены значением соответствующих записей № 1-300 для Q из
20 таблицы 1.

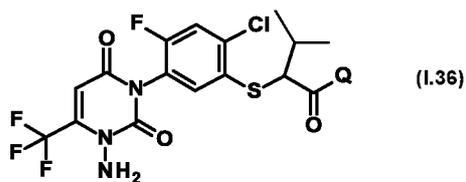
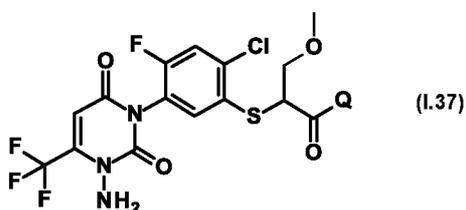
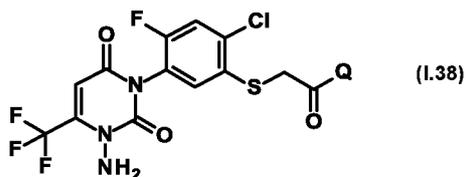


Таблица I.36. Предпочтительные соединения формулы (I.36) представляют собой соединения I.36-1 - I.36-300, в которых Q имеет определения из таблицы 1, которые
 5 приведены в соответствующей строке. Соединения I.36-1 - I.36-300 из таблицы I.36, таким образом, определены значением соответствующих записей № 1-300 для Q из таблицы 1.



10 Таблица I.37. Предпочтительные соединения формулы (I.37) представляют собой соединения I.37-1 - I.37-300, в которых Q имеет определения из таблицы 1, которые приведены в соответствующей строке. Соединения I.37-1 - I.37-300 из таблицы I.37, таким образом, определены значением соответствующих записей № 1-300 для Q из
 15 таблицы 1.



20 Таблица I.38. Предпочтительные соединения формулы (I.38) представляют собой соединения I.38-1 - I.38-300, в которых Q имеет определения из таблицы 1, которые приведены в соответствующей строке. Соединения I.38-1 - I.38-300 из таблицы I.38, таким образом, определены значением соответствующих записей № 1-300 для Q из
 25 таблицы 1.

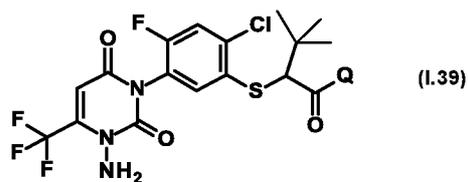
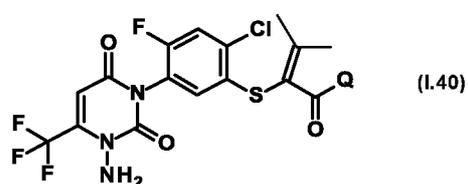


Таблица I.39. Предпочтительные соединения формулы (I.39) представляют собой соединения I.39-1 - I.39-300, в которых Q имеет определения из таблицы 1, которые
 5 приведены в соответствующей строке. Соединения I.39-1 - I.39-300 из таблицы I.39, таким образом, определены значением соответствующих записей № 1-300 для Q из таблицы 1.



10 Таблица I.40. Предпочтительные соединения формулы (I.40) представляют собой соединения I.40-1 - I.40-300, в которых Q имеет определения из таблицы 1, которые приведены в соответствующей строке. Соединения I.40-1 - I.40-300 из таблицы I.40, таким образом, определены значением соответствующих записей № 1-300 для Q из
 15 таблицы 1.

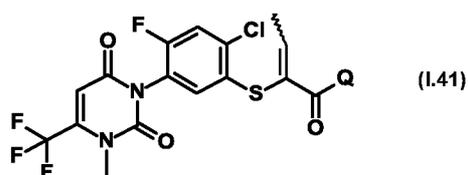


Таблица I.41. Предпочтительные соединения формулы (I.41) представляют собой соединения I.41-1 - I.41-300, в которых Q имеет определения из таблицы 1, которые
 20 приведены в соответствующей строке. Соединения I.41-1 - I.41-300 из таблицы I.41, таким образом, определены значением соответствующих записей № 1 - 300 для Q из таблицы 1.

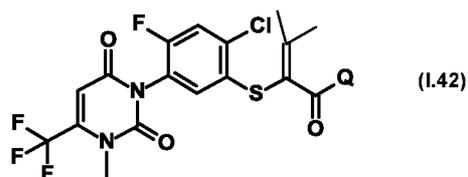
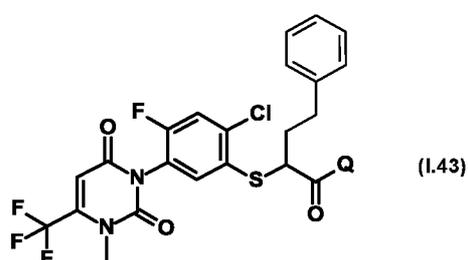
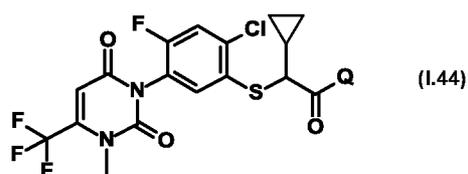


Таблица I.42. Предпочтительные соединения формулы (I.42) представляют собой соединения I.42-1 - I.42-300, в которых Q имеет определения из таблицы 1, которые
 5 приведены в соответствующей строке. Соединения I.42-1 - I.42-300 из таблицы I.42, таким образом, определены значением соответствующих записей № 1-300 для Q из таблицы 1.



10 Таблица I.43. Предпочтительные соединения формулы (I.43) представляют собой соединения I.43-1 - I.43-300, в которых Q имеет определения из таблицы 1, которые приведены в соответствующей строке. Соединения I.43-1 - I.43-300 из таблицы I.43, таким образом, определены значением соответствующих записей № 1-300 для Q из
 15 таблицы 1.



15 Таблица I.44. Предпочтительные соединения формулы (I.44) представляют собой соединения I.44-1 - I.44-300, в которых Q имеет определения из таблицы 1, которые
 20 приведены в соответствующей строке. Соединения I.44-1 - I.44-300 из таблицы I.44, таким образом, определены значением соответствующих записей № 1-300 для Q из таблицы 1.

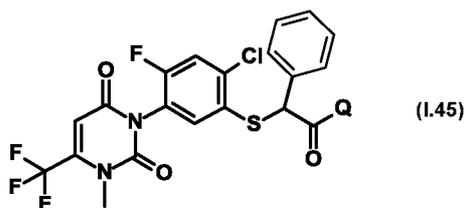


Таблица I.45. Предпочтительные соединения формулы (I.45) представляют собой соединения I.45-1 - I.45-300, в которых Q имеет определения из таблицы 1, которые приведены в соответствующей строке. Соединения I.45-1 - I.45-300 из таблицы I.45, таким образом, определены значением соответствующих записей № 1 - 300 для Q из

5 таблицы 1.

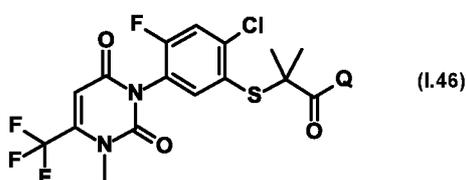


Таблица I.46. Предпочтительные соединения формулы (I.46) представляют собой соединения I.46-1 - I.46-300, в которых Q имеет определения из таблицы 1, которые приведены в соответствующей строке. Соединения I.46-1 - I.46-300 из таблицы I.46, таким образом, определены значением соответствующих записей № 1-300 для Q из

10 таблицы 1.

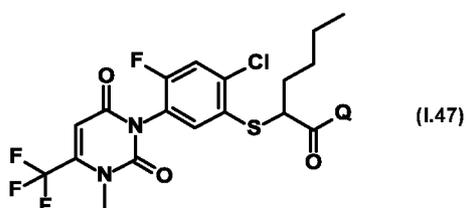


Таблица I.47. Предпочтительные соединения формулы (I.47) представляют собой соединения I.47-1 - I.47-300, в которых Q имеет определения из таблицы 1, которые приведены в соответствующей строке. Соединения I.47-1 - I.47-300 из таблицы I.47, таким образом, определены значением соответствующих записей № 1-300 для Q из

15

20 таблицы 1.

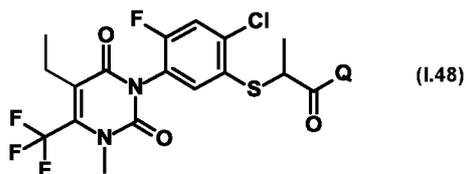
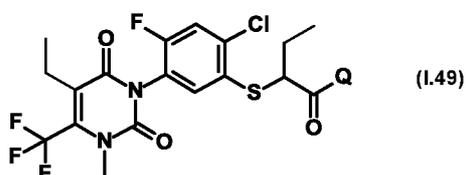
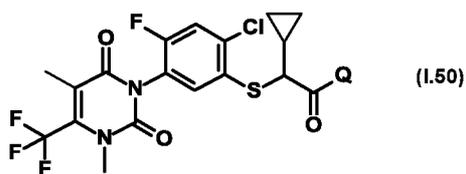


Таблица I.48. Предпочтительные соединения формулы (I.48) представляют собой соединения I.48-1 - I.48-300, в которых Q имеет определения из таблицы 1, которые
 5 приведены в соответствующей строке. Соединения I.48-1 - I.48-300 из таблицы I.48, таким образом, определены значением соответствующих записей № 1-300 для Q из таблицы 1.



10 Таблица I.49. Предпочтительные соединения формулы (I.49) представляют собой соединения I.49-1 - I.49-300, в которых Q имеет определения из таблицы 1, которые приведены в соответствующей строке. Соединения I.49-1 - I.49-300 из таблицы I.49, таким образом, определены значением соответствующих записей № 1-300 для Q из
 15 таблицы 1.



20 Таблица I.50. Предпочтительные соединения формулы (I.50) представляют собой соединения I.50-1 - I.50-300, в которых Q имеет определения из таблицы 1, которые приведены в соответствующей строке. Соединения I.50-1 - I.50-300 из таблицы I.50, таким образом, определены значением соответствующих записей № 1-300 для Q из
 25 таблицы 1.

Данные спектрального анализа выбранных примеров из таблицы

а) Традиционная интерпретация ЯМР

Пример № I.1-43:

¹H-ЯМР (CDCl₃ δ, ppm) 7,61 (m, 1H), 7,37 (d, 1H), 6,34 (s, 1H), 4,63-4,53 (m, 2H), 4,20-
5 4,13 (m, 2H), 3,98-3,91 (m, 1H), 3,55 (s, 3H), 1,57 (d, 3H), 1,25 (t, 3H).

Пример № I.1-46:

¹H-ЯМР (CDCl₃ δ, ppm) 7,59 (m, 1H), 7,39-7,27 (m, 6H), 6,32 (m, 1H), 5,18-5,11 (m, 2H),
4,70-4,59 (m, 2H), 3,98-3,91 (m, 1H), 3,53 (m, 3H), 1,55 (m, 3H).

Пример № I.1-51:

10 ¹H-ЯМР (CDCl₃ δ, ppm) 7,63 (m, 1H), 7,37 (d, 1H), 6,34 (m, 1H), 4,63-4,53 (m, 2H), 4,13-
4,09 (m, 2H), 3,96-3,93 (m, 1H), 3,55 (s, 3H), 1,62-1,55 (m, 5H), 1,39-1,33 (m, 2H), 0,92 (t,
3H).

Пример № I.1-233:

15 ¹H-ЯМР (CDCl₃ δ, ppm) 7,52 (m, 1H), 7,37 (d, 1H), 6,34 (s, 1H), 4,43-4,32 (m, 2H), 3,91-3,8
(m, 1H), 3,55 (s, 3H), 3,43-3,37 (m, 1H), 3,32-3,27 (m, 1H), 2,92 / 2,88 (s, 3H), 2,57-2,51 (m,
2H), 1,52 (d, 3H), 1,15 / 1,07 (t, 3H).

Пример № I.2-6:

20 ¹H-ЯМР (CDCl₃ δ, ppm) 7,48 (m, 1H), 7,37-7,31 (m, 6H), 6,33 (m, 1H), 5,11 (s, 2H), 4,39-
4,26 (m, 2H), 3,66 (m, 1H), 3,52 (m, 3H), 2,62-2,56 (m, 2H), 1,97-1,89 (m, 1H), 1,86-1,75
(m, 1H), 1,04 (t, 3H).

Пример № I.8-54:

¹H-ЯМР (CDCl₃ δ, ppm) 7,53 (d, 1H), 7,35 (d, 1H), 6,34 (s, 1H), 5,03-4,97 (sept, 1H), 4,59
(s, 2H), 3,74 (s, 2H), 3,55 (s, 3H), 1,24 (d, 6H).

Пример № I.8-46:

25 ¹H-ЯМР (CDCl₃ δ, ppm) 7,51 (m, 1H), 7,39-7,28 (m, 6H), 6,32 (s, 1H), 5,14 (s, 2H), 4,69 (s,
2H), 3,98-3,74 (s, 2H), 3,53 (s, 3H).

Пример № I.8-51:

^1H -ЯМР (CDCl_3 δ , ppm) 7,52 (d, 1H), 7,35 (d, 1H), 6,34 (s, 1H), 4,63 (s, 2H), 4,10 (t, 2H), 3,74 (s, 2H), 3,55 (s, 3H), 1,63-1,56 (m, 5H), 1,42-1,32 (m, 2H), 0,93 (t, 3H).

Пример № I.12-3:

5 ^1H -ЯМР (CDCl_3 δ , ppm) 7,47 (m, 1H), 7,35 (m, 1H), 4,39-4,24 (m, 2H), 4,17-4,09 (m, 2H), 3,70-3,67 (m, 1H), 3,54 (s, 3H), 2,62-2,55 (m, 2H), 2,27-2,22 (m, 3H), 1,99-1,91 (m, 1H), 1,89-1,81 (m, 1H), 1,25 (t, 3H), 1,06 (t, 3H).

Пример № I.14-3:

10 ^1H -ЯМР (CDCl_3 δ , ppm) 7,47 (m, 1H), 7,36 (m, 1H), 4,37-4,29 (m, 1H), 4,28-4,20 (m, 1H), 4,13-4,10 (q, 2H), 3,84-3,80 (m, 1H), 3,54 (s, 3H), 2,58-2,52 (m, 2H), 2,24-2,20 (m, 3H), 1,89-1,82 (m, 1H), 1,78-1,73 (m, 1H), 1,69-1,60 (m, 2H), 1,31-1,22 (m, 4H), 0,96-0,92 (m, 6H).

Пример № I.47-3:

15 ^1H -ЯМР (d_6 -DMSO δ , ppm) 7,85 (m, 1H), 7,70 (m, 1H), 6,60 (m, 1H), 4,27-4,21 (m, 1H), 4,20-4,14 (m, 1H), 4,06 (q, 2H), 3,92-3,87 (m, 1H), 3,47 (s, 3H), 2,59-2,55 (m, 2H), 1,87-1,78 (m, 1H), 1,76-1,68 (m, 1H), 1,42-1,24 (m, 4H), 1,17 (t, 3H), 0,85 (t, 3H).

Пример № I.47-6:

20 ^1H -ЯМР (CDCl_3 δ , ppm) 7,56 (m, 1H), 7,36-7,32 (m, 6H), 6,33 (m, 1H), 5,11 (s, 2H), 4,39-4,25 (m, 2H), 3,72 (m, 1H), 3,52 (m, 3H), 2,62-2,58 (m, 2H), 1,93-1,88 (m, 1H), 1,81-1,73 (m, 1H), 1,45-1,33 (m, 4H), 0,91 (t, 3H).

Перечень пиков при способе ЯМР - Данные ^1H ЯМР в отношении выбранных примеров указаны в виде перечней пиков ^1H ЯМР. Для каждого пика сигнала приведены сначала значение δ в ppm и затем интенсивность сигнала в круглых скобках. Пары чисел значение δ /интенсивность сигнала для пиков отличающихся сигналов приведены с отделением друг от друга посредством точки с запятой.

Перечень пиков примера, следовательно, принимает следующий вид: δ_1 (интенсивность $_1$); δ_2 (интенсивность $_2$);.....; δ_i (интенсивность $_i$);.....; δ_n

(интенсивность_n). Интенсивность отчетливых сигналов коррелирует с высотой сигналов в распечатанном примере ЯМР-спектра в см и демонстрирует реальные соотношения значений интенсивности сигналов. В случае широких сигналов может быть показано несколько пиков или центр сигнала и его относительная интенсивность в сравнении с наиболее интенсивным сигналом в спектре.

Для калибровки химического сдвига ¹H ЯМР-спектров авторы настоящего изобретения применяли тетраметилсилан и/или химический сдвиг растворителя, в частности в случае спектров, которые измеряли в DMSO. Следовательно, в перечнях пиков ЯМР может присутствовать пик тетраметилсилана, но это не обязательно.

10 Перечни пиков ¹H ЯМР подобны традиционным распечаткам результатов ¹H ЯМР и, таким образом, обычно содержат все пики, перечисленные в традиционной интерпретации ЯМР.

Кроме того, подобно традиционным распечаткам результатов ¹H ЯМР они могут демонстрировать сигналы растворителя, сигналы стереоизомеров целевых соединений, 15 которые таким же образом представлены в настоящем изобретении, и/или пиков примесей. При предоставлении информации о сигналах соединений в дельта-диапазоне для растворителей и/или воды приведенные перечни пиков ¹H ЯМР демонстрируют пики стандартных растворителей, например пики DMSO в DMSO-D₆ и пик воды, которые обычно характеризуются в среднем высокой интенсивностью. Пики 20 стереоизомеров целевых соединений и/или пики примесей обычно характеризуются в среднем более низкой интенсивностью, чем пики целевых соединений (например, с чистотой > 90%).

Такие стереоизомеры и/или примеси могут быть типичными для конкретного способа получения. Их пики, таким образом, могут способствовать идентификации 25 воспроизведения представленного способа получения с помощью "характеристических свойств побочных продуктов". Эксперт, который рассчитывает пики целевых соединений посредством известных методов (MestreC, моделирование ACD, или с применением эмпирически оцененных ожидаемых значений), может выделить пики целевых соединений при необходимости, необязательно с применением 30 дополнительных фильтров в отношении интенсивности. Такое выделение будет подобно отбору значимых пиков в традиционной интерпретации ¹H-ЯМР.

Дополнительные подробности для перечней пиков ¹H ЯМР можно найти в Research Disclosure Database № 564025.

Пример № I.1-1:

^1H -ЯМР (400 МГц, CDCl_3 , δ , ppm) 7,5183 (3,8); 7,4518 (5,2); 7,4451 (5,5); 7,4331 (5,2);
 7,4266 (5,5); 7,3877 (5,3); 7,3802 (5,6); 7,3647 (5,4); 7,3574 (5,8); 7,3089 (3,1); 7,2966
 5 (1,7); 7,2594 (648,9); 7,2081 (1,9); 6,9953 (3,5); 6,4114 (10,7); 5,2986 (13,6); 4,4561 (1,0);
 4,4428 (1,1); 4,4391 (1,3); 4,4283 (2,6); 4,4157 (2,3); 4,3991 (2,7); 4,3848 (2,0); 4,3717
 (1,5); 4,3320 (1,5); 4,3188 (2,4); 4,3120 (1,7); 4,3038 (2,4); 4,2998 (2,2); 4,2958 (1,8);
 4,2902 (1,9); 4,2840 (2,6); 4,2715 (1,5); 4,2561 (1,0); 3,9480 (1,3); 3,9424 (1,4); 3,9298
 (4,3); 3,9245 (4,4); 3,9117 (4,2); 3,9064 (4,3); 3,8938 (1,4); 3,8883 (1,3); 3,5810 (13,9);
 3,5780 (15,6); 3,5735 (16,0); 3,5705 (14,1); 2,5391 (5,6); 2,5241 (9,8); 2,5174 (3,5); 2,5104
 10 (4,4); 2,0054 (1,3); 1,5698 (18,9); 1,5676 (18,0); 1,5516 (18,5); 1,5495 (17,3); 0,1462 (1,0);
 0,0494 (1,1); 0,0079 (8,6); -0,0002 (238,4); -0,0084 (6,9); -0,0515 (0,7); -0,1495 (0,9)

Пример № I.1-2:

^1H -ЯМР (400 МГц, CDCl_3 , δ , ppm) 7,4907 (0,6); 7,4847 (0,7); 7,4719 (0,7); 7,4659 (0,7);
 15 7,3814 (0,7); 7,3777 (0,7); 7,3587 (0,7); 7,3549 (0,7); 7,2595 (75,2); 6,3512 (1,2); 6,3475
 (1,2); 4,2934 (0,7); 3,8837 (1,0); 3,8658 (1,0); 3,6668 (6,2); 3,5515 (3,0); 3,5489 (3,0);
 2,5821 (0,6); 2,5665 (1,0); 2,5548 (0,7); 2,5517 (0,7); 1,5327 (16,0); 1,5232 (3,7); 1,5053
 (3,6); 1,3686 (0,7); 0,0078 (0,9); -0,0002 (26,8); -0,0085 (0,8)

20 Пример № I.1-3:

^1H -ЯМР (400 МГц, CDCl_3 , δ , ppm) 7,5184 (2,3); 7,4974 (3,4); 7,4908 (3,6); 7,4786 (3,5);
 7,4720 (3,5); 7,3800 (3,7); 7,3760 (3,7); 7,3572 (3,8); 7,3532 (3,7); 7,2914 (1,0); 7,2841
 (0,8); 7,2595 (404,0); 6,9955 (2,3); 6,3497 (5,6); 6,3444 (5,7); 4,3686 (0,5); 4,3513 (0,7);
 4,3409 (1,5); 4,3340 (1,5); 4,3262 (1,6); 4,3237 (1,9); 4,3190 (1,7); 4,3162 (2,0); 4,3130
 25 (1,7); 4,3092 (2,6); 4,3012 (1,8); 4,2976 (2,5); 4,2944 (2,7); 4,2819 (2,0); 4,2783 (1,6);
 4,2665 (1,0); 4,2542 (0,5); 4,1591 (0,7); 4,1509 (2,2); 4,1487 (2,3); 4,1412 (0,8); 4,1331
 (6,4); 4,1308 (6,6); 4,1152 (6,5); 4,1129 (6,6); 4,0974 (2,2); 4,0951 (2,3); 3,8988 (1,3);
 3,8809 (4,4); 3,8630 (4,4); 3,8452 (1,3); 3,5504 (15,3); 3,5475 (15,8); 2,6517 (0,5); 2,5959
 (0,7); 2,5805 (0,6); 2,5704 (3,0); 2,5552 (5,2); 2,5447 (2,1); 2,5415 (3,8); 2,5393 (4,7);
 30 2,5272 (1,7); 2,5239 (1,6); 2,5005 (0,5); 2,0331 (1,0); 2,0277 (1,2); 1,5691 (1,8); 1,5531
 (1,8); 1,5223 (20,8); 1,5044 (20,3); 1,2744 (0,8); 1,2652 (7,8); 1,2634 (8,0); 1,2565 (1,8);
 1,2473 (15,5); 1,2455 (16,0); 1,2388 (1,2); 1,2295 (7,5); 1,2277 (7,6); 0,3308 (0,7); 0,2375
 (0,5); 0,1574 (0,7); 0,1459 (0,6); 0,0079 (5,2); -0,0002 (177,4); -0,0085 (5,4); -0,1495 (0,7)

Пример № I.1-5:

^1H -ЯМР (400 МГц, CDCl_3 , δ , ppm) 7,5186 (1,7); 7,5125 (3,7); 7,5068 (3,8); 7,4938 (3,7);
 7,4880 (3,8); 7,3787 (3,8); 7,3750 (4,0); 7,3559 (3,8); 7,3522 (4,0); 7,2861 (0,6); 7,2597
 5 (283,3); 6,9957 (1,6); 6,3505 (5,9); 6,3439 (6,1); 5,2986 (3,6); 4,3112 (0,7); 4,3083 (0,6);
 4,3026 (1,5); 4,2984 (1,8); 4,2932 (0,7); 4,2877 (1,9); 4,2839 (3,7); 4,2807 (2,4); 4,2779
 (1,8); 4,2689 (3,3); 4,2624 (2,8); 4,2562 (0,8); 4,2527 (1,7); 4,2466 (1,5); 4,2409 (0,8);
 4,2348 (0,8); 3,8956 (0,8); 3,8918 (0,9); 3,8776 (3,0); 3,8739 (3,2); 3,8597 (3,1); 3,8560
 (3,2); 3,8419 (0,9); 3,8382 (0,9); 3,5503 (15,5); 3,5477 (16,0); 2,5151 (0,8); 2,4994 (0,5);
 10 2,4896 (2,6); 2,4741 (5,8); 2,4616 (2,7); 2,4587 (4,9); 2,4443 (1,7); 2,4400 (1,6); 1,6097
 (7,4); 1,5210 (20,5); 1,5031 (20,2); 1,4472 (1,0); 1,4308 (92,0); 1,4293 (95,4); 0,0080 (3,2); -
 0,0002 (102,5); -0,0085 (2,9)

Пример № I.1-6:

^1H -ЯМР (400 МГц, CDCl_3 , δ , ppm) 7,5183 (9,6); 7,4723 (6,0); 7,4603 (6,4); 7,4536 (6,0);
 15 7,4416 (6,4); 7,3726 (3,6); 7,3599 (3,3); 7,3550 (7,3); 7,3498 (9,4); 7,3418 (23,8); 7,3352
 (29,0); 7,3271 (10,7); 7,3217 (10,2); 7,3178 (6,1); 7,2979 (2,2); 7,2931 (2,2); 7,2906 (2,5);
 7,2867 (2,9); 7,2843 (2,9); 7,2820 (3,1); 7,2772 (4,8); 7,2740 (6,0); 7,2732 (6,2); 7,2724
 (6,7); 7,2700 (9,6); 7,2684 (11,8); 7,2668 (15,6); 7,2594 (1724,6); 7,2378 (1,0); 7,2271 (1,1);
 7,2088 (1,9); 6,9954 (9,8); 6,3351 (9,3); 6,3182 (9,6); 5,2985 (9,0); 5,1439 (1,0); 5,1092
 20 (16,0); 5,0770 (0,9); 4,3853 (1,1); 4,3707 (1,2); 4,3675 (1,4); 4,3578 (3,2); 4,3529 (1,6);
 4,3483 (2,4); 4,3431 (3,5); 4,3399 (3,0); 4,3334 (2,7); 4,3304 (3,2); 4,3251 (2,6); 4,3212
 (3,2); 4,3155 (2,7); 4,3051 (6,0); 4,2895 (3,3); 4,2773 (2,4); 4,2611 (1,3); 3,8686 (1,4);
 3,8506 (5,2); 3,8354 (5,6); 3,8328 (5,6); 3,8175 (5,6); 3,7997 (1,4); 3,5307 (13,7); 3,5276
 (14,2); 3,5048 (13,0); 3,5018 (13,5); 2,6667 (0,9); 2,6514 (1,5); 2,6252 (4,9); 2,6096 (9,3);
 25 2,5942 (8,4); 2,5798 (2,6); 2,5755 (2,4); 2,5526 (1,0); 2,0049 (0,9); 1,5343 (143,3); 1,4845
 (21,0); 1,4823 (21,6); 1,4666 (20,2); 1,4644 (21,0); 1,2844 (0,8); 1,2562 (1,5); 0,1459 (2,8);
 0,1131 (1,2); 0,0334 (1,0); 0,0080 (27,7); 0,0064 (10,6); 0,0055 (11,6); 0,0047 (13,5); -0,0002
 (851,4); -0,0059 (10,4); -0,0067 (9,1); -0,0085 (24,9); -0,0115 (2,7); -0,0163 (1,1); -0,0219
 (0,9); -0,0507 (0,8); -0,1496 (2,5)

30

Пример № I.1-8:

^1H -ЯМР (400 МГц, CDCl_3 , δ , ppm) 7,4969 (1,0); 7,4900 (1,0); 7,4782 (1,0); 7,4713 (1,0);
 7,3794 (1,0); 7,3754 (1,0); 7,3566 (1,0); 7,3527 (1,0); 7,2689 (0,6); 7,2681 (0,7); 7,2673
 (0,8); 7,2665 (0,9); 7,2657 (1,1); 7,2649 (1,4); 7,2600 (86,0); 7,2535 (0,9); 7,2527 (0,8);

7,2519 (0,6); 6,3488 (1,6); 6,3429 (1,4); 4,3383 (0,5); 4,3274 (0,5); 4,3231 (0,5); 4,3126 (0,7); 4,2976 (0,6); 4,2934 (0,6); 4,2815 (0,5); 4,0445 (1,1); 4,0420 (1,1); 4,0276 (2,1); 4,0252 (2,2); 4,0107 (1,1); 4,0084 (1,1); 3,8806 (0,9); 3,8789 (0,9); 3,8628 (0,9); 3,8609 (0,9); 3,5496 (4,3); 3,5465 (4,3); 2,5810 (0,7); 2,5657 (1,3); 2,5499 (1,1); 1,6638 (0,8);
 5 1,6452 (1,5); 1,6283 (1,4); 1,6098 (0,8); 1,5759 (16,0); 1,5206 (5,4); 1,5027 (5,4); 0,9465 (2,3); 0,9379 (0,7); 0,9278 (4,6); 0,9094 (2,0); 0,0080 (1,0); -0,0002 (29,7); -0,0085 (0,8)

Пример № I.1-22:

¹H-ЯМР (400 МГц, CDCl₃, δ, ppm) 7,5185 (1,1); 7,5088 (1,3); 7,5008 (1,4); 7,4901 (1,3);
 10 7,4821 (1,4); 7,4670 (1,4); 7,4639 (1,3); 7,4486 (1,3); 7,4453 (1,4); 7,3670 (3,9); 7,3442 (3,9); 7,2596 (208,2); 6,9956 (1,1); 6,3503 (5,7); 5,2986 (1,2); 5,2520 (0,7); 5,2411 (0,8); 5,2366 (0,8); 5,2224 (0,9); 5,2065 (0,8); 5,1930 (0,5); 3,8666 (1,0); 3,8595 (1,1); 3,8486 (1,4); 3,8416 (1,2); 3,8304 (1,5); 3,8123 (1,2); 3,6461 (16,0); 3,6371 (15,2); 3,5523 (9,9); 3,5494 (9,4); 2,6192 (1,1); 2,6004 (1,0); 2,5802 (1,9); 2,5614 (1,8); 2,4937 (0,9); 2,4901
 15 (0,9); 2,4800 (0,9); 2,4767 (1,0); 2,4659 (0,8); 2,4574 (0,8); 2,4512 (1,3); 2,4422 (1,0); 2,4182 (0,5); 2,4122 (0,5); 1,7277 (1,0); 1,5155 (9,2); 1,4976 (9,2); 1,2638 (4,1); 1,2611 (4,4); 1,2480 (4,2); 1,2453 (4,3); 1,2018 (8,0); 1,1860 (7,9); 0,0080 (2,1); -0,0002 (73,2); -0,0085 (2,3)

20 Пример № I.1-23:

¹H-ЯМР (400 МГц, CDCl₃, δ, ppm) 7,5184 (3,1); 7,5151 (2,4); 7,5053 (2,4); 7,4965 (2,2);
 7,4867 (2,3); 7,4723 (2,2); 7,4696 (2,2); 7,4538 (2,2); 7,3660 (5,9); 7,3433 (5,9); 7,2871 (1,2); 7,2596 (522,0); 7,2267 (1,1); 7,2099 (1,0); 6,9956 (2,9); 6,3471 (8,1); 5,2986 (6,9); 5,2630 (1,0); 5,2486 (1,6); 5,2332 (1,6); 5,2153 (1,2); 5,2003 (0,9); 4,2038 (1,0); 4,1861
 25 (3,1); 4,1682 (3,1); 4,1503 (1,2); 4,1300 (1,4); 4,1242 (2,3); 4,1121 (4,2); 4,1063 (6,7); 4,0942 (4,4); 4,0885 (6,8); 4,0765 (1,5); 4,0707 (2,3); 3,8751 (0,6); 3,8648 (1,7); 3,8577 (1,8); 3,8466 (2,1); 3,8397 (1,9); 3,8272 (3,1); 3,8091 (2,8); 3,7913 (0,8); 3,5514 (16,0); 3,5484 (14,9); 2,9716 (0,9); 2,9634 (0,9); 2,6089 (1,0); 2,6042 (1,0); 2,5897 (1,1); 2,5853 (0,9); 2,5732 (1,7); 2,5697 (1,9); 2,5652 (1,7); 2,5568 (1,5); 2,5506 (1,7); 2,5462 (1,6);
 30 2,4759 (2,1); 2,4646 (1,7); 2,4608 (1,7); 2,4509 (1,3); 2,4429 (2,6); 2,4363 (2,0); 2,4278 (1,3); 2,4212 (2,0); 2,4119 (0,9); 2,4038 (0,9); 2,3973 (1,0); 2,3890 (0,8); 2,0051 (0,6); 1,5347 (122,2); 1,5187 (9,1); 1,5131 (13,4); 1,5008 (9,2); 1,4952 (13,0); 1,2962 (3,6); 1,2783 (7,2); 1,2604 (11,1); 1,2566 (6,1); 1,2443 (11,3); 1,2387 (14,0); 1,2277 (9,9); 1,2256 (11,0);

1,2228 (7,1); 1,2099 (4,8); 1,2078 (5,2); 1,1997 (13,0); 1,1839 (12,6); 0,1459 (0,8); 0,0079 (5,8); -0,0002 (185,2); -0,0085 (5,1); -0,1496 (0,8)

Пример № I.1-32:

5 ^1H -ЯМР (400 МГц, CDCl_3 , δ , ppm) 7,5184 (0,9); 7,4862 (2,0); 7,4739 (2,2); 7,4677 (2,0);
7,4551 (2,1); 7,3630 (2,5); 7,3400 (2,5); 7,2596 (168,8); 6,9955 (0,9); 6,3526 (3,7); 6,3485
(3,8); 4,1714 (1,6); 4,1624 (1,7); 4,1446 (2,5); 4,1357 (2,6); 4,0597 (2,6); 4,0430 (2,4);
4,0330 (1,6); 4,0163 (1,6); 3,8935 (0,7); 3,8755 (2,1); 3,8580 (2,1); 3,8401 (0,6); 3,6775
(1,6); 3,6454 (14,6); 3,6403 (15,1); 3,5530 (9,5); 2,0126 (0,8); 2,0050 (1,0); 1,5784 (3,1);
10 1,5245 (11,4); 1,5067 (11,2); 1,2079 (1,5); 1,1642 (12,2); 1,1615 (11,9); 1,1356 (16,0);
0,0079 (2,1); -0,0002 (65,2); -0,0085 (1,9)

Пример № I.1-42:

^1H -ЯМР (400 МГц, CDCl_3 , δ , ppm) 7,6230 (2,3); 7,6040 (2,4); 7,5965 (2,2); 7,5776 (2,2);
15 7,5183 (2,5); 7,3813 (2,5); 7,3759 (2,3); 7,3663 (0,6); 7,3585 (2,5); 7,3532 (2,3); 7,3094
(1,0); 7,2920 (0,5); 7,2594 (453,3); 7,2098 (0,6); 6,9954 (2,4); 6,3457 (3,4); 6,3387 (3,8);
4,7127 (0,9); 4,7018 (0,6); 4,6559 (1,0); 4,6504 (1,5); 4,6355 (0,6); 4,6102 (3,4); 4,5959
(4,0); 4,5838 (5,5); 4,5434 (1,2); 3,9686 (1,9); 3,9555 (2,0); 3,9506 (1,9); 3,9375 (1,9);
3,9327 (0,7); 3,9198 (0,6); 3,7402 (1,6); 3,7244 (1,8); 3,7084 (15,2); 3,7040 (16,0); 3,5501
20 (10,1); 3,5470 (10,8); 3,5295 (0,7); 2,0049 (0,7); 1,5911 (7,4); 1,5852 (8,0); 1,5731 (9,3);
1,5672 (12,1); 1,5606 (8,6); 0,0079 (4,7); -0,0002 (167,9); -0,0085 (5,1); -0,1495 (0,6)

Пример № 1-71:

^1H -ЯМР (400 МГц, CDCl_3 , δ , ppm) δ = 7,4932 (3,4); 7,4890 (3,3); 7,4743 (3,5); 7,4702 (3,3);
25 7,3814 (3,8); 7,3784 (3,7); 7,3587 (3,8); 7,3557 (3,6); 7,2603 (78,2); 6,3869 (5,5); 6,3770
(5,2); 5,2985 (14,1); 4,9902 (0,7); 4,9798 (0,8); 4,9724 (2,5); 4,9622 (2,8); 4,9547 (2,6);
4,9445 (2,8); 4,9370 (0,8); 4,9267 (0,8); 4,1333 (0,7); 4,1271 (0,7); 4,1154 (2,1); 4,1093
(2,1); 4,0975 (2,1); 4,0915 (2,1); 4,0797 (0,7); 4,0734 (0,6); 3,5715 (7,7); 3,5687 (7,9);
3,5579 (8,5); 3,5551 (8,8); 1,5699 (10,6); 1,5678 (10,9); 1,5520 (10,6); 1,5500 (10,8); 1,5297
30 (0,6); 1,5258 (0,5); 1,4225 (16,0); 1,4048 (15,9); 0,0080 (1,0); -0,0002 (30,3); -0,0085 (1,1)

Пример № I.1-72:

¹H-ЯМР (400 МГц, CDCl₃ δ, ppm) 7,6037 (1,5); 7,5850 (1,6); 7,5603 (1,9); 7,5572 (2,8); 7,5418 (1,9); 7,5382 (2,7); 7,5183 (2,5); 7,3846 (2,0); 7,3795 (1,9); 7,3611 (3,2); 7,3563 (3,4); 7,3379 (1,7); 7,3334 (1,8); 7,2883 (0,5); 7,2811 (0,6); 7,2803 (0,6); 7,2794 (0,6); 5 7,2787 (0,7); 7,2779 (0,8); 7,2771 (0,8); 7,2763 (0,8); 7,2755 (0,9); 7,2747 (1,0); 7,2739 (1,1); 7,2731 (1,2); 7,2723 (1,4); 7,2715 (1,5); 7,2707 (1,7); 7,2699 (2,0); 7,2691 (2,2); 7,2683 (2,5); 7,2675 (2,8); 7,2667 (3,2); 7,2659 (4,0); 7,2650 (5,0); 7,2594 (418,8); 7,2530 (3,5); 7,2506 (1,3); 7,2497 (1,0); 7,2489 (0,8); 7,2481 (0,7); 7,2473 (0,7); 7,2465 (0,6); 7,2457 (0,5); 7,2449 (0,6); 6,9954 (2,4); 6,3526 (3,0); 6,3406 (3,2); 6,3369 (2,8); 5,2983 (4,7); 5,0983 (1,5); 5,0808 (2,2); 5,0633 (1,4); 5,0227 (1,4); 5,0144 (1,4); 5,0050 (1,4); 10 4,9968 (1,5); 4,0133 (1,6); 4,0086 (1,7); 3,9954 (1,7); 3,9908 (1,8); 3,9240 (1,3); 3,9160 (1,3); 3,9059 (1,4); 3,8978 (1,4); 3,7010 (15,3); 3,6982 (16,0); 3,6824 (14,3); 3,6806 (14,0); 3,5592 (4,3); 3,5560 (4,6); 3,5451 (10,1); 1,6000 (11,6); 1,5958 (13,2); 1,5884 (8,5); 1,5776 (6,0); 1,5702 (5,7); 1,5619 (6,3); 1,5577 (6,6); 1,5440 (5,9); 1,5398 (6,2); 1,4603 (5,5); 15 1,4487 (5,7); 1,4426 (5,6); 1,4310 (5,6); 1,3514 (8,6); 1,3338 (8,7); 0,0079 (5,1); 0,0063 (1,7); 0,0054 (2,0); 0,0046 (2,6); -0,0002 (163,8); -0,0051 (2,6); -0,0060 (2,1); -0,0069 (2,0); -0,0085 (4,8)

Пример № I.1-102:

¹H-ЯМР (400 МГц, d₆-DMSO δ, ppm) 7,8549 (1,5); 7,8513 (1,4); 7,8312 (1,5); 7,8274 (1,4); 20 7,7657 (1,2); 7,7594 (1,3); 7,7466 (1,2); 7,7407 (1,3); 6,6184 (2,6); 6,6151 (2,6); 5,7526 (3,6); 4,1723 (1,0); 4,1610 (1,1); 4,1545 (1,0); 4,1433 (1,0); 3,5974 (16,0); 3,4230 (5,7); 3,3081 (219,0); 2,6738 (1,3); 2,6692 (1,8); 2,6646 (1,3); 2,5226 (9,0); 2,5179 (12,6); 2,5093 (113,1); 2,5047 (230,5); 2,5002 (313,9); 2,4956 (216,7); 2,4911 (97,9); 2,3316 (1,3); 2,3270 25 (1,9); 2,3224 (1,3); 1,4714 (6,4); 1,4537 (6,3); 1,4125 (0,8); 1,3962 (0,6); 1,3474 (0,6); 1,3294 (0,9); 1,1382 (0,7); 1,1236 (2,0); 1,1084 (1,3); 1,0813 (0,5); 0,0080 (3,6); -0,0002 (112,5); -0,0085 (3,6)

Пример № I.1-127:

¹H-ЯМР (400 МГц, CDCl₃ δ, ppm) 7,5184 (1,2); 7,4816 (1,2); 7,4687 (1,2); 7,4630 (1,2); 30 7,4502 (1,2); 7,3700 (1,2); 7,3650 (1,3); 7,3473 (1,2); 7,3423 (1,2); 7,2595 (203,8); 6,9955 (1,2); 6,3486 (3,6); 5,4824 (0,7); 5,4665 (0,5); 3,8281 (1,3); 3,8106 (1,3); 3,6485 (16,0); 3,6445 (10,0); 3,6424 (9,8); 3,5498 (5,3); 2,6900 (2,0); 2,6862 (1,2); 2,6756 (2,7); 2,6694

(1,2); 2,6590 (2,4); 2,6490 (1,1); 2,6430 (1,8); 2,6334 (1,1); 2,6241 (0,9); 1,5339 (58,3);
1,5154 (5,7); 1,4974 (5,6); 0,0080 (2,4); -0,0002 (77,4); -0,0085 (2,2)

Пример № I.1-132:

5 ^1H -ЯМР (400 МГц, CDCl_3 , δ , ppm) 7,5307 (1,7); 7,5246 (1,7); 7,5120 (1,8); 7,5059 (1,7);
7,3713 (1,8); 7,3673 (1,8); 7,3486 (1,8); 7,3446 (1,8); 7,2604 (50,2); 6,3441 (5,2); 3,9130
(1,4); 3,9058 (1,4); 3,8950 (1,4); 3,8878 (1,4); 3,6714 (16,0); 3,6698 (15,8); 3,5485 (7,3);
3,5457 (7,6); 2,0048 (3,0); 1,5546 (7,6); 1,5400 (5,4); 1,5360 (5,6); 1,5220 (5,3); 1,5180
(5,4); 1,4765 (9,1); 1,4711 (25,5); 0,0079 (0,6); -0,0002 (21,9); -0,0085 (0,7)

10

Пример № I.1-141:

^1H -ЯМР (400 МГц, CDCl_3 , δ , ppm) 7,6862 (3,7); 7,6780 (4,3); 7,6674 (4,0); 7,6592 (8,0);
7,6511 (4,1); 7,6404 (4,0); 7,6324 (4,1); 7,5185 (3,5); 7,3841 (6,6); 7,3802 (7,4); 7,3614
(6,2); 7,3575 (7,6); 7,3178 (0,7); 7,3107 (0,8); 7,3092 (2,1); 7,3020 (0,6); 7,2940 (0,8);
15 7,2908 (0,7); 7,2892 (0,5); 7,2837 (0,8); 7,2829 (0,7); 7,2820 (0,9); 7,2813 (0,8); 7,2804
(0,9); 7,2797 (1,1); 7,2789 (1,1); 7,2781 (1,1); 7,2773 (1,3); 7,2765 (1,3); 7,2757 (1,5);
7,2749 (1,6); 7,2741 (1,6); 7,2733 (1,6); 7,2725 (1,8); 7,2717 (2,0); 7,2709 (2,0); 7,2701
(2,4); 7,2693 (2,7); 7,2685 (3,1); 7,2677 (3,7); 7,2669 (4,2); 7,2661 (4,9); 7,2653 (6,0);
7,2645 (7,8); 7,2637 (10,4); 7,2596 (611,7); 7,2556 (21,9); 7,2548 (17,5); 7,2540 (14,6);
20 7,2532 (12,2); 7,2524 (10,4); 7,2516 (8,8); 7,2507 (7,7); 7,2499 (7,2); 7,2491 (6,6); 7,2483
(6,2); 7,2475 (5,7); 7,2467 (5,4); 7,2459 (5,0); 7,2451 (4,6); 7,2443 (4,4); 7,2436 (4,3);
7,2428 (3,9); 7,2419 (3,8); 7,2412 (3,7); 7,2404 (3,5); 7,2396 (3,3); 7,2387 (3,3); 7,2380
(3,2); 7,2372 (3,1); 7,2364 (3,1); 7,2356 (3,0); 7,2340 (3,2); 7,2236 (1,9); 7,2197 (1,8);
7,2149 (1,6); 7,2089 (0,9); 7,2054 (0,9); 7,1974 (0,9); 7,1588 (1,1); 7,1467 (0,6); 6,9956
25 (3,5); 6,3483 (5,7); 6,3318 (5,9); 6,3215 (7,2); 6,3171 (6,7); 5,4442 (1,8); 5,4366 (1,7);
5,4226 (2,1); 5,4192 (2,2); 5,4148 (2,2); 5,4110 (2,2); 5,3973 (2,0); 5,3892 (1,9); 5,3466
(1,8); 5,3225 (3,9); 5,3005 (4,5); 5,2985 (7,9); 5,2763 (2,2); 4,4636 (0,8); 4,4582 (1,0);
4,4500 (1,0); 4,4407 (2,0); 4,4353 (2,1); 4,4273 (2,5); 4,4221 (2,7); 4,4183 (1,6); 4,4128
(1,3); 4,4062 (3,9); 4,4003 (4,2); 4,3835 (2,1); 4,3776 (2,0); 4,2771 (1,3); 4,2704 (1,3);
30 4,2615 (2,3); 4,2589 (1,7); 4,2543 (2,6); 4,2519 (1,9); 4,2456 (2,8); 4,2427 (2,1); 4,2375
(3,3); 4,2359 (3,3); 4,2314 (1,9); 4,2289 (2,9); 4,2215 (3,0); 4,2143 (2,0); 4,2111 (1,7);
4,2062 (1,3); 4,1980 (1,4); 4,1949 (1,4); 4,0885 (0,8); 4,0760 (1,1); 4,0707 (3,3); 4,0582
(4,0); 4,0530 (3,6); 4,0404 (4,1); 4,0354 (1,1); 4,0227 (1,1); 3,8910 (0,8); 3,8728 (3,4);
3,8548 (3,7); 3,8381 (3,7); 3,8201 (3,3); 3,8021 (0,9); 3,5512 (10,9); 3,5481 (11,4); 3,5391

(10,4); 3,5358 (13,1); 3,5324 (14,0); 3,5289 (15,1); 3,5247 (12,0); 2,6357 (1,1); 2,6304 (1,1);
 2,6199 (1,3); 2,6143 (1,9); 2,6086 (1,3); 2,6038 (1,6); 2,5983 (3,0); 2,5926 (1,8); 2,5880
 (1,8); 2,5822 (2,8); 2,5764 (2,4); 2,5660 (2,0); 2,5597 (2,3); 2,5535 (1,1); 2,5490 (1,1);
 2,5434 (1,8); 2,5376 (1,2); 2,5271 (1,1); 2,5215 (0,9); 2,3182 (0,6); 2,3052 (0,6); 2,2927
 5 (1,3); 2,2865 (0,7); 2,2800 (1,4); 2,2701 (1,5); 2,2673 (1,0); 2,2609 (1,4); 2,2575 (1,5);
 2,2481 (1,3); 2,2447 (0,8); 2,2382 (1,2); 2,2322 (0,8); 2,2256 (1,2); 2,2125 (0,5); 2,1403
 (1,4); 2,1333 (1,0); 2,1240 (0,8); 2,1157 (1,9); 2,1082 (0,7); 2,0995 (1,6); 2,0931 (1,6);
 2,0834 (1,3); 2,0768 (1,7); 2,0674 (1,7); 2,0610 (1,3); 2,0520 (0,7); 2,0445 (1,4); 2,0365
 (0,6); 2,0199 (0,6); 2,0049 (0,9); 1,6350 (4,8); 1,6038 (16,0); 1,6019 (15,7); 1,5857 (15,5);
 10 1,5838 (15,0); 1,5707 (25,7); 1,5529 (24,8); 0,3309 (0,9); 0,2376 (0,8); 0,1579 (1,2); 0,1460
 (0,7); 0,1262 (0,6); 0,0494 (1,0); 0,0160 (0,6); 0,0136 (0,7); 0,0128 (0,7); 0,0120 (0,8);
 0,0112 (0,9); 0,0104 (1,1); 0,0080 (8,0); 0,0065 (2,2); 0,0057 (2,5); 0,0048 (3,1); 0,0040
 (4,2); -0,0002 (278,7); -0,0057 (7,2); -0,0066 (6,3); -0,0085 (10,3); -0,1497 (0,8)

15 Пример № I.1-142:

^1H -ЯМР (400 МГц, CDCl_3 , δ , ppm) 7,7293 (1,5); 7,7157 (1,8); 7,7104 (1,6); 7,6970 (1,7);
 7,6551 (1,7); 7,6364 (1,7); 7,5952 (1,7); 7,5768 (1,7); 7,5184 (1,1); 7,3723 (1,6); 7,3620
 (3,5); 7,3538 (1,9); 7,3496 (1,7); 7,3394 (3,6); 7,3314 (1,8); 7,2595 (203,2); 6,9955 (1,1);
 6,3441 (2,4); 6,3296 (2,8); 6,3216 (4,8); 5,3188 (3,7); 5,3141 (3,8); 5,2962 (3,1); 5,2881
 20 (3,6); 4,0857 (1,2); 4,0761 (1,4); 4,0677 (1,2); 4,0582 (1,4); 4,0321 (1,0); 4,0248 (0,9);
 4,0097 (3,1); 4,0014 (3,7); 3,9890 (4,4); 3,9724 (1,4); 3,9661 (1,3); 3,9544 (1,4); 3,9362
 (0,7); 3,9177 (1,3); 3,8996 (1,3); 3,5482 (4,2); 3,5452 (4,5); 3,5373 (4,3); 3,5342 (4,8);
 3,5300 (4,4); 3,5266 (3,8); 3,5168 (4,1); 3,5138 (4,1); 2,1271 (0,7); 2,0046 (3,7); 1,6429
 (5,1); 1,6367 (5,1); 1,6248 (5,4); 1,6186 (5,5); 1,5949 (10,6); 1,5770 (9,4); 1,1561 (8,6);
 25 1,1476 (16,0); 1,1391 (7,4); 1,0342 (11,6); 0,9934 (5,7); 0,9625 (6,7); 0,0079 (2,3); -0,0002
 (81,5); -0,0085 (2,7)

Пример № I.1-144:

^1H -ЯМР (400 МГц, d_6 -DMSO, δ , ppm) 7,9102 (3,3); 7,8956 (3,4); 7,8617 (2,7); 7,8542 (3,4);
 30 7,8374 (2,6); 7,8311 (3,1); 7,8257 (2,9); 7,7520 (3,9); 7,7333 (4,2); 7,7205 (2,4); 6,6041
 (8,2); 6,5922 (3,8); 6,2417 (1,7); 6,2371 (3,0); 6,2316 (1,9); 6,2227 (2,8); 6,2171 (1,6);
 5,7528 (9,5); 5,3130 (3,1); 5,2997 (3,2); 4,9603 (7,1); 4,9550 (11,9); 4,9506 (7,1); 4,4841
 (1,9); 4,4715 (2,0); 4,4566 (2,6); 4,4440 (3,1); 4,4263 (1,5); 4,4163 (1,8); 4,4047 (1,2);
 4,2561 (1,5); 4,2293 (1,6); 4,2109 (1,3); 4,1083 (2,2); 4,0906 (3,6); 4,0809 (2,0); 4,0731

(2,6); 4,0592 (3,8); 4,0326 (2,8); 3,4257 (20,9); 3,3084 (331,5); 3,0207 (1,8); 3,0033 (2,2);
 2,9939 (1,5); 2,9770 (2,5); 2,9569 (2,3); 2,9484 (1,4); 2,9325 (1,4); 2,6691 (5,4); 2,5220
 (41,3); 2,5085 (319,6); 2,5043 (620,2); 2,4999 (827,8); 2,4956 (601,1); 2,4914 (298,3);
 2,4311 (3,2); 2,3866 (1,2); 2,3267 (5,5); 2,2853 (1,2); 2,2675 (1,1); 2,0711 (1,1); 1,4451
 5 (16,0); 1,4329 (8,0); 1,4274 (15,2); 1,2368 (1,1); 0,0074 (5,2); -0,0002 (123,3); -0,0083 (6,7)

Пример № I.1-145:

¹H-ЯМР (400 МГц, CDCl₃ δ, ppm) 7,6028 (3,4); 7,5839 (3,5); 7,5724 (3,3); 7,5581 (3,3);
 7,5536 (3,6); 7,5393 (3,2); 7,5211 (3,5); 7,5025 (3,4); 7,4106 (6,4); 7,4029 (3,8); 7,3972
 10 (3,8); 7,3879 (6,7); 7,3801 (3,8); 7,3745 (3,6); 7,2724 (0,8); 7,2610 (127,6); 7,2117 (0,5);
 6,9970 (0,7); 6,3471 (4,6); 6,3281 (5,1); 6,3159 (5,1); 6,3001 (5,2); 4,6195 (0,6); 4,6109
 (1,1); 4,6018 (1,3); 4,5921 (1,9); 4,5852 (1,7); 4,5742 (2,3); 4,5673 (1,9); 4,5634 (1,4);
 4,5561 (2,2); 4,5491 (1,4); 4,5377 (0,9); 4,2747 (1,4); 4,2672 (1,4); 4,2539 (1,6); 4,2469
 (1,9); 4,2443 (2,3); 4,2369 (2,4); 4,2308 (3,1); 4,2234 (3,8); 4,2164 (2,3); 4,2080 (2,4);
 15 4,2005 (4,1); 4,1933 (2,3); 4,0909 (2,5); 4,0893 (2,4); 4,0808 (2,4); 4,0759 (2,8); 4,0637
 (4,2); 4,0604 (2,4); 4,0506 (1,9); 4,0456 (3,8); 4,0334 (2,9); 4,0155 (1,6); 3,9946 (0,9);
 3,9907 (1,0); 3,9856 (0,9); 3,9766 (3,0); 3,9728 (3,2); 3,9677 (2,9); 3,9589 (3,6); 3,9550
 (3,4); 3,9499 (3,0); 3,9418 (3,6); 3,9371 (1,2); 3,9321 (1,0); 3,9239 (3,1); 3,9062 (0,9);
 3,5502 (7,9); 3,5470 (9,2); 3,5419 (10,3); 3,5355 (16,0); 2,5425 (1,8); 2,5400 (2,0); 2,5373
 20 (2,1); 2,5352 (1,9); 2,5282 (1,8); 2,5253 (2,3); 2,5187 (7,0); 2,5129 (4,5); 2,5085 (2,4);
 2,5017 (3,7); 2,4971 (5,2); 2,4873 (4,0); 2,4777 (2,2); 2,4752 (2,3); 2,4650 (2,0); 2,4513
 (0,6); 2,4412 (0,5); 2,3289 (0,5); 2,3230 (0,5); 2,3104 (0,9); 2,3046 (0,9); 2,2964 (0,7);
 2,2906 (1,3); 2,2843 (0,9); 2,2787 (1,4); 2,2761 (1,4); 2,2731 (1,3); 2,2595 (1,6); 2,2571
 (1,7); 2,2434 (1,2); 2,2404 (1,4); 2,2375 (1,1); 2,2344 (1,0); 2,2273 (1,3); 2,2241 (1,1);
 25 2,2210 (1,2); 2,2080 (1,0); 2,2047 (1,1); 2,1857 (0,5); 1,8931 (0,5); 1,8883 (0,5); 1,8752
 (0,6); 1,8695 (1,0); 1,8664 (0,8); 1,8595 (0,8); 1,8535 (1,2); 1,8476 (1,2); 1,8421 (1,5);
 1,8371 (1,7); 1,8332 (1,6); 1,8293 (1,4); 1,8209 (1,6); 1,8147 (2,0); 1,8093 (1,5); 1,8032
 (1,1); 1,7969 (1,5); 1,7910 (1,2); 1,7822 (1,1); 1,7643 (0,7); 1,7582 (0,8); 1,5605 (9,7);
 1,5536 (10,2); 1,5445 (14,7); 1,5428 (20,7); 1,5358 (11,0); 1,5267 (12,6); 1,5252 (11,7);
 30 0,0079 (1,5); -0,0002 (51,8); -0,0085 (2,2)

Пример № I.1-151:

¹H-ЯМР (400 МГц, d₆-DMSO δ, ppm) 7,8607 (8,7); 7,8370 (9,0); 7,7546 (3,9); 7,7473 (4,3);
 7,7354 (4,2); 7,7282 (4,2); 7,3034 (2,4); 6,8591 (2,5); 6,6152 (15,5); 4,2586 (0,9); 4,2419

(1,8); 4,2315 (2,5); 4,2150 (4,1); 4,1987 (4,2); 4,1827 (5,0); 4,1666 (2,6); 4,1556 (2,2);
 4,1395 (1,1); 4,0575 (1,3); 4,0407 (5,4); 4,0229 (5,4); 4,0051 (1,4); 3,4363 (17,6); 3,3685
 (67,3); 2,6854 (1,5); 2,5388 (5,0); 2,5341 (7,2); 2,5254 (89,1); 2,5208 (186,5); 2,5162
 (259,7); 2,5116 (177,7); 2,5071 (79,7); 2,3991 (0,8); 2,3770 (3,0); 2,3696 (3,0); 2,3610 (6,6);
 5 2,3532 (5,8); 2,3448 (3,5); 2,3370 (3,4); 2,0878 (3,1); 1,4301 (16,0); 1,4130 (15,8); 0,0157
 (1,0)

Пример № I.1-152:

¹H-ЯМР (400 МГц, CDCl₃, δ, ppm) δ= 7,4893 (1,7); 7,4705 (1,7); 7,4609 (1,6); 7,4421 (1,6);
 10 7,3982 (1,7); 7,3909 (1,7); 7,3755 (1,7); 7,3682 (1,7); 7,2598 (84,7); 6,3803 (2,8); 6,3665
 (2,9); 4,3498 (0,6); 4,3444 (0,7); 4,3377 (0,8); 4,3287 (1,6); 4,3226 (1,4); 4,3135 (1,4);
 4,3081 (1,4); 4,2948 (1,0); 4,2888 (0,8); 4,2744 (0,6); 3,9720 (0,5); 3,9674 (1,3); 3,9543
 (1,4); 3,9495 (1,4); 3,9364 (1,3); 3,5750 (6,2); 3,5724 (6,2); 2,6723 (4,9); 2,6651 (5,2);
 2,6604 (5,1); 2,6532 (4,6); 2,2788 (0,7); 2,2710 (0,5); 2,2639 (0,9); 2,2566 (1,0); 2,2446
 15 (0,7); 2,2271 (0,7); 2,2224 (0,6); 2,2120 (0,6); 2,2071 (0,8); 2,1883 (0,6); 1,5429 (16,0);
 1,5334 (5,1); 1,5256 (5,2); 1,5155 (4,8); 1,5077 (4,9); 0,0079 (2,0); -0,0002 (48,4); -0,0085
 (1,6)

Пример № I.1-153:

¹H-ЯМР (400 МГц, CDCl₃, δ, ppm) δ= 7,5194 (0,7); 7,5029 (4,1); 7,4840 (4,2); 7,4740 (4,0);
 20 7,4552 (4,0); 7,3953 (4,3); 7,3871 (4,2); 7,3726 (4,3); 7,3644 (4,2); 7,3112 (0,8); 7,2606
 (115,1); 7,2118 (0,8); 6,9965 (0,7); 6,3739 (6,5); 6,3542 (7,0); 6,1415 (0,7); 6,0210 (0,7);
 4,3609 (0,5); 4,3541 (0,9); 4,3453 (1,4); 4,3422 (1,8); 4,3387 (0,9); 4,3316 (2,4); 4,3268
 (3,6); 4,3179 (4,4); 4,3134 (2,8); 4,3054 (2,1); 4,3030 (2,1); 4,2991 (2,0); 4,2906 (2,0);
 25 4,2864 (2,2); 4,2784 (0,7); 4,2716 (1,8); 4,2635 (0,6); 4,2592 (0,7); 4,2443 (0,6); 3,9695
 (0,9); 3,9515 (3,5); 3,9368 (3,5); 3,9336 (3,8); 3,9189 (3,4); 3,9011 (0,9); 3,5717 (16,0);
 3,2090 (1,0); 3,2042 (0,6); 3,1908 (3,3); 3,1861 (1,8); 3,1764 (3,7); 3,1725 (4,5); 3,1680
 (2,0); 3,1587 (3,3); 3,1542 (2,7); 3,1405 (1,1); 3,1361 (0,6); 2,2940 (1,2); 2,2789 (1,4);
 2,2712 (1,2); 2,2638 (0,7); 2,2564 (3,3); 2,2414 (3,5); 2,2334 (1,4); 2,2265 (1,2); 2,2179
 30 (1,6); 2,2152 (1,8); 2,2124 (1,6); 2,1998 (1,5); 2,1962 (2,0); 2,1932 (1,8); 2,1774 (1,9);
 2,1591 (0,7); 2,1557 (0,7); 2,1399 (0,5); 1,5580 (12,2); 1,5317 (11,8); 1,5237 (12,8); 1,5138
 (11,9); 1,5058 (12,3); 1,0702 (7,7); 1,0668 (7,5); 1,0520 (15,9); 1,0486 (15,3); 1,0338 (7,6);
 1,0304 (7,3); 0,0080 (2,0); -0,0002 (67,3); -0,0085 (2,6)

Пример № I.1-182:

¹H-ЯМР (400 МГц, CDCl₃, δ, ppm) 7,5411 (5,0); 7,5393 (5,0); 7,5223 (5,1); 7,5205 (5,3);
7,4091 (7,8); 7,3865 (7,8); 7,3100 (1,1); 7,2599 (286,8); 6,9959 (1,6); 6,3716 (6,9); 6,3620
(6,8); 5,9964 (1,0); 4,5648 (1,4); 4,5548 (1,1); 4,5267 (4,7); 4,5171 (5,2); 4,4983 (7,2);
5 4,4599 (1,6); 3,9302 (1,0); 3,9253 (1,0); 3,9124 (3,5); 3,9075 (3,5); 3,8946 (3,6); 3,8897
(3,5); 3,8769 (1,1); 3,8719 (1,0); 3,5669 (16,0); 2,7704 (10,9); 2,7638 (11,2); 2,7582 (11,4);
2,7516 (10,6); 2,0052 (2,4); 1,6077 (2,6); 1,5674 (19,1); 1,5496 (18,6); 0,1463 (0,6); 0,0499
(0,5); 0,0079 (4,9); -0,0002 (154,1); -0,0085 (5,1); -0,1495 (0,6)

10 Пример № I.1-183:

¹H-ЯМР (400 МГц, CDCl₃, δ, ppm) 7,5291 (4,3); 7,5279 (4,4); 7,5197 (0,9); 7,5105 (4,3);
7,5092 (4,4); 7,4048 (7,0); 7,3822 (7,1); 7,3105 (0,7); 7,2607 (111,8); 7,2269 (0,7); 7,2126
(0,8); 6,9967 (0,6); 6,3651 (6,0); 6,3584 (5,8); 6,0674 (0,9); 4,5655 (1,7); 4,5512 (1,2);
4,5276 (4,6); 4,5136 (5,1); 4,4919 (5,7); 4,4887 (5,2); 4,4544 (1,5); 4,4508 (1,8); 3,9521
15 (0,9); 3,9495 (0,9); 3,9344 (3,2); 3,9316 (3,2); 3,9166 (3,3); 3,9138 (3,2); 3,8987 (1,0);
3,8961 (1,0); 3,5655 (11,1); 3,5624 (16,0); 3,5591 (11,8); 3,3062 (1,0); 3,2920 (1,3); 3,2879
(2,4); 3,2740 (3,4); 3,2696 (2,6); 3,2604 (2,5); 3,2559 (3,4); 3,2423 (2,4); 3,2379 (1,4);
3,2242 (1,1); 3,2090 (0,5); 2,0049 (1,9); 1,6934 (1,7); 1,5692 (11,6); 1,5662 (11,8); 1,5514
(11,6); 1,5484 (11,7); 1,1152 (7,1); 1,1134 (7,2); 1,0970 (14,4); 1,0952 (14,8); 1,0788 (7,0);
20 1,0770 (7,1); 0,0080 (1,3); -0,0002 (42,3); -0,0085 (1,4)

Пример № I.1-184:

¹H-ЯМР (400 МГц, CDCl₃, δ, ppm) 7,5193 (3,8); 7,5163 (3,4); 7,5007 (3,3); 7,4977 (3,4);
7,4030 (6,1); 7,3804 (6,1); 7,2605 (97,9); 6,9965 (0,5); 6,3586 (7,2); 5,9415 (0,8); 4,5442
25 (1,7); 4,5297 (1,1); 4,5068 (4,8); 4,4926 (5,4); 4,4757 (5,5); 4,4711 (5,0); 4,4385 (1,2);
4,4336 (1,7); 4,0924 (0,7); 4,0892 (0,9); 4,0760 (1,0); 4,0727 (1,5); 4,0695 (0,8); 4,0594
(0,8); 4,0563 (1,5); 4,0530 (1,0); 4,0398 (0,9); 4,0366 (0,7); 3,9694 (1,3); 3,9516 (4,8);
3,9338 (5,0); 3,9160 (1,3); 3,5597 (13,2); 2,0044 (0,7); 1,5959 (0,7); 1,5680 (9,9); 1,5640
(10,0); 1,5502 (9,7); 1,5462 (9,7); 1,1309 (12,1); 1,1229 (9,3); 1,1131 (16,0); 1,1066 (9,3);
30 1,0957 (8,6); 0,0080 (1,1); -0,0002 (35,1); -0,0085 (1,0)

Пример № I.1-231:

¹H-ЯМР (400 МГц, CDCl₃, δ, ppm) δ= 7,5141 (2,0); 7,5116 (1,9); 7,4954 (2,0); 7,4928 (1,9);
7,3690 (2,7); 7,3463 (2,7); 7,2608 (35,2); 6,3421 (5,3); 4,4087 (0,9); 4,3984 (0,9); 4,3916

(0,5); 4,3812 (1,9); 4,3633 (1,4); 4,3542 (0,6); 4,3461 (1,3); 4,3379 (1,3); 4,3298 (0,7);
 4,3214 (0,7); 4,3188 (0,6); 4,3105 (0,6); 3,8958 (0,7); 3,8779 (2,5); 3,8601 (2,6); 3,8422
 (0,7); 3,5468 (7,9); 2,9592 (12,4); 2,9563 (12,1); 2,9134 (16,0); 2,5657 (2,1); 2,5491 (4,2);
 2,5323 (2,0); 1,5641 (4,9); 1,5242 (5,9); 1,5219 (5,9); 1,5063 (5,9); 1,5040 (5,8); 0,0080
 5 (0,7); -0,0002 (20,1); -0,0085 (0,7)

Пример № I.1-241:

¹H-ЯМР (400 МГц, CDCl₃, δ, ppm) 7,6956 (1,7); 7,6767 (1,7); 7,6665 (1,7); 7,6478 (1,6);
 7,5187 (0,7); 7,3619 (1,8); 7,3510 (1,8); 7,3391 (1,8); 7,3283 (1,7); 7,2599 (127,1); 6,9958
 10 (0,7); 6,3300 (2,7); 6,3194 (2,8); 4,7569 (0,9); 4,7365 (0,9); 4,7206 (1,6); 4,7002 (1,7);
 4,6251 (1,7); 4,6217 (1,8); 4,5889 (1,0); 4,5853 (1,0); 4,0410 (1,5); 4,0242 (1,8); 4,0065
 (1,5); 3,5419 (7,8); 3,5390 (8,1); 2,9245 (16,0); 2,9030 (7,7); 2,8991 (7,4); 1,6152 (4,8);
 1,6033 (5,2); 1,5972 (5,0); 1,5854 (5,0); 1,5475 (4,8); 1,2553 (0,6); 0,0079 (1,2); -0,0002
 (35,0); -0,0085 (1,1)

15

Пример № I.1-242:

¹H-ЯМР (400 МГц, CDCl₃, δ, ppm) 7,7081 (1,6); 7,6892 (1,6); 7,6689 (1,6); 7,6502 (1,6);
 7,5188 (0,6); 7,3631 (1,9); 7,3532 (1,7); 7,3402 (1,7); 7,3305 (1,7); 7,2599 (103,8); 6,9959
 (0,6); 6,3282 (2,7); 6,3157 (2,6); 4,8718 (0,5); 4,8324 (1,2); 4,8170 (1,4); 4,7909 (1,5);
 20 4,7871 (1,5); 4,7392 (0,6); 4,7346 (0,8); 4,0084 (1,3); 3,9904 (1,4); 3,9877 (1,4); 3,9697
 (1,4); 3,7169 (16,0); 3,7149 (14,8); 3,5422 (7,6); 3,5394 (8,1); 3,5110 (0,6); 3,1469 (1,3);
 3,1351 (13,9); 3,1168 (1,3); 2,0053 (2,2); 1,6134 (5,0); 1,6027 (5,5); 1,5954 (5,6); 1,5847
 (5,6); 1,5771 (1,7); 1,5745 (1,5); 1,5589 (1,1); 1,5565 (1,0); 0,0080 (1,7); -0,0002 (56,2); -
 0,0085 (1,9)

25

Пример № I.1-251:

¹H-ЯМР (400 МГц, CDCl₃, δ, ppm) 7,5432 (3,2); 7,5322 (3,2); 7,5247 (3,4); 7,5203 (1,2);
 7,5137 (6,0); 7,5105 (3,2); 7,4952 (3,0); 7,4918 (2,9); 7,3770 (2,8); 7,3728 (3,0); 7,3615
 (3,6); 7,3584 (3,8); 7,3542 (3,2); 7,3501 (3,2); 7,3389 (3,6); 7,3358 (3,7); 7,2727 (0,5);
 30 7,2719 (0,5); 7,2711 (0,6); 7,2703 (0,6); 7,2694 (0,8); 7,2687 (0,9); 7,2679 (1,1); 7,2670
 (1,3); 7,2662 (1,7); 7,2654 (2,3); 7,2614 (136,5); 7,2573 (4,1); 7,2565 (3,3); 7,2557 (2,8);
 7,2549 (2,4); 7,2541 (2,1); 7,2533 (1,8); 7,2525 (1,5); 7,2517 (1,4); 7,2509 (1,2); 7,2501
 (1,1); 7,2493 (1,0); 7,2485 (0,9); 7,2477 (0,9); 7,2469 (0,8); 7,2461 (0,8); 7,2453 (0,7);
 7,2445 (0,7); 7,2437 (0,7); 7,2429 (0,7); 7,2421 (0,6); 7,2413 (0,6); 7,2405 (0,6); 7,2397

(0,6); 7,2389 (0,6); 7,2357 (0,5); 7,2167 (0,5); 6,9973 (0,8); 6,3683 (4,9); 6,3574 (5,3);
 6,3518 (5,0); 6,3487 (4,8); 5,7628 (0,8); 5,6816 (1,3); 4,4584 (0,9); 4,4501 (1,0); 4,4306
 (1,4); 4,4223 (1,5); 4,4001 (0,7); 4,3914 (0,8); 4,3771 (0,9); 4,3726 (1,9); 4,3671 (1,6);
 4,3638 (2,0); 4,3575 (0,8); 4,3495 (1,6); 4,3400 (4,0); 4,3294 (4,4); 4,3181 (2,7); 4,3168
 5 (2,8); 4,3138 (1,5); 4,3053 (2,4); 4,3015 (3,3); 4,2884 (3,0); 4,2777 (0,9); 4,2740 (1,1);
 4,2605 (1,0); 4,1304 (0,8); 4,1125 (0,8); 3,8846 (0,7); 3,8665 (2,6); 3,8534 (0,8); 3,8485
 (3,0); 3,8461 (3,0); 3,8355 (2,6); 3,8327 (2,9); 3,8280 (3,0); 3,8174 (2,6); 3,8147 (2,7);
 3,8100 (1,0); 3,7994 (0,8); 3,7968 (0,8); 3,5613 (7,8); 3,5581 (12,0); 3,5549 (16,0); 3,5517
 (15,0); 3,5483 (9,2); 3,5468 (8,8); 3,5433 (7,6); 3,2906 (2,5); 3,2760 (3,4); 3,2743 (4,2);
 10 3,2703 (2,8); 3,2677 (1,9); 3,2545 (3,6); 3,2482 (1,2); 3,2287 (1,8); 3,2122 (1,6); 3,1927
 (1,2); 3,1861 (0,7); 3,1834 (0,7); 3,1726 (0,8); 3,1699 (0,9); 3,1638 (1,2); 3,1608 (1,0);
 3,1548 (0,7); 3,1442 (0,9); 3,1413 (1,0); 3,1346 (0,9); 3,1321 (0,9); 2,6354 (0,9); 2,6259
 (1,4); 2,6154 (1,7); 2,6123 (1,7); 2,6029 (1,8); 2,5925 (1,3); 2,5821 (1,0); 2,2307 (0,7);
 2,2207 (1,0); 2,2148 (1,0); 2,2109 (0,9); 2,2047 (1,2); 2,2013 (1,2); 2,1973 (1,8); 2,1917
 15 (1,2); 2,1883 (1,4); 2,1819 (1,4); 2,1779 (1,2); 2,1735 (1,4); 2,1686 (1,0); 2,1644 (1,0);
 2,1592 (0,8); 2,1547 (0,5); 2,0436 (4,0); 1,9229 (1,0); 1,9104 (0,9); 1,9064 (1,1); 1,9028
 (1,1); 1,8899 (1,9); 1,8828 (0,7); 1,8778 (0,8); 1,8698 (1,8); 1,8555 (1,4); 1,8501 (0,9);
 1,8364 (1,0); 1,5804 (6,6); 1,5558 (10,0); 1,5517 (14,7); 1,5501 (13,5); 1,5378 (10,4); 1,5349
 (12,7); 1,5336 (14,7); 1,5320 (13,6); 1,2764 (1,4); 1,2586 (3,3); 1,2407 (1,3); 0,0079 (1,9);
 20 0,0054 (0,5); 0,0046 (0,7); -0,0002 (70,0); -0,0052 (1,9); -0,0060 (1,6); -0,0069 (1,5); -0,0085
 (2,7); -0,0116 (0,7); -0,0124 (0,7); -0,0140 (0,6); -0,0148 (0,5)

Пример № I.1-254:

¹H-ЯМР (400 МГц, CDCl₃ δ, ppm) 7,5189 (1,0); 7,5114 (2,0); 7,4920 (4,5); 7,4774 (2,7);
 25 7,4726 (3,0); 7,4179 (2,4); 7,4094 (2,8); 7,4047 (2,8); 7,3952 (2,7); 7,3867 (2,8); 7,3820
 (2,8); 7,2600 (151,9); 6,9959 (0,9); 6,3656 (5,2); 6,3617 (5,0); 6,3577 (4,3); 6,3449 (4,3);
 5,6570 (1,2); 5,6283 (1,3); 5,6085 (1,0); 5,5535 (0,9); 5,2761 (1,7); 5,2615 (3,6); 5,2466
 (2,8); 5,2309 (0,7); 4,0852 (0,5); 4,0674 (1,9); 4,0543 (2,1); 4,0498 (2,1); 4,0366 (2,0);
 4,0192 (0,6); 3,9183 (0,6); 3,9010 (1,9); 3,8980 (1,8); 3,8830 (1,9); 3,8649 (0,6); 3,6418
 30 (1,0); 3,6368 (1,0); 3,6283 (1,1); 3,6235 (1,0); 3,6126 (1,3); 3,6077 (1,3); 3,5994 (2,4);
 3,5861 (1,5); 3,5805 (1,6); 3,5629 (14,5); 3,5540 (16,0); 3,5382 (1,6); 3,2446 (1,2); 3,2316
 (1,1); 3,2161 (1,1); 3,2023 (1,0); 3,0583 (1,4); 3,0283 (1,3); 3,0107 (1,4); 2,9816 (1,3);
 2,6486 (1,2); 2,6324 (1,3); 2,6183 (1,0); 2,6106 (1,2); 2,6026 (2,4); 2,5941 (1,3); 2,5878
 (1,6); 2,5737 (1,3); 2,5662 (1,5); 2,5572 (1,3); 2,5498 (1,3); 2,3091 (1,6); 2,2962 (1,6);

2,2619 (2,4); 2,2515 (2,4); 2,2190 (1,0); 2,2070 (0,9); 2,0045 (1,9); 1,5459 (12,2); 1,5284 (16,1); 1,5147 (10,1); -0,0002 (54,6)

Пример № I.1-255:

5 ^1H -ЯМР (400 МГц, CDCl_3 , δ , ppm) 7,5387 (3,0); 7,5194 (4,1); 7,5151 (2,9); 7,4963 (2,7); 7,4766 (3,1); 7,4721 (2,8); 7,4579 (3,3); 7,4534 (3,0); 7,4499 (3,8); 7,4256 (6,8); 7,4021 (3,7); 7,2601 (297,0); 7,2104 (1,1); 6,9961 (1,6); 6,3797 (4,2); 6,3614 (8,0); 6,3448 (5,0); 5,8476 (0,9); 5,7945 (1,7); 5,7683 (0,9); 4,1754 (1,3); 4,1720 (1,4); 4,1658 (1,5); 4,1619 (1,6); 4,1475 (1,6); 4,1444 (1,8); 4,1379 (1,7); 4,1343 (1,8); 4,0557 (1,1); 4,0475 (1,1);

10 4,0268 (2,4); 4,0192 (3,4); 4,0023 (5,7); 3,9981 (2,7); 3,9899 (2,2); 3,9846 (5,7); 3,9806 (2,7); 3,9669 (1,7); 3,9628 (2,4); 3,9451 (0,6); 3,8742 (1,7); 3,8711 (1,4); 3,8585 (2,0); 3,8552 (1,7); 3,8459 (1,2); 3,8427 (1,1); 3,8301 (1,5); 3,8269 (1,4); 3,8040 (1,2); 3,7878 (1,7); 3,7750 (1,8); 3,7597 (3,4); 3,7471 (1,0); 3,7318 (2,2); 3,7146 (1,2); 3,7004 (1,9); 3,6932 (1,8); 3,6858 (1,8); 3,6729 (1,2); 3,5652 (7,4); 3,5622 (8,0); 3,5510 (16,0); 2,3759

15 (0,6); 2,3505 (1,9); 2,3330 (1,9); 2,3255 (1,6); 2,3082 (2,7); 2,3008 (1,3); 2,2949 (2,1); 2,2911 (2,3); 2,2880 (3,1); 2,2834 (2,9); 2,2767 (1,7); 2,2719 (3,3); 2,2700 (3,1); 2,2662 (3,1); 2,2597 (1,1); 2,2555 (1,8); 2,2498 (1,8); 2,2457 (0,8); 2,2413 (0,8); 2,2323 (1,2); 2,2288 (1,5); 2,2226 (1,1); 2,2146 (1,4); 2,2073 (1,5); 2,1976 (1,2); 2,1946 (1,3); 2,1867 (1,4); 2,1788 (1,6); 2,1749 (1,7); 2,1662 (0,7); 2,1623 (0,9); 2,1561 (1,2); 2,0048 (2,3);

20 1,8045 (0,9); 1,7920 (1,1); 1,7825 (1,2); 1,7791 (1,3); 1,7705 (1,7); 1,7625 (1,8); 1,7549 (1,5); 1,7500 (1,6); 1,7414 (1,3); 1,7331 (1,7); 1,7247 (1,1); 1,7191 (1,0); 1,7147 (1,0); 1,7011 (1,0); 1,6455 (0,6); 1,5524 (8,4); 1,5434 (11,7); 1,5400 (13,3); 1,5347 (9,3); 1,5257 (11,5); 1,5231 (12,6); 0,0080 (3,3); -0,0002 (108,7); -0,0085 (3,3)

25 Пример № I.1-293:

^1H -ЯМР (400 МГц, CDCl_3 , δ , ppm) 7,4868 (3,5); 7,4794 (3,6); 7,4683 (3,6); 7,4608 (3,6); 7,3655 (4,9); 7,3429 (5,0); 7,2717 (0,5); 7,2709 (0,6); 7,2701 (0,6); 7,2693 (0,7); 7,2685 (0,8); 7,2677 (1,0); 7,2668 (1,1); 7,2660 (1,4); 7,2652 (1,7); 7,2610 (83,8); 6,3517 (7,4); 4,1846 (2,8); 4,1835 (2,9); 4,1789 (2,4); 4,1766 (2,6); 4,1654 (6,9); 4,1586 (10,2); 4,1520 (4,8); 4,1476 (7,3); 4,1409 (7,2); 4,1298 (2,3); 4,1231 (2,4); 4,1148 (4,2); 4,0992 (3,8); 4,0878 (1,9); 4,0722 (2,1); 3,8702 (0,7); 3,8597 (0,8); 3,8522 (2,9); 3,8418 (3,0); 3,8343 (3,0); 3,8239 (3,8); 3,8160 (1,7); 3,8137 (1,7); 3,8055 (2,1); 3,7945 (2,4); 3,7842 (2,5); 3,7745 (1,9); 3,7654 (1,7); 3,7555 (0,9); 3,5597 (9,4); 3,5565 (13,4); 3,5530 (10,0); 3,4871 (1,3); 3,4804 (2,1); 3,4762 (1,1); 3,4737 (1,1); 3,4700 (1,0); 3,4595 (1,8); 3,4572 (1,9);

3,4528 (2,5); 3,4505 (2,7); 3,4464 (1,9); 3,4433 (1,6); 3,4300 (1,4); 3,4233 (1,7); 3,4192 (1,0); 3,4166 (0,8); 3,4130 (0,7); 2,0034 (1,1); 1,9935 (0,8); 1,9785 (2,0); 1,9587 (0,9); 1,9505 (1,3); 1,9448 (1,2); 1,5769 (2,3); 1,5727 (2,3); 1,5679 (2,4); 1,5505 (1,3); 1,5406 (1,5); 1,5308 (2,2); 1,5220 (13,8); 1,5209 (14,0); 1,5041 (14,7); 1,5032 (14,4); 1,4960 (1,8);
 5 1,4922 (1,4); 1,4846 (1,2); 1,4686 (1,2); 1,4574 (0,9); 1,2666 (7,4); 1,2616 (7,5); 1,2488 (15,7); 1,2439 (16,0); 1,2310 (7,1); 1,2260 (7,3); 0,0080 (1,1); 0,0048 (0,5); 0,0040 (0,7); - 0,0002 (32,9); -0,0085 (0,8)

Пример № I.2-2:

10 ^1H -ЯМР (400 МГц, CDCl_3 , δ , ppm) 7,6080 (0,6); 7,5183 (1,2); 7,4793 (1,8); 7,4715 (1,8); 7,4607 (2,0); 7,4528 (1,9); 7,3708 (2,0); 7,3670 (2,2); 7,3481 (1,9); 7,3444 (2,2); 7,2787 (0,7); 7,2594 (216,1); 7,2456 (0,6); 7,2081 (0,5); 6,9955 (1,2); 6,3517 (3,5); 6,3483 (3,5); 5,2985 (0,8); 4,3495 (0,8); 4,3427 (0,8); 4,3324 (1,1); 4,3258 (0,9); 4,3111 (1,2); 4,2965 (1,6); 4,2837 (1,0); 4,2683 (0,5); 3,7022 (0,6); 3,6932 (1,0); 3,6737 (2,0); 3,6649 (15,7);
 15 3,6635 (16,0); 3,6403 (0,5); 3,5503 (8,5); 2,5888 (1,5); 2,5804 (1,3); 2,5732 (2,7); 2,5645 (2,0); 2,5576 (1,6); 2,5478 (1,0); 1,9955 (0,5); 1,9763 (0,7); 1,9604 (1,0); 1,9422 (1,2); 1,9226 (0,8); 1,8682 (0,8); 1,8515 (1,2); 1,8332 (1,4); 1,8150 (1,0); 1,7986 (0,6); 1,6535 (1,3); 1,0666 (4,9); 1,0482 (10,7); 1,0298 (4,6); 0,0080 (2,5); -0,0002 (74,9); -0,0085 (2,3)

20 Пример № I.2-32:

^1H -ЯМР (400 МГц, CDCl_3 , δ , ppm) 7,5180 (7,0); 7,4695 (2,1); 7,4534 (2,4); 7,4346 (2,0); 7,3794 (1,0); 7,3549 (2,3); 7,3511 (2,6); 7,3322 (3,0); 7,3287 (2,9); 7,2998 (2,8); 7,2966 (3,0); 7,2918 (4,6); 7,2871 (4,9); 7,2839 (5,8); 7,2831 (5,7); 7,2814 (6,8); 7,2807 (7,0); 7,2799 (7,2); 7,2791 (7,5); 7,2783 (8,0); 7,2775 (8,2); 7,2767 (8,8); 7,2759 (9,8); 7,2751 (10,3); 7,2743 (10,8); 7,2735 (11,5); 7,2727 (12,4); 7,2719 (13,3); 7,2711 (14,6); 7,2703 (16,0); 7,2695 (17,6); 7,2687 (19,6); 7,2679 (21,6); 7,2671 (24,0); 7,2663 (27,3); 7,2591 (1212,4); 7,2558 (43,1); 7,2550 (33,0); 7,2542 (26,8); 7,2533 (23,0); 7,2525 (19,8); 7,2517 (18,2); 7,2509 (16,2); 7,2501 (14,8); 7,2493 (13,7); 7,2485 (12,7); 7,2477 (12,1); 7,2469 (11,5); 7,2462 (10,9); 7,2454 (10,1); 7,2446 (9,6); 7,2437 (9,1); 7,2430 (8,8); 7,2421 (8,4);
 25 7,2414 (8,5); 7,2406 (7,9); 7,2398 (7,6); 7,2390 (7,4); 7,2382 (7,2); 7,2374 (6,9); 7,2366 (6,8); 7,2358 (6,8); 7,2350 (6,8); 7,2342 (6,4); 7,2334 (6,4); 7,2318 (6,4); 7,2295 (5,8); 7,2247 (6,6); 7,2152 (5,8); 7,2087 (6,5); 7,1400 (2,6); 7,1170 (1,5); 6,9951 (6,9); 6,3501 (3,5); 6,2796 (0,8); 4,1771 (1,4); 4,1667 (1,6); 4,1503 (2,2); 4,1399 (2,4); 4,0479 (2,4); 4,0268 (2,3); 4,0212 (1,7); 4,0001 (1,8); 3,6845 (1,1); 3,6678 (2,1); 3,6382 (15,7); 3,6327

(16,0); 3,5539 (6,0); 3,5505 (6,1); 3,5192 (1,5); 2,0048 (2,0); 1,9486 (1,0); 1,9295 (1,2);
 1,9091 (0,8); 1,8721 (0,8); 1,8539 (1,2); 1,8377 (1,5); 1,8191 (1,0); 1,5275 (180,9); 1,2545
 (1,0); 1,1668 (11,1); 1,1643 (10,5); 1,1383 (10,9); 1,1361 (10,9); 1,0508 (4,6); 1,0325 (9,5);
 1,0141 (4,1); 0,1459 (1,6); 0,0365 (1,0); 0,0142 (4,2); 0,0079 (19,7); 0,0062 (12,4); 0,0046
 5 (20,3); -0,0002 (470,3); -0,0052 (13,0); -0,0060 (11,4); -0,0068 (10,5); -0,0085 (18,6); -
 0,0116 (5,8); -0,0123 (5,6); -0,0179 (3,9); -0,0235 (3,2); -0,0275 (2,9); -0,0346 (2,9); -0,0498
 (2,8); -0,1495 (2,0)

Пример № I.2-46:

10 ^1H -ЯМР (400 МГц, CDCl_3 , δ , ppm) $\delta = 7,3818$ (0,6); 7,3633 (0,8); 7,3519 (0,6); 7,3461 (1,8);
 7,3427 (1,9); 7,3378 (0,8); 7,3236 (1,8); 7,3214 (1,5); 7,2593 (69,0); 6,3157 (0,8); 6,2865
 (0,8); 5,1265 (2,2); 4,0533 (0,5); 4,0400 (0,6); 3,5182 (1,2); 3,5154 (1,3); 3,4994 (1,2);
 3,4965 (1,2); 2,0046 (0,8); 1,5337 (16,0); 1,1242 (1,3); 1,1057 (2,7); 1,0872 (1,2); 0,0079
 (1,2); -0,0002 (34,5); -0,0085 (1,3)

15

Пример № I.4-43:

^1H -ЯМР (400 МГц, CDCl_3 , δ , ppm) 7,5932 (0,5); 7,3734 (0,5); 7,3507 (0,5); 7,2646 (0,6);
 7,2597 (46,5); 6,3405 (1,1); 4,5843 (0,7); 4,5710 (0,8); 4,5270 (0,8); 4,5203 (0,7); 4,1612
 (0,8); 4,1433 (0,8); 3,5481 (1,8); 3,5444 (1,4); 1,5388 (16,0); 1,2627 (1,2); 1,2613 (1,3);
 20 1,2448 (2,4); 1,2434 (2,6); 1,2269 (1,1); 1,2255 (1,2); 0,9781 (1,2); 0,9754 (1,4); 0,9678
 (2,3); 0,9619 (1,4); 0,9591 (1,4); 0,9518 (2,0); 0,0079 (0,6); -0,0002 (19,5); -0,0085 (0,6)

Пример № I.5-2:

^1H -ЯМР (400 МГц, CDCl_3 , δ , ppm) $\delta = 7,5185$ (1,0); 7,3596 (0,7); 7,3566 (0,5); 7,3370 (0,6);
 25 7,3340 (0,5); 7,2742 (0,5); 7,2734 (0,5); 7,2726 (0,6); 7,2718 (0,6); 7,2710 (0,7); 7,2702
 (0,8); 7,2694 (0,9); 7,2686 (1,1); 7,2678 (1,2); 7,2670 (1,4); 7,2662 (1,6); 7,2654 (2,0);
 7,2645 (2,4); 7,2597 (179,3); 7,2524 (1,0); 7,2516 (0,7); 7,2508 (0,6); 7,2500 (0,6); 7,2492
 (0,6); 6,9956 (1,0); 6,3475 (1,2); 6,3434 (1,2); 3,6602 (6,4); 3,6584 (4,5); 3,6438 (0,5);
 3,6403 (0,5); 3,5469 (3,0); 2,5634 (0,8); 2,5557 (0,6); 1,5338 (16,0); 1,1284 (2,2); 1,1114
 30 (2,1); 1,0391 (1,2); 1,0222 (1,2); 0,9467 (0,7); 0,9362 (1,1); 0,9281 (1,4); 0,9177 (2,4);
 0,9096 (0,6); 0,8991 (0,9); 0,1263 (0,5); 0,0080 (2,3); -0,0002 (79,6); -0,0085 (2,2)

Пример № I.5-3:

^1H -ЯМР (400 МГц, CDCl_3 , δ , ppm) δ = 7,2694 (0,5); 7,2686 (0,6); 7,2678 (0,7); 7,2670 (0,7);
7,2662 (0,9); 7,2654 (1,0); 7,2646 (1,2); 7,2638 (1,6); 7,2597 (83,0); 7,2557 (1,6); 7,2549
5 (1,2); 7,2540 (0,9); 7,2532 (0,7); 7,2524 (0,6); 6,3458 (0,6); 6,3403 (0,6); 5,2988 (16,0);
4,1258 (0,6); 4,1080 (0,6); 3,5457 (1,4); 2,0439 (0,8); 1,5355 (12,5); 1,2591 (1,2); 1,2429
(1,6); 1,2414 (1,8); 1,2238 (0,8); 1,1266 (1,0); 1,1097 (1,0); 1,0394 (0,6); 1,0227 (0,6);
0,9344 (0,6); 0,9260 (0,7); 0,9159 (1,1); 0,8973 (0,5); 0,0080 (1,0); -0,0002 (36,9); -0,0085
(1,0)

10 Пример № I.8-2:

^1H -ЯМР (400 МГц, CDCl_3 , δ , ppm) 7,5184 (1,0); 7,4121 (2,2); 7,3938 (2,2); 7,3592 (2,3);
7,3367 (2,3); 7,3105 (0,8); 7,2596 (173,6); 6,9956 (1,0); 6,3545 (3,5); 5,2986 (1,2); 4,3769
(2,3); 4,3612 (4,6); 4,3456 (2,4); 3,6752 (16,0); 3,6351 (9,4); 3,5541 (5,3); 3,5510 (5,6);
2,6266 (2,1); 2,6109 (4,1); 2,5952 (2,0); 1,5836 (5,4); 0,0079 (2,0); -0,0002 (64,9); -0,0085
15 (2,1)

Пример № I.8-3:

^1H -ЯМР (400 МГц, CDCl_3 , δ , ppm) δ = 7,4172 (3,9); 7,3989 (3,9); 7,3582 (4,0); 7,3356 (4,0);
7,2616 (8,1); 6,3525 (6,8); 4,3777 (3,8); 4,3620 (7,9); 4,3462 (4,1); 4,1567 (2,1); 4,1389
20 (6,4); 4,1210 (6,5); 4,1032 (2,2); 3,6349 (16,0); 3,5526 (10,3); 3,5498 (11,0); 2,6123 (3,9);
2,5966 (7,7); 2,5809 (3,8); 1,5637 (0,6); 1,2689 (7,0); 1,2511 (14,2); 1,2332 (7,1); -0,0002
(10,4); -0,0083 (0,6)

Пример № I.8-23:

25 ^1H -ЯМР (400 МГц, CDCl_3 , δ , ppm) 7,5182 (2,3); 7,4130 (1,7); 7,4059 (1,8); 7,3948 (1,9);
7,3878 (1,8); 7,3489 (2,8); 7,3262 (2,9); 7,2969 (0,5); 7,2929 (0,7); 7,2825 (0,7); 7,2802
(0,9); 7,2785 (0,9); 7,2778 (0,9); 7,2762 (1,1); 7,2754 (1,3); 7,2746 (1,3); 7,2738 (1,4);
7,2730 (1,5); 7,2722 (1,6); 7,2714 (1,8); 7,2706 (1,9); 7,2698 (2,2); 7,2690 (2,5); 7,2682
(2,7); 7,2674 (3,2); 7,2666 (3,6); 7,2657 (4,3); 7,2594 (419,5); 7,2544 (10,8); 7,2536 (9,1);
30 7,2528 (7,8); 7,2520 (6,7); 7,2512 (5,9); 7,2504 (5,3); 7,2496 (4,8); 7,2488 (4,5); 7,2480
(4,2); 7,2472 (4,0); 7,2464 (3,7); 7,2456 (3,6); 7,2448 (3,4); 7,2440 (3,3); 7,2432 (3,0);
7,2424 (2,9); 7,2416 (3,0); 7,2408 (2,8); 7,2400 (2,8); 7,2393 (2,6); 7,2384 (2,5); 7,2376
(2,5); 7,2369 (2,4); 7,2360 (2,3); 7,2352 (2,3); 7,2345 (2,2); 7,2337 (2,0); 7,2329 (1,9);
7,2321 (2,0); 7,2313 (1,9); 7,2305 (1,8); 7,2297 (1,8); 7,2289 (1,8); 7,2273 (1,7); 7,2249

(1,6); 7,2233 (1,6); 7,2209 (1,6); 7,2091 (1,4); 7,1971 (1,0); 7,1875 (0,8); 6,9953 (2,4);
 6,3494 (3,8); 5,3010 (0,6); 5,2853 (1,0); 5,2666 (1,0); 5,2512 (0,6); 4,1250 (1,4); 4,1070
 (4,3); 4,0898 (4,4); 4,0719 (1,5); 3,6193 (4,9); 3,6167 (8,6); 3,6149 (5,4); 3,5518 (8,0);
 3,5487 (8,3); 2,6314 (0,9); 2,6123 (1,0); 2,5923 (1,6); 2,5735 (1,5); 2,4920 (1,3); 2,4887
 5 (1,3); 2,4781 (1,4); 2,4746 (1,4); 2,4530 (0,8); 2,4497 (0,8); 2,4390 (0,8); 2,4356 (0,8);
 1,5403 (24,9); 1,2712 (7,0); 1,2696 (7,2); 1,2554 (7,2); 1,2537 (7,5); 1,2493 (8,4); 1,2314
 (16,0); 1,2135 (7,6); 0,0080 (4,6); -0,0002 (161,4); -0,0085 (6,1); -0,1496 (0,6)

Пример № I.8-42:

10 ^1H -ЯМР (400 МГц, CDCl_3 , δ , ppm) 7,5102 (2,3); 7,4919 (2,3); 7,3576 (2,4); 7,3350 (2,4);
 7,2601 (38,9); 6,3459 (3,9); 4,7512 (1,0); 4,7495 (0,9); 4,6549 (1,3); 4,6400 (8,5); 3,7478
 (2,6); 3,7399 (9,6); 3,7086 (16,0); 3,5515 (5,3); 3,5484 (5,5); 3,5451 (2,6); 3,5406 (1,0); -
 0,0002 (14,5)

15 Пример № I.8-43:

^1H -ЯМР (400 МГц, CDCl_3 , δ , ppm) $\delta =$ 7,5170 (2,5); 7,4983 (2,1); 7,3530 (2,3); 7,3303 (2,3);
 7,2929 (0,6); 7,2594 (225,1); 7,2091 (1,2); 6,9954 (1,3); 6,3409 (3,7); 5,2985 (0,7); 4,6242
 (8,9); 4,1858 (1,0); 4,1679 (3,2); 4,1500 (3,3); 4,1321 (1,2); 3,7409 (8,7); 3,5498 (5,6);
 3,5469 (5,6); 1,5667 (16,0); 1,2715 (3,8); 1,2536 (7,9); 1,2358 (3,8); 0,0080 (2,7); -0,0002
 20 (81,2); -0,0084 (3,3)

Пример № I.8-127:

^1H -ЯМР (400 МГц, CDCl_3 , δ , ppm) 7,3850 (1,1); 7,3669 (1,1); 7,3494 (1,2); 7,3269 (1,2);
 7,2604 (21,7); 6,3480 (1,8); 5,5276 (0,5); 5,5117 (0,8); 5,4959 (0,5); 3,6477 (16,0); 3,6211
 25 (4,4); 3,5497 (2,6); 3,5467 (2,7); 2,6947 (3,5); 2,6786 (3,4); 1,5467 (6,4); -0,0002 (7,9)

Пример № I.11-3:

^1H -ЯМР (400 МГц, CDCl_3 , δ , ppm) 7,5184 (1,8); 7,4851 (2,1); 7,4820 (2,1); 7,4664 (2,1);
 7,4632 (2,1); 7,3719 (3,5); 7,3490 (3,6); 7,2854 (0,6); 7,2781 (0,8); 7,2773 (0,8); 7,2741
 30 (1,1); 7,2717 (1,5); 7,2710 (1,5); 7,2701 (1,7); 7,2693 (1,9); 7,2686 (2,1); 7,2669 (2,7);
 7,2595 (328,4); 6,9955 (1,8); 4,3477 (0,6); 4,3375 (1,4); 4,3323 (0,6); 4,3220 (1,7); 4,3195
 (1,7); 4,3086 (1,5); 4,3046 (1,5); 4,2928 (2,7); 4,2810 (0,6); 4,2771 (1,5); 4,2652 (0,9);
 4,2495 (0,5); 4,1496 (1,6); 4,1319 (4,8); 4,1140 (4,8); 4,0964 (1,6); 3,8979 (0,6); 3,8815
 (2,0); 3,8799 (2,0); 3,8636 (2,1); 3,8620 (2,0); 3,8457 (0,6); 3,5516 (2,9); 3,5463 (8,0);

3,5409 (8,2); 3,5354 (2,9); 2,5736 (1,2); 2,5580 (3,2); 2,5429 (2,8); 2,5280 (0,9); 2,5249 (0,9); 2,2496 (1,7); 2,2404 (4,6); 2,2381 (4,9); 2,2289 (4,9); 2,2266 (4,9); 2,2174 (1,7); 2,2150 (1,7); 2,0243 (0,7); 1,5864 (8,3); 1,5167 (10,9); 1,4989 (10,7); 1,2713 (0,6); 1,2634 (7,8); 1,2567 (0,9); 1,2455 (16,0); 1,2277 (7,6); 0,0080 (4,5); 0,0057 (1,8); 0,0048 (2,1); -
5 0,0002 (147,0); -0,0085 (3,9)

Пример № I.46-2:

^1H -ЯМР (400 МГц, CDCl_3 , δ , ppm) 7,5387 (2,2); 7,5193 (2,4); 7,4067 (2,2); 7,3836 (2,3); 7,2596 (84,2); 6,3496 (3,7); 4,3413 (2,0); 4,3253 (4,5); 4,3094 (2,2); 3,6677 (16,0); 3,5559 (5,4); 3,5530 (5,6); 2,6364 (2,0); 2,6204 (4,2); 2,6044 (2,0); 1,5380 (2,6); 1,5245 (11,2); 1,5202 (11,2); 0,0080 (1,0); -0,0002 (31,3); -0,0084 (0,9)

Настоящее изобретение дополнительно предусматривает применение одного или нескольких соединений формулы (I) в соответствии с настоящим изобретением и/или их солей, как определено выше, предпочтительно в конфигурации, идентифицированной как предпочтительная или особенно предпочтительная, в частности, одного или нескольких соединений формул (I.1)-(I.50) и/или их солей, как определено выше в случае каждого, в качестве гербицида и/или регулятора роста растений, предпочтительно для сельскохозяйственных культур полезных растений и/или декоративных растений.

Настоящее изобретение дополнительно предусматривает способ контроля вредоносных растений и/или регуляции роста растений, характеризующийся тем, что эффективное количество

- одного или нескольких соединений формулы (I) в соответствии с настоящим изобретением и/или их солей, как определено выше, предпочтительно в конфигурации, идентифицированной как предпочтительная или особенно предпочтительная, в частности, одного или нескольких соединений формул (I.1)-(I.50) и/или их солей, как определено выше в случае каждого, или

- композиции по настоящему изобретению, как определено ниже, применяют в отношении (вредоносных) растений, семян (вредоносных) растений, почвы, в или на которой растут (вредоносные) растения, или посевной площади.

Настоящее изобретение также предусматривает способ контроля нежелательных растений, предпочтительно в сельскохозяйственных культурах полезных растений, характеризующийся тем, что эффективное количество

5

- одного или нескольких соединений формулы (I) и/или их солей, как определено выше, предпочтительно в конфигурации, идентифицированной как предпочтительная или особенно предпочтительная, в частности, одного или нескольких соединений формул (I.1)-(I.50) и/или их солей, как определено выше в случае каждого, или

10

- композиции по настоящему изобретению, как определено ниже,

применяют в отношении нежелательных растений (например, вредоносных растений, таких как одно- или двудольные сорняки, или нежелательных культурных растений), семян нежелательных растений (т. е. семян растений, например зерен, семян или органов вегетативного размножения, таких как клубни или части побегов с почками), почвы, в или на которой растут нежелательные растения (например, пахотной земли или непахотной земли), или посевной площади (т. е. площади, на которой вырастут нежелательные растения).

20

Настоящее изобретение также дополнительно предусматривает способы контроля регуляции роста растений, предпочтительно полезных растений, характеризующиеся тем, что эффективное количество

25 - одного или нескольких соединений формулы (I) и/или их солей, как определено выше, предпочтительно в конфигурации, идентифицированной как предпочтительная или особенно предпочтительная, в частности, одного или нескольких соединений формул (I.1)-(I.50) и/или их солей, как определено выше в случае каждого, или

30 - композиции по настоящему изобретению, как определено ниже,

применяют в отношении растения, семени растения (т. е. семян растения, например зерен, семян или органов вегетативного размножения, таких как клубни или части побегов с почками), почвы, в или на которой растут растения (например, пахотной

земли или непахотной земли), или посевной площади (т. е. площади, на которой вырастут растения).

5 В таком случае для соединений по настоящему изобретению или композиций по настоящему изобретению возможно применение, например, с помощью способов предпосевной обработки (возможно, даже посредством внесения в почву), обработки до появления всходов и/или после появления всходов. Конкретные примеры некоторых представителей флоры в виде однодольных и двудольных сорняков, которые можно контролировать с помощью соединений по настоящему изобретению, представлены
10 далее, при этом не предусмотрено ограничение перечислением конкретных видов.

В способе контроля вредоносных растений или регуляции роста растений в соответствии с настоящим изобретением предпочтение отдают применению одного или нескольких соединений формулы (I) и/или их солей для контроля вредоносных
15 растений или для регуляции роста в сельскохозяйственных культурах полезных растений или декоративных растений, при этом полезные растения или декоративные растения в предпочтительной конфигурации представляют собой трансгенные растения.

20 Соединения формулы (I) в соответствии с настоящим изобретением и/или их соли являются подходящими для контроля следующих родов однодольных и двудольных вредоносных растений.

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

Двудольные вредоносные растения рода Abutilon, Amaranthus, Ambrosia, Anoda, Anthemis, Aphanes, Artemisia, Atriplex, Bellis, Bidens, Capsella, Carduus, Cassia,
30 Centaurea, Chenopodium, Cirsium, Convolvulus, Datura, Desmodium, Emex, Erysimum, Euphorbia, Galeopsis, Galinsoga, Galium, Hibiscus, Ipomoea, Kochia, Lamium, Lepidium, Lindernia, Matricaria, Mentha, Mercurialis, Mullugo, Myosotis, Papaver, Pharbitis, Plantago, Polygonum, Portulaca, Ranunculus, Raphanus, Rorippa, Rotala, Rumex, Salsola, Senecio,

Sesbania, Sida, Sinapis, Solanum, Sonchus, Sphenoclea, Stellaria, Taraxacum, Thlaspi, Trifolium, Urtica, Veronica, Viola, Xanthium.

5 Если соединения по настоящему изобретению применяют в отношении поверхности почвы перед прорастанием вредоносных растений (сорных трав и/или широколиственных сорняков) (способ обработки до появления всходов), появление всходов сорных трав и/или всходов широколиственных сорняков предотвращается полностью, либо сорняки растут до тех пор, пока они не достигают стадии семядоли, но затем они прекращают расти и в конечном итоге погибают полностью через три-четыре 10 недели.

Если активные ингредиенты применяют после появления всходов в отношении зеленых частей растений, рост прекращается после обработки, и вредоносные растения остаются на стадии роста в момент применения, или они гибнут полностью по 15 прошествии определенного времени, так что конкуренция со стороны сорняков, которые являются вредоносными для культурных растений, благодаря этому устраняется очень рано и надолго.

Хотя соединения по настоящему изобретению обладают превосходной гербицидной 20 активностью в отношении однодольных и двудольных сорняков, культурные растения экономически важных сельскохозяйственных культур, например двудольных сельскохозяйственных культур рода *Arachis*, *Beta*, *Brassica*, *Cucumis*, *Cucurbita*, *Helianthus*, *Daucus*, *Glycine*, *Gossypium*, *Ipomoea*, *Lactuca*, *Linum*, *Lycopersicon*, *Miscanthus*, *Nicotiana*, *Phaseolus*, *Pisum*, *Solanum*, *Vicia* или однодольных 25 сельскохозяйственных культур рода *Allium*, *Ananas*, *Asparagus*, *Avena*, *Hordeum*, *Oryza*, *Panicum*, *Saccharum*, *Secale*, *Sorghum*, *Triticale*, *Triticum*, *Zea*, будут повреждены лишь незначительно, если вообще будут, в зависимости от структуры конкретного соединения по настоящему изобретению и нормы его применения. По этим причинам соединения по настоящему изобретению обладают очень хорошей пригодностью для 30 селективного контроля роста нежелательных растений среди растительных культур, таких как выращиваемые на плантациях полезные с точки зрения сельского хозяйства растения или декоративные растения.

Кроме того, соединения по настоящему изобретению (в зависимости от их конкретной структуры и применяемой нормы применения) обладают превосходными свойствами в отношении регуляции роста у культурных растений. Они вмешиваются в собственный метаболизм растений с регулирующим эффектом и, таким образом, могут применяться для контролируемого воздействия на компоненты растения и облегчать сбор урожая, например, вызывая высыхание и задержку роста. Кроме того, они также являются подходящими для общего контроля и подавления нежелательного вегетативного роста без уничтожения растений. Подавление вегетативного роста играет ключевую роль для множества одно- и двудольных сельскохозяйственных культур, поскольку, например, это может снизить или полностью предотвратить полегание.

Благодаря своим гербицидным свойствам и свойствам в отношении регуляции роста растений активные ингредиенты также можно применять для контроля вредоносных растений в сельскохозяйственных культурах генетически модифицированных растений или растений, модифицированных традиционным мутагенезом. В целом трансгенные растения отличаются конкретными преимущественными свойствами, например устойчивостью к определенным пестицидам, в частности определенным гербицидам, устойчивостью к заболеваниям растений или патогенам, вызывающим заболевания растений, таким как определенные насекомые или микроорганизмы, такие как грибы, бактерии или вирусы. Другие конкретные характеристики относятся, например, к собранному материалу с точки зрения количества, качества, стабильности при хранении, состава и конкретных компонентов. Например, известны трансгенные растения с повышенным содержанием крахмала или с измененным качеством крахмала или с другим составом жирных кислот собранного материала.

Касательно трансгенных сельскохозяйственных культур, предпочтение отдается применению соединений в соответствии с настоящим изобретением и/или их солей в экономически важных трансгенных сельскохозяйственных культурах полезных растений и декоративных растений, например злаковых, таких как пшеница, ячмень, рожь, разновидности овса, просо/сорго, рис и кукуруза, или, в противном случае, сельскохозяйственных культур – сахарной свеклы, хлопчатника, сои, масличного рапса, разновидностей картофеля, томатов, гороха и других овощей.

Соединения по настоящему изобретению можно также предпочтительно применять в качестве гербицидов в сельскохозяйственных культурах полезных растений, которые

являются устойчивыми, или приобрели устойчивость с помощью рекомбинантных средств, к фитотоксическим эффектам гербицидов.

5 Благодаря своим гербицидным свойствам и свойствам в отношении регуляции роста растений активные ингредиенты также можно применять для контроля вредоносных растений в сельскохозяйственных культурах генетически модифицированных растений, которые известны или еще не разработаны. В целом трансгенные растения отличаются конкретными преимущественными свойствами, например устойчивостью к определенным пестицидам, в частности определенным гербицидам, устойчивостью к 10 заболеваниям растений или патогенам, вызывающим заболевания растений, таким как определенные насекомые или микроорганизмы, такие как грибы, бактерии или вирусы. Другие конкретные характеристики относятся, например, к собранному материалу с точки зрения количества, качества, стабильности при хранении, состава и конкретных компонентов. Например, известны трансгенные растения с повышенным содержанием 15 крахмала или с измененным качеством крахмала или с другим составом жирных кислот собранного материала. Другими конкретными свойствами могут быть толерантность или устойчивость к абиотическим факторам стресса, например к теплу, холоду, засухе, солености и ультрафиолетовому излучению.

20 Предпочтение отдается применению соединений формулы (I) в соответствии с настоящим изобретением или их солей в экономически важных трансгенных сельскохозяйственных культурах полезных растений и декоративных растений, например злаковых, таких как пшеница, ячмень, рожь, разновидности овса, тритикале, просо/сорго, рис, кассава и кукуруза, или, в противном случае, сельскохозяйственных 25 культур – сахарной свеклы, хлопчатника, сои, масличного рапса, разновидностей картофеля, томатов, гороха и других овощей.

Соединения формулы (I) можно предпочтительно применять в качестве гербицидов в сельскохозяйственных культурах полезных растений, которые являются устойчивыми, 30 или приобрели устойчивость с помощью рекомбинантных средств, к фитотоксическим эффектам гербицидов.

Традиционные способы получения новых растений, которые обладают модифицированными свойствами по сравнению с существующими растениями,

включают, например, традиционные способы культивирования и получение мутантов. Альтернативно новые растения с измененными свойствами могут быть получены с помощью рекомбинантных способов.

5 Специалисту в данной области техники известны многочисленные методики молекулярной биологии, с помощью которых могут быть получены новые трансгенные растения с модифицированными свойствами. Для таких рекомбинантных манипуляций молекулы нуклеиновых кислот, которые допускают мутагенез или изменение последовательности путем рекомбинации последовательностей ДНК, могут быть
10 введены в плазмиды. С помощью стандартных способов можно, например, выполнить замены оснований, удалить части последовательностей или добавить природные или синтетические последовательности. Для соединения фрагментов ДНК друг с другом к фрагментам можно добавить адаптеры или линкеры.

15 Например, продуцирования растительных клеток со сниженной активностью продукта гена можно достичь посредством экспрессии по меньшей мере одной соответствующей антисмысловой РНК, смысловой РНК для достижения эффекта косупрессии, или посредством экспрессии по меньшей мере одного соответствующим образом сконструированного рибозима, который специфически расщепляет транскрипты
20 вышеуказанного продукта гена.

Для этого, во-первых, можно применять молекулы ДНК, которые охватывают всю кодирующую последовательность продукта гена, включая любые фланкирующие последовательности, которые могут присутствовать, а также молекулы ДНК, которые
25 охватывают лишь части кодирующей последовательности, в случае чего необходимо, чтобы данные части были достаточно длинными, чтобы оказывать антисмысловый эффект в клетках. Также можно применять последовательности ДНК, которые имеют высокую степень гомологии с кодирующими последовательностями продукта гена, но не являются полностью идентичными.

30 При экспрессии молекул нуклеиновой кислоты в растениях синтезированный белок может быть локализован в любом необходимом компартменте растительной клетки. Однако для достижения локализации в конкретном компартменте можно, например, присоединить кодирующую область к последовательностям ДНК, которые

обеспечивают локализацию в конкретном компартменте. Такие последовательности известны специалистам в данной области техники (см., например, Braun et al., EMBO J. 11 (1992), 3219-3227). Молекулы нуклеиновой кислоты также могут экспрессироваться в органеллах растительных клеток.

5

Трансгенные растительные клетки могут быть регенерированы посредством известных методик с целью получения целых растений. По сути, трансгенные растения могут быть растениями любых необходимых видов растений, т. е. не только однодольными, но также и двудольными растениями.

10

Таким способом могут быть получены трансгенные растения, обладающие свойствами, измененными в результате сверхэкспрессии, супрессии или подавления гомологичных (= природных) генов или последовательностей генов или экспрессии гетерологичных (= чужеродных) генов или последовательностей генов.

15

Соединения (I) в соответствии с настоящим изобретением можно предпочтительно применять в трансгенных сельскохозяйственных культурах, которые устойчивы к регуляторам роста, например дикамбе, или к гербицидам, которые ингибируют жизненно важные ферменты растений, например ацетолактатсинтазы (ALS), EPSP-синтазы, глутаминсинтазы (GS) или гидроксифенилпируватдиоксигеназы (HPPD), или к гербицидам из группы сульфонилмочевин, глифосатов, глюфосинатов или бензоилизоксазолов и аналогичных активных ингредиентов.

20

25

Когда активные ингредиенты по настоящему изобретению применяют в трансгенных сельскохозяйственных культурах, они оказывают эффекты не только в отношении вредоносных растений, которые наблюдают в других сельскохозяйственных культурах, но часто также эффекты, которые являются специфическими для применения в конкретной трансгенной сельскохозяйственной культуре, например измененный или специфически расширенный спектр сорняков, которые можно контролировать, измененные нормы применения, которые можно использовать для применения, предпочтительно хорошая сочетаемость с гербицидами, к которым трансгенная сельскохозяйственная культура является устойчивой, и влияние на рост и урожайность трансгенных культурных растений.

30

Настоящее изобретение, следовательно, также предусматривает применение соединений формулы (I) в соответствии с настоящим изобретением и/или их солей в качестве гербицидов для контроля вредоносных растений в сельскохозяйственных культурах полезных растений или декоративных растений, при необходимости в трансенных культурных растениях.

5

Предпочтение отдается применению в злаковых, предпочтительно кукурузе, пшенице, ячмене, ржи, разновидностях овса, просе/сорго или рисе до или после появления всходов

10

Предпочтение также отдается применению в сое до или после появления всходов.

15

Применение в соответствии с настоящим изобретением для контроля вредоносных растений или для регуляции роста растений также включает случай, при котором активный ингредиент формулы (I) или его соль образуются только после размещения на растении, в растении или в почве из вещества-предшественника ("пролекарства"). Настоящее изобретение также предусматривает применение одного или нескольких соединений формулы (I) или их солей или композиции в соответствии с настоящим изобретением (как определено ниже) (в способе) для контроля вредоносных растений или регуляции роста растений, где эффективное количество одного или нескольких соединений формулы (I) или их солей применяется в отношении растений (вредоносных растений, при необходимости вместе с культурными растениями), семян растений, почвы, в которой или на которой растут растения, или посевной площади.

20

Настоящее изобретение также предусматривает гербицидную и/или регулируемую рост растений композицию, характеризующуюся тем, что композиция содержит:

25

(а) одно или несколько соединений формулы (I) и/или их солей, как определено выше, предпочтительно в конфигурации, идентифицированной как предпочтительная или особенно предпочтительная, в частности, одно или несколько соединений формул (I.1)-(I.XX) и/или их солей, как определено выше в случае каждого,

30

и

(b) одно или несколько дополнительных веществ, выбранных из групп (i) и/или (ii):

(i) один или несколько дополнительных активных агрохимических ингредиентов, предпочтительно выбранных из группы, состоящей из инсектицидов, акарицидов, нематоцидов, дополнительных гербицидов (т. е. таких, которые не соответствуют вышеуказанной формуле (I)), фунгицидов, антидотов, удобрений и/или дополнительных регуляторов роста,

(ii) одно или несколько вспомогательных средств для составления, применяемых традиционно для защиты сельскохозяйственных культур.

Дополнительные активные агрохимические ингредиенты компонента (i) композиции по настоящему изобретению предпочтительно выбраны из группы веществ, указанных в "The Pesticide Manual", 16th edition, The British Crop Protection Council and the Royal Soc. of Chemistry, 2012.

Гербицидная или регулирующая рост растений композиция по настоящему изобретению предпочтительно содержит одно, два, три или более вспомогательных средств для составления (ii), которые являются традиционными для защиты сельскохозяйственных культур, выбранных из группы, состоящей из поверхностно-активных веществ, эмульгаторов, диспергирующих веществ, пленкообразователей, загустителей, неорганических солей, пылевидных средств, носителей, которые являются твердыми при 25°C и 1013 мбар, предпочтительно адсорбирующих гранулированных инертных материалов, смачивающих средств, антиоксидантов, стабилизаторов, буферных веществ, противовспенивателей, воды, органических растворителей, предпочтительно органических растворителей, которые смешиваются с водой в любом необходимом соотношении при 25°C и 1013 мбар.

Соединения (I) в соответствии с настоящим изобретением могут быть использованы в виде смачиваемых порошков, эмульгируемых концентратов, распыляемых растворов, пылевидных продуктов или гранул в традиционных составах. Следовательно, настоящее изобретение также предусматривает гербицидные композиции и композиции для регуляции роста растений, содержащие соединения формулы (I) и/или их соли.

Соединения формулы (I) и/или их соли могут быть составлены различными способами в соответствии с необходимыми биологическими и/или физико-химическими параметрами. Возможные составы включают, например: смачиваемые порошки (WP), водорастворимые порошки (SP), водорастворимые концентраты, эмульгируемые концентраты (EC), эмульсии (EW), такие как эмульсии типа "масло-в-воде" и "вода-в-масле", распыляемые растворы, суспензионные концентраты (SC), дисперсии на основе масла или воды, смешиваемые с маслом растворы, капсульные суспензии (CS), порошки для опыливания (DP), составы для протравливания семян, гранулы для разбрасывания и внесения в почву, гранулы (GR) в виде микрогранул, гранулы для распыления, гранулы для абсорбции и адсорбции, диспергируемые в воде гранулы (WG), водорастворимые гранулы (SG), составы ULV, микрокапсулы и воски.

Данные отдельные типы составов и вспомогательные средства для составления, такие как инертные материалы, поверхностно-активные вещества, растворители и дополнительные добавки, известны специалисту в данной области техники и описаны, например, в: Watkins, "Handbook of Insecticide Dust Diluents and Carriers", 2nd ed., Darland Books, Caldwell N.J., H.v. Olphen, "Introduction to Clay Colloid Chemistry"; 2nd ed., J. Wiley & Sons, N.Y.; C. Marsden, "Solvents Guide"; 2nd Ed., Interscience, N.Y. 1963; McCutcheon's "Detergents and Emulsifiers Annual", MC Publ. Corp., Ridgewood N.J.; Sisley and Wood, "Encyclopedia of Surface Active Agents", Chem. Publ. Co. Inc., N.Y. 1964; Schönfeldt, "Grenzflächenaktive Äthylenoxidaddukte" [Interface-Active Ethylene Oxide Products], Wiss. Verlagsgesellschaft, Stuttgart 1976; Winnacker-Küchler, "Chemische Technologie" [Chemical Technology], volume 7, C. Hanser Verlag Munich, 4th ed. 1986.

Смачиваемые порошки представляют собой препараты, которые равномерно диспергируются в воде и, в дополнение к активному ингредиенту, помимо разбавителя или инертного вещества, также содержат ионные и/или неионогенные поверхностно-активные вещества (смачивающие средства, диспергирующие вещества), например, полиэтокселированные алкилфенолы, полиэтокселированные жирные спирты, полиэтокселированные жирные амины, полигликольэфирсульфаты жирных спиртов, алкансульфонаты, алкилбензолсульфонаты, лигносульфонат натрия, 2,2'-динафтилметан-6,6'-дисульфонат натрия, дибутилнафталинсульфонат натрия или, в противном случае, олеилметилтаурат натрия. Смачиваемые порошки получают путем

тонкого измельчения активных гербицидных ингредиентов, например, в традиционных устройствах, таких как молотковые мельницы, воздуходувные мельницы и мельницы с воздушной струей, и одновременного или последовательного смешивания со вспомогательными средствами для составления.

5

Эмульгируемые концентраты получают путем растворения активного ингредиента в органическом растворителе, например, бутаноле, циклогексаноне, диметилформамиде, ксилоле или, в противном случае, относительно высококипящих ароматических веществах или углеводородах, или смесях органических растворителей, с добавлением одного или нескольких ионных и/или неионогенных поверхностно-активных веществ (эмульгаторов). Примерами эмульгаторов, которые можно применять, являются: алкиларилсульфонаты кальция, такие как додецилбензолсульфонат кальция, или неионогенные эмульгаторы, такие как сложные эфиры полигликоля и жирных кислот, простые эфиры алкиларилполигликоля, простые эфиры полигликоля и жирных спиртов, продукты конденсации пропиленоксида-этиленоксида, простые алкилполиэфиры, сложные эфиры сорбитана, например сложные эфиры сорбитана и жирных кислот, или сложные эфиры полиоксиэтиленсорбитана, например сложные эфиры полиоксиэтиленсорбитана и жирных кислот.

10

15

20

Порошки для опыливания получают путем измельчения активного ингредиента с тонкоизмельченными твердыми материалами, например тальком, натуральными глинами, такими как каолин, бентонит и пиррофиллит, или диатомовой землей.

25

Суспензионные концентраты могут быть на водной или масляной основе. Они могут быть получены, например, путем мокрого измельчения с помощью коммерческих бисерных мельниц и необязательного добавления поверхностно-активных веществ, как уже перечислено выше, например, для других типов составов.

30

Эмульсии, например эмульсии типа "масло-в-воде" (EW), могут быть получены, например, с помощью мешалок, коллоидных мельниц и/или статических смесителей с использованием водных органических растворителей и необязательно поверхностно-активных веществ, как уже перечислено выше, например, для других типов составов.

- Гранулы могут быть получены либо путем распыления активного ингредиента на адсорбирующий гранулированный инертный материал, либо путем нанесения концентратов активного ингредиента на поверхность носителей, таких как песок, каолиниты или гранулированный инертный материал, с помощью адгезивов, например, поливинилового спирта, полиакрилата натрия или, в противном случае, минеральных масел. Подходящие активные ингредиенты также можно гранулировать способом, традиционным для получения гранул удобрения, если необходимо – в виде смеси с удобрениями.
- 5
- 10 Диспергируемые в воде гранулы, как правило, получают традиционными способами, такими как высушивание распылением, грануляция в псевдооживленном слое, гранулирование на тарельчатом грануляторе, смешивание с помощью высокоскоростных смесителей и экструзия без твердого инертного материала.
- 15 Для получения гранул на тарельчатом грануляторе, в псевдооживленном слое, в экструдере и посредством распыления см., например, способы в "Spray Drying Handbook" 3rd Ed. 1979, G. Goodwin Ltd., London, J.E. Browning, "Agglomeration", Chemical and Engineering 1967, страницы 147 и далее; "Perry's Chemical Engineer's Handbook", 5th ed., McGraw-Hill, New York 1973, стр. 8-57.
- 20
- 25 Для получения дополнительной информации о составлении композиций для защиты сельскохозяйственных культур см., например, G.C. Klingman, "Weed Control as a Science", John Wiley and Sons, Inc., New York, 1961, страницы 81-96 и J.D. Freyer, S.A. Evans, "Weed Control Handbook", 5th Ed., Blackwell Scientific Publications, Oxford, 1968, страницы 101-103.
- 30
- Агрохимические препараты, предпочтительно гербицидные или регулирующие рост растений композиции по настоящему изобретению предпочтительно содержат в общей сложности от 0,1 до 99% по весу, предпочтительно от 0,5% до 95% по весу, более предпочтительно от 1% до 90% по весу, особенно предпочтительно от 2% до 80% по весу активных ингредиентов формулы (I) и их солей.
- В смачиваемых порошках концентрация активного ингредиента составляет, например, от приблизительно 10% до 90% по весу, остаток до 100% по весу состоит из

традиционных компонентов состава. В эмульгируемых концентратах концентрация активного ингредиента может составлять от приблизительно 1% до 90% и предпочтительно от 5% до 80% по весу. Составы в форме, предназначенной для опыливания, содержат от 1% до 30% по весу активного ингредиента, предпочтительно обычно от 5% до 20% по весу активного ингредиента; распыляемые растворы содержат от приблизительно 0,05% до 80% по весу, предпочтительно от 2% до 50% по весу активного ингредиента. В случае диспергируемых в воде гранул содержание активного ингредиента частично зависит от того, находится ли активное соединение в жидкой или твердой форме, и от того, какие применяют вспомогательные средства для грануляции, наполнители и т. д. В диспергируемых в воде гранулах содержание активного ингредиента составляет, например, от 1% до 95% по весу, предпочтительно от 10% до 80% по весу.

Кроме того, упомянутые составы на основе активного ингредиента необязательно содержат соответствующие традиционные адгезивы, смачивающие вещества, диспергирующие вещества, эмульгаторы, средства, усиливающие проникновение, консерванты, антифризы и растворители, наполнители, носители и красители, пеногасители, замедлители выпаривания и модификаторы pH и вязкости. Примеры вспомогательных средств для составления описаны, среди прочего, в "Chemistry and Technology of Agrochemical Formulations", ed. D. A. Knowles, Kluwer Academic Publishers (1998).

Соединения формулы (I) или их соли можно применять отдельно или в комбинации в виде препаратов (составов) на их основе с другими веществами, обладающими пестицидной активностью, например, инсектицидами, акарицидами, нематоцидами, гербицидами, фунгицидами, антидотами, удобрениями и/или регуляторами роста, например, в виде готового состава или в виде баковых смесей. Комбинированные составы могут быть получены в данном случае на основе вышеупомянутых составов, принимая во внимание физические свойства и значения стабильности активных ингредиентов, подлежащих объединению.

Компоненты для образования комбинации, применимые с соединениями формулы (I) в соответствии с настоящим изобретением в смешанных составах или в баковой смеси, представляют собой, например, известные активные ингредиенты, действие которых

основано на ингибировании, например, ацетолактатсинтазы, ацетил-СоА-карбоксилазы, целлюлозосинтазы, енолпирувилшिकимат-3-фосфатсинтазы, глутаминсинтетазы, п-гидроксифенилпируватдиоксигеназы, фитоендесатуразы, фотосистемы I, фотосистемы II, протопорфириногеназы, как описано, например, в Weed Research 26 (1986) 441-445 или "The Pesticide Manual", 16th edition, The British Crop Protection Council and the Royal Soc. of Chemistry, 2012 и литературе, цитируемой в них.

Особый интерес представляет селективный контроль вредоносных растений в сельскохозяйственных культурах полезных растений и декоративных растений. Хотя соединения (I) в соответствии с настоящим изобретением уже обладают очень хорошей или надлежащей селективностью для многих сельскохозяйственных культур, теоретически может возникнуть фитотоксичность для культурных растений в случае некоторых сельскохозяйственных культур и, в частности, в случае смесей с другими гербицидами, которые являются менее селективными. Особый интерес в этом отношении представляют комбинации соединений (I) в соответствии с настоящим изобретением, которые содержат соединения (I) или их комбинации с другими гербицидами или пестицидами и антидотами. Антидоты, которые применяют при содержании, обеспечивающем антидотный эффект, уменьшают фитотоксические побочные эффекты применяемых гербицидов/пестицидов, например в экономически важных сельскохозяйственных культурах, таких как злаковые (пшеница, ячмень, рожь, кукуруза, рис, просо/сорго), сахарная свекла, сахарный тростник, масличный рапс, хлопчатник и соя, предпочтительно злаковые.

Весовые соотношения гербицида (смесь) и антидота обычно зависят от нормы применения гербицида и эффективности соответствующего антидота и могут варьировать в широких пределах, например в диапазоне от 200:1 до 1:200, предпочтительно от 100:1 до 1:100, особенно от 20:1 до 1:20. Антидоты могут быть составлены аналогично соединениям (I) или их смесям с дополнительными гербицидами/пестицидами и могут быть предоставлены и применены в виде готового состава или баковой смеси с гербицидами.

Для применения составы на основе гербицида или гербицида-антидота в коммерческой форме разбавляют, при необходимости, традиционным способом с помощью воды,

например, в случае смачиваемых порошков, эмульгируемых концентратов, дисперсий и диспергируемых в воде гранул. Составы для опыливания, гранулы для внесения в почву или разбрасывания и распыляемые растворы, как правило, дополнительно не разбавляют дополнительными инертными веществами до применения.

5

Внешние условия, такие как температура, влажность и т. д., в некоторой степени влияют на норму применения соединений формулы (I) и/или их солей. Норма применения может варьироваться в широких пределах. В случае применения в качестве гербицида для контроля вредоносных растений общее количество соединений формулы (I) и их солей предпочтительно находится в диапазоне от 0,001 до 10,0 кг/га, предпочтительно в диапазоне от 0,005 до 5 кг/га, более предпочтительно в диапазоне от 0,01 до 1,5 кг/га, особенно предпочтительно в диапазоне от 0,05 до 1 кг/га. Это касается применения как до, так и после появления всходов.

10

15 Когда соединения формулы (I) и/или их соли применяют в качестве регуляторов роста растений, например, в качестве средства для укорочения стебля в случае культурных растений, как указано выше, предпочтительно в случае злаковых растений, таких как пшеница, ячмень, рожь, тритикале, просо/сорго, рис или кукуруза, общая норма применения предпочтительно находится в диапазоне от 0,001 до 2 кг/га, предпочтительно в диапазоне от 0,005 до 1 кг/га, особенно в диапазоне от 10 до 20

20 500 г/га, наиболее предпочтительно в диапазоне от 20 до 250 г/га. Это касается применения как до, так и после появления всходов.

20

Применение в качестве средства для укорочения стебля можно осуществлять на различных стадиях роста растений. Предпочтение отдается, например, применению после кущения в начале линейного роста.

25

Альтернативным вариантом в случае применения в качестве регулятора роста растений также является обработка семени, которая предусматривает различные методики протравливания семян и нанесения покрытия. Норма применения зависит от отдельных методик и может быть установлена в предварительных испытаниях.

30

Компоненты для образования комбинации, применимые с соединениями формулы (I) в соответствии с настоящим изобретением в композициях по настоящему изобретению

(например, смешанных составах или в баковой смеси), представляют собой, например, известные активные ингредиенты, действие которых основано на ингибировании, например, ацетолактатсинтазы, ацетил-СоА-карбоксилазы, целлюлозосинтазы, энолпирувилшикимат-3-фосфатсинтазы, глутаминсинтетазы, п-
 5 гидроксифенилпируватдиоксигеназы, фитоендесатуразы, фотосистемы I, фотосистемы II, протопорфириногенаоксидазы, как описано, например, в Weed Research 26 (1986) 441-445 или "The Pesticide Manual", 16th edition, The British Crop Protection Council and the Royal Soc. of Chemistry, 2012 и литературе, цитируемой в них. В качестве примера
 10 далее в данном документе указаны известные гербициды или регуляторы роста растений, которые можно объединять с соединениями по настоящему изобретению, с обозначением таких активных ингредиентов либо их общепринятым названием в англоязычном варианте в соответствии с нормами Международной организации по стандартизации (ISO), либо химическим названием или кодовым номером. Они всегда
 15 включают все формы для применения, например, кислоты, соли, сложные эфиры, а также все изомерные формы, такие как стереоизомеры и оптические изомеры, даже если это не указано в явной форме.

Примерами таких гербицидных компонентов для образования смеси являются:
 ацетохлор, ацифлуорфен, ацифлуорфен-натрий, аклонифен, алахлор, аллидохлор,
 20 аллоксидим, аллоксидим-натрий, аметрин, амикарбазон, амидохлор, амидосульфурон, 4-амино-3-хлор-6-(4-хлор-2-фтор-3-метилфенил)-5-фторпиримидин-2-карбоновая кислота, аминоциклопирахлор, аминоциклопирахлор-калий, аминоциклопирахлор-метил, аминопиралид, амитрол, сульфамат аммония, анилофос, асулам, атразин, азафенидин, азимсульфурон, бефлубутамид, беназолин, беназолин-этил, бенфлуралин, бенфуресат,
 25 бенсульфурон, бенсульфурон-метил, бенсулид, бентазон, бензобициклон, бензофенап, бициклопирон, бифенокс, биланафос, биланафос-натрий, биспирибак, биспирибак-натрий, бромацил, бромобутид, бромофеноксим, бромоксинил, бромоксинил-бутират, -калий, -гептаноат и -октаноат, бузоксинон, бутахлор, бутафенацил, бутамифос, бутенахлор, бутралин, бутроксидим, бутилат, кафенстрол, карбетамид, карфентразон,
 30 карфентразон-этил, хлорамбен, хлорбромурон, хлорфенак, хлорфенак-натрий, хлорфенпроп, хлорфлуренол, хлорфлуренол-метил, хлоридазон, хлоримурон, хлоримурон-этил, хлорфталим, хлортолурун, хлортал-диметил, хлорсульфурон, цинидон, цинидон-этил, цинметилин, циносульфурон, клацифос, клетодим, клодинафоп, клодинафоп-

пропаргил, кломазон, кломепроп, клопиралид, клорансулам, клорансулам-метил, кумилурон, цианамид, цианазин, циклоат, циклопириморат, циклосульфамурон, циклоксидим, цигалофоп, цигалофоп-бутил, ципразин, 2,4-D, 2,4-D-бутотил, -бутил, -диметиламмоний, -диоламин, -этил, 2-этилгексил, -изобутил, -изооктил, -

5 изопропиламмоний, -калий, -триизопропаноламмоний и -троламин, 2,4-DB, 2,4-DB-бутил, -диметиламмоний, изооктил, -калий и -натрий, даимурон (димрон), далапон, дазомет, н-деканол, десмедифам, детозил-пиразолат (DTP), дикамба, дихлобенил, 2-(2,4-дихлорбензил)-4,4-диметил-1,2-оксазолидин-3-он, 2-(2,5-дихлорбензил)-4,4-диметил-

10 1,2-оксазолидин-3-он, дихлорпроп, дихлорпроп-Р, диклофоп, диклофоп-метил, диклофоп-Р-метил, диклосулам, дифензокват, дифлуфеникан, дифлуфензопир, дифлуфензопир-натрий, димефурон, димепиперат, диметахлор, диметаметрин, диметенамид, диметенамид-Р, диметрасульфурон, динитрамин, динотерб, дифенамид, дикват, дикват-дибромид, дитиопир, диурон,

15 DNOC, эндотал, ЕРТС, эспрокарб, эталфлуралин, этаметсульфурон, этаметсульфурон-метил, этиозин, этофумезат, этоксифен, этоксифен-этил, этоксисульфурон, этобензанид, F-9600, F-5231, т. е. N-[2-хлор-4-фтор-5-[4-(3-фторпропил)-4,5-дигидро-5-оксо-1H-тетразол-1-ил]фенил]этансульфонамид, F-7967, т. е. 3-[7-хлор-5-фтор-2-

20 (трифторметил)-1H-бензимидазол-4-ил]-1-метил-6-(трифторметил)пиримидин-2,4(1H,3H)-дион, феноксапроп, феноксапроп-Р, феноксапроп-этил, феноксапроп-Р-этил, феноксасульфон, фенквинотрион, фентразамид, флампроп, флампроп-М-изопропил, флампроп-М-метил, флазасульфурон, флорасулам, флуазифоп, флуазифоп-Р, флуазифоп-бутил,

25 флуазифоп-Р-бутил, флукарбазон, флукарбазон-натрий, флуцетосульфурон, флухлоралин, флуфенацет, флуфенпир, флуфенпир-этил, флуметсулам, флумиклорак, флумиклорак-пентил, флумиоксазин, флуометурон, флуренол, флуренол-бутил, -диметиламмоний и -метил, флуорогликофен, флуорогликофен-этил, флупропанат, флупирсульфурон, флупирсульфурон-метил-натрий, флуридон, флурохлоридон,

30 флуроксипир, флуроксипир-мептил, флуртамон, флутиацет, флутиацет-метил, фомесафен, фомесафен-натрий, форамсульфурон, фосамин, глюфосинат, глюфосинат-аммоний, глюфосинат-Р-натрий, глюфосинат-Р-аммоний, глюфосинат-Р-натрий, глифосат, глифосат-аммоний, -изопропиламмоний, -диаммоний, -диметиламмоний, -

- калий, -натрий и -тримезиум, Н-9201, т. е. О-(2,4-диметил-6-нитрофенил)-О-этилизопропилфосфорамидотиоат, галауксифен, галауксифен-метил, галосафен, галосульфурон, галосульфурон-метил, галоксифоп, галоксифоп-Р, галоксифоп-этоксипропил, галоксифоп-Р-этоксипропил, галоксифоп-метил, галоксифоп-Р-метил,
- 5 гексазинос, НВ-02, т. е. 1-(диметоксифосфорил)этил-(2,4-дихлорфеноксид)ацетат, имазаметабенз, имазаметабенз-метил, имазамокс, имазамокс-аммоний, имазапик, имазапик-аммоний, имазапир, имазапир-изопропиламмоний, имазакин, имазакин-аммоний, имазетапир, имазетапир-иммоний, имазосульфурон, инданофан, индазифлам, йодосульфурон, йодосульфурон-метил-натрий,
- 10 иоксинил, иоксинил-октаноат, -калий и натрий, ипфенкарбазон, изопротурон, изоурон, изоксабен, изоксафлютол, карбутилат, КУН-043, т. е. 3-([5-(дифторметил)-1-метил-3-(трифторметил)-1Н-пиразол-4-ил]метил)сульфонил)-5,5-диметил-4,5-дигидро-1,2-оксазол, кетоспирадокс, лактофен, ленацил, линурон, МСРА, МСРА-бутотил, -диметиламмоний, -2-этилгексил, -изопропиламмоний, -калий
- 15 и -натрий, МСРВ, МСРВ-метил, -этил и -натрий, мекопроп, мекопроп-натрий и -бутотил, мекопроп-Р, мекопроп-Р-бутотил, -диметиламмоний, -2-этилгексил и -калий, мефенацет, мефлуидид, мезосульфурон, мезосульфурон-метил, мезотрион, метабензтиазурон, метам, метамифоп, метамитрон, метазахлор, метаосульфурон, метабензтиазурон, метиопирсульфурон, метиозолин,
- 20 метилизотиоцианат, метобромурон, метолахлор, S-метолахлор, метосулам, метоксурон, метрибузин, метсульфурон, метсульфурон-метил, молинат, монолинурон, моносульфурон, моносульфурон-сложный эфир, МТ-5950, т. е. N-[3-хлор-4-(1-метилэтил)-фенил]-2-метилпентанамид, NGGC-011, напропамид, NC-310, т. е. 4-(2,4-дихлорбензоил)-1-метил-5-бензилоксипиразол, небурон, никосульфурон,
- 25 нонановая кислота (пеларгоновая кислота), норфлуразон, олеиновая кислота (жирные кислоты), орбенкарб, ортосульфамурон, оризалин, оксадиаргил, оксадиазон, оксаосульфурон, оксазикалмефон, оксифлуорфен, паракват, паракват дихлорид, пебулат, пендиметалин, пеноксулам, пентахлорфенол, пентоксазон, петоксамид, нефтяные масла,
- 30 фенмедифам, пиклорам, пиколинафен, пиноксаден, пиперофос, претилахлор, примисульфурон, примисульфурон-метил, продиамин, профоксидим, прометон, прометрин, пропахлор, пропанил, пропаквизафоп, пропазин, профам, пропизохлор, пропоксикарбазон, пропоксикарбазон-натрий, пропирисульфурон, пропизамид, просульфокарб, просульфурон, пираклонил, пирафлуфен, пирафлуфен-этил,

пирасульфотол, пиразолинат (пиразолат), пиразосульфурон, пиразосульфурон-этил, пиразоксифен,

пирибамбенз, пирибамбенз-изопропил, пирибамбенз-пропил, пирибензоксим, пирибутикарб, пиридафол, пиридат, пирифталид, пириминобак, пириминобак-метил,

5 пирымисульфан, пиритиобак, пиритиобак-натрий, пироксасульфурон, пироксулам, квинкlorак, квинмерак, квинокламин, квизалофоп, квизалофоп-этил, квизалофоп-Р, квизалофоп-Р-этил, квизалофоп-Р-тефурил, римсульфурон, сафлуфенацил, сетоксидим, сидурон,

симазин, симетрин, SL-261, сулькотрион, сульфентразон, сульфометурон,

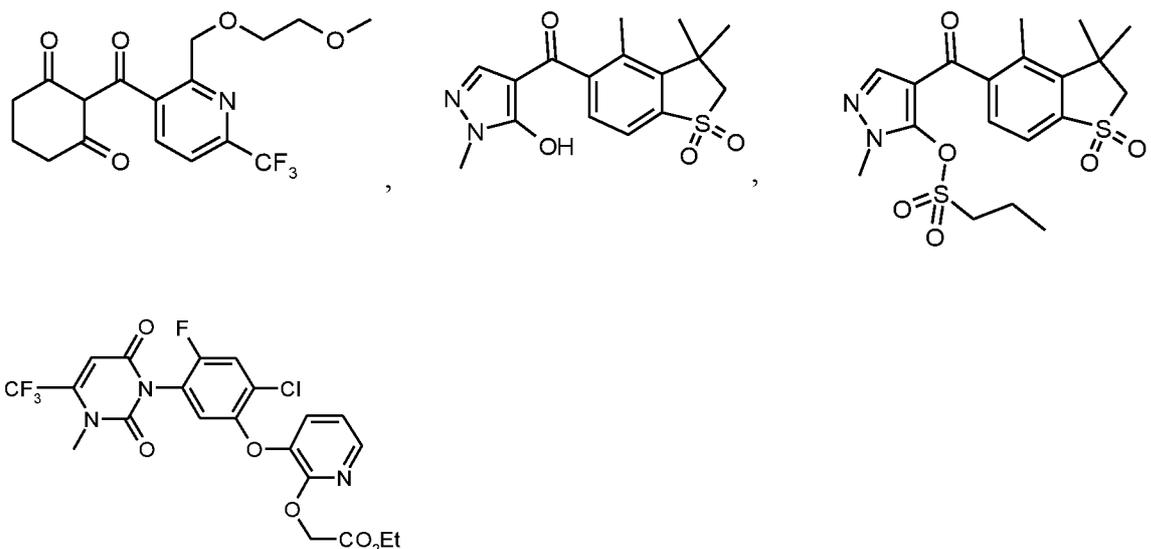
10 сульфометурон-метил, сульфосульфурон, SYN-523, SYP-249, т. е. 1-этоксидиметил-1-оксобут-3-ен-2-ил-5-[2-хлор-4-(трифторметил)феноксидиметил]-2-нитробензоат, SYP-300, т. е. 1-[7-фтор-3-оксо-4-(проп-2-ин-1-ил)-3,4-дигидро-2Н-1,4-бензоксазин-6-ил]-3-пропил-2-тиоксоимидазолидин-4,5-дион, 2,3,6-ТВА, ТСА (трифторуксусная кислота), ТСА-натрий, тебутиурон, тефурилтрион, темботрион, тепралоксидим, тербацил,

15 тербукарб, тербуметон, тербутилазин, тербутрин, тенилхлор, тиазопир, тиенкарбазон, тиенкарбазон-метил, тифенсульфурон, тифенсульфурон-метил, тиобенкарб,

тиафенацил, толпиралат, топрамезон, тралкоксидим, триафамон, триаллат, триасульфурон, триазифлам, трибенурон, трибенурон-метил, триклопир,

триэтазин, трифлорисульфурон, трифлорисульфурон-натрий, трифлудимоксазин,

20 трифлуралин, трифлусульфурон, трифлусульфурон-метил, тритосульфурон, сульфат мочевины, вернолат, XDE-848, ZJ-0862, т. е. 3,4-дихлор-N-{2-[(4,6-диметоксипиримидин-2-ил)окси]бензил}анилин и следующие соединения:



Примерами регуляторов роста растений в качестве возможных компонентов для образования смеси являются:

- ацибензолар, ацибензолар-S-метил, 5-аминолевулиновая кислота, анцимидол, 6-бензиламинопурин, брассинолид, катехол, хлормекват хлорид, клопроп, цикланилид, 3-(циклопроп-1-енил)пропионовая кислота, даминозид, дазомет, н-деканол, дикегулак, дикегулак-натрий, эндотал, эндотал-дикалий, -динатрий и моно(N,N-диметилалкиламмоний), этефон, флуметралин, флуренол, флуренол-бутил, флурпримидол, форхлорфенурон, гиббереллиновая кислота, инабенфид, индол-3-уксусная кислота (IAA), 4-индол-3-илмасляная кислота, изопротиолан, пробеназол, жасмоновая кислота, сложный метиловый эфир жасмоновой кислоты, малеиновый гидразид, мепикват хлорид, 1-метилциклопропен, 2-(1-нафтил)ацетамид, 1-нафтилуксусная кислота, 2-нафтилоксиуксусная кислота, нитрофенолатная смесь, 4-оксо-4[(2-фенилэтил)амино]масляная кислота, паклобутразол, N-фенилфталамовая кислота, прогексадион, прогексадион-кальций, прогидрожасмон, салициловая кислота, стриголактон, текназен, тидиазурон, триаконтанол, тринексапак, тринексапак-этил, цитодеф, униканазол, униканазол-II.

В качестве компонентов для образования комбинации с соединениями формулы (I) в соответствии с настоящим изобретением также пригодны, например, следующие antidotes:

- S1) соединения из группы производных гетероциклических карбоновых кислот:
- S1^a) соединения типа дихлорфенилпиразолин-3-карбоновой кислоты (S1^a), предпочтительно соединения, такие как 1-(2,4-дихлорфенил)-5-(этоксикарбонил)-5-метил-2-пиразолин-3-карбоновая кислота, этил-1-(2,4-дихлорфенил)-5-(этоксикарбонил)-5-метил-2-пиразолин-3-карбоксилат (S1-1) ("мефенпир-диэтил") и родственные соединения, как описано в WO-A-91/07874;
- S1^b) производные дихлорфенилпиразолкарбоновой кислоты (S1^b), предпочтительно соединения, такие как этил-1-(2,4-дихлорфенил)-5-метилпиразол-3-карбоксилат (S1-2), этил-1-(2,4-дихлорфенил)-5-изопропилпиразол-3-карбоксилат (S1-3),

этил-1-(2,4-дихлорфенил)-5-(1,1-диметилэтил)пиразол-3-карбоксилат (S1-4) и родственные соединения, как описано в EP-A-333131 и EP-A-269806;

5 S1^c) производные 1,5-дифенилпиразол-3-карбоновой кислоты (S1^c), предпочтительно соединения, такие как этил-1-(2,4-дихлорфенил)-5-фенилпиразол-3-карбоксилат (S1-5), метил-1-(2-хлорфенил)-5-фенилпиразол-3-карбоксилат (S1-6) и родственные соединения, как описано, например, в EP-A-268554;

10 S1^d) соединения типа триазолкарбоновой кислоты (S1^d), предпочтительно соединения, такие как фенхлоразол (сложный этиловый эфир), т. е. этил-1-(2,4-дихлорфенил)-5-трихлорметил-(1H)-1,2,4-триазол-3-карбоксилат (S1-7), и родственные соединения, как описано в EP-A-174562 и EP-A-346620;

15 S1^e) соединения типа 5-бензил- или 5-фенил-2-изоксазолин-3-карбоновой кислоты или 5,5-дифенил-2-изоксазолин-3-карбоновой кислоты (S1^e), предпочтительно соединения, такие как этил-5-(2,4-дихлорбензил)-2-изоксазолин-3-карбоксилат (S1-8) или этил-5-фенил-2-изоксазолин-3-карбоксилат (S1-9) и родственные соединения, как описано в WO-A-91/08202, или 5,5-дифенил-2-изоксазолинкарбоновая кислота (S1-10), или этил-5,5-дифенил-2-изоксазолин-3-карбоксилат (S1-11) ("изоксадифен-этил"), или н-пропил-5,5-дифенил-2-изоксазолин-3-карбоксилат (S1-12), или этил-5-(4-фторфенил)-5-фенил-2-изоксазолин-3-карбоксилат (S1-13), как описано в заявке на патент WO-A-20 95/07897;

S2) соединения из группы 8-хинолиноксипроизводных (S2):

25 S2^a) соединения типа 8-хинолиноксисукусной кислоты (S2^a), предпочтительно 1-метилгексил-(5-хлор-8-хинолинокси)ацетат ("клоквинтосет-мексил") (S2-1), 1,3-диметилбут-1-ил-(5-хлор-8-хинолинокси)ацетат (S2-2), 4-аллилоксибутил-(5-хлор-8-хинолинокси)ацетат (S2-3), 1-аллилоксипроп-2-ил-(5-хлор-8-хинолинокси)ацетат (S2-4), этил(5-хлор-8-хинолинокси)ацетат (S2-5),

метил-(5-хлор-8-хинолинокси)ацетат (S2-6),

30 аллил-(5-хлор-8-хинолинокси)ацетат (S2-7), 2-(2-пропилидениминокси)-1-этил(5-хлор-8-хинолинокси)ацетат (S2-8), 2-оксопроп-1-ил(5-хлор-8-хинолинокси)ацетат (S2-9) и родственные соединения, как описано в EP-A-86750, EP-A-94349 и EP-A-

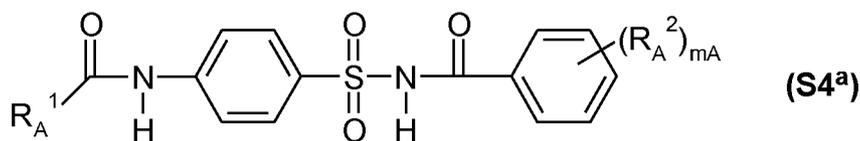
191736 или EP-A-0492366, а также (5-хлор-8-хинолинокси)уксусная кислота (S2-10), гидраты и их соли, например их соли, образованные с литием, натрием, калием, кальцием, магнием, алюминием, железом, аммонием, четвертичным аммонием, сульфонием или фосфонием, как описано в WO-A-2002/34048;

- 5 S2^b) соединения типа (5-хлор-8-хинолинокси)малоновой кислоты (S2^b), предпочтительно соединения, такие как диэтил-(5-хлор-8-хинолинокси)малонат, диаллил-(5-хлор-8-хинолинокси)малонат, метилэтил-(5-хлор-8-хинолинокси)малонат и родственные соединения, как описано в EP-A-0582198;
- 10 S3) активные ингредиенты дихлорацетамидного типа (S3), которые зачастую применяются в качестве довсходовых антидотов (антидотов, действующих в почве), например,
- "дихлормид" (N,N-диаллил-2,2-дихлорацетамид) (S3-1),
- "R-29148" (3-дихлорацетил-2,2,5-триметил-1,3-оксазолидин) от Stauffer (S3-2),
- "R-28725" (3-дихлорацетил-2,2-диметил-1,3-оксазолидин) от Stauffer (S3-3),
- 15 "беноксакор" (4-дихлорацетил-3,4-дигидро-3-метил-2H-1,4-бензоксазин) (S3-4),
- "PPG-1292" (N-аллил-N-[(1,3-диоксолан-2-ил)метил]дихлорацетамид) от PPG Industries (S3-5),
- "DKA-24" (N-аллил-N-[(аллиламинокарбонил)метил]дихлорацетамид) от Sagro-Chem (S3-6),
- 20 "AD-67" или "MON 4660" (3-дихлорацетил-1-окса-3-азаспиро[4.5]декан) от Nitrokemia или Monsanto (S3-7),
- "TI-35" (1-дихлорацетилазепан) от TRI-Chemical RT (S3-8),
- "Diclonon" (дициклонон) или "BAS145138" или "LAB145138" (S3-9),
- 25 ((RS)-1-дихлорацетил-3,3,8a-триметилпергидропирроло[1,2-a]пиримидин-6-он) от BASF,

"фурилазол" или "MON 13900" ((RS)-3-дихлорацетил-5-(2-фурил)-2,2-диметилпиперазин) (S3-10) и (R)-изомер каждого из них (S3-11);

S4) соединения из класса ацилсульфонамидов (S4):

S4^a) N-ацилсульфонамиды формулы (S4^a) и их соли, как описано в WO-A-97/45016,



в которых

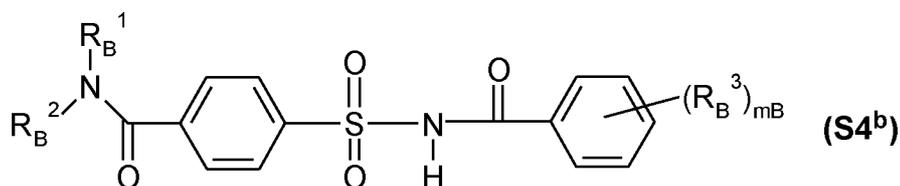
10 R_A^1 представляет собой (C₁-C₆)алкил, (C₃-C₆)циклоалкил, где 2 последних радикала замещены v_A заместителями из группы галогена, (C₁-C₄)алкокси, (C₁-C₆)галогеналкокси и (C₁-C₄)алкилтио, и, в случае циклических радикалов, также (C₁-C₄)алкилом и (C₁-C₄)галогеналкилом;

R_A^2 представляет собой галоген, (C₁-C₄)алкил, (C₁-C₄)алкокси, CF₃;

m_A равняется 1 или 2;

v_A равняется 0, 1, 2 или 3;

15 S4^b) соединения 4-(бензоилсульфамойл)бензамидного типа формулы (S4^b) и их соли, как описано в WO-A-99/16744,



в которых

20 R_B^1 , R_B^2 независимо представляют собой водород, (C₁-C₆)алкил, (C₃-C₆)циклоалкил, (C₃-C₆)алкенил, (C₃-C₆)алкинил,

R_B^3 представляет собой галоген, (C₁-C₄)алкил, (C₁-C₄)галогеналкил или (C₁-C₄)алкокси, и

m_B равняется 1 или 2,

например, соединения, в которых

R_B^1 = циклопропил, R_B^2 = водород, и $(R_B^3) = 2\text{-OMe}$ ("ципросульфамид", S4-1),

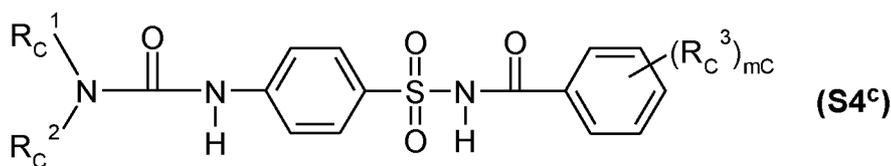
R_B^1 = циклопропил, R_B^2 = водород, и $(R_B^3) = 5\text{-Cl-2-OMe}$ (S4-2),

5 R_B^1 = этил, R_B^2 = водород, и $(R_B^3) = 2\text{-OMe}$ (S4-3),

R_B^1 = изопропил, R_B^2 = водород, и $(R_B^3) = 5\text{-Cl-2-OMe}$ (S4-4), и

R_B^1 = изопропил, R_B^2 = водород, и $(R_B^3) = 2\text{-OMe}$ (S4-5);

S4^c) соединения из класса бензоилсульфамойлфенилмочевин формулы (S4^c), как описано в EP-A-365484,



в которых

R_C^1, R_C^2 независимо представляют собой водород, $(C_1\text{-}C_8)$ алкил, $(C_3\text{-}C_8)$ циклоалкил, $(C_3\text{-}C_6)$ алкенил, $(C_3\text{-}C_6)$ алкинил,

R_C^3 представляет собой галоген, $(C_1\text{-}C_4)$ алкил, $(C_1\text{-}C_4)$ алкокси, CF_3 , и

15 m_C равняется 1 или 2;

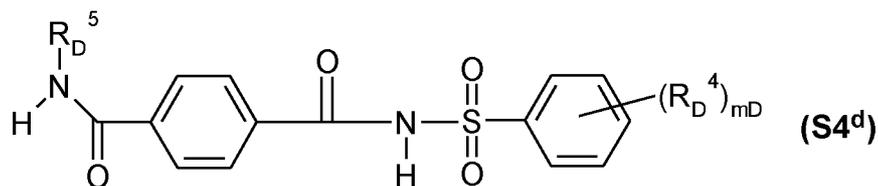
например,

1-[4-(N-2-метоксибензоилсульфамойл)фенил]-3-метилмочевина,

1-[4-(N-2-метоксибензоилсульфамойл)фенил]-3,3-диметилмочевина,

1-[4-(N-4,5-диметилбензоилсульфамойл)фенил]-3-метилмочевина;

S4^d) соединения N-фенилсульфонилтерефталамидного типа формулы (S4^d) и их соли, которые известны, например, из CN 101838227,



в которых

5 R_D⁴ представляет собой галоген, (C₁-C₄)алкил, (C₁-C₄)алкокси, CF₃;

m_D равняется 1 или 2;

R_D⁵ представляет собой водород, (C₁-C₆)алкил, (C₃-C₆)циклоалкил, (C₂-C₆)алкенил, (C₂-C₆)алкинил, (C₅-C₆)циклоалкенил;

10 S5) активные ингредиенты из класса производных гидроксиароматических и ароматических-алифатических карбоновых кислот (S5), например,

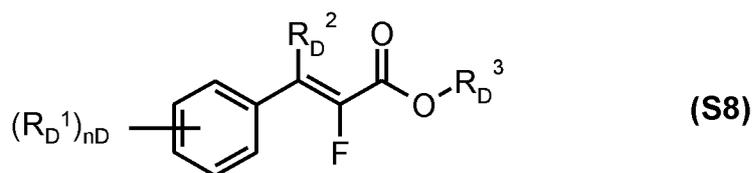
этил-3,4,5-триацетоксибензоат, 3,5-диметокси-4-гидроксибензойная кислота, 3,5-дигидроксибензойная кислота, 4-гидроксисалициловая кислота, 4-фторсалицилическая кислота, 2-гидроксикоричная кислота, 2,4-дихлоркоричная кислота, как описано в WO-A-2004/084631, WO-A-2005/015994, 15 WO-A-2005/016001;

S6) активные ингредиенты из класса 1,2-дигидрохиноксалин-2-онов (S6), например,

1-метил-3-(2-тиенил)-1,2-дигидрохиноксалин-2-он, 1-метил-3-(2-тиенил)-1,2-дигидрохиноксалин-2-тион, 1-(2-аминоэтил)-3-(2-тиенил)-1,2-дигидрохиноксалин-2-она гидрохлорид, 1-(2-метилсульфоаминоэтил)-3-(2-тиенил)-1,2-дигидрохиноксалин-2-он, как описано в WO-A-2005/112630; 20

S7) соединения из класса производных дифенилметоксиуксусной кислоты (S7), например, метилдифенилметоксиацетат (регистрационный номер по CAS 41858-19-9) (S7-1), этилдифенилметоксиацетат или дифенилметоксиуксусная кислота, как описано в WO-A-98/38856;

S8) соединения формулы (S8), как описано в WO-A-98/27049,



в которых символы и индексы определены следующим образом:

5 R_D^1 представляет собой галоген, (C₁-C₄)алкил, (C₁-C₄)галогеналкил, (C₁-C₄)алкокси, (C₁-C₄)галогеналкокси,

R_D^2 представляет собой водород или (C₁-C₄)алкил,

10 R_D^3 представляет собой водород, (C₁-C₈)алкил, (C₂-C₄)алкенил, (C₂-C₄)алкинил или арил, где каждый из вышеуказанных углеродсодержащих радикалов является незамещенным или замещен одним или несколькими, предпочтительно не более чем тремя идентичными или различными радикалами из группы, состоящей из галогена и алкокси; или их соли,

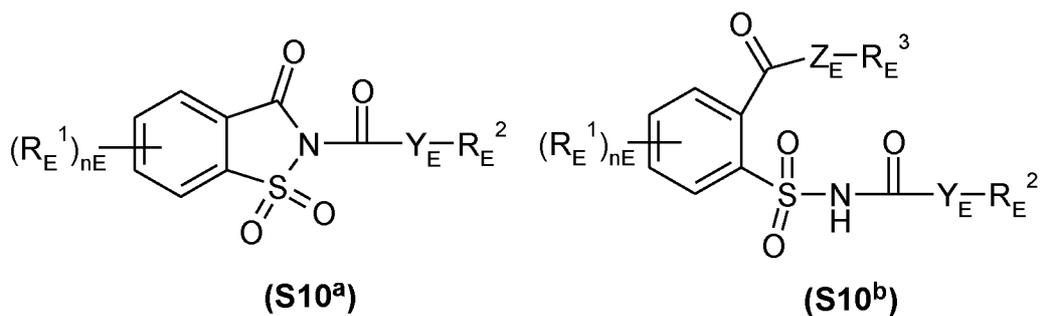
n_D представляет собой целое число от 0 до 2;

S9) активные ингредиенты из класса 3-(5-тетразолилкарбонил)-2-хинолонов (S9), например,

15 1,2-дигидро-4-гидрокси-1-этил-3-(5-тетразолилкарбонил)-2-хинолон (регистрационный номер по CAS: 219479-18-2), 1,2-дигидро-4-гидрокси-1-метил-3-(5-тетразолилкарбонил)-2-хинолон (регистрационный номер по CAS 95855-00-8), как описано в WO-A-1999/000020;

S10) соединения формулы (S10^a) или (S10^b),

20 как описано в WO-A-2007/023719 и WO-A-2007/023764,



в которых

R_E^1 представляет собой галоген, (C_1-C_4) алкил, метокси, нитро, циано, CF_3 , OCF_3 ,

Y_E, Z_E независимо представляют собой O или S,

5 n_E представляет собой целое число от 0 до 4,

R_E^2 представляет собой (C_1-C_{16}) алкил, (C_2-C_6) алкенил, (C_3-C_6) циклоалкил, арил; бензил, галогенбензил,

R_E^3 представляет собой водород или (C_1-C_6) алкил;

10 S11) активные ингредиенты типа оксииминосоединения (S11), которые известны как средства для протравливания семян, например,

"оксабетринил" ((Z)-1,3-диоксолан-2-илметоксиимино(фенил)ацетонитрил) (S11-1), который известен как антидот для протравливания семян для проса/сорго от повреждения, вызываемого метолахлором,

15 "флуксофеним" (1-(4-хлорфенил)-2,2,2-трифтор-1-этанон-O-(1,3-диоксолан-2-илметил)оксим) (S11-2), который известен как антидот для протравливания семян для проса/сорго от повреждения, вызываемого метолахлором, и

"циометринил" или "CGA-43089" ((Z)-цианометоксиимино(фенил)ацетонитрил) (S11-3), который известен как антидот для протравливания семян для проса/сорго от повреждения, вызываемого метолахлором;

20 S12) активные ингредиенты из класса изотиохроманонов (S12), например, метил[(3-оксо-1H-2-бензотиопиран-4(3H)-илиден)метокси]ацетат (регистрационный

номер по CAS 205121-04-6) (S12-1) и родственные соединения из WO-A-1998/13361;

S13) одно или несколько соединений из группы (S13):

5 "нафтойный ангидрид" (1,8-нафталиндикарбоновый ангидрид) (S13-1), который известен как антидот для протравливания семян для кукурузы от повреждения, вызываемого тиокарбаматным гербицидом,

"фенклорим" (4,6-дихлор-2-фенилпиримидин) (S13-2), который известен как антидот для претилахлора в культивируемом рисе,

10 "флуразол" (бензил-2-хлор-4-трифторметил-1,3-тиазол-5-карбоксилат) (S13-3), который известен как антидот для протравливания семян для проса/сорго от повреждения, вызываемого алахлором и метолахлором,

"CL 304415" (регистрационный номер по CAS 31541-57-8),

15 (4-карбокси-3,4-дигидро-2H-1-бензопиран-4-уксусная кислота) (S13-4) от American Cyanamid, который известен как антидот для кукурузы от повреждения, вызываемого имидазолинонами,

"MG 191" (регистрационный номер по CAS 96420-72-3) (2-дихлорметил-2-метил-1,3-диоксолан) (S13-5) от Nitrokemia, который известен как антидот для кукурузы,

"MG 838" (регистрационный номер по CAS 133993-74-5),

20 (2-пропенил-1-окса-4-азаспиро[4.5]декан-4-карбодитиоат) (S13-6) от Nitrokemia,

"дисульфотон" (O,O-диэтил-S-2-этилтиоэтилфосфородитиоат) (S13-7),

"диэтолат" (O,O-диэтил-O-фенилфосфоротиоат) (S13-8),

"мефенат" (4-хлорфенилметилкарбамат) (S13-9);

25 S14) активные ингредиенты, которые в дополнение к гербицидному действию в отношении вредоносных растений также характеризуются антидотным действием в отношении культурных растений, таких как рис, например,

"димепиперат" или "МУ-93" (*S*-1-метил-1-фенилэтилпиперидин-1-карботиоат),
 который известен как антидот для риса от повреждения, вызываемого
 гербицидом молинатом,

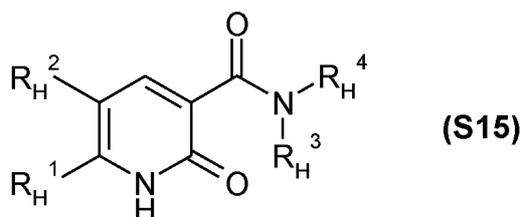
5 "даимурон" или "SK 23" (1-(1-метил-1-фенилэтил)-3-*p*-толилмочевина), которые
 известны как антидот для риса от повреждения, вызываемого гербицидом
 имазосульфуроном,

"кумилурон" = "JC-940" (3-(2-хлорфенилметил)-1-(1-метил-1-
 фенилэтил)мочевина, см. JP-A-60087254), который известен как антидот для
 риса от повреждения, вызываемого некоторыми гербицидами,

10 "метоксифенон" или "NK 049" (3,3'-диметил-4-метоксибензофенон), которые
 известны как антидот для риса от повреждения, вызываемого некоторыми
 гербицидами,

"CSB" (1-бром-4-(хлорметилсульфонил)бензол) от Kumiai (регистрационный
 номер по CAS 54091-06-4), который известен как антидот от повреждения,
 15 вызываемого некоторыми гербицидами, в рисе;

S15) соединения формулы (S15) или их таутомеры,



как описано в WO-A-2008/131861 и WO-A-2008/131860,

в которых

20 R_H^1 представляет собой (C_1 - C_6)галогеналкильный радикал, и

R_H^2 представляет собой водород или галоген, и

R_H^3, R_H^4 независимо представляют собой водород, (C_1 - C_{16})алкил, (C_2 - C_{16})алкенил
 или (C_2 - C_{16})алкинил,

где каждый из 3 последних радикалов является незамещенным или замещен одним или несколькими радикалами из группы, состоящей из галогена, гидроксила, циано, (C₁-C₄)алкокси, (C₁-C₄)галогеналкокси, (C₁-C₄)алкилтио, (C₁-C₄)алкиламино, ди[(C₁-C₄)алкил]амино, [(C₁-C₄)алкокси]карбонила, [(C₁-C₄)галогеналкокси]карбонила, (C₃-C₆)циклоалкила, который является незамещенным или замещенным, фенила, который является незамещенным или замещенным, и гетероциклила, который является незамещенным или замещенным,

или (C₃-C₆)циклоалкил, (C₄-C₆)циклоалкенил, (C₃-C₆)циклоалкил, конденсированный с одной стороны кольца с 4-6-членным насыщенным или ненасыщенным карбоциклическим кольцом, или (C₄-C₆)-циклоалкенил, конденсированный с одной стороны кольца с 4-6-членным насыщенным или ненасыщенным карбоциклическим кольцом,

где каждый из 4 последних радикалов является незамещенным или замещен одним или несколькими радикалами из группы, состоящей из галогена, гидроксила, циано, (C₁-C₄)алкила, (C₁-C₄)галогеналкила, (C₁-C₄)алкокси, (C₁-C₄)галогеналкокси, (C₁-C₄)алкилтио, (C₁-C₄)алкиламино, ди[(C₁-C₄)алкил]амино, [(C₁-C₄)алкокси]карбонила, [(C₁-C₄)галогеналкокси]карбонила, (C₃-C₆)циклоалкила, который является незамещенным или замещенным, фенила, который является незамещенным или замещенным, и гетероциклила, который является незамещенным или замещенным,

или

R_H^3 представляет собой (C₁-C₄)алкокси, (C₂-C₄)алкенилокси, (C₂-C₆)алкинилокси или (C₂-C₄)галогеналкокси, и

R_H^4 представляет собой водород или (C₁-C₄)алкил, или

R_H^3 и R_H^4 вместе с непосредственно связанным атомом азота представляют собой четырех - восьми-членное гетероциклическое кольцо, которое помимо атома азота может также содержать дополнительные гетероатомы кольца, предпочтительно не более двух дополнительных гетероатомов кольца из

группы, состоящей из N, O и S, и которое является незамещенным или замещено одним или несколькими радикалами из группы, состоящей галогена, циано, нитро, (C₁-C₄)алкила, (C₁-C₄)галогеналкила, (C₁-C₄)алкокси, (C₁-C₄)галогеналкокси и (C₁-C₄)алкилтио;

- 5 S16) активные ингредиенты, которые применяют преимущественно в качестве гербицидов, но которые также характеризуются антидотным действием в отношении культурных растений, например,
- (2,4-дихлорфенокси)уксусная кислота (2,4-D),
- (4-хлорфенокси)уксусная кислота,
- 10 (R,S)-2-(4-хлор-о-толилокси)пропионовая кислота (мекопроп),
- 4-(2,4-дихлорфенокси)масляная кислота (2,4-DB),
- (4-хлор-о-толилокси)уксусная кислота (MCPA),
- 4-(4-хлор-о-толилокси)масляная кислота,
- 4-(4-хлорфенокси)масляная кислота,
- 15 3,6-дихлор-2-метоксибензойная кислота (дикамба),
- 1-(этоксикарбонил)этил-3,6-дихлор-2-метоксибензоат (лактидихлор-этил).

- Предпочтительные антидоты в комбинации с соединениями формулы (I) в соответствии с настоящим изобретением и/или их солями, особенно с соединениями формул (I.1)-(I.50) и/или их солями, представляют собой клоквинтосет-мексил,
- 20 ципросульфамид, сложный этиловый эфир фенхлоразола, изоксадифен-этил, мефенпир-диэтил, фенклорим, кумилурон, S4-1 и S4-5, и, в частности, предпочтительные антидоты представляют собой клоквинтосет-мексил, ципросульфамид, изоксадифен-этил и мефенпир-диэтил.

Биологические примеры

А. Гербицидное действие и совместимость с сельскохозяйственной культурой после появления всходов

5

Семена одно- и двудольных сорных растений и культурных растений выкладывали в супесчаную почву в пластиковых или древесноволокнистых горшках, покрывали почвой и выращивали в контролируемых условиях роста в теплице. Испытуемые растения обрабатывали на стадии одного листа через 2-3 недели после посева.

10 Соединения по настоящему изобретению, составленные в виде смачиваемых порошков (WP) или концентратов эмульсии (EC), затем распыляли на зеленые части растения в виде водной суспензии или эмульсии с добавлением 0,5% добавки с эквивалентной нормой применения воды 600 л/га. После того как испытуемые растения простояли в течение приблизительно 3 недель в теплице, в оптимальных условиях роста, эффект препаратов оценивали визуально путем сравнения с необработанными контролями.

15 Например, 100% эффективность соответствовала состоянию, когда растения погибли, 0% эффективность соответствовала контрольным растениям.

Значения совместимости с культурными растениями также оценивали соответственно.

20 В таблицах А1-А16 ниже показаны значения эффективности выбранных соединений общей формулы (I) в соответствии с таблицами I.1-I.50 в отношении различных вредоносных растений и норма применения, соответствующая 80 г/га или ниже, которые получали с помощью вышеуказанного способа испытания.

25 Таблица А1

Соединение № примера	<i>Alopecurus myosuroides</i> (Эффективность в %)	Норма применения [г/га]
I.1-2	100	80
I.1-3	100	80
I.1-22	80	80
I.1-23	90	80
I.1-127	90	80
I.1-132	80	80
I.1-141	90	80
I.1-151	90	80

Соединение № примера	<i>Alopecurus myosuroides</i> (Эффективность в %)	Норма применения [г/га]
I.1-182	80	80
I.1-183	80	80
I.1-184	80	80
I.1-242	90	20
I.1-251	100	80
I.1-255	90	80
I.2-2	100	80
I.8-2	80	80
I.8-127	80	80
I.1-32	80	80
I.1-142	80	20
I.1-2-3	90	20
I.1-144	80	20
I.1-8	90	80
I.1-43	80	20
I.1-46	80	20
I.2-6	80	20
I.2-32	80	20
I.5-3	80	20
I.5-2	80	20
I.1-233	90	20
I.1-153	90	20
I.1-152	80	20

Таблица А2

Соединение № примера	<i>Echinochloa crus-galli</i> (Эффективность в %)	Норма применения [г/га]
I.1-1	100	80
I.1-2	100	80
I.1-3	100	80
I.1-5	100	80
I.1-22	100	80
I.1-23	100	80
I.1-42	100	20
I.1-72	100	80
I.1-127	100	80
I.1-132	100	80
I.1-141	100	80
I.1-151	100	80
I.1-182	100	80

Соединение № примера	Echinochloa crus-galli (Эффективность в %)	Норма применения [г/га]
I.1-183	100	80
I.1-184	100	80
I.1-241	100	80
I.1-242	100	80
I.1-251	100	80
I.1-254	100	80
I.1-255	100	80
I.2-2	100	80
I.8-2	100	80
I.8-23	100	80
I.8-42	100	80
I.8-127	100	20
I.46-2	100	80
I.1-32	100	80
I.1-142	100	20
I.1-102	100	20
I.1-2-3	100	20
I.1-144	100	20
I.1-8	100	80
I.11-3	100	20
I.1-43	100	20
I.8-43	90	20
I.1-51	100	20
I.8-46	90	20
I.1-46	100	20
I.8-51	90	20
I.47-3	80	20
I.2-6	100	20
I.2-8	100	20
I.2-32	100	20
I.2-43	100	20
I.2-145	100	20
I.5-3	100	20
I.5-2	100	20
I.12-3	100	20
I.1-293	90	20
I.1-233	100	20
I.1-231	100	20
I.1-153	100	20
I.1-152	100	20

Таблица А3

Соединение № примера	<i>Setaria viridis</i> (Эффективность в %)	Норма применения [г/га]
I.1-1	100	80
I.1-2	100	80
I.1-3	100	80
I.1-5	100	80
I.1-22	100	80
I.1-23	100	80
I.1-42	100	20
I.1-72	100	20
I.1-127	100	80
I.1-132	100	80
I.1-141	100	20
I.1-151	100	80
I.1-183	100	80
I.1-184	100	20
I.1-241	100	80
I.1-242	100	80
I.1-251	100	20
I.1-254	100	80
I.1-255	100	80
I.2-2	100	80
I.8-2	100	80
I.8-23	100	80
I.8-42	100	80
I.8-127	100	20
I.46-2	100	80
I.1-32	100	80
I.1-142	100	20
I.1-102	100	20
I.1-2-3	100	20
I.1-144	100	20
I.1-8	100	80
I.1-43	100	20
I.8-43	100	20
I.1-51	100	20
I.8-46	100	20
I.1-46	100	20
I.8-51	100	20
I.8-44	100	20
I.47-6	100	20

Соединение № примера	<i>Setaria viridis</i> (Эффективность в %)	Норма применения [г/га]
I.47-3	100	20
I.2-6	100	20
I.2-8	100	20
I.2-32	100	20
I.2-43	100	20
I.6-3	100	20
I.2-145	100	20
I.4-3	90	20
I.5-3	100	20
I.5-2	100	20
I.12-3	100	20
I.14-3	90	20
I.1-293	90	20
I.1-233	100	20
I.1-231	100	20
I.1-153	100	20
I.1-152	100	20

Таблица А4

Соединение № примера	<i>Abrutylon theophrasti</i> (Эффективность в %)	Норма применения [г/га]
I.1-1	100	80
I.1-2	100	80
I.1-3	100	80
I.1-5	100	80
I.1-22	100	80
I.1-23	100	80
I.1-42	100	20
I.1-72	100	20
I.1-127	100	80
I.1-132	100	80
I.1-141	100	80
I.1-151	100	80
I.1-182	100	80
I.1-183	100	80
I.1-184	100	80
I.1-241	100	80
I.1-242	100	80
I.1-251	100	80
I.1-254	100	80

Соединение № примера	Abutilon theophrasti (Эффективность в %)	Норма применения [г/га]
I.1-255	100	80
I.2-2	100	80
I.8-2	100	80
I.8-23	100	80
I.8-42	100	80
I.8-127	100	20
I.46-2	100	80
I.1-32	100	80
I.1-142	100	20
I.1-102	100	20
I.1-2-3	100	20
I.1-144	100	20
I.1-6	100	20
I.1-8	100	80
I.11-3	100	20
I.1-43	100	20
I.8-43	100	20
I.1-51	100	20
I.8-46	100	20
I.1-46	100	20
I.8-51	100	20
I.8-44	100	20
I.47-6	100	20
I.47-3	100	20
I.2-6	100	20
I.2-8	100	20
I.2-32	100	20
I.2-43	100	20
I.6-3	100	20
I.6-43	100	20
I.2-145	100	20
I.4-3	100	20
I.4-43	100	20
I.5-3	100	20
I.5-2	100	20
I.12-3	100	20
I.14-3	100	20
I.1-293	100	20
I.1-233	100	20
I.1-231	100	20
I.1-153	100	20
I.1-152	100	20

Таблица А5

Соединение № примера	Amaranthus retroflexus (Эффективность в %)	Норма применения [г/га]
I.1-1	100	20
I.1-2	100	80
I.1-3	100	80
I.1-5	100	80
I.1-22	100	80
I.1-23	100	80
I.1-42	100	20
I.1-72	100	20
I.1-127	100	20
I.1-132	100	80
I.1-141	100	80
I.1-151	100	80
I.1-182	100	80
I.1-183	100	80
I.1-184	100	80
I.1-241	100	80
I.1-242	100	80
I.1-251	100	80
I.1-254	100	80
I.1-255	100	80
I.2-2	100	80
I.8-2	100	20
I.8-23	100	80
I.8-42	100	20
I.8-127	100	20
I.46-2	100	80
I.1-32	100	80
I.1-142	100	20
I.1-102	100	20
I.1-2-3	100	20
I.1-144	100	20
I.1-6	100	20
I.1-8	100	80
I.1-43	100	20
I.8-43	100	20
I.1-51	100	20
I.8-46	100	20
I.1-46	100	20
I.8-51	100	20

Соединение № примера	<i>Amaranthus retroflexus</i> (Эффективность в %)	Норма применения [г/га]
I.8-44	100	20
I.47-6	100	20
I.47-3	100	20
I.2-6	100	20
I.2-8	100	20
I.2-32	100	20
I.2-43	100	20
I.6-3	100	20
I.2-145	100	20
I.4-3	100	20
I.4-43	100	20
I.5-3	100	20
I.5-2	100	20
I.12-3	100	20
I.14-3	100	20
I.1-293	100	20
I.1-233	100	20
I.1-231	100	20
I.1-153	100	20
I.1-152	100	20

Таблица А6

Соединение № примера	<i>Matricaria inodora</i> (Эффективность в %)	Норма применения [г/га]
I.1-1	100	80
I.1-2	100	80
I.1-3	100	80
I.1-5	100	80
I.1-22	100	80
I.1-23	100	80
I.1-42	100	20
I.1-72	100	80
I.1-127	100	80
I.1-132	90	80
I.1-141	100	80
I.1-151	100	80
I.1-182	100	80
I.1-183	100	80
I.1-184	100	80
I.1-241	100	80

Соединение № примера	<i>Matricaria inodora</i> (Эффективность в %)	Норма применения [г/га]
I.1-242	100	80
I.1-251	100	80
I.1-254	100	80
I.1-255	100	80
I.2-2	100	80
I.8-2	100	20
I.8-23	100	20
I.8-42	100	20
I.8-127	100	20
I.46-2	100	20
I.1-32	100	80
I.1-142	100	20
I.1-102	100	20
I.1-2-3	100	20
I.1-144	100	20
I.1-8	100	80
I.11-3	90	20
I.1-43	100	20
I.8-43	100	20
I.1-51	100	20
I.8-46	100	20
I.1-46	100	20
I.8-51	100	20
I.8-44	100	20
I.47-3	100	20
I.2-6	100	20
I.2-8	100	20
I.2-32	100	20
I.2-43	100	20
I.6-3	100	20
I.2-145	100	20
I.4-3	80	20
I.4-43	90	20
I.5-3	100	20
I.5-2	100	20
I.1-293	100	20
I.1-233	100	20
I.1-231	100	20
I.1-153	100	20
I.1-152	100	20

Таблица А7

Соединение № примера	<i>Polygonum convolvulus</i> (Эффективность в %)	Норма применения [г/га]
I.1-1	100	80
I.1-2	100	20
I.1-3	100	80
I.1-5	100	80
I.1-22	100	80
I.1-23	100	80
I.1-42	100	20
I.1-72	100	80
I.1-127	100	80
I.1-132	100	80
I.1-141	100	80
I.1-151	100	80
I.1-182	100	80
I.1-183	100	80
I.1-184	100	80
I.1-241	100	80
I.1-242	100	80
I.1-251	100	80
I.1-254	100	80
I.1-255	100	80
I.2-2	100	80
I.8-2	100	20
I.8-23	100	20
I.8-42	100	80
I.8-127	100	80
I.46-2	100	20
I.1-32	100	80
I.1-142	100	20
I.1-102	100	20
I.1-2-3	100	20
I.1-144	100	20
I.1-8	100	80
I.1-43	100	20
I.8-43	100	20
I.1-51	100	20
I.8-46	100	20
I.1-46	100	20
I.8-51	100	20
I.8-44	100	5

Соединение № примера	<i>Polygonum convolvulus</i> (Эффективность в %)	Норма применения [г/га]
I.47-6	100	20
I.47-3	100	20
I.2-6	100	20
I.2-8	100	20
I.2-32	100	20
I.2-43	100	20
I.2-145	100	20
I.4-43	100	20
I.5-3	100	20
I.5-2	100	20
I.12-3	100	20
I.14-3	100	20
I.1-233	100	20
I.1-231	100	20
I.1-153	100	20
I.1-152	100	20

Таблица А8

Соединение № примера	<i>Stellaria media</i> (Эффективность в %)	Норма применения [г/га]
I.1-1	100	80
I.1-2	100	20
I.1-3	100	80
I.1-5	100	80
I.1-22	100	80
I.1-23	100	80
I.1-42	100	20
I.1-72	100	80
I.1-127	100	20
I.1-132	100	80
I.1-141	100	80
I.1-151	90	80
I.1-182	100	80
I.1-183	100	20
I.1-184	100	80
I.1-241	100	80
I.1-242	100	80
I.1-251	100	80
I.1-254	90	80
I.1-255	100	80

Соединение № примера	<i>Stellaria media</i> (Эффективность в %)	Норма применения [г/га]
I.2-2	100	80
I.8-2	100	20
I.8-23	100	80
I.8-42	100	80
I.8-127	100	20
I.46-2	80	80
I.1-32	100	80
I.1-142	100	20
I.1-102	80	20
I.1-2-3	100	20
I.1-144	80	20
I.1-8	100	80
I.11-3	100	20
I.1-43	80	20
I.8-43	80	20
I.1-51	100	20
I.8-46	100	20
I.1-46	100	20
I.8-44	100	20
I.47-6	80	20
I.2-6	100	20
I.2-8	100	20
I.2-43	100	20
I.6-3	100	20
I.6-43	90	20
I.2-145	100	20
I.4-43	80	20
I.5-3	100	20
I.5-2	100	20
I.12-3	100	20
I.1-293	100	20
I.1-233	100	20
I.1-231	100	20
I.1-153	100	20
I.1-152	100	20

Таблица А9

Соединение № примера	<i>Viola tricolor</i> (Эффективность в %)	Норма применения [г/га]
I.1-1	100	80

Соединение № примера	<i>Viola tricolor</i> (Эффективность в %)	Норма применения [г/га]
I.1-2	100	80
I.1-3	100	80
I.1-5	100	20
I.1-22	100	80
I.1-23	100	20
I.1-42	100	20
I.1-72	100	80
I.1-127	100	80
I.1-151	100	80
I.1-182	100	20
I.1-183	100	20
I.1-184	100	80
I.1-241	100	80
I.1-242	100	80
I.1-251	100	80
I.1-254	100	80
I.1-255	100	80
I.2-2	100	80
I.8-2	100	80
I.8-23	100	20
I.8-42	100	80
I.8-127	100	80
I.46-2	80	80
I.1-32	100	80
I.1-142	100	20
I.1-102	100	20
I.1-2-3	100	20
I.1-144	100	20
I.1-6	100	20
I.1-8	100	80
I.11-3	90	20
I.1-43	100	20
I.8-43	100	20
I.1-51	100	20
I.8-46	100	20
I.1-46	100	20
I.8-51	100	20
I.8-44	100	20
I.47-6	100	20
I.47-3	100	20
I.2-6	100	20
I.2-8	100	20

Соединение № примера	<i>Viola tricolor</i> (Эффективность в %)	Норма применения [г/га]
I.2-32	100	20
I.2-43	100	20
I.6-3	100	20
I.6-43	100	20
I.2-145	100	20
I.4-3	100	20
I.4-43	100	20
I.5-3	100	20
I.5-2	100	20
I.12-3	100	20
I.14-3	100	20
I.1-293	100	20
I.1-233	100	20
I.1-231	100	20
I.1-153	100	20
I.1-152	100	20

Таблица A10

Соединение № примера	<i>Veronica persica</i> (Эффективность в %)	Норма применения [г/га]
I.1-1	100	80
I.1-2	100	20
I.1-3	100	80
I.1-5	100	80
I.1-22	100	80
I.1-23	100	80
I.1-42	100	80
I.1-72	100	80
I.1-127	100	20
I.1-132	100	80
I.1-141	100	80
I.1-151	100	80
I.1-182	100	80
I.1-183	100	20
I.1-184	100	80
I.1-241	100	80
I.1-242	100	80
I.1-251	100	80
I.1-254	90	80
I.1-255	100	80

Соединение № примера	<i>Veronica persica</i> (Эффективность в %)	Норма применения [г/га]
I.2-2	100	20
I.8-2	100	80
I.8-23	100	80
I.8-42	100	80
I.8-127	100	20
I.46-2	80	80
I.1-32	100	80
I.1-142	100	20
I.1-102	100	20
I.1-2-3	100	20
I.1-144	100	20
I.1-6	100	20
I.1-8	100	80
I.1-43	100	20
I.8-43	100	20
I.1-51	100	20
I.8-46	100	20
I.1-46	100	20
I.8-51	100	20
I.8-44	100	20
I.47-6	100	20
I.47-3	100	20
I.2-6	100	20
I.2-8	100	20
I.2-32	100	20
I.2-43	100	20
I.6-3	100	20
I.6-43	100	5
I.2-145	100	20
I.4-3	80	20
I.4-43	100	20
I.5-3	100	20
I.5-2	100	20
I.12-3	100	20
I.14-3	100	20
I.1-293	100	20
I.1-233	100	20
I.1-231	100	20
I.1-153	100	20
I.1-152	100	20

Таблица А11

Соединение № примера	<i>Rhazbitis purpurea</i> (Эффективность в %)	Норма применения [г/га]
I.1-1	100	80
I.1-2	100	20
I.1-3	100	80
I.1-5	100	80
I.1-22	100	80
I.1-23	100	80
I.1-42	100	20
I.1-72	100	20
I.1-127	100	20
I.1-132	100	80
I.1-141	100	80
I.1-151	100	80
I.1-182	100	80
I.1-183	100	80
I.1-184	100	80
I.1-241	100	80
I.1-242	100	80
I.1-251	100	80
I.1-254	100	80
I.1-255	100	80
I.2-2	100	20
I.8-2	100	80
I.8-23	100	20
I.8-42	100	80
I.8-127	100	20
I.46-2	100	80
I.1-32	100	80
I.1-142	100	20
I.1-102	100	20
I.1-2-3	100	20
I.1-144	100	20
I.1-8	100	80
I.1-43	100	20
I.8-43	100	20
I.1-51	100	20
I.8-46	100	20
I.1-46	100	20
I.8-51	100	20
I.8-44	100	20
I.47-6	100	20

Соединение № примера	<i>Pharbitis purpurea</i> (Эффективность в %)	Норма применения [г/га]
I.47-3	100	20
I.2-6	100	20
I.2-8	100	20
I.2-32	100	20
I.2-43	100	20
I.5-3	100	20
I.5-2	100	20
I.12-3	100	5
I.14-3	100	20
I.1-233	100	20
I.1-231	100	20
I.1-153	100	20
I.1-152	100	20

Таблица A12

Соединение № примера	<i>Hordeum murinum</i> (Эффективность в %)	Норма применения [г/га]
I.1-2	100	20
I.1-5	80	80
I.1-127	90	80
I.1-184	80	80
I.1-242	90	80
I.1-254	100	80
I.1-254	80	80
I.8-2	80	20
I.2-2	80	80
I.8-42	80	80
I.1-102	100	20
I.1-144	80	20
I.1-8	90	80
I.1-46	100	20

Таблица A13

Соединение № примера	<i>Avena fatua</i> (Эффективность в %)	Норма применения [г/га]
I.1-2	80	80
I.1-3	80	80
I.1-127	80	80

Соединение № примера	<i>Avena fatua</i> (Эффективность в %)	Норма применения [г/га]
I.1-182	90	80
I.1-242	80	80
I.1-251	80	80
I.1-254	80	80
I.1-255	80	80
I.2-2	80	80
I.8-127	80	80
I.1-32	80	80
I.2-3	100	20
I.1-144	100	20
I.1-8	80	80

Таблица A14

Соединение № примера	<i>Lolium multiflorum</i> (Эффективность в %)	Норма применения [г/га]
I.1-3	100	80

Таблица A15

Соединение № примера	<i>Lolium rigidum</i> (Эффективность в %)	Норма применения [г/га]
I.1-1	80	80
I.1-2	90	80
I.1-5	80	80
I.1-22	90	80
I.1-23	90	80
I.1-42	90	80
I.1-127	100	80
I.1-182	100	80
I.1-183	100	80
I.1-184	100	80
I.1-241	90	80
I.1-242	100	80
I.1-251	100	80
I.1-255	100	80
I.2-2	80	80
I.8-2	90	80
I.8-127	90	80
I.1-32	100	80

Соединение № примера	<i>Lolium rigidum</i> (Эффективность в %)	Норма применения [г/га]
I.1-102	80	20
I.1-144	100	20
I.1-8	90	80
I.1-46	80	20
I.2-32	80	20
I.1-233	90	20
I.1-153	80	20
I.1-152	80	20

Таблица А16

Соединение № примера	<i>Digitaria sanguinalis</i> (Эффективность в %)	Норма применения [г/га]
I.1-32	100	80
I.1-142	100	20
I.1-102	100	20
I.1-2-3	100	20
I.1-144	80	20
I.1-8	100	80
I.1-43	100	20
I.1-51	90	20
I.1-46	100	20
I.8-51	100	20
I.47-6	80	20
I.47-3	100	20
I.2-6	80	20
I.2-8	100	20
I.2-32	100	20
I.2-43	100	20
I.6-3	100	20
I.2-145	100	20
I.5-3	80	20
I.5-2	80	20
I.12-3	100	20
I.1-293	100	20
I.1-233	100	20
I.1-231	100	20
I.1-153	100	20
I.1-152	100	20

В таблицах А17-А21 ниже показаны значения совместимости выбранных соединений общей формулы (I) в соответствии с таблицами I.1-I.50 с сельскохозяйственными культурами при норме применения, соответствующей 80 г/га или ниже, которые наблюдали в испытаниях в соответствии с вышеуказанным способом испытания. Далее приведены наблюдаемые эффекты в отношении выбранных культурных растений по сравнению с необработанными контролями (значения в %).

Таблица А17

Соединение № примера	<i>Oryza sativa</i> (Эффективность в %)	Норма применения [г/га]
I.1-32	20	20
I.1-102	0	5
I.1-2-3	0	20
I.1-144	20	5
I.1-6	0	20
I.1-8	20	5
I.11-3	10	20
I.8-51	0	20
I.47-6	20	20
I.47-3	20	20
I.2-6	10	20
I.2-8	0	20
I.2-32	0	20
I.2-43	20	20
I.6-3	20	20
I.6-43	0	20
I.2-145	0	20
I.4-43	10	20
I.12-3	0	20
I.14-3	0	20
I.1-233	20	20
I.1-231	10	5
I.1-153	10	5
I.1-152	10	5
I.1-3	20	20
I.1-72	10	20
I.8-42	0	20
I.1-42	10	20
I.1-22	0	5
I.2-2	20	5
I.46-2	20	80

Соединение № примера	Oryza sativa (Эффективность в %)	Норма применения [г/га]
I.8-23	20	5
I.1-241	10	5
I.1-242	20	5
I.1-183	20	20
I.1-254	0	80
I.1-255	0	80
I.1-251	20	20
I.1-182	20	20
I.1-145	20	5
I.1-151	10	20
I.1-141	0	20
I.1-132	20	80

Таблица A18

Соединение № примера	Zea mays (Эффективность в %)	Норма применения [г/га]
I.1-32	20	20
I.1-102	0	5
I.1-2-3	0	20
I.1-144	10	5
I.1-6	10	20
I.47-6	20	20
I.2-6	0	5
I.2-8	0	20
I.2-32	20	5
I.2-43	20	20
I.1-231	20	5
I.1-127	20	5
I.46-2	20	20
I.1-1	10	5
I.1-242	20	80
I.1-183	10	20
I.1-254	0	80
I.1-184	20	20
I.1-255	10	80
I.1-251	10	20
I.1-182	20	20
I.1-151	20	5
I.1-141	10	5
I.1-132	20	20

Таблица А19

Соединение № примера	Brassica napis (Эффективность в %)	Норма применения [г/га]
I.1-6	0	5
I.1-3	0	20
I.46-2	20	5
I.1-254	20	20
I.1-255	10	20

Таблица А20

Соединение № примера	Glycine max (Эффективность в %)	Норма применения [г/га]
I.47-6	20	5
I.2-6	20	5
I.2-43	20	5
I.14-3	20	20
I.1-152	20	5
I.46-2	20	5
I.1-241	10	5
I.1-254	20	20
I.1-255	20	20

5

Таблица А21

Соединение № примера	Triticum aestivum (Эффективность в %)	Норма применения [г/га]
I.1-32	20	5
I.1-142	20	20
I.1-6	0	20
I.1-8	20	20
I.11-3	10	5
I.1-43	10	5
I.8-43	10	5
I.1-51	0	5
I.8-46	20	5
I.1-46	20	20
I.8-51	20	20

Соединение № примера	Triticum aestivum (Эффективность в %)	Норма применения [г/га]
I.8-44	20	5
I.47-6	20	5
I.47-3	20	20
I.2-6	20	20
I.2-8	0	20
I.2-32	20	5
I.2-43	10	20
I.2-145	20	20
I.4-43	10	20
I.5-3	20	5
I.5-2	20	5
I.12-3	20	20
I.14-3	20	20
I.1-231	20	5
I.1-152	20	5
I.1-3	10	20
I.1-72	20	20
I.8-42	20	5
I.1-42	20	20
I.1-22	20	20
I.2-2	20	5
I.46-2	20	20
I.1-5	20	80
I.1-23	20	20
I.8-23	20	20
I.1-241	10	5
I.1-1	20	80
I.1-242	20	5
I.1-254	10	20
I.1-255	10	20
I.1-251	10	20
I.1-182	10	5
I.1-151	20	80
I.1-141	20	20
I.1-132	10	20

Как показывают результаты, соединения общей формулы (I) в соответствии с настоящим изобретением в случае обработки после появления всходов проявляют надлежащую гербицидную эффективность в отношении вредоносных растений, таких

как, например, *Abutilon theophrasti*, *Alopecurus myosuroides*, *Amaranthus retroflexus*, *Avena fatua*, *Echinochloa crus-galli*, *Hordeum murinum*, *Lolium multiflorum*, *Lolium rigidum*, *Matricaria inodora*, *Pharbitis purpurea*, *Polygonum convolvulus*, *Setaria viridis*, *Stellaria media*, *Veronica persica* и *Viola tricolor*, при норме применения 0,08 кг

5 активного вещества или меньше на гектар.

Испытуемые культурные растения *Brassica napus*, *Glycine max*, *Oryza sativa*, *Triticum aestivum* и *Zea mays* поражаются лишь в незначительной степени, если вообще поражаются, после применения соединений общей формулы (I) в соответствии с настоящим изобретением при норме применения от 0,005 до 0,08 кг активного

10 вещества на гектар.

В. Гербицидное действие и совместимость с сельскохозяйственной культурой до появления всходов

15 Семена одно- и двудольных сорняков и культурных растений выкладывали в пластиковые или органические горшки для выращивания растений и покрывали почвой. Соединения по настоящему изобретению, составленные в виде смачиваемых порошков (WP) или концентратов эмульсии (EC), затем применяли в отношении поверхности покрывающей почвы в виде водной суспензии или эмульсии с

20 добавлением 0,5% добавки с эквивалентной нормой применения воды 600 л/га. После обработки горшки помещали в теплицу и выдерживали в надлежащих условиях для роста испытуемых растений. Через приблизительно 3 недели эффективность препаратов оценивали визуально в процентах путем сравнения с необработанными контролями. Например, 100% эффективность соответствовала состоянию, когда

25 растения погибли, 0% эффективность соответствовала контрольным растениям. Значения совместимости с культурными растениями также оценивали соответственно.

В таблицах В1-В17 ниже показаны значения эффективности выбранных соединений общей формулы (I) в соответствии с таблицами I.1-I.50 в отношении различных

30 вредоносных растений и норма применения, соответствующая 320 г/га или ниже, которые получали с помощью вышеуказанного способа испытания.

Таблица В1

Соединение № примера	<i>Alopecurus myosuroides</i> (Эффективность в %)	Норма применения [г/га]
I.1-1	100	320
I.1-2	90	320
I.1-3	90	80
I.1-5	100	320
I.1-22	80	320
I.1-23	100	320
I.1-42	90	320
I.1-127	90	320
I.1-132	100	320
I.1-141	80	320
I.1-182	80	320
I.1-183	90	320
I.1-184	90	320
I.1-241	100	320
I.1-242	90	320
I.1-251	100	320
I.1-254	100	320
I.1-255	90	320
I.2-2	100	320
I.8-2	80	320
I.46-2	90	320
I.1-32	90	320
I.1-8	80	320

Таблица В2

Соединение № примера	<i>Echinochloa crus-galli</i> (Эффективность в %)	Норма применения [г/га]
I.1-1	100	320
I.1-2	100	320
I.1-3	100	320
I.1-5	100	320
I.1-22	100	320
I.1-23	100	320
I.1-42	100	320
I.1-72	100	320
I.1-127	100	320
I.1-132	100	320
I.1-141	100	320
I.1-151	100	320

Соединение № примера	<i>Echinochloa crus-galli</i> (Эффективность в %)	Норма применения [г/га]
I.1-182	100	320
I.1-183	100	320
I.1-184	100	320
I.1-241	100	320
I.1-242	100	320
I.1-251	100	320
I.1-254	100	320
I.1-255	100	320
I.2-2	100	320
I.8-2	100	320
I.8-23	100	320
I.8-42	100	320
I.8-127	100	320
I.46-2	100	320
I.1-32	100	320
I.1-142	90	80
I.1-8	100	320

Таблица В3

Соединение № примера	<i>Setaria viridis</i> (Эффективность в %)	Норма применения [г/га]
I.1-1	100	320
I.1-2	100	80
I.1-3	100	320
I.1-5	100	320
I.1-22	100	80
I.1-23	100	80
I.1-42	100	80
I.1-72	100	80
I.1-127	100	320
I.1-132	100	320
I.1-141	100	320
I.1-151	100	320
I.1-182	100	320
I.1-183	100	320
I.1-184	100	80
I.1-241	100	320
I.1-242	100	80
I.1-251	100	320
I.1-254	100	320

Соединение № примера	<i>Setaria viridis</i> (Эффективность в %)	Норма применения [г/га]
I.1-255	100	320
I.2-2	100	320
I.8-2	100	320
I.8-23	100	320
I.8-42	100	320
I.8-127	100	320
I.46-2	100	320
I.1-32	100	320
I.1-142	100	80
I.1-8	100	320

Таблица В4

Соединение № примера	<i>Abrutylon theophrasti</i> (Эффективность в %)	Норма применения [г/га]
I.1-1	100	320
I.1-2	100	80
I.1-3	100	320
I.1-5	100	320
I.1-22	100	80
I.1-23	100	80
I.1-42	100	80
I.1-72	100	80
I.1-127	100	320
I.1-132	100	320
I.1-141	100	320
I.1-151	100	320
I.1-182	100	320
I.1-183	100	320
I.1-184	100	80
I.1-241	100	320
I.1-242	100	80
I.1-251	100	320
I.1-254	100	320
I.1-255	100	320
I.2-2	100	320
I.8-2	100	320
I.8-23	100	320
I.8-42	100	320
I.8-127	100	320
I.46-2	100	320

Соединение № примера	<i>Abutilon theophrasti</i> (Эффективность в %)	Норма применения [г/га]
I.1-32	100	320
I.1-142	100	80
I.1-8	100	320

Таблица В5

Соединение № примера	<i>Amaranthus retroflexus</i> (Эффективность в %)	Норма применения [г/га]
I.1-1	100	20
I.1-2	100	80
I.1-3	100	80
I.1-5	100	80
I.1-22	100	80
I.1-23	100	80
I.1-42	100	20
I.1-72	100	20
I.1-127	100	20
I.1-132	100	80
I.1-141	100	80
I.1-151	100	80
I.1-182	100	80
I.1-183	100	80
I.1-184	100	80
I.1-241	100	80
I.1-242	100	80
I.1-251	100	80
I.1-254	100	80
I.1-255	100	80
I.2-2	100	80
I.8-2	100	20
I.8-23	100	80
I.8-42	100	20
I.8-127	100	20
I.46-2	100	80
I.1-32	100	320
I.1-142	100	80
I.1-8	100	320

Таблица В6

Соединение № примера	<i>Matricaria inodora</i> (Эффективность в %)	Норма применения [г/га]
I.1-1	100	320
I.1-2	100	80
I.1-3	100	320
I.1-5	100	80
I.1-22	100	80
I.1-23	100	800
I.1-42	100	80
I.1-72	100	80
I.1-127	100	320
I.1-132	100	320
I.1-141	100	320
I.1-151	100	320
I.1-182	100	320
I.1-183	100	320
I.1-184	100	80
I.1-241	100	320
I.1-242	100	80
I.1-251	100	320
I.1-254	100	320
I.1-255	100	320
I.2-2	100	320
I.8-2	100	320
I.8-23	100	80
I.8-42	100	320
I.8-127	100	320
I.46-2	100	320
I.1-32	100	320
I.1-142	100	80
I.1-8	100	320

Таблица В7

Соединение № примера	<i>Polygonum convolvulus</i> (Эффективность в %)	Норма применения [г/га]
I.1-1	100	320
I.1-2	100	80
I.1-3	100	320
I.1-5	100	320
I.1-22	100	80
I.1-23	100	80

Соединение № примера	<i>Polygonum convolvulus</i> (Эффективность в %)	Норма применения [г/га]
I.1-42	100	80
I.1-72	100	80
I.1-127	100	320
I.1-132	100	320
I.1-141	100	320
I.1-151	100	320
I.1-182	100	320
I.1-183	100	320
I.1-184	100	80
I.1-241	100	320
I.1-242	100	80
I.1-251	100	320
I.1-254	100	320
I.1-255	100	320
I.2-2	100	320
I.8-2	100	320
I.8-23	100	320
I.8-42	100	320
I.8-127	100	320
I.46-2	100	320
I.1-32	100	320
I.1-142	100	80
I.1-8	100	320

Таблица В8

Соединение № примера	<i>Stellaria media</i> (Эффективность в %)	Норма применения [г/га]
I.1-1	100	320
I.1-2	100	80
I.1-3	100	320
I.1-5	100	80
I.1-22	100	80
I.1-23	100	80
I.1-42	100	80
I.1-72	100	80
I.1-127	100	320
I.1-132	100	320
I.1-141	100	320
I.1-151	100	320
I.1-182	100	320

Соединение № примера	<i>Stellaria media</i> (Эффективность в %)	Норма применения [г/га]
I.1-183	100	320
I.1-184	100	80
I.1-241	100	320
I.1-242	100	80
I.1-254	100	320
I.1-255	100	320
I.2-2	100	320
I.8-2	100	320
I.8-23	100	80
I.8-42	100	320
I.8-127	100	320
I.46-2	100	320
I.1-32	100	320
I.1-142	100	80
I.1-8	100	320

Таблица В9

Соединение № примера	<i>Viola tricolor</i> (Эффективность в %)	Норма применения [г/га]
I.1-1	100	320
I.1-2	100	80
I.1-3	100	320
I.1-5	100	320
I.1-22	100	80
I.1-23	100	80
I.1-42	100	80
I.1-72	100	80
I.1-127	100	320
I.1-132	100	320
I.1-141	100	320
I.1-151	100	320
I.1-182	100	320
I.1-183	100	320
I.1-184	100	80
I.1-241	100	320
I.1-242	100	80
I.1-251	100	320
I.1-254	100	320
I.1-255	100	320
I.2-2	100	320

Соединение № примера	<i>Viola tricolor</i> (Эффективность в %)	Норма применения [г/га]
I.8-2	100	320
I.8-23	100	320
I.8-42	100	320
I.1-32	100	320
I.1-142	100	80
I.1-8	100	320

Таблица В10

Соединение № примера	<i>Veronica persica</i> (Эффективность в %)	Норма применения [г/га]
I.1-1	100	320
I.1-2	100	80
I.1-3	100	320
I.1-5	100	320
I.1-22	100	320
I.1-23	100	80
I.1-42	100	80
I.1-72	100	80
I.1-127	100	320
I.1-132	100	320
I.1-141	100	320
I.1-151	100	320
I.1-182	100	320
I.1-183	100	320
I.1-184	100	80
I.1-241	100	320
I.1-242	100	80
I.1-251	100	320
I.1-254	100	320
I.1-255	100	320
I.2-2	100	80
I.8-2	100	80
I.8-23	100	320
I.8-42	100	320
I.8-127	100	320
I.46-2	100	320
I.1-32	100	320
I.1-142	100	80
I.1-8	100	320

Таблица В11

Соединение № примера	<i>Pharbitis purpurea</i> (Эффективность в %)	Норма применения [г/га]
I.1-1	100	320
I.1-2	100	80
I.1-3	100	320
I.1-5	100	320
I.1-22	100	320
I.1-23	100	80
I.1-42	100	80
I.1-72	100	320
I.1-127	100	320
I.1-132	100	320
I.1-141	100	320
I.1-151	100	320
I.1-182	100	320
I.1-183	100	320
I.1-184	100	80
I.1-241	100	320
I.1-242	100	80
I.1-251	100	320
I.1-254	100	320
I.1-255	100	320
I.2-2	100	320
I.8-2	100	320
I.8-23	100	320
I.8-42	100	320
I.8-127	100	320
I.46-2	100	320
I.1-32	100	320
I.1-142	90	80
I.1-8	100	320

Таблица В12

Соединение № примера	<i>Hordeum murinum</i> (Эффективность в %)	Норма применения [г/га]
I.1-1	90	320
I.1-2	90	320
I.1-5	100	320
I.1-22	100	320
I.1-23	100	320
I.1-42	100	320

Соединение № примера	<i>Hordeum murinum</i> (Эффективность в %)	Норма применения [г/га]
I.1-72	80	320
I.1-127	100	320
I.1-132	80	320
I.1-141	100	320
I.1-151	80	320
I.1-182	90	320
I.1-183	90	320
I.1-184	90	320
I.1-241	100	320
I.1-242	90	320
I.1-251	90	320
I.1-254	90	320
I.1-255	100	320
I.2-2	100	320
I.8-2	80	320
I.8-23	80	320
I.8-42	80	320
I.8-127	90	320
I.1-32	90	320

Таблица В13

Соединение № примера	<i>Avena fatua</i> (Эффективность в %)	Норма применения [г/га]
I.1-2	90	320
I.1-5	100	320
I.1-23	100	320
I.1-42	90	320
I.1-72	90	320
I.1-127	90	320
I.1-132	90	320
I.1-141	80	320
I.1-151	90	320
I.1-182	90	320
I.1-183	90	320
I.1-184	90	320
I.1-241	100	320
I.1-242	80	320
I.1-251	90	320
I.1-254	90	320
I.1-255	90	320

Соединение № примера	<i>Avena fatua</i> (Эффективность в %)	Норма применения [г/га]
I.8-2	80	320
I.8-42	80	320

Таблица В14

Соединение № примера	<i>Lolium multiflorum</i> (Эффективность в %)	Норма применения [г/га]
I.1-3	100	80

Таблица В15

Соединение № примера	<i>Lolium rigidum</i> (Эффективность в %)	Норма применения [г/га]
I.1-1	100	320
I.1-2	100	320
I.1-5	100	320
I.1-22	100	320
I.1-23	100	80
I.1-42	100	320
I.1-72	90	320
I.1-127	100	320
I.1-132	100	320
I.1-141	100	320
I.1-151	90	320
I.1-182	100	320
I.1-183	90	320
I.1-184	100	320
I.1-241	100	320
I.1-242	100	320
I.1-254	100	320
I.1-255	100	320
I.2-2	100	320
I.8-2	90	80
I.8-23	90	320
I.8-42	80	320
I.8-127	90	320
I.46-2	100	320
I.1-32	90	320
I.1-8	90	320

Таблица В16

Соединение № примера	<i>Cyperus esculentus</i> (Эффективность в %)	Норма применения [г/га]
I.1-3	100	320
I.1-5	80	320
I.1-22	90	320
I.1-42	100	320
I.1-72	100	320
I.1-182	80	320
I.1-183	80	320
I.1-241	100	320
I.1-242	80	80
I.1-251	80	320
I.1-254	80	320
I.2-2	90	320
I.8-2	90	320
I.8-23	90	320
I.8-42	100	320
I.8-127	90	320

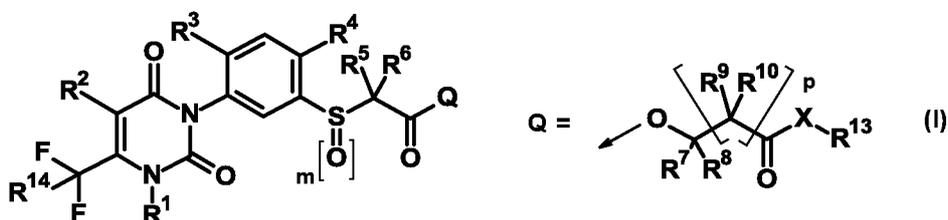
Таблица В17

Соединение № примера	<i>Digitaria sanguinalis</i> (Эффективность в %)	Норма применения [г/га]
I.1-32	100	320
I.1-142	100	80
I.1-	100	320

- 5 Как показывают результаты, соединения общей формулы (I) в соответствии с настоящим изобретением в случае обработки до появления всходов проявляют надлежащую гербицидную эффективность в отношении вредоносных растений, например в отношении таких вредоносных растений, как *Abutilon theophrasti*, *Alopecurus myosuroides*, *Amaranthus retroflexus*, *Avena fatua*, *Cyperus esculentus*,
- 10 *Echinochloa crus-galli*, *Hordeum murinum*, *Lolium rigidum*, *Matricaria inodora*, *Pharbitis purpurea*, *Polygonum convolvulus*, *Setaria viridis*, *Stellaria media*, *Veronica persica* и *Viola tricolor*, при норме применения 0,32 кг активного вещества или меньше на гектар.

ФОРМУЛА ИЗОБРЕТЕНИЯ

1. Замещенный тиофенилурацил общей формулы (I) или его соль,



5

в котором

R^1 представляет собой (C₁-C₈)-алкил, амина, бис[(C₁-C₈)-алкил]амино,

10 R^2 представляет собой водород, (C₁-C₈)-алкил,

R^3 представляет собой водород, галоген, (C₁-C₈)-алкокси,

15 R^4 представляет собой галоген, циано, NO₂, C(O)NH₂, C(S)NH₂, (C₁-C₈)-галогеналкил, (C₂-C₈)-алкинил,

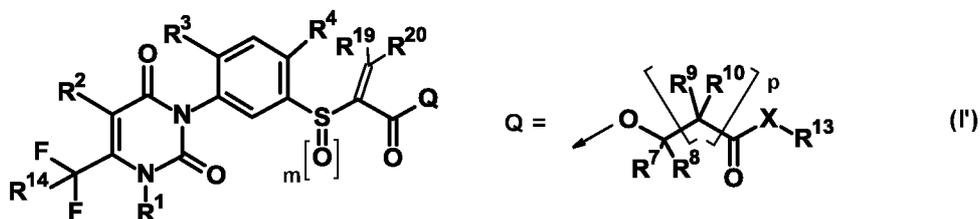
R^5 и R^6 независимо представляют собой водород, галоген, (C₁-C₈)-алкил, (C₃-C₈)-циклоалкил, (C₃-C₈)-циклоалкил-(C₁-C₈)-алкил, (C₂-C₈)-алкенил, (C₂-C₈)-алкинил, (C₁-C₁₀)-галогеналкил, (C₂-C₈)-галогеналкенил, (C₂-C₈)-галогеналкинил, (C₃-C₁₀)-галогенциклоалкил, (C₄-C₁₀)-циклоалкенил, (C₄-C₁₀)-галогенциклоалкенил, (C₁-C₈)-алкокси, (C₁-C₈)-алкокси-(C₁-C₈)-алкил, (C₁-C₈)-алкокси-(C₁-C₈)-галогеналкил, (C₁-C₈)-галогеналкокси-(C₁-C₈)-галогеналкил, (C₁-C₈)-галогеналкокси-(C₁-C₈)-алкил, арил, арил-(C₁-C₈)-алкил, гетероарил, гетероарил-(C₁-C₈)-алкил, (C₄-C₁₀)-циклоалкенил-(C₁-C₈)-алкил, гетероциклил, гетероциклил-(C₁-C₈)-алкил, (C₁-C₈)-алкилтио-(C₁-C₈)-алкил, (C₁-C₈)-галогеналкилтио-(C₁-C₈)-алкил, (C₁-C₈)-алкилкарбонил-(C₁-C₈)-алкил, C(O)OR¹⁷, C(O)NR¹⁵R¹⁶, C(O)R¹⁷, R¹⁷O(O)C-(C₁-C₈)-алкил, R¹⁵R¹⁶N(O)C-(C₁-C₈)-алкил, R¹⁵R¹⁶N-(C₁-C₈)-алкил, или

30

R^5 и R^6 вместе с атомом углерода, с которым они связаны, образуют полностью насыщенное или частично насыщенное 3-10-членное моноциклическое или бициклическое кольцо, необязательно прерываемое гетероатомами и необязательно включающее дополнительное замещение, или

5

R^5 и R^6 вместе с атомом углерода, с которым они связаны, образуют двойную связь, необязательно дополнительно замещенную R^{19} и R^{20} , в соответствии с формулой (I') ниже,



10

m равняется 0, 1, 2,

p равняется 0, 1, 2, 3, 4, 5,

15

X представляет собой O (кислород) или фрагменты $N-R^{11}$ или $N-O-R^{12}$, и при этом R^{11} и R^{12} во фрагментах $N-R^{11}$ и $N-O-R^{12}$ независимо имеют значения в соответствии с определениями ниже,

20

R^7 , R^8 , R^9 и R^{10} независимо представляют собой водород, фтор, (C_1-C_8) -алкил, (C_3-C_8) -циклоалкил, (C_3-C_8) -циклоалкил- (C_1-C_8) -алкил, (C_2-C_8) -алкенил, (C_2-C_8) -алкинил, (C_1-C_{10}) -галогеналкил, (C_2-C_8) -галогеналкенил, (C_2-C_8) -галогеналкинил, (C_3-C_{10}) -галогенциклоалкил, (C_4-C_{10}) -циклоалкенил, (C_4-C_{10}) -галогенциклоалкенил, (C_1-C_8) -алкокси- (C_1-C_8) -галогеналкил, (C_1-C_8) -галогеналкокси- (C_1-C_8) -галогеналкил, арил, арил- (C_1-C_8) -алкил, гетероарил, гетероарил- (C_1-C_8) -алкил, (C_4-C_{10}) -циклоалкенил- (C_1-C_8) -алкил, гетероциклил, гетероциклил- (C_1-C_8) -алкил, $R^{17}O-(C_1-C_8)$ -алкил, $R^{18}S-(C_1-C_8)$ -алкил, (C_1-C_8) -алкилкарбонил- (C_1-C_8) -алкил, $C(O)OR^{17}$, $C(O)NR^{15}R^{16}$, $C(O)R^{17}$, $R^{17}O(O)C-(C_1-C_8)$ -алкил, $R^{15}R^{16}N(O)C-(C_1-C_8)$ -алкил, $R^{15}R^{16}N-(C_1-C_8)$ -алкил, или

30

- 5 R^5 и R^7 вместе с атомами углерода, с которыми они связаны, образуют полностью насыщенное или частично насыщенное 3-8-членное моноциклическое или бициклическое кольцо, необязательно прерываемое гетероатомами и необязательно включающее дополнительное замещение, или
- 10 R^7 и R^8 вместе с атомом углерода, с которым они связаны, образуют полностью насыщенное или частично насыщенное 3-10-членное моноциклическое или бициклическое кольцо, необязательно прерываемое гетероатомами и необязательно включающее дополнительное замещение, или
- 15 R^9 и R^{10} вместе с атомом углерода, с которым они связаны, образуют полностью насыщенное или частично насыщенное 3-10-членное моноциклическое или бициклическое кольцо, необязательно прерываемое гетероатомами и необязательно включающее дополнительное замещение, или
- 20 R^9 и R^{10} вместе с атомом углерода, с которым они связаны, образуют экзометиленовую группу, или
- 25 R^7 и R^9 вместе с атомами углерода, с которыми они связаны, образуют полностью насыщенное или частично насыщенное 3-10-членное моноциклическое или бициклическое кольцо, необязательно прерываемое гетероатомами и необязательно включающее дополнительное замещение,
- 30 R^{11} представляет собой водород, (C_1-C_8) -алкил, (C_3-C_8) -циклоалкил, циано- (C_1-C_8) -алкил, (C_3-C_8) -циклоалкил- (C_1-C_8) -алкил, (C_1-C_8) -алкилсульфонил, арилсульфонил, гетероарилсульфонил, (C_3-C_8) -циклоалкилсульфонил, гетероциклилсульфонил, арил- (C_1-C_8) -алкилсульфонил, (C_1-C_8) -алкилкарбонил, арилкарбонил, гетероарилкарбонил, (C_3-C_8) -циклоалкилкарбонил, гетероциклилкарбонил, (C_1-C_8) -алкоксикарбонил, (C_1-C_8) -алкокси, (C_2-C_8) -алкенилокси,

- арил-(C₁-C₈)-алкоксикарбонил, (C₁-C₈)-галогеналкилкарбонил, (C₂-C₈)-алкенил, (C₂-C₈)-алкинил, (C₁-C₈)-галогеналкил, галоген-(C₂-C₈)-алкинил, галоген-(C₂-C₈)-алкенил, (C₁-C₈)-алкокси-(C₁-C₈)-алкил, amino, (C₁-C₈)-алкиламино, бис[(C₁-C₈)-алкил]амино, (C₁-C₈)-алкокси-(C₁-C₈)-алкокси-(C₁-C₈)-алкил, гетероарил-(C₁-C₈)-алкилсульфонил, гетероциклил-(C₁-C₈)-алкилсульфонил, (C₂-C₈)-алкенилоксикарбонил, (C₂-C₈)-алкинилоксикарбонил, (C₁-C₈)-алкиламинокарбонил, (C₃-C₈)-циклоалкиламинокарбонил, бис-[(C₁-C₈)-алкил]аминокарбонил,
- 5
- 10 R^{12} представляет собой водород, (C₁-C₈)-алкил, (C₃-C₈)-циклоалкил-(C₁-C₈)-алкил, (C₂-C₈)-алкенил, (C₂-C₈)-алкинил, (C₁-C₈)-алкокси-(C₁-C₈)-алкил, арил, арил-(C₁-C₈)-алкил, $R^{17}O(O)C-(C_1-C_8)$ -алкил, $R^{15}R^{16}N(O)C-(C_1-C_8)$ -алкил,
- 15 R^{13} представляет собой водород, (C₁-C₈)-алкил, (C₁-C₈)-галогеналкил, (C₃-C₈)-циклоалкил, (C₃-C₈)-циклоалкил-(C₁-C₈)-алкил, (C₂-C₈)-алкенил, (C₂-C₈)-алкинил, (C₁-C₈)-алкокси-(C₁-C₈)-алкил, (C₁-C₈)-галогеналкокси-(C₁-C₈)-алкил, арил, арил-(C₁-C₈)-алкил, гетероарил, гетероарил-(C₁-C₈)-алкил, гетероциклил, гетероциклил-(C₁-C₈)-алкил, (C₁-C₈)-алкилтио-(C₁-C₈)-алкил, (C₁-C₈)-галогеналкилтио-(C₁-C₈)-алкил, (C₁-C₈)-алкилкарбонил-(C₁-C₈)-алкил, $R^{17}O(O)C-(C_1-C_8)$ -алкил, $R^{15}R^{16}N(O)C-(C_1-C_8)$ -алкил, $R^{15}R^{16}N-(C_1-C_8)$ -алкил, или
- 20
- 25 R^7 и R^{13} вместе с атомами, с которыми они связаны, образуют полностью насыщенное или частично насыщенное 3-10-членное моноциклическое или бициклическое кольцо, необязательно прерываемое гетероатомами и необязательно включающее дополнительное замещение, или
- 30 R^9 и R^{13} вместе с атомами, с которыми они связаны, образуют полностью насыщенное или частично насыщенное 3-10-членное моноциклическое или бициклическое кольцо, необязательно прерываемое гетероатомами и необязательно включающее дополнительное замещение, или

R^{11} и R^{13} , если X представляет собой $N-R^{11}$, вместе с атомом азота, с которым они связаны, образуют 4-10-членное моноциклическое или бициклическое кольцо, которое является полностью насыщенным или необязательно прерываемым гетероатомами и необязательно включает дополнительное замещение, или

5

R^{12} и R^{13} , если X представляет собой $N-O-R^{12}$, вместе с атомом азота, с которым они связаны, образуют полностью насыщенное и необязательно дополнительно замещенное 4-10-членное моноциклическое или бициклическое кольцо,

10

R^{14} представляет собой водород, фтор, хлор, бром, (C_1-C_5) -галогеналкил, (C_1-C_8) -алкокси,

15

R^{15} и R^{16} являются одинаковыми или различными и независимо представляют собой водород, (C_1-C_8) -алкил, (C_2-C_8) -алкенил, (C_2-C_8) -алкинил, (C_1-C_8) -цианоалкил, (C_1-C_{10}) -галогеналкил, (C_2-C_8) -галогеналкенил, (C_2-C_8) -галогеналкинил, (C_3-C_{10}) -циклоалкил, (C_3-C_{10}) -галогенциклоалкил, (C_4-C_{10}) -циклоалкенил, (C_4-C_{10}) -галогенциклоалкенил, (C_1-C_8) -алкокси- (C_1-C_8) -алкил, (C_1-C_8) -галогеналкокси- (C_1-C_8) -алкил, (C_1-C_8) -алкилтио- (C_1-C_8) -алкил, (C_1-C_8) -галогеналкилтио- (C_1-C_8) -алкил, (C_1-C_8) -алкокси- (C_1-C_8) -галогеналкил, арил, арил- (C_1-C_8) -алкил, гетероарил, гетероарил- (C_1-C_8) -алкил, (C_3-C_8) -циклоалкил- (C_1-C_8) -алкил, (C_4-C_{10}) -циклоалкенил- (C_1-C_8) -алкил, COR^{17} , SO_2R^{18} , (C_1-C_8) -алкил- HNO_2S- , (C_3-C_8) -циклоалкил- HNO_2S- , гетероциклил, (C_1-C_8) -алкоксикарбонил- (C_1-C_8) -алкил, (C_1-C_8) -алкоксикарбонил, арил- (C_1-C_8) -алкоксикарбонил- (C_1-C_8) -алкил, арил- (C_1-C_8) -алкоксикарбонил, гетероарил- (C_1-C_8) -алкоксикарбонил, (C_2-C_8) -алкенилоксикарбонил, (C_2-C_8) -алкинилоксикарбонил, гетероциклил- (C_1-C_8) -алкил,

20

25

30

R^{17} представляет собой водород, (C_1-C_8) -алкил, (C_2-C_8) -алкенил, (C_2-C_8) -алкинил, (C_1-C_8) -цианоалкил, (C_1-C_{10}) -галогеналкил, (C_2-C_8) -галогеналкенил, (C_2-C_8) -галогеналкинил, (C_3-C_{10}) -циклоалкил, (C_3-C_{10}) -галогенциклоалкил, (C_4-C_{10}) -циклоалкенил, (C_4-C_{10}) -

галогенциклоалкенил, (C₁-C₈)-алкокси-(C₁-C₈)-алкил, (C₁-C₈)-алкокси-(C₁-C₈)-галогеналкил, арил, арил-(C₁-C₈)-алкил, гетероарил, гетероарил-(C₁-C₈)-алкил, (C₃-C₈)-циклоалкил-(C₁-C₈)-алкил, (C₄-C₁₀)-циклоалкенил-(C₁-C₈)-алкил, (C₁-C₈)-алкоксикарбонил-(C₁-C₈)-алкил, (C₂-C₈)-алкенилоксикарбонил-(C₁-C₈)-алкил, арил-(C₁-C₈)-алкоксикарбонил-(C₁-C₈)-алкил, гидроксикарбонил-(C₁-C₈)-алкил, гетероциклил, гетероциклил-(C₁-C₈)-алкил,

R¹⁸ представляет собой водород, (C₁-C₈)-алкил, (C₂-C₈)-алкенил, (C₂-C₈)-алкинил, (C₁-C₈)-цианоалкил, (C₁-C₁₀)-галогеналкил, (C₂-C₈)-галогеналкенил, (C₂-C₈)-галогеналкинил, (C₃-C₁₀)-циклоалкил, (C₃-C₁₀)-галогенциклоалкил, (C₄-C₁₀)-циклоалкенил, (C₄-C₁₀)-галогенциклоалкенил, (C₁-C₈)-алкокси-(C₁-C₈)-алкил, (C₁-C₈)-алкокси-(C₁-C₈)-галогеналкил, арил, арил-(C₁-C₈)-алкил, гетероарил, гетероарил-(C₁-C₈)-алкил, гетероциклил-(C₁-C₈)-алкил, (C₃-C₈)-циклоалкил-(C₁-C₈)-алкил, (C₄-C₁₀)-циклоалкенил-(C₁-C₈)-алкил, NR¹⁵R¹⁶,

и

R¹⁹ и R²⁰ независимо представляют собой водород, галоген, (C₁-C₈)-алкил, (C₃-C₈)-циклоалкил, (C₂-C₈)-алкенил, (C₂-C₈)-алкинил, (C₁-C₈)-галогеналкил, арил или

R¹⁹ и R²⁰ вместе с атомом углерода, с которым они связаны, образуют 3-10-членное моноциклическое или бициклическое кольцо, которое является насыщенным или необязательно прерываемым гетероатомами и необязательно включает дополнительное замещение.

2. Соединение общей формулы (I) по п. 1 и/или его соль, отличающееся тем, что

R¹ представляет собой (C₁-C₇)-алкил, amino, бис[(C₁-C₇)-алкил]амино,

R² представляет собой водород, (C₁-C₇)-алкил,

R^3 представляет собой водород, галоген, (C_1-C_7) -алкокси,

R^4 представляет собой галоген, циано, NO_2 , $C(O)NH_2$, $C(S)NH_2$, (C_1-C_7) -галогеналкил, (C_2-C_7) -алкинил,

5

R^5 и R^6 независимо представляют собой водород, галоген, (C_1-C_7) -алкил, (C_3-C_7) -циклоалкил, (C_3-C_7) -циклоалкил- (C_1-C_7) -алкил, (C_2-C_7) -алкенил, (C_2-C_7) -алкинил, (C_1-C_{10}) -галогеналкил, (C_2-C_7) -галогеналкенил, (C_2-C_7) -галогеналкинил, (C_3-C_{10}) -галогенциклоалкил, (C_4-C_{10}) -циклоалкенил, (C_4-C_{10}) -галогенциклоалкенил, (C_1-C_7) -алкокси, (C_1-C_7) -алкокси- (C_1-C_7) -алкил,

10

(C_1-C_7) -алкокси- (C_1-C_7) -галогеналкил, (C_1-C_7) -галогеналкокси- (C_1-C_7) -галогеналкил, (C_1-C_7) -галогеналкокси- (C_1-C_7) -алкил, арил, арил- (C_1-C_7) -алкил, гетероарил, гетероарил- (C_1-C_7) -алкил, (C_4-C_{10}) -циклоалкенил- (C_1-C_7) -алкил, гетероцикл, гетероцикл- (C_1-C_7) -алкил, (C_1-C_7) -алкилтио- (C_1-C_7) -алкил, (C_1-C_7) -галогеналкилтио- (C_1-C_7) -алкил, (C_1-C_7) -алкилкарбонил- (C_1-C_7) -алкил, $C(O)OR^{17}$, $C(O)NR^{15}R^{16}$, $C(O)R^{17}$, $R^{17}O(O)C-(C_1-C_7)$ -алкил, $R^{15}R^{16}N(O)C-(C_1-C_7)$ -алкил, $R^{15}R^{16}N-(C_1-C_7)$ -алкил, или

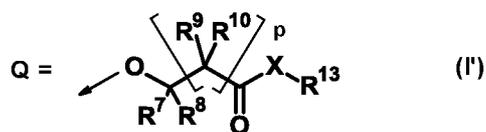
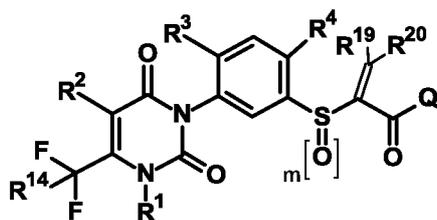
15

20

R^5 и R^6 вместе с атомом углерода, с которым они связаны, образуют полностью насыщенное или частично насыщенное 3-10-членное моноциклическое или бициклическое кольцо, необязательно прерываемое гетероатомами и необязательно включающее дополнительное замещение, или

25

R^5 и R^6 вместе с атомом углерода, с которым они связаны, образуют двойную связь, необязательно дополнительно замещенную R^{19} и R^{20} , в соответствии с формулой (I') ниже,



30

m равняется 0, 1, 2,

p равняется 0, 1, 2, 3,

5

X представляет собой O (кислород), N (азот) или фрагменты N-R¹¹ или N-O-R¹², и при этом R¹¹ и R¹² во фрагментах N-R¹¹ и N-O-R¹² независимо имеют значения в соответствии с определениями ниже,

10 R⁷, R⁸, R⁹ и R¹⁰ независимо представляют собой водород, фтор, (C₁-C₇)-алкил, (C₃-C₇)-циклоалкил, (C₃-C₇)-циклоалкил-(C₁-C₇)-алкил, (C₂-C₇)-алкенил, (C₂-C₇)-алкинил, (C₁-C₁₀)-галогеналкил, (C₂-C₇)-галогеналкенил, (C₂-C₇)-галогеналкинил, (C₃-C₁₀)-галогенциклоалкил, (C₄-C₁₀)-циклоалкенил, (C₄-C₁₀)-галогенциклоалкенил, (C₁-C₇)-алкокси-(C₁-C₇)-галогеналкил, (C₁-C₇)-галогеналкокси-(C₁-C₇)-галогеналкил, арил, арил-(C₁-C₇)-алкил, гетероарил, гетероарил-(C₁-C₇)-алкил, (C₄-C₁₀)-циклоалкенил-(C₁-C₇)-алкил, гетероциклил, гетероциклил-(C₁-C₇)-алкил, R¹⁷O-(C₁-C₇)-алкил, R¹⁸S-(C₁-C₇)-алкил, (C₁-C₇)-алкилкарбонил-(C₁-C₇)-алкил, C(O)OR¹⁷, C(O)NR¹⁵R¹⁶, C(O)R¹⁷, R¹⁷O(O)C-(C₁-C₇)-алкил, R¹⁵R¹⁶N(O)C-(C₁-C₇)-алкил, R¹⁵R¹⁶N-(C₁-C₇)-алкил, или

15

20

R⁵ и R⁷ вместе с атомами углерода, с которыми они связаны, образуют полностью насыщенное или частично насыщенное 3-8-членное моноциклическое или бициклическое кольцо, необязательно прерываемое гетероатомами и необязательно включающее дополнительное замещение, или

25

R⁷ и R⁸ вместе с атомом углерода, с которым они связаны, образуют полностью насыщенное или частично насыщенное 3-10-членное моноциклическое или бициклическое кольцо, необязательно прерываемое гетероатомами и необязательно включающее дополнительное замещение, или

30

R⁹ и R¹⁰ вместе с атомом углерода, с которым они связаны, образуют полностью насыщенное или частично насыщенное 3-10-членное моноциклическое

или бициклическое кольцо, необязательно прерываемое гетероатомами и необязательно включающее дополнительное замещение, или

R^9 и R^{10} вместе с атомом углерода, с которым они связаны, образуют экзометиленовую группу, или

R^7 и R^9 вместе с атомами углерода, с которыми они связаны, образуют полностью насыщенное или частично насыщенное 3-10-членное моноциклическое или бициклическое кольцо, необязательно прерываемое гетероатомами и необязательно включающее дополнительное замещение,

R^{11} представляет собой водород, (C₁-C₇)-алкил, (C₃-C₇)-циклоалкил, циано-(C₁-C₇)-алкил, (C₃-C₇)-циклоалкил-(C₁-C₇)-алкил, (C₁-C₇)-алкилсульфонил, арилсульфонил, гетероарилсульфонил, (C₃-C₇)-циклоалкилсульфонил, гетероциклилсульфонил, арил-(C₁-C₇)-алкилсульфонил, (C₁-C₇)-алкилкарбонил, арилкарбонил, гетероарилкарбонил, (C₃-C₇)-циклоалкилкарбонил, гетероциклилкарбонил, (C₁-C₇)-алкоксикарбонил, (C₁-C₇)-алкокси, (C₂-C₇)-алкенилокси, арил-(C₁-C₇)-алкоксикарбонил, (C₁-C₇)-галогеналкилкарбонил, (C₂-C₇)-алкенил, (C₂-C₇)-алкинил, (C₁-C₇)-галогеналкил, галоген-(C₂-C₇)-алкинил, галоген-(C₂-C₇)-алкенил, (C₁-C₇)-алкокси-(C₁-C₇)-алкил, amino, (C₁-C₇)-алкиламино, бис[(C₁-C₇)-алкил]амино, (C₁-C₇)-алкокси-(C₁-C₇)-алкокси-(C₁-C₇)-алкил, гетероарил-(C₁-C₇)-алкилсульфонил, гетероциклил-(C₁-C₇)-алкилсульфонил, (C₂-C₇)-алкенилоксикарбонил, (C₂-C₇)-алкинилоксикарбонил, (C₁-C₇)-алкиламинокарбонил, (C₃-C₇)-циклоалкиламинокарбонил, бис-[(C₁-C₇)-алкил]аминокарбонил,

R^{12} представляет собой водород, (C₁-C₇)-алкил, (C₃-C₇)-циклоалкил-(C₁-C₇)-алкил, (C₂-C₇)-алкенил, (C₂-C₇)-алкинил, (C₁-C₇)-алкокси-(C₁-C₇)-алкил, арил, арил-(C₁-C₇)-алкил, $R^{17}O(O)C-(C_1-C_7)$ -алкил, $R^{15}R^{16}N(O)C-(C_1-C_7)$ -алкил,

- 5 R^{13} представляет собой водород, (C_1-C_7) -алкил, (C_1-C_7) -галогеналкил, (C_3-C_7) -циклоалкил, (C_3-C_7) -циклоалкил- (C_1-C_7) -алкил, (C_2-C_7) -алкенил, (C_2-C_7) -алкинил, (C_1-C_7) -алкокси- (C_1-C_7) -алкил, (C_1-C_7) -галогеналкокси- (C_1-C_7) -алкил, арил, арил- (C_1-C_7) -алкил, гетероарил, гетероарил- (C_1-C_7) -алкил, гетероциклил, гетероциклил- (C_1-C_7) -алкил, (C_1-C_7) -алкилтио- (C_1-C_7) -алкил, (C_1-C_7) -галогеналкилтио- (C_1-C_7) -алкил, (C_1-C_7) -алкилкарбонил- (C_1-C_7) -алкил, $R^{17}O(O)C-(C_1-C_7)$ -алкил, $R^{15}R^{16}N(O)C-(C_1-C_7)$ -алкил, $R^{15}R^{16}N-(C_1-C_7)$ -алкил, или
- 10 R^7 и R^{13} вместе с атомами, с которыми они связаны, образуют полностью насыщенное или частично насыщенное 3-10-членное моноциклическое или бициклическое кольцо, необязательно прерываемое гетероатомами и необязательно включающее дополнительное замещение, или
- 15 R^9 и R^{13} вместе с атомами, с которыми они связаны, образуют полностью насыщенное или частично насыщенное 3-10-членное моноциклическое или бициклическое кольцо, необязательно прерываемое гетероатомами и необязательно включающее дополнительное замещение, или
- 20 R^{11} и R^{13} , если X представляет собой $N-R^{11}$, вместе с атомом азота, с которым они связаны, образуют 4-10-членное моноциклическое или бициклическое кольцо, которое является полностью насыщенным или необязательно прерываемым гетероатомами и необязательно включает дополнительное замещение, или
- 25 R^{12} и R^{13} , если X представляет собой $N-O-R^{12}$, вместе с атомом азота, с которым они связаны, образуют полностью насыщенное и необязательно дополнительно замещенное 4-10-членное моноциклическое или бициклическое кольцо,
- 30 R^{14} представляет собой водород, фтор, хлор, бром, (C_1-C_5) -галогеналкил, (C_1-C_7) -алкокси,

- R^{15} и R^{16} являются одинаковыми или различными и независимо представляют собой водород, (C₁-C₇)-алкил, (C₂-C₇)-алкенил, (C₂-C₇)-алкинил, (C₁-C₇)-цианоалкил, (C₁-C₁₀)-галогеналкил, (C₂-C₇)-галогеналкенил, (C₂-C₇)-галогеналкинил, (C₃-C₁₀)-циклоалкил, (C₃-C₁₀)-галогенциклоалкил, (C₄-C₁₀)-циклоалкенил, (C₄-C₁₀)-галогенциклоалкенил, (C₁-C₇)-алкокси-(C₁-C₇)-алкил, (C₁-C₇)-галогеналкокси-(C₁-C₇)-алкил, (C₁-C₇)-алкилтио-(C₁-C₇)-алкил, (C₁-C₇)-галогеналкилтио-(C₁-C₇)-алкил, (C₁-C₇)-алкокси-(C₁-C₇)-галогеналкил, арил, арил-(C₁-C₇)-алкил, гетероарил, гетероарил-(C₁-C₇)-алкил, (C₃-C₇)-циклоалкил-(C₁-C₇)-алкил, (C₄-C₁₀)-циклоалкенил-(C₁-C₇)-алкил, COR¹⁷, SO₂R¹⁸, (C₁-C₇)-алкил-HNO₂S-, (C₃-C₇)-циклоалкил-HNO₂S-, гетероциклил, (C₁-C₇)-алкоксикарбонил-(C₁-C₇)-алкил, (C₁-C₇)-алкоксикарбонил, арил-(C₁-C₇)-алкоксикарбонил-(C₁-C₇)-алкил, арил-(C₁-C₇)-алкоксикарбонил, гетероарил-(C₁-C₇)-алкоксикарбонил, (C₂-C₇)-алкенилоксикарбонил, (C₂-C₇)-алкинилоксикарбонил, гетероциклил-(C₁-C₇)-алкил,
- R^{17} представляет собой водород, (C₁-C₇)-алкил, (C₂-C₇)-алкенил, (C₂-C₇)-алкинил, (C₁-C₇)-цианоалкил, (C₁-C₇)-галогеналкил, (C₂-C₇)-галогеналкенил, (C₂-C₇)-галогеналкинил, (C₃-C₁₀)-циклоалкил, (C₃-C₁₀)-галогенциклоалкил, (C₄-C₁₀)-циклоалкенил, (C₄-C₁₀)-галогенциклоалкенил, (C₁-C₇)-алкокси-(C₁-C₇)-алкил, (C₁-C₇)-алкокси-(C₁-C₇)-галогеналкил, арил, арил-(C₁-C₇)-алкил, гетероарил, гетероарил-(C₁-C₇)-алкил, (C₃-C₇)-циклоалкил-(C₁-C₇)-алкил, (C₄-C₁₀)-циклоалкенил-(C₁-C₇)-алкил, (C₁-C₇)-алкоксикарбонил-(C₁-C₇)-алкил, (C₂-C₇)-алкенилоксикарбонил-(C₁-C₇)-алкил, арил-(C₁-C₇)-алкоксикарбонил-(C₁-C₇)-алкил, гидроксикарбонил-(C₁-C₇)-алкил, гетероциклил, гетероциклил-(C₁-C₇)-алкил,
- R^{18} представляет собой водород, (C₁-C₇)-алкил, (C₂-C₇)-алкенил, (C₂-C₇)-алкинил, (C₁-C₇)-цианоалкил, (C₁-C₁₀)-галогеналкил, (C₂-C₇)-галогеналкенил, (C₂-C₇)-галогеналкинил, (C₃-C₁₀)-циклоалкил, (C₃-C₁₀)-галогенциклоалкил, (C₄-C₁₀)-циклоалкенил, (C₄-C₁₀)-галогенциклоалкенил, (C₁-C₇)-алкокси-(C₁-C₇)-алкил, (C₁-C₇)-алкокси-(C₁-C₇)-галогеналкил, арил, арил-(C₁-C₇)-алкил, гетероарил,

гетероарил-(C₁-C₇)-алкил, гетероциклил-(C₁-C₇)-алкил, (C₃-C₇)-циклоалкил-(C₁-C₇)-алкил, (C₄-C₁₀)-циклоалкенил-(C₁-C₇)-алкил, NR¹⁵R¹⁶,

и

5

R¹⁹ и R²⁰ независимо представляют собой водород, галоген, (C₁-C₇)-алкил, (C₃-C₇)-циклоалкил,

(C₂-C₇)-алкенил, (C₂-C₇)-алкинил, (C₁-C₇)-галогеналкил, арил или

10

R¹⁹ и R²⁰ вместе с атомом углерода, с которым они связаны, образуют 3-10-членное моноциклическое или бициклическое кольцо, которое является насыщенным или необязательно прерываемым гетероатомами и необязательно включает дополнительное замещение.

15

3. Соединение общей формулы (I) по п. 1 и/или его соль, отличающееся тем, что

R¹ представляет собой (C₁-C₆)-алкил, амино, бис[(C₁-C₆)-алкил]амино,

R² представляет собой водород, (C₁-C₆)-алкил,

20

R³ представляет собой водород, галоген, (C₁-C₆)-алкокси,

R⁴ представляет собой галоген, циано, NO₂, C(O)NH₂, C(S)NH₂, (C₁-C₆)-галогеналкил, (C₂-C₆)-алкинил,

25

R⁵ и R⁶ независимо представляют собой водород, галоген, (C₁-C₆)-алкил, (C₃-C₆)-циклоалкил, (C₃-C₆)-циклоалкил-(C₁-C₆)-алкил, (C₂-C₆)-алкенил, (C₂-C₆)-алкинил, (C₁-C₁₀)-галогеналкил, (C₂-C₆)-галогеналкенил, (C₂-C₆)-галогеналкинил, (C₃-C₁₀)-галогенциклоалкил, (C₄-C₁₀)-циклоалкенил, (C₄-C₁₀)-галогенциклоалкенил, (C₁-C₆)-алкокси, (C₁-C₆)-алкокси-(C₁-C₆)-алкил, (C₁-C₆)-алкокси-(C₁-C₆)-галогеналкил, (C₁-C₆)-галогеналкокси-(C₁-C₆)-галогеналкил, (C₁-C₆)-галогеналкокси-(C₁-C₆)-алкил, арил, арил-(C₁-C₆)-алкил, гетероарил, гетероарил-(C₁-C₆)-алкил,

30

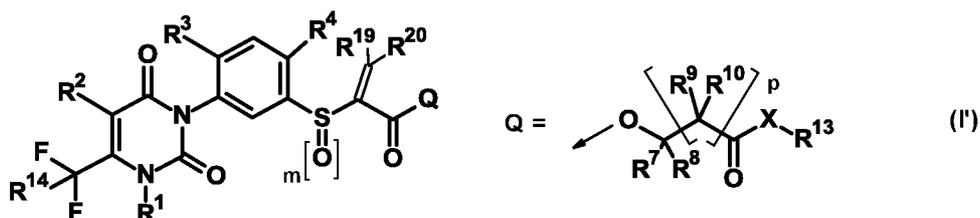
(C₄-C₁₀)-циклоалкенил-(C₁-C₆)-алкил, гетероциклил, гетероциклил-(C₁-C₆)-алкил, (C₁-C₆)-алкилтио-(C₁-C₆)-алкил, (C₁-C₆)-галогеналкилтио-(C₁-C₆)-алкил, (C₁-C₆)-алкилкарбонил-(C₁-C₆)-алкил, C(O)OR¹⁷, C(O)NR¹⁵R¹⁶, C(O)R¹⁷, R¹⁷O(O)C-(C₁-C₆)-алкил, R¹⁵R¹⁶N(O)C-(C₁-C₆)-алкил, R¹⁵R¹⁶N-(C₁-C₆)-алкил, или

5

R⁵ и R⁶ вместе с атомом углерода, с которым они связаны, образуют полностью насыщенное или частично насыщенное 3-10-членное моноциклическое или бициклическое кольцо, необязательно прерываемое гетероатомами и необязательно включающее дополнительное замещение, или

10

R⁵ и R⁶ вместе с атомом углерода, с которым они связаны, образуют двойную связь, необязательно дополнительно замещенную R¹⁹ и R²⁰, в соответствии с формулой (I') ниже,



15

m равняется 0, 1, 2,

p равняется 0, 1, 2, 3,

20

X представляет собой O (кислород), N (азот) или фрагменты N-R¹¹ или N-O-R¹², и при этом R¹¹ и R¹² во фрагментах N-R¹¹ и N-O-R¹² независимо имеют значения в соответствии с определениями ниже,

25

R⁷, R⁸, R⁹ и R¹⁰ независимо представляют собой водород, фтор, (C₁-C₆)-алкил, (C₃-C₆)-циклоалкил, (C₃-C₆)-циклоалкил-(C₁-C₆)-алкил, (C₂-C₆)-алкенил, (C₂-C₆)-алкинил, (C₁-C₁₀)-галогеналкил, (C₂-C₆)-галогеналкенил, (C₂-C₆)-галогеналкинил, (C₃-C₁₀)-галогенциклоалкил, (C₄-C₁₀)-циклоалкенил, (C₄-C₁₀)-галогенциклоалкенил, (C₁-C₆)-алкокси-(C₁-C₆)-галогеналкил, (C₁-C₆)-

галогеналкокси-(C₁-C₆)-галогеналкил, арил, арил-(C₁-C₆)-алкил,
гетероарил, гетероарил-(C₁-C₆)-алкил,

(C₄-C₁₀)-циклоалкенил-(C₁-C₆)-алкил, гетероциклил, гетероциклил-(C₁-C₆)-
алкил, R¹⁷O-(C₁-C₆)-алкил, R¹⁸S-(C₁-C₆)-алкил, (C₁-C₆)-алкилкарбонил-
5 (C₁-C₆)-алкил, C(O)OR¹⁷, C(O)NR¹⁵R¹⁶, C(O)R¹⁷, R¹⁷O(O)C-(C₁-C₆)-алкил,
R¹⁵R¹⁶N(O)C-(C₁-C₆)-алкил, R¹⁵R¹⁶N-(C₁-C₆)-алкил, или

R⁵ и R⁷ вместе с атомами углерода, с которыми они связаны, образуют
10 полностью насыщенное или частично насыщенное 3-8-членное
моноциклическое или бициклическое кольцо, необязательно прерываемое
гетероатомами и необязательно включающее дополнительное замещение,
или

R⁷ и R⁸ вместе с атомом углерода, с которым они связаны, образуют полностью
15 насыщенное или частично насыщенное 3-10-членное моноциклическое
или бициклическое кольцо, необязательно прерываемое гетероатомами и
необязательно включающее дополнительное замещение, или

R⁹ и R¹⁰ вместе с атомом углерода, с которым они связаны, образуют полностью
20 насыщенное или частично насыщенное 3-10-членное моноциклическое
или бициклическое кольцо, необязательно прерываемое гетероатомами и
необязательно включающее дополнительное замещение, или

R⁹ и R¹⁰ вместе с атомом углерода, с которым они связаны, образуют
25 экзометиленовую группу, или

R⁷ и R⁹ вместе с атомами углерода, с которыми они связаны, образуют
30 полностью насыщенное или частично насыщенное 3-10-членное
моноциклическое или бициклическое кольцо, необязательно прерываемое
гетероатомами и необязательно включающее дополнительное замещение,

R¹¹ представляет собой водород, (C₁-C₆)-алкил, (C₃-C₆)-циклоалкил, циано-
(C₁-C₆)-алкил, (C₃-C₆)-циклоалкил-(C₁-C₆)-алкил, (C₁-C₆)-алкилсульфонил,
арилсульфонил, гетероарилсульфонил, (C₃-C₆)-циклоалкилсульфонил,

гетероциклилсульфонил, арил-(C₁-C₆)-алкилсульфонил, (C₁-C₆)-алкилкарбонил, арилкарбонил, гетероарилкарбонил, (C₃-C₆)-циклоалкилкарбонил, гетероциклилкарбонил, (C₁-C₆)-алкоксикарбонил, (C₁-C₆)-алкокси, (C₂-C₆)-алкенилокси, арил-(C₁-C₆)-алкоксикарбонил, (C₁-C₆)-галогеналкилкарбонил, (C₂-C₆)-алкенил, (C₂-C₆)-алкинил, (C₁-C₆)-галогеналкил, галоген-(C₂-C₆)-алкинил, галоген-(C₂-C₆)-алкенил, (C₁-C₆)-алкокси-(C₁-C₆)-алкил, amino, (C₁-C₆)-алкиламино, бис[(C₁-C₆)-алкил]амино, (C₁-C₆)-алкокси-(C₁-C₆)-алкокси-(C₁-C₆)-алкил, гетероарил-(C₁-C₆)-алкилсульфонил, гетероциклил-(C₁-C₆)-алкилсульфонил, (C₂-C₆)-алкенилоксикарбонил, (C₂-C₆)-алкинилоксикарбонил, (C₁-C₆)-алкиламинокарбонил, (C₃-C₆)-циклоалкиламинокарбонил, бис-[(C₁-C₆)-алкил]аминокарбонил,

R¹² представляет собой водород, (C₁-C₆)-алкил, (C₃-C₆)-циклоалкил-(C₁-C₆)-алкил, (C₂-C₆)-алкенил, (C₂-C₆)-алкинил, (C₁-C₆)-алкокси-(C₁-C₆)-алкил, арил, арил-(C₁-C₆)-алкил, R¹⁷O(O)C-(C₁-C₆)-алкил, R¹⁵R¹⁶N(O)C-(C₁-C₆)-алкил,

R¹³ представляет собой водород, (C₁-C₆)-алкил, (C₁-C₆)-галогеналкил, (C₃-C₆)-циклоалкил, (C₃-C₆)-циклоалкил-(C₁-C₆)-алкил, (C₂-C₆)-алкенил, (C₂-C₆)-алкинил, (C₁-C₆)-алкокси-(C₁-C₆)-алкил, (C₁-C₆)-галогеналкокси-(C₁-C₆)-алкил, арил, арил-(C₁-C₆)-алкил, гетероарил, гетероарил-(C₁-C₆)-алкил, гетероциклил, гетероциклил-(C₁-C₆)-алкил, (C₁-C₆)-алкилтио-(C₁-C₆)-алкил, (C₁-C₆)-галогеналкилтио-(C₁-C₆)-алкил, (C₁-C₆)-алкилкарбонил-(C₁-C₆)-алкил, R¹⁷O(O)C-(C₁-C₆)-алкил, R¹⁵R¹⁶N(O)C-(C₁-C₆)-алкил, R¹⁵R¹⁶N-(C₁-C₆)-алкил, или

R⁷ и R¹³ вместе с атомами, с которыми они связаны, образуют полностью насыщенное или частично насыщенное 3-10-членное моноциклическое или бициклическое кольцо, необязательно прерываемое гетероатомами и необязательно включающее дополнительное замещение, или

R⁹ и R¹³ вместе с атомами, с которыми они связаны, образуют полностью насыщенное или частично насыщенное 3-10-членное моноциклическое

или бициклическое кольцо, необязательно прерываемое гетероатомами и необязательно включающее дополнительное замещение, или

- 5 R^{11} и R^{13} , если X представляет собой $N-R^{11}$, вместе с атомом азота, с которым они связаны, образуют 4-10-членное моноциклическое или бициклическое кольцо, которое является полностью насыщенным или необязательно прерываемым гетероатомами и необязательно включает дополнительное замещение, или
- 10 R^{12} и R^{13} , если X представляет собой $N-O-R^{12}$, вместе с атомом азота, с которым они связаны, образуют полностью насыщенное и необязательно дополнительно замещенное 4-10-членное моноциклическое или бициклическое кольцо,
- 15 R^{14} представляет собой водород, фтор, хлор, бром, (C_1-C_5) -галогеналкил, (C_1-C_6) -алкокси,
- 20 R^{15} и R^{16} являются одинаковыми или различными и независимо представляют собой водород, (C_1-C_6) -алкил, (C_2-C_6) -алкенил, (C_2-C_6) -алкинил, (C_1-C_6) -цианоалкил, (C_1-C_{10}) -галогеналкил, (C_2-C_6) -галогеналкенил, (C_2-C_6) -галогеналкинил, (C_3-C_{10}) -циклоалкил, (C_3-C_{10}) -галогенциклоалкил, (C_4-C_{10}) -циклоалкенил, (C_4-C_{10}) -галогенциклоалкенил, (C_1-C_6) -алкокси- (C_1-C_6) -алкил, (C_1-C_6) -галогеналкокси- (C_1-C_6) -алкил, (C_1-C_6) -алкилтио- (C_1-C_6) -алкил, (C_1-C_6) -галогеналкилтио- (C_1-C_6) -алкил, (C_1-C_6) -алкокси- (C_1-C_6) -галогеналкил, арил, арил- (C_1-C_6) -алкил, гетероарил,
- 25 гетероарил- (C_1-C_6) -алкил, (C_3-C_6) -циклоалкил- (C_1-C_6) -алкил, (C_4-C_{10}) -циклоалкенил- (C_1-C_6) -алкил, COR^{17} , SO_2R^{18} , (C_1-C_6) -алкил- HNO_2S- , (C_3-C_6) -циклоалкил- HNO_2S- , гетероциклил, (C_1-C_6) -алкоксикарбонил- (C_1-C_6) -алкил, (C_1-C_6) -алкоксикарбонил, арил- (C_1-C_6) -алкоксикарбонил- (C_1-C_6) -алкил, арил- (C_1-C_6) -алкоксикарбонил, гетероарил- (C_1-C_6) -алкоксикарбонил, (C_2-C_6) -алкенилоксикарбонил, (C_2-C_6) -алкинилоксикарбонил, гетероциклил- (C_1-C_6) -алкил,
- 30

R^{17} представляет собой водород, (C_1-C_6) -алкил, (C_2-C_6) -алкенил, (C_2-C_6) -алкинил, (C_1-C_6) -цианоалкил, (C_1-C_{10}) -галогеналкил, (C_2-C_6) -галогеналкенил, (C_2-C_6) -галогеналкинил, (C_3-C_{10}) -циклоалкил, (C_3-C_{10}) -галогенциклоалкил, (C_4-C_{10}) -циклоалкенил, (C_4-C_{10}) -галогенциклоалкенил, (C_1-C_6) -алкокси- (C_1-C_6) -алкил, (C_1-C_6) -алкокси- (C_1-C_6) -галогеналкил, арил, арил- (C_1-C_6) -алкил, гетероарил, гетероарил- (C_1-C_6) -алкил, (C_3-C_6) -циклоалкил- (C_1-C_6) -алкил, (C_4-C_{10}) -циклоалкенил- (C_1-C_6) -алкил, (C_1-C_6) -алкоксикарбонил- (C_1-C_6) -алкил, (C_2-C_6) -алкенилоксикарбонил- (C_1-C_6) -алкил, арил- (C_1-C_6) -алкоксикарбонил- (C_1-C_6) -алкил, гидроксикарбонил- (C_1-C_6) -алкил, гетероциклил, гетероциклил- (C_1-C_6) -алкил,

R^{18} представляет собой водород, (C_1-C_6) -алкил, (C_2-C_6) -алкенил, (C_2-C_6) -алкинил, (C_1-C_6) -цианоалкил, (C_1-C_{10}) -галогеналкил, (C_2-C_6) -галогеналкенил, (C_2-C_6) -галогеналкинил, (C_3-C_{10}) -циклоалкил, (C_3-C_{10}) -галогенциклоалкил, (C_4-C_{10}) -циклоалкенил, (C_4-C_{10}) -галогенциклоалкенил, (C_1-C_6) -алкокси- (C_1-C_6) -алкил, (C_1-C_6) -алкокси- (C_1-C_6) -галогеналкил, арил, арил- (C_1-C_6) -алкил, гетероарил, гетероарил- (C_1-C_6) -алкил, гетероциклил- (C_1-C_6) -алкил, (C_3-C_6) -циклоалкил- (C_1-C_6) -алкил, (C_4-C_{10}) -циклоалкенил- (C_1-C_6) -алкил, $NR^{15}R^{16}$,

и

R^{19} и R^{20} независимо представляют собой водород, галоген, (C_1-C_6) -алкил, (C_3-C_6) -циклоалкил, (C_2-C_6) -алкенил, (C_2-C_6) -алкинил, (C_1-C_6) -галогеналкил, арил или

R^{19} и R^{20} вместе с атомом углерода, с которым они связаны, образуют 3-10-членное моноциклическое или бициклическое кольцо, которое является насыщенным или необязательно прерываемым гетероатомами и необязательно включает дополнительное замещение.

4. Соединение общей формулы (I) по п. 1 и/или его соль, отличающееся тем, что

- R^1 представляет собой метил, этил, н-пропил, 1-метилэтил, н-бутил, 1-метилпропил, 2-метилпропил, 1,1-диметилэтил, н-пентил, 1-метилбутил, 2-метилбутил, 3-метилбутил, 1,1-диметилпропил, 1,2-диметилпропил, 2,2-диметилпропил, 1-этилпропил, н-гексил, 1-метилпентил, 2-метилпентил, 3-метилпентил, 4-метилпентил, 1,1-диметилбутил, 1,2-диметилбутил, 1,3-диметилбутил, 2,2-диметилбутил, 2,3-диметилбутил, 3,3-диметилбутил, 1-этилбутил, 2-этилбутил, 1,1,2-триметилпропил, 1,2,2-триметилпропил, 1-этил-1-метилпропил, 1-этил-2-метилпропил, amino, диметиламино, диэтиламино, метил(этил)амино, метил(н-пропил)амино,
- R^2 представляет собой водород, метил, этил, н-пропил, изопропил,
- R^3 представляет собой водород, фтор, хлор, бром, метокси, этокси,
- R^4 представляет собой галоген, циано, NO_2 , $C(O)NH_2$, $C(S)NH_2$, дифторметил, трифторметил, этинил, пропин-1-ил, 1-бутин-1-ил, пентин-1-ил, гексин-1-ил,
- R^5 и R^6 независимо представляют собой водород, фтор, метил, этил, н-пропил, 1-метилэтил, н-бутил, 1-метилпропил, 2-метилпропил, 1,1-диметилэтил, н-пентил, 1-метилбутил, 2-метилбутил, 3-метилбутил, 1,1-диметилпропил, 1,2-диметилпропил, 2,2-диметилпропил, 1-этилпропил, н-гексил, 1-метилпентил, 2-метилпентил, 3-метилпентил, 4-метилпентил, 1,1-диметилбутил, 1,2-диметилбутил, 1,3-диметилбутил, 2,2-диметилбутил, 2,3-диметилбутил, 3,3-диметилбутил, 1-этилбутил, 2-этилбутил, 1,1,2-триметилпропил, 1,2,2-триметилпропил, 1-этил-1-метилпропил, 1-этил-2-метилпропил, циклопропил, циклобутил, циклопентил, циклогексил, спиро[2.2]пент-1-ил, спиро[2.3]гекс-1-ил, спиро[2.3]гекс-4-ил, 3-спиро[2.3]гекс-5-ил, бицикло[1.1.0]бутан-1-ил, бицикло[1.1.0]бутан-2-ил, бицикло[2.1.0]пентан-1-ил, бицикло[1.1.1]пентан-1-ил,

- бицикло[2.1.0]пентан-2-ил, бицикло[2.1.0]пентан-5-ил, бицикло[2.1.1]гексил, 1-метилциклопропил, 2-метилциклопропил, 2,2-диметилциклопропил, 2,3-диметилциклопропил, 1,1'-би(циклопропил)-1-ил, 1,1'-би(циклопропил)-2-ил, 2'-метил-1,1'-би(циклопропил)-2-ил, 1-цианоциклопропил, 2-цианоциклопропил, 1-метилциклобутил, 2-метилциклобутил, 3-метилциклобутил, 3,3-диметилциклобут-1-ил, 1-цианоциклобутил, 2-цианоциклобутил, 3-цианоциклобутил, 3,3-дифторциклобут-1-ил, 3-фторциклобут-1-ил, 2,2-дифторциклопроп-1-ил, 1-фторциклопроп-1-ил, 2-фторциклопроп-1-ил, 1-аллилциклопропил, 1-винилциклобутил, 1-винилциклопропил, 1-этилциклопропил, 1-метилциклогексил, 2-метилциклогексил, 3-метилциклогексил, 1-метоксициклогексил, 2-метоксициклогексил, 3-метоксициклогексил, 2-фторциклопроп-1-ил, 4-фторциклогексил, 4,4-дифторциклогексил, циклопропилметил, циклобутилметил, циклопентилметил, циклогексилметил, этенил, 1-пропенил, 2-пропенил, 1-метилэтенил, 1-бутенил, 2-бутенил, 3-бутенил, 1-метил-1-пропенил, 2-метил-1-пропенил, 1-метил-2-пропенил, 2-метил-2-пропенил, 1-пентенил, 2-пентенил, 3-пентенил, 4-пентенил, 1-метил-1-бутенил, 2-метил-1-бутенил, 3-метил-1-бутенил, 1-метил-2-бутенил, 2-метил-2-бутенил, 3-метил-2-бутенил, 1-метил-3-бутенил, 2-метил-3-бутенил, 3-метил-3-бутенил, 1,1-диметил-2-пропенил, 1,2-диметил-1-пропенил, 1,2-диметил-2-пропенил, 1-этил-1-пропенил, 1-этил-2-пропенил, 1-гексенил, 2-гексенил, 3-гексенил, 4-гексенил, 5-гексенил, 1-метил-1-пентенил, 2-метил-1-пентенил, 3-метил-1-пентенил, 4-метил-1-пентенил, 1-метил-2-пентенил, 2-метил-2-пентенил, 3-метил-2-пентенил, 4-метил-2-пентенил, 1-метил-3-пентенил, 2-метил-3-пентенил, 3-метил-3-пентенил, 4-метил-3-пентенил, 1-метил-4-пентенил, 2-метил-4-пентенил, 3-метил-4-пентенил, 4-метил-4-пентенил, 1,1-диметил-2-бутенил, 1,1-диметил-3-бутенил, 1,2-диметил-1-бутенил, 1,2-диметил-2-бутенил, 1,2-диметил-3-бутенил, 1,3-диметил-1-бутенил, 1,3-диметил-2-бутенил, 1,3-диметил-3-бутенил, 2,2-диметил-3-бутенил, 2,3-диметил-1-бутенил, 2,3-диметил-2-бутенил, 2,3-диметил-3-бутенил, 3,3-диметил-1-бутенил, 3,3-диметил-2-бутенил,

- 1-этил-1-бутенил, 1-этил-2-бутенил, 1-этил-3-бутенил, 2-этил-1-бутенил, 2-этил-2-бутенил, 2-этил-3-бутенил, 1,1,2-триметил-2-пропенил, 1-этил-1-метил-2-пропенил, 1-этил-2-метил-1-пропенил, 1-этил-2-метил-2-пропенил, этинил, 1-пропинил, 2-пропинил, 1-бутинил, 2-бутинил, 3-бутинил, 1-метил-2-пропинил,
- 5 1-пентинил, 2-пентинил, 3-пентинил, 4-пентинил, 1-метил-2-бутинил, 1-метил-3-бутинил, 2-метил-3-бутинил, 3-метил-1-бутинил, 1,1-диметил-2-пропинил, 1-этил-2-пропинил, 1-гексинил, 2-гексинил, 3-гексинил, 4-гексинил, 5-гексинил, 1-метил-2-пентинил, 1-метил-3-пентинил, 1-метил-4-пентинил, 2-метил-3-пентинил, 2-метил-4-пентинил, 3-метил-1-пентинил, 3-метил-4-пентинил, 4-метил-1-пентинил, 4-метил-2-пентинил, 1,1-диметил-2-бутинил, 1,1-диметил-3-бутинил, 1,2-диметил-3-бутинил, 2,2-диметил-3-бутинил, 3,3-диметил-1-бутинил, 1-этил-2-бутинил, 1-этил-3-бутинил, 2-этил-3-бутинил, 1-этил-1-метил-2-пропинил, трифторметил, пентафторэтил,
- 15 1,1,2,2-тетрафторэтил, гептафторпропил, нонафторбутил, хлордифторметил, бромдифторметил, дихлорфторметил, йоддифторметил, бромфторметил, 1-фторэтил, 2-фторэтил, фторметил, дифторметил, 2,2-дифторэтил, 2,2,2-трифторэтил, дифтор-трет-бутил, хлорметил, бромметил, метокси, этокси,
- 20 н-пропилокси, изопрпилокси, н-бутилокси, трет-бутилокси, метоксиметил, этоксиметил, н-пропилоксиметил, изопрпилоксиметил, метоксиэтил, этоксиэтил, н-пропилоксиэтил, изопрпилоксиэтил, метокси-н-пропил, метоксидифторметил, этоксидифторметил, н-пропилоксидифторметил, н-бутилоксидифторметил, трифторметоксиметил, трифторметоксиэтил,
- 25 трифторметокси-н-пропил, фенил, 2-фторфенил, 3-фторфенил, 4-фторфенил, 2,4-дифторфенил, 2,5-дифторфенил,
- 2,6-дифторфенил, 2,3-дифторфенил, 3,4-дифторфенил, 3,5-дифторфенил, 2,4,5-трифторфенил, 3,4,5-трифторфенил, 2-хлорфенил, 3-хлорфенил, 4-хлорфенил, 2,4-дихлорфенил, 2,5-дихлорфенил, 2,6-дихлорфенил, 2,3-дихлорфенил, 3,4-дихлорфенил, 3,5-дихлорфенил, 2,4,5-трихлорфенил, 3,4,5-трихлорфенил, 2,4,6-трихлорфенил, 2-бромфенил, 3-бромфенил, 4-бромфенил, 2-йодфенил,
- 30 3-йодфенил, 4-йодфенил, 2-бром-4-фторфенил, 2-бром-4-хлорфенил, 3-бром-4-фторфенил, 3-бром-4-хлорфенил, 3-бром-5-фторфенил, 3-бром-5-

- хлорфенил, 2-фтор-4-бромфенил, 2-хлор-4-бромфенил, 3-фтор-4-бромфенил, 3-хлор-4-бромфенил, 2-хлор-4-фторфенил, 3-хлор-4-фторфенил, 2-фтор-3-хлорфенил, 2-фтор-4-хлорфенил, 2-фтор-5-хлорфенил, 3-фтор-4-хлорфенил, 3-фтор-5-хлорфенил, 2-фтор-6-хлорфенил, 2-метилфенил, 3-метилфенил, 4-метилфенил, 2,4-диметилфенил, 2,5-диметилфенил, 2,6-диметилфенил, 2,3-диметилфенил, 3,4-диметилфенил,
- 3,5-диметилфенил, 2,4,5-триметилфенил, 3,4,5-триметилфенил, 2,4,6-триметилфенил, 2-метоксифенил, 3-метоксифенил, 4-метоксифенил, 2,4-диметоксифенил, 2,5-диметоксифенил, 2,6-диметоксифенил, 2,3-диметоксифенил, 3,4-диметоксифенил,
- 3,5-диметоксифенил, 2,4,5-триметоксифенил, 3,4,5-триметоксифенил, 2,4,6-триметоксифенил, 2-трифторметоксифенил, 3-трифторметоксифенил, 4-трифторметоксифенил, 2-дифторметоксифенил, 3-дифторметоксифенил, 4-дифторметоксифенил, 2-трифторметилфенил, 3-трифторметилфенил, 4-трифторметилфенил, 2-дифторметилфенил, 3-дифторметилфенил, 4-дифторметилфенил, 3,5-бис(трифторметил)фенил, 3-трифторметил-5-фторфенил,
- 3-трифторметил-5-хлорфенил, 3-метил-5-фторфенил, 3-метил-5-хлорфенил, 3-метокси-5-фторфенил, 3-метокси-5-хлорфенил, 3-трифторметокси-5-хлорфенил, 2-этоксифенил, 3-этоксифенил, 4-этоксифенил, 2-метилтиофенил, 3-метилтиофенил, 4-метилтиофенил, 2-трифторметилтиофенил,
- 3-трифторметилтиофенил, 4-трифторметилтиофенил, 2-этилфенил, 3-этилфенил, 4-этилфенил, 2-метоксикарбонилфенил, 3-метоксикарбонилфенил, 4-метоксикарбонилфенил, 2-этоксикарбонилфенил, 3-этоксикарбонилфенил, 4-этоксикарбонилфенил, пиридин-2-ил, пиридин-3-ил, пиридин-4-ил, пиразин-2-ил, пиридазин-3-ил, пиридазин-4-ил, пиримидин-2-ил, пиримидин-5-ил, пиримидин-4-ил, пиридазин-3-илметил, пиридазин-4-илметил, пиримидин-2-илметил, пиримидин-5-илметил,
- пиримидин-4-илметил, пиразин-2-илметил, 3-хлорпиразин-2-ил, 3-бромпиразин-2-ил, 3-метоксипиразин-2-ил, 3-этоксипиразин-2-ил, 3-трифторметилпиразин-2-ил, 3-цианопиразин-2-ил, нафт-2-ил, нафт-1-ил,

хинолин-4-ил, хинолин-6-ил, хинолин-8-ил, хинолин-2-ил, хиноксалин-2-ил, 2-нафтилметил, 1-нафтилметил, хинолин-4-илметил, хинолин-6-илметил, хинолин-8-илметил, хинолин-2-илметил, хиноксалин-2-илметил, пиразин-2-илметил, 4-хлорпиридин-2-ил, 3-хлорпиридин-4-ил,

5 2-хлорпиридин-3-ил, 2-хлорпиридин-4-ил, 2-хлорпиридин-5-ил, 2,6-дихлорпиридин-4-ил, 3-хлорпиридин-5-ил, 3,5-дихлорпиридин-2-ил, 3-хлор-5-трифторметилпиридин-2-ил, (4-хлорпиридин-2-ил)метил, (3-хлорпиридин-4-ил)метил, (2-хлорпиридин-3-ил)метил, (2-хлорпиридин-4-ил)метил, (2-хлорпиридин-5-ил)метил, (2,6-дихлорпиридин-4-ил)метил,

10 (3-хлорпиридин-5-ил)метил, (3,5-дихлорпиридин-2-ил)метил, тиофен-2-ил, тиофен-3-ил, 5-метилтиофен-2-ил, 5-этилтиофен-2-ил, 5-хлортиофен-2-ил,

5-бромтиофен-2-ил, 4-метилтиофен-2-ил, 3-метилтиофен-2-ил, 5-фтортиофен-3-ил, 3,5-диметилтиофен-2-ил, 3-этилтиофен-2-ил, 4,5-диметилтиофен-2-ил,

15 3,4-диметилтиофен-2-ил, 4-хлортиофен-2-ил, фуран-2-ил, 5-метилфуран-2-ил, 5-этилфуран-2-ил, 5-метоксикарбонилфуран-2-ил, 5-хлорфуран-2-ил, 5-бромфуран-2-ил, тиофан-2-ил, тиофан-3-ил, сульфолан-2-ил, сульфолан-3-ил, тетрагидропириран-4-ил, тетрагидропириран-4-ил, тетрагидрофуран-2-ил, тетрагидрофуран-3-ил, 1-

20 (4-метилфенил)этил, 1-(3-метилфенил)этил, 1-(2-метилфенил)этил, 1-(4-хлорфенил)этил, 1-(3-хлорфенил)этил, 1-(2-хлорфенил)этил, бензил, (4-фторфенил)метил, (3-фторфенил)метил, (2-фторфенил)метил, (2,4-дифторфенил)метил, (3,5-дифторфенил)метил, (2,5-дифторфенил)метил, (2,6-дифторфенил)метил, (2,4,5-трифторфенил)метил, (2,4,6-

25 трифторфенил)метил, (4-хлорфенил)метил, (3-хлорфенил)метил, (2-хлорфенил)метил, (2,4-дихлорфенил)метил, (3,5-дихлорфенил)метил, (2,5-дихлорфенил)метил,

(2,6-дихлорфенил)метил, (2,4,5-трихлорфенил)метил, (2,4,6-трихлорфенил)метил, (4-бромфенил)метил, (3-бромфенил)метил, (2-

30 бромфенил)метил, (4-йодфенил)метил, (3-йодфенил)метил, (2-йодфенил)метил, (3-хлор-5-трифторметилпиридин-2-ил)метил, (2-бром-4-фторфенил)метил, (2-бром-4-хлорфенил)метил, (3-бром-4-фторфенил)метил, (3-бром-4-хлорфенил)метил, (3-бром-5-фторфенил)метил, (3-бром-5-

хлорфенил)метил, (2-фтор-4-бромфенил)метил, (2-хлор-4-
 бромфенил)метил, (3-фтор-4-бромфенил)метил, (3-хлор-4-
 бромфенил)метил, (2-хлор-4-фторфенил)метил, (3-хлор-4-
 фторфенил)метил, (2-фтор-3-хлорфенил)метил,
 5 (2-фтор-4-хлорфенил)метил, (2-фтор-5-хлорфенил)метил, (3-фтор-4-
 хлорфенил)метил, (3-фтор-5-хлорфенил)метил, (2-фтор-6-
 хлорфенил)метил, 2-фенилэт-1-ил, 3-трифторметил-4-хлорфенил,
 3-хлор-4-трифторметилфенил, 2-хлор-4-трифторметилфенил, 3,5-
 дифторпиридин-2-ил, (3,6-дихлорпиридин-2-ил)метил, (4-
 10 трифторметилфенил)метил, (3-трифторметилфенил)метил, (2-
 трифторметилфенил)метил,
 (4-трифторметоксифенил)метил, (3-трифторметоксифенил)метил, (2-
 трифторметоксифенил)метил, (4-метоксифенил)метил, (3-
 метоксифенил)метил, (2-метоксифенил)метил, (4-метилфенил)метил, (3-
 15 метилфенил)метил, (2-метилфенил)метил, (4-цианофенил)метил, (3-
 цианофенил)метил,
 (2-цианофенил)метил, (2,4-диэтилфенил)метил, (3,5-диэтилфенил)метил, (3,4-
 диметилфенил)метил, (3,5-диметоксифенил)метил, 1-фенилэт-1-ил, 1-(о-
 хлорфенил)эт-1-ил, 1,3-тиазол-2-ил, 4-метил-1,3-тиазол-2-ил, 1,3-тиазол-
 20 2-ил, метилтиометил, этилтиометил, этилтиоэтил, метилтиоэтил, н-
 пропилтиометил, изопротилтиометил, трифторметилтиометил,
 трифторметилтиоэтил,
 метилкарбонилметил, этилкарбонилметил, н-пропилкарбонилметил,
 изопротилкарбонилметил, метилкарбонилэтил, гидроксикарбонил,
 25 метоксикарбонил, этоксикарбонил, н-пропилоксикарбонил,
 изопротилоксикарбонил, н-бутилоксикарбонил, трет-бутилоксикарбонил,
 аллилоксикарбонил, бензилоксикарбонил, аминокарбонил,
 метиламинокарбонил, этиламинокарбонил, н-пропиламинокарбонил,
 изопротиламинокарбонил, диметиламинокарбонил,
 30 диэтиламинокарбонил, метил(этил)аминокарбонил,
 циклопропиламинокарбонил, циклобутиламинокарбонил,
 циклопентиламинокарбонил,
 циклогексиламинокарбонил, аллиламинокарбонил, бензиламинокарбонил, трет-
 бутилоксикарбониламинокарбонил, гидроксикарбонилметил,

- метоксикарбонилметил, этоксикарбонилметил, н-пропилоксикарбонилметил, изопропилоксикарбонилметил, н-бутилоксикарбонилметил, трет-бутилоксикарбонилметил, аллилоксикарбонилметил,
- 5 бензилоксикарбонилметил, аминокарбонилметил, метиламинокарбонилметил, этиламинокарбонилметил, н-пропиламинокарбонилметил, изопропиламинокарбонилметил, диметиламинокарбонилметил, диэтиламинокарбонилметил, метил(этил)аминокарбонилметил, циклопропиламинокарбонилметил, циклобутиламинокарбонилметил,
- 10 циклопентиламинокарбонилметил, циклогексиламинокарбонилметил, аллиламинокарбонилметил, бензиламинокарбонилметил, 1-(гидроксикарбонил)эт-1-ил, 1-(метоксикарбонил)эт-1-ил, 1-(этоксикарбонил)эт-1-ил, 1-(трет-бутилоксикарбонил)эт-1-ил, 1-(бензилоксикарбонил)эт-1-ил, 2-(гидроксикарбонил)эт-1-ил,
- 15 2-(метоксикарбонил)эт-1-ил, 2-(этоксикарбонил)эт-1-ил, 2-(трет-бутилоксикарбонил)эт-1-ил, 2-(бензилоксикарбонил)эт-1-ил, 1-(гидроксикарбонил)проп-1-ил, 1-(метоксикарбонил)проп-1-ил, 1-(этоксикарбонил)проп-1-ил, 1-(трет-бутилоксикарбонил)проп-1-ил, 1-(бензилоксикарбонил)проп-1-ил,
- 20 2-(гидроксикарбонил)проп-1-ил, 2-(метоксикарбонил)проп-1-ил, 2-(этоксикарбонил)проп-1-ил, 2-(трет-бутилоксикарбонил)проп-1-ил, 2-(бензилоксикарбонил)проп-1-ил, 1-(гидроксикарбонил)проп-2-ил, 1-(метоксикарбонил)проп-2-ил, 1-(этоксикарбонил)проп-2-ил, 1-(трет-бутилоксикарбонил)проп-2-ил, 1-(бензилоксикарбонил)проп-2-ил,
- 25 3-(гидроксикарбонил)проп-1-ил, 3-(метоксикарбонил)проп-1-ил, 3-(этоксикарбонил)проп-1-ил, 3-(трет-бутилоксикарбонил)проп-1-ил, 3-(бензилоксикарбонил)проп-1-ил, аминметил, 2-аминоэт-1-ил, 1-аминоэт-1-ил, 1-аминопроп-1-ил, 3-аминопроп-1-ил, метиламинометил, диметиламинометил, диэтиламинометил, этиламинометил,
- 30 изопропиламинометил, циклопропиламинометил, циклобутиламинометил, циклопентиламинометил, циклогексиламинометил, метоксикарбониламинометил, этоксикарбониламинометил, трет-бутилоксикарбониламинометил, метилкарбониламинометил, этилкарбониламинометил, н-

пропилкарбониламинметил, изопропилкарбониламинметил, 2-(метиламино)эт-1-ил,

2-(диэт-1-иламино)эт-1-ил, 2-(диэтиламино)эт-1-ил, 2-(этиламино)эт-1-ил, 2-(изопропиламино)эт-1-ил, 2-(циклопропиламино)эт-1-ил, 2-(циклобутиламино)эт-1-ил, 2-(циклопентиламино)эт-1-ил, 2-(циклогексиламино)эт-1-ил, 2-(метоксикарбониламино)эт-1-ил, 2-(этоксикарбониламино)эт-1-ил,

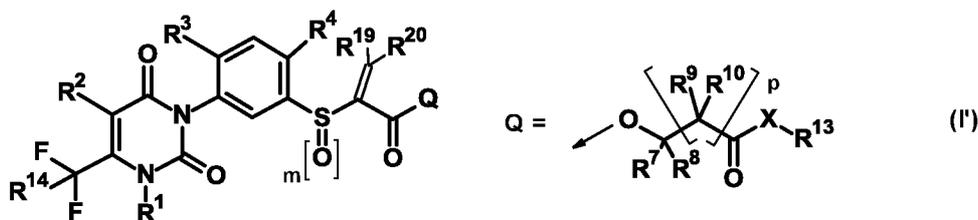
2-(трет-бутилоксикарбониламино)эт-1-ил, 2-(метилкарбониламино)эт-1-ил, 2-(этилкарбониламино)эт-1-ил, 2-(н-пропилкарбониламино)эт-1-ил,

2-(изопропилкарбониламино)эт-1-ил, 1-(метиламино)эт-1-ил, 1-(диэт-1-иламино)эт-1-ил, 1-(диэтиламино)эт-1-ил, 1-(этиламино)эт-1-ил, 1-(изопропиламино)эт-1-ил, 1-(циклопропиламино)эт-1-ил, 1-(циклобутиламино)эт-1-ил, 1-(циклопентиламино)эт-1-ил, 1-(циклогексиламино)эт-1-ил, 1-(метоксикарбониламино)эт-1-ил,

1-(этоксикарбониламино)эт-1-ил, 1-(трет-бутилоксикарбониламино)эт-1-ил, 1-(метилкарбониламино)эт-1-ил, 1-(этилкарбониламино)эт-1-ил, 1-(н-пропилкарбониламино)эт-1-ил, 1-(изопропилкарбониламино)эт-1-ил, или

R^5 и R^6 вместе с атомом углерода, с которым они связаны, образуют полностью насыщенное или частично насыщенное 3-10-членное моноциклическое или бициклическое кольцо, необязательно прерываемое гетероатомами и необязательно включающее дополнительное замещение, или

R^5 и R^6 вместе с атомом углерода, с которым они связаны, образуют двойную связь, необязательно дополнительно замещенную R^{19} и R^{20} , в соответствии с формулой (I') ниже,



R^{14} представляет собой водород, фтор, хлор, бром, трифторметил, метокси, этокси, н-пропилокси, н-бутилокси,

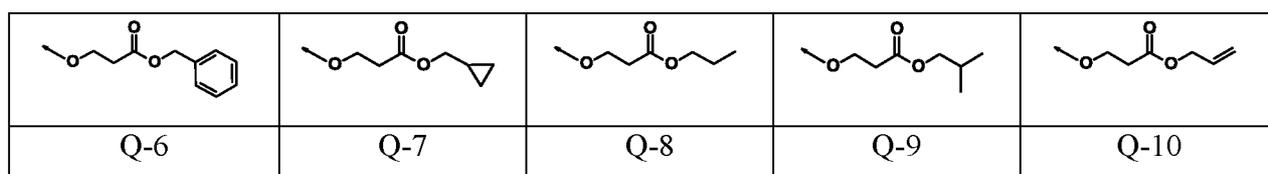
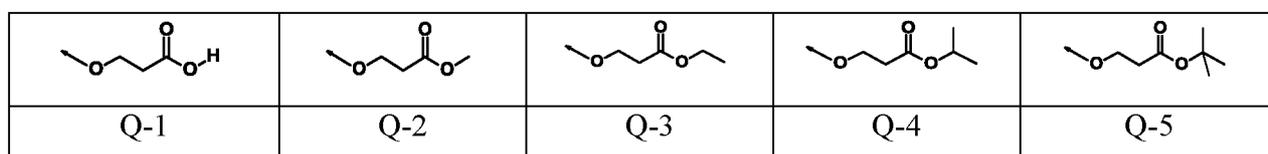
m равняется 0, 1, 2,

5 R^{19} и R^{20} независимо представляют собой водород, фтор, хлор, бром, метил, этил, н-пропил, 1-метилэтил, н-бутил, 1-метилпропил, 2-метилпропил, 1,1-диметилэтил, н-пентил, 1-метилбутил, 2-метилбутил, 3-метилбутил, 1,1-диметилпропил, 1,2-диметилпропил, 2,2-диметилпропил, 1-этилпропил, н-гексил, циклопропил, циклобутил, циклопентил, циклогексил, трифторметил, дифторметил, пентафторэтил, этенил, 1-пропенил, 1-метилэтенил, 1-бутенил, фенил или

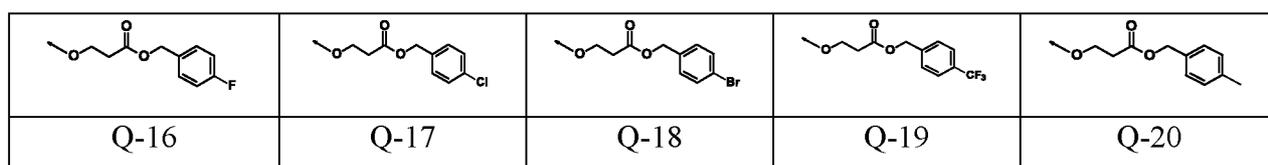
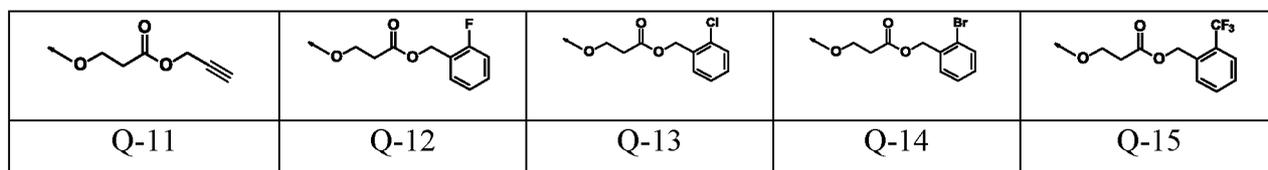
10 R^{19} и R^{20} вместе с атомом углерода, с которым они связаны, образуют 3-10-членное моноциклическое или бициклическое кольцо, которое является насыщенным или необязательно прерываемым гетероатомами и

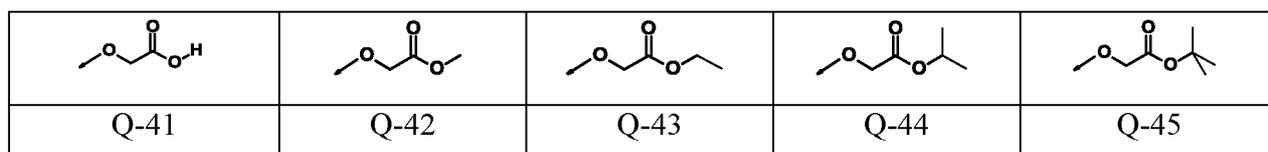
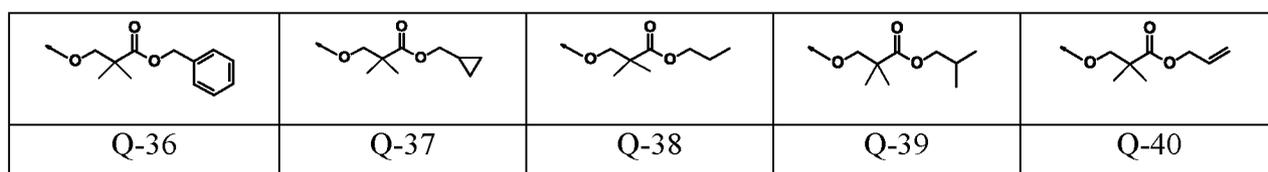
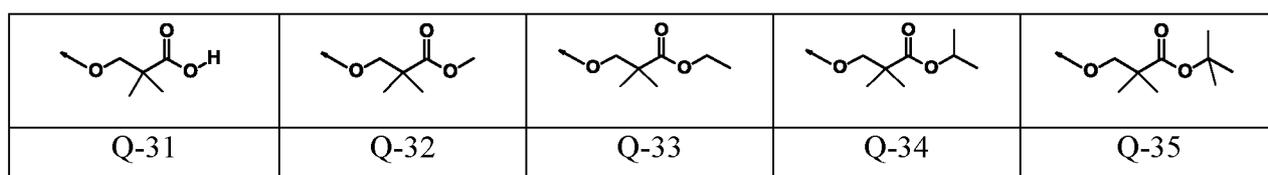
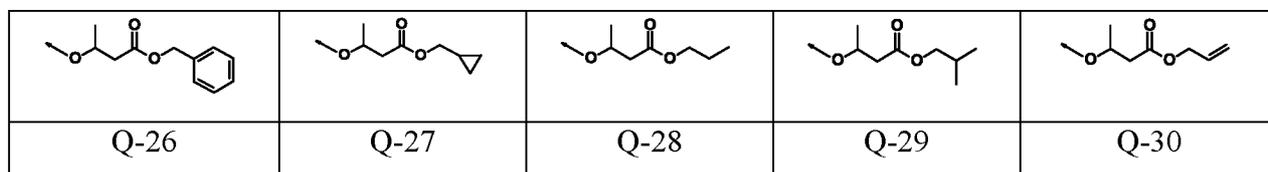
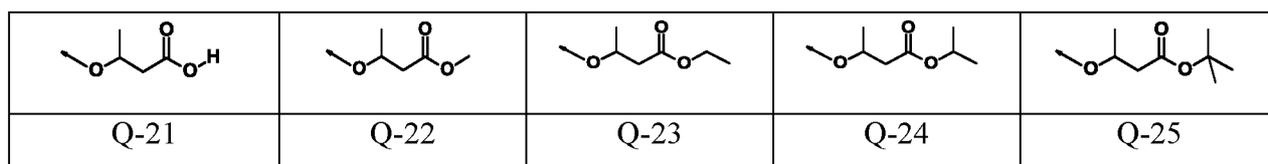
15 необязательно включает дополнительное замещение,

и Q представляет собой один из фрагментов Q-1 - Q-300, указанных ниже:

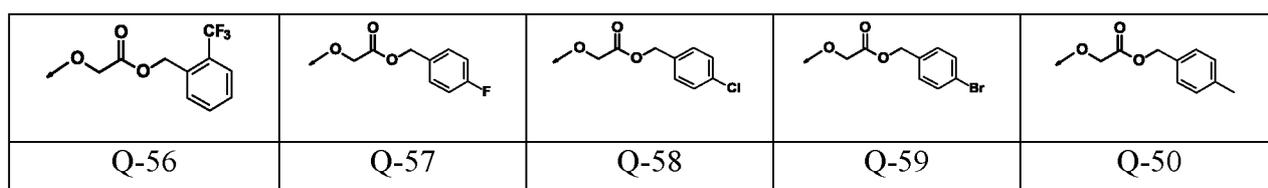
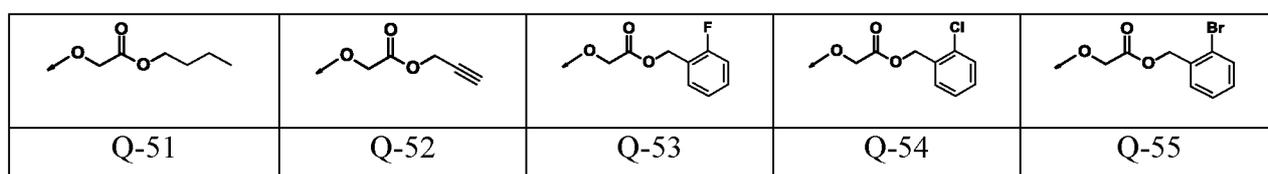
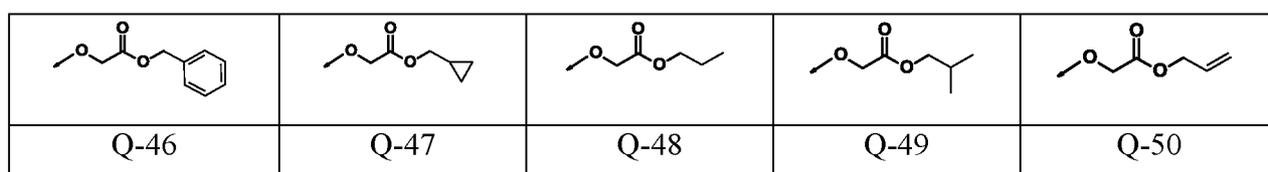


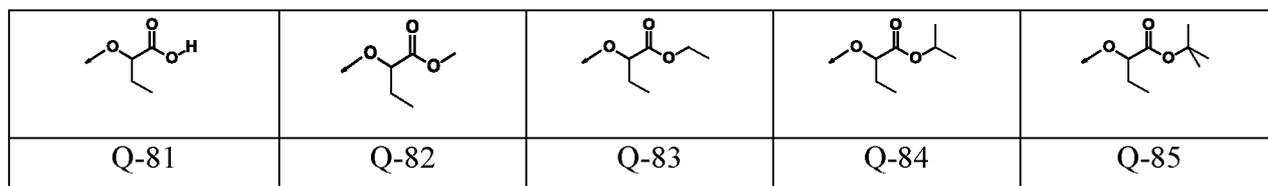
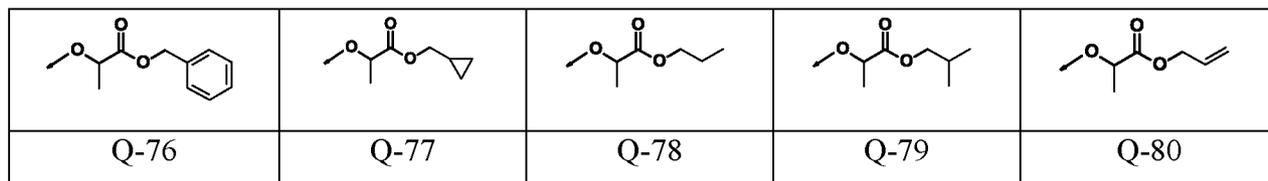
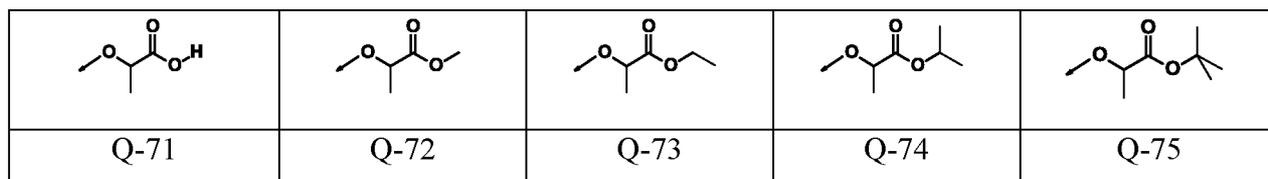
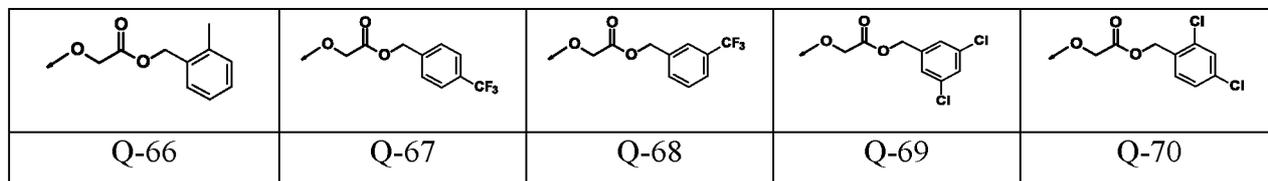
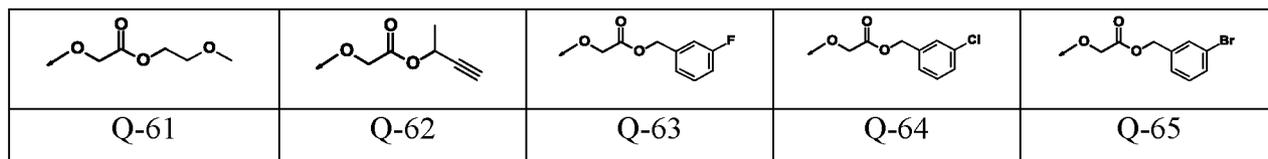
20



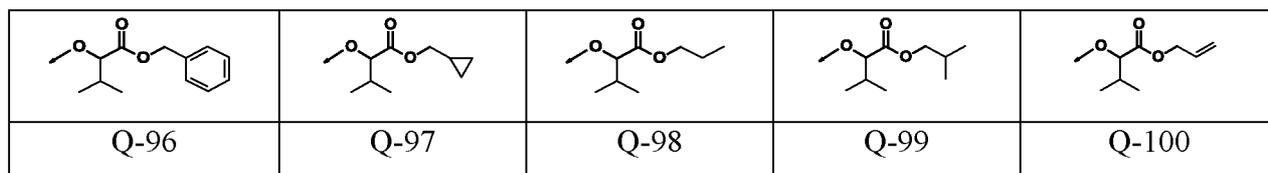
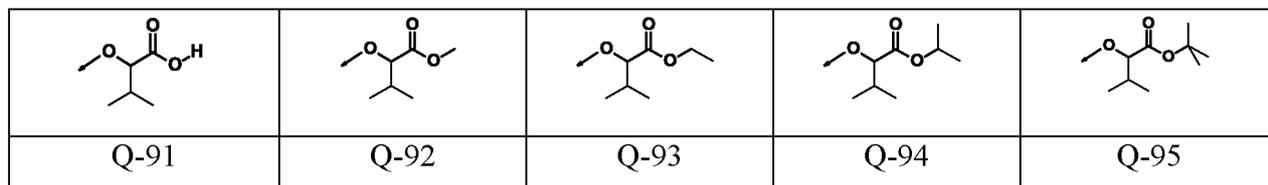
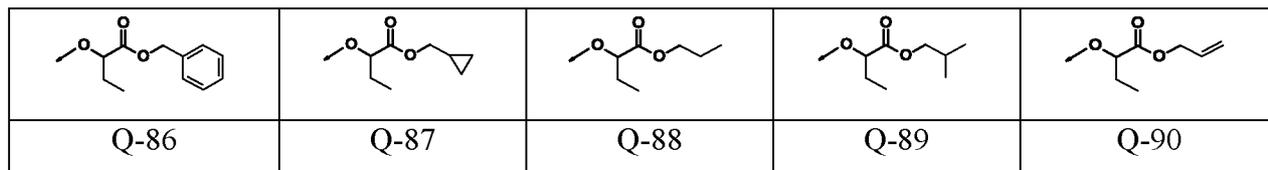


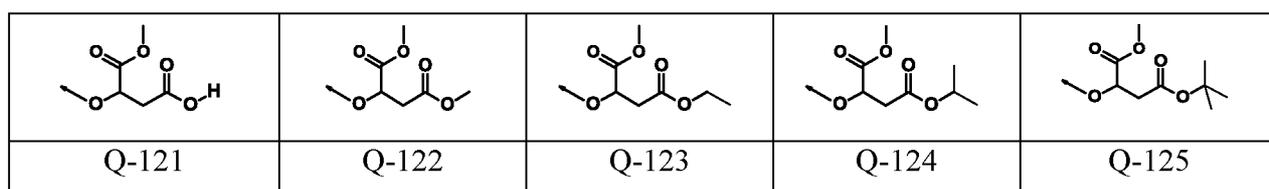
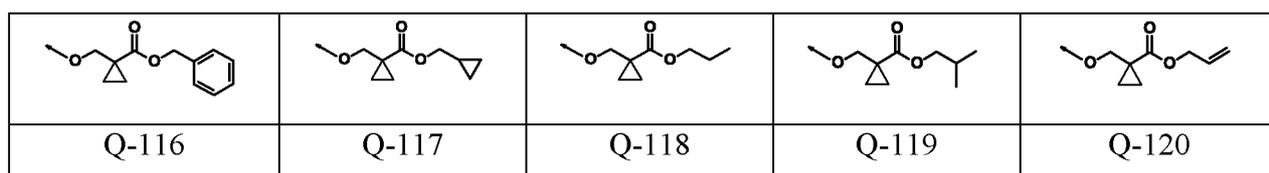
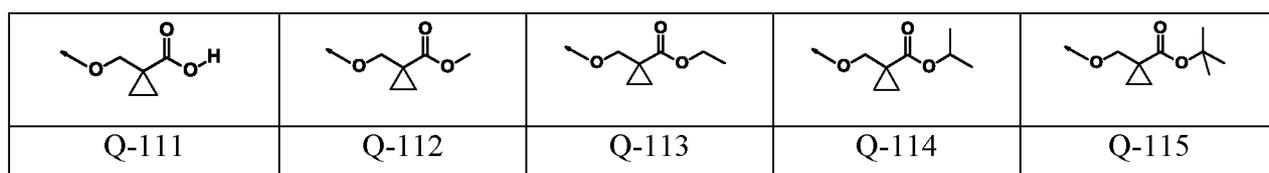
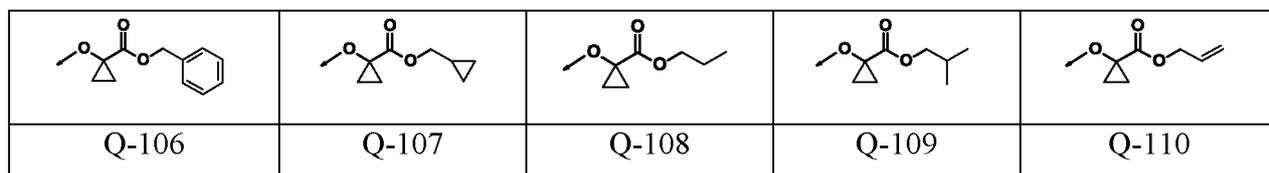
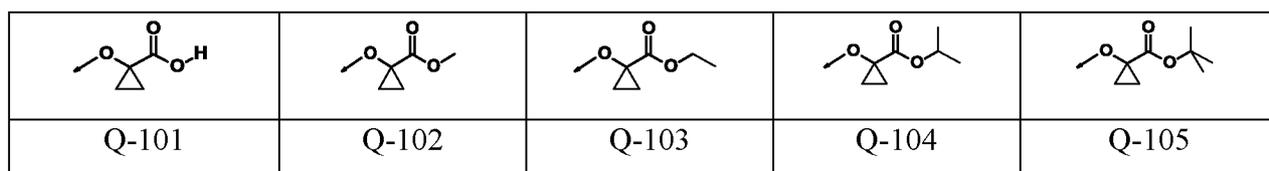
5



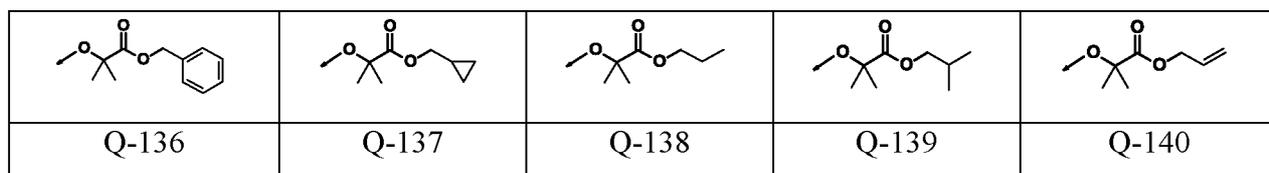
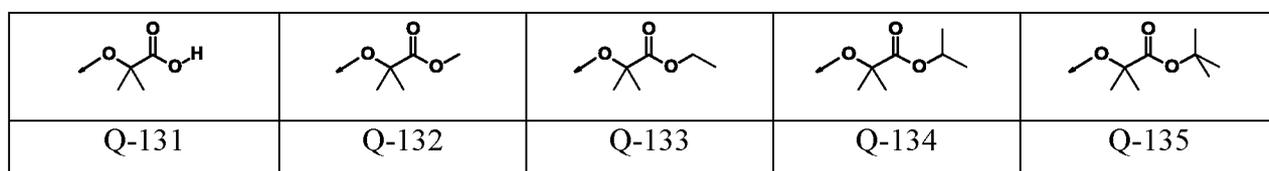
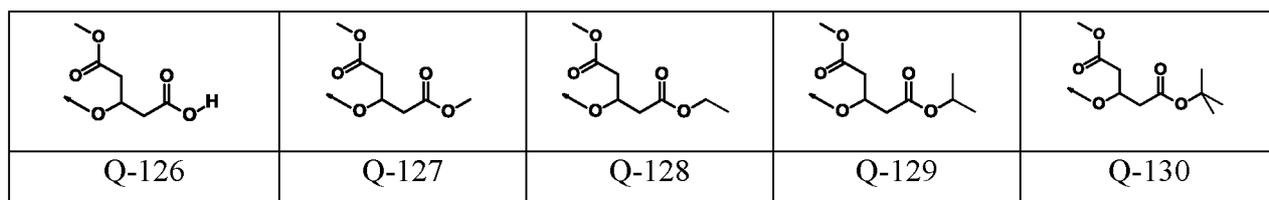


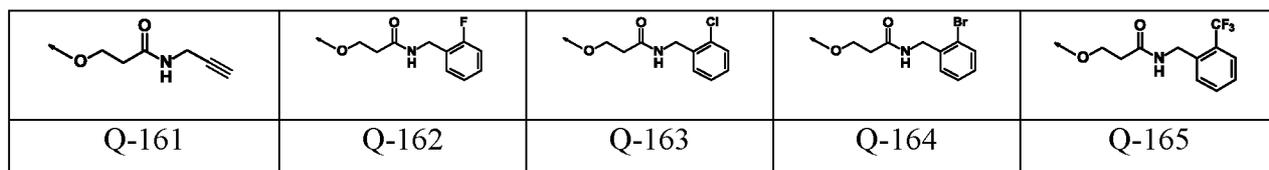
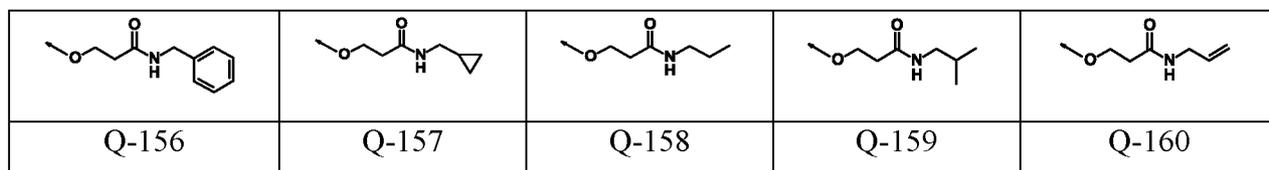
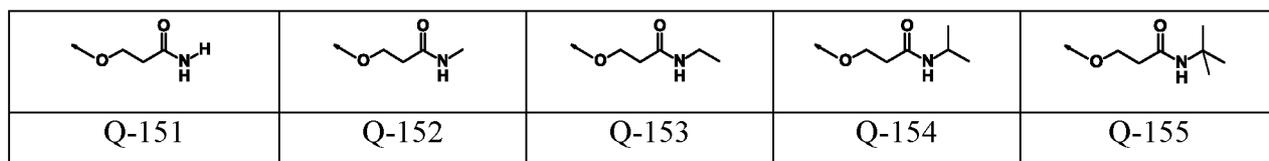
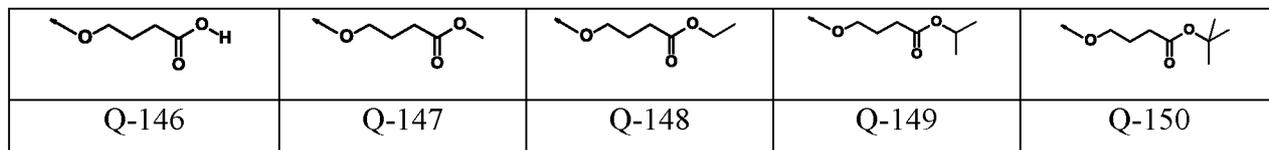
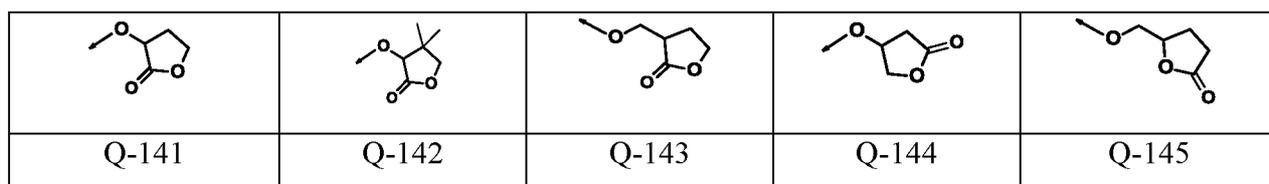
5



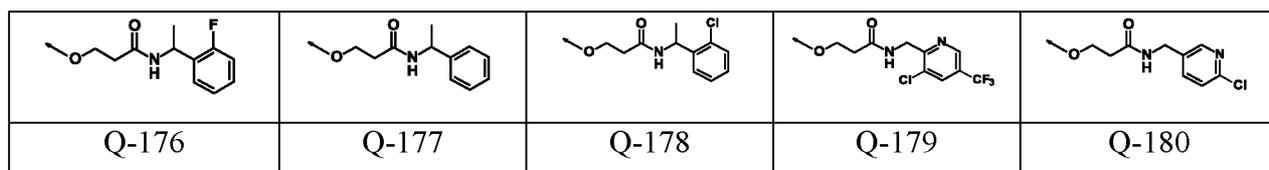
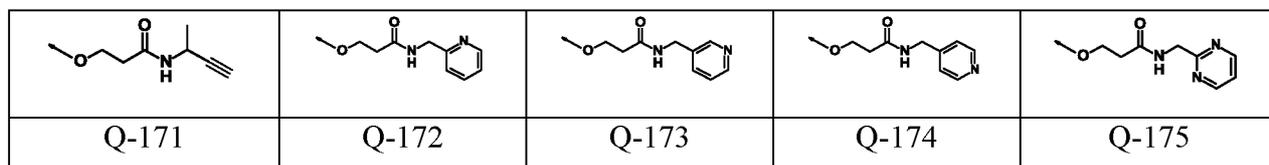
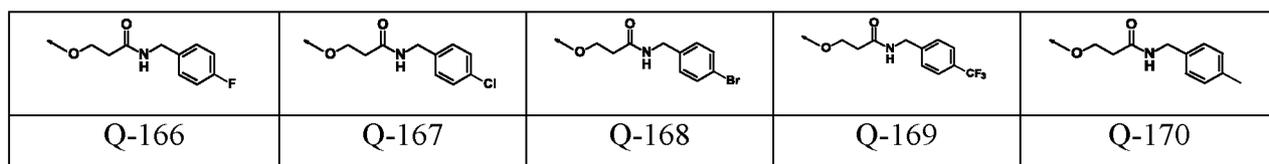


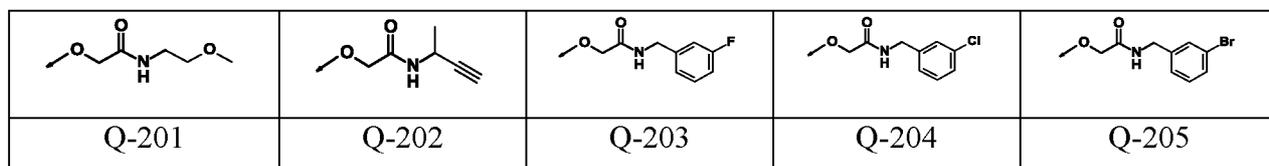
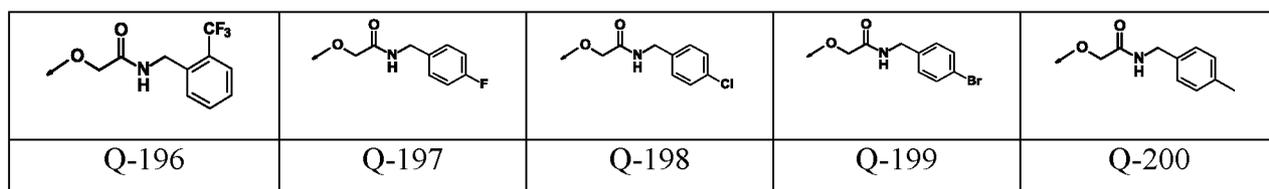
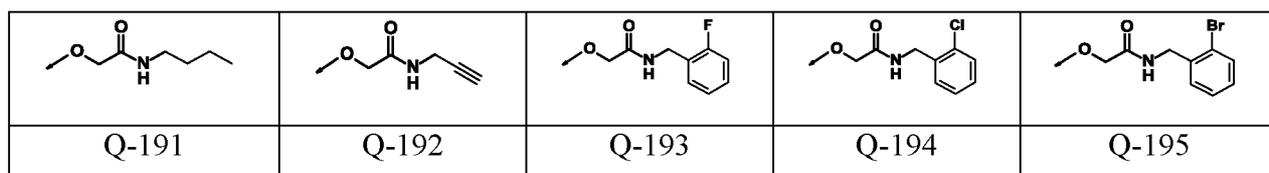
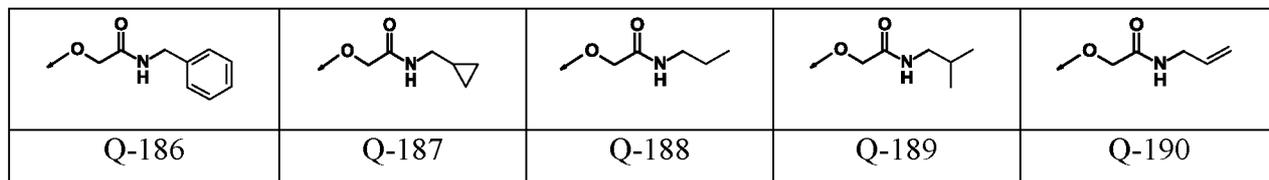
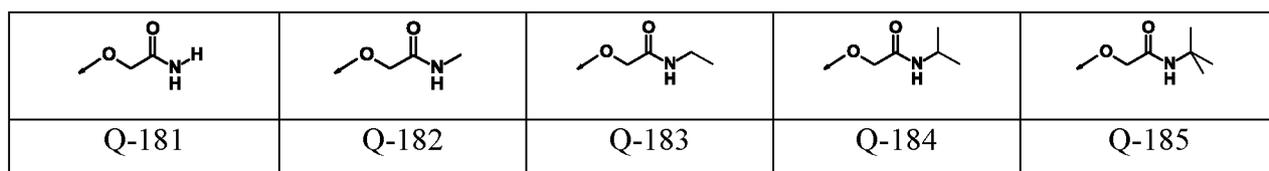
5



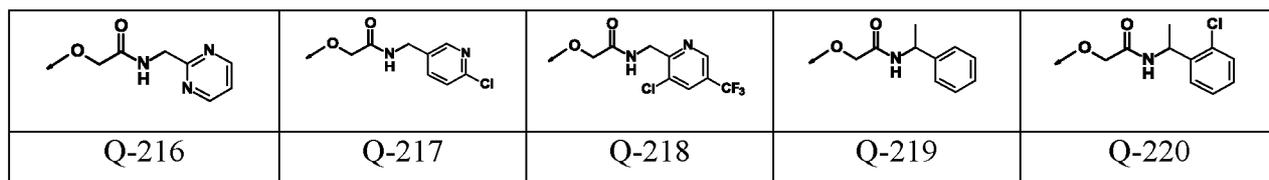
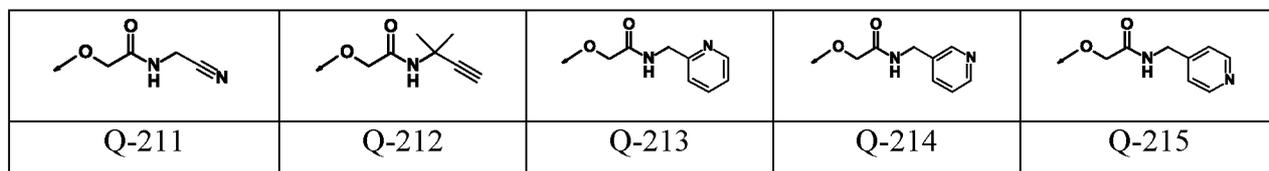
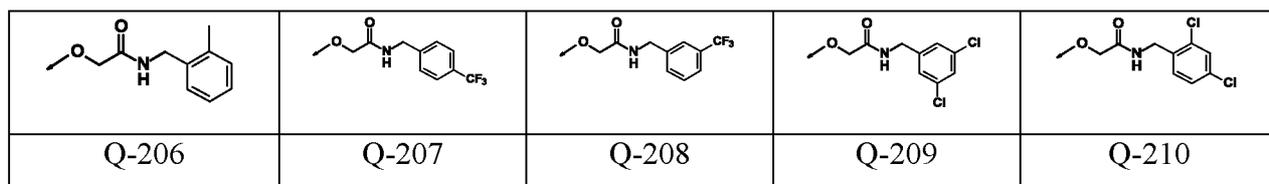


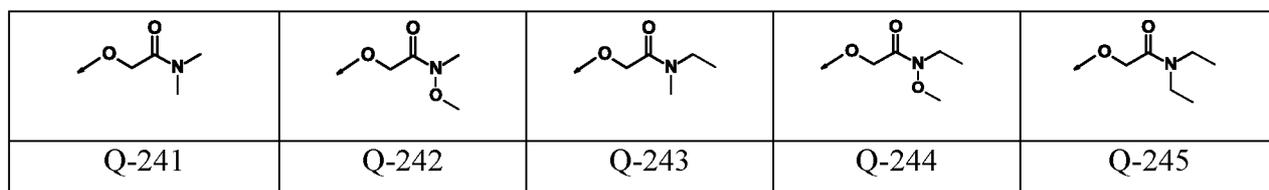
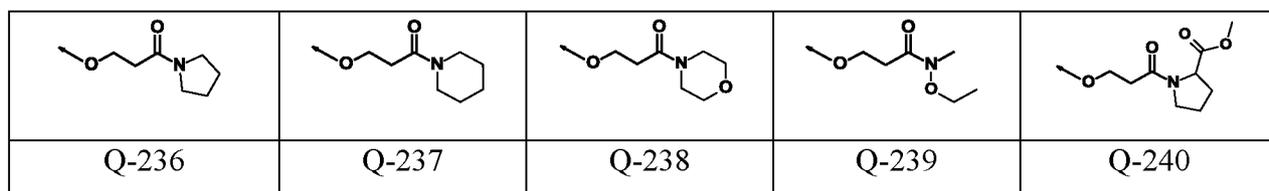
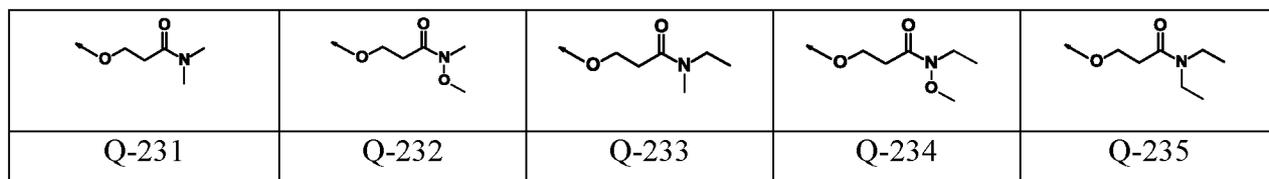
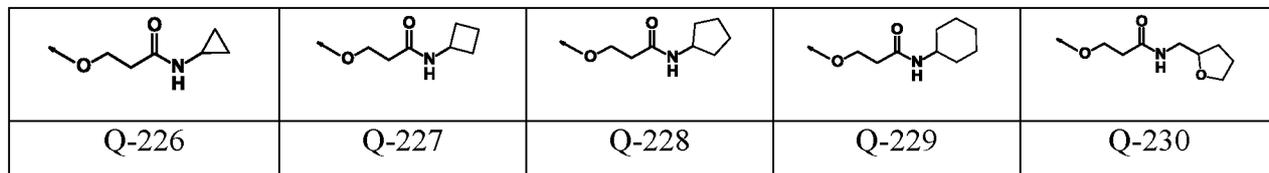
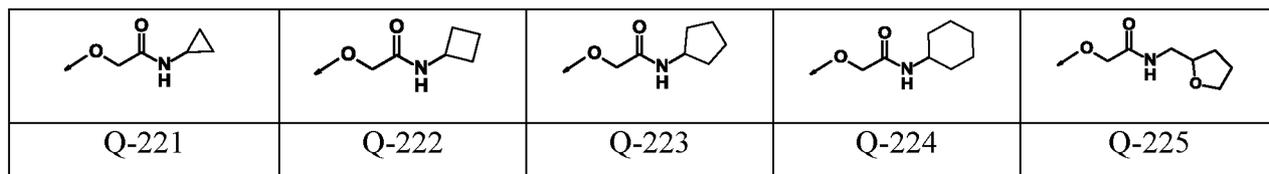
5



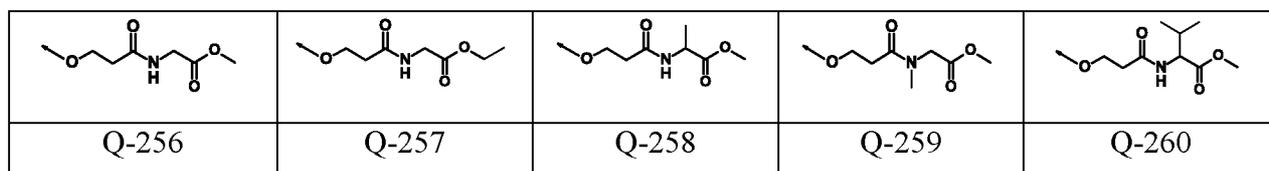
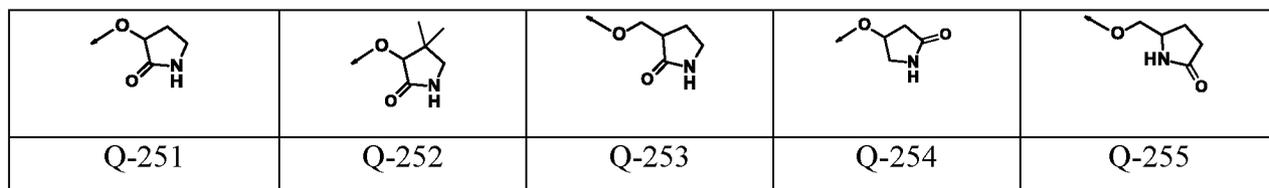
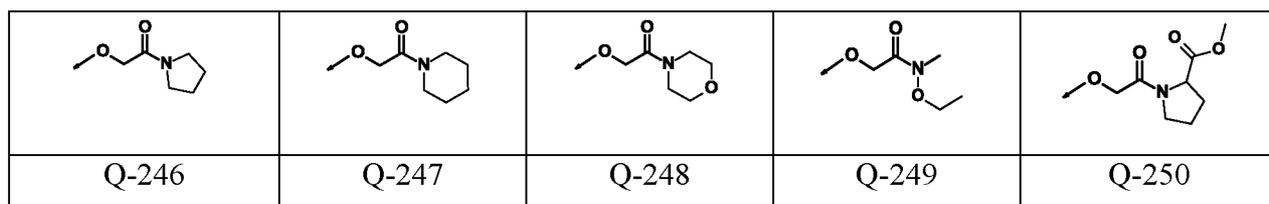


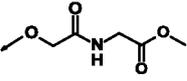
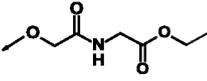
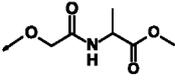
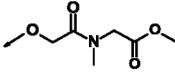
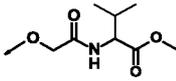
5

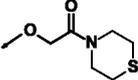
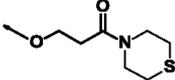
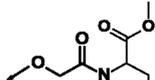
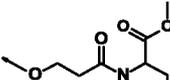
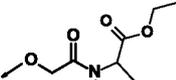


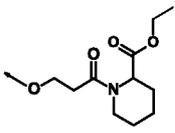
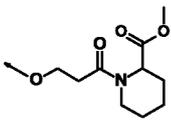
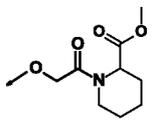
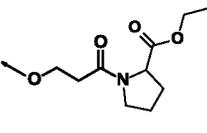
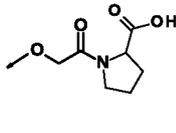


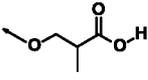
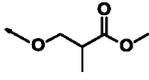
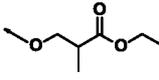
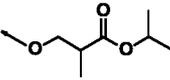
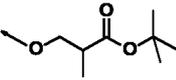
5

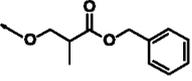
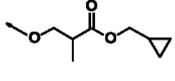
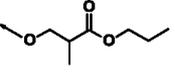
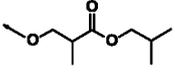
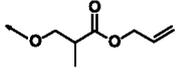


				
Q-261	Q-262	Q-263	Q-264	Q-265

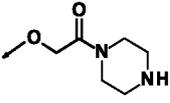
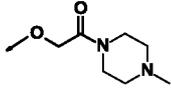
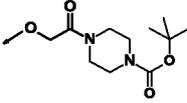
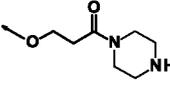
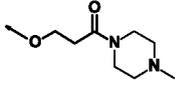
				
Q-266	Q-267	Q-268	Q-269	Q-270

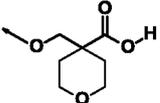
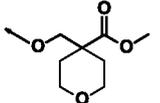
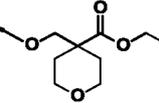
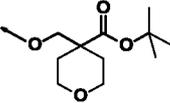
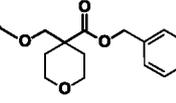
				
Q-271	Q-272	Q-273	Q-274	Q-275

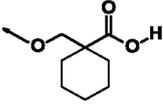
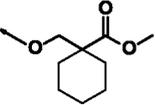
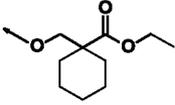
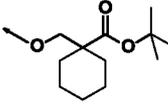
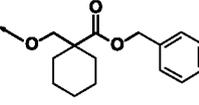
				
Q-276	Q-277	Q-278	Q-279	Q-280

				
Q-281	Q-282	Q-283	Q-284	Q-285

5

				
Q-286	Q-287	Q-288	Q-289	Q-290

				
Q-291	Q-292	Q-293	Q-294	Q-295

				
Q-296	Q-297	Q-298	Q-299	Q-300

5. Соединение общей формулы (I) по п. 1 и/или его соль, отличающееся тем, что

- 5 R^1 представляет собой метил, этил, н-пропил, 1-метилэтил, н-бутил, 1-метилпропил, 2-метилпропил, 1,1-диметилэтил, н-пентил, amino, диметиламино, диэтиламино,
- 10 R^2 представляет собой водород, метил, этил, н-пропил, изопропил,
- R^3 представляет собой водород, фтор, хлор, бром, метокси, этокси,
- R^4 представляет собой галоген, циано, $C(O)NH_2$, $C(S)NH_2$, дифторметил, трифторметил, этинил, пропин-1-ил,
- 15 R^5 и R^6 независимо представляют собой водород, фтор, метил, этил, н-пропил, 1-метилэтил, н-бутил, 1-метилпропил, 2-метилпропил, 1,1-диметилэтил, н-пентил, 1-метилбутил, 2-метилбутил, 3-метилбутил, 1,1-диметилпропил, 1,2-диметилпропил, 2,2-диметилпропил, 1-этилпропил, н-гексил, 1-метилпентил, 2-метилпентил, 3-метилпентил, 4-метилпентил, 1,1-
- 20 диметилбутил, 1,2-диметилбутил, 1,3-диметилбутил, 2,2-диметилбутил, 2,3-диметилбутил, 3,3-диметилбутил, 1-этилбутил, 2-этилбутил, 1,1,2-триметилпропил, 1,2,2-триметилпропил, 1-этил-1-метилпропил, 1-этил-2-метилпропил, циклопропил, циклобутил, циклопентил, циклогексил, циклопропилметил, циклобутилметил, циклопентилметил,
- 25 циклогексилметил, этенил, 1-пропенил, 2-пропенил, 1-метилэтенил, 1-бутенил, 2-бутенил, 3-бутенил, 1-метил-1-пропенил, 2-метил-1-пропенил, 1-метил-2-пропенил, 2-метил-2-пропенил, 1-пентенил, 2-пентенил, 3-пентенил, 4-пентенил, 1-метил-1-бутенил, 2-метил-1-бутенил, 3-метил-1-бутенил, 1-метил-2-бутенил, 2-метил-2-бутенил, 3-метил-2-бутенил, 1-
- 30 метил-3-бутенил, 2-метил-3-бутенил, 3-метил-3-бутенил, 1,1-диметил-2-

- пропенил, 1,2-диметил-1-пропенил, 1,2-диметил-2-пропенил, 1-этил-1-пропенил, 1-этил-2-пропенил, этинил, 1-пропинил,
- 2-пропинил, 1-бутинил, 2-бутинил, 3-бутинил, 1-метил-2-пропинил, 1-пентинил, 2-пентинил, 3-пентинил, 4-пентинил, 1-метил-2-бутинил, 1-метил-3-бутинил, 2-метил-3-бутинил, 3-метил-1-бутинил, 1,1-диметил-2-пропинил, 1-этил-2-пропинил, трифторметил, пентафторэтил, 1,1,2,2-тетрафторэтил, гептафторпропил,
- нонафторбутил, хлордифторметил, бромдифторметил, дихлорфторметил, йоддифторметил, бромфторметил, 1-фторэтил, 2-фторэтил, фторметил, дифторметил, 2,2-дифторэтил, 2,2,2-трифторэтил, дифтор-трет-бутил, метокси, этокси, н-пропилокси, изопрпилокси, н-бутилокси, трет-бутилокси, метоксиметил,
- этоксиметил, н-пропилоксиметил, изопрпилоксиметил, метоксиэтил, этоксиэтил, н-пропилоксиэтил, изопрпилоксиэтил, метокси-н-пропил, метоксидифторметил, этоксидифторметил, н-пропилоксидифторметил, н-бутилоксидифторметил, трифторметоксиметил, трифторметоксиэтил, трифторметокси-н-пропил, фенил, 2-фторфенил, 3-фторфенил, 4-фторфенил, 2,4-дифторфенил, 2,5-дифторфенил,
- 2,6-дифторфенил, 2,3-дифторфенил, 3,4-дифторфенил, 3,5-дифторфенил, 2,4,5-трифторфенил, 3,4,5-трифторфенил, 2-хлорфенил, 3-хлорфенил, 4-хлорфенил, 2,4-дихлорфенил, 2,5-дихлорфенил, 2,6-дихлорфенил, 2,3-дихлорфенил,
- 3,4-дихлорфенил, 3,5-дихлорфенил, 2,4,5-трихлорфенил, 3,4,5-трихлорфенил, 2,4,6-трихлорфенил, пиридин-2-ил, пиридин-3-ил, пиридин-4-ил, тиофен-2-ил, тиофен-3-ил, фуран-2-ил, тетрагидрофуран-2-ил, тетрагидрофуран-3-ил, 1-(4-метилфенил)этил, 1-(3-метилфенил)этил, 1-(2-метилфенил)этил, 1-(4-хлорфенил)этил, 1-(3-хлорфенил)этил, 1-(2-хлорфенил)этил, бензил, (4-фторфенил)метил,
- (3-фторфенил)метил, (2-фторфенил)метил, (2,4-дифторфенил)метил, (3,5-дифторфенил)метил, (2,5-дифторфенил)метил, (2,6-дифторфенил)метил, (2,4,5-трифторфенил)метил, (2,4,6-трифторфенил)метил, (4-хлорфенил)метил,

- (3-хлорфенил)метил, (2-хлорфенил)метил, (2,4-дихлорфенил)метил, (3,5-дихлорфенил)метил, (2,5-дихлорфенил)метил, (2,6-дихлорфенил)метил, (2,4,5-трихлорфенил)метил, (2,4,6-трихлорфенил)метил, метилтиометил, этилтиометил, этилтиоэтил, метилтиоэтил, н-пропилтиометил,
- 5 изопропилтиометил, трифторметилтиометил, трифторметилтиоэтил, метилкарбонилметил, этилкарбонилметил, н-пропилкарбонилметил, изопропилкарбонилметил,
- метилкарбонилэтил, гидроксикарбонил, метоксикарбонил, этоксикарбонил, н-пропилоксикарбонил, изопропилоксикарбонил, н-бутилоксикарбонил,
- 10 трет-бутилоксикарбонил, аллилоксикарбонил, бензилоксикарбонил, аминокарбонил, метиламинокарбонил, этиламинокарбонил, н-пропиламинокарбонил, изопропиламинокарбонил, диметиламинокарбонил, диэтиламинокарбонил, метил(этил)аминокарбонил, циклопропиламинокарбонил, циклобутиламинокарбонил,
- 15 циклопентиламинокарбонил, циклогексиламинокарбонил, аллиламинокарбонил, бензиламинокарбонил, трет-бутилоксикарбониламинокарбонил, гидроксикарбонилметил, метоксикарбонилметил, этоксикарбонилметил, н-пропилоксикарбонилметил, изопропилоксикарбонилметил, н-
- 20 бутилоксикарбонилметил, трет-бутилоксикарбонилметил, аллилоксикарбонилметил, бензилоксикарбонилметил, аминокарбонилметил, метиламинокарбонилметил, этиламинокарбонилметил, н-пропиламинокарбонилметил, изопропиламинокарбонилметил, диметиламинокарбонилметил,
- 25 диэтиламинокарбонилметил, метил(этил)аминокарбонилметил, циклопропиламинокарбонилметил, циклобутиламинокарбонилметил, циклопентиламинокарбонилметил, циклогексиламинокарбонилметил, аллиламинокарбонилметил,
- бензиламинокарбонилметил, 1-(гидроксикарбонил)эт-1-ил, 1-
- 30 (метоксикарбонил)эт-1-ил, 1-(этоксикарбонил)эт-1-ил, 1-(трет-бутилоксикарбонил)эт-1-ил,
- 1-(бензилоксикарбонил)эт-1-ил, 2-(гидроксикарбонил)эт-1-ил, 2-
- (метоксикарбонил)эт-1-ил, 2-(этоксикарбонил)эт-1-ил, 2-(трет-бутилоксикарбонил)эт-1-ил, 2-(бензилоксикарбонил)эт-1-ил, 1-

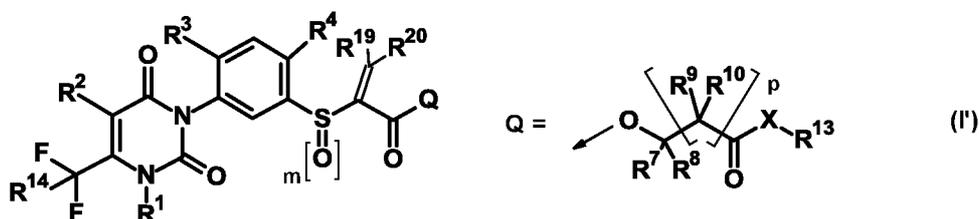
- (гидроксикарбонил)проп-1-ил, 1-(метоксикарбонил)проп-1-ил, 1-(этоксикарбонил)проп-1-ил, 1-(трет-бутилоксикарбонил)проп-1-ил, 1-(бензилоксикарбонил)проп-1-ил, 2-(гидроксикарбонил)проп-1-ил, 2-(метоксикарбонил)проп-1-ил, 2-(этоксикарбонил)проп-1-ил, 2-(трет-бутилоксикарбонил)проп-1-ил, 2-(бензилоксикарбонил)проп-1-ил, 1-(гидроксикарбонил)проп-2-ил, 1-(метоксикарбонил)проп-2-ил, 1-(этоксикарбонил)проп-2-ил, 1-(трет-бутилоксикарбонил)проп-2-ил, 1-(бензилоксикарбонил)проп-2-ил, 3-(гидроксикарбонил)проп-1-ил, 3-(метоксикарбонил)проп-1-ил, 3-(этоксикарбонил)проп-1-ил, 3-(трет-бутилоксикарбонил)проп-1-ил, 3-(бензилоксикарбонил)проп-1-ил, аминометил, 2-аминоэт-1-ил, 1-аминоэт-1-ил, 1-аминопроп-1-ил, 3-аминопроп-1-ил, метиламинометил, диметиламинометил, диэтиламинометил, этиламинометил, изопропиламинометил, циклопропиламинометил, циклобутиламинометил, циклопентиламинометил, циклогексиламинометил, метоксикарбониламинометил, этоксикарбониламинометил, трет-бутилоксикарбониламинометил, метилкарбониламинометил, этилкарбониламинометил, н-пропилкарбониламинометил, изопропилкарбониламинометил, 2-(метиламино)эт-1-ил, 2-(диэт-1-иламино)эт-1-ил, 2-(диэтиламино)эт-1-ил, 2-(этиламино)эт-1-ил, 2-(изопропиламино)эт-1-ил, 2-(циклопропиламино)эт-1-ил, 2-(циклобутиламино)эт-1-ил, 2-(циклопентиламино)эт-1-ил, 2-(циклогексиламино)эт-1-ил, 2-(метоксикарбониламино)эт-1-ил, 2-(этоксикарбониламино)эт-1-ил, 2-(трет-бутилоксикарбониламино)эт-1-ил, 2-(метилкарбониламино)эт-1-ил, 2-(этилкарбониламино)эт-1-ил, 2-(н-пропилкарбониламино)эт-1-ил, 2-(изопропилкарбониламино)эт-1-ил, 1-(метиламино)эт-1-ил, 1-(диэт-1-иламино)эт-1-ил, 1-(диэтиламино)эт-1-ил, 1-(этиламино)эт-1-ил, 1-(изопропиламино)эт-1-ил, 1-(циклопропиламино)эт-1-ил, 1-(циклобутиламино)эт-1-ил, 1-(циклопентиламино)эт-1-ил, 1-(циклогексиламино)эт-1-ил, 1-(метоксикарбониламино)эт-1-ил, 1-(этоксикарбониламино)эт-1-ил, 1-(трет-бутилоксикарбониламино)эт-1-ил, 1-(метилкарбониламино)эт-1-ил, 1-(этилкарбониламино)эт-1-ил, 1-(н-пропилкарбониламино)эт-1-ил, 1-(изопропилкарбониламино)эт-1-ил, или

R^5 и R^6 вместе с атомом углерода, с которым они связаны, образуют полностью насыщенное или частично насыщенное 3-10-членное моноциклическое или бициклическое кольцо, необязательно прерываемое гетероатомами и

5

R^5 и R^6 вместе с атомом углерода, с которым они связаны, образуют двойную связь, необязательно дополнительно замещенную R^{19} и R^{20} , в соответствии с формулой (I') ниже,

10



R^{14} представляет собой водород, фтор, хлор, бром, трифторметил, метокси, этокси, н-пропилокси, н-бутилокси,

15

m равняется 0, 1, 2,

R^{19} и R^{20} независимо представляют собой водород, фтор, хлор, бром, метил, этил, н-пропил, 1-метилэтил, н-бутил, 1-метилпропил, 2-метилпропил, 1,1-диметилэтил, н-пентил, 1-метилбутил, 2-метилбутил, 3-метилбутил, 1,1-диметилпропил, 1,2-диметилпропил, 2,2-диметилпропил, 1-этилпропил, н-гексил, циклопропил, циклобутил, циклопентил, циклогексил, трифторметил, дифторметил, пentaфторэтил, этенил, 1-пропенил, 1-метилэтенил, 1-бутенил, фенил или

20

25

R^{19} и R^{20} вместе с атомом углерода, с которым они связаны, образуют 3-10-членное моноциклическое или бициклическое кольцо, которое является насыщенным или необязательно прерываемым гетероатомами и необязательно включает дополнительное замещение,

30

и

Q представляет собой один из фрагментов Q-1 - Q-300, указанных в п. 4.

- 5 6. Применение одного или нескольких соединений общей формулы (I) и/или их солей по любому из пп. 1-5 в качестве гербицида и/или регулятора роста растений, предпочтительно в сельскохозяйственных культурах полезных растений и/или декоративных растениях.
- 10 7. Гербицидная и/или регулирующая рост растений композиция, отличающаяся тем, что композиция содержит одно или несколько соединений формулы (I) и/или их солей по любому из пп. 1-5 и/или одно или несколько дополнительных веществ, выбранных из групп (i) и/или (ii):
- 15 (i) один или несколько дополнительных активных агрохимических ингредиентов, предпочтительно выбранных из группы, состоящей из инсектицидов, акарицидов, нематоцидов, дополнительных гербицидов, фунгицидов, антидотов, удобрений и/или дополнительных регуляторов роста,
- 20 (ii) одно или несколько вспомогательных средств для составления, применяемых традиционно для защиты сельскохозяйственных культур.
- 25 8. Способ контроля вредоносных растений или регуляции роста растений, отличающийся тем, что эффективное количество
- одного или нескольких соединений формулы (I) и/или их солей по любому из пп. 1-5 или
 - композиции по п. 7
- применяют в отношении растений, семян растений, почвы, в которой или на которой растут растения, или посевной площади.