

(19)



Евразийское  
патентное  
ведомство

(11) 039486

(13) B1

## (12) ОПИСАНИЕ ИЗОБРЕТЕНИЯ К ЕВРАЗИЙСКОМУ ПАТЕНТУ

(45) Дата публикации и выдачи патента  
2022.02.01

(51) Int. Cl. C07D 413/12 (2006.01)  
A01N 43/80 (2006.01)

(21) Номер заявки  
202090015

(22) Дата подачи заявки  
2018.06.11

(54) ГЕРБИЦИДНО-АКТИВНЫЕ 3-ФЕНИЛИЗОКСАЗОЛИН-5-КАРБОКСАМИДЫ  
ТЕТРАГИДРО- И ДИГИДРОФУРАНОВЫХ КАРБОНОВЫХ КИСЛОТ И ЭФИРОВ И ИХ  
ПРИМЕНЕНИЕ

(31) 17175777.6

(32) 2017.06.13

(33) EP

(43) 2020.05.31

(86) PCT/EP2018/065333

(87) WO 2018/228985 2018.12.20

(71)(73) Заявитель и патентовладелец:  
БАЙЕР АКЦИЕНГЕЗЕЛЬШАФТ;  
БАЙЕР КРОПСАЙЕНС  
АКЦИЕНГЕЗЕЛЬШАФТ (DE)

(72) Изобретатель:

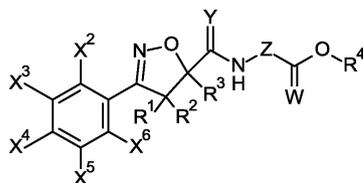
Петерс Олаф, Хааф Клаус Бернхард,  
Линдель Стевен Давид, Бояк Гидо,  
Ляв Катеринэ Розе, Мачеттира Ану  
Бемая, Дитрих Хансйорг, Гатцвайлер  
Эльмар, Розингер Кристофер Хью  
(DE)

(74) Представитель:

Беляева Е.Н. (BY)

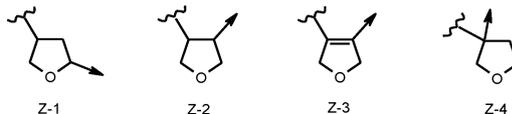
(56) WO-A1-2012130798

(57) Изобретение касается 3-фенилизоксазолин-5-карбоксамидов общей формулы (I)



(I).

и его агрохимически приемлемых солей, в которой R<sup>1</sup> и R<sup>2</sup> означают соответственно водород; R<sup>3</sup> означает (C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)алкил, (C<sub>3</sub>-C<sub>4</sub>)циклоалкил, (C<sub>2</sub>-C<sub>3</sub>)алкенил, (C<sub>2</sub>-C<sub>3</sub>)алкинил или (C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)алкокси, которые замещены соответственно m остатками, выбранными из группы, состоящей из фтора, хлора, брома, циано, (C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>)алкокси и гидроксид; R<sup>4</sup> означает водород или означает (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)алкил, (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)циклоалкил, (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)циклоалкил(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)алкил, (C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)алкенил, (C<sub>5</sub>-C<sub>6</sub>)циклоалкенил или (C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)алкинил, которые замещены соответственно m остатками, выбранными из группы, состоящей из фтора, хлора, брома, циано, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)алкокси, гидроксид и арила, причем арил означает фенил, при необходимости, замещенный 0-5 остатками, выбранными из группы, включающей фтор, хлор, бром, йод, циано, гидроксид, (C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)алкил, (C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)алкокси, (C<sub>3</sub>-C<sub>4</sub>)циклоалкил, (C<sub>2</sub>-C<sub>3</sub>)алкенил и (C<sub>2</sub>-C<sub>3</sub>)алкинил; Y означает кислот; W означает кислот; Z означает группу Z-1 - Z-4, причем Z-1 - Z-4 имеют следующее значение:

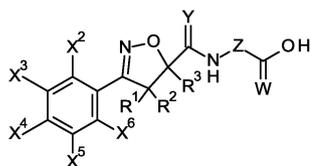


причем стрелка означает соответственно связь с группой C=W формулы (I); X<sup>2</sup>, X<sup>4</sup> и X<sup>6</sup> означают независимо друг от друга водород или фтор; X<sup>3</sup> и X<sup>5</sup> означают независимо друг от друга водород, фтор, хлор, бром, гидроксид или циано или (C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)алкил, (C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)алкокси, (C<sub>3</sub>-C<sub>4</sub>)циклоалкил, (C<sub>2</sub>-C<sub>3</sub>)алкенил или (C<sub>2</sub>-C<sub>3</sub>)алкинил, которые замещены соответственно m остатками, выбранными из группы, состоящей из фтора, хлора и брома; и m равен порядковому числу 0, 1, 2 или 3. Изобретение также касается гербицидного средства и средства, регулирующего рост растений, содержащих одно или более указанных соединений общей формулы (I) или их солей, а также способа борьбы с нежелательными растениями с применением указанного соединения или указанного гербицидного средства, применения указанного соединения или указанного гербицидного

039486 B1

039486 B1

средства для борьбы с нежелательными растениями и соединения формулы (II) и его агрохимически приемлемых солей:



в которой остатки  $X^2$ ,  $X^3$ ,  $X^4$ ,  $X^5$ ,  $X^6$ ,  $R^1$ ,  $R^2$ ,  $R^3$ ,  $Y$ ,  $Z$  и  $W$  имеют значения, как определено в п.1.

039486 B1

039486 B1

Настоящее изобретение касается технической области гербицидов, в частности гербицидов для селективной борьбы с сорными растениями и сорными травами в культурах полезных растений.

В частности, настоящее изобретение касается 3-фенилизоксазолин-5-карбоксамида общей формулы (I) согласно изобретению и его агрохимически приемлемых солей, гербицидного средства и средства, регулирующего рост растений, содержащих указанное соединение, способа борьбы с нежелательными растениями с применением указанного соединения или указанного гербицидного средства, применения указанного соединения или указанного гербицидного средства для борьбы с нежелательными растениями, и соединения формулы (II) согласно изобретению и его агрохимически приемлемых солей.

WO 1995/014681 A1, WO 1995/014680 A1, WO 2008/035315 A1, WO 2005/051931 A1 и WO 2005/021515 A1, помимо прочего, описывают соответственно 3-фенилизоксазолин-5-карбоксамиды, которые на фенильном кольце замещены в 3- и 4-позиции алкокси-остатками. WO 1998/057937 A1 описывает, помимо прочего, соединения, которые на фенильном кольце замещены в 4-позиции алкокси-остатками. WO 2006/016237 A1 описывает, помимо прочего, соединения, которые на фенильном кольце замещены в 4-позиции амидо-остатками. Описанные в ранее названных документах соединения обладают фармакологическим действием.

В WO 2005/021516 A1 раскрыты 3-((3-(3-трет-бутилфенил)-5-этил-4,5-дигидро-1,2-оксазол-5-ил)карбонил)амино)-5-фтор-4-оксопентановая кислота и 3-((3-(3-трет-бутилфенил)-5-изопропил-4,5-дигидро-1,2-оксазол-5-ил)карбонил)амино)-5-фтор-4-оксопентановая кислота в качестве фармакологически действующих соединений.

Из DE 4026018 A1, EP 0520371 A2 и DE 4017665 известны 3-фенилизоксазолин-5-карбоксамиды, которые в 5-позиции изоксазолинового кольца имеют атом водорода. Эти соединения описаны там как агрохимически действующие защитные средства, т.е. как соединения, которые устраняют нежелательное гербицидное действие гербицидов по отношению к культурным растениям. Гербицидное действие этих соединений не раскрыто. Приоритетная, ранее неопубликованная европейская патентная заявка № 10170238 обнаруживает гербицидно- и фунгицидно-активные 3-фенилизоксазолин-5-карбоксамиды и 3-фенилизоксазолин-5-тиоамиды, которые в 5-позиции изоксазолинового кольца имеют атом водорода. Из Monatshefte Chemie (2010), 141, 461 и Letters in Organic Chemistry (2010), 7, 502 также известны 3-фенилизоксазолин-5-карбоксамиды, которые в 5-позиции изоксазолинового кольца имеют атом водорода. Некоторые из этих соединений имеют фунгицидное действие, но не имеют гербицидного действия.

WO 2014/048827 описывает гербицидное действие 3-фенилизоксазолин-5-карбоновых кислот, эфиров 3-фенилизоксазолин-5-карбоновых кислот, 5-карбальдегидов и 5-нитрилов.

WO 2014/048853 описывает изоксазолин-5-карбоксамиды и -5-тиоамиды с гетероциклами в 3-позиции, которые обладают гербицидным и фунгицидным действием.

WO 2014/048940 описывает изоксазолин-карбоксамиды фунгицидного действия с хинолином в качестве особого гетероцикла в 3-позиции.

WO 2014/048882 описывает изоксазолин-карбоксамиды с алкокси в качестве особого остатка в 5-позиции.

В WO 2012/130798 описаны гербицидно- и фунгицидно-активные 3-фенилизоксазолин-5-карбоксамиды и -5-тиоамиды замещенных гетероциклов.

Гербицидное действие этих известных соединений, в частности, при низкой норме расхода или их совместимость с культурными растениями должны быть улучшены.

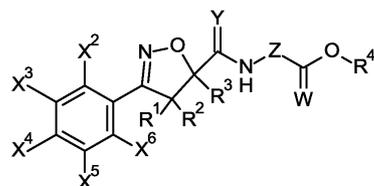
В результате названных причин существует потребность в более сильных гербицидах и/или регуляторах роста растений для селективного применения в культурах растений или для применения в области некультурных растений, причем эти действующие вещества предпочтительно должны обладать другими предпочтительными свойствами для применения, как, например, улучшенная совместимость с культурными растениями.

Поэтому предметом настоящего изобретения является получение соединений с гербицидным действием (гербицидов), которые даже при относительно низкой норме расхода являются высокоэффективными по отношению к экономически важным вредным растениям и предпочтительно при хорошей эффективности по отношению к вредным растениям должны иметь селективное применение в культурных растениях, и при этом предпочтительно они должны показывать хорошую совместимость с культурными растениями. Предпочтительно эти гербицидные соединения должны быть особенно эффективными и действенными относительно широкого спектра сорных трав, и предпочтительно дополнительно обнаруживать хорошую эффективность относительно многих сорных растений.

Кроме гербицидного действия, многочисленные соединения формулы (I) также обладают фунгицидным действием, которое, однако, проявляется лишь незначительно.

Неожиданно было обнаружено, что нижеуказанные 3-фенилизоксазолин-5-карбоксамиды тетрагидро- и дигидрофуранкарбоновых кислот и эфиров формулы (I) и их солей обнаруживают отличное гербицидное действие относительно широкого спектра экономически важных одно- и двудольных однолетних вредных растений.

Предметами настоящего изобретения являются, следовательно, 3-фенилизоксазолин-5-карбоксамида общей формулы (I)



(I)

и его агрохимически приемлемые соли,

в которой  $R^1$  и  $R^2$  означают соответственно водород;

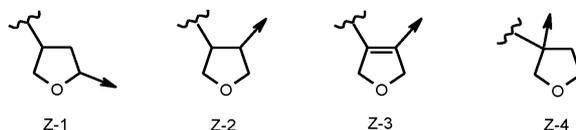
$R^3$  означает  $(C_1-C_3)$ алкил,  $(C_3-C_4)$ циклоалкил,  $(C_2-C_3)$ алкенил,  $(C_2-C_3)$ алкинил или  $(C_1-C_3)$ алкокси, которые замещены соответственно  $m$  остатками, выбранными из группы, состоящей из фтора, хлора, брома, циано,  $(C_1-C_4)$ алкокси и гидроксид;

$R^4$  означает водород или означает  $(C_1-C_6)$ алкил,  $(C_3-C_6)$ циклоалкил,  $(C_3-C_6)$ циклоалкил $(C_1-C_6)$ алкил,  $(C_2-C_6)$ алкенил,  $(C_5-C_6)$ циклоалкенил или  $(C_2-C_6)$ алкинил, которые замещены соответственно  $m$  остатками, выбранными из группы, состоящей из фтора, хлора, брома, циано,  $(C_1-C_4)$ алкокси, гидроксид и арила, причем арил означает фенил, при необходимости, замещенный 0-5 остатками, выбранными из группы, включающей фтор, хлор, бром, йод, циано, гидроксид,  $(C_1-C_3)$ алкил,  $(C_1-C_3)$ алкокси,  $(C_3-C_4)$ циклоалкил,  $(C_2-C_3)$ алкенил и  $(C_2-C_3)$ алкинил;

Y означает кислород;

W означает кислород;

Z означает группу Z-1 - Z-4, причем Z-1 - Z-4 имеют следующее значение:



причем стрелка означает соответственно связь с группой  $C=W$  формулы (I);

$X^2$ ,  $X^4$  и  $X^6$  означают независимо друг от друга водород или фтор;

$X^3$  и  $X^5$  означают независимо друг от друга водород, фтор, хлор, бром, гидроксид или циано или  $(C_1-C_3)$ алкил,  $(C_1-C_3)$ алкокси,  $(C_3-C_4)$ циклоалкил,  $(C_2-C_3)$ алкенил или  $(C_2-C_3)$ алкинил, которые замещены соответственно  $m$  остатками, выбранными из группы, состоящей из фтора, хлора и брома;

$m$  равен порядковому числу 0, 1, 2 или 3.

Алкил означает насыщенный, линейный или разветвленный углеводородный остаток соответственно с указанным количеством атомов углерода, например  $C_1-C_6$ -алкил, как метил, этил, пропил, 1-метилэтил, бутил, 1-метилпропил, 2-метилпропил, 1,1-диметилабтил, пентил, 1-метилбутил, 2-метилбутил, 3-метилбутил, 2,2-диметилпропил, 1-этилпропил, гексил, 1,1-диметилпропил, 1,2-диметилпропил, 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 и 1-этил-2-метилпропил.

Замещенный галогеном алкил означает линейные или разветвленные алкильные группы, причем в этих группах атомы водорода могут быть частично или полностью замещены атомами галогена, например  $C_1-C_2$ -галогеналкил, такой как хлорметил, бромметил, дихлорметил, трихлорметил, фторметил, дифторметил, трифторметил, хлорфторметил, дихлорфторметил, хлордифторметил, 1-хлорэтил, 1-бромэтил, 1-фторэтил, 2-фторэтил, 2,2-дифторэтил, 2,2,2-трифторэтил, 2-хлор-2-фторэтил, 2-хлор, 2-дифторэтил, 2,2-дихлор-2-фторэтил, 2,2,2-трихлорэтил, пентафторэтил и 1,1,1-трифторпроп-2-ил.

Алкенил означает ненасыщенные, линейные или разветвленные углеводородные остатки соответственно с указанным количеством атомов углерода и двойной связью в любой позиции, например  $C_2-C_6$ -алкенил, 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-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 и 1-этил-2-метил-2-пропенил.

Алкинил означает линейные или разветвленные углеводородные остатки соответственно с указанным количеством атомов углерода и тройной связью в любой позиции, например  $C_2$ - $C_6$ -алкинил, такой как этинил, 1-пропинил, 2-пропинил (или пропаргил), 1-бутинил, 2-бутинил, 3-бутинил, 1-метил-2-пропинил, 1-пентинил, 2-пентинил, 3-пентинил, 4-пентинил, 3-метил-1-бутинил, 1-метил-2-бутинил, 1-метил-3-бутинил, 2-метил-3-бутинил, 1,1-диметил-2-пропинил, 1-этил-2-пропинил, 1-гексинил, 2-гексинил, 3-гексинил, 4-гексинил, 5-гексинил, 3-метил-1-пентинил, 4-метил-1-пентинил, 1-метил-2-пентинил, 4-метил-2-пентинил, 1-метил-3-пентинил, 2-метил-3-пентинил, 1-метил-4-пентинил, 2-метил-4-пентинил, 3-метил-4-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.

Циклоалкил означает карбоциклическую, насыщенную кольцевую систему предпочтительно с 3-8 кольцевыми C-атомами, например циклопропил, циклобутил, циклопентил или циклогексил. Если, при необходимости, присутствует замещенный циклоалкил, то также содержится циклическая система с заместителями, причем также присутствуют заместители с двойной связью на циклоалкильном остатке, например такая алкилиденная группа, как метилиден.

Если присутствует, при необходимости, замещенный циклоалкил, то также содержатся многоциклические алифатические системы, как, например, бицикло[1.1.0]бутан-1-ил, бицикло[1.1.0]бутан-2-ил, бицикло[2.1.0]пентан-1-ил, бицикло[2.1.0]пентан-2-ил, бицикло[2.1.0]пентан-5-ил, бицикло[2.2.1]гепт-2-ил (норборнил), адамантан-1-ил и адамантан-2-ил.

Если также присутствует замещенный циклоалкил, то также содержится спироциклическая алифатическая система, как, 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.

Циклоалкенил означает карбоциклическую, неароматическую, частично ненасыщенную кольцевую систему, предпочтительно с 4-8 C-атомами, например 1-циклобутенил, 2-циклобутенил, 1-циклопентенил, 2-циклопентенил, 3-циклопентенил или 1-циклогексенил, 2-циклогексенил, 3-циклогексенил, 1,3-циклогексаденил или 1,4-циклогексаденил, причем также присутствуют заместители с двойной связью на циклоалкенильном остатке, например такая алкилиденная группа, как метилиден. Если, при необходимости, присутствует замещенный циклоалкенил, пояснения также относятся и к замещенному циклоалкилу.

Алкил означает насыщенный, линейный или разветвленный углеводородный остаток соответственно с указанным количеством атомов углерода, например  $C_1$ - $C_6$ -алкокси, как метокси, этокси, пропокси, 1-метилэтокси, бутокси, 1-метилпропокси, 2-метилпропокси, 1,1-диметилэтокси, пентокси, 1-метилбутокси, 2-метилбутокси, 3-метилбутокси, 2,2-диметилпропокси, 1-этилпропокси, гексокси, 1,1-диметилпропокси, 1,2-диметилпропокси, 1-метилпентокси, 2-метилпентокси, 3-метилпентокси, 4-метилпентокси, 1,1-диметилбутокси, 1,2-диметилбутокси, 1,3-диметилбутокси, 2,2-диметилбутокси, 2,3-диметилбутокси, 3,3-диметилбутокси, 1-этилбутокси, 2-этилбутокси, 1,1,2-триметилпропокси, 1,2,2-триметилпропокси, 1-этил-1-метилпропокси и 1-этил-2-метилпропокси. Замещенный галогеном алкил означает линейные или разветвленные алкокси-остатки с соответствующим указанным количеством атомов углерода, причем в этих группах атомы водорода могут быть частично или полностью замещены атомами галогена, например  $C_1$ - $C_2$ -галогеналкокси, как хлорметокси, бромметокси, дихлорметокси, трихлорметокси, фторметокси, дифторметокси, трифторметокси, хлорфторметокси, дихлорфторметокси, хлордифторметокси, 1-хлорэтокси, 1-бромэтокси, 1-фторэтокси, 2-фторэтокси, 2,2-дифторэтокси, 2,2,2-трифторэтокси, 2-хлор-2-фторэтокси, 2-хлор-1,2-дифторэтокси, 2,2-дихлор-2-фторэтокси, 2,2,2-трихлорэтокси, пентафторэтокси и 1,1,1-трифторпроп-2-окси.

Арил означает, при необходимости, замещенный 0-5 остатками из группы фтора, хлора, брома, йода, циано, гидроксид, ( $C_1$ - $C_3$ )алкила, ( $C_1$ - $C_3$ )алкокси, ( $C_3$ - $C_4$ )циклоалкила, ( $C_2$ - $C_3$ )алкенила или ( $C_2$ - $C_3$ )алкинила фенил.

Понятие "галоген" означает фтор, хлор, бром или йод. Если это понятие используют для остатка, то "галоген" означает атом фтора, хлора, брома или йода.

Соединения формулы (I) в зависимости от вида и соединения заместителей могут присутствовать в виде стереоизомеров. Например, если присутствует один или несколько асимметричных замещенных атомов углерода и/или сульфоксида, таким образом, могут возникать энантимеры и диастереомеры. Стереоизомеры могут возникать при получении смесей обычными методами разделения, например, с помощью хроматографических методов разделения. Также можно селективно получать стереоизомеры с помощью стереоселективных реакций с применением оптически активных исходных и/или вспомогательных веществ.

Настоящее изобретение может касаться также всех стереоизомеров и их смесей, которые содержатся в формуле (I), однако не имеют специфического определения. Однако далее для краткости говорят только о соединениях формулы (I), хотя они могут быть представлены как чистыми соединениями, так и, при необходимости, смесями с различными компонентами изомерных соединений.

В зависимости от вида вышеуказанных заместителей соединения формулы (I) имеют кислотные свойства и вместе с неорганическими или органическими основаниями или ионами металлов также, при

необходимости, могут образовывать внутренние соли или аддукты. Если соединения формулы (I) содержат гидроксид, карбоксид или другие группы, индуцирующие кислотные свойства, то эти соединения можно превращать основаниями в соли. Подходящими основаниями являются, например, гидроксиды, карбонаты, гидрокарбонаты щелочных и щелочноземельных металлов, в частности натрия, калия, магния и кальция, далее аммиак, первичные, вторичные и третичные амины с (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)алкильными группами, моно-, ди- и триалканоламины (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)алканолов, холин, а также хлорхолин, а также органические амины, как триалкиламины, морфолин, пиперидин или пиридин. Эти соли являются соединениями, в которых кислотный водород замещен подходящим для сельского хозяйства катионом, например солями металлов, в частности солями щелочных металлов или солями щелочноземельных металлов, в частности солями натрия и калия, или также солями аммония, солями с органическими аминами или четвертичными солями аммония, например с катионами формулы  $[NRR'R''R''']^+$ , где R'-R''' соответственно независимо друг от друга представляют собой органический остаток, в частности алкил, арил, арилалкил или алкиларил. Также принимают во внимание соли алкилсульфония и алкилсульфоксония, как соли (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)триалкилсульфония и (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)триалкилсульфоксония.

Соединения формулы (I) во время присоединения подходящих неорганических или органических кислот, как, например, минеральных кислот, как, например, HCl, HBr, H<sub>2</sub>SO<sub>4</sub>, H<sub>3</sub>PO<sub>4</sub> или HNO<sub>3</sub>, или органических кислот, например карбоновых кислот, как муравьиная кислота, уксусная кислота, пропионовая кислота, щавелевая кислота, молочная или салициловая кислота или сульфокислоты, как, например, β-толуолсульфокислота, к щелочной группе, как, например, амина, алкиламина, диалкиламина, пиперидино, морфолино или пиридино, могут образовывать соли. Эти соли содержат сопряженное основание кислоты в качестве аниона.

Подходящие заместители, которые присутствуют в депротонированном виде, как, например, сульфокислоты или карбоновые кислоты, могут образовывать внутренние соли с протонируемыми со своей стороны группами, такими как аминокгруппы.

Если группа несколько раз замещена остатками, то это означает, что эта группа замещена одним или более одинаковыми или различными упомянутыми остатками.

Во всех ниженазванных формулах заместители и символы, если не указано другого, имеют такое же значение, как в формуле (I). Стрелки в химической формуле означают места присоединений к остаточной молекуле.

Далее, соответственно для отдельных заместителей описаны предпочтительные, особенно предпочтительные и весьма предпочтительные значения. Остальные заместители общей формулы (I), которые не названы ниже, имеют вышеуказанные значения.

В рамках данного изобретения возможно комбинирование отдельных предпочтительных, особенно предпочтительных и наиболее предпочтительных значений для заместителей R<sup>1</sup>-R<sup>4</sup>, X<sup>2</sup>-X<sup>6</sup>, W, Y и Z, а также порядкового числа m любым способом друг с другом.

Это значит, что в настоящем изобретении представлены соединения общей формулы (I), в которых, например, заместитель R<sup>1</sup> имеет предпочтительное значение и заместители R<sup>2</sup>-R<sup>4</sup> имеют общие значения или заместитель R<sup>2</sup> имеет предпочтительное значение, заместитель R<sup>3</sup> имеет особенно предпочтительное значение или весьма предпочтительное значение и остальные заместители имеют общее значение.

Далее в виде таблицы представлены примеры соединений общей формулы (I). В следующей табл. 1 по отдельности указаны определенные в формуле (I) заместители.

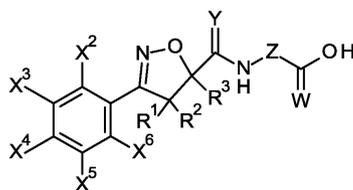
Таблица 1

Соединения общей формулы (I), где  $X^2=X^4=X^6=R^1=R^2=H$  и означает  $Y=W=O$ 

Пример №	$X^3$	$X^5$	$R^3$	$R^4$	Z	Примечание
I - 1	F	F	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	Z-1	Z-1 с конфигурацией 2,4-цис
I - 2	Cl	Cl	OCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	Z-1	Z-1 с конфигурацией 2,4-цис
I - 3	Cl	Cl	CH=CH <sub>2</sub>	CH <sub>3</sub>	Z-1	Z-1 с конфигурацией 2,4-цис
I - 4	Br	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	Z-1	Z-1 с конфигурацией 2,4-цис
I - 5	F	F	OCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	Z-1	Z-1 с конфигурацией 2,4-цис
I - 6	F	F	CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	Z-1	Z-1 с конфигурацией 2,4-цис
I - 7	F	H	CH=CH <sub>2</sub>	CH <sub>3</sub>	Z-1	Z-1 с конфигурацией 2,4-цис
I - 8	Br	CH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	Z-1	Z-1 с конфигурацией 2,4-цис
I - 9	F	F	(R) - CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	Z-1	Z-1 с конфигурацией 2,4-цис
I - 10	F	F	(S) - CH=CH <sub>2</sub>	CH <sub>3</sub>	Z-1	Z-1 с конфигурацией 2,4-цис; 2 Диастереоизомера
I - 11	F	F	(S) - CH=CH <sub>2</sub>	CH <sub>3</sub>	Z-1	Z-1 с конфигурацией 2,4-цис; Диастереоизомер 1 из I-10 (единственный энантиомер)
I - 12	F	F	(S) - CH=CH <sub>2</sub>	CH <sub>3</sub>	Z-1	Z-1 с конфигурацией 2,4-цис; Диастереоизомер 2 из I-10 (единственный энантиомер)
I - 13	F	H	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	Z-1	Z-1 с конфигурацией 2,4-цис
I - 14	H	H	OCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	Z-1	Z-1 с конфигурацией 2,4-цис
I - 15	F	F	(R) - CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	Z-1	Z-1 с конфигурацией 2,4-цис; Диастереоизомер 1 (единственный энантиомер)
I - 16	F	F	(R) - CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	Z-1	Z-1 с конфигурацией 2,4-цис; Диастереоизомер 2 (единственный энантиомер)
I - 17	F	F	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	Z-4	
I - 18	F	F	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	Z-4	
I - 19	F	F	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	Z-2	
I - 20	F	H	CH <sub>3</sub>	H	Z-1	Z-1 с конфигурацией 2,4-цис
I - 21	F	F	CH=CH <sub>2</sub>	H	Z-1	Z-1 с конфигурацией 2,4-цис
I - 22	F	F	(R) - CH=CH <sub>2</sub>	CH <sub>3</sub>	Z-1	Z-1 с конфигурацией 2,4-цис
I - 23	F	F	CH=CH <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	Z-3	
I - 24	F	F	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	Z-3	
I - 25	F	F	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	Z-3	
I - 26	F	F	(S) - CH=CH <sub>2</sub>	CH <sub>3</sub>	Z-2	
I - 27	F	F	OCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	Z-2	
I - 28	F	F	(R) - CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	Z-2	
I - 29	Cl	Cl	OCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	Z-2	
I - 30	F	H	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	Z-1	Z-1 с конфигурацией 2,4-цис
I - 31	F	F	(S) - CH=CH <sub>2</sub>	H	Z-1	Z-1 с конфигурацией 2,4-цис
I - 32	F	H	CH <sub>3</sub>	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	Z-1	Z-1 с конфигурацией 2,4-цис
I - 33	F	H	CH <sub>3</sub>	C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	Z-1	Z-1 с конфигурацией 2,4-цис
I - 34	F	H	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> Ph	Z-1	Z-1 с конфигурацией 2,4-цис
I - 35	F	F	(S) - CH=CH <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	Z-1	Z-1 с конфигурацией 2,4-цис
I - 36	F	F	(S) - CH=CH <sub>2</sub>	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	Z-1	Z-1 с конфигурацией 2,4-цис
I - 37	F	F	(S) - CH=CH <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub> Ph	Z-1	Z-1 с конфигурацией 2,4-цис

I - 38	F	F	(S) - CH=CH <sub>2</sub>	C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	Z-1	Z-1 с конфигурацией 2,4-цис
I - 39	F	H	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	Z-13	(4S)-4-амино-4,5-дигидрофуран-2-карбоксилат
I - 40	F	H	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	Z-8	(2S,4S)-4-амино-тетрагидрофуран-2-карбоксилат
I - 41	F	F	(R) - CH <sub>3</sub>	H	Z-1	Z-1 с конфигурацией 2,4-цис
I - 42	F	F	(R) - CH <sub>3</sub>	C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	Z-1	Z-1 с конфигурацией 2,4-цис
I - 43	F	F	(R) - CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	Z-1	Z-1 с конфигурацией 2,4-цис
I - 44	F	F	(R) - CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> (CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	Z-1	Z-1 с конфигурацией 2,4-цис
I - 45	F	F	(R) - CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> Ph	Z-1	Z-1 с конфигурацией 2,4-цис
I - 46	F	H	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	Z-13	(4R)-4-амино-4,5-дигидрофуран-2-карбоксилат
I - 47	F	H	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	Z-8	(2R,4R)-4-амино-тетрагидрофуран-2-карбоксилат
I - 48	F	F	(R) - CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	Z-1	Z-1 с конфигурацией 2,4-цис
I - 49	F	F	(R) - CF <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	Z-1	Z-1 с конфигурацией 2,4-цис
I - 50	F	F	(R) - CF <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	H	Z-1	Z-1 с конфигурацией 2,4-цис
I - 51	F	F	(R) - CF <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	Z-1	Z-1 с конфигурацией 2,4-цис
I - 52	F	F	(S) - CH=CH <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub> (3-F-Ph)	Z-1	Z-1 с конфигурацией 2,4-цис
I - 53	F	F	(R) - CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> (3-F-Ph)	Z-1	Z-1 с конфигурацией 2,4-цис
I - 54	F	F	(S) - CH=CH <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub> (4-OMe-Ph)	Z-1	Z-1 с конфигурацией 2,4-цис
I - 55	F	F	(R) - CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	Z-1	Z-1 с конфигурацией 2,4-trans
I - 56	F	F	(S) - CH=CH <sub>2</sub>	CH <sub>3</sub>	Z-1	Z-1 с конфигурацией 2,4-trans

Настоящее изобретения касается также соединения формулы (II) и его агрохимически приемлемых солей:

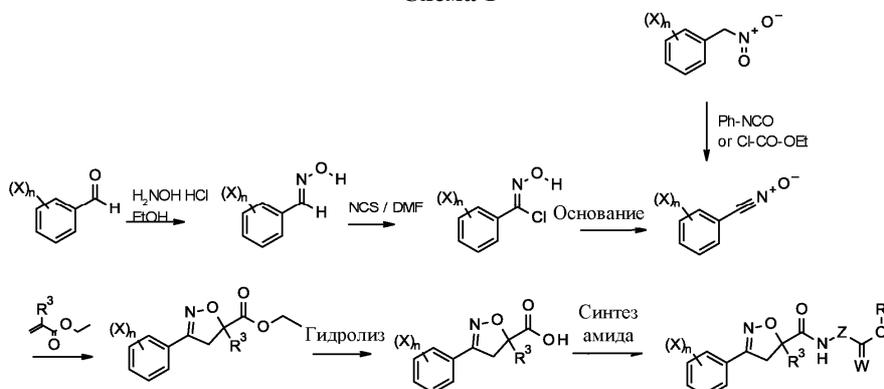


(II),

в которой остатки X<sup>2</sup>, X<sup>3</sup>, X<sup>4</sup>, X<sup>5</sup>, X<sup>6</sup>, R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup>, R<sup>3</sup>, Y, Z и W имеют значения, как определено выше.

Соединения согласно изобретению могут быть получены различными способами, которые представлены ниже в виде примеров.

### Схема 1

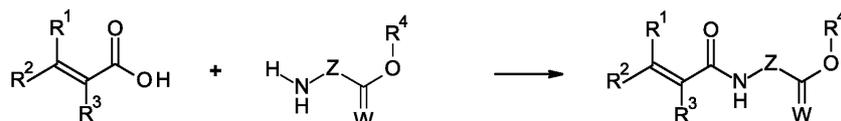


На схеме 1 и последующих схемах (X)<sub>n</sub> означает заместители X<sup>2</sup>, X<sup>3</sup>, X<sup>4</sup>, X<sup>5</sup> и X<sup>6</sup>. Такие 1,3-дипольные циклоприсоединения нитрилоксидов с подходящими диполярофилами описаны, например, в обзоре: 1,3 dipolar Cycloaddition Chemistry, Padwa, ed. Wiley, Нью-Йорк, 1984; Kanemasa and Tsuge, Heterocycles 1990, 30, 719. Для представления хлороксимов см. Kim, Jae N., Ryu, Eung K. J. Org. Chem. 1992, 57, 6649).

Соединения согласно изобретению, которые замещены в 4- и 5-позиции изоксазолин-кольцевой системы, также можно получать с помощью 1,3-дипольного циклоприсоединения, в котором подходящие 1,2-дизамещенные олефины применяют в качестве диполярофилов. Во время этой реакции чаще всего образуются смеси диастереоизомеров, которые можно разделять с помощью колоночной хроматографии. Оптически активные изоксазолины могут быть получены с помощью хиральной ВЭЖХ предварительных или последних этапов, также с помощью энантиоселективных реакций, как, например, энзиматического эфирного или амидного отщепления, или применением хиральных вспомогательных реагентов на диполярофилах, как описывает Olssen (J. Org. Chem. 1988, 53, 2468).

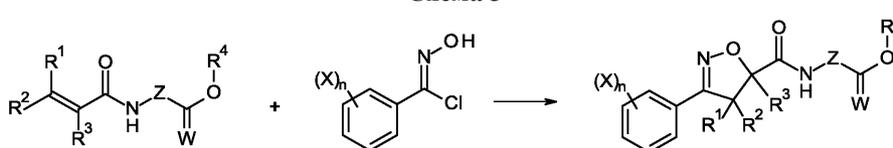
Для получения соединений согласно изобретению также можно применять замещенные амиды 2-алкоксиактиловой кислоты (схема 3). Описанные на схеме 2 эфиры акриловых кислот получают после гидролиза и образования амидов.

Схема 2



При этом для активации акриловых кислот предлагаются карбодиимиды, как, например, EDCI (Chen, F.M.F.; Benoiton, N.L. *Synthesis*, 1979, 709). Получение амидов акриловых кислот см. в US 2521902, JP 60112746, *J. of Polymer Science* 1979, 17(6), 1655. Подходящие замещенные амиды акриловых кислот могут быть получены во время 1,3-циклоприсоединения с нитрилоксидами к соединениям согласно изобретению (схема 3).

Схема 3



Превращения функциональных групп  $R^3$  возможны как на этапе алкенов, так и на этапе изоксазолинов.

Собрание из соединений формулы (I) и/или их солей, которые могут быть синтезированы в результате вышеназванных реакций, также могут быть получены сравнительным способом, причем это можно производить вручную, частично автоматическим или полностью автоматизированным способом. При этом, например, возможно провести автоматизацию проведения реакции, переработку или очистку продукта или промежуточных продуктов. Подобный способ описан, например, в D. Tiesbes in *Combinatorial Chemistry - Synthesis, Analysis, Screening* (Herausgeber Günther Jung), Verlag Wiley 1999, стр. 1-34.

Соединения согласно изобретению формулы (I) (и/или их соли), названные далее как "соединения согласно изобретению", обладают отличным гербицидным действием против широкого спектра экономически важных одно- и двудольных однолетних вредных растений.

Поэтому предметом настоящего изобретения является гербицидное средство, которое содержит одно или более соединений общей формулы (I) или их солей согласно изобретению. В предпочтительном варианте выполнения указанное гербицидное средство дополнительно содержит вспомогательное средство для препаративных форм.

В предпочтительном варианте выполнения указанное гербицидное средство содержит по меньшей мере одно дополнительное биологически активное вещество из группы инсектицидов, акарицидов, гербицидов, фунгицидов, защитных средств и/или регуляторов роста растений.

Предпочтительно указанное гербицидное средство содержит защитное средство.

Предпочтительно настоящее изобретения касается гербицидного средства, где защитное средство выбрано из группы, состоящей из мифенпир-диэтила, дипросульфамида, изоксадифен-этила, клоквинто-сет-мексила, беноксакора и дихлормида.

Также настоящее изобретение касается средства, регулирующего рост растений, содержащего одно или более соединений общей формулы (I) или их солей согласно изобретению.

Предметом настоящего изобретения также является способ борьбы с нежелательными растениями, в котором эффективное количество по меньшей мере одного соединения формулы (I) согласно изобретению или одного гербицидного средства согласно изобретению наносят на нежелательные растения или на место произрастания нежелательных растений. При этом соединения согласно изобретению можно вносить, например, в предпосевной (при необходимости также при внесении удобрений в почву), предвсходовый и/или послевсходовый период. В частности, в качестве примеров должны быть названы представители одно- и двудольных сорных растений, которые можно контролировать с помощью соединений согласно изобретению, однако изобретение не должно ограничиваться этими названиями.

Однодольные вредные растения видов:

Aegilops (эгилопс), Agropyron (пырей), Agrostis (полевица), Alopecurus (лисохвост), Apera (метлица), Avena (овес), Brachiaria (брахиария), Bromus (костер), Cenchrus (ценхрус), Commelina (коммелина), Cyperus (сыть), Dactyloctenium (дактилоктениум), Digitaria (росичка), Echinochloa (ежовник), Eleocharis (болотница), Eleusine (дагусса), Eragrostis (полевичка), Eriochloa (шерстяк), Festuca (овсяница), Fimbristylis (фимбристилис), Heteranthera (гетерантера), Imperata (императа), Ischaemum (бородач), Leptochloa (лептохлоа), Lolium (плевел), Monochoria (монохория), Panicum (просо), Paspalum (паспалум), Phalaris (канареечник), Phleum (аржанец), Poa (мятлик), Rottboellia (ротбеллия), Sagittaria (стрелолист), Scirpus (камыш), Setaria (щетинник), Sorghum (сорго).

Двудольные сорные растения видов:

Abutilon (канатник), Amaranthus (амарант), Ambrosia (амброзия), Anoda (анода), Anthemis (пупавка), Aphanes (манжетка), Artemisia (полынь), Atriplex (лебеда), Bellis (маргаритка), Bidens (череда), Capsella (пастушья сумка), Carduus (чертополох), Cassia (кассия), Centaurea (василек), Chenopodium (марь), Cirsium (бодяк), Convolvulus (вьюнок), Datura (дурман), Desmodium (телеграфное растение), Emex (эмекс), Erysimum (желтушник), Euphorbia (молочай), Galeopsis (пикульник), Galinsoga (галинсога), Galium (подмаренник), Hibiscus (бамия), Ipomoea (ипомея), Kochia (кохия), Lamium (ясотка), Lepidium (клоповник), Lindernia, Matricaria (ромашка), Mentha (мята), Mercurialis (пролесник), Mullugo (моллюго), Myosotis (незабудка), Papaver (мак), Pharbitis (фарбитис), Plantago (подорожник), Polygonum (горец), Portulaca (портулак), Ranunculus (лютик), Raphanus (редька), Rogipra (жерушник), Rotala (ротала), Rumex (щавель), Salsola (солянка), Senecio (крестовник), Sesbania (сесбания), Sida (сида), Sinapis (сесбания), Solanum (паслен), Sonchus (осот), Sphenoclea (сфеноклея), Stellaria (звездчатка), Taraxacum (одуванчик), Thlaspi (ярутка), Trifolium (клевер), Urtica (крапива), Veronica (вероника), Viola (фиалка), Xanthium (дурнишник).

Если соединения согласно изобретению наносят на поверхность земли перед прорастанием ростков, то рост ростков сорняков полностью прекращается или сорняки растут до стадии семядоли, однако затем их рост прекращается.

При нанесении действующих веществ на зеленые части растений при послевсходовом применении после обработки наступает прекращение роста, и вредные растения на той стадии роста, на которой они находились в момент применения, полностью погибают через определенный промежуток времени, таким образом, очень рано и на продолжительный период устраняют конкуренцию в виде вредных сорных растений.

Соединения согласно изобретению в культурах полезных растений могут обладать селективностью и также могут быть использованы в качестве неселективных гербицидов.

Благодаря их гербицидным качествам и свойствам, регулирующим рост, действующие вещества также могут быть использованы для борьбы с вредными растениями в культурах известных или новых растений, измененных с помощью геной инженерии или обычного мутагенеза. Трансгенные растения отличаются, как правило, особенно предпочтительными свойствами, например своей резистентностью к определенным применяемым в перерабатывающей сельскохозяйственной продукции промышленностью действующим веществам, прежде всего, к определенным гербицидам, резистентностью к болезням растений или их возбудителям, таким как определенные насекомые или микроорганизмы, таким как грибы, бактерии или вирусы. Другие особые свойства, как правило, касаются собранного урожая, относительно количества, качества, стабильности при хранении, состава и особых компонентов. Так, известны трансгенные растения с повышенным содержанием крахмала или измененным свойством крахмала или растения с другим составом кислоты жирного ряда в собранном урожае. Другими особыми свойствами являются толерантность или устойчивость по отношению к абиотическим стрессовым факторам, как, например,

жаре, холоду, засухе, повышенному содержанию солей и ультрафиолетовому излучению.

Предпочтительным является применение соединений формулы (I) согласно изобретению или их солей в определенных экономических трансгенных культурах полезных и декоративных растений,

Могут быть использованы соединения формулы (I) в качестве гербицидов в полезных технических культурах, которые являются устойчивыми к фитотоксичному действию гербицидов или стали устойчивыми благодаря методам геной инженерии.

Обычными способами получения новых растений, которые по сравнению с ранее имеющимися растениями обнаруживают новые измененные качества, являются, например, классические методы выращивания и создание мутированных растений. Альтернативно, можно получать новые растения с измененными свойствами, используя методы геной инженерии (см., например, EP 0221044, EP 0131624). Описаны, например, во многих случаях: гентехнические изменения культурных растений, вызванные изменением синтезированного в растениях крахмала (например, WO 92/011376 A, WO 92/014827 A, WO 91/019806 A); трансгенные культурные растения, которые являются устойчивыми к определенным гербицидам типа глюфосината (см., например, EP 0242236 A, EP 0242246 A) или глифосата (WO 92/000377 A) или сульфонилмочевины (EP 257993 A, US 5013659) или к комбинациям или смесям этих гербицидов благодаря "пакетированию генов", как трансгенные культурные растения, например кукуруза или соя под торговым названием Optimum™ GAT™ (толерантность к ALS глифосату):

трансгенные культурные растения, например хлопок, который может производить *Vacillus thuringiensis*-токсины (Bt-токсины), которые делают растения устойчивыми к определенными вредителям (EP 0142924 A, EP 0193259 A);

трансгенные культурные растения с измененным составом жирных кислот (WO 91/013972 A);

генетически модифицированные культурные растения с новыми составными или вторичными веществами, например новыми фитоалексинами, которые вызывают повышенную устойчивость к болезням (EP 309862 A, EP 464461 A);

генетически модифицированные растения с уменьшенной фотореспирацией, которые обладают высокой урожайностью и повышенной толерантностью к стрессовым факторам (EP 0305398 A);

трансгенные культурные растения, которые производят фармацевтически или диагностически важные протеины ("молекулярный фарминг");

трансгенные культурные растения, которые отличаются высокой урожайностью или улучшенным качеством;

трансгенные культурные растения, которые отличаются, например, комбинациями новых свойств ("пакетирование генов").

Специалисту известно множество молекулярно-биологических технологий, с помощью которых могут быть получены новые трансгенные растения с измененными свойствами; см., например, I. Potrykus и G. Spangenberg (изд.) *Gene Transfer to Plants*, Springer Lab Manual (1995), Springer Verlag Berlin, Heidelberg, oder Christou, "Trends in Plant Science", 1 (1996), 423-431).

Для генноинженерных манипуляций такого рода молекулы нуклеиновых кислот могут доставляться в плазмиды, которые позволяют мутагенез или внесение изменений в нуклеотидную ДНК-последовательность. С помощью стандартных технологий может проводиться, например, катионный обмен, могут удаляться частичные последовательности или добавляться природные или синтетические последовательности. Для соединения ДНК-фрагментов друг с другом к фрагментам могут прикрепляться адаптеры или линкеры, см., например, Sambrook et al., 1989, *Molecular Cloning, A Laboratory Manual*, 2-е изд. Cold Spring Harbor Laboratory Press, Cold Spring Harbor, NY; или Winnacker "Gene und Klone", VCH Weinheim 2-е изд. 1996.

Создание клеток растений со сниженной активностью генного продукта может, например, быть достигнуто экспрессией по меньшей мере одного соответствующего антисмыслового РНК, одного смыслового РНК для извлечения РНК-интерференции или экспрессией, по меньшей мере, соответствующей созданной рибосомы, специфическим транскриптом вышеназванного генного продукта. Кроме того, могут использоваться молекулы ДНК, которые охватывают общую кодированную последовательность генного продукта, включая возможные имеющиеся фланкирующие последовательности, а также и молекулы ДНК, которые охватывают только часть кодированной последовательности, причем эта часть должна быть достаточно длинной, чтобы вызвать в клетках антисмысловый эффект. Возможно также применение ДНК-последовательностей, которые указывают высокую степень гомологии кодированных последовательностей, но не полностью идентичны.

При экспрессии молекул нуклеиновых кислот в растениях синтетический протеин может локализоваться в любом отделении растительной клетки. Но, чтобы достигнуть локализации в определенном отделении, кодированная область может, например, связываться с ДНК-последовательностями, которые обеспечивают локализацию в одном определенном отделении. Такие последовательности известны специалисту (см., например, Braun et al., EMBO J. 11 (1992), 3219-3227; Wolter et al., Proc. Natl. Acad. Sci. USA, 85 (1988), 846-850; Sonnwald et al., Plant J. 1 (1991), 95-106). Экспрессия молекул нуклеиновых кислот также может происходить в органеллах растительных клеток.

Трансгенные растительные клетки могут регенерироваться известными способами в целые расте-

ния. В случае трансгенных растений речь может идти принципиально о растениях любых видов, т.е. как об однодольных, так и о двудольных. Так, трансгенные растения, имеющиеся в продаже, могут иметь измененные свойства благодаря повышенной экспрессии, подавлению или ингибированию гомологичных (= природных) генов или генной последовательности или экспрессии гетерологичных (= чужеродных) генов или последовательности генов.

Преимущественно в трансгенных культурах могут применяться соединения согласно изобретению, которые устойчивы к ростовым веществам, как, например, 2,4 D, дикамба, или к гербицидам, которые сдерживают существенные растительные энзимы, как, например, ацетолактат синтаза (ALS), EPSP синтаза, глутамин синтаза (ГС) или гидроксифенилпируват диоксигеназа (ГФПДГ), или к гербицидам из группы сульфонилмочевины, глифосата, глюфосината или бензоиллоксазола и аналогичным активным действующим веществам. или к любым комбинациям этих действующих веществ.

Особенно предпочтительно могут быть использованы соединения согласно изобретению в трансгенных культурных растениях, которые являются резистентными к комбинации глифосатов и глюфосинатов, глифосатов и сульфонилмочевины или имидазолинонов. Весьма предпочтительно могут быть использованы соединения согласно изобретению в трансгенных культурных растениях, как, например, кукуруза или соя с торговым названием или обозначением Optimum™ GAT™ (толерантность к глифосату ALS).

При применении согласно изобретению активных действующих веществ в трансгенных культурах рядом с наблюдаемыми результатами по отношению к вредным растениям в других культурах часто возникают результаты, которые специфичны для данных трансгенных культур, например измененный или специально расширенный спектр сорняков, которые могут подавляться, измененное расходуемое количество, которое может быть использовано для применения, предпочтительно хорошая сочетаемость с гербицидами, к которым трансгенные культуры устойчивы, а также влияние на рост и урожай трансгенных культур.

Поэтому предметом изобретения также является применение соединений формулы (I) согласно изобретению или гербицидного средства согласно изобретению для борьбы с нежелательными растениями.

В предпочтительном варианте выполнения изобретения соединения формулы (I) применяют для борьбы с нежелательными растениями в культурах полезных растений.

Предпочтительно полезные растения представляют собой трансгенные полезные растения.

Соединения согласно изобретению могут быть использованы в форме порошка для впрыскивания, эмульгируемых концентратов, растворов для опрыскивания, средств для распыления или гранулятов в виде общепринятых препаратов.

Соединения согласно изобретению могут быть сформулированы различными способами, в зависимости от того, какие биологические и/или химико-физические параметры заданы. Например, принимают в расчет следующие варианты препаративных форм: порошки для опрыскивания (WP), водорастворимые порошки (SP Штуттгарт), водорастворимые концентраты, концентраты, образующие эмульсии (EC), эмульсии (EW), как эмульсии типа "масло в воде" и "вода в масле", растворы для опрыскивания, концентраты суспензий (SC), диспергирование в масляной или водной фазе, растворы масляных эмульсий, капсульные суспензии (CS), средство для распыления (DP), протравители, грануляты для рассыпания и обработки почвы, грануляты (GR) в форме микрогранул, грануляты для рассеивания, грануляты в оболочке и грануляты для абсорбции, водно-диспергируемые грануляты (WG), водорастворимые грануляты (SG), препаративные формы сверхмалого объема (ULV), микрокапсулы и воски. Эти отдельные типы препаративных форм, в принципе, являются известными специалисту и описаны, например, в Winnacker-Küchler, "Chemische Technologie", т. 7, издательство C. Hanser Verlag Мюнхен, 4-е изд. 1986, Wade van Valkenburg, "Pesticide Formulations", Marcel Dekker, N.Y., 1973, K. Martens, "Spray Drying", Handbook, 3-е изд. 1979, G. Goodwin Ltd. Лондон.

Эти отдельные типы вспомогательных средств для препаративных форм, как инертные вещества, ПАВы, растворители и другие добавки, также являются известными и описаны, например, в Watkins, "Handbook of Insecticide Dust Diluents and Carriers", 2-е Изд., Darland Books, Caldwell N.J., H.V. Olphen, "Introduction to Clay Colloid Chemistry", 2-е изд., J. Wiley & Sons, N.Y., C Marsden, "Solvents Guide", 2-е изд., Interscience, N.Y. 1963, McCutcheon's "Detergents and Emulsifiers Annual", MC Publ. Corp., Ridgewood N.J., Sisley and Wood, "Enumuiopedia of Surface Active Agents", Chem. Publ. Co. Inc., N.Y. 1964, Schönfeldt, "Grenzflächenaktive Äthylenoxid-addukte", Wiss. Verlagsgesell, Штутгарт 1976, Winnacker-Küchler, "Chemische Technologie", т. 7, издательство C. Hanser Verlag Мюнхен, 4-е изд. 1986.

На основе этих препаративных форм также могут быть получены комбинации с другими действующими веществами, как, например, инсектицидами, акарицидами, гербицидами, фунгицидами, а также с защитными средствами, удобрениями и/или регуляторами роста, например, в виде готовых препаративных форм или в виде смешивания в емкости.

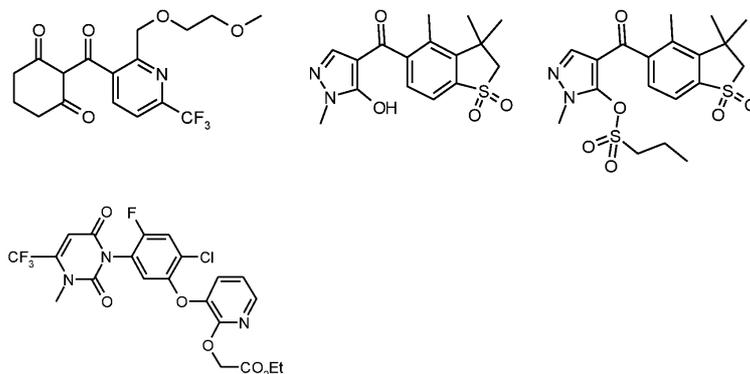
В качестве комбинирующих партнеров для соединений согласно изобретению в смешанных препаративных формах или при смешивании в емкости применяют, например, известные действующие вещества, которые основываются, например, на ингибировании, например, фермента ацетолактатсинтазы,

энзима ацетил-СоА-карбоксилазы, целлюлозосинтазы, энолпируват шикимат-3-фосфат-синтазы, глутамин-синтазы, р-гидроксифенилпируват-диоксигеназы, фитоген-десатуразы, фотосистемы I, фотосистемы II, протопорфириноген-оксидазы, как описано, например, в Weed Research, 26 (1986), 441-445 или "The Pesticide Manual", 15-е изд., The British Crop Protection Council and the Royal Soc. of Chemistry, 2006 и упомянутой там литературе. Далее в качестве примеров названы известные гербициды или регуляторы роста растений, которые можно комбинировать с соединениями согласно изобретению, причем эти действующие вещества указаны или под "общим названием" в английском варианте согласно Международной организации по стандартизации (ИСО), или под химическим названием или имеют кодовый номер. При этом присутствуют все формы применения, как, например, кислоты, соли, сложные эфиры, а также все изомерные формы, как стереоизомеры и оптические изомеры, также даже если они явно не указаны.

Примерами таких гербицидных партнеров для смешивания являются:

ацетохлор, ацифторфен, ацифторфен-натрий, аклонифен, алахлор, аллидохлор, аллоксидим, аллоксидим-натрий, аметрин, амикарбазон, амидохлор, амидосульфурон, 4-амино-3-хлоро-6-(4-хлоро-2-фторо-3-метилфенил)-5-фторопиридин-2-карбоксихлорид кислоты, аминоциклопирапирахлор, аминоциклопирахлор-калий, аминоциклопирахлор-метил, аминопирилатид, амитрол, сульфамат аммония, анилофос, асулам, атразин, азаденидин, азимсульфурон, бифлутурамид, беназолин, беназолин-этил, бенфлуралин, бенфуресат, бифенокс, биланафос, биланафос-натрий, биспирибак, биспирибак-натрий, бромацил, бромобтид, бенсульфурон, бенсульфурон-метил, бенсулид, бентазон, бензобициклоп, бензофенап, бициклопирон, бромофеноксим, бромоксинил, бромоксинил-бутират, -калий, -гептаноат и -октаноат, бусоксинон, бутахлор, бутафенацил, бутамифос, бутенахлор, бутралин, бутроксидим, бутилат, кафенстрол, карбетамид, карфентразон, карфентразон-этил, хлорамбен, хлорбромурон, хлорфенак, хлорфенак-натрий, хлорфенпроп, хлорфлуренол, хлорфлуренол-метил, хлоридазон, хлоримурон, хлоримурон-этил, хлорофталим, хлоротодурон, хлортал-диметил, хлорсульфурон, цинидон, цинидон-этил, цинметилин, циносульфурон, клацифос, клетодим, клодинафон, клодинафоп-пропаргил, кломазон, кломепроп, клопиралид, клорансулам, клорансулам-метил, кумилурон, цианамид, цианазин, циклоат, циклопириморат, циклосульфомурун, циклоксидим, цигалофоп, цигалофоп-бутил, ципразин, 2,4-D, 2,4-D-бутотил, -бутил, -диметиламмоний, -диоламин, -этил, 2-этилгексил, -изобутил, -изооктил, -изопропиламмоний, -калий, -триизопропаноламмоний и -троламин, 2,4-DB, 2,4-DB-бутил, -диметиламмоний, изооктил, -калий и -натрий, даимурон (димрон), далапон, дазомет, н-деканол, десмедифам, детосил-пиразолат (ДТР), дикамба, диклобенил, 2-(2,4-дихлоробензил)-4,4-диметил-1,2-оксазолидин-3-он, 2-(2,5-дихлоробензил)-4,4-диметил-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, DNOC, эндотал, ЕРТС, эспрокарб, эталфлуралин, этаметсульфурон, этаметсульфурон-метил, этиозин, этофумесат, 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-1Н-тетразол-1-ил]-фенил]-этансульфонамид, F-7967, т.е. 3-[7-хлор-5-фтор-2-(трифторметил)-1Н-бензимидазол-4-ил]-1-метил-6-(трифторметил)пиримидин-2,4(1Н,3Н)-дион, феноксапроп, феноксапроп-Р, феноксапроп-этил, феноксапроп-Р-этил, феноксасульфон, фенквинотрион, фентризамид, флампроп, флампроп-М-изопропил, флампроп-М-метил, флазасульфурон, флорасулам, флауазифоп, флауазифоп-Р, флауазифоп-бутил, флауазифоп-Р-бутил, флукарбазон, флукарбазон-натрий, флуцетосульфурон, флухлоралин, флуфенацет, флуфенпир, флуфенпир-этил, флуметсулам, флумиклорак, флумиклорак-пентил, флумиоксазин, флуометурон, флуренол, флуренол-бутил, -диметиламмоний и -метил, фторогликофен, фторогликофен-этил, флупропанат, флупирсульфурон, флупирсульфурон-метил-натрий, флуридон, флуорохлоридон, флуороксипир, флуороксипир-метил, флуртамон, флутиацет, флутиацет-метил, фомесафен, фомесафен-натрий, форамсульфурон, фосамин, глюофосинат, глюофосинат-аммоний, глюофосинат-Р-натрий, глюофосинат-Р-аммоний, глюофосинат-Р-натрий, глифосат, глифосат-аммоний, -изопропиламмоний, -диаммоний, -диметиламмоний, -калий, -натрий и -тримезиум, Н-9201, т.е. О-(2,4-диметил-6-нитрофенил)-О-этил-изопропилфосфорамидотиоат, галауксифен, галауксифен-метил, галосафен, галосульфурон, галосульфурон-метил, галоксифоп, галоксифоп-Р, галоксифоп-этоксизтил, галоксифоп-Р-этоксизтил, галоксифоп-метил, галоксифоп-Р-метил, гексазинон, НW-02, т.е. 1-(диметоксифосфорил)-этил-(2,4-дихлорфенокси)ацетат, имазаметабенз, имазаметабенз-метил, имазамокс, имазамокс-аммоний, имазапик, имазапик-аммоний, имазапир, имазапир-изопропиламмоний, имазаквин, имазаквин-аммоний, имазетапир, имазетапир-иммоний, имазосульфурон, инданофан, индазифлам, йодосульфурон, йодосульфурон-метил-натрий, иоксинил, иоксинил-октаноат, -калий и натрий, ипфенкарбазон, изопротурон, изоурон, изоксабен, изоксафлутол, карбутилат, КUH-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 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, метио-

пирсульфурон, метиозолин, метил изотиоцианат, метобромурон, метолахлор, S-метолахлор, метосулам, метоксурон, метрибузин, метсульфурон, метсульфурон-метил, молинат, монолинурон, моноссульфурон, моноссульфуриновый 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, никоссульфурон, нониловая кислота (пеларгоновая кислота), норфлуазон, олеиновая кислота (жирная кислота), орбенкарб, ортосульфамурон, оризалин, оксадиаргил, оксадиазоп, оксасульфурон, оксацикломефон, оксифторфен, паракват, паракват дихлорид, пебулат, пендиметалин, пенноксулам, пентахлорфенол, пентоксазон, петоксамид, минеральное масло, фенмедифам, пиклорам, пиколинафен, пиноксаден, пиперофос, претилахлор, примисульфурон, примисульфурон-метил, продиамин, профоксидим, прометон, прометрин, пропахлор, пропанил, пропаквизафоп, пропазин, профам, пропизохлор, пропоксикарбазон, пропоксикарбазон-натрия, пропирисульфурон, пропизамид, просульфокарб, просульфурон, пираклонил, пирафлуфен, пирафлуфен-этил, пирасульфотол, пиразолинат (пиразолат), пиразосульфурон, пиразосульфурон-этил, пиразоксифен, пирибамбенз, пирибамбенз-изопропил, пирибамбенз-пропил, пирибамбенз-зоксим, пирибутикарб, пиридафол, пиридат, пирифталид, пириминобак, пириминобак-метил, пириминосульфам, пиритиобак, пиритиобак-натрий, пироксасульфам, пироксасульфурон, пироксулам, квинкlorак, квинмерак, квинокламин, квизалофоп, квизалофоп-этил, квизалофоп-Р, квизалофоп-Р-этил, квизалофоп-Р-тефурил, римсульфурон, сафлуфенацил, сетоксидим, сидурон, симазин, симетрин, SL-261, сулкотрион, сульфентразон, сульфометурон, сульфометурон-метил, сульфосульфурон, SYN-523, SYP-249, т.е. 1-этокси-3-метил-1-охобут-3-ен-2-ил-5-[2-хлор-4-(трифторметил)фенокси]-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, 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, триетазин, трифлорисульфурон, трифлорисульфурон-натрий, трифлудимоксазин, трифлуралин, трифлуусульфурон, трифлуосульфурон-метил, тритосульфурон, сульфат мочевины, вернолят, XDE-848, ZJ-0862 т.е. 3,4-дихлор-N-{2-[(4,6-диметоксипириимидин-2-ил)окси]бензил}анилин, а также следующие соединения:

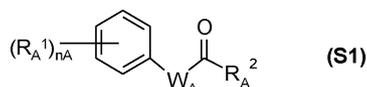


Примерами возможных партнеров для смешивания для регуляторов роста растений являются:

ацибензолар, ацибензолар-S-метил, 5-аминолевулиновая кислота, анцимидол, 6-бензиламинопурин, брассинолид, катехин, 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, изопропиолан, пробеназол, жасмоновая кислота, метиловый эфир жасмоновой кислоты, малеиновый гидразид, мепикват хлорид, 1-метилциклопропен, 2-(1-нафтил)ацетамид, 1-нафтилуксусная кислота, 2-нафтилоксиуксусная кислота, нитрофенолятная смесь, 4-оксо-4-[(2-фенилэтил)амино] масляная кислота, паклобутразол, полиамид N-фенилфталевой кислоты, прогексадион, прогексадион-кальций, прогидроясмон, салициловая кислота, стриголактон, текназен, тидиазурон, триаконтанол, тринексапак, тринексапак-этил, тситодеф, униканозол, униканозол-Р.

Защитные средства, которые можно применять в комбинации с соединениями формулы (I) согласно изобретению и, при необходимости, в комбинации с другими действующими веществами, как, например, инсектицидами, акарицидами, гербицидами, фунгицидами, как описано выше, предпочтительно выбранными из группы, состоящей из:

S1) соединения формулы (S1)

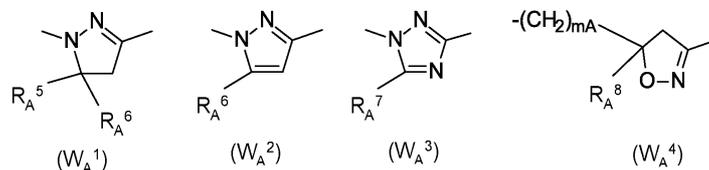


причем символы и индексы имеют следующие значения:

$n_A$  означает натуральное число 0-5, предпочтительно 0-3;

$R_A^1$  означает галоген,  $(C_1-C_4)$ алкил,  $(C_1-C_4)$ алкокси, нитро или  $(C_1-C_4)$ галоалкил;

$W_A$  означает незамещенный или замещенный дивалентный гетероциклический остаток из группы частично ненасыщенных или ароматических гетероциклов с 1-3 кольцевыми гетероатомами из группы N и O, причем по меньшей мере один N-атом и не более одного O-атома присутствуют в кольце, предпочтительно остаток из группы  $(W_A^1)$  -  $(W_A^4)$ :



$m_A$  означает 0 или 1;

$R_A^2$  означает  $OR_A^3$ ,  $SR_A^3$  или  $NR_A^3R_A^4$  или насыщенный или ненасыщенный 3-6-членный гетероцикл по меньшей мере с одним атомом N и содержащий до трех гетероатомов, предпочтительно из группы O и S, который связан с помощью N-атома с карбонильной группой в (S1) и является незамещенным или замещен остатками из группы  $(C_1-C_4)$ алкила,  $(C_1-C_4)$ алкокси или, при необходимости, замещен фенолом, предпочтительно означает остаток формулы  $OR_A^3$ ,  $NHR_A^4$  или  $N(CH_3)_2$ , особенно предпочтительно формулы  $OR_A^3$ ;

$R_A^3$  означает водород или незамещенный или замещенный алифатический углеводородный остаток предпочтительно с 1-18 C-атомами;

$R_A^4$  означает водород,  $(C_1-C_6)$ алкил,  $(C_1-C_6)$ алкокси или замещенный или незамещенный фенил;

$R_A^5$  означает H,  $(C_1-C_8)$ алкил,  $(C_1-C_8)$ галоалкил,  $(C_1-C_4)$ алкокси $(C_1-C_8)$ алкил, циано или  $COOR_A^9$ , где  $R_A^9$  означает водород,  $(C_1-C_8)$ алкил,  $(C_1-C_8)$ галоалкил,  $(C_1-C_4)$ алкокси $(C_1-C_4)$ алкил,  $(C_1-C_6)$ гидроксиалкил,  $(C_3-C_{12})$ циклоалкил или три $(C_1-C_4)$ алкилсиллил;

$R_A^6$ ,  $R_A^7$ ,  $R_A^8$  означают или отличны от водорода,  $(C_1-C_8)$ алкила,  $(C_1-C_8)$ галоалкила,  $(C_3-C_{12})$ циклоалкила или замещенного или незамещенного фенила;

предпочтительно:

a) соединения типа дихлорфенилпиразолин-3-карбоновой кислоты (S1<sup>a</sup>), предпочтительно такие соединения, как 1-(2,4-дихлорфенил)-5-(этоксикарбонил)-5-метил-2-пиразолин-3-карбоновой кислоты, этиловый эфир 1-(2,4-дихлорфенил)-5-(этоксикарбонил)-5-метил-2-пиразолин-3-карбоновой кислоты (S1-1) ("мефенпир-диэтил"), и родственные соединения, которые описаны в WO 91/07874 A;

b) производные дихлорфенилпиразолкарбоновой кислоты (S1<sup>b</sup>), предпочтительно такие соединения, как

этиловый эфир 1-(2,4-дихлорфенил)-5-метилпиразол-3-карбоновой кислоты (S1-2),

этиловый эфир 1-(2,4-дихлорфенил)-5-изопропилпиразол-3-карбоновой кислоты (S1-3),

этиловый эфир 1-(2,4-дихлорфенил)-5-(1,1-диметил-этил)пиразол-3-карбоновой кислоты (S1-4) и

родственные соединения, которые описаны в EP-A-333131 и EP-A-269806;

c) производные 1,5-дифенилпиразол-3-карбоновой кислоты (S1<sup>c</sup>), предпочтительно такие соединения, как

этиловый эфир 1-(2,4-дихлорфенил)-5-фенилпиразол-3-карбоновой кислоты (S1-5),

метиловый эфир 1-(2-хлорфенил)-5-фенилпиразол-3-карбоновой кислоты (S1-6) и

родственные соединения, которые описаны, например, в EP-A-268554;

d) соединения типа триазолкарбоновой кислоты (S1<sup>d</sup>), предпочтительно такие соединения, как фенхлоразол (-этиловый эфир), т.е. этиловый эфир 1-(2,4-дихлорфенил)-5-трихлорметил-(1H)-1,2,4-триазол-3-карбоновой кислоты (S1-7), и

родственные соединения, которые описаны в EP-A-174562 и EP-A-346620;

e) соединения типа 5-бензил- или 5-фенил-2-изоксазолин-3-карбоновой кислоты или 5,5-дифенил-2-изоксазолин-3-карбоновой кислоты (S1<sup>e</sup>), предпочтительно такие соединения, как

этиловый эфир 5-(2,4-дихлорбензил)-2-изоксазолин-3-карбоновой кислоты (S1-8) или

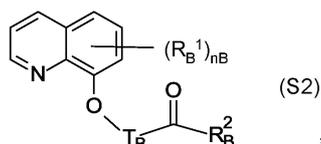
этиловый эфир 5-фенил-2-изоксазолин-3-карбоновой кислоты (S1-9), и

родственные соединения, которые описаны в WO 91/08202 A, или 5,5-дифенил-2-изоксазолин-карбоновая кислота (S1-10), или

этиловый эфир 5,5-дифенил-2-изоксазолин-3-карбоновой кислоты (S1-11) ("изоксафифен-этил") или -n-пропиловый эфир (S1-12), или

этиловый эфир 5-(4-фторфенил)-5-фенил-2-изоксазолин-3-карбоновой кислоты (S1-13), как описывает патентная заявка WO 95/07897 A.

S2) производные хинолина формулы (S2)



причем символы и индексы имеют следующие значения:

$R_B^1$  означает галоген, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)алкил, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)алкокси, нитро или (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)галоалкил;

$n_B$  означает натуральное число 0-5, предпочтительно 0-3;

$R_B^2$  означает ORB<sup>3</sup>, SRB<sup>3</sup> или NRB<sup>3</sup>R<sup>4</sup> или насыщенный или ненасыщенный 3-6-членный гетероцикл по меньшей мере с одним атомом N и содержащий до трех гетероатомов, предпочтительно из группы O и S, который связан с помощью N-атома с карбонильной группой в (S2) и является незамещенным или замещен остатками из группы (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)алкила, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)алкокси или, при необходимости, замещен фенолом, предпочтительно означает остаток формулы ORB<sup>3</sup>, NHRB<sup>4</sup> или N(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, особенно предпочтительно формулы ORB<sup>3</sup>;

$R_B^3$  означает водород или незамещенный или замещенный алифатический углеводородный остаток, предпочтительно с 1-18 C-атомами;

$R_B^4$  означает водород, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)алкил, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)алкокси или замещенный или незамещенный фенил;

T<sub>B</sub> означает (C<sub>1</sub> или C<sub>2</sub>)-алкандиильную цепь, которая является незамещенной или может быть замещена одним или двумя (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)алкильными остатками или [(C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)алкокси]карбонилем; предпочтительно:

а) соединения типа 8-хинолиноксиуксусной кислоты (S2<sup>a</sup>), предпочтительно

(1-метилгексилловый)эфир (5-хлор-8-хинолинокси)уксусной кислоты ("клоквинтосет-мексил") (S2-1),

(1,3-диметил-бут-1-иловый)эфир (5-хлор-8-хинолинокси)уксусной кислоты (S2-2),

4-аллилокси-бутиловый эфир (5-хлор-8-хинолинокси)уксусной кислоты (S2-3),

1-аллилокси-проп-2-иловый эфир (5-хлор-8-хинолинокси)уксусной кислоты (S2-4),

этиловый эфир (5-хлор-8-хинолинокси)уксусной кислоты (S2-5),

метилловый эфир (5-хлор-8-хинолинокси)уксусной кислоты (S2-6),

аллиловый эфир (5-хлор-8-хинолинокси)уксусной кислоты (S2-7),

2-(2-пропилиден-иминокси)-1-этиловый эфир (5-хлор-8-хинолинокси)уксусной кислоты (S2-8),

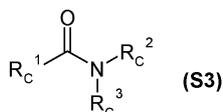
2-оксо-проп-1-иловый эфир (5-хлор-8-хинолинокси)уксусной кислоты (S2-9) и

родственные соединения, как описанные 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), ее гидраты и соли, например их соли лития, натрия, калия, кальция, магния, алюминия, железа, аммония, четвертичного аммония, сульфония или соли фосфония, которые описаны в WO 2002/34048 A;

б) соединения типа (5-хлор-8-хинолинокси)малоновой кислоты (S2<sup>b</sup>), предпочтительно такие соединения, как диэтиловый эфир (5-хлор-8-хинолинокси)малоновой кислоты, диаллиловый эфир (5-хлор-8-хинолинокси)малоновой кислоты, метил-этиловый эфир (5-хлор-8-хинолинокси)малоновой кислоты и родственные соединения, которые описаны в EP-A-058298;

S3) соединения формулы (S3)



причем символы и индексы имеют следующие значения:

$R_C^1$  означает (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)алкил, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)галоалкил, (C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>)алкенил, (C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>)галоалкенил, (C<sub>3</sub>-C<sub>7</sub>)циклоалкил, предпочтительно дихлорметил;

$R_C^2$ ,  $R_C^3$  равны или отличны от водорода, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)алкила, (C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>)алкенила, (C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>)алкинила, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)галоалкила, (C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>)галоалкенила, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)алкилкарбамоил, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)алкила, (C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>)алкенилкарбамоил, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)алкила, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)алкокси, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)алкила, диоксоланил, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)алкила, тиазолила, фурила, фурилалкила, тиенила, пиперидила, замещенного или незамещенного фенил или  $R_C^2$  и  $R_C^3$  вместе образуют замещенное или незамещенное гетероциклическое кольцо, предпочтительно оксазолидиновое, тиазолидиновое, пиперидиновое, морфолиновое, гексагидропиримидиновое или бензоксазиновое кольцо;

предпочтительно:

действующие вещества типа дихлорацетамидов, которые часто используют в качестве защитных средств в предвсходовый период (защитные средства, для применения в почве), как, например:

"дихлормид" (N,N-диаллил-2,2-дихлорацетамид) (S3-1),

"R-29148" (3-дихлорацетил-2,2,5-триметил-1,3-оксазолидин) фирмы Stauffer (S3-2),

"R-28725" (3-дихлорацетил-2,2-диметил-1,3-оксазолидин) фирмы Stauffer (S3-3),

"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) фирмы PPG Industries (S3-5),

"DKA-24" (N-аллил-N-[(аллиламинокарбонил)метил]дихлорацетамид) фирмы Sagro-Chem (S3-6),

"AD-67" или "MON 4660" (3-дихлорацетил-1-окса-3-азаспиро[4,5]декан) фирмы Nitrokemia или Monsanto (S3-7),

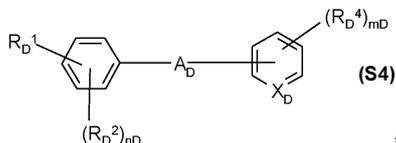
"TI-35" (1-дихлорацетил-азепан) фирмы TRI-Chemical RT (S3-8),

"диклонон" (дициклонон) или "BAS145138" или "LAB 145138" (S3-9),

((RS)-1-дихлорацетил-3,3,8a-триметилпергидропирроло[1,2-a]пиримидин-6-он) фирмы BASF,

"фурилазол" или "MON 13900" (RS)-3-дихлорацетил-5-(2-фурил)-2,2-диметилкоксазолидин) (S3-10), а также их (R)-изомер (S3-11);

S4) N-ацилсульфонамиды формулы (S4) и их соли:



где символы и индексы имеют следующие значения:

$A_D$  означает  $SO_2-NR_D^3-CO$  или  $CO-NR_D^3-SO_2$ ;

$X_D$  означает CH или N;

$R_D^1$  означает  $CO-NR_D^5R_D^6$  или  $NHCO-R_D^7$ ;

$R_D^2$  означает галоген,  $(C_1-C_4)$ галоалкил,  $(C_1-C_4)$ галоалкокси, нитро,  $(C_1-C_4)$ алкил,  $(C_1-C_4)$ алкокси,  $(C_1-C_4)$ алкилсульфонил,  $(C_1-C_4)$ алкоксикарбонил или  $(C_1-C_4)$ алкилкарбонил;

$R_D^3$  означает водород,  $(C_1-C_4)$ алкил,  $(C_2-C_4)$ алкенил или  $(C_2-C_4)$ алкинил;

$R_D^4$  означает галоген, нитро,  $(C_1-C_4)$ алкил,  $(C_1-C_4)$ галоалкил,  $(C_1-C_4)$ галоалкокси,  $(C_3-C_6)$ циклоалкил, фенил,  $(C_1-C_4)$ алкокси, циано,  $(C_1-C_4)$ алкилтио,  $(C_1-C_4)$ алкилсульфинил,  $(C_1-C_4)$ алкилсульфонил,  $(C_1-C_4)$ алкоксикарбонил или  $(C_1-C_4)$ алкилкарбонил;

$R_D^5$  означает водород,  $(C_1-C_6)$ алкил,  $(C_3-C_6)$ циклоалкил,  $(C_2-C_6)$ алкенил,  $(C_2-C_6)$ алкинил,  $(C_5-C_6)$ циклоалкенил, фенил или 3-6-членный гетероцикл, содержащий  $v_D$  гетероатомов из группы азота, кислорода и серы, причем семь названных последними остатков замещены  $v_D$  заместителями из группы галогена,  $(C_1-C_6)$ алкокси,  $(C_1-C_6)$ галоалкокси,  $(C_1-C_2)$ алкилсульфинила,  $(C_1-C_2)$ алкилсульфонила,  $(C_3-C_6)$ циклоалкила,  $(C_1-C_4)$ алкоксикарбонила,  $(C_1-C_4)$ алкилкарбонила и фенила, и в случае циклических остатков также  $(C_1-C_4)$  алкил и  $(C_1-C_4)$ галоалкил являются замещенными;

$R_D^6$  означает водород,  $(C_1-C_6)$ алкил,  $(C_2-C_6)$ алкенил или  $(C_2-C_6)$ алкинил, причем три названных последними остатка замещены  $v_D$  остатками из группы галогена, гидроксид,  $(C_1-C_4)$ алкила,  $(C_1-C_4)$ алкокси и  $(C_1-C_4)$ алкилтио; или

$R_D^5$  и  $R_D^6$  вместе с присутствующим атомом азота образуют пирролидинильный или пиперидинильный остаток;

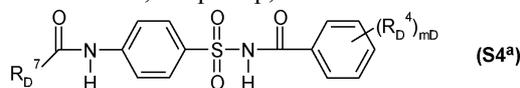
$R_D^7$  представляет собой водород,  $(C_1-C_4)$ алкиламино, ди $(C_1-C_4)$ алкиламино,  $(C_1-C_6)$ алкил,  $(C_3-C_6)$ циклоалкил, причем два последних остатка замещены  $v_D$  заместителями из группы галогена,  $(C_1-C_4)$ алкокси,  $(C_1-C_6)$ галоалкокси и  $(C_1-C_4)$ алкилтио и в случае циклических остатков также замещены  $(C_1-C_4)$ алкилом и  $(C_1-C_4)$ галоалкилом;

$n_D$  означает 0, 1 или 2;

$m_D$  означает 1 или 2;

$v_D$  означает 0, 1, 2 или 3;

из них предпочтительными являются соединения типа N-ацилсульфонамидов, например, нижеследующей формулы (S4<sup>a</sup>), которые известны, например, из WO 97/45016 A:



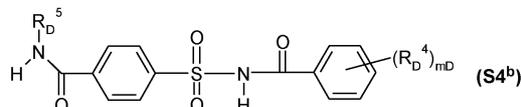
где  $R_D^7$  означает  $(C_1-C_6)$ алкил,  $(C_3-C_6)$ циклоалкил, причем два названных последними остатка замещены  $v_D$  заместителями из группы галогена,  $(C_1-C_4)$ алкокси,  $(C_1-C_6)$ галоалкокси и  $(C_1-C_4)$ алкилтио и в случае циклических остатков также замещены  $(C_1-C_4)$ алкилом и  $(C_1-C_4)$ галоалкилом;

$R_D^4$  означает галоген,  $(C_1-C_4)$ алкил,  $(C_1-C_4)$ алкокси,  $CF_3$ ;

$m_D$  означает 1 или 2;

$v_D$  означает 0, 1, 2 или 3;

а также амиды ацилсульфамойлбензойной кислоты, например, следующей формулы (S4<sup>b</sup>), которые, например, известны из WO 99/16744 A:



например, такие, где

$R_D^5$  = циклопропил и  $(R_D^4) = 2\text{-OMe}$  ("ципросульфамиды", S4-1),

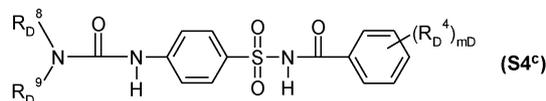
$R_D^5$  = циклопропил и  $(R_D^4) = 5\text{-Cl-2-OMe}$  (S4-2),

$R_D^5$  = этил и  $(R_D^4) = 2\text{-OMe}$  (S4-3),

$R_D^5$  = циклопропил и  $(R_D^4) = 5\text{-Cl-2-OMe}$  (S4-4), и

$R_D^5$  = этил и  $(R_D^4) = 2\text{-OMe}$  (S4-5),

а также соединения типа N-ацилсульфамоилфенилмочевины формулы (S4c), которые, например, известны из EP-A-365484:



где  $R_D^8$  и  $R_D^9$  независимо друг от друга означают 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;

$R_D^4$  означает галоген,  $(C_1\text{-}C_4)$ алкил,  $(C_1\text{-}C_4)$ алкокси,  $CF_3$ ;

$m_D$  означает 1 или 2;

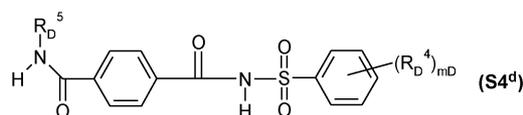
например,

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

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

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

а также N-фенилсульфонилтерeftаламиды формулы (S4<sup>d</sup>), которые, например, известны из CN 10183227:



например, такие, где  $R_D^4$  означает галоген,  $(C_1\text{-}C_4)$ алкил,  $(C_1\text{-}C_4)$ алкокси,  $CF_3$ ;

$m_D$  означает 1 или 2;

$R_D^5$  означает водород,  $(C_1\text{-}C_6)$ алкил,  $(C_3\text{-}C_6)$ циклоалкил,  $(C_2\text{-}C_6)$ алкенил,  $(C_2\text{-}C_6)$ алкинил,  $(C_5\text{-}C_6)$ циклоалкенил;

S5) действующие вещества из класса гидрокси-ароматических соединений и ароматически-алифатических производных карбоновой кислоты (S5), например этиловый эфир 3,4,5-триацетокси-бензойной кислоты, 3,5-диметокси-4-гидроксибензойная кислота, 3,5-дигидроксибензойная кислота, 4-гидроксисалициловая кислота, 4-фторсалициловая кислота, 2-гидроксикоричная кислота, 2,4-дихлоркоричная кислота, которые описаны в WO 2004/084631 A, WO 2005/015994 A, WO 2005/016001 A;

S6) действующие вещества из класса 1,2-дигидрохиноксалин-2-онов (S6), например:

1-метил-3-(2-тиенил)-1,2-дигидрохиноксалин-2-он,

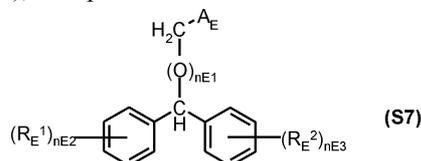
1-метил-3-(2-тиенил)-1,2-дигидрохиноксалин-2-тион,

1-(2-аминоэтил)-3-(2-тиенил)-1,2-дигидрохиноксалин-2-он-гидрохлорид,

1-(2-метилсульфоаминоэтил)-3-(2-тиенил)-1,2-дигидро-хиноксалин-2-он,

которые описаны в WO 2005/112630 A;

S7) соединения формулы (S7), которые описаны в WO 1998/38856 A:



где символы и индексы имеют следующие значения:

$R_E^1$ ,  $R_E^2$  означают независимо друг от друга галоген,  $(C_1\text{-}C_4)$ алкил,  $(C_1\text{-}C_4)$ алкокси,  $(C_1\text{-}C_4)$ галоалкил,  $(C_1\text{-}C_4)$ алкиламино, ди $(C_1\text{-}C_4)$ алкиламино, нитро;

$A_E$  означает  $COOR_E^3$  или  $COSR_E^4$ ;

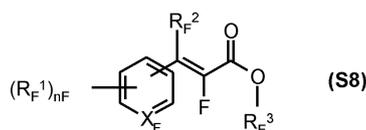
$R_E^3$ ,  $R_E^4$  независимо друг от друга означают водород,  $(C_1\text{-}C_4)$ алкил,  $(C_2\text{-}C_6)$ алкенил,  $(C_2\text{-}C_4)$ алкинил, цианоалкил,  $(C_1\text{-}C_4)$ галоалкил, фенил, нитрофенил, бензил, галобензил, пиридинилалкил и алкиламмоний;

$n_E^1$  означает 0 или 1;

$n_E^2$ ,  $n_E^3$  независимо друг от друга означают 0, 1 или 2,

предпочтительно дифенилметоксиуксусная кислота, этиловый эфир дифенилметоксиуксусной кислоты, метиловый эфир дифенилметоксиуксусной кислоты (Reg. № CAS 41858-19-9) (S7-1);

S8) соединения формулы (S8), которые описаны в WO 98/27049 A:



где  $X_F$  означает СН или N,  
 $n_F$ , если  $X_F=N$ , означает целое число от 0 до 4 и, если  $X_F=CH$ , означает целое число от 0 до 5,  
 $R_F^1$  означает галоген, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)алкил, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)галоалкил, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)алкокси, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)галоалкокси, нитро, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)алкилтио, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)алкилсульфонил, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)алкоксикарбонил, при необходимости, замещенный фенил, при необходимости, замещенный фенокси,  
 $R_F^2$  означает водород или (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)алкил,  
 $R_F^3$  означает водород, (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)алкил, (C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>)алкенил, (C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>)алкинил или арил, причем каждый из предварительно названных C-содержащих остатков является незамещенным или замещен одним или несколькими, предпочтительно до трех, одинаковыми или различными остатками из группы, состоящей из галогена и алкокси;

или их соли,

предпочтительно соединения, где  $X_F$  означает СН,

$n_F$  означает целое число 0-2,

$R_F^1$  означает галоген, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)алкил, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)галоалкил, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)алкокси, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)галоалкокси,

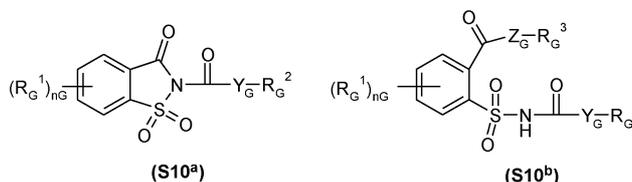
$R_F^2$  означает водород или (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)алкил,

$R_F^3$  означает водород, (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)алкил, (C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>)алкенил, (C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>)алкинил или арил, причем каждый из предварительно названных C-содержащих остатков является незамещенным или замещен одним или несколькими, предпочтительно до трех, одинаковыми или различными остатками из группы, состоящей из галогена и алкокси;

или их соли;

S9) действующие вещества из класса 3-(5-тетразолилкарбонил)-2-хинолонов (S9), например 1,2-дигидро-4-гидрокси-1-этил-3-(5-тетразолилкарбонил)-2-хинолон (Рег. № CAS 219479-18-2), 1,2-дигидро-4-гидрокси-1-метил-3-(5-тетразолилкарбонил)-2-хинолон (Рег. № CAS 95855-00-8), которые описаны в WO 1999/000020 А;

S10) соединения формулы (S10a) или (S10b), которые описаны в WO 2007/023719 А и WO 2007/023764 А:



где  $R_G^1$  означает галоген, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)алкил, метокси, нитро, циано, CF<sub>3</sub>, OCF<sub>3</sub>,

$Y_G, Z_G$  независимо друг от друга означают О или S,

$n_G$  означает целое число 0-4,

$R_G^2$  означает (C<sub>1</sub>-C<sub>16</sub>)алкил, (C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)алкенил, (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)циклоалкил, арил; бензил, галогенбензил,

$R_G^3$  означает водород или (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)алкил;

S11) действующие вещества типа оксиимино-соединений (S11), которые используют в качестве протравочных средств для семян, как, например, "оксабетринил" ((2)-1,3-диоксолан-2-илметоксиимино(фенил)ацетонитрил) (S11-1), который используют в качестве защитного средства для протравки семян для проса от повреждений, вызванных метолахлором, "флукофенил" (1-(4-хлорфенил)-2,2,2-трифтор-1-этанон-О-(1,3-диоксолан-2-илметил)оксим) (S11-2), который используют в качестве защитного средства для протравки семян для проса от повреждений, вызванных метолахлором, и "циометринил" или "CGA-43089" ((2)-цианометоксиимино(фенил)-ацетонитрил) (S11-3), который используют в качестве защитного средства для протравки семян для проса от повреждений, вызванных метолахлором;

S12) действующие вещества из класса изотиохроманонов (S12), как, например, метил-[(3-оксо-1Н-2-бензотиопиран-4(3Н)-илиден)метокси]ацетат (Рег. № CAS 205121-04-6) (S12-1) и родственные соединения из WO 1998/13361 А;

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

"нафталик ангидрид" (ангидрид 1,8-нафталиндикарбоновой кислоты) (S13-1), который используют в качестве защитного средства для протравки семян кукурузы от повреждений, вызванных тиокарбаматными гербицидами,

"фенклорим" (4,6-дихлор-2-фенилпиримидин) (S13-2), который используют в качестве защитного средства от претилахлора в посеянном рисе,

"флуразол" (бензил-2-хлор-4-трифторметил-1,3-тиазол-5-карбоксилат) (S13-3), который используют в качестве защитного средства для протравки семян для проса от повреждений, вызванных алахлором и метолахлором,

"CL 304415" (Reg. № CAS 31541-57-8) (4-карбоксо-3,4-дигидро-2Н-1-бензопиран-4-уксусная кислота) (S13-4) фирмы American Cyanamid, который используют в качестве защитного средства для кукурузы от повреждений, вызванных имидазолинонами,

"MG 191" (Reg. № CAS 96420-72-3) (2-дихлорметил-2-метил-1,3-диоксолан) (S13-5) фирмы Nitrokemia, который используют в качестве защитного средства для кукурузы,

"MG 838" (Reg. № CAS 133993-74-5) (2-пропенил 1-окса-4-азаспиро[4.5]декан-4-карбодитиоат) (S13-6) фирмы Nitrokemia,

"дисульфотон" (О,О-диэтил S-2-этилтиоэтилфосфордитиоат) (S13-7),

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

"мефенат" (4-хлорфенил-метилкарбамат) (S13-9);

S14) действующие вещества, которые, наряду с гербицидным действием против вредных растений, также оказывают защитное действие на такие культурные растения, как рис, как, например:

"димепиперат" или "MY-93" (S-1-метил-1-фенилэтил-пиперидин-1-карботиоат), который является защитным средством для риса от повреждений, вызванных гербицидом молинатом,

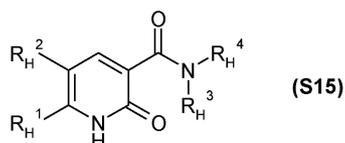
"даимурон" или "SK 23" (1-(1-метил-1-фенилэтил)-3-р-толил-мочевина), который является защитным средством для риса от повреждений, вызванных гербицидом имазосульфуроном,

"кумидурон" = "JC-940" (3-(2-хлорфенилметил)-1-(1-метил-1-фенилэтил)мочевина, см. JP-A-60087254), который является защитным средством для риса от повреждений, вызванных некоторыми гербицидами,

"метоксифенон" или "NK 049" (3,3'-диметил-4-метоксибензофенон), который является защитным средством для риса от повреждений, вызванных некоторыми гербицидами,

"CSB" (1-бром-4-(хлорметилсульфонил)бензол) фирмы Kumiai, (Reg. № CAS 54091-06-4), который является защитным средством для риса от повреждений, вызванных некоторыми гербицидами;

S15) соединения формулы (S15) или их таутомеры, которые описаны в WO 2008/131861 А и WO 2008/131860 А:



где  $R_H^1$  означает (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)галоалкильный остаток,

$R_H^2$  означает водород или галоген,

$R_H^3$ ,  $R_H^4$  независимо друг от друга означают водород, (C<sub>1</sub>-C<sub>16</sub>)алкил, (C<sub>2</sub>-C<sub>16</sub>)алкенил или (C<sub>2</sub>-C<sub>16</sub>)алкинил,

причем каждый из трех названных последними остатков является незамещенным или может быть замещен одним или более остатками из группы галогена, гидрокси, циано, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)алкокси, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)галоалкокси, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)алкилтио, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)алкиламино, ди[(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)алкил]амино, [(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)алкокси]-карбонила, [(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)галоалкокси]карбонила, (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)циклоалкила, который является незамещенным или замещенным, фенила, который является незамещенным или замещенным, и гетероциклила, который является незамещенным или замещенным, или (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)циклоалкила, (C<sub>4</sub>-C<sub>6</sub>)циклоалкенила, (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)циклоалкила, который на стороне кольца конденсируется одним 4-6-членным насыщенным или ненасыщенным карбоциклическим кольцом, или (C<sub>4</sub>-C<sub>6</sub>)циклоалкенила, который на стороне кольца конденсируется одним 4-6-членным насыщенным или ненасыщенным карбоциклическим кольцом,

причем каждый из четырех названных последними остатков является незамещенным или может быть замещен одним или более остатками из группы галогена, гидрокси, циано, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)алкила, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)галоалкила, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)алкокси, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)галоалкокси, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)алкилтио, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)алкиламино, ди[(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)алкил]амино, [(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)алкокси]карбонила, [(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)галоалкокси]карбонила, (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)циклоалкила, который является незамещенным или замещенным, фенила, который является незамещенным или замещенным, и гетероциклила, который является незамещенным или замещенным, или

$R_H^3$  означает (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)алкокси, (C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>)алкенилокси, (C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)алкинилокси или (C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>)галоалкокси,

$R_H^4$  означает водород или (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-алкил или

$R_H^3$  и  $R_H^4$  вместе с напрямую соединенным N-атомом означает 4-8-членное гетероциклическое кольцо, которое, наряду с N-атомом, также может содержать другие кольцевые гетероатомы, предпочтительно до двух других кольцевых гетероатомов из группы N, O и S, и которое является незамещенным или замещено одним или более остатками из группы галогена, циано, нитро, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)алкила, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)галоалкила, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)алкокси, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)галоалкокси и (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)алкилтио;

S16) действующие вещества, которые преимущественно используют в качестве гербицидов, однако которые также оказывают защитное действие на культурные растения, например:

(2,4-дихлорфенокси)уксусная кислота (2,4-D),

(4-хлорфенокси)уксусная кислота,

(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 (МСРА),  
 4-(4-хлор-о-толилокси)масляная кислота,  
 4-(4-хлорфенокси)масляная кислота,  
 3,6-дихлор-2-метоксибензойная кислота (дикамба),  
 1-(этоксикарбонил)этил-3,6-дихлор-2-метоксибензоат (лактидихлор-этил).

Особенно предпочтительными защитными средствами являются мефенпир-диэтил, ципросульфамид, изоксадифен-этил, флоквентосет-мексил и дихлормид.

Порошками для распыления являются препараты, равномерно диспергируемые в воде, которые, наряду с действующим веществом, кроме разбавителя или инертного вещества, также содержат еще ПАВы неионного и/или ионного вида (смачиватели, диспергаторы), например полиоксиэтилированные алкилфенолы, полиоксметилированные алифатические спирты, полиоксиэтилированные алифатические амины, полигликольэфирсульфаты жирного спирта, алкансульфонаты, алкилбензолсульфонаты, лигнинсульфонокислый натрий, 2,2'-динафтилметан-6,6'-дисульфокислый натрий, дибутилнафталин сульфокислый натрий или также олеолметилтауринкислый натрий. Для изготовления порошков для распыления гербицидные действующие вещества тонко измельчают, например, на таком обычном оборудовании, как молотковая дробилка, воздушодувная и воздушоструйная мельница и сразу или потом смешивают со вспомогательными средствами для препаративных форм.

Эмульгируемые концентраты получают при растворении биологически активного вещества в органическом растворителе, например бутаноле, циклогексаноне, диметилформамиде, ксилоле или также в высококипящих ароматических соединениях или углеводородах, или смесях органического растворителя с использованием одного или нескольких ПАВ ионного и/или неионного вида (эмульгаторов). В качестве эмульгаторов, например, могут быть использованы: кальциевые соли алкиларилсульфонокислоты, как Са-додецилбензолсульфонат или неионные эмульгаторы, как полигликолевый эфир жирной кислоты, алкиларилполигликолевый эфир, полигликолевый эфир жирного спирта, продукты конденсации пропиленоксида-этиленоксида, алкилполиэфир, сорбитановый эфир, как, например, сорбитановый эфир жирной кислоты или полиоксэтиленсорбитановый эфир, как, например, полиоксиэтиленсорбитановый эфир жирной кислоты.

Средства для опыления получают при измельчении биологически активного вещества с такими тонко измельченными твердыми веществами, как, например, тальк, такими природными глинами, как каолин, бентонит и пиррофиллит или диатомовая земля.

Суспензионные концентраты могут иметь водную или масляную основу. Они могут быть получены, например, при влажном измельчении с помощью стандартных бисерных мельниц, при необходимости, с добавлением ПАВ, как, например, уже было названо в других типах препаративных форм.

Эмульсии, например эмульсии типа "масло в воде" (EW), могут быть получены с помощью мешалок, коллоидных мельниц и/или статических смесителей при использовании водных органических растворителей и, при необходимости, ПАВ, как, например, уже было названо в других типах препаративных форм.

Грануляты могут производиться путем распыления активного действующего вещества на гранулированные инертные адсорбенты или нанесения концентрата активных действующих веществ при помощи связующих веществ, например поливинилового спирта, натрия полиакриловой кислоты или также минеральных масел, на поверхность такого наполнителя, как песок, каолинит или гранулированный инертный материал. Также для изготовления гранулятов для удобрений надлежащие действующие вещества дробят обычным способом, при желании в смеси с удобрениями.

Водно-диспергируемые грануляты производятся, как правило, обычными способами, такими как распылительная сушка, гранулирование в кипящем слое, гранулирование дисковым гранулятором, смешивание в высокоскоростном миксере-грануляторе и экструзия без твердого инертного вещества.

Для получения гранулятов с помощью дискового гранулятора, гранулятов, полученных в псевдооживленном слое, в экструдере и при распылительной сушке см., например, способ в "Spray-Drying Handbook" 3-е изд. 1979, G. Goodwin Ltd., Лондон, J.E. Browning, "Agglomeration", Chemical and Engineering 1967, стр. 147, "Perry's Chemical Engineer's Handbook", 5-е изд., McGraw-Hill, Нью-Йорк 1973, стр. 8-57.

Другие подробности о препаративных формах средств защиты растений см., например, G.C. Klingman, "Weed Control as a Science", John Wiley and Sons, Inc., Нью-Йорк, 1961, стр. 81-96 и J.D. Freyer, S.A. Evans, "Weed Control Handbook", 5-е изд., Blackwell Scientific Publications, Оксфорд, 1968, стр. 101-103.

Агрохимические препаративные формы содержат, как правило, 0,1-99 мас.%, в частности 0,1-95 мас.%, соединения согласно изобретению. В порошках для опыливания концентрация действующего вещества составляет, например, 10-90 мас.% остатка к 100 мас.% из обычных компонентов препаративной формы. В эмульгируемых концентратах концентрация биологически активного вещества может составлять примерно 1-90, предпочтительно 5-80 мас.%. Пылевидные препаративные формы содержат 1-30 мас.% действующего вещества, предпочтительно по меньшей мер, 5-20 мас.% действующего вещества, растворы для рассыпания содержат примерно 0,05-80, предпочтительно 2-50 мас.% действующего

шего вещества. В вододиспергируемых гранулятах содержание активного компонента частично зависит от того, присутствует действующее соединение в жидком или твердом виде и какие гранулирующие вспомогательные вещества, наполнители и т.д. используют. В диспергируемых в воде гранулятах содержание действующего вещества составляет, например, 1-95 мас.%, предпочтительно 10-80 мас.%.

Наряду с этим, названные соединения активных действующих веществ, при необходимости, содержат обычные схватывающие, смачивающие, диспергирующие, эмульгирующие, проникающие, консервирующие вещества, вещества, защищающие от мороза, и растворители, наполнители, носители, красители, пеногасители, тормозные испарители и антитранспиранты и средства, влияющие на уровень pH и вязкость.

На основе этих препаративных форм также могут быть получены комбинации с другими пестицидно действующими веществами, как, например, инсектицидами, акарицидами, гербицидами, фунгицидами, а также с защитными средствами, удобрениями и/или регуляторами роста, например, в виде готовых препаративных форм или в виде смешивания в емкости.

Для применения присутствующие в обычном виде препаративные формы разбавляют обычным способом с водой, например в виде порошков для распыления, эмульгируемых концентратов, дисперсий и диспергируемых в воде гранулятов. Пылевидные препаративные формы, почвенные грануляты или грануляты, а также растворы для распыления перед применением обычно не разбавляют другими инертными веществами.

При воздействии внешних условий, таких как температура, влажность, вид применяемого гербицида и т.д., необходимые нормы соединений формулы (I) меняются. Они могут колебаться в пределах определенных границ, например 0,001-1,0 кг/га или большее количество активного вещества, однако предпочтительным является 0,005-750 г/га.

Наполнитель означает природное или синтетическое, органическое или неорганическое вещество, с которым смешивают или соединяют действующие вещества для улучшенной пригодности к употреблению, для нанесения на растения или части растений, или семенной материал. Наполнитель, который может быть твердым или жидким, в общем, является инертным и должен применяться в сельском хозяйстве.

В качестве твердого или жидкого наполнителя принимают во внимание: например, соли аммония и природную каменную муку, как каолин, глинозем, тальк, мел, кварц, аттапульгит, монтмориллонит или диатомовую землю и синтетическую каменную муку, как высокодисперсную кремниевую кислоту, оксид алюминия и природные или синтетические силикаты, смолы, воски, твердые удобрения, воду, спирт, в частности бутанол, органические растворители, минеральные и растительные масла, а также их производные. Также могут быть использованы смеси таких наполнителей. В качестве твердых наполнителей для гранулятов принимают во внимание, например, разломанную и фракционированную природную горную породу, как кальцит, мрамор, пемзу, сепиолит, доломит, а также синтетические грануляты из неорганического и органического муки, а также грануляты из органических материалов, как опилки, скорлупа кокосового ореха, кукурузные початки и стебли табачного растения.

В качестве сжиженных газообразных разбавителей или наполнителей принимают во внимание такие жидкости, которые при нормальной температуре и нормальном давлении являются газообразными, например аэрозольные пропелленты, как галоген-углеводороды, а также бутан, пропан, азот и диоксид углерода.

В препаративных формах могут быть использованы такие средства, улучшающие адгезию, как карбоксиметилцеллюлоза, природные и синтетические порошкообразные, зернистые или латексные полимеры, как гуммиарабик, поливиниловый спирт, поливинилацетат, а также природный фосфолипид, как кефалин и лецитин, и синтетический фосфолипид. Другими добавками могут быть минеральные и растительные масла.

В случае использования воды в качестве разбавителя можно, например, также использовать органические растворители в качестве вспомогательных растворителей. В качестве жидких растворителей в основном принимают во внимание ароматические углеводороды, как ксилол, толуол или алкилнафталины, хлорированные ароматические углеводороды или хлорированные алифатические углеводороды, как хлорбензол, хлорэтилены или дихлорметан, алифатические углеводороды, как циклогексан или парафин, например нефтяные фракции, минеральные и растительные масла, спирты, как бутанол или гликоль, а также их простые и сложные эфиры, кетоны, как ацетон, метилэтилкетон, метилизобутилкетон или циклогексанол, очень полярные растворители, как диметилформамид и диметилсульфоксид, а также вода.

Средства согласно изобретению могут дополнительно содержать другие компоненты, как кломазон, ПАВы. В качестве ПАВ принимают во внимание эмульгаторы и/или пенообразующие средства, диспергаторы или смачиватели с ионными или неионными свойствами или смеси этих ПАВ. Их примерами являются соли полиакриловой кислоты, соли лигносульфоновой кислоты, соли фенолсульфокислоты или нафталинсульфокислоты, поликонденсаты этиленоксида с алифатическими спиртами или с алифатическими аминами, замещенные фенолы (предпочтительно алкилфенолы или арилфенолы), соли эфиров сульфоянтарной кислоты, производные таурина (предпочтительно алкилтаурата), эфиры фосфорной кислоты полиэтоксигированных спиртов или фенолов, эфиры жирных кислот многоатомных спиртов и

производные соединений, содержащих сульфаты, сульфонаты и фосфаты, например алкиларилполигликолевый эфир, алкилсульфонат, алкилсульфат, арилсульфонат, белковые гидролизаты, лигнин-сульфитный щелок и метилцеллюлоза. Присутствие поверхностно-активных веществ является необходимым, если одно из действующих веществ и/или один из инертных наполнителей нерастворимы в воде и если применение происходит в воде. Количество поверхностно-активных веществ составляет 5-40 мас.% согласно изобретению. Можно применять такие неорганические пигменты, как, например, оксид железа, титана, ферроцианосиний и органические красители, как ализариновые красители, азокрасители и красители металлофталоцианина, и соли питательных веществ, как соли железа, марганца, бора, меди, кобальта, молибдена и цинка.

При необходимости, также могут присутствовать другие дополнительные компоненты, например защитные коллоиды, вяжущие вещества, клеящее вещество, сгустители, тиксотропные вещества, усилители пенетрации, стабилизаторы, комплексообразующее соединение, комплексообразователи. В общем действующие вещества можно комбинировать с твердыми или жидкими добавками, которые обычно используют для препаративной формы. В общем средства и препаративные формы согласно изобретению содержат 0,05-99, 0,01-98 мас.%, предпочтительно 0,1-95 мас.%, особенно предпочтительно 0,5-90 мас.% действующего вещества, весьма предпочтительно 10-70 мас.%. Действующие вещества или средства согласно изобретению можно применять в чистом виде или в зависимости от их соответствующих физических и/или химических свойств в виде их препаративных форм или полученных из них форм применения, как аэрозоли, капсульные суспензии, концентраты для холодного тумана, концентраты для горячего тумана, грануляты в капсулах, мелкозернистый гранулят, жидкий концентрат для обработки семенного материала, готовый к употреблению раствор, порошок для опыливания, эмульгируемый концентрат, эмульсии "масло в воде", эмульсии "вода в масле", макрогранулят, микрогранулят, порошок, диспергируемый в масле, жидкий концентрат для смешивания в масле, смешиваемые с маслом жидкости, пены, пасты, семенной материал в оболочке из пестицида, суспензионные концентраты, концентрат суспензия-эмульсии, растворимый концентрат, суспензия, порошки для опрыскивания, растворимый порошок, средства для опыления и грануляты, растворимые в воде грануляты или таблетки, растворимый в воде порошок обработки семенного материала, порошок для смачивания, пропитанные действующим веществом природные и синтетические материалы, а также мелкозернистые вещества в капсулах из полимерных веществ и в оболочках для семенного материала, а также препаративные формы для ULV генератора холодного и горячего тумана.

Названные препаративные формы могут быть получены известным способом, например смешиванием действующих веществ по меньшей мере с одним обычным разбавителем, растворителем, эмульгатором, диспергатором и/или вяжущим веществом или фиксирующим средством, смачивателем, водным репеллентом, при необходимости, сиккативом и UV-стабилизаторами и, при необходимости, красителем и пигментом, пеногасителем, консервантом, вторичным сгустителем, клеящим веществом, гиббереллинами, а также другими технологическими добавками.

Средства согласно изобретению могут содержать не только препаративные формы, которые уже готовы к применению и с помощью специального оборудования могут быть нанесены на растения или семенной материал, а также имеющиеся в продаже концентраты, которые перед применением необходимо разбавлять водой.

Действующие вещества согласно изобретению могут присутствовать в чистом виде или в виде их (обычных) смесей, а также полученных из этих препаративных форм формах применения в смесях с другими (известными) действующими веществами, как инсектициды, аттрактанты, стерилианты, бактерициды, акарициды, нематоциды, фунгициды, регуляторы роста, гербициды, удобрения, защитные средства или семиохемикалии.

Обработку согласно изобретению растений и частей растений действующими веществами или средствами осуществляют непосредственным применением или воздействием на окружающую среду, среду обитания или место хранения обычными методами обработки, например окунанием, (разбрызгивание) опрыскиванием, распылением, орошением, распылением жидкости, пульверизацией, опыливанием, (рассеиванием) осыпанием, вспениванием, обмазыванием, предварительное промазывание, поливом (сплошным поливом), капельным орошением также на материал размножения растений, в частности семян, далее с помощью сухого протравливания, мокрого протравливания, травления в растворах, нанесения слоя, нанесения одной или нескольких оболочек и т.д. Далее можно наносить действующие вещества с помощью способа ультрамалого объема или впрыскивать раствор действующих веществ или само действующее вещество в почву.

Как также описано ниже, обработка трансгенного семенного материала действующими веществами или средствами согласно изобретению имеет особое значение. Это касается семенного материала растения, которые содержат по меньшей мере один гетерологичный ген, который способствует экспрессии полипептида или протеина с инсектицидными свойствами. Гетерологичный ген в трансгенном семенном материале может происходить, например, из микроорганизмов вида *Bacillus*, *Rhizobium*, *Pseudomonas*, *Serratia*, *Trichoderma*, *Clavibacter*, *Glomus* или *Gliocladium*. Предпочтительно этот гетерологичный ген происходит из *Bacillus* sp., причем генный продукт обладает действием против кукурузной огневки

(European corn borer) и/или западного кукурузного корневого жука. Особенно предпочтительно гетерологичный ген происходит из *Bacillus thuringiensis*.

В рамках настоящего изобретения средство согласно изобретению отдельно или в виде подходящей препаративной формы наносят на семенной материал. Предпочтительно семенной материал обрабатывают в том состоянии, в котором он является стабильным, чтобы не возникали повреждения во время обработки. В общем обработку семенного материала можно проводить в любой момент между уборкой урожая и посевом. Обычно используют семенной материал, который не имеет дополнительно частей растений, початков, кожуры, стеблей, оболочек, волосков или мякоти плода. Так, например, может быть использован семенной материал, который собрали, очистили и высушили до содержания влаги менее 15 мас.%. Также альтернативно может быть использован семенной материал, который, например, после высушивания обработали водой и затем снова высушили.

В общем, во время обработки семенного материала нужно обращать внимание на то, чтобы выбирать количество наносимого на семенной материал средства согласно изобретению и/или другие добавки не вредили прорастанию семян или не наносили вред выросшим из них растениям. Это прежде всего принимают во внимание при использовании тех действующих веществ, которые при определенной норме расхода могут оказывать фитотоксичный эффект.

Средства согласно изобретению можно наносить в чистом виде, т.е. без содержания других компонентов и без разбавления водой. Как правило, предпочтительным является нанесение средств на семенной материал в виде подходящих препаративных форм. Подходящие препаративные формы и способы обработки семенного материала известны специалисту и описаны, например, в следующих документах: US 4272417 A, US 4245432 A, US 4808430, US 5876739, US 2003/0176428 A1, WO 2002/080675 A1, WO 2002/028186 A2.

Применяемые согласно изобретению действующие вещества можно превращать в обычные препаративные формы протравителей, как растворы, эмульсии, суспензии, порошки, пены, затравочные суспензии или другие оболочечные массы для семенного материала, а также ULV-препаративные формы.

Эти препаративные формы получают известным способом, например при смешивании действующих веществ с обычными добавками, как, например, обычными разбавителями, а также растворителями или наполнителями, красителями, смачивателями, диспергаторами, эмульгаторами, пеногасителями, консервантами, вторичными сгустителями, клеящим веществом, гиббереллинами и также водой.

В качестве красителей, которые могут присутствовать в применяемых согласно изобретению препаративных формах протравителей, принимают во внимание все обычные для такой цели красители. При этом могут быть использованы как плохо растворимые в воде пигменты, так и растворимые в воде красители. В качестве примеров должны быть названы известные красители родамин Б, С.І. пигмент красный 112 и С.І. сольвент красный 1.

В качестве смачивателей, которые могут присутствовать в применяемых согласно изобретению препаративных формах протравителей, принимают во внимание все обычные для смачивания препаративных форм агрохимических веществ вещества. Предпочтительно используют алкилнафталинсульфонаты, как диизопропил- или диизобутил-нафталинсульфонаты.

В качестве диспергаторов и/или эмульгаторов, которые могут присутствовать в применяемых согласно изобретению препаративных формах протравителей, принимают во внимание все обычные для такой препаративной формы неионные, анионные и катионные диспергаторы. Предпочтительно применяют неионные или анионные диспергаторы или смеси неионных или анионных диспергаторов. В качестве подходящих неионных диспергаторов, в частности, следует назвать блок-сополимеры этиленоксид-пропиленоксида, алкилфенолполигликолевые эфиры, а также тристирилфенолполигликолевый эфир и их фосфатированные или сульфатированные производные. Подходящими анионными диспергаторами, в частности, являются лигнинсульфонаты, соли полиакриловой кислоты и формальдегидные конденсаты арилсульфоната.

В качестве пеногасителей, которые могут присутствовать в применяемых согласно изобретению препаративных формах протравителей, принимают во внимание все обычные препятствующие вспениванию вещества для препаративной формы агрохимических веществ. Предпочтительно применяют силиконовые пеногасители и стеарат магния.

В качестве консервантов в применяемых согласно изобретению препаративных формах протравителей могут присутствовать все подходящие для этой цели, применяемые в агрохимических средствах вещества. Например, должны быть названы дихлорофен и гемиформаль бензилового спирта.

В качестве вторичных сгустителей, которые могут присутствовать в применяемых согласно изобретению препаративных формах протравителей, принимают во внимание все применяемые для такой цели в агрохимических средствах вещества. Предпочтительно принимают во внимание производные целлюлозы, производные акриловых кислот, ксантан, модифицированные глины и высокодисперсную кремниевую кислоту.

В качестве клеящих веществ, которые могут присутствовать в применяемых согласно изобретению препаративных формах протравителей, принимают во внимание все применяемые для такой цели в протравителях вяжущие вещества. Предпочтительно должны быть названы поливинилпирролидон, поливи-

нилацетат, поливиниловый спирт и тилоза.

Применяемые согласно изобретению препаративные формы протравителей можно применять или в чистом виде, или после предварительного разбавления водой для обработки семенного материала разного вида, также семенного материала трансгенных растений. При этом при взаимодействии с веществами, образовавшимися в результате экспрессии, также могут возникать дополнительные синергические эффекты.

Для обработки семенного материала применяемыми согласно изобретению препаративными формами протравителей или полученными из них с помощью добавления воды композициями обычно принимают во внимание все применяемые для протравливания смесители. В частности, при протравливании семенной материал помещают в мешалку, добавляют соответствующее необходимое количество препаративных форм протравителя или в чистом виде, или после предварительного разбавления водой и перемешивают до равномерного распределения препаративной формы на семенном материале. При необходимости, также присоединяют процесс высушивания.

Действующие вещества согласно изобретению при хорошей совместимости с растениями, отсутствии токсичности для теплокровных животных и хорошей экологической совместимости подходят для защиты растений и органов растений, для увеличения количества урожая, улучшения качества собранного урожая. Предпочтительно их можно применять в качестве средств защиты растений. Они оказывают действие на виды с нормальной чувствительностью и устойчивые виды, а также действуют на всех или отдельных стадиях развития.

В качестве растений, которые можно обрабатывать согласно изобретению, следует назвать следующие основные культивируемые растения: кукуруза, соевые бобы, хлопок, семена масличных культур Brassica, как Brassica napus (например, канола), Brassica rapa, B. juncea (например, горчица полевая) и Brassica carinata, рис, пшеница, сахарная свекла, сахарный тростник, овес, рожь, ячмень, просо, тритикале, лён, виноград и различные фрукты и овощи разных ботанических классов, как, например, Rosaceae sp. (например, семечковые плоды, как яблони и груши, а также такие косточковые плоды, как абрикосы, вишня, миндаль и персики, и садово-ягодные культуры, как земляника), Ribesioideae sp., Juglandaceae sp., Betulaceae sp., Anacardiaceae sp., Fagaceae sp., Moraceae sp., Oleaceae sp., Actinidaceae sp., Lauraceae sp., Musaceae sp. (например, банановые деревья и плантации), Rubiaceae sp. (например, кофе), Theaceae sp., Sterculiaceae sp., Rutaceae sp. (например, лимоны, апельсины и грейпфруты); Solanaceae sp. (например, томаты, картофель, перец, баклажаны), Liliaceae sp., Compositae sp. (например, салат, артишок и салатный сорт цикория, включая корневой цикорий, цикорий-эндивий или обычный цикорий), Umbelliferae sp. (например, морковь, петрушку, черешковый сельдерей и сельдерей корневой), Cucurbitaceae sp. (например, огурцы, включая огурцы для маринования, тыкву, арбуз, бутылочную тыкву и дыню), Alliaceae sp. (например, зеленый лук и репчатый лук), Cruciferae sp. (например, белокочанная капуста, краснокочанная капуста, брокколи, цветная капуста, цветная капуста, брюссельская капуста, пак-чой, кольраби, редис, хрен, кресс-салат и китайская капуста), Leguminosae sp. (например, арахис, горох и бобовые, как, например, вьющаяся фасоль и бобы), Chenopodiaceae sp. (например, свекла столовая листовая, кормовая свекла, шпинат, красная свекла), Malvaceae (например, окра), Asparagaceae (например, спаржа); полезные и декоративные растения в саду и лесу; а также соответственно генетически модифицированные виды этих растений.

Как упоминалось выше, согласно изобретению можно обрабатывать все растения и их части. В предпочтительной форме выполнения обрабатывают дикорастущие или полученные с помощью традиционных методов разведения, как скрещивание или синтез протопластов, растения и растения, а также их части. В другой предпочтительной форме выполнения обрабатывают трансгенные растения и растения, которые получили с помощью генно-технологических методов, при необходимости, в комбинации с традиционными методами (генетически модифицированные организмы), и их части. Понятие "части" или "части растений" упоминалось выше. Особенно предпочтительно обрабатывают растения согласно изобретению соответственно обычных или используемых сортов растений. Под сортами растений понимают растения с новыми свойствами ("Traits"), которые были получены как с помощью традиционных методов разведения, с помощью мутагенеза, так и с помощью рекомбинантных ДНК-технологий. Это могут быть сорта, породы, био- и генотипы.

Способы согласно изобретению можно применять для обработки генетически модифицированных организмов (ГМО), например растений или семян. Генетически модифицированные растения (или трансгенные растения) это такие растения, у которых один гетерологичный ген стабильно интегрирован в геном. Понятие "гетерологичный ген" означает в основном ген, который получен или асемблирован вне растения и который при введении в геном ядра клетки растения, геном хлоропласта или геном митохондрии трансформируемого растения придает ему новые или улучшенные агрохимические или подобные свойства, благодаря экспримированию нового необходимого протеина или полипептида или перепрограммированию или отключению другого гена, который присутствует в растении, или других генов, которые присутствуют в растении (например, с помощью антисмысловых технологий, косупрессионных технологий или технологий РНК-интерференции [РНК-интерференция]). Гетерологичный ген, который присутствует в геноме, также называют трансгеном. Трансген, который определен его особым располо-

жением в геноме растения, называют трансформационным или трансгенным событием.

В зависимости от видов или сортов растений, места их произрастания и их условий роста (почвы, климата, периода вегетации, питания) обработка согласно изобретению также может приводить к сверх-аддитивным ("синергическим") эффектам. Так, например, возможны следующие, превосходящие ожидаемые эффекты: уменьшение норм расхода, и/или расширение спектра воздействия, и/или усиление эффективности применяемых согласно данному изобретению действующих веществ и препаративных форм, которые можно применять согласно изобретению, лучший рост растений, повышенная толерантность к высоким и низким температурам, повышенная толерантность к сухости или к содержанию воды и солей в почве, повышенная продуктивность цветения, облегчение уборки урожая, ускорение созревания, повышение размеров урожая, более крупные плоды, большие размеры растений, окраска листьев более глубокого зеленого цвета, более раннее цветение, улучшенное качество и/или повышенная пищевая ценность продукта урожая, более высокое содержание сахаров во фруктах, повышенная устойчивость при хранении и/или обрабатываемость продукта урожая.

К растениям и сортам растений, которые можно предпочтительно обрабатывать согласно изобретению, относят все растения, которые обладают определенным наследственным материалом, который придает этим растениям особенно предпочтительные, полезные признаки (неважно, вызвано ли это традиционным разведением и/или биотехнологией).

Примерами устойчивых к нематодам растениям являются, например, следующие растения, описанные в патентных заявках США: 11/765491, 11/765494, 10/926819, 10/782020, 12/032479, 10/783417, 10/782096, 11/657964, 12/192904, 11/396808, 12/166253, 12/166239, 12/166124, 12/166209, 11/762886, 12/364335, 11/763947, 12/252453, 12/209354, 12/491396 и 12/497221.

Растения, которые могут быть обработаны согласно данному изобретению, представляют собой гибридные растения, которые как раз экспримируют свойства гетерозиса, соответственно гибридного эффекта, что, как правило, ведет к более высокой урожайности, более высокому росту, лучшему здоровью и лучшей устойчивости по отношению к биотическим и абиотическим стрессовым факторам.

Такие растения создают типичным образом в результате того, что воспитанную родительскую линию со стерильной пылью (женский партнер при скрещивании) скрещивают с другой воспитанной родительской линией с фертильной (репродуктивной) пылью (мужской партнер при скрещивании). Гибридный семенной материал получают типичным образом от растений со стерильной пылью и продают тем, кто занимается их дальнейшим размножением. Растения со стерильной пылью иногда могут быть получены (например, в случае кукурузы) в результате удаления метелок (т.е. механического удаления мужских половых органов, соответственно соцветий); однако более распространено, когда стерильность пыльцы связана с генетическими детерминантами в геноме растения. В этом случае, в частности, когда семена являются желательным продуктом, урожай которого хотят получить от гибридных растений, обычно полезно убедиться в том, что полностью восстановлена фертильность (репродуктивность) пыльцы в гибридных растениях, которые содержат генетические детерминанты, отвечающие за стерильность пыльцы. Этого можно добиться, используя при скрещивании таких мужских партнеров, которые содержат соответствующие гены, восстанавливающие фертильность (репродуктивность), которые обладают способностью восстановления фертильности пыльцы в гибридных растениях, содержащих генетические детерминанты, отвечающие за стерильность пыльцы. Генетические детерминанты, отвечающие за стерильность пыльцы, могут локализоваться в цитоплазме. В качестве примеров цитоплазматической стерильности пыльцы (CMS) описаны, например, виды рода брассика (*Brassica*). Генетические детерминанты стерильности пыльцы могут также локализоваться в геноме ядра клетки. Растения со стерильной пылью могут быть также получены методами биотехнологии растений, такими как генные технологии. Особенно благоприятное средство для создания растений со стерильной пылью описано в WO 89/10396, причем, например, экспримируют одну рибонуклеазу, такую как *Barnase selektiv* в *Tarpetum*-клетках в опылительных листьях. Фертильность можно также восстановить в результате экспрессии ингибитора рибонуклеазы, такого как *Barstar* в *Tarpetum*-клетках.

Растения или сорта растений (которые могут быть получены методами биотехнологии растений, такими как генные технологии), которые могут быть обработаны согласно данному изобретению, являются растениями, толерантными к гербицидам, т.е. растениями, которые выращены толерантными по отношению к одному или нескольким заданным гербицидам. Такие растения могут быть получены или в результате генетической трансформации, или в результате селекции растений, которая включает одну мутацию, обеспечивающую такую толерантность к гербицидам.

К толерантным к гербицидам растениям относятся, например, растения, толерантные к глифосату, т.е. растения, выращенные толерантными по отношению к гербициду глифосату или к его солям. Растения могут стать толерантными к глифосату с помощью различных методов. Так могут быть получены, например, толерантные к глифосату растения в результате трансформации растения с помощью гена, который кодирует энзим 5-энолпирувилшикимат-3-фосфатсинтазу (EPSPS). К примерам таких EPSPS-генов относятся *AgoA*-ген (мутант CT7) бактерии *Salmonella typhimurium* (Comai et al., 1983, *Science*, 221, 370-371), CP4-ген бактерии *Agrobacterium* sp., (Barry et al., 1992, *Curr. Topics Plant Physiol.* 7, 139-145), гены, которые кодируют один EPSPS из петунии, один EPSPS из томатов (Shah et al., 1986, *Sci-*

ence 233, 478-481), и один EPSPS из томата (Gasser et al., 1988, J. Biol. Chem. 263, 4280-4289) или один EPSPS из элеusine (WO 01/66704). Может иметься в виду и мутированный EPSPS. Толерантные к глифосату растения могут быть получены также в результате того, что экспримируют ген, который кодирует энзим глифосат-оксидоредуктазы. Толерантные к глифосату растения можно также получить в результате того, что экспримируют ген, который кодирует энзим глат-ацетилтрансферазы. Толерантные к глифосату растения можно также получить в результате того, что селекционируют растения, которые содержат естественно встречающиеся в природе мутации упомянутых выше генов. Растения, которые экспримируют EPSPS ген, который придает толерантность к глифосату, описаны. Растения, которые экспримируют другой ген, который придает толерантность к глифосату, например ген декарбоксилазы, описаны.

К другим устойчивым к гербицидам растениям относятся, например, растения, которые выращены толерантными к гербицидам, ингибирующим энзим глутаминсинтазы, таким как биалафос, фосфинотрицин или глюфосинат. Такие растения могут быть получены в результате того, что экспримируют энзим, который обезвреживает гербицид, или один мутант энзима глутаминсинтазы, устойчивого к ингибированию. Таким эффективным обезвреживающим энзимом является, например, энзим, который кодирует фосфинотрицин-ацетилтрансферазу (такой как, например, бар- или пат-протеин, содержащийся в *Streptomyces* видах) Растения, которые экспримируют экзогенную фосфинотрицин-ацетилтрансферазу, описаны.

К другим толерантным к гербицидам растениям относятся также растения, которые выращены толерантными к гербицидам, ингибирующим энзим гидроксифенилпируватдиоксигеназы (HPPD). В случае гидроксифенилпируватдиоксигеназ имеются в виду энзимы, которые катализируют реакцию, при которой парагидроксифенилпируват (HPP) превращается в гомогентисат. Растения, которые толерантны по отношению к HPPD-ингибиторам, могут быть трансформированы с помощью гена, который кодирует встречающийся в природе резистентный HPPD-энзим, или гена, который кодирует мутированный или химерный HPPD-энзим, как описано в WO 96/38567, WO 99/24585, WO 99/24586, WO 2009/144079, WO 2002/046387 или US 6768044. Толерантности по отношению к HPPD-ингибиторам можно добиться также в результате того, что растения трансформируют с помощью генов, которые кодируют определенные энзимы, способствующие образованию гомогентисата, несмотря на ингибирование нативного HPPD-энзима с помощью HPPD-ингибитора. Такие растения описаны в WO 99/34008 и WO 02/36787. Толерантность растений по отношению к HPPD-ингибиторам можно также улучшить в результате того, что в растениях дополнительно трансформируют ген, который кодирует энзим, толерантный к HPPD, с помощью гена, который кодирует энзим префенатдегидрогеназы, как описано в WO 2004/024928. Кроме того, можно сделать растения более толерантными к HPPD-ингибиторам, если ввести в геном ген, который кодирует энзим, который метаболизирует или разрушает HPPD-ингибитор, как, например, CYP450 энзимы (см. WO 2007/103567 и WO 2008/150473).

К другим растениям, устойчивым к гербицидам, относятся растения, выращенные толерантными по отношению к ингибиторам ацетолактатсинтазы (ALS-ингибиторы). К известным ALS-ингибиторам относятся, например, сульфонилмочевина, имидазолин, триазолопиримидин, пиримидинилокси(тио)-бензоат и/или сульфониламинокарбонилтриазолиноновые гербициды. Известно, что различные мутации в энзиме ALS (также известном как ацетогидроксикислоты-синтаза, AHAS) придают толерантность по отношению к различным гербицидам или группам гербицидов, как, например, описанные в Tranel und Wright (Weed Science, 2002, 50, 700-712). Получение растений, толерантных к сульфонилмочевине, и растений, толерантных к имидазолинону, описано. Другие растения, толерантные к сульфонилмочевине и имидазолинону, также описаны.

Другие растения, толерантные к имидазолинону и/или сульфонилмочевине, могут быть получены в результате индуцированного мутагенеза, селекции клеточных культур в присутствии гербицида или в результате мутационной селекции (см., например, для соевых бобов US 5,084,082, для риса WO 97/41218, для сахарной свеклы US 5,773,702 и WO 99/057965, для салата US 5198599 или для подсолнечника WO 01/065922).

Растения или сорта растений (которые были получены методами растительной биотехнологии, такими как генные технологии), которые также могут быть обработаны согласно данному изобретению, являются толерантными по отношению к абиотическим стрессовым факторам. Такие растения могут быть получены в результате генетической трансформации или в результате селекции растений, которая включает одну мутацию, обеспечивающую такую устойчивость к стрессовым факторам. К особенно полезным растениям с толерантностью по отношению к стрессам относятся следующие:

а) растения, которые содержат трансген, способный понижать экспрессию и/или активность гена отвечающего за поли(ADP-рибоза)полимеразу (PARP) в растительных клетках или в растениях;

б) растения, которые содержат трансген, создающий толерантность к стрессам, который способен понижать экспрессию и/или активность гена, отвечающего за кодирование PARP в растениях или в растительных клетках;

с) растения, которые содержат трансген, создающий толерантность к стрессам, который кодирует функциональный для растений энзим пути биосинтеза никотинамидадениндинуклеотид-сальваже, среди них никотинамидазу, никотинатфосфоррибосилтрансферазу, никотиновой кислоты мононуклеотидаде-

нилтрансферазу, никотинамидадениндинуклеотидсинтазу или никотинамидфосфорибосилтрансферазу.

Растения или сорта растений (которые были получены методами растительной биотехнологии, такими как генные технологии), которые также могут быть обработаны согласно данному изобретению, отличаются измененным количеством, качеством и/или лучшей сохраняемостью при хранении продукта урожая и/или измененными свойствами определенных компонентов продукта урожая, например:

1) трансгенные растения, которые синтезируют модифицированный крахмал, отличающийся измененными физико-химическими свойствами, в частности содержанием амилозы или соотношением амилоза/амилопектин, степенью разветвления, средней длиной цепи, разделением боковых цепей, поведением вязкости, прочностью геля, размерами зерен крахмала и/или морфологией зерен крахмала по сравнению с крахмалом, который синтезирован дикими типами клеток растений или растений, так что этот модифицированный крахмал лучше подходит для некоторых применений;

2) трансгенные растения, которые синтезируют некрахмальные углеводные полимеры или некрахмальные углеводные полимеры, свойства которых по сравнению с дикими типами растений изменены без генетических модификаций. Например, такие растения, которые продуцируют полифруктозу, предпочтительно типа инулина и левана, растения, которые продуцируют альфа-1,4-глюкан, растения, которые продуцируют альфа-1,6-разветвленные альфа-1,4-глюканы, и растения, которые продуцируют альтернан;

3) трансгенные растения, которые продуцируют гиалуронан;

4) трансгенные растения или гибридные растения, как репчатый лук с определенными свойствами как "высокое содержание растворимых твердых веществ" ("high soluble solids content"), незначительная едкость вкуса ("low pungency", LP) и/или длительная стабильность при хранении ("long storage", LS).

Растения или сорта растений (которые были получены методами растительной биотехнологии, такими как генные технологии), которые также могут быть обработаны согласно данному изобретению, представляют собой растения хлопчатника с измененными свойствами волокон. Такие растения могут быть получены в результате генетической трансформации или в результате селекции растений, которые содержат одну мутацию, которая вызывает такие изменения свойств волокон; к ним относятся:

a) растения, такие как растения хлопчатника, которые содержат измененную форму генов целлюлозасинтазы;

b) растения, такие как растения хлопчатника, которые содержат измененную форму gsw2- или гэтл/3-гомологов нуклеиновых кислот; растения хлопчатника, с повышенной экспрессией сахарозафосфатсинтазы;

c) растения, такие как растения хлопчатника, с повышенной экспрессией сахарозасинтазы;

d) растения, такие как растения хлопчатника, у которых изменен момент времени пропускания плазмодесмов у основания клетки волокна, например, в результате регулирования вниз волокон-селективной  $\beta$ -1,3-глюканазы;

e) растения, такие как растения хлопчатника с волокнами с измененной реакционной способностью, например, в результате экспрессии гена N-ацетилглюкозамин-трансферазы, среди них также podC, и гена хитинсинтазы.

Растения или сорта растений (которые были получены методами растительной биотехнологии, такими как генные технологии), которые также могут быть обработаны согласно данному изобретению, представляют собой растения рапса или родственных Brassica-растения с измененными свойствами по составу масла. Такие растения могут быть получены в результате генетической трансформации или в результате селекции растений, которые содержат одну мутацию, которая вызывает такие изменения свойств масла; к ним относятся:

a) растения, такие как растения рапса, которые продуцируют масло с высоким содержанием олеиновой кислоты;

b) растения, такие как растения рапса, которые продуцируют масло с низким содержанием линолевой кислоты;

c) растения, такие как растения рапса, которые продуцируют масло с низким содержанием насыщенных жирных кислот.

Растениями или сортами растений (которые могут быть получены с помощью методов растительных биотехнологий, как генные технологии), которые также могут быть обработаны согласно данному изобретению, являются такие растения, как картофель, который является устойчивым к вирусам, например к вирусу картофеля Y (событие SY230 и SY233 Tecnoplant, Аргентина), или которые являются устойчивыми к таким заболеваниям, как гниль ботвы или клубневая гниль (potato late blight) (например, ген RB), или которые показывают уменьшение сладковатого вкуса, вызванного холодом (который несут гены Nt-Inh, II-INV), или которые показывают фенотип карликовости (ген A-20 оксидаза).

Растения или сорта растений (которые были получены методами растительной биотехнологии, такими как генные технологии), которые также могут быть обработаны согласно данному изобретению, представляют собой растения рапса или родственных Brassica-растений с измененными свойствами расклевывания семян (seed shattering). Такие растения могут быть получены в результате генетической трансформации или в результате селекции растений, которые содержат одну мутацию, которая вызывает

такие измененные свойства, и включает такие растения, как рапс с замедленным или пониженным рас-трескиванием семян.

Особенно полезными трансгенными растениями, которые могут быть обработаны согласно данно-му изобретению, являются растения, с одним трансформирующим событием или комбинацией транс-формирующих событий, которые в США в Службе контроля здоровья животных и растений (Animal and Plant Health Inspection Service (APHIS)) Министерства сельского хозяйства США (United States Department of Agriculture (USDA)) являются предметом предоставленных или находящихся на рассмот-рении прошений нерегулируемого статуса. Информация об этом может быть получена в любое время в APHIS (4700 River Road Riverdale, MD 20737, США), например, на интернет-странице [http://www.aphis.usda.gov/brs/not\\_reg.html](http://www.aphis.usda.gov/brs/not_reg.html). В день подачи этой заявки в APHIS эти прошения являются либо предоставленными, либо находящимися на рассмотрении.

Прошение: Персональный идентификационный номер прошения. Техническое описание событий трансформации, полученных от APHIS, может быть найдено на интернет-странице по номеру прошения. При этом эти описания раскрыты на основании отзывов.

Дополнение прошения: Отзыв о более раннем прошении, для которого требуются дополнение или дополнительные сведения.

Учреждение: Имя лица, подающего прошение.

Предмет регулирования: относящиеся к нему виды растений.

Трансгенный фенотип: свойства ("Trait"), которые получили растения в результате событий транс-формации.

Событие или линии трансформации: название события или событий (иногда также называемых "линия/линии"), для которых требуется нерегулируемый статус.

Документы APHIS: различные документы, которые были опубликованы APHIS относительно про-шения или могут быть получены от APHIS по запросу.

Особенно полезными трансгенными растениями, которые могут быть обработаны согласно данно-му изобретению, являются растения с одним или несколькими генами, кодирующими один или несколь-ко токсинов, трансгенные растения, которые продаются под торговыми названиями: YIELD GARD® (например, кукуруза, хлопчатник, соевые бобы), KnockOut® (например, кукуруза), BiteGard® (например, кукуруза), VT-Xtra® (например, кукуруза), StarLink® (например, кукуруза), Bollgard® (хлопчатник), NucleoTn® (хлопчатник), NucleoTn 33B® (хлопчатник), NatureGard® (например, кукуруза), Protecta® и NewLeaf® (картофель). Толерантными к гербицидам растениями, которые следует упомянуть, являются, например, сорта кукурузы, сорта хлопчатника и сорта соя-бобов, которые продаются под следующими торговыми названиями: Roundup Ready® (толерантность к глифосату, например кукуруза, хлопчатник, соевые бобы), Liberty Link® (толерантность к фосфинотрицину, например рапс), IMI® (толерантность к имидазолинону) и SCS® (толерантность к сульфонилмочевине, например кукуруза). К устойчивым к гербицидам растениям (растениям, традиционно выращенным с толерантностью к гербицидам), которые следует упомянуть, относятся сорта, продаваемые под торговым названием Clearfield® (например, куку-руза).

Особенно полезными трансгенными растениями, которые могут быть обработаны согласно данно-му изобретению, являются растения, в которых произошли события трансформации или комбинация событий трансформации и которые, например, приведены в базе данных различных национальных или региональных ведомств (см., например, [http://gmoinfo.jrc.it/gmp\\_browser.aspx](http://gmoinfo.jrc.it/gmp_browser.aspx) и [http://ceragmc.org/index.php?evidcode=&hstroXCode=&gType=&AbbrCode=&atCode=&stCode=&coIDCode=&action=gmcrop\\_database&mode=Submit](http://ceragmc.org/index.php?evidcode=&hstroXCode=&gType=&AbbrCode=&atCode=&stCode=&coIDCode=&action=gmcrop_database&mode=Submit)).

А. Химические примеры.

Данные ЯМР опубликованных примеров представлены или в классической форме ( $\delta$ -значения, мультиплетность, количество Н-атомов), или в виде так называемых списков ЯМР-пигов. В способах списков, содержащих пики ЯМР, указаны данные ЯМР выбранных примеров в виде списков ЯМР-пигов, причем к каждому сигнальному пику сначала указано  $\delta$ -значение в ч./тыс. (ppm) и затем интенсивность сигнала отдельно через знак пробела. Пара данных  $\delta$ -величина-интенсивность сигнала различных сиг-нальных пигов отделены друг от друга точкой с запятой.

Поэтому список пигов примеров имеет форму:

$\delta_1$  (интенсивность);  $\delta_2$  (интенсивность); ...;  $\delta_i$  (интенсивность); ...;  $\delta_n$  (интенсивность).

Интенсивность четких сигналов находится в отношениях корреляции с высотой сигналов в печат-ном примере спектра ЯМР в см и показывает действительное соотношение интенсивности сигнала. В широких сигналах могут быть представлены несколько пигов или середина сигнала и ее относительная интенсивность по сравнению с самым интенсивным сигналом в спектре.

Для калибровки химического сдвига  $^1\text{H}$ -ЯМР-спектров используют тетраметилсилан и/или химиче-ский сдвиг растворителя, в частности, в случае спектров, которые измеряют в ДМСО. Поэтому в пике списков ЯМР может встречаться тетраметилсилан, но это является необязательным.

Списки пигов  $^1\text{H}$ -ЯМР схожи с классическими печатными списками  $^1\text{H}$ -ЯМР и обычно содержат

все пики, которые упоминают классические ЯМР-интерпретации.

Кроме того, они могут, как и классические печатные списки  $^1\text{H}$ -ЯМР, показывать сигналы растворителей, стереоизомеров необходимых соединений, которые также являются предметом изобретения, и/или пики примесей.

В данных сигналах соединений в дельта-области растворителей и/или воды в  $^1\text{H}$ -ЯМР-пиках показаны обычные пики растворителей, например пики ДМСО в ДМСО- $d_6$  и пик воды, которые в среднем обычно обнаруживают высокую интенсивность.

Такие стереоизомеры и/или примеси могут быть типичными для соответствующих способов получения. Таким образом, их пики могут помогать при распознавании воспроизведения рассматриваемого способа получения при помощи "отпечатков пальцев" побочного продукта.

Эксперт, который оценивает пики необходимых соединений с помощью известных способов (MestreC, ACD-моделирование или с помощью полученных опытным путем, анализируемых ожидаемых значений), по мере необходимости может изолировать пики необходимых соединений, причем, при необходимости, применяя дополнительный фильтр интенсивности. Такое изолирование было бы похоже на упомянутое отображение пиков в классической интерпретации  $^1\text{H}$ -ЯМР.

Другие детали  $^1\text{H}$ -ЯМР пиковых списков можно взять из теоретической базы научных исследований Research Disclosure Database № 564025.

Представленные ниже примеры разъясняют изобретение более подробно.

Промежуточное соединение 1.

Получение 3,5-дифтор-N-гидроксибензолкарбоксимидоилхлорида.

По аналогии с предписанием в WO 2012/130798 для 3,5-дихлор-N-гидроксибензолкарбоксимидоилхлорида получили 3,5-дифтор-N-гидроксибензолкарбоксимидоилхлорид из 3,5-дифторбензальдегида за два этапа.

Промежуточное соединение 2.

Получение метилового эфира 3-(3,5-дифторфенил)-5-метил-4Н-изоксазол-5-карбоновой кислоты.

По аналогии с предписанием в WO 2012/130798 для метилового эфира 3-(3,5-дифторфенил)-5-метил-4Н-изоксазол-5-карбоновой кислоты получили метиловый эфир 3-(3,5-дифторфенил)-5-метил-4Н-изоксазол-5-карбоновой кислоты из 3,5-дифторбензальдегид за три этапа.

Промежуточное соединение 3.

Получение 3-(3,5-дифторфенил)-5-винил-4Н-изоксазол-5-карбоновой кислоты.

По аналогии с предписанием в WO 2012/130798 для 3-(3,5-дихлорфенил)-5-метил-4Н-изоксазол-5-карбоновой кислоты получили 3-(3,5-дифторфенил)-5-метил-4Н-изоксазол-5-карбоновую кислоту путем омыления метилового эфира 3-(3,5-дифторфенил)-5-метил-4Н-изоксазол-5-карбоновой кислоты.

Промежуточное соединение 4.

Получение хлорида 3-(3,5-дифторфенил)-5-метил-4Н-изоксазол-5-карбоновой кислоты.

По аналогии с предписанием в WO 2012/130798 для N-трет-бутил-3-(3,5-дихлорфенил)-5-метил-4,5-дигидро-1,2-оксазол-5-карбоксамиды из 3-(3,5-дифторфенил)-5-метил-4Н-изоксазол-5-карбоновой кислоты с помощью замещения оксалилхлоридом получили хлорид 3-(3,5-дифторфенил)-5-метил-4Н-изоксазол-5-карбоновой кислоты и использовали в качестве исходного продукта без дополнительной очистки.

Промежуточное соединение 5.

Получение метилового эфира 3-(3,5-дифторфенил)-5-(1-гидроксиэтил)-4Н-изоксазол-5-карбоновой кислоты.

19,9 г (104 ммоль) 3,5-дифтор-N-гидроксибензимидаилхлорида (см. Промежуточное соединение 1) растворили в 330 мл 2-пропанола и смешали с 15,0 г метилового эфира (104 ммоль) 3-гидрокси-2-метилбутановой кислоты. После добавления 43,8 г (522 ммоль) гидрокарбоната натрия суспензию нагрели до 50°C и поддерживали температуру в течение 2 ч до полного превращения исходного материала. Суспензию отфильтровали и фильтрат сгустили в вакууме. Полученный остаток поместили в дихлорметан, затем промыли насыщенным раствором хлорида натрия, высушили органические фазы сульфатом натрия и после фильтрования выпарили в вакууме. Полученный таким образом неочищенный продукт поместили в толуол и кристаллизовали добавлением н-гептана. Таким образом, получили 25.5 г (86%) метилового эфира 3-(3,5-дифторфенил)-5-(1-гидроксиэтил)-4Н-изоксазол-5-карбоновой кислоты в виде бесцветных кристаллов.

Диастереоизомер 1:  $^1\text{H}$  ЯМР ( $\text{CDCl}_3$ ):  $\delta = 1.20$  (d, 3H), 2.36 (d, 1H), 3.52 (d, 1H), 3.72 (d, 1H), 3.83 (s, 3H), 4.34 (m, 1H), 6.88 (m, 1H), 7.20 (m, 2H).

Диастереоизомер 2:  $^1\text{H}$  ЯМР ( $\text{CDCl}_3$ ):  $\delta = 1.29$  (d, 3H), 2.12 (d, 1H), 3.58 (d, 1H), 3.68 (d, 1H), 3.83 (s, 3H), 4.23 (m, 1H), 6.88 (m, 1H), 7.20 (m, 2H).

Промежуточное соединение 6.

Получение метилового эфира 3-(3,5-дифторфенил)-5-[1-(трифторметилсульфонилокси)этил]-4Н-изоксазол-5-карбоновой кислоты.

29.9 (105 ммоль) метилового эфира 3-(3,5-дифторфенил)-5-(1-гидроксиэтил)-4Н-изоксазол-5-

карбоновой кислоты охладили в 660 мл дихлорметана до 0°C и смешали с 16.3 г (210 ммоль) пиридина. Затем медленно добавили раствор из 38.6г (137 ммоль) ангидрида трифторметансульфонокислоты в 80 мл дихлорметана. Через 30 мин при 0°C смешали с 300 мл дихлорметана и трижды промыли органическую фазу по 200 мл раствора из насыщенного раствора хлорида натрия и 1н. соляной кислоты (3:1). Затем органическую фазу дважды промыли насыщенным раствором хлорида натрия, высушили сульфатом натрия и удалили растворитель в вакууме. Полученный таким образом исходный продукт использовали на следующем этапе без дополнительной очистки.

Диастереоизомер 1:  $^1\text{H}$  ЯМР ( $\text{CDCl}_3$ ):  $\delta = 1.54$  (d, 3H), 3.44 (d, 1H), 3.89 (s, 3H), 3.94 (d, 1H), 5.49 (q, 1H), 6.91 (m, 1H), 7.20 (m, 2H).

Диастереоизомер 2:  $^1\text{H}$  ЯМР ( $\text{CDCl}_3$ ):  $\delta = 1.59$  (d, 3H), 3.53 (d, 1H), 3.89 (s, 3H), 3.90 (d, 1H), 5.57 (q, 1H), 6.91 (m, 1H), 7.20 (m, 2H).

Промежуточное соединение 7.

Получение метилового эфира 3-(3,5-дифторфенил)-5-винил-4Н-изоксазол-5-карбоновой кислоты.

43.0 г (103 ммоль) неочищенного продукта последнего этапа (метилового эфира 3-(3,5-дифторфенил)-5-[1-(трифторметилсульфонил)этил]-4Н-изоксазол-5-карбоновой кислоты) растворили в 500 мл диметилацетамида и в течение 20 мин по каплям смешивали с раствором из 18.8 г (124 ммоль) DBU в 50 мл диметилацетамида. Реакционную смесь перемешивали 2 ч при комнатной температуре, затем до 1 л добавили холодную как лед 2н. соляную кислоту и дважды экстрагировали по 500 мл диэтилового эфира. Объединенные органические фазы высушили сульфатом натрия, отфильтровали и выпарили в вакууме. После хроматографической очистки на силикагеле с дихлорметаном в качестве элюента исходный продукт перекристаллизовали из циклогексана. Таким образом, получили 23.4 г (85%) бесцветных кристаллов.

$^1\text{H}$  ЯМР ( $\text{CDCl}_3$ ):  $\delta = 3.34$  (d, 1H), 3.84 (s, 3H), 3.93 (d, 1H), 5.38 (d, 1H), 5.55 (d, 1H), 6.14 (dd, 1H), 6.88 (m, 1H), 7.19 (m, 2H).

Промежуточное соединение 8.

Получение 3-(3,5-дифторфенил)-5-винил-4Н-изоксазол-5-карбоновой кислоты.

7.5 г метилового эфира (28.0 ммоль) 3-(3,5-дифторфенил)-5-винил-4Н-изоксазол-5-карбоновой кислоты смешали с 21 мл 2н. натриевого щёлочка и нагревали в течение 8 ч обратным потоком. После охлаждения реакционную смесь промыли этилацетатом, подкислили водную фазу с помощью 2н. соляной кислоты до уровня pH 1, отфильтровали бесцветный осадок и высушили на воздухе. Выход составил 6.8 г, (96%).

$^1\text{H}$  ЯМР ( $\text{CDCl}_3$ ):  $\delta = 3.40$  (d, 1H), 3.92 (d, 1H), 5.00 (dd, 1H), 5.45 (d, 1H), 5.63 (d, 1H), 6.16 (dd, 1H), 6.87-6.93 (m, 1H), 7.16-7.21 (m, 2H).

Промежуточное соединение 9.

Получение хлорида 3-(3,5-дифторфенил)-5-винил-4Н-изоксазол-5-карбоновой кислоты.

2.70 г (10.6 ммоль) 3-(3,5-дифторфенил)-5-винил-4Н-изоксазол-5-карбоновой кислоты добавили в 45 мл дихлорметана, затем добавили три капли диметилформамида (ДМФ) и потом 2.03 г (15.9 ммоль) оксалилхлорида. Наблюдалось активное газообразование. Смесь перемешивали 6 ч при комнатной температуре и затем растворитель и избыток оксалилхлорида выпарили в вакууме. Полученный таким образом исходный продукт использовали на следующем этапе без дополнительной очистки.

Промежуточное соединение 10.

Получение хлорида 3-(3,5-дихлорфенил)-5-метокси-4Н-изоксазол-5-карбоновой кислоты.

282 мг (0.97 ммоль) 3-(3,5-дихлорфенил)-5-метокси-4Н-изоксазол-5-карбоновой кислоты добавили в 10 мл дихлорметана, затем добавили три капли диметилформамида (ДМФ) и затем 185 мг (1.85 ммоль) оксалилхлорида, растворенного в небольшом количестве дихлорметана. Смесь перемешивали 6 ч при комнатной температуре, и реакционную смесь затем выпарили в вакууме. Затем остаток еще дважды смешали с дихлорметаном и выпарили в вакууме. Полученный таким образом исходный продукт использовали на следующем этапе без дополнительной очистки.

Промежуточное соединение 11.

Получение метилового эфира 4-амино-2,5-дигидрофуран-3-карбоновой кислоты.

Метилловый эфир 4-амино-2,5-дигидрофуран-3-карбоновой кислоты может быть получен аналогично описанным в F. Cohen et al., J. Med. Chem. 2011, 54, 3426-3435 методом.

Промежуточное соединение 12.

Получение этилового эфира 4-амино-2,5-дигидрофуран-3-карбоновой кислоты.

Этиловый эфир 4-амино-2,5-дигидрофуран-3-карбоновой кислоты может быть получен аналогично описанным в F. Cohen et al., J. Med. Chem. 2011, 54, 3426-3435 методом.

Промежуточное соединение 13.

Получение метилового эфира 4-аминотетрагидрофуран-3-карбоновой кислоты.

Метилловый эфир 4-аминотетрагидрофуран-3-карбоновой кислоты может быть получен согласно описанным в G.R. Ott et al.; Bioorg. Med. Chem. Lett. 2008, 694-699 методом.

Промежуточное соединение 14.

Получение метилового эфира цис-4-аминотетрагидрофуран-2-карбоновой кислоты гидрохлорида.

Метилвый эфир цис-4-аминотетрагидрофуран-2-карбоновой кислоты гидрохлорид может быть получен согласно описанным в D.P. Walker et al., Synthesis 2011, 1113-1119 методам.

Промежуточное соединение 15.

Получение трет-бутил-N,N'-диизопропилкарбамимидата 2.33 г трет-бутанола и 3.44 г N,N'-диизопропилкарбодиимида смешали в нагретой колбе в атмосфере азота с 27 мг безводного хлорида меди(I), перемешивали при комнатной температуре в течение 2 ч и оставили на три дня.

Этот исходный продукт использовали для переэтерификации в трет-бутиловый эфир и добавляли через впрыскивающий фильтр.

Промежуточное соединение 16.

Получение метилового эфира транс-4-аминотетрагидрофуран-2-карбоновой кислоты гидрохлорида.

Метилвый эфир транс-4-аминотетрагидрофуран-2-карбоновой кислоты гидрохлорид может быть получен из имеющейся в продаже транс-аминокарбонной кислоты с помощью переэтерификации с использованием тионилхлорида/метанола или согласно описанным в Allan, Robin D.; Tran, Hue W. Australian Journal of Chemistry (1984), 37(5), 1123-6 методам из имеющейся в продаже 2,5-ангидро-3-дезоксипентоновой кислоты.

Промежуточное соединение 17.

Получение метилового эфира (4S)-4-амино-4,5-дигидрофуран-2-карбоновой кислоты.

Метилвый эфир (4S)-4-амино-4,5-дигидрофуран-2-карбоновой кислоты может быть получен согласно описанным в Joseph P. Burkhart, Gene W. Holbert, Brian W. Metcalf, Tetrahedron Lett., 25(46), 1984, p. 5267-5270 методам из имеющегося в продаже метилового эфира L-глутаминовой кислоты.

Промежуточное соединение 18.

Получение метилового эфира (4R)-4-амино-4,5-дигидрофуран-2-карбоновой кислоты.

Метилвый эфир (4R)-4-амино-4,5-дигидрофуран-2-карбоновой кислоты может быть получен согласно описанным в Joseph P. Burkhart, Gene W. Holbert, Brian W. Metcalf, Tetrahedron Lett., 25(46), 1984, pp. 5267-5270 методам из имеющегося в продаже метилового эфира D-глутаминовой кислоты.

Пример I-01.

Получение метилового эфира цис-4-[[3-(3,5-дифторфенил)-5-метил-4Н-изоксазол-5-карбонил]амино]тетрагидрофуран-2-карбоновой кислоты.

К 262 мг (1.44 ммоль) Промежуточного соединения 14 в 5 мл дихлорметана добавили 292 мг (2.88 ммоль) триэтиламина, затем при 0°C добавили 250 мг (0.96 ммоль) хлорида карбоновой кислоты (Промежуточное соединение 4) в 6 мл дихлорметана, перемешивали в течение 6 ч при нагревании до комнатной температуры и затем добавили воду. Органическую фазу отделили, высушили сульфатом натрия и выпарили в вакууме. После хроматографии выпаренного остатка на силикагеле (растворитель н-гептан/этилацетат) получили 75 мг (21%) метилового эфира цис-4-[[3-(3,5-дифторфенил)-5-метил-4Н-изоксазол-5-карбонил]амино]тетрагидрофуран-2-карбоновой кислоты.

Пример I-02.

Получение метилового эфира цис-4-[[3-(3,5-дихлорфенил)-5-метокси-4Н-изоксазол-5-карбонил]амино]тетрагидрофуран-2-карбоновой кислоты.

К 249 мг (1.37 ммоль) Промежуточного соединения 14 в 5 мл дихлорметана добавили 277 мг (2.74 ммоль) триэтиламина, затем при 0°C добавили 282 мг хлорида (0.91 ммоль) 3-(3,5-дихлорфенил)-5-метокси-4Н-изоксазол-5-карбоновой кислоты в 5 мл дихлорметана, перемешивали в течение 6 ч при нагревании до комнатной температуры и затем добавили воду. Органическую фазу отделили, высушили сульфатом натрия и выпарили в вакууме. После хроматографии выпаренного остатка на силикагеле (растворитель н-гептан/этилацетат) получили 41 мг (11%) метилового эфира цис-4-[[3-(3,5-дихлорфенил)-5-метокси-4Н-изоксазол-5-карбонил]амино]тетрагидрофуран-2-карбоновой кислоты.

Пример I-03.

Получение метилового эфира цис-4-[[3-(3,5-дихлорфенил)-5-винил-4Н-изоксазол-5-карбонил]амино]тетрагидрофуран-2-карбоновой кислоты.

Исходя из 3,5-дихлорбензальдегида по аналогии с получением Промежуточного соединения 9 сначала получили соответствующий хлорид карбоновой кислоты. Затем его по аналогии с Примером I-02 превратили в целевое соединение.

Таким образом из 317 мг (1.74 ммоль) Промежуточного соединения 14 и 400 мг (1.39 ммоль) хлорида карбоновой кислоты получили 10 мг (2%) метилового эфира цис-4-[[3-(3,5-дихлорфенил)-5-винил-4Н-изоксазол-5-карбонил]амино]тетрагидрофуран-2-карбоновой кислоты.

Пример I-04.

Получение метилового эфира цис-4-[[3-(3-бром-5-метилфенил)-5-метил-4Н-изоксазол-5-карбонил]амино]тетрагидрофуран-2-карбоновой кислоты.

Исходя из 3-бром-5-метилбензальдегида по аналогии с получением Промежуточного соединения 4 прежде всего получили хлорид карбоновой кислоты. Затем его по аналогии с Примером I-02 превратили в целевое соединение.

Таким образом, из 129 мг (0.71 ммоль) Промежуточного соединения 14 и 150 мг (0.47 ммоль) хло-

рида карбоновой кислоты получили 22 мг (11%) метилового эфира цис-4-[[3-(3-бром-5-метил-фенил)-5-метил-4Н-изоксазол-5-карбонил]амино]тетрагидрофуран-2-карбоновой кислоты.

Пример I-05.

Получение метилового эфира цис-4-[[3-(3,5-дихлорфенил)-5-метокси-4Н-изоксазол-5-карбонил]амино]тетрагидрофуран-2-карбоновой кислоты.

Исходя из 3,5-дифторбензальдегида по аналогии с получением Промежуточного соединения 4 сначала получили соответствующий хлорид карбоновой кислоты, который затем по аналогии с Примером I-02 превратили в целевое соединение.

Таким образом, из 247 мг (1.36 ммоль) Промежуточного соединения 14 и 250 мг (0.90 ммоль) хлорида карбоновой кислоты получили 63 мг (18 %) метилового эфира цис-4-[[3-(3,5-дифторфенил)-5-метокси-4Н-изоксазол-5-карбонил]амино]тетрагидрофуран-2-карбоновой кислоты.

Пример I-06.

Получение метилового эфира цис-4-[[3-(3,5-дифторфенил)-5-(трифторметил)-4Н-изоксазол-5-карбонил]амино]тетрагидрофуран-2-карбоновой кислоты.

По аналогии с получением Промежуточного соединения 4 сначала получили соответствующий хлорид карбоновой кислоты, который затем по аналогии с Примером I-02 превратили в целевое соединение.

Таким образом, из 184 мг (1.01 ммоль) Промежуточного соединения 14 и 212 мг (0.67 ммоль) хлорида карбоновой кислоты получили 39 мг (13%) метилового эфира цис-4-[[3-(3,5-дифторфенил)-5-(трифторметил)-4Н-изоксазол-5-карбонил]амино]тетрагидрофуран-2-карбоновой кислоты.

Пример I-07.

Получение метилового эфира цис-4-[[3-(3-фторфенил)-5-винил-4Н-изоксазол-5-карбонил]амино]тетрагидрофуран-2-карбоновой кислоты.

По аналогии с получением Промежуточного соединения 9 сначала получили соответствующий хлорид карбоновой кислоты, который по аналогии с Примером I-02 превратили в целевое соединение.

Таким образом, из 184 мг (1.01 ммоль) Промежуточного соединения 14 и 212 мг (0.67 ммоль) хлорида карбоновой кислоты получили 64 мг (26 %) метилового эфира цис-4-[[3-(3-фторфенил)-5-винил-4Н-изоксазол-5-карбонил]амино]тетрагидрофуран-2-карбоновой кислоты.

Пример I-08.

Получение метилового эфира цис-4-[[3-(3-бром-5-метилфенил)-5-метокси-4Н-изоксазол-5-карбонил]амино]тетрагидрофуран-2-карбоновой кислоты.

По аналогии с получением Промежуточного соединения 4 сначала получили соответствующий хлорид карбоновой кислоты, который по аналогии с Примером I-02 превратили в целевое соединение.

Таким образом, из 184 мг (1.01 ммоль) Промежуточного соединения 14 и 212 мг (0.67 ммоль) хлорида карбоновой кислоты получили 64 мг (26 %) метилового эфира цис-4-[[3-(3-фторфенил)-5-винил-4Н-изоксазол-5-карбонил]амино]тетрагидрофуран-2-карбоновой кислоты.

Пример I-09.

Получение метилового эфира цис-4-[[3-(3,5-дифторфенил)-5-метил-4Н-изоксазол-5-карбонил]амино]тетрагидрофуран-2-карбоновой кислоты.

По аналогии с получением Промежуточного соединения 4 сначала получили соответствующий хлорид карбоновой кислоты, который по аналогии с Примером I-01 превратили в целевое соединение.

Таким образом, из 227 мг (1.24 ммоль) Промежуточного соединения 14 и 216 мг (0.83 ммоль) хлорида карбоновой кислоты получили 79 мг (25%) метилового эфира цис-4-[[3-(3,5-дифторфенил)-5-метил-4Н-изоксазол-5-карбонил]амино]тетрагидрофуран-2-карбоновой кислоты.

Смесь отдельных диастереоизомеров может быть посредством ВЭЖХ разделена на I-15 и I-16.

Пример I-10.

Получение метилового эфира цис-4-[[3-(3,5-дифторфенил)-5-винил-4Н-изоксазол-5-карбонил]амино]тетрагидрофуран-2-карбоновой кислоты.

По аналогии с получением Промежуточного соединения 9 сначала получили соответствующий хлорид карбоновой кислоты, который по аналогии с Примером I-01 превратили в целевое соединение.

Таким образом, из 246 мг (1.35 ммоль) Промежуточного соединения 14 и 228 мг (0.90 ммоль) хлорида карбоновой кислоты получили 110 мг (31%) метилового эфира цис-4-[[3-(3,5-дифторфенил)-5-винил-4Н-изоксазол-5-карбонил]амино]тетрагидрофуран-2-карбоновой кислоты.

Смесь отдельных диастереоизомеров посредством ВЭЖХ разделили на I-11 и I-12.

Пример I-11.

Диастереоизомер 1 из I-10.

Получение метилового эфира цис-4-[[3-(3,5-дифторфенил)-5-винил-4Н-изоксазол-5-карбонил]амино]тетрагидрофуран-2-карбоновой кислоты.

<sup>1</sup>H-ЯМР данные см. в таблице аналитических данных.

Пример I-12.

Диастереоизомер 2 из I-10.

Получение метилового эфира цис-4-[[3-(3,5-дифторфенил)-5-винил-4Н-изоксазол-5-

карбонил]амино]тетрагидрофуран-2-карбоновой кислоты.

<sup>1</sup>H-ЯМР данные см. в таблице аналитических данных.

Пример I-13.

Получение метилового эфира цис-4-[[3-(3-фторфенил)-5-метил-4Н-изоксазол-5-карбонил]амино]-тетрагидрофуран-2-карбоновой кислоты.

По аналогии с получением Промежуточного соединения 4 сначала получили соответствующий хлорид карбоновой кислоты, который по аналогии с Примером I-01 превратили в целевое соединение.

Таким образом, из 169 мг (0.93 ммоль) Промежуточного соединения 14 и 150 мг (0.62 ммоль) хлорида карбоновой кислоты получили 171 мг (75%) метилового эфира цис-4-[[3-(3-фторфенил)-5-метил-4Н-изоксазол-5-карбонил]амино]тетрагидрофуран-2-карбоновой кислоты.

Пример I-14.

Получение метилового эфира цис-4-[(5-метокси-3-фенил-4Н-изоксазол-5-карбонил)амино]-тетрагидрофуран-2-карбоновой кислоты.

По аналогии с получением Промежуточного соединения 10 сначала получили соответствующий хлорид карбоновой кислоты, который по аналогии с Примером I-03 превратили в целевое соединение.

Таким образом, из 247 мг (1.35 ммоль) Промежуточного соединения 14 и 217 мг (0.90 ммоль) хлорида карбоновой кислоты получили 75 мг (23%) метилового эфира цис-4-[(5-метокси-3-фенил-4Н-изоксазол-5-карбонил)амино]тетрагидрофуран-2-карбоновой кислоты.

Пример I-15.

Диастереоизомер 1 из I-09.

Получение метилового эфира цис-4-[[5R)-3-(3,5-дифторфенил)-5-метил-4Н-изоксазол-5-карбонил]амино]тетрагидрофуран-2-карбоновой кислоты.

<sup>1</sup>H-ЯМР данные см. в таблице аналитических данных.

Пример I-16.

Диастереоизомер 2 из I-09.

Метилловый эфир цис-4-[[5R)-3-(3,5-дифторфенил)-5-метил-4Н-изоксазол-5-карбонил]амино]-тетрагидрофуран-2-карбоновой кислоты.

<sup>1</sup>H-ЯМР данные см. в таблице аналитических данных.

Пример I-17.

Получение метилового эфира 3-[[3-(3,5-дифторфенил)-5-метил-4Н-изоксазол-5-карбонил]амино]-тетрагидрофуран-3-карбоновой кислоты.

Сначала получили соответствующий хлорид карбоновой кислоты, который по аналогии с Примером I-01 превратили в целевое соединение.

Таким образом, из 1.57 г (8.66 ммоль) метилового эфира 3-аминотетрагидрофуран-3-карбоновой кислоты- гидрохлорида и 1.50 г (5.77 ммоль) хлорида карбоновой кислоты получили 477 мг (22%) метилового эфира 3-[[3-(3,5-дифторфенил)-5-метил-4Н-изоксазол-5-карбонил]амино]тетрагидрофуран-3-карбоновой кислоты.

Пример I-18.

Получение этилового эфира 3-[[3-(3,5-дифторфенил)-5-метил-4Н-изоксазол-5-карбонил]амино]-тетрагидрофуран-3-карбоновой кислоты.

Указанное в заголовке соединение могло быть получено по аналогии с Примером I-17.

Пример I-19.

Получение метилового эфира 4-[[3-(3,5-дифторфенил)-5-метил-4Н-изоксазол-5-карбонил]амино]-тетрагидрофуран-3-карбоновой кислоты.

Сначала получили соответствующий хлорид карбоновой кислоты, который по аналогии с Примером I-01 с помощью метилового эфира 4-аминотетрагидрофуран-3-карбоновой кислоты превратили в целевое соединение.

Таким образом, из 419 мг (8.66 ммоль) метилового эфира 4-аминотетрагидрофуран-3-карбоновой кислоты и 500 мг (1.92 ммоль) хлорида карбоновой кислоты получили 657 мг (91%) метилового эфира 4-[[3-(3,5-дифтор-фенил)-5-метил-4Н-изоксазол-5-карбонил]амино]тетрагидрофуран-3-карбоновой кислоты.

Пример I-20.

Получение цис-4-[[3-(3-фторфенил)-5-метил-4Н-изоксазол-5-карбонил]амино]тетрагидрофуран-2-карбоновой кислоты.

85 мг (0.24 ммоль) метилового эфира цис-4-[[3-(3-фторфенил)-5-метил-4Н-изоксазол-5-карбонил]амино]тетрагидрофуран-2-карбоновой кислоты сначала смешали с 1 мл 2н. соляной кислоты и оставили на 3 дня при комнатной температуре. Затем реакционную смесь выпарили на ротационном выпарном аппарате. Таким образом, получили 33 мг (40%) цис-4-[[3-(3-фторфенил)-5-метил-4Н-изоксазол-5-карбонил]амино]тетрагидрофуран-2-карбоновой кислоты.

Пример I-21.

Получение цис-4-[[3-(3,5-дифторфенил)-5-винил-4Н-изоксазол-5-карбонил]амино]тетрагидрофуран-2-карбоновой кислоты.

650 мг (1.70 ммоль) метилового эфира цис-4-[[3-(3,5-дифторфенил)-5-винил-4Н-изоксазол-5-карбонил]амино]тетрагидрофуран-2-карбоновой кислоты добавили в 10 мл тетрагидрофурана, при комнатной температуре смешали с 0.64 мл 2н. натриевого щёлочка и перемешивали в течение 6 ч. Затем подкислили соляной кислотой, экстрагировали этилацетатом и высушили органические фазы сульфатом натрия. Путем испарения органической фазы получили 530 мг (83%) цис-4-[[3-(3,5-дифторфенил)-5-винил-4Н-изоксазол-5-карбонил]амино]тетрагидрофуран-2-карбоновой кислоты.

Пример I-22.

Получение метилового эфира цис-4-[[5R)-3-(3,5-дифторфенил)-5-винил-4Н-изоксазол-5-карбонил]амино]тетрагидрофуран-2-карбоновой кислоты.

Указанное в заголовке соединение получили по аналогии с Примером I-01 из 268 мг (0.98 ммоль) соответствующего хлорида карбоновой кислоты и 215 мг (1.48 ммоль) амина (Промежуточное соединение 14).

Таким образом, получили 64 мг (17%) метилового эфира цис-4-[[5R)-3-(3,5-дифторфенил)-5-винил-4Н-изоксазол-5-карбонил]амино]тетрагидрофуран-2-карбоновой кислоты.

Пример I-23.

Получение этилового эфира 4-[[3-(3,5-дифторфенил)-5-винил-4Н-изоксазол-5-карбонил]амино]-2,5-дигидрофуран-3-карбоновой кислоты.

Сначала получили этиловый эфир 4-амино-2,5-дигидрофуран-3-карбоновой кислоты по аналогии с F. Cohen et al., J. Med. Chem. 2011, 54, 3426-3435 из этилового эфира 4-оксотетрагидрофуранкарбоновой кислоты, который затем превратили с помощью соответствующего хлорида карбоновой кислоты (Промежуточное соединение 9) аналогично образцу I-01.

Таким образом, из 230 мг (0.84 ммоль) хлорида карбоновой кислоты и 166 мг (1.05 ммоль) амина получили 52 мг (15%) этилового эфира 4-[[3-(3,5-дифторфенил)-5-винил-4Н-изоксазол-5-карбонил]амино]-2,5-дигидрофуран-3-карбоновой кислоты.

Пример I-24.

Получение этилового эфира 4-[[3-(3,5-дифторфенил)-5-метил-4Н-изоксазол-5-карбонил]амино]-2,5-дигидрофуран-3-карбоновой кислоты.

Сначала получили этиловый эфир 4-амино-2,5-дигидрофуран-3-карбоновой кислоты по аналогии с F. Cohen et al., J. Med. Chem. 2011, 54, 3426-3435 из этилового эфира 4-оксотетрагидрофуранкарбоновой кислоты, который затем превратили с помощью соответствующего хлорида карбоновой кислоты (Промежуточное соединение 4) аналогично образцу I-01.

Таким образом, из 220 мг (0.84 ммоль) хлорида карбоновой кислоты и 166 мг (1.05 ммоль) амина получили 175 мг этилового эфира (53%) 4-[[3-(3,5-дифторфенил)-5-метил-4Н-изоксазол-5-карбонил]амино]-2,5-дигидрофуран-3-карбоновой кислоты.

Пример I-25.

Получение метилового эфира 4-[[3-(3,5-дифторфенил)-5-метил-4Н-изоксазол-5-карбонил]амино]-2,5-дигидрофуран-3-карбоновой кислоты.

Сначала получили метиловый эфир 4-амино-2,5-дигидрофуран-3-карбоновой кислоты по аналогии с F. Cohen et al., J. Med. Chem. 2011, 54, 3426-3435 из метилового эфира 4-оксотетрагидрофуранкарбоновой кислоты, который затем превратили с помощью соответствующего хлорида карбоновой кислоты (Промежуточное соединение 4) по аналогии с предписанием I-01.

Таким образом, из 200 мг (0.77 ммоль) хлорида карбоновой кислоты и 165 мг (1.15 ммоль) амина получили 94 мг (33%) метилового эфира 4-[[3-(3,5-дифторфенил)-5-метил-4Н-изоксазол-5-карбонил]амино]-2,5-дигидрофуран-3-карбоновой кислоты.

Пример I-26.

Получение метилового эфира 4-[[5S)-3-(3,5-дифторфенил)-5-винил-4Н-изоксазол-5-карбонил]амино]тетрагидрофуран-3-карбоновой кислоты.

Сначала получили соответствующий хлорид карбоновой кислоты, который по аналогии с Примером I-01 с помощью метилового эфира 4-аминотетрагидрофуран-3-карбоновой кислоты превратили в целевое соединение.

Таким образом, из 110 мг (0.40 ммоль) хлорида карбоновой кислоты и 88 мг (0.60 ммоль) метилового эфира цис-4-аминотетрагидрофуран-3-карбоновой кислоты получили 7 мг (4%) метилового эфира 4-[[5S)-3-(3,5-дифторфенил)-5-винил-4Н-изоксазол-5-карбонил]амино]тетрагидрофуран-3-карбоновой кислоты.

Пример I-27.

Получение метилового эфира 4-[[3-(3,5-дифторфенил)-5-метокси-4Н-изоксазол-5-карбонил]амино]тетрагидрофуран-3-карбоновой кислоты.

Сначала получили соответствующий хлорид карбоновой кислоты, который по аналогии с Примером I-02 с помощью метилового эфира 4-аминотетрагидрофуран-3-карбоновой кислоты превратили в целевое соединение.

Таким образом, из 112 мг (0.40 ммоль) хлорида карбоновой кислоты и 88 мг (0.60 ммоль) метилового эфира 4-аминотетрагидрофуран-3-карбоновой кислоты получили 28 мг (17%) метилового эфира

4-[[3-(3,5-дифторфенил)-5-метокси-4Н-изоксазол-5-карбонил]амино]тетрагидрофуран-3-карбоновой кислоты.

Пример I-28.

Получение метилового эфира 4-[[3-(3,5-дифторфенил)-5-метил-4Н-изоксазол-5-карбонил]амино]тетрагидрофуран-3-карбоновой кислоты.

По аналогии с получением Промежуточного соединения 4 сначала получили соответствующий хлорид карбоновой кислоты, который в соответствии с Примером I-01 с помощью метилового эфира 4-аминотетрагидрофуран-3-карбоновой кислоты превратили в целевое соединение.

Таким образом из 110 мг (0.42 ммоль) хлорида карбоновой кислоты и 92 мг (0.63 ммоль) метилового эфира 4-аминотетрагидрофуран-3-карбоновой кислоты получили 36 мг (23%) метилового эфира 4-[[3-(3,5-дифторфенил)-5-метил-4Н-изоксазол-5-карбонил]амино]тетрагидрофуран-3-карбоновой кислоты.

Пример I-29.

Получение метилового эфира 4-[[3-(3,5-дихлорфенил)-5-метокси-4Н-изоксазол-5-карбонил]амино]тетрагидрофуран-3-карбоновой кислоты.

Сначала получили соответствующий хлорид карбоновой кислоты (Промежуточное соединение 10), который по аналогии с Примером I-02 с помощью метилового эфира 4-аминотетрагидрофуран-3-карбоновой кислоты превратили в целевое соединение.

Таким образом, из 110 мг (0.35 ммоль) хлорида карбоновой кислоты и 78 мг (0.53 ммоль) метилового эфира 4-аминотетрагидрофуран-3-карбоновой кислоты получили 80 мг (53%) метилового эфира 4-[[3-(3,5-дихлорфенил)-5-метокси-4Н-изоксазол-5-карбонил]амино]тетрагидрофуран-3-карбоновой кислоты.

Пример I-30.

Получение этилового эфира цис-4-[[3-(3-фторфенил)-5-метил-4Н-изоксазол-5-карбонил]амино]тетрагидрофуран-2-карбоновой кислоты.

0.10 г карбоновой кислоты, 85 мг 1-(3-диметиламинопропил)-3-этилкарбодимид гидрохлорида и 4 мг 4-диметиламинопиридина растворили в 5 мл дихлорметана.

После этого при перемешивании при комнатной температуре добавили 68 мг этанола и реакционную смесь перемешивали 8 ч при комнатной температуре и затем в течение ночи.

Реакционную смесь промыли 0.5 М водного раствора соляной кислоты, высушили и сконцентрировали в вакууме. Исходный продукт затем очистили посредством хроматографии. Получили 55 мг этилового эфира (49 % выхода).

Пример I-31.

Получение цис-4-[[3-(3,5-дифторфенил)-5-винил-4Н-изоксазол-5-карбонил]амино]тетрагидрофуран-2-карбоновой кислоты.

0.52 г метилового эфира растворили в 8 мл тетрагидрофурана и охладили до 0°C. К этому раствору по каплям при помешивании добавили раствор 98 мг гидроксида лития в 4 мл воды. В реакционной смеси при помешивании в течение 1 ч установили комнатную температуру. Реакционную смесь разбавили водой, подкислили с помощью 0.5 М водного раствора соляной кислоты и экстрагировали этилацетатом. Затем полученную таким образом фазу этилацетата высушили и сконцентрировали в вакууме.

Исходный продукт для последующей очистки поместили в 2 М водного натриевого щёлока и промыли этилацетатом. После этого водную фазу подкислили 2 М водного раствора соляной кислоты и экстрагировали дихлорметаном. Высушили фазу дихлорметана и сгустили. Получили 0.53 г карбоновой кислоты (84% выхода).

Пример I-32.

Получение изопропилового эфира цис-4-[[3-(3-фторфенил)-5-метил-4Н-изоксазол-5-карбонил]амино]тетрагидрофуран-2-карбоновой кислоты.

0.12 г карбоновой кислоты, 98 мг 1-(3-диметиламинопропил)-3-этилкарбодимид гидрохлорида и 4 мг 4-диметиламинопиридина растворили в 5 мл дихлорметана.

После этого при перемешивании при комнатной температуре добавили 0.41 г 2-пропанола и реакционную смесь перемешивали в течение 1.5 ч при комнатной температуре и затем в течение трех дней.

Реакционную смесь промыли 0.5 М водного раствора соляной кислоты, высушили и сконцентрировали в вакууме. Исходный продукт затем очистили посредством хроматографии.

Получили 82 мг (61% выхода) 2-пропилового эфира.

Пример I-33.

Получение трет-бутилового эфира цис-4-[[3-(3-фторфенил)-5-метил-4Н-изоксазол-5-карбонил]амино]тетрагидрофуран-2-карбоновой кислоты.

0.11 г карбоновой кислоты растворили в 2 мл тетрагидрофурана и осадили в атмосфере азота.

Через впрыскивающий фильтр добавили 0.2 мл трет-бутил-N,N"-диизопропилкарбамидата. Реакционную смесь нагревали в течение 3 ч обратным потоком, охладили и добавили еще 0.2 мл трет-бутил-N,N"-диизопропилкарбамидата. Реакционную смесь возвращали обратно в течение 2 ч и затем охладили до комнатной температуры.

Затем реакционную смесь разбавили этилацетатом и отфильтровали через целит, причем провели повторную промывку дополнительным этилацетатом. Объединенные фильтраты сконцентрировали в вакууме и очистили с помощью колоночной хроматографии. После последующей очистки с помощью ВЭЖХ получили 61 мг трет-бутилового эфира (48 % выхода).

Пример I-34.

Получение бензилового эфира цис-4-[[5RS)-3-(3-фторфенил)-5-метил-4Н-изоксазол-5-карбонил]амино]тетрагидрофуран-2-карбоновой кислоты.

0,10 г карбоновой кислоты, 89 мг 1-(3-диметиламинопропил)-3-этилкарбодиимид гидрохлорида и 4 мг 4-диметиламинопиридина растворили в 5 мл дихлорметана.

После этого при перемешивании при комнатной температуре добавили 0.67 г бензилового спирта и реакционную смесь перемешивали в течение 1.5 ч при комнатной температуре и затем оставили на три дня.

Реакционную смесь промыли 0.5 М водного раствора соляной кислоты, высушили и сконцентрировали в вакууме. Исходный продукт затем очистили посредством хроматографии.

Получили 84 мг (61%) бензилового эфира.

Пример I-35.

Получение этилового эфира цис-4-[[5S)-3-(3,5-дифторфенил)-5-винил-4Н-изоксазол-5-карбонил]амино]тетрагидрофуран-2-карбоновой кислоты.

0.12 г карбоновой кислоты и 8 мг 4-диметиламинопиридина растворили в 5 мл дихлорметана. После этого при перемешивании при комнатной температуре добавили 92 мг 1-(3-диметиламинопропил)-3-этилкарбодиимида гидрохлорида за 0.22 г этанола и реакционную смесь перемешивали в течение 1.5 ч при комнатной температуре и затем оставили при этой температуре на 36 ч.

Реакционную смесь промыли 0.5 М водного раствора соляной кислоты, высушили и сконцентрировали в вакууме. Исходный продукт затем очистили посредством хроматографии.

Получили 82 мг этилового эфира (64% выхода).

Пример I-36.

Получение изопропилового эфира цис-4-[[5S)-3-(3,5-дифторфенил)-5-винил-4Н-изоксазол-5-карбонил]амино]тетрагидрофуран-2-карбоновой кислоты.

0.13 г карбоновой кислоты и 9 мг 4-диметиламинопиридина растворили в 5 мл дихлорметана. После этого при перемешивании при комнатной температуре добавили 104 мг 1-(3-диметиламинопропил)-3-этилкарбодиимида гидрохлорида за 0.33 г 2-пропанола и реакционную смесь перемешивали в течение 1.5 ч при комнатной температуре и затем оставили при этой температуре на 36 ч.

Реакционную смесь промыли 0.5 М водного раствора соляной кислоты, высушили и сконцентрировали в вакууме. Исходный продукт затем очистили посредством хроматографии.

Получили 106 мг 2-пропилового эфира (71% выхода).

Пример I-37.

Получение бензилового эфира цис-4-[[5S)-3-(3,5-дифторфенил)-5-винил-4Н-изоксазол-5-карбонил]амино]тетрагидрофуран-2-карбоновой кислоты.

0.10 г карбоновой кислоты и 0.04 г бензилового спирта растворили в 5 мл дихлорметана. К указанной смеси при перемешивании при комнатной температуре добавили 0.07 г N,N-диизопропилэтиламина за 0.26 г раствора ангидрида пропилфосфоновой кислоты 50%-ного в тетрагидрофуране и реакционную смесь перемешивали в течение 1 ч при комнатной температуре.

Реакционную смесь промыли насыщенным водным раствором гидрокарбоната натрия, высушили и сконцентрировали в вакууме.

Получили 100 мг бензилового эфира (73% выхода).

Пример I-38.

Получение трет-бутилового эфира цис-4-[[5S)-3-(3,5-дифторфенил)-5-винил-4Н-изоксазол-5-карбонил]амино]тетрагидрофуран-2-карбоновой кислоты.

0.13 г карбоновой кислоты растворили в 2 мл тетрагидрофурана и осадили в атмосфере азота.

Через впрыскивающий фильтр добавили 0.2 мл трет-бутил-N,N'-диизопропилкарбамимидата. Реакционную смесь нагревали в течение 3 ч обратным потоком, охладили и добавили 0.2 мл трет-бутил-N,N'-диизопропилкарбамимидата. Реакционную смесь возвращали обратно в течение 2 ч и затем охладили до комнатной температуры.

Затем реакционную смесь разбавили этилацетатом и отфильтровали через целит, причем провели повторную промывку дополнительным этилацетатом. Объединенные фильтраты сконцентрировали в вакууме и очистили с помощью колоночной хроматографии. После последующей очистки с помощью ВЭЖХ получили 84 мг трет-бутилового эфира (54% выхода).

Примеры I-39 и I-40.

Получение метилового эфира (3S)-3-[[3-(3-фторфенил)-5-метил-4Н-изоксазол-5-карбонил]амино]-2,3-дигидрофуран-5-карбоновой кислоты и метилового эфира (2S,4S)-4-[[3-(3-фторфенил)-5-метил-4Н-изоксазол-5-карбонил]амино]-2-метокси-тетрагидрофуран-2-карбоновой кислоты.

0.43 г промежуточного соединения 17 (в качестве гидрохлорида) и 0.42 г карбоновой кислоты рас-

творили в 15 мл дихлорметана. К указанной смеси при перемешивании при комнатной температуре добавили 0.78 мл триэтиламина за 3.34 мл раствора ангидрида пропилфосфоновой кислоты 50%-ного в тетрагидрофуране и реакцию смесь перемешивали 3 ч при комнатной температуре. Реакционную смесь промыли насыщенным водным раствором гидрокарбоната натрия, высушили и сконцентрировали в вакууме. Исходный продукт затем очистили посредством хроматографии.

Получили 40 мг (5% выхода) метилового эфира (3S)-3-[[3-(3-фторфенил)-5-метил-4Н-изоксазол-5-карбонил]амино]-2,3-дигидрофуран-5-карбоновой кислоты, а также 96 мг (13% выхода) метилового эфира (2S,4S)-4-[[3-(3-фторфенил)-5-метил-4Н-изоксазол-5-карбонил]амино]-2-метокси-тетрагидрофуран-2-карбоновой кислоты.

Примеры I-46 и I-47.

Получение метилового эфира (3R)-3-[[3-(3-фторфенил)-5-метил-4Н-изоксазол-5-карбонил]амино]-2,3-дигидрофуран-5-карбоновой кислоты и метилового эфира (2R,4R)-4-[[3-(3-фторфенил)-5-метил-4Н-изоксазол-5-карбонил]амино]-2-метокситетрагидрофуран-2-карбоновой кислоты.

Получение осуществляли аналогично промежуточному соединению 18 (в качестве гидрохлорида) в указанных для примера I-39 и примера I-40 условиях.

Пример I-55.

Получение метилового эфира транс-4-[[5(R)-3-(3,5-дифторфенил)-5-метил-4Н-изоксазол-5-карбонил]амино]тетрагидрофуран-2-карбоновой кислоты.

0.08 г промежуточного соединения 16 и 0.11 г карбоновой кислоты растворили в 5 мл дихлорметана. К указанной смеси при перемешивании при комнатной температуре добавили 0.18 мл триэтиламина за 0.79 мл раствора ангидрида пропилфосфоновой кислоты 50%-ного в тетрагидрофуране и реакцию смесь перемешивали 2 ч при комнатной температуре. Реакционную смесь промыли насыщенным водным раствором гидрокарбоната натрия, высушили и сконцентрировали в вакууме. Исходный продукт затем очистили посредством хроматографии. Получили 90 мг (54% выхода).

Пример I-56.

Получение метилового эфира транс-4-[[5(S)-3-(3,5-дифторфенил)-5-винил-4Н-изоксазол-5-карбонил]амино]тетрагидрофуран-2-карбоновой кислоты.

Получение осуществляли по аналогии с Примером I-55 с использованием 0.08 г Промежуточного соединения 16 и 0.11 г карбоновой кислоты. Получили 110 мг (64% выхода).

#### Аналитические данные Примеров I-01 - I-56

№	NMR
I-01	<sup>1</sup> H-NMR(400.0 MHz, CDCl <sub>3</sub> ): δ = 7.518(1.0);7.260(1.8);7.171(1.8);7.166(2.2);7.162(1.3);7.155(1.2);7.151(2.2);7.146(1.8);6.996(1.0);6.898(0.6);6.883(0.7);6.882(0.7);6.878(1.2);6.876(1.2);6.870(0.6);6.854(0.6);4.578(1.1);4.573(0.7);4.569(1.1);4.560(0.5);4.554(1.6);4.545(1.3);4.530(1.0);4.521(0.8);4.065(0.8);4.052(0.8);4.042(1.3);4.029(1.7);4.017(0.8);4.006(1.1);3.993(1.0);3.967(0.7);3.962(0.7);3.900(0.6);3.896(0.6);3.834(1.4);3.785(1.6);3.773(2.0);3.756(1.8);3.730(2.2);3.712(2.0);3.190(1.9);3.182(2.0);3.146(1.6);3.138(1.8);2.558(0.7);2.541(0.9);2.524(0.8);2.506(0.5);2.019(0.5);1.710(1.3);1.687(1.0);1.541(35.4);0.008(2.1);0.000(68.8);-0.008(1.9)
I-02	<sup>1</sup> H-NMR(400.0 MHz, CDCl <sub>3</sub> ): δ = 7.556(5.0);7.552(6.9);7.552(6.5);7.548(6.3);7.518(1.0);7.438(1.8);7.437(1.6);7.433(3.1);7.432(2.8);7.429(1.5);7.427(1.4);7.268(0.6);7.267(0.7);7.260(105.5);6.996(0.6);5.298(5.7);4.677(0.6);4.671(0.6);4.590(0.8);4.582(1.2);4.574(0.7);4.567(0.8);4.558(1.3);4.551(0.7);4.061(0.6);4.048(0.7);4.045(1.3);4.037(1.4);4.033(1.2);4.024(1.3);4.014(0.6);4.010(0.7);4.000(0.7);3.994(0.8);3.890(1.5);3.848(1.9);3.844(1.9);3.810(15.9);3.802(2.2);3.79

	2(13.4);3.359(13.3);3.355(16.0);3.337(2.2);3.320(1.8);3.291(1.8);3.274(1.6);2.591(0.5);2.573(0.6);2.567(0.5);2.126(0.5);1.538(20.2);0.008(1.3);0.000(42.8);-0.008(1.2)
I-03	<sup>1</sup> H-NMR(400.0 MHz, CDCl <sub>3</sub> ): δ= 7.595(2.6);7.590(2.9);7.526(7.9);7.521(8.3);7.518(2.3);7.448(1.1);7.445(1.4);7.443(1.4);7.419(2.0);7.414(3.2);7.409(1.7);7.259(347.5);6.995(1.9);6.172(1.3);6.145(1.6);6.129(1.6);6.102(1.7);5.556(1.6);5.555(1.8);5.540(1.0);5.513(1.5);5.512(1.5);5.497(0.8);5.355(1.6);5.341(0.8);5.328(1.4);5.314(0.8);5.298(3.5);4.594(0.6);4.587(0.7);4.572(0.8);4.564(0.9);4.556(1.0);4.548(1.0);4.541(0.5);4.533(0.8);4.524(0.8);4.053(1.3);4.040(1.6);4.029(1.4);4.016(1.7);4.008(0.6);4.003(0.8);3.949(0.8);3.924(2.5);3.903(1.3);3.881(2.1);3.860(1.4);3.857(5.2);3.827(5.8);3.814(9.6);3.803(16.0);3.326(1.0);3.318(1.1);3.315(1.0);3.308(1.8);3.301(1.0);3.290(1.0);3.274(0.8);3.265(1.5);2.837(0.7);2.835(0.7);2.526(0.6);2.508(0.5);2.039(0.6);2.004(0.8);1.532(84.5);1.284(0.5);1.256(0.5);0.899(2.5);0.896(2.3);0.884(2.5);0.880(2.3);0.008(4.3);-0.000(146.4);-0.008(3.9)
I-04	<sup>1</sup> H-NMR(400.0 MHz, CDCl <sub>3</sub> ): δ= 8.018(1.1);7.569(1.2);7.518(6.4);7.384(2.3);7.359(2.0);7.322(2.1);7.308(2.4);7.295(2.9);7.259(1071.8);7.252(5.2);7.251(1.9);7.250(1.7);7.249(1.6);7.248(1.4);7.248(1.5);7.247(1.5);7.246(1.5);7.245(1.3);7.244(1.2);7.244(1.2);7.242(1.1);7.241(1.2);7.240(1.2);7.239(1.1);7.236(1.4);7.232(1.6);7.227(1.8);7.221(1.6);7.217(1.8);7.209(2.1);7.194(1.1);7.150(0.6);6.995(5.9);5.298(16.0);4.565(0.8);4.541(0.8);4.419(0.6);4.392(0.6);4.113(0.6);4.043(0.8);3.991(0.9);3.947(0.9);3.825(3.9);3.786(4.3);3.772(4.7);3.760(4.6);3.746(1.4);3.706(1.6);3.633(1.5);3.589(0.6);3.424(2.1);3.203(2.3);3.166(0.9);3.142(0.9);3.129(1.8);3.124(2.2);3.040(2.4);2.992(2.0);2.986(1.8);2.955(11.0);2.884(9.4);2.882(9.4);2.553(0.6);2.352(6.6);2.340(2.6);2.321(1.4);2.221(3.9);2.043(2.2);2.003(1.2);1.714(6.2);1.704(6.4);1.686(6.9);1.676(5.7);1.664(6.0);1.658(6.2);1.495(2.1);1.434(2.5);1.333(1.0);1.284(1.1);1.258(1.9);0.146(1.4);0.008(13.6);0.000(458.9);-0.008(12.8);-0.051(0.7);-0.149(1.4)
I-05	<sup>1</sup> H-NMR(400.0 MHz, CDCl <sub>3</sub> ): δ= 7.518(1.6);7.310(0.5);7.259(217.2);7.227(0.5);7.211(1.3);7.208(1.9);7.205(2.0);7.202(2.0);7.191(2.0);7.188(1.8);7.186(1.9);7.182(1.2);6.995(1.2);6.920(0.7);6.904(0.8);6.898(1.3);6.894(0.7);6.878(0.7);4.678(0.6);4.673(0.6);4.667(0.5);4.591(0.7);4.583(1.3);4.575(0.9);4.568(0.8);4.560(1.4);4.552(0.8);4.071(0.5);4.059(0.7);4.047(1.6);4.037(1.6);4.035(1.6);4.025(1.3);4.015(0.8);4.012(0.8);4.002(0.7);3.998(0.7);3.884(1.8);3.841(1.9);3.838(2.3);3.810(14.7);3.796(2.4);3.790(16.0);3.366(15.8);3.362(15.0);3.343(2.1);3.326(2.2);3.298(1.8);3.280(1.8);2.593(0.5);2.580(0.5);2.573(0.6);2.562(0.6);2.556(0.5);2.552(0.5);2.545(0.5);2.146(0.5);2.128(0.5);2.119(0.5);1.539(11.2);0.008(2.6);0.000(88.3);-0.008(2.4)
I-06	<sup>1</sup> H-NMR(400.0 MHz, CDCl <sub>3</sub> ): δ= 7.261(34.4);7.205(1.5);7.200(2.0);7.196(1.2);7.189(1.2);7.185(1.9);7.180(1.6);6.960(0.8);6.945(0.8);6.939(1.5);6.933(0.7);6.917(0.7);5.298(5.5);4.678(0.5);4.675(0.6);4.663(0.6);4.658(0.5);4.606(0.6);4.598(0.7);4.585(0.8);4.582(0.8);4.577(1.0);4.575(0.8);4.561(0.8);4.554(0.8);4.074(0.7);4.061(0.7);4.050(1.4);4.047(0.6);4.037(1.3);4.035(0.6);4.022(1.2);4.010(1.2);4.000(0.7);3.998(0.8);3.993(1.2);3.987(0.8);3.985(0.7);3.980(0.9);3.969(0.6);3.955(0.6);3.934(1.1);3.910(0.9);3.829(12.4);3.798(16.0);3.752(2.0);3.746(2.3);3.707(1.3);3.701(1.6);2.521(0.5);2.104(0.6);2.099(0.6);2.096(0.6);1.556(6.0);0.000(14.2)
I-07	<sup>1</sup> H-NMR(400.0 MHz, CDCl <sub>3</sub> ): δ= 7.405(0.7);7.404(0.8);7.402(1.0);7.400(1.0);7.398(1.0);7.394(1.4);7.393(1.4);7.388(0.9);7.385(1.5);7.380(5.0);7.377(2.9);7.375(2.0);7.372(2.8);7.368(1.5);7.261(32.6);7.149(0.6);7.143(0.6);7.135(0.8);7.133(0.7);7.127(0.8);7.114(0.5);6.189(1.3);6.163(1.4);6.146(1.5);6.119(1.6);5.562(1.7);5.561(1.7);5.547(1.4);5.545(1.4);5.519(1.5);5.518(1.5);5.504(1.2);5.502(1.2);5.346(1.4);5.345(1.4);5.334(1.2);5.332(1.2);5.320(1.4);5.318(1.4);5.307(1.1);5.305(1.1);5.298(2.9);4.572(0.9);4.564(0.8);4.554(0.9);4.549(0.9);4.545(0.9);4.540(0.7);4.531(0.8);4.521(0.8);4.062(0.8);4.049(0.8);4.044(0.7);4.039(1.2);4.031(0.7);4.026(1.2);4.020(1.0);4.007(0.9);3.952(0.7);3.950(0.7);3.946(2.5);3.926(2.6);3.921(1.0);3.919(0.9);3.903(2.6);3.883(1.9);3.815(13.3);3.796(16.0);3.357(1.6);3.348(1.9);3.314(1.4);3.305(1.6);2.542(0.6);2.531(0.6);2.513(0.5);2.042(0.5);1.572(4.6);0.000(12.8)

I-08	<sup>1</sup> H-NMR(400.0 MHz, CDCl <sub>3</sub> ): δ= 7.613(0.7);7.611(0.8);7.607(1.5);7.605(1.4);7.603(1.4);7.598(0.7);7.596(0.6);7.413(2.8);7.411(3.9);7.409(4.0);7.407(3.5);7.262(34.4);5.298(11.2);4.675(0.6);4.670(0.5);4.667(0.5);4.654(0.5);4.589(0.7);4.580(1.5);4.572(0.8);4.565(0.8);4.557(1.5);4.548(0.8);4.074(0.6);4.063(0.7);4.062(0.7);4.050(1.8);4.039(1.6);4.038(1.6);4.027(1.2);4.014(0.7);4.012(0.7);4.009(0.8);4.006(0.7);3.998(0.6);3.996(0.7);3.992(1.0);3.989(0.9);3.881(1.7);3.841(1.7);3.836(2.1);3.810(14.9);3.795(2.1);3.789(16.0);3.360(2.5);3.355(15.3);3.351(14.7);3.343(2.2);3.315(1.7);3.297(1.8);2.594(0.5);2.576(0.5);2.574(0.5);2.562(0.6);2.363(11.5);2.362(11.5);2.143(0.5);2.136(0.6);2.130(0.5);1.568(4.3);0.000(14.6)
I-09	<sup>1</sup> H-NMR(400.0 MHz, CDCl <sub>3</sub> ): δ= 7.263(29.0);7.172(1.9);7.166(2.3);7.163(1.3);7.155(1.3);7.152(2.2);7.146(1.9);6.900(0.6);6.898(0.6);6.884(0.7);6.882(0.7);6.878(1.3);6.876(1.2);6.872(0.7);6.870(0.6);6.856(0.6);6.854(0.6);5.299(4.4);4.579(1.2);4.574(0.7);4.569(1.2);4.560(0.6);4.554(1.7);4.545(1.4);4.530(0.9);4.521(0.8);4.066(0.7);4.053(0.7);4.042(1.2);4.029(1.7);4.017(0.8);4.006(1.2);3.993(1.1);3.967(0.7);3.963(0.6);3.961(0.6);3.902(0.6);3.900(0.6);3.896(0.6);3.894(0.6);3.834(16.0);3.785(15.8);3.779(0.7);3.774(2.3);3.757(1.9);3.730(2.2);3.714(2.2);3.191(2.0);3.183(1.9);3.148(1.7);3.140(1.7);2.565(0.6);2.559(0.7);2.541(0.9);2.524(0.8);2.122(0.5);2.020(0.5);1.710(10.7);1.687(10.9);1.585(5.6);0.000(11.5)
I-10	<sup>1</sup> H-NMR(400.0 MHz, CDCl <sub>3</sub> ): δ= 7.262(28.6);7.180(2.2);7.174(2.6);7.171(1.5);7.163(1.5);7.160(2.6);7.154(2.1);6.903(0.8);6.887(0.9);6.882(1.6);6.876(0.8);6.860(0.8);6.176(2.0);6.150(2.3);6.133(2.4);6.106(2.5);5.560(1.8);5.558(1.8);5.544(1.7);5.543(1.7);5.517(1.5);5.515(1.5);5.501(1.5);5.500(1.4);5.357(1.6);5.356(1.6);5.343(1.5);5.342(1.5);5.330(1.5);5.329(1.5);5.316(1.4);5.315(1.4);5.299(0.2);4.603(0.5);4.596(0.6);4.591(0.6);4.585(0.6);4.579(0.6);4.574(1.1);4.565(1.2);4.558(1.1);4.550(1.4);4.542(0.9);4.534(0.9);4.525(0.8);4.056(0.8);4.043(0.9);4.041(0.9);4.033(1.3);4.028(0.8);4.020(1.3);4.017(1.4);4.004(1.1);3.950(0.7);3.946(0.7);3.944(0.7);3.929(1.1);3.922(2.7);3.905(0.5);3.899(2.3);3.878(2.2);3.856(2.2);3.814(15.9);3.800(16.0);3.322(1.9);3.313(1.9);3.279(1.6);3.270(1.7);2.566(0.5);2.564(0.5);2.555(0.6);2.549(0.5);2.546(0.5);2.540(0.6);2.538(0.6);2.531(0.6);2.529(0.6);2.514(0.5);2.511(0.6);2.094(0.6);2.060(0.5);2.052(0.5);2.044(0.6);1.577(5.9);0.000(11.4)
I-11	<sup>1</sup> H-NMR(400.6 MHz, CDCl <sub>3</sub> ): δ= 7.494(0.6);7.474(0.6);7.278(0.9);7.184(1.5);7.178(2.0);7.176(1.4);7.167(1.3);7.164(2.0);7.159(1.7);6.906(0.6);6.890(0.7);6.884(1.3);6.879(0.7);6.863(0.6);6.180(1.1);6.153(1.2);6.137(1.4);6.110(1.4);5.560(2.2);5.559(2.2);5.516(1.9);5.516(1.9);5.358(2.1);5.331(2.0);4.622(0.5);4.615(0.6);4.611(0.6);4.608(0.6);4.602(0.6);4.597(0.6);4.562(1.0);4.553(1.2);4.539(1.2);4.530(1.1);4.060(0.9);4.047(1.0);4.036(1.5);4.023(1.4);3.955(1.1);3.951(1.2);3.928(2.9);3.885(2.5);3.801(16.0);3.322(2.3);3.279(2.0);2.569(0.5);2.551(0.6);2.546(0.6);2.534(0.7);2.528(0.6);2.517(0.7);2.511(0.7);2.493(0.6);2.056(0.5);2.050(0.8);2.043(0.6);2.015(0.8);2.009(0.5);0.000(0.8)
I-12	<sup>1</sup> H-NMR(400.6 MHz, CDCl <sub>3</sub> ): δ= 7.461(0.7);7.442(0.7);7.278(0.9);7.184(1.6);7.178(2.0);7.164(2.1);7.159(1.6);6.907(0.6);6.891(0.8);6.885(1.3);6.880(0.7);6.864(0.7);6.179(1.1);6.152(1.3);6.136(1.4);6.109(1.4);5.543(2.3);5.500(2.0);5.344(2.2);5.317(2.1);4.593(0.6);4.587(0.7);4.579(1.6);4.570(1.8);4.563(0.6);4.555(1.5);4.546(1.2);4.043(1.0);4.030(1.0);4.019(1.6);4.006(1.4);3.935(1.2);3.930(1.2);3.905(3.0);3.862(2.6);3.814(16.0);3.331(2.4);3.288(2.1);2.596(0.5);2.579(0.6);2.573(0.6);2.562(0.7);2.555(0.6);2.544(0.7);2.538(0.7);2.521(0.6);2.107(0.6);2.101(0.9);2.095(0.6);2.073(0.5);2.067(0.8);2.060(0.5);1.257(0.5);0.000(0.8)
I-13	<sup>1</sup> H-NMR(400.0 MHz, CDCl <sub>3</sub> ): δ= 7.518(1.2);7.394(1.4);7.389(2.4);7.374(5.0);7.365(4.2);7.358(0.6);7.310(0.7);7.268(1.5);7.265(3.0);7.259(207.2);7.253(1.0);7.252(0.8);7.251(0.6);7.145(0.8);7.140(0.6);7.130(1.0);7.121(0.9);7.113(0.6);7.110(0.6);6.995(1.2);4.577(1.2);4.567(1.1);4.557(0.6);4.553(1.2);4.550(1.2);4.544(1.0);4.540(1.1);4.526(0.9);4.517(0.8);4.072(0.8);4.059(0.8);4.048(1.3);4.035(1.6);4.021(0.8);4.010(1.1);3.997(0.9);3.966(0.7);3.961(0.8);3.896(0.6);3.890(0.6);3.835(14.3);3.800(2.0);3.785(2.1);3.778(16.0);3.762(0.6);3.757(2.3);3.742(2.1);3.223(1.9);3.215(2.1);3.180(1.7);3.172(1.9);2.561(0.8);2.549(0.5);2.543(0.9);2.526(0.9);2.5

	20(0.5);2.509(0.5);2.503(0.5);2.018(0.6);1.983(0.5);1.725(0.6);1.714(1.4);1.708(11.3);1.697(0.7);1.686(10.3);1.666(0.6);1.606(2.7);0.008(2.2);0.000(86.6);-0.008(2.6)
I-14	<sup>1</sup> H-NMR(400.0 MHz, CDCl <sub>3</sub> ): $\delta$ = 7.684(1.6);7.680(2.9);7.677(2.1);7.670(1.0);7.666(1.6);7.665(1.5);7.663(1.6);7.660(2.4);7.656(1.9);7.520(0.6);7.454(0.6);7.452(0.7);7.451(0.8);7.450(0.8);7.442(1.4);7.440(1.6);7.437(5.2);7.432(2.3);7.427(1.0);7.422(1.3);7.418(2.4);7.404(0.8);7.261(43.3);5.298(3.7);4.680(0.5);4.672(0.5);4.590(0.7);4.581(1.3);4.571(0.8);4.567(0.8);4.557(1.3);4.548(0.8);4.081(0.6);4.068(1.0);4.057(1.4);4.055(0.8);4.044(2.0);4.031(1.2);4.018(0.7);4.016(0.7);4.012(0.7);4.009(0.7);3.999(0.6);3.997(0.7);3.992(1.0);3.904(1.9);3.866(1.8);3.858(2.2);3.821(2.2);3.813(14.8);3.783(15.8);3.438(2.2);3.420(2.3);3.393(1.9);3.375(2.5);3.370(16.0);3.364(15.0);2.600(0.8);2.583(0.7);2.577(0.8);2.566(0.6);2.560(0.7);2.146(0.8);2.143(0.6);2.140(0.6);2.137(0.7);2.111(0.7);2.108(0.5);2.105(0.5);2.102(0.6);1.563(9.6);0.008(0.5);0.000(18.3);-0.008(0.5)
I-15	<sup>1</sup> H-NMR(400.0 MHz, CDCl <sub>3</sub> ): $\delta$ = 7.518(1.2);7.259(207.4);7.210(0.6);7.170(1.4);7.165(1.8);7.150(1.7);7.145(1.4);6.995(1.2);6.898(0.6);6.882(0.7);6.876(1.2);6.870(0.6);6.854(0.6);4.581(0.6);4.554(1.2);4.545(1.0);4.530(1.2);4.521(1.0);4.066(0.9);4.052(0.9);4.042(1.5);4.029(1.4);3.968(1.0);3.962(1.1);3.945(0.7);3.786(16.0);3.773(2.3);3.729(2.5);3.182(2.4);3.138(2.1);2.559(0.5);2.540(0.5);2.536(0.6);2.524(0.7);2.518(0.6);2.506(0.7);2.501(0.6);2.483(0.5);2.019(0.8);1.985(0.6);1.710(13.0);1.530(23.7);0.008(2.5);0.000(73.7);-0.008(2.3)
I-16	<sup>1</sup> H-NMR(400.0 MHz, CDCl <sub>3</sub> ): $\delta$ = 7.519(0.5);7.426(0.5);7.260(91.8);7.172(1.4);7.166(1.8);7.152(1.7);7.146(1.4);6.900(0.6);6.884(0.7);6.878(1.2);6.872(0.6);6.856(0.6);4.580(1.3);4.570(1.5);4.556(1.6);4.547(1.3);4.030(1.0);4.017(1.0);4.006(1.4);3.993(1.3);3.901(1.0);3.895(0.9);3.878(0.7);3.871(0.7);3.834(16.0);3.756(2.2);3.713(2.5);3.190(2.4);3.147(2.0);2.599(0.5);2.581(0.6);2.575(0.5);2.564(0.6);2.558(0.6);2.547(0.6);2.541(0.6);2.524(0.6);2.122(0.8);2.087(0.6);1.688(12.8);1.536(5.7);0.008(1.4);0.000(33.1);-0.008(1.1)
I-17	<sup>1</sup> H-NMR(400.0 MHz, CDCl <sub>3</sub> ): $\delta$ = 7.260(62.3);7.217(0.8);7.186(1.3);7.181(2.3);7.178(1.4);7.175(1.5);7.171(1.1);7.167(1.6);7.164(1.3);7.161(2.3);7.155(1.1);6.919(0.5);6.913(0.9);6.897(1.1);6.891(1.8);6.886(0.9);6.876(0.5);6.870(0.9);4.239(1.7);4.215(2.1);4.203(1.6);4.179(1.9);4.012(1.6);4.002(2.5);3.996(1.5);3.993(2.0);3.988(1.1);3.982(2.1);3.977(2.8);3.968(0.9);3.964(0.9);3.946(1.3);3.922(1.1);3.769(1.9);3.760(1.7);3.724(14.8);3.716(2.1);3.706(16.0);3.208(3.1);3.165(2.8);2.624(0.6);2.603(0.5);2.590(0.9);2.584(0.6);2.570(0.6);2.551(0.8);2.252(0.6);2.236(0.5);2.219(0.5);2.190(0.6);2.174(0.6);1.723(14.0);1.547(5.9);0.008(0.7);0.000(23.6);-0.008(0.7)
I-18	<sup>1</sup> H-NMR(400.0 MHz, CDCl <sub>3</sub> ): $\delta$ = 7.262(30.8);7.221(0.9);7.184(1.4);7.178(2.2);7.173(1.6);7.168(1.1);7.164(1.8);7.158(2.1);7.153(1.0);6.917(0.6);6.911(1.0);6.905(0.5);6.895(1.2);6.889(2.0);6.884(1.0);6.874(0.6);6.868(1.0);5.299(2.7);4.230(1.9);4.206(2.9);4.198(1.6);4.190(1.3);4.188(2.9);4.173(4.5);4.170(3.3);4.155(3.8);4.152(1.2);4.137(1.2);4.009(1.5);4.006(1.9);3.997(1.9);3.993(2.0);3.990(1.4);3.982(2.8);3.978(2.6);3.974(1.7);3.962(1.8);3.953(1.2);3.928(1.0);3.776(2.0);3.766(1.6);3.733(2.3);3.723(1.8);3.207(3.2);3.164(2.8);2.625(0.7);2.610(0.5);2.608(0.5);2.592(1.0);2.589(0.9);2.575(0.6);2.573(0.5);2.570(0.5);2.556(1.0);2.245(0.6);2.229(0.5);2.184(0.7);2.168(0.6);2.151(0.6);1.726(16.0);1.215(3.2);1.197(9.0);1.180(10.3);1.162(3.9);0.000(12.2)

I-19	<sup>1</sup> H-NMR(400.0 MHz, CDCl <sub>3</sub> ): δ= 7.263(33.4);7.258(0.6);7.179(0.5);7.174(1.4);7.168(1.8);7.165(2.3);7.159(2.1);7.157(1.5);7.154(2.0);7.148(2.2);7.145(1.7);7.140(1.3);7.040(0.7);7.021(0.7);6.916(0.8);6.910(0.8);6.900(0.8);6.894(1.7);6.888(1.5);6.882(0.6);6.879(0.7);6.872(1.0);6.866(0.8);4.715(0.8);4.710(0.6);4.706(0.8);4.700(0.6);4.696(0.8);4.690(0.5);4.225(0.7);4.203(1.7);4.181(1.8);4.159(0.9);4.149(0.6);4.131(1.6);4.113(1.6);4.095(0.6);4.038(0.9);4.023(0.9);4.014(1.8);4.000(1.8);3.991(1.0);3.976(1.1);3.950(1.0);3.934(1.0);3.927(0.9);3.922(1.0);3.911(0.9);3.907(1.1);3.899(0.9);3.884(0.9);3.792(2.0);3.780(2.0);3.774(0.6);3.772(0.5);3.757(0.9);3.746(16.0);3.741(1.2);3.737(6.0);3.731(1.2);3.725(1.0);3.710(0.6);3.704(0.6);3.691(16.0);3.680(1.1);3.665(0.9);3.656(0.8);3.541(3.0);3.211(2.8);3.188(0.6);3.168(2.4);3.145(0.5);3.007(1.0);2.045(7.1);1.722(10.8);1.715(13.2);1.688(2.5);1.277(2.6);1.264(1.8);1.260(5.3);1.242(2.3);0.899(0.9);0.882(3.1);0.864(1.2);0.000(13.7)
I-20	<sup>1</sup> H-NMR(400.0 MHz, d <sub>6</sub> -DMSO): δ= 8.147(0.6);8.130(0.6);8.087(0.6);8.069(0.6);7.526(2.2);7.524(2.3);7.517(3.2);7.512(2.2);7.498(2.4);7.469(1.1);7.465(0.9);7.349(0.6);7.341(0.6);7.334(0.7);7.326(1.0);7.322(0.9);7.315(0.6);7.308(0.6);7.303(0.7);5.756(5.0);4.380(0.6);4.365(1.4);4.359(0.8);4.349(1.0);4.343(1.5);4.327(0.9);4.318(0.8);4.303(0.8);3.911(0.7);3.895(0.7);3.889(0.9);3.873(0.8);3.868(0.7);3.853(0.7);3.847(0.8);3.831(0.7);3.761(1.3);3.740(1.5);3.717(1.6);3.696(1.9);3.678(0.8);3.671(0.7);3.660(0.8);3.647(0.7);3.638(0.6);3.625(0.6);3.390(1.8);3.385(1.7);3.346(1.9);3.341(2.0);3.322(43.8);2.670(0.6);2.544(0.8);2.524(1.3);2.519(2.0);2.510(32.8);2.506(72.0);2.501(100.7);2.497(70.3);2.492(31.4);2.468(0.8);2.456(1.2);2.451(1.0);2.447(1.1);2.436(0.5);2.425(0.7);2.328(0.6);2.048(0.5);1.979(0.6);1.963(0.6);1.947(0.6);1.567(1.4);1.534(16.0);0.000(1.8)
I-21	<sup>1</sup> H-NMR(400.0 MHz, d <sub>6</sub> -DMSO): δ= 7.428(4.5);7.421(1.4);7.410(3.4);7.404(2.6);7.386(0.6);7.381(0.5);6.160(1.0);6.153(0.9);6.134(1.1);6.126(1.0);6.117(1.2);6.110(1.1);6.091(1.2);6.083(1.0);5.398(2.3);5.396(1.5);5.355(2.1);5.316(2.1);5.288(2.0);4.376(0.6);4.367(0.8);4.360(1.0);4.354(1.0);4.351(1.2);4.346(1.3);4.339(1.0);4.330(1.3);4.314(0.5);4.056(1.0);4.038(3.2);4.020(3.2);4.003(1.1);3.908(0.7);3.893(1.6);3.887(1.0);3.880(1.5);3.871(0.8);3.862(0.6);3.856(0.8);3.849(1.5);3.840(0.8);3.835(1.7);3.667(1.4);3.653(1.3);3.645(1.2);3.631(1.1);3.601(0.6);3.574(3.0);3.530(2.6);3.431(1.9);2.670(0.7);2.524(2.1);2.519(3.0);2.510(39.7);2.506(85.1);2.501(118.3);2.496(82.4);2.492(36.6);2.476(0.6);2.464(0.6);2.453(0.8);2.432(0.6);2.332(0.5);2.328(0.7);2.323(0.5);2.014(0.6);2.005(0.7);1.996(0.6);1.988(16.0);1.973(0.6);1.908(1.7);1.760(0.5);1.356(0.8);1.192(4.1);1.175(8.3);1.157(4.0);0.000(3.8)
I-22	<sup>1</sup> H-NMR(400.0 MHz, CDCl <sub>3</sub> ): δ= 7.262(46.3);7.180(2.1);7.174(2.4);7.171(1.4);7.164(1.4);7.160(2.4);7.154(1.9);6.904(0.8);6.888(0.9);6.882(1.5);6.877(0.7);6.860(0.7);6.176(2.0);6.150(2.2);6.133(2.4);6.106(2.4);5.560(1.8);5.559(1.8);5.544(1.7);5.543(1.7);5.517(1.6);5.516(1.6);5.501(1.5);5.500(1.4);5.358(1.6);5.356(1.6);5.344(1.5);5.342(1.4);5.331(1.4);5.330(1.4);5.317(1.4);5.316(1.4);5.300(2.9);4.586(0.5);4.579(0.6);4.576(1.1);4.566(1.1);4.559(1.1);4.552(1.3);4.543(0.8);4.535(0.9);4.526(0.8);4.056(0.8);4.043(0.9);4.041(0.8);4.033(1.3);4.028(0.8);4.020(1.3);4.017(1.3);4.004(1.1);3.953(0.6);3.951(0.7);3.947(0.7);3.945(0.6);3.930(1.0);3.927(1.0);3.921(2.4);3.899(2.0);3.878(2.2);3.856(2.1);3.814(15.6);3.801(16.0);3.323(1.8);3.313(1.9);3.280(1.6);3.270(1.6);2.556(0.5);2.549(0.5);2.547(0.5);2.541(0.5);2.539(0.6);2.532(0.6);2.530(0.6);2.515(0.5);2.512(0.6);2.095(0.6);2.052(0.6);2.044(0.6);1.569(13.8);0.008(0.6);0.000(18.2);-0.008(0.5)
I-23	<sup>1</sup> H-NMR(400.0 MHz, CDCl <sub>3</sub> ): δ= 7.519(0.6);7.269(0.5);7.268(0.6);7.267(0.7);7.266(0.9);7.266(1.1);7.265(1.4);7.264(1.9);7.263(2.5);7.260(105.9);7.256(1.7);7.255(1.3);7.254(1.0);7.253(0.7);7.252(0.6);7.210(0.9);7.200(1.1);7.195(1.2);7.192(0.7);7.184(0.7);7.181(1.3);7.175(1.1);6.996(0.6);6.896(0.5);6.890(0.9);6.189(0.9);6.162(1.1);6.146(1.2);6.119(1.2);5.647(1.7);5.646(1.7);5.604(1.5);5.603(1.5);5.428(1.6);5.401(1.4);5.299(1.3);5.217(1.1);5.206(2.1);5.194(1.2);4.754(1.1);4.742(2.3);4.732(0.8);4.730(0.9);4.318(0.6);4.301(1.9);4.300(1.9);4.283(2.0);4.283(2.0);4.265(0.7);3.942(1.7);3.898(1.9);3.367(1.6);3.324(1.4);1.539(16.0);1.371(3.2);1.353(6.7);1.335(3.1);0.008(1.1);0.000(41.6);-0.005(0.7);-0.006(0.6);-0.008(1.3)

I-24	<sup>1</sup> H-NMR(400.0 MHz, CDCl <sub>3</sub> ): δ= 10.908(1.1);7.260(57.2);7.210(0.8);7.194(2.0);7.189(2.4);7.178(1.7);7.175(2.4);7.169(1.8);6.907(0.8);6.891(1.0);6.885(1.6);6.879(0.8);6.869(0.5);6.863(0.8);5.299(0.6);5.222(1.3);5.211(2.4);5.205(2.5);5.200(1.6);5.194(1.3);4.757(1.6);4.751(1.9);4.745(2.2);4.741(2.3);4.738(2.0);4.728(1.3);4.324(0.8);4.319(0.8);4.306(2.4);4.301(2.4);4.288(2.5);4.283(2.4);4.270(0.9);4.265(0.8);4.189(0.7);4.171(2.0);4.153(2.0);4.135(0.8);4.121(5.1);3.852(1.4);3.836(2.9);3.820(1.5);3.793(2.8);3.756(8.4);3.750(3.5);3.254(3.0);3.211(2.6);2.655(1.4);2.638(2.6);2.622(1.3);1.777(16.0);1.554(4.9);1.370(5.0);1.352(10.2);1.335(5.0);1.285(2.5);1.267(4.9);1.257(1.0);1.249(2.5);0.008(1.3);0.000(23.4);-0.008(1.1)
I-25	<sup>1</sup> H-NMR(400.0 MHz, CDCl <sub>3</sub> ): δ= 7.266(0.5);7.263(16.6);7.200(1.2);7.196(0.8);7.194(1.3);7.190(0.7);7.183(0.7);7.180(1.4);7.177(0.7);7.174(1.1);6.907(0.5);6.891(0.6);6.885(1.1);6.879(0.5);6.863(0.5);5.300(1.8);5.218(0.6);5.211(0.8);5.207(1.1);5.200(1.3);5.196(0.8);5.189(0.7);4.753(1.0);4.746(1.0);4.743(1.1);4.741(1.3);4.736(1.2);4.734(1.0);4.731(0.9);4.724(0.8);4.120(3.7);3.854(1.3);3.838(2.9);3.822(2.0);3.818(16.0);3.794(1.9);3.756(6.7);3.751(2.3);3.706(7.2);3.257(1.9);3.214(1.7);2.672(1.0);2.656(1.9);2.640(0.9);1.779(10.8);1.574(2.0);0.000(7.0)
I-26	<sup>1</sup> H-NMR(400.0 MHz, CDCl <sub>3</sub> ): δ= 7.520(1.9);7.311(0.9);7.291(0.8);7.261(352.0);7.255(0.8);7.254(0.7);7.210(2.5);7.183(1.3);7.177(1.5);7.174(1.6);7.169(1.5);7.166(1.5);7.163(1.5);7.160(1.3);7.157(1.6);7.155(1.4);7.149(1.1);6.997(2.5);6.977(0.6);6.920(0.8);6.915(0.8);6.904(0.6);6.899(1.6);6.893(1.5);6.887(0.6);6.877(0.8);6.871(0.8);6.181(1.1);6.174(1.0);6.154(1.2);6.147(1.2);6.138(1.2);6.131(1.3);6.111(1.2);6.104(1.2);5.562(1.8);5.561(1.7);5.552(1.7);5.550(1.8);5.519(1.5);5.517(1.6);5.508(1.5);5.507(1.6);5.372(1.5);5.360(1.6);5.344(1.4);5.333(1.5);5.300(2.3);4.729(0.6);4.720(0.7);4.212(1.1);4.190(1.8);4.167(5.4);4.026(0.8);4.019(0.8);4.011(0.8);4.002(1.1);3.995(1.0);3.987(1.1);3.980(0.8);3.943(0.9);3.936(1.9);3.925(2.0);3.921(1.8);3.905(1.6);3.897(0.8);3.893(2.4);3.882(2.8);3.739(16.0);3.717(0.7);3.711(1.3);3.698(15.8);3.687(0.7);3.678(0.6);3.580(1.9);3.336(2.1);3.294(1.8);3.146(0.8);3.128(2.6);3.110(2.6);3.091(0.8);1.628(2.0);1.382(2.6);1.363(5.4);1.345(2.5);1.284(0.6);1.254(0.9);0.008(4.1);0.000(145.8);-0.006(1.2);-0.008(4.2);-0.050(1.2)
I-27	<sup>1</sup> H-NMR(400.0 MHz, CDCl <sub>3</sub> ): δ= 7.262(46.2);7.212(0.8);7.210(1.0);7.204(1.3);7.200(1.1);7.194(0.9);7.190(1.3);7.184(1.1);7.180(0.6);6.909(0.9);6.903(0.8);5.300(3.9);4.258(0.6);4.236(1.0);4.214(0.8);4.035(0.6);4.026(0.8);4.011(0.8);3.936(0.5);3.920(1.0);3.901(1.2);3.874(1.1);3.856(1.4);3.796(0.9);3.788(0.6);3.775(0.6);3.765(0.6);3.758(7.8);3.744(8.3);3.736(3.6);3.719(3.6);3.362(7.7);3.356(6.1);3.354(8.9);3.345(1.2);3.343(0.7);3.337(1.2);3.321(0.5);3.300(1.0);3.292(1.0);1.558(16.0);0.008(0.5);0.000(18.3)
I-28	<sup>1</sup> H-NMR(400.0 MHz, CDCl <sub>3</sub> ): δ= 7.262(57.6);7.179(0.6);7.174(1.0);7.169(1.5);7.165(1.8);7.160(1.6);7.154(1.3);7.149(1.6);7.146(1.2);7.144(0.9);7.140(0.8);6.916(0.6);6.910(0.5);6.901(0.7);6.895(1.2);6.889(1.0);6.879(0.8);6.873(0.8);6.867(0.5);5.300(8.2);4.704(0.5);4.695(0.5);4.202(1.1);4.181(1.2);4.158(0.5);4.038(0.6);4.023(0.6);4.021(0.6);4.014(1.1);3.999(1.2);3.990(0.7);3.976(0.9);3.949(0.6);3.934(0.7);3.926(0.6);3.922(0.7);3.910(0.6);3.906(0.7);3.899(0.5);3.883(0.5);3.790(1.4);3.778(1.3);3.773(0.8);3.755(0.7);3.746(12.8);3.737(6.4);3.730(1.3);3.723(0.5);3.703(0.8);3.695(0.8);3.691(11.2);3.678(0.5);3.662(0.5);3.542(5.0);3.211(1.9);3.188(0.9);3.167(1.6);3.144(0.8);1.722(7.6);1.715(10.9);1.688(4.0);1.563(16.0);0.008(0.7);0.000(23.2);-0.008(0.6)

I-29	<sup>1</sup> H-NMR(400.0 MHz, CDCl <sub>3</sub> ): $\delta$ = 7.558(1.3);7.553(7.2);7.549(10.9);7.544(5.8);7.445(1.8);7.444(1.8);7.440(3.4);7.439(3.2);7.436(2.2);7.263(38.3);7.005(0.6);6.999(0.6);6.990(0.6);5.300(15.8);4.798(0.6);4.789(0.7);4.783(0.8);4.778(0.7);4.774(0.7);4.770(0.5);4.764(0.7);4.257(1.3);4.235(2.0);4.214(1.5);4.050(0.8);4.047(0.9);4.035(0.9);4.033(0.9);4.025(1.2);4.023(1.2);4.011(1.2);3.961(0.9);3.951(1.0);3.945(1.0);3.938(0.9);3.936(1.1);3.927(1.0);3.924(2.0);3.912(0.9);3.906(1.9);3.879(2.1);3.860(2.2);3.806(0.8);3.798(1.1);3.787(1.0);3.783(0.7);3.774(0.9);3.763(0.9);3.757(15.3);3.744(16.0);3.736(3.1);3.722(3.0);3.354(14.7);3.350(4.7);3.347(16.0);3.340(2.4);3.337(0.8);3.332(2.2);3.294(1.9);3.287(1.9);3.077(0.6);3.066(0.8);3.061(0.6);3.056(0.6);3.050(0.8);2.045(0.8);1.575(11.7);1.259(0.6);0.000(15.0)
I-30	<sup>1</sup> H-NMR(400.0 MHz, CDCl <sub>3</sub> ): $\delta$ = 7.394(0.9);7.390(1.4);7.388(1.2);7.374(3.6);7.371(2.6);7.368(2.0);7.366(2.7);7.261(6.8.0);7.144(0.7);7.128(0.7);7.121(0.7);4.548(0.7);4.538(0.7);4.522(0.8);4.512(0.8);4.498(0.7);4.489(0.7);4.296(1.3);4.293(1.3);4.278(1.4);4.275(1.3);4.248(0.9);4.230(2.8);4.213(2.9);4.195(1.0);4.079(0.6);4.065(0.6);4.055(1.0);4.042(0.9);4.034(0.6);4.021(0.6);4.010(0.8);3.997(0.8);3.968(0.6);3.963(0.6);3.802(1.6);3.789(1.4);3.759(1.9);3.746(1.6);3.221(1.5);3.213(1.7);3.178(1.3);3.170(1.5);2.561(0.5);2.526(0.5);1.708(9.2);1.684(8.0);1.554(16.0);1.360(2.8);1.342(5.8);1.325(2.7);1.296(3.2);1.278(6.7);1.260(3.3);0.008(0.7);0.000(24.6);-0.008(0.7)
I-31	<sup>1</sup> H-NMR(400.0 MHz, CDCl <sub>3</sub> ): $\delta$ = 7.520(1.5);7.343(1.5);7.322(1.6);7.305(1.7);7.284(1.9);7.261(268.6);7.179(1.2);7.177(1.2);7.166(5.7);7.164(8.0);7.161(9.1);7.158(8.3);7.147(8.5);7.144(8.8);7.141(7.4);7.139(5.1);7.129(1.0);6.997(1.5);6.906(1.3);6.900(2.2);6.896(1.6);6.890(2.3);6.884(3.3);6.878(4.5);6.874(3.2);6.869(4.3);6.863(3.1);6.857(2.3);6.853(1.6);6.847(2.1);6.841(0.9);6.168(4.3);6.156(4.4);6.141(4.9);6.130(5.1);6.124(5.4);6.113(5.2);6.098(5.5);6.086(5.4);5.544(7.8);5.543(6.8);5.532(7.5);5.531(6.8);5.501(6.8);5.500(6.0);5.489(6.7);5.355(7.2);5.346(7.0);5.328(6.8);5.319(6.4);5.299(16.0);4.609(3.9);4.598(7.8);4.588(5.5);4.585(6.1);4.575(8.8);4.565(5.7);4.553(2.3);4.546(2.1);4.540(1.5);4.527(1.2);4.380(0.5);4.150(1.0);4.132(2.6);4.115(2.7);4.103(3.0);4.097(1.2);4.090(3.0);4.079(7.4);4.066(7.2);4.056(4.9);4.042(4.5);4.012(3.1);4.007(3.1);3.988(2.1);3.983(4.6);3.976(3.1);3.958(1.9);3.952(1.8);3.926(7.3);3.915(7.6);3.884(8.4);3.872(8.6);3.698(0.6);3.332(7.6);3.325(7.6);3.289(6.6);3.282(6.7);2.681(1.5);2.664(1.6);2.657(1.6);2.646(2.1);2.640(3.3);2.629(2.0);2.623(3.4);2.616(1.7);2.605(3.7);2.599(1.8);2.588(1.8);2.582(1.8);2.564(1.6);2.226(1.3);2.219(2.1);2.210(1.3);2.192(1.2);2.184(3.0);2.176(3.1);2.167(1.4);2.150(1.1);2.141(1.8);2.133(1.1);2.116(4.1);2.046(10.8);1.432(3.6);1.304(1.2);1.277(5.0);1.265(5.9);1.259(10.0);1.242(3.6);0.899(3.2);0.882(11.0);0.864(4.2);0.008(2.5);0.000(95.7);-0.008(2.8)
I-32	<sup>1</sup> H-NMR(400.0 MHz, CDCl <sub>3</sub> ): $\delta$ = 7.487(0.6);7.466(0.7);7.434(0.6);7.399(1.6);7.395(1.9);7.392(1.6);7.388(1.8);7.383(1.7);7.380(1.8);7.375(5.0);7.372(5.4);7.370(5.0);7.366(5.9);7.360(2.1);7.357(2.4);7.261(5.8.8);7.149(0.5);7.146(0.6);7.139(1.0);7.134(0.9);7.126(1.2);7.122(1.1);7.119(1.2);7.113(1.0);7.107(0.9);7.102(0.5);5.144(1.2);5.128(1.6);5.112(1.2);5.091(0.5);5.075(1.3);5.060(1.7);5.044(1.3);5.028(0.5);4.602(0.6);4.595(0.9);4.588(1.1);4.582(1.0);4.577(1.1);4.570(1.1);4.563(0.9);4.557(0.7);4.550(0.5);4.503(1.1);4.493(1.2);4.478(1.8);4.468(1.9);4.454(1.3);4.444(1.3);4.082(1.1);4.068(1.1);4.059(1.8);4.045(1.6);4.032(1.1);4.018(1.1);4.008(1.5);3.995(1.4);3.967(1.1);3.961(1.1);3.944(0.8);3.937(0.7);3.889(1.0);3.882(1.0);3.865(0.7);3.859(0.7);3.803(2.8);3.791(2.5);3.760(3.2);3.748(2.9);3.221(2.8);3.212(3.1);3.178(2.4);3.169(2.7);2.599(0.6);2.581(0.6);2.576(0.6);2.565(0.7);2.558(0.7);2.555(0.7);2.547(0.7);2.541(0.7);2.536(0.7);2.531(0.7);2.523(0.7);2.520(0.8);2.513(0.7);2.502(0.7);2.497(0.7);2.478(0.6);2.056(0.7);2.022(0.6);1.958(0.8);1.923(0.7);1.708(16.0);1.685(14.4);1.569(9.5);1.327(7.3);1.314(8.2);1.311(8.4);1.299(7.5);1.290(8.2);1.274(8.0);1.262(0.6);1.255(0.6);1.247(0.5);1.212(8.0);1.196(7.9);0.008(0.6);0.000(19.7);-0.008(0.8)

I-33	<sup>1</sup> H-NMR(400.0 MHz, CDCl <sub>3</sub> ): δ= 7.519(0.7);7.387(0.5);7.373(0.8);7.364(1.0);7.352(0.6);7.260(128.7);6.996(0.7);3.797(0.5);3.754(0.6);3.743(0.5);3.220(0.5);3.211(0.6);3.177(0.5);3.168(0.5);1.918(0.6);1.704(3.4);1.682(3.1);1.540(16.0);1.520(9.8);1.465(10.8);1.369(0.6);1.335(0.6);1.255(0.9);1.134(0.5);1.106(0.5);0.008(1.6);0.000(47.3);-0.008(1.9)
I-34	<sup>1</sup> H-NMR(400.0 MHz, CDCl <sub>3</sub> ): δ= 7.483(0.6);7.464(0.6);7.448(0.6);7.427(0.5);7.402(1.0);7.387(4.8);7.384(4.6);7.376(4.5);7.369(7.4);7.365(7.2);7.352(3.1);7.347(1.8);7.340(1.0);7.331(1.5);7.328(1.1);7.318(1.5.6);7.260(69.1);7.151(0.5);7.142(0.8);7.135(0.8);7.128(1.1);7.123(1.0);7.120(1.4);7.114(1.1);7.108(0.8);7.103(0.5);7.097(0.7);5.304(1.3);5.274(3.0);5.228(3.0);5.197(1.4);5.182(5.2);5.179(5.6);4.591(0.6);4.586(1.6);4.576(1.8);4.566(2.2);4.563(2.0);4.556(2.1);4.553(1.8);4.542(1.6);4.533(1.3);4.091(1.1);4.077(1.1);4.068(1.7);4.054(1.6);4.040(1.0);4.026(1.0);4.016(1.4);4.002(1.3);3.968(1.1);3.961(1.1);3.944(0.7);3.938(0.7);3.897(0.9);3.890(0.9);3.874(0.6);3.866(0.6);3.803(2.8);3.785(2.4);3.760(3.2);3.742(2.7);3.213(2.1);3.210(3.3);3.170(2.4);3.167(2.8);2.602(0.5);2.584(0.6);2.579(0.5);2.568(0.6);2.561(0.6);2.556(0.6);2.550(0.6);2.544(0.7);2.538(0.7);2.533(0.7);2.527(0.6);2.522(0.8);2.515(0.7);2.503(0.7);2.498(0.7);2.480(0.6);2.079(0.7);2.045(0.6);2.019(0.8);1.984(0.7);1.701(16.0);1.647(13.2);1.560(16.4);0.008(0.8);0.000(23.7);-0.008(0.7)
I-35	<sup>1</sup> H-NMR(400.0 MHz, CDCl <sub>3</sub> ): δ= 7.519(1.7);7.477(1.5);7.452(2.5);7.430(1.8);7.260(283.4);7.228(5.0);7.210(0.7);7.173(8.0);7.158(8.0);6.996(1.6);6.901(2.3);6.880(4.7);6.858(2.4);6.175(3.6);6.148(4.0);6.132(4.4);6.105(4.5);5.558(4.5);5.540(5.0);5.515(3.9);5.497(4.4);5.354(4.2);5.335(4.9);5.328(4.3);5.309(4.5);4.595(2.6);4.546(2.4);4.537(2.8);4.530(2.5);4.522(4.5);4.513(2.8);4.507(2.6);4.498(2.3);4.292(2.1);4.274(7.8);4.256(11.6);4.238(7.8);4.221(2.2);4.061(1.8);4.048(2.0);4.038(3.5);4.024(3.5);4.017(3.5);4.004(3.1);3.947(2.4);3.922(8.1);3.900(6.2);3.879(4.8);3.857(5.2);3.320(5.1);3.310(4.6);3.277(4.4);3.267(4.1);2.588(1.1);2.570(1.4);2.564(1.6);2.554(1.7);2.547(1.7);2.536(2.5);2.530(2.1);2.520(1.4);2.512(1.7);2.484(1.2);2.072(2.0);2.031(2.4);1.990(1.5);1.537(40.6);1.350(8.0);1.332(16.0);1.318(9.5);1.314(9.5);1.300(14.6);1.282(7.4);1.258(1.3);0.146(0.5);0.000(103.5)
I-36	<sup>1</sup> H-NMR(400.0 MHz, CDCl <sub>3</sub> ): δ= 7.518(1.5);7.460(2.0);7.435(1.3);7.260(234.7);7.226(0.6);7.211(1.0);7.174(5.8);7.160(5.8);6.996(1.3);6.900(1.5);6.878(3.1);6.856(1.6);6.176(2.8);6.150(3.0);6.133(3.2);6.106(3.4);5.560(3.3);5.544(3.5);5.518(2.9);5.501(3.0);5.354(3.2);5.329(5.3);5.303(3.1);5.142(0.6);5.126(1.5);5.110(2.1);5.102(1.7);5.095(1.8);5.086(2.0);5.071(1.6);5.055(0.6);4.602(2.0);4.502(1.6);4.493(2.0);4.487(1.9);4.478(3.1);4.470(2.0);4.464(1.9);4.455(1.6);4.064(1.3);4.050(1.4);4.040(3.4);4.027(3.4);4.016(2.2);4.003(2.0);3.946(1.9);3.923(5.9);3.901(4.2);3.880(3.4);3.858(3.5);3.320(3.4);3.310(3.4);3.277(3.0);3.267(3.0);2.583(0.8);2.549(1.2);2.531(1.8);2.501(1.2);2.478(0.8);2.026(1.4);1.985(2.1);1.949(1.2);1.536(39.5);1.318(10.2);1.304(16.0);1.298(13.5);1.290(11.4);1.282(11.1);1.256(1.2);1.240(9.5);1.224(9.5);0.000(88.1)
I-37	<sup>1</sup> H-NMR(400.0 MHz, CDCl <sub>3</sub> ): δ= 7.469(0.8);7.448(1.4);7.428(0.8);7.385(3.1);7.383(3.4);7.379(3.7);7.372(9.3);7.359(2.1);7.350(2.5);7.338(3.4);7.332(18.3);7.308(0.6);7.260(75.8);7.192(0.6);7.186(0.7);7.180(2.2);7.174(4.2);7.169(3.1);7.164(2.5);7.159(3.2);7.154(4.1);7.148(2.1);7.142(0.7);6.902(0.9);6.897(0.9);6.891(0.9);6.886(1.3);6.880(1.8);6.875(1.7);6.869(1.7);6.864(1.2);6.859(0.9);6.853(0.9);6.848(0.8);6.168(1.6);6.152(1.6);6.141(1.7);6.125(3.4);6.109(1.9);6.098(1.9);6.082(1.9);5.552(3.0);5.537(2.9);5.509(2.6);5.494(2.5);5.348(2.8);5.321(3.0);5.318(3.1);5.291(2.6);5.274(1.4);5.252(1.5);5.244(4.8);5.220(7.7);5.198(4.8);5.189(1.5);5.167(1.4);4.618(0.8);4.611(1.0);4.604(1.0);4.598(1.3);4.592(1.3);4.585(2.3);4.576(3.4);4.567(2.0);4.562(1.8);4.553(3.0);4.544(1.4);4.074(1.3);4.060(1.2);4.050(2.8);4.036(2.5);4.025(1.9);4.012(1.8);3.954(1.3);3.947(1.3);3.930(2.2);3.921(4.2);3.906(1.0);3.898(3.7);3.878(3.4);3.855(3.3);3.318(3.1);3.306(3.1);3.275(2.7);3.263(2.7);2.590(0.6);2.573(0.7);2.567(0.7);2.560(0.8);2.556(0.9);2.549(0.8);2.542(0.9);2.538(1.3);2.532(0.9);2.526(0.9);2.519(0.8);2.515(0.8);2.508(0.8);2.502(0.8);2.484(0.7);2.072(0.6);2.065(1.0);2.058(0.6);2.051(0.7);2.043(1.1);2.037(1.0);2.022(0.6);2.017(0.6);2.009(0.9);2.002(0.5);1.554(16.0);0.008(1.0);0.000(27.3);-0.008(1.0)
I-38	<sup>1</sup> H-NMR(400.0 MHz, CDCl <sub>3</sub> ): δ= 7.518(16.0);7.454(1.7);7.321(2.2);7.297(3.1);7.260(2792.7);7.230(2.9);7.210(9.5);7.201(2.0);7.177(3.3);7.172(3.7);7.166(4.1);7.160(5.6);7.146(5.5);6.996(15.6);6.898(1.8);6.876(2.8);6.175(3.9);6.148(3.6);6.132(4.2);6.105(3.9);5.559(4.5);5.540(4.0);5.516(4.3);5.497(3.5);5.349(4.3);5.321(6.3);5.293(3.2);4.610(1.9);4.432(1.7);4.423(2.4);4.418(2.3);4.409(3.9);4.399(2.0);4.394(2.5);4.385(2.2);4.065(2.1);4.052(2.5);4.042(3.3);4.028(3.7);4.011(3.4);3.944(2.3);3.915(6.8);3.894(5.0);3.872(6.0);3.852(4.5);3.493(1.9);3.319(4.5);3.308(5.1);3.276(3.8);3.265(4.4);2.535(1.8);2.517(1.8);2.501(2.1);2.481(1.6);1.949(5.4);1.915(4.5);1.713(4.1);1.679(5.0);1.617(2.8);1.593(2.8);1.574(3.2);1.537(678.7);1.505(87.4);1.479(101.8);1.398(2.3);1.369(5.2);1.335(5.1);1.306(3.1);1.254(13.8);1.193(2.0);1.166(3.2);1.135(4.2);1.105(4.8);1.079(4.0);0.880(1.7);0.146(3.5);0.008(31.6);0.000(1031.9);-0.008(30.7);-0.050(3.7);-0.150(3.8)
I-39	<sup>1</sup> H-NMR(400.0 MHz, CDCl <sub>3</sub> ): δ= 7.5181(3.2); 7.3998(1.1); 7.3867(2.5); 7.3811(3.4); 7.3771(3.1); 7.3707(3.0); 7.3616(1.5); 7.3073(0.9); 7.2880(0.9); 7.2592(562.4); 7.2336(0.7); 7.2088(1.0); 7.2001(0.6); 7.1603(1.1); 7.1383(0.9); 7.1308(0.7); 7.1227(0.8); 6.9953(3.6); 5.9486(1.8); 5.9409(1.8); 5.8861(1.1); 5.8789(1.1); 5.2426(0.8); 5.2314(0.6); 5.2211(0.6); 5.2124(0.5); 4.6185(0.6); 4.6035(0.8); 4.5964(0.6); 4.5766(1.0); 4.5539(0.8); 4.3293(0.6); 4.3195(0.6); 4.3024(0.6); 4.2342(1.1); 4.2240(1.1); 4.2074(1.0); 4.1973(0.9); 3.8522(13.3); 3.8423(8.0); 3.8080(1.2); 3.7891(1.8); 3.7649(1.3); 3.7458(2.1); 3.6913(0.6); 3.2485(2.1); 3.2434(1.4); 3.2052(1.8); 3.2001(1.1); 2.4632(1.1); 2.3297(1.0); 1.7155(16.0); 1.7038(0.8); 1.5291(89.5); 1.3237(0.8); 1.3064(0.7); 1.2559(0.7); 0.1460(0.9); 0.0079(6.9); -0.0002(200.7); -0.0084(6.5); -0.1498(0.9)

I-40	<sup>1</sup> H-NMR(599.8 MHz, CDCl <sub>3</sub> ): $\delta$ = 7.4820 (2.4); 7.4684 (2.5); 7.4487 (2.4); 7.4353 (2.4); 7.4046 (1.0); 7.3998 (1.3); 7.3962 (1.2); 7.3915 (4.1); 7.3866 (6.8); 7.3826 (9.1); 7.3816 (9.1); 7.3780 (12.0); 7.3758 (12.0); 7.3717 (12.8); 7.3672 (14.8); 7.3579 (2.5); 7.3553 (2.1); 7.2849 (5.3); 7.1506 (1.4); 7.1462 (2.9); 7.1436 (2.9); 7.1419 (2.6); 7.1381 (2.7); 7.1367 (2.7); 7.1321 (5.0); 7.1279 (4.7); 7.1212 (3.0); 7.1167 (2.7); 7.1124 (1.3); 7.1078 (0.3); 4.6805 (0.5); 4.6718 (1.5); 4.6672 (2.4); 4.6634 (3.0); 4.6594 (3.4); 4.6550 (3.8); 4.6512 (3.5); 4.6473 (2.9); 4.6429 (2.4); 4.6393 (1.7); 4.6298 (0.6); 4.1557 (3.8); 4.1474 (3.9); 4.1401 (4.8); 4.1318 (4.5); 4.1271 (3.8); 4.1185 (3.8); 4.1113 (4.4); 4.1027 (4.1); 4.0077 (0.3); 3.9767 (3.9); 3.9624 (3.1); 3.9614 (3.1); 3.9010 (3.4); 3.8990 (3.6); 3.8867 (50.0); 3.8552 (49.2); 3.8453 (0.8); 3.8328 (2.0); 3.8078 (0.4); 3.7963 (7.8); 3.7759 (7.7); 3.7675 (8.7); 3.7607 (0.6); 3.7471 (8.3); 3.7291 (0.3); 3.3491 (48.2); 3.3405 (48.2); 3.2449 (0.4); 3.2368 (8.2); 3.2253 (8.6); 3.2186 (0.7); 3.2163 (0.6); 3.2080 (7.5); 3.2021 (0.6); 3.1965 (7.7); 2.5589 (3.2); 2.5468 (3.4); 2.5351 (3.9); 2.5231 (3.7); 2.5024 (3.4); 2.4902 (3.5); 2.4785 (4.0); 2.4664 (3.8); 2.2319 (2.9); 2.2308 (3.0); 2.2264 (3.0); 2.2082 (2.6); 2.2071 (2.6); 2.2027 (2.6); 2.1546 (2.9); 2.1533 (3.0); 2.1493 (3.1); 2.1481 (2.9); 2.1307 (2.6); 2.1294 (2.7); 2.1255 (2.8); 1.8553 (1.3); 1.7169 (40.5); 1.6954 (39.1); 1.3373 (0.8); 1.2871 (1.3); 1.2573 (3.3); 0.8920 (0.4); 0.8808 (0.9); 0.8689 (0.5); 0.8424 (0.3); -0.0001 (4.5)
I-41	<sup>1</sup> H-NMR(400.0 MHz, CDCl <sub>3</sub> ): $\delta$ = 7.5185 (0.9); 7.3305 (0.6); 7.3101 (0.9); 7.2935 (0.8); 7.2901 (0.8); 7.2596 (159.2); 7.1701 (0.7); 7.1642 (0.6); 7.1577 (3.3); 7.1520 (4.0); 7.1488 (2.3); 7.1411 (2.2); 7.1378 (4.0); 7.1322 (3.3); 7.1197 (0.5); 6.9956 (0.9); 6.8966 (0.8); 6.8885 (0.8); 6.8808 (1.0); 6.8749 (1.6); 6.8668 (1.7); 6.8609 (0.9); 6.8532 (0.8); 6.8451 (0.8); 5.2983 (0.6); 4.6116 (1.2); 4.6013 (1.4); 4.5885 (2.0); 4.5793 (1.9); 4.5660 (1.5); 4.5561 (1.7); 4.5443 (0.8); 4.5381 (0.9); 4.5332 (0.9); 4.5265 (0.9); 4.5204 (0.9); 4.5131 (0.8); 4.5085 (0.5); 4.1133 (1.1); 4.1002 (1.1); 4.0894 (2.0); 4.0763 (1.9); 4.0733 (1.4); 4.0599 (1.2); 4.0492 (1.8); 4.0357 (2.0); 4.0261 (1.2); 4.0094 (0.7); 4.0022 (0.7); 3.9682 (1.1); 3.9624 (1.1); 3.9441 (0.7); 3.9372 (0.7); 3.7796 (2.9); 3.7729 (2.9); 3.7363 (3.3); 3.7296 (3.3); 3.1984 (3.0); 3.1935 (3.0); 3.1551 (2.6); 3.1502 (2.7); 2.6774 (0.6); 2.6601 (0.7); 2.6537 (0.6); 2.6427 (0.8); 2.6365 (0.7); 2.6257 (0.8); 2.6191 (0.8); 2.6112 (0.6); 2.6048 (0.7); 2.6020 (0.8); 2.5939 (0.8); 2.5875 (0.7); 2.5766 (0.7); 2.5703 (0.7); 2.5529 (0.6); 2.2721 (1.0); 2.2378 (0.7); 2.1741 (0.8); 2.1396 (0.7); 2.1109 (7.6); 1.7027 (15.9); 1.6873 (16.0); 1.4319 (4.0); 1.2567 (0.7); 0.8820 (0.9); 0.0080 (1.5); -0.0002 (46.7); -0.0085 (1.4)
I-42	<sup>1</sup> H-NMR(400.0 MHz, CDCl <sub>3</sub> ): $\delta$ = 7.5186 (1.0); 7.5024 (0.6); 7.4829 (0.6); 7.4416 (0.8); 7.4215 (0.8); 7.2598 (167.2); 7.2093 (0.6); 7.1693 (2.1); 7.1639 (2.6); 7.1496 (3.8); 7.1370 (2.2); 7.1315 (1.8); 6.9958 (0.9); 6.8933 (1.0); 6.8888 (1.0); 6.8772 (1.0); 6.8718 (2.0); 6.8669 (2.0); 6.8554 (0.6); 6.8500 (1.0); 6.8454 (0.9); 4.5805 (1.1); 4.4363 (1.2); 4.4274 (1.4); 4.4131 (2.3); 4.4042 (2.4); 4.3899 (1.1); 4.3808 (1.1); 4.0768 (0.9); 4.0631 (0.9); 4.0533 (1.5); 4.0394 (1.7); 4.0231 (1.2); 4.0132 (1.7); 3.9994 (1.6); 3.9694 (1.1); 3.9633 (1.2); 3.9467 (0.8); 3.9395 (0.7); 3.8931 (1.3); 3.8869 (1.4); 3.8694 (0.9); 3.8631 (1.1); 3.7676 (2.2); 3.7564 (2.7); 3.7244 (2.6); 3.7133 (3.1); 3.1860 (2.9); 3.1770 (2.6); 3.1428 (2.6); 3.1338 (2.3); 2.5651 (0.6); 2.5472 (0.7); 2.5417 (0.7); 2.5311 (1.0); 2.5239 (0.8); 2.5127 (1.1); 2.4992 (0.7); 2.4910 (1.0); 2.4807 (0.7); 2.4756 (0.7); 2.4573 (0.6); 2.2528 (0.6); 2.0199 (1.0); 1.9855 (0.9); 1.9132 (0.8); 1.8784 (0.7); 1.7070 (13.3); 1.6833 (16.0); 1.5392 (24.4); 1.5194 (53.5); 1.4680 (43.6); 1.4445 (0.7); 1.4275 (0.7); 1.2552 (0.7); 1.2049 (0.7); 1.1885 (0.8); 1.1827 (2.5); 1.1713 (2.3); 1.1525 (1.0); 1.1368 (1.0); 0.0079 (2.2); -0.0002 (58.9)

I-43	<sup>1</sup> H-NMR(400.6 MHz, CDCl <sub>3</sub> ): $\delta$ = 7.5219 (0.6); 7.5011 (0.7); 7.4886 (0.7); 7.4681 (0.6); 7.2990 (1.4); 7.1903 (0.5); 7.1780 (2.9); 7.1724 (3.6); 7.1691 (2.1); 7.1616 (2.1); 7.1580 (3.6); 7.1525 (2.9); 7.1460 (0.5); 7.1402 (0.5); 6.9069 (0.7); 6.9011 (1.3); 6.8953 (0.7); 6.8852 (1.5); 6.8794 (2.6); 6.8736 (1.3); 6.8634 (0.8); 6.8577 (1.3); 6.8519 (0.6); 4.6076 (0.6); 4.6031 (0.7); 4.6008 (0.6); 4.5967 (0.8); 4.5933 (0.7); 4.5899 (1.0); 4.5867 (0.9); 4.5832 (1.0); 4.5761 (0.8); 4.5727 (0.7); 4.5697 (0.7); 4.5660 (0.6); 4.5590 (0.6); 4.5559 (1.3); 4.5466 (1.4); 4.5320 (2.2); 4.5226 (2.2); 4.5082 (1.3); 4.4989 (1.2); 4.3114 (0.9); 4.3099 (1.0); 4.2936 (2.9); 4.2921 (3.0); 4.2757 (3.0); 4.2745 (3.0); 4.2577 (1.1); 4.2567 (1.1); 4.2531 (1.2); 4.2353 (3.7); 4.2176 (3.9); 4.1998 (1.4); 4.0770 (1.1); 4.0638 (1.1); 4.0535 (1.8); 4.0403 (1.7); 4.0340 (1.2); 4.0207 (1.2); 4.0104 (1.7); 3.9971 (1.6); 3.9801 (1.1); 3.9749 (1.0); 3.9734 (1.0); 3.9566 (0.7); 3.9514 (0.6); 3.9499 (0.6); 3.9089 (0.9); 3.9075 (1.0); 3.9024 (1.0); 3.9009 (0.9); 3.8854 (0.6); 3.8838 (0.7); 3.8788 (0.7); 3.8774 (0.6); 3.8340 (1.0); 3.7866 (2.9); 3.7836 (1.3); 3.7732 (2.6); 3.7435 (3.3); 3.7300 (3.0); 3.2065 (2.8); 3.1990 (3.0); 3.1634 (2.5); 3.1559 (2.6); 2.6102 (0.6); 2.5926 (0.6); 2.5868 (0.6); 2.5758 (0.8); 2.5691 (0.8); 2.5665 (0.7); 2.5582 (0.7); 2.5524 (0.8); 2.5484 (0.7); 2.5430 (0.7); 2.5348 (0.8); 2.5320 (0.9); 2.5251 (0.7); 2.5139 (0.7); 2.5086 (0.7); 2.4906 (0.6); 2.1117 (0.8); 2.1095 (0.5); 2.0773 (0.6); 2.0132 (0.8); 2.0063 (0.5); 1.9969 (0.6); 1.9787 (0.7); 1.7143 (16.0); 1.6904 (14.9); 1.3614 (5.6); 1.3436 (11.6); 1.3257 (5.4); 1.3047 (5.8); 1.2869 (12.0); 1.2691 (5.7); 1.2597 (0.8); -0.0002 (1.0)
I-44	<sup>1</sup> H-NMR(400.6 MHz, CDCl <sub>3</sub> ): $\delta$ = 7.5274 (0.7); 7.5067 (0.8); 7.4922 (0.8); 7.4716 (0.7); 7.3034 (1.2); 7.1783 (2.8); 7.1745 (3.5); 7.1728 (3.3); 7.1603 (3.1); 7.1586 (3.6); 7.1548 (2.9); 7.1532 (2.4); 6.9036 (0.6); 6.8991 (1.0); 6.8979 (1.0); 6.8935 (0.6); 6.8922 (0.6); 6.8832 (1.1); 6.8819 (1.3); 6.8774 (2.0); 6.8762 (2.1); 6.8718 (1.1); 6.8704 (1.1); 6.8614 (0.6); 6.8601 (0.7); 6.8558 (1.0); 6.8544 (1.1); 6.8501 (0.5); 6.8488 (0.5); 5.1433 (1.3); 5.1277 (1.8); 5.1120 (1.3); 5.0961 (0.7); 5.0947 (0.7); 5.0788 (1.4); 5.0631 (1.8); 5.0475 (1.4); 5.0318 (0.5); 4.6095 (0.7); 4.6023 (0.9); 4.5987 (0.9); 4.5952 (1.0); 4.5918 (1.1); 4.5889 (1.0); 4.5846 (1.0); 4.5820 (0.9); 4.5779 (0.8); 4.5748 (0.7); 4.5712 (0.6); 4.5124 (1.2); 4.5030 (1.4); 4.4888 (2.5); 4.4793 (2.6); 4.4651 (1.4); 4.4558 (1.3); 4.0796 (1.1); 4.0663 (1.1); 4.0561 (1.9); 4.0428 (1.7); 4.0321 (1.2); 4.0187 (1.1); 4.0085 (1.7); 3.9951 (1.6); 3.9824 (1.2); 3.9765 (1.2); 3.9589 (0.8); 3.9533 (0.7); 3.9036 (1.1); 3.8980 (1.0); 3.8800 (0.7); 3.8745 (0.7); 3.7882 (2.9); 3.7840 (0.5); 3.7769 (2.7); 3.7451 (3.3); 3.7337 (3.1); 3.2084 (2.9); 3.2001 (3.1); 3.1652 (2.6); 3.1569 (2.7); 2.6063 (0.6); 2.5885 (0.6); 2.5830 (0.6); 2.5720 (0.8); 2.5651 (0.7); 2.5610 (0.7); 2.5542 (0.7); 2.5486 (0.8); 2.5428 (0.7); 2.5376 (0.7); 2.5308 (0.7); 2.5265 (0.9); 2.5195 (0.7); 2.5083 (0.7); 2.5032 (0.7); 2.4850 (0.6); 2.0692 (0.8); 2.0622 (0.5); 2.0443 (0.9); 2.0348 (0.8); 1.9781 (0.5); 1.9712 (0.8); 1.9641 (0.5); 1.9626 (0.5); 1.9367 (0.7); 1.7159 (16.0); 1.6923 (15.1); 1.3290 (8.0); 1.3156 (9.6); 1.3136 (9.8); 1.3002 (8.8); 1.2970 (9.4); 1.2812 (8.3); 1.2594 (0.6); 1.2582 (0.6); 1.2217 (8.2); 1.2060 (8.2); -0.0002 (0.9)

I-45	<sup>1</sup> H-NMR(400.0 MHz, CDCl <sub>3</sub> ): $\delta$ = 7.5182 (1.0); 7.4766 (0.5); 7.4574 (0.6); 7.4411 (0.6); 7.4206 (0.6); 7.4015 (0.8); 7.3897 (2.3); 7.3853 (4.0); 7.3813 (3.4); 7.3750 (1.3); 7.3723 (3.1); 7.3701 (3.5); 7.3646 (1.0); 7.3572 (1.2); 7.3547 (1.7); 7.3514 (1.6); 7.3487 (1.4); 7.3436 (1.0); 7.3313 (2.3); 7.3254 (13.2); 7.3128 (0.7); 7.3062 (0.5); 7.2935 (0.6); 7.2593 (174.4); 7.1696 (1.9); 7.1661 (2.9); 7.1637 (2.9); 7.1604 (3.1); 7.1528 (1.5); 7.1497 (3.0); 7.1463 (2.9); 7.1441 (2.9); 7.1405 (1.8); 6.9953 (1.0); 6.8960 (0.8); 6.8899 (0.8); 6.8839 (0.8); 6.8801 (1.0); 6.8743 (1.6); 6.8682 (1.5); 6.8622 (1.5); 6.8564 (0.9); 6.8526 (0.8); 6.8464 (0.7); 6.8405 (0.8); 5.3028 (1.6); 5.2723 (3.6); 5.2284 (4.1); 5.1973 (5.2); 5.1839 (4.2); 5.1533 (0.8); 4.5944 (0.6); 4.5894 (1.9); 4.5800 (2.0); 4.5765 (1.3); 4.5717 (2.0); 4.5659 (2.1); 4.5626 (2.2); 4.5565 (2.0); 4.5486 (1.6); 4.5391 (1.5); 4.0842 (1.1); 4.0709 (1.1); 4.0607 (1.8); 4.0473 (1.6); 4.0356 (1.2); 4.0222 (1.2); 4.0119 (1.7); 3.9985 (1.5); 3.9693 (1.0); 3.9637 (1.0); 3.9458 (0.7); 3.9399 (0.7); 3.9022 (1.0); 3.8967 (1.0); 3.8785 (0.7); 3.8731 (0.7); 3.7711 (2.8); 3.7541 (2.8); 3.7280 (3.2); 3.7110 (3.2); 3.1777 (3.1); 3.1733 (3.1); 3.1346 (2.7); 3.1302 (2.7); 2.5979 (0.6); 2.5800 (0.6); 2.5746 (0.6); 2.5634 (0.8); 2.5563 (1.0); 2.5456 (0.7); 2.5400 (0.8); 2.5373 (0.8); 2.5321 (0.7); 2.5212 (1.1); 2.5141 (0.7); 2.5027 (0.7); 2.4976 (0.7); 2.4795 (0.6); 2.0772 (0.8); 2.0428 (0.7); 2.0327 (0.7); 2.0231 (0.8); 1.9886 (0.7); 1.7099 (0.6); 1.7009 (16.0); 1.6443 (16.0); 1.5408 (30.6); 1.2557 (0.5); 0.0080 (1.9); -0.0002 (61.3); -0.0085 (1.8)
I-46	<sup>1</sup> H-NMR(400.0 MHz, CDCl <sub>3</sub> ): $\delta$ = 7.5183 (1.2); 7.4000 (1.1); 7.3866 (2.4); 7.3814 (3.3); 7.3772 (3.0); 7.3726 (2.5); 7.3705 (3.1); 7.3650 (1.1); 7.3617 (1.4); 7.2595 (199.8); 7.1662 (0.6); 7.1600 (0.8); 7.1475 (0.6); 7.1451 (0.7); 7.1368 (0.8); 7.1305 (0.6); 7.1224 (0.8); 6.9954 (1.5); 5.9487 (1.6); 5.9411 (1.6); 5.8864 (1.3); 5.8787 (1.3); 5.2429 (0.6); 5.2304 (0.6); 5.2226 (0.6); 5.2204 (0.5); 5.2104 (0.5); 4.6454 (0.6); 4.6231 (0.6); 4.6189 (0.7); 4.6036 (0.7); 4.5963 (0.6); 4.5807 (0.7); 4.5768 (0.9); 4.5542 (0.7); 4.3294 (0.8); 4.3197 (0.8); 4.3027 (0.7); 4.2930 (0.7); 4.2343 (1.0); 4.2243 (1.0); 4.2075 (0.9); 4.1975 (0.9); 3.8592 (0.5); 3.8520 (14.0); 3.8421 (11.8); 3.8082 (1.5); 3.7892 (1.8); 3.7649 (1.7); 3.7459 (2.1); 3.2487 (2.0); 3.2436 (1.7); 3.2054 (1.7); 3.2003 (1.4); 2.0436 (1.1); 1.7157 (16.0); 1.5330 (11.1); 1.2765 (0.5); 1.2586 (1.3); 0.8819 (0.8); 0.0080 (2.3); -0.0002 (73.4); -0.0085 (2.2)
I-47	<sup>1</sup> H-NMR(400.0 MHz, CDCl <sub>3</sub> ): $\delta$ = 7.4477 (0.6); 7.4344 (0.6); 7.4155 (0.7); 7.4110 (0.7); 7.3960 (1.4); 7.3912 (1.9); 7.3889 (1.7); 7.3826 (2.0); 7.3779 (2.5); 7.3722 (3.0); 7.3673 (5.3); 7.3610 (3.5); 7.3520 (0.6); 7.3479 (0.5); 7.2625 (29.8); 7.1554 (0.8); 7.1497 (0.8); 7.1456 (0.5); 7.1421 (0.5); 7.1393 (0.6); 7.1352 (0.9); 7.1310 (1.0); 7.1277 (0.8); 7.1255 (0.8); 7.1172 (0.6); 7.1118 (0.6); 4.6657 (0.6); 4.6604 (0.7); 4.6525 (0.8); 4.6474 (0.8); 4.6402 (0.7); 4.6346 (0.6); 4.1581 (1.0); 4.1458 (1.0); 4.1345 (1.4); 4.1303 (1.1); 4.1222 (1.2); 4.1175 (1.0); 4.1066 (1.2); 4.0938 (1.1); 3.9763 (0.8); 3.9514 (0.7); 3.8892 (15.7); 3.8757 (0.8); 3.8727 (0.8); 3.8703 (0.7); 3.8592 (16.0); 3.8414 (0.8); 3.8008 (2.1); 3.7795 (2.0); 3.7576 (2.3); 3.7363 (2.3); 3.3514 (15.6); 3.3424 (15.2); 3.2389 (2.2); 3.2272 (2.2); 3.1956 (1.9); 3.1839 (1.9); 2.5668 (0.8); 2.5487 (0.9); 2.5311 (1.1); 2.5123 (1.5); 2.4932 (0.9); 2.4755 (1.1); 2.4573 (1.0); 2.2298 (0.7); 2.2275 (0.7); 2.2215 (0.7); 2.2192 (0.7); 2.1941 (0.6); 2.1917 (0.6); 2.1858 (0.6); 2.1834 (0.6); 2.1532 (0.7); 2.1506 (0.7); 2.1453 (0.7); 2.1428 (0.7); 2.1173 (0.6); 2.1148 (0.6); 2.1095 (0.6); 2.1069 (0.6); 1.7164 (11.9); 1.6946 (11.4); -0.0002 (10.0)

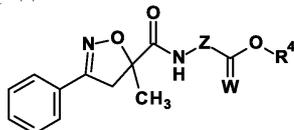
I-48	<sup>1</sup> H-NMR(400.0 MHz, CDCl <sub>3</sub> ): $\delta$ = 7.2618 (68.4); 7.1797 (0.5); 7.1715 (2.4); 7.1676 (3.6); 7.1620 (2.6); 7.1571 (2.1); 7.1543 (2.6); 7.1518 (3.5); 7.1480 (3.2); 7.1419 (1.5); 7.1353 (0.5); 6.9978 (0.9); 6.9792 (0.6); 6.9142 (0.8); 6.9086 (0.8); 6.9056 (0.5); 6.9037 (0.6); 6.8982 (1.2); 6.8925 (1.8); 6.8869 (1.5); 6.8839 (0.9); 6.8819 (1.0); 6.8779 (1.3); 6.8766 (1.4); 6.8708 (1.3); 6.8653 (0.8); 6.8603 (0.5); 6.8564 (0.6); 6.8549 (0.6); 4.6416 (0.6); 4.6209 (1.4); 4.6031 (1.4); 4.5801 (1.3); 4.5744 (0.8); 4.5703 (1.2); 4.5610 (0.8); 4.5555 (2.0); 4.5462 (1.7); 4.5369 (0.9); 4.5310 (1.5); 4.5221 (1.0); 4.1650 (0.9); 4.1522 (0.9); 4.1411 (1.1); 4.1359 (1.0); 4.1283 (1.0); 4.1230 (0.9); 4.1119 (1.1); 4.0989 (1.0); 4.0662 (0.7); 4.0532 (0.6); 4.0426 (1.1); 4.0299 (1.6); 4.0172 (0.8); 4.0066 (1.0); 3.9935 (1.0); 3.9680 (0.7); 3.9635 (0.6); 3.9010 (0.6); 3.8965 (0.6); 3.8555 (0.7); 3.8515 (0.6); 3.8489 (0.6); 3.8342 (13.9); 3.8276 (0.9); 3.8252 (0.8); 3.7909 (2.6); 3.7856 (13.6); 3.7738 (2.0); 3.7706 (2.5); 3.7654 (14.3); 3.7570 (2.4); 3.7505 (14.2); 3.7307 (2.1); 3.7273 (2.4); 3.7137 (2.0); 3.2132 (2.0); 3.2095 (2.1); 3.1912 (1.8); 3.1832 (1.8); 3.1699 (1.8); 3.1661 (1.8); 3.1480 (1.6); 3.1400 (1.5); 2.5651 (0.5); 2.5591 (0.7); 2.5418 (0.8); 2.5247 (0.8); 2.4160 (0.7); 2.3990 (0.9); 2.3863 (0.8); 2.3818 (1.2); 2.3692 (0.9); 2.3644 (0.6); 2.3520 (1.0); 2.3345 (0.5); 1.7167 (16.0); 1.7106 (10.7); 1.6878 (9.8); 1.5652 (8.8); 0.0080 (0.7); -0.0002 (24.5); -0.0085 (0.8)
I-49	<sup>1</sup> H-NMR(400.0 MHz, CDCl <sub>3</sub> ): $\delta$ = 7.2603 (79.2); 7.2105 (0.5); 7.1993 (1.7); 7.1949 (2.3); 7.1797 (2.3); 7.1755 (1.7); 6.9331 (0.8); 6.9171 (0.9); 6.9113 (1.6); 6.9056 (0.8); 6.8897 (0.8); 4.6474 (0.7); 4.6423 (0.7); 4.6307 (0.7); 4.6268 (0.7); 4.6214 (0.5); 4.5982 (0.8); 4.5903 (0.9); 4.5751 (1.2); 4.5676 (1.4); 4.5526 (0.9); 4.5445 (0.8); 4.0667 (0.7); 4.0543 (0.8); 4.0430 (2.0); 4.0304 (1.9); 4.0191 (1.3); 4.0063 (1.2); 3.9783 (0.7); 3.9749 (0.8); 3.9636 (0.7); 3.9575 (1.0); 3.8276 (15.4); 3.8151 (0.9); 3.8010 (16.0); 3.7826 (1.4); 3.7706 (1.3); 3.6729 (2.3); 3.6505 (2.1); 3.6285 (1.3); 3.6061 (1.3); 2.5764 (0.5); 2.5591 (0.5); 2.5562 (0.5); 2.5526 (0.5); 2.5354 (0.6); 2.5325 (0.5); 2.5212 (0.5); 2.4976 (0.5); 2.1028 (0.5); 2.0811 (0.6); 2.0730 (0.6); 2.0436 (0.8); 1.8128 (2.2); 1.7968 (2.1); 1.7659 (4.4); 1.7498 (4.2); 1.7190 (2.4); 1.7029 (2.3); 1.5438 (17.9); 0.0080 (1.2); -0.0002 (41.5); -0.0085 (1.2)
I-50	<sup>1</sup> H-NMR(400.0 MHz, CDCl <sub>3</sub> ): $\delta$ = 7.5191 (1.2); 7.4723 (1.2); 7.4535 (1.2); 7.3606 (0.6); 7.3094 (0.5); 7.2779 (0.6); 7.2771 (0.6); 7.2763 (0.7); 7.2755 (0.7); 7.2739 (0.9); 7.2731 (1.0); 7.2723 (1.1); 7.2715 (1.2); 7.2707 (1.3); 7.2699 (1.4); 7.2691 (1.6); 7.2683 (1.8); 7.2675 (2.0); 7.2602 (205.8); 7.2530 (1.5); 7.2521 (1.2); 7.2513 (0.9); 7.2505 (0.8); 7.2497 (0.7); 7.2489 (0.6); 7.2481 (0.5); 7.2095 (0.6); 7.1932 (0.6); 7.1876 (0.6); 7.1801 (2.8); 7.1761 (3.4); 7.1608 (3.7); 7.1568 (2.5); 6.9962 (1.2); 6.9293 (0.9); 6.9228 (1.0); 6.9138 (1.0); 6.9077 (2.0); 6.9011 (2.0); 6.8952 (0.9); 6.8862 (0.9); 6.8795 (1.0); 4.6357 (1.2); 4.6266 (1.5); 4.6216 (0.8); 4.6114 (3.1); 4.6023 (3.8); 4.5877 (2.2); 4.5785 (2.0); 4.5726 (0.7); 4.1498 (1.2); 4.1320 (3.5); 4.1195 (1.2); 4.1141 (3.7); 4.1069 (1.1); 4.0958 (2.9); 4.0884 (1.2); 4.0828 (1.9); 4.0755 (1.0); 4.0641 (1.9); 4.0511 (1.8); 4.0386 (1.3); 4.0335 (1.3); 4.0142 (1.8); 3.9952 (0.6); 3.9901 (0.6); 3.8220 (1.4); 3.8138 (1.3); 3.7775 (2.8); 3.7742 (3.7); 3.7681 (3.2); 3.7638 (2.3); 3.7574 (6.6); 3.7514 (2.2); 3.7471 (1.5); 3.7400 (3.4); 3.7221 (2.1); 3.7046 (0.8); 3.6642 (4.8); 3.6196 (2.8); 2.6928 (0.6); 2.6757 (0.6); 2.6688 (0.6); 2.6580 (0.8); 2.6518 (0.7); 2.6410 (0.7); 2.6342 (0.9); 2.6177 (1.0); 2.6123 (0.7); 2.6012 (0.9); 2.5951 (0.7); 2.5840 (0.8); 2.5775 (0.7); 2.5602 (0.7); 2.2473 (0.5); 2.2406 (0.8); 2.2307 (0.7); 2.2207 (0.9); 2.2137 (0.9); 2.2058 (0.8); 2.1948 (0.6); 2.1859 (0.7); 2.1136 (1.6); 2.0456 (16.0); 1.8760 (2.4); 1.8683 (2.2); 1.8594 (7.1); 1.8546 (1.5); 1.8505 (2.2); 1.8428 (2.4); 1.8042 (3.1); 1.7864 (2.9); 1.7572 (6.5); 1.7392 (5.8); 1.7104 (3.5); 1.6924 (3.1); 1.4320 (1.1); 1.2772 (4.6); 1.2655 (2.4); 1.2593 (9.4); 1.2480 (4.5); 1.2414 (4.9); 1.2391 (2.8); 1.2304 (2.2); 0.0079 (2.0); -0.0002 (64.7); -0.0068 (0.9); -0.0085 (2.1)

I-51	<sup>1</sup> H-NMR(400.0 MHz, CDCl <sub>3</sub> ): $\delta$ = 7.7312 (1.0); 7.7094 (1.0); 7.6924 (1.0); 7.6716 (0.9); 7.5189 (1.4); 7.2929 (0.5); 7.2600 (265.2); 7.2108 (1.2); 7.1984 (4.5); 7.1938 (5.8); 7.1788 (5.7); 7.1742 (4.5); 7.1616 (0.8); 6.9960 (1.5); 6.9329 (1.0); 6.9290 (1.6); 6.9271 (1.6); 6.9213 (0.9); 6.9130 (1.9); 6.9112 (2.0); 6.9073 (3.2); 6.9055 (3.2); 6.9016 (1.7); 6.8997 (1.6); 6.8914 (1.0); 6.8896 (1.0); 6.8856 (1.6); 6.8838 (1.6); 6.8799 (0.8); 5.1532 (0.9); 5.1375 (2.3); 5.1218 (3.1); 5.1099 (1.1); 5.1061 (2.4); 5.0943 (2.4); 5.0905 (1.1); 5.0786 (3.2); 5.0629 (2.3); 5.0472 (0.9); 4.6923 (0.5); 4.6866 (0.5); 4.6798 (0.9); 4.6744 (1.0); 4.6690 (1.0); 4.6633 (1.2); 4.6582 (1.3); 4.6518 (1.3); 4.6457 (1.3); 4.6399 (1.2); 4.6247 (0.9); 4.6183 (0.5); 4.6122 (0.5); 4.5188 (2.0); 4.5104 (2.3); 4.5028 (2.2); 4.4948 (4.4); 4.4867 (2.1); 4.4794 (2.2); 4.4711 (2.1); 4.0691 (1.8); 4.0564 (1.8); 4.0453 (3.2); 4.0366 (2.0); 4.0327 (3.1); 4.0236 (1.8); 4.0127 (3.1); 3.9996 (2.9); 3.9768 (1.8); 3.9730 (1.8); 3.9471 (2.8); 3.9426 (1.9); 3.9232 (1.1); 3.9188 (1.0); 3.8237 (2.0); 3.8157 (2.1); 3.7792 (3.4); 3.7713 (3.6); 3.6777 (5.6); 3.6551 (5.5); 3.6332 (3.2); 3.6107 (3.3); 2.6051 (1.0); 2.5872 (1.0); 2.5813 (1.0); 2.5702 (1.3); 2.5635 (1.1); 2.5526 (1.2); 2.5465 (1.3); 2.5431 (1.1); 2.5287 (1.2); 2.5250 (1.2); 2.5195 (1.1); 2.5081 (1.3); 2.5016 (1.1); 2.4902 (1.2); 2.4847 (1.2); 2.4667 (1.0); 2.0339 (1.4); 2.0308 (1.7); 2.0283 (1.8); 2.0257 (1.6); 2.0227 (1.5); 1.9991 (1.3); 1.9934 (1.5); 1.9877 (1.3); 1.8128 (5.2); 1.7970 (5.2); 1.7659 (10.6); 1.7500 (10.5); 1.7191 (5.7); 1.7032 (5.7); 1.5429 (43.8); 1.4474 (0.6); 1.3265 (13.4); 1.3108 (14.3); 1.3062 (16.0); 1.3037 (16.0); 1.2905 (15.3); 1.2880 (15.4); 1.2553 (0.8); 1.2437 (13.2); 1.2280 (13.0); 0.0079 (3.5); -0.0002 (112.0); -0.0085 (3.3)
I-52	<sup>1</sup> H-NMR(400.0 MHz, CDCl <sub>3</sub> ): $\delta$ = 7.5190 (1.4); 7.4491 (1.9); 7.4333 (2.6); 7.4159 (1.9); 7.3658 (1.7); 7.3512 (1.9); 7.3461 (3.2); 7.3323 (3.9); 7.3263 (2.8); 7.3188 (2.1); 7.3122 (4.5); 7.2989 (3.4); 7.2938 (2.8); 7.2793 (2.8); 7.2731 (1.4); 7.2690 (2.2); 7.2683 (2.4); 7.2601 (236.0); 7.2109 (0.6); 7.1919 (0.6); 7.1861 (1.2); 7.1777 (1.8); 7.1738 (5.6); 7.1679 (7.8); 7.1653 (10.5); 7.1624 (8.6); 7.1597 (9.8); 7.1570 (6.8); 7.1541 (7.7); 7.1483 (8.9); 7.1456 (8.8); 7.1433 (6.9); 7.1400 (6.9); 7.1275 (1.3); 7.1177 (4.0); 7.1162 (4.0); 7.1138 (3.4); 7.1049 (2.8); 7.1009 (3.7); 7.0998 (3.7); 7.0972 (3.3); 7.0868 (1.8); 7.0815 (2.4); 7.0775 (1.9); 7.0581 (2.8); 7.0557 (2.8); 7.0524 (3.4); 7.0342 (4.3); 7.0303 (5.4); 7.0097 (3.4); 6.9961 (1.7); 6.9883 (1.3); 6.9818 (1.0); 6.9085 (1.3); 6.9027 (2.3); 6.8986 (1.7); 6.8929 (2.5); 6.8868 (3.6); 6.8810 (4.6); 6.8769 (3.4); 6.8754 (3.0); 6.8712 (4.7); 6.8653 (3.4); 6.8593 (2.3); 6.8552 (1.7); 6.8495 (2.3); 6.8436 (1.0); 6.1652 (4.5); 6.1552 (4.5); 6.1384 (5.0); 6.1284 (5.0); 6.1221 (5.5); 6.1120 (5.2); 6.0952 (5.6); 6.0852 (5.4); 5.5477 (7.5); 5.5463 (7.7); 5.5327 (7.0); 5.5311 (7.3); 5.5046 (6.7); 5.5032 (6.7); 5.4895 (6.3); 5.4880 (6.3); 5.3488 (6.9); 5.3476 (6.7); 5.3219 (6.6); 5.3207 (7.2); 5.3186 (7.3); 5.3171 (6.7); 5.2917 (5.9); 5.2903 (5.9); 5.2638 (2.6); 5.2385 (2.7); 5.2325 (8.5); 5.2069 (16.0); 5.1880 (8.9); 5.1749 (2.6); 5.1567 (2.3); 4.7085 (0.8); 4.6437 (0.5); 4.6373 (1.0); 4.6307 (1.2); 4.6238 (2.0); 4.6171 (2.5); 4.6101 (2.4); 4.6034 (3.3); 4.5998 (5.6); 4.5916 (8.0); 4.5832 (5.6); 4.5768 (5.0); 4.5683 (6.3); 4.5598 (3.8); 4.0771 (3.3); 4.0638 (3.4); 4.0532 (6.5); 4.0398 (5.8); 4.0283 (4.9); 4.0149 (4.4); 3.9575 (3.0); 3.9524 (2.9); 3.9328 (4.4); 3.9298 (4.6); 3.9257 (11.9); 3.9068 (2.0); 3.8998 (2.3); 3.8953 (8.0); 3.8827 (9.2); 3.8523 (8.9); 3.3196 (7.7); 3.3057 (7.9); 3.2766 (6.7); 3.2627 (6.9); 2.6071 (1.7); 2.5893 (1.8); 2.5837 (1.8); 2.5727 (2.6); 2.5660 (2.0); 2.5569 (2.4); 2.5549 (2.6); 2.5516 (2.5); 2.5494 (2.5); 2.5404 (2.3); 2.5337 (2.3); 2.5317 (2.2); 2.5226 (2.1); 2.5172 (2.0); 2.4993 (1.8); 2.0840 (1.4); 2.0772 (2.3); 2.0687 (2.5); 2.0602 (2.5); 2.0515 (2.4); 2.0427 (2.1); 2.0340 (2.2); 2.0256 (2.1); 2.0190 (1.2); 1.5534 (22.4); 1.2559 (0.7); 0.0079 (3.2); -0.0002 (99.5); -0.0068 (1.2); -0.0085 (3.0)

I-53	<sup>1</sup> H-NMR(400.0 MHz, CDCl <sub>3</sub> ): δ= 7.4651 (0.6); 7.4434 (0.7); 7.3653 (0.5); 7.3508 (0.5); 7.3455 (0.9); 7.3302 (1.3); 7.3257 (0.9); 7.3140 (0.7); 7.3104 (1.7); 7.2949 (1.2); 7.2900 (0.8); 7.2748 (0.9); 7.2601 (81.2); 7.1746 (1.2); 7.1731 (1.2); 7.1706 (1.4); 7.1641 (1.8); 7.1580 (3.8); 7.1547 (2.9); 7.1521 (3.0); 7.1486 (2.0); 7.1441 (2.2); 7.1416 (2.1); 7.1382 (3.4); 7.1322 (2.0); 7.1257 (0.6); 7.1197 (0.9); 7.1065 (1.3); 7.1051 (1.3); 7.0877 (1.3); 7.0861 (1.2); 7.0463 (0.8); 7.0411 (0.9); 7.0345 (0.9); 7.0311 (1.0); 7.0276 (1.2); 7.0244 (1.0); 7.0176 (0.9); 7.0134 (1.0); 7.0071 (1.2); 6.9962 (0.6); 6.8971 (0.7); 6.8919 (0.7); 6.8863 (0.8); 6.8810 (1.1); 6.8753 (1.4); 6.8702 (1.3); 6.8646 (1.6); 6.8590 (1.0); 6.8536 (0.7); 6.8485 (0.6); 6.8429 (0.8); 5.2928 (1.0); 5.2616 (2.3); 5.2160 (2.6); 5.1836 (4.0); 5.1732 (3.4); 4.6044 (1.4); 4.5953 (1.8); 4.5911 (1.0); 4.5879 (1.8); 4.5845 (1.3); 4.5809 (2.1); 4.5786 (2.4); 4.5716 (1.7); 4.5645 (2.0); 4.5554 (1.4); 4.0874 (1.1); 4.0741 (1.1); 4.0638 (1.8); 4.0506 (1.6); 4.0390 (1.0); 4.0257 (1.0); 4.0153 (1.4); 4.0020 (1.3); 3.9744 (1.0); 3.9688 (1.0); 3.9507 (0.7); 3.9453 (0.6); 3.9040 (0.8); 3.8987 (0.8); 3.8803 (0.6); 3.8749 (0.6); 3.7769 (2.8); 3.7520 (2.3); 3.7337 (3.2); 3.7088 (2.7); 3.1824 (2.5); 3.1760 (2.9); 3.1393 (2.2); 3.1328 (2.6); 2.5968 (0.6); 2.5912 (0.5); 2.5801 (0.7); 2.5734 (0.6); 2.5704 (0.7); 2.5624 (0.6); 2.5567 (0.7); 2.5525 (0.7); 2.5472 (0.7); 2.5389 (0.6); 2.5359 (0.8); 2.5292 (0.7); 2.5179 (0.7); 2.5126 (0.7); 2.4947 (0.6); 2.0911 (0.7); 2.0566 (0.6); 2.0479 (0.8); 2.0396 (0.8); 2.0049 (0.7); 1.7017 (16.0); 1.6504 (13.3); 1.5512 (10.8); 1.2584 (0.5); 0.0079 (1.2); -0.0002 (35.6); -0.0085 (1.0)
I-54	<sup>1</sup> H-NMR(400.0 MHz, CDCl <sub>3</sub> ): δ= 7.4531 (0.7); 7.3377 (2.3); 7.3325 (0.8); 7.3212 (0.8); 7.3158 (2.5); 7.3089 (0.5); 7.2925 (2.5); 7.2872 (1.0); 7.2760 (1.0); 7.2706 (2.9); 7.2600 (55.9); 7.1855 (2.2); 7.1798 (2.6); 7.1767 (1.5); 7.1689 (1.5); 7.1657 (2.7); 7.1600 (2.2); 6.9096 (0.6); 6.9032 (3.4); 6.8978 (1.2); 6.8949 (0.8); 6.8869 (1.3); 6.8815 (3.4); 6.8760 (1.1); 6.8732 (1.5); 6.8686 (3.3); 6.8634 (1.0); 6.8603 (0.7); 6.8518 (1.3); 6.8467 (2.8); 6.1708 (1.1); 6.1572 (1.0); 6.1440 (1.2); 6.1304 (1.2); 6.1277 (1.4); 6.1141 (1.2); 6.1009 (1.3); 6.0873 (1.2); 5.5589 (1.9); 5.5575 (1.8); 5.5443 (1.7); 5.5428 (1.7); 5.5157 (1.6); 5.5144 (1.6); 5.5013 (1.5); 5.4997 (1.4); 5.3543 (1.7); 5.3532 (1.6); 5.3315 (1.6); 5.3300 (1.7); 5.3276 (1.7); 5.3264 (1.6); 5.3047 (1.4); 5.3033 (1.4); 5.2078 (0.7); 5.1956 (0.9); 5.1781 (2.3); 5.1658 (2.2); 5.1573 (2.3); 5.1308 (2.3); 5.1011 (0.8); 4.6040 (0.6); 4.5971 (0.5); 4.5907 (0.7); 4.5854 (0.6); 4.5790 (0.5); 4.5723 (0.6); 4.5504 (0.9); 4.5407 (1.5); 4.5311 (1.0); 4.5269 (1.0); 4.5173 (1.6); 4.5078 (0.8); 4.0599 (0.8); 4.0465 (0.8); 4.0361 (1.5); 4.0227 (1.4); 4.0111 (1.1); 3.9977 (1.0); 3.9409 (0.8); 3.9337 (0.8); 3.9301 (2.0); 3.9168 (1.1); 3.9100 (1.1); 3.8965 (1.9); 3.8871 (2.6); 3.8536 (2.1); 3.8127 (16.0); 3.7946 (15.8); 3.3214 (1.8); 3.3109 (1.9); 3.2784 (1.6); 3.2679 (1.7); 2.5341 (0.6); 2.5186 (0.6); 2.5162 (0.6); 2.5137 (0.6); 2.5108 (0.6); 2.5023 (0.5); 2.4955 (0.5); 2.0433 (0.6); 2.0343 (0.5); 2.0089 (0.8); 2.0000 (0.8); 1.5548 (7.2); 1.2584 (0.5); 0.0079 (0.7); -0.0002 (24.0); -0.0085 (0.7)
I-55	<sup>1</sup> H-NMR(400.0 MHz, CDCl <sub>3</sub> ): δ= 7.2610 (30.5); 7.1737 (1.7); 7.1677 (2.8); 7.1643 (2.5); 7.1617 (2.4); 7.1581 (2.3); 7.1539 (2.6); 7.1515 (2.6); 7.1481 (2.8); 7.1421 (1.7); 6.9968 (1.0); 6.9770 (1.0); 6.9141 (0.8); 6.9087 (0.8); 6.8979 (0.8); 6.8925 (1.6); 6.8870 (1.5); 6.8813 (0.8); 6.8764 (0.6); 6.8708 (0.9); 6.8653 (0.8); 4.6416 (0.6); 4.6215 (1.5); 4.6030 (1.6); 4.5825 (0.8); 4.5490 (1.0); 4.5426 (1.1); 4.5372 (1.1); 4.5306 (1.1); 4.1649 (0.8); 4.1522 (0.8); 4.1410 (1.2); 4.1359 (1.1); 4.1283 (1.2); 4.1230 (1.0); 4.1119 (1.1); 4.0990 (1.0); 3.8549 (0.8); 3.8511 (0.8); 3.8337 (0.8); 3.8271 (0.8); 3.7906 (2.4); 3.7654 (11.5); 3.7505 (11.9); 3.7270 (2.4); 3.2127 (2.2); 3.2093 (2.0); 3.1694 (2.0); 3.1660 (1.8); 2.4160 (0.6); 2.3990 (0.9); 2.3862 (1.0); 2.3819 (1.2); 2.3693 (1.0); 2.3646 (0.7); 2.3521 (1.0); 2.3346 (0.5); 2.2651 (0.6); 2.1767 (0.5); 1.7169 (16.0); 1.5519 (8.1); -0.0002 (13.3)
I-56	<sup>1</sup> H-NMR(400.0 MHz, CDCl <sub>3</sub> ): δ= 7.2602 (70.1); 7.1772 (4.1); 7.1582 (4.2); 6.9440 (1.7); 6.9241 (1.5); 6.9183 (1.7); 6.9128 (1.5); 6.8967 (2.4); 6.8913 (2.3); 6.8751 (1.4); 6.8696 (1.3); 6.1887 (1.1); 6.1731 (1.2); 6.1620 (1.3); 6.1460 (2.5); 6.1300 (1.5); 6.1190 (1.4); 6.1032 (1.5); 5.5554 (2.9); 5.5500 (3.0); 5.5122 (2.6); 5.5069 (2.7); 5.3632 (4.1); 5.3365 (3.9); 4.6264 (1.9); 4.6074 (3.2); 4.5884 (2.3); 4.5516 (1.8); 4.1567 (1.2); 4.1438 (1.5); 4.1392 (1.6); 4.1326 (1.8); 4.1263 (1.6); 4.1198 (1.8); 4.1152 (1.8); 4.1025 (1.5); 3.9348 (2.3); 3.9161 (2.4); 3.8917 (2.6); 3.8730 (2.8); 3.8349 (1.3); 3.8153 (2.5); 3.7911 (1.3); 3.7857 (1.3); 3.7620 (15.4); 3.7515 (16.0); 3.3388 (3.9); 3.2956 (3.4); 2.4196 (0.5); 2.4120 (0.6); 2.4024 (1.0); 2.3945 (1.1); 2.3854 (1.5); 2.3775 (1.5); 2.3682 (1.8); 2.3604 (1.8); 2.3507 (1.1); 2.3428 (1.0); 2.2829 (0.7); 2.2757 (0.7); 2.2625 (0.7); 2.2552 (0.8); 2.2273 (1.1); 2.2198 (1.1); 2.2062 (0.8); 2.1984 (0.8); 2.1722 (0.6); 1.5419 (18.5); -0.0002 (29.5)

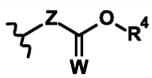
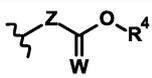
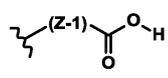
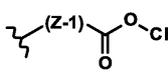
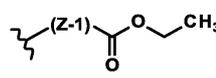
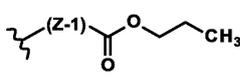
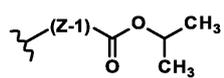
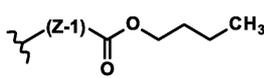
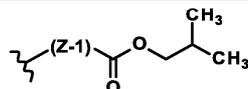
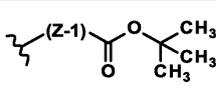
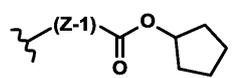
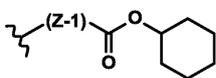
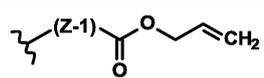
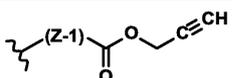
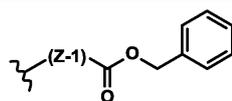
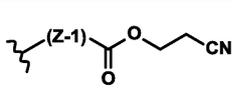
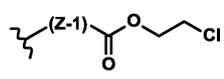
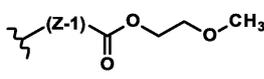
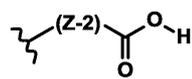
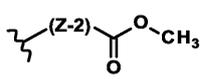
Аналогично вышеуказанным названным примерам получения и учитывая общие данные для изготовления замещенных изоксазолин-карбоксамидов, могут быть получены следующие названные соединения.

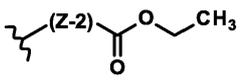
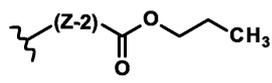
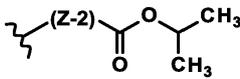
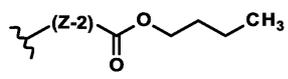
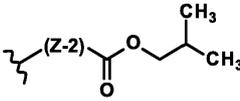
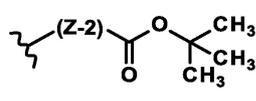
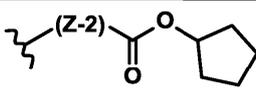
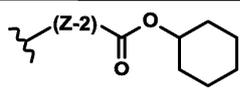
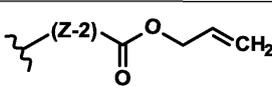
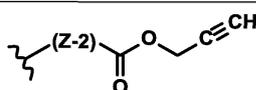
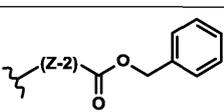
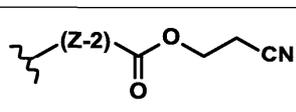
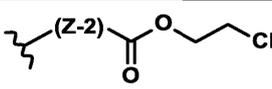
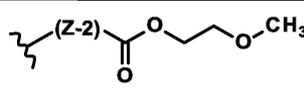
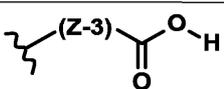
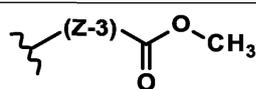
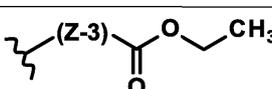
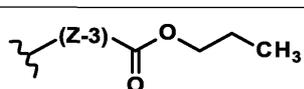
Таблица 2.1: Соединения согласно изобретению 2.1-1 - 2.1-240 общей формулы (I.1), где Z(C=W)-O-R<sup>4</sup> имеет значение, как определено ниже.

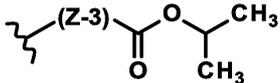
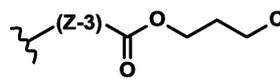
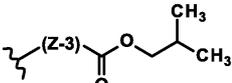
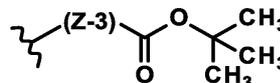
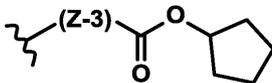
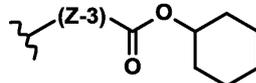
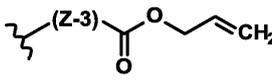
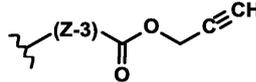
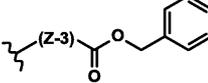
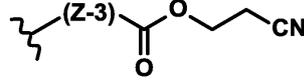
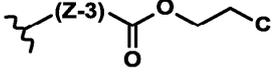
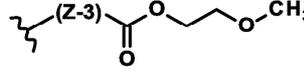
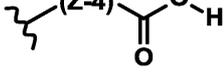
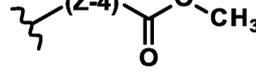
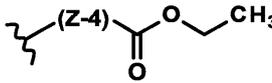
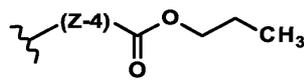
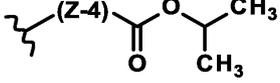
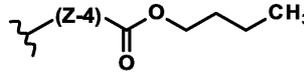


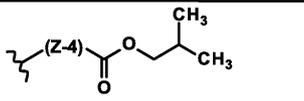
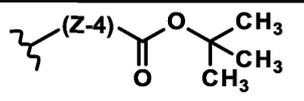
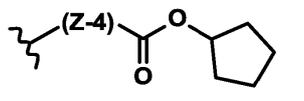
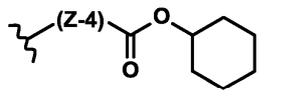
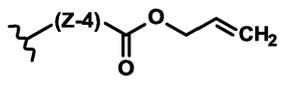
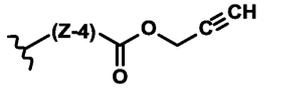
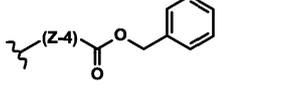
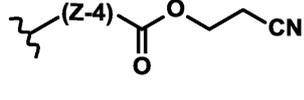
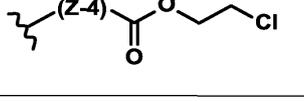
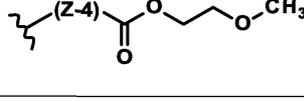
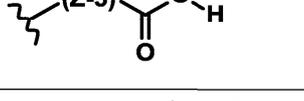
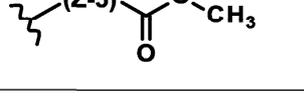
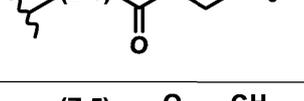
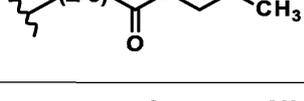
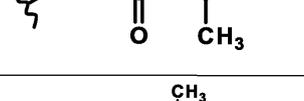
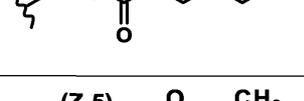
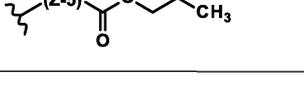
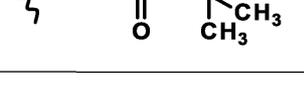
(I.1),

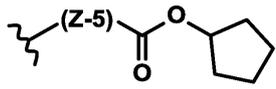
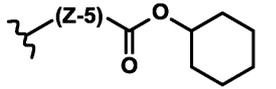
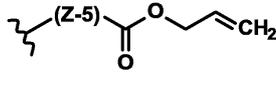
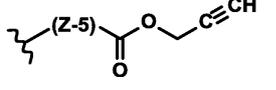
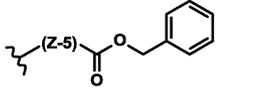
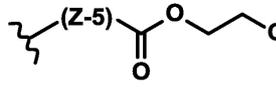
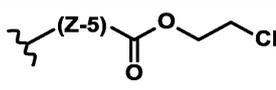
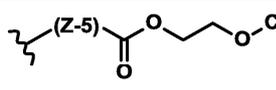
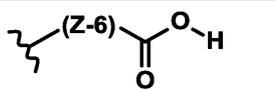
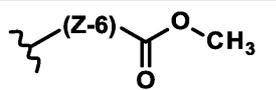
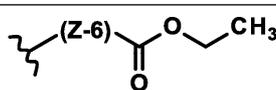
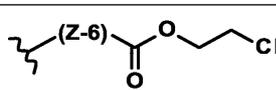
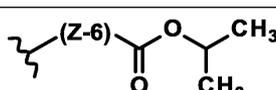
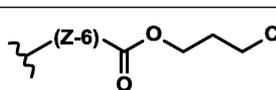
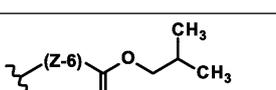
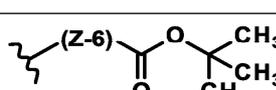
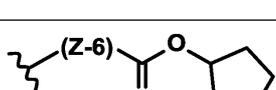
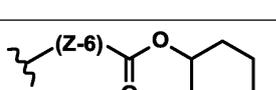
Таблица 2.1

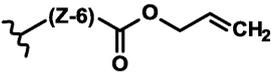
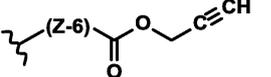
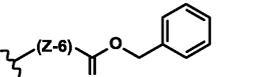
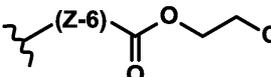
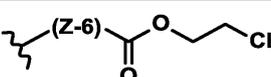
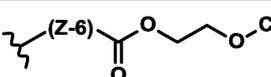
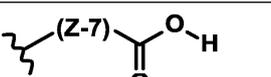
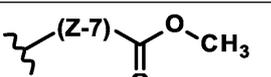
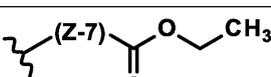
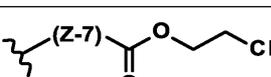
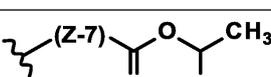
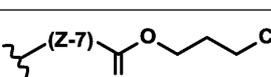
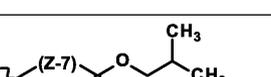
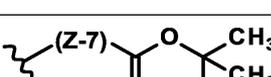
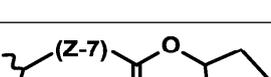
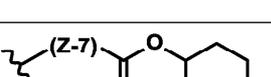
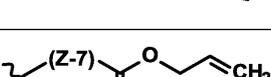
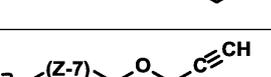
№		№	
2.1-1		2.1-2	
2.1-3		2.1-4	
2.1-5		2.1-6	
2.1-7		2.1-8	
2.1-9		2.1-10	
2.1-11		2.1-12	
2.1-13		2.1-14	
2.1-15		2.1-16	
2.1-17		2.1-18	

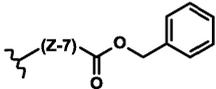
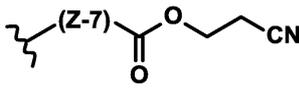
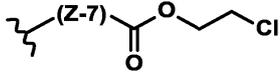
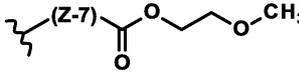
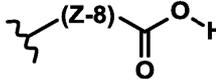
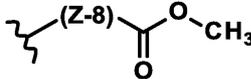
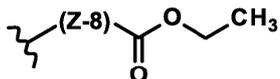
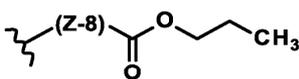
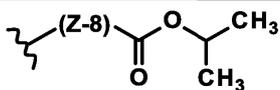
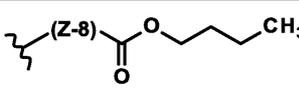
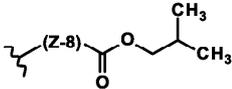
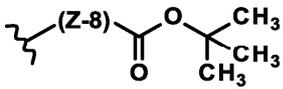
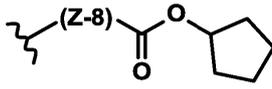
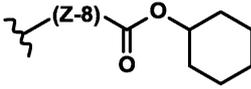
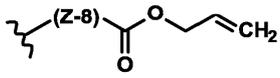
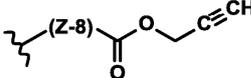
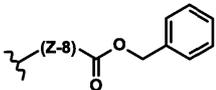
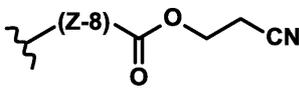
2.1-19		2.1-20	
2.1-21		2.1-22	
2.1-23		2.1-24	
2.1-25		2.1-26	
2.1-27		2.1-28	
2.1-29		2.1-30	
2.1-31		2.1-32	
2.1-33		2.1-34	
2.1-35		2.1-36	

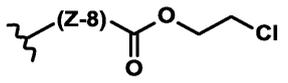
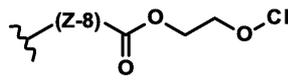
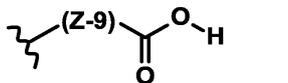
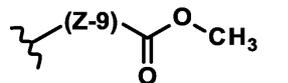
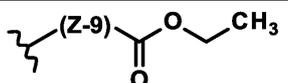
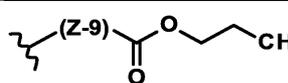
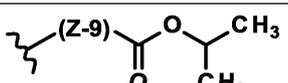
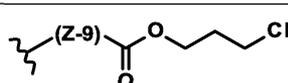
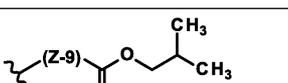
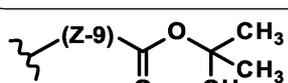
2.1-37		2.1-38	
2.1-39		2.1-40	
2.1-41		2.1-42	
2.1-43		2.1-44	
2.1-45		2.1-46	
2.1-47		2.1-48	
2.1-49		2.1-50	
2.1-51		2.1-52	
2.1-53		2.1-54	

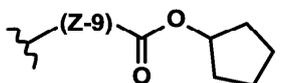
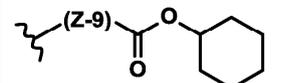
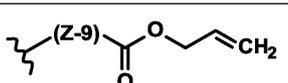
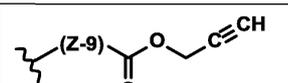
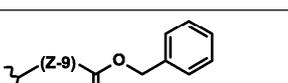
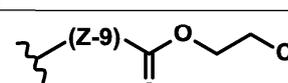
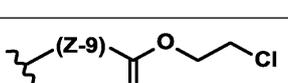
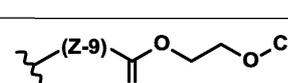
2.1-55		2.1-56	
2.1-57		2.1-58	
2.1-59		2.1-60	
2.1-61		2.1-62	
2.1-63		2.1-64	
2.1-65		2.1-66	
2.1-67		2.1-68	
2.1-69		2.1-70	
2.1-71		2.1-72	

2.1-73		2.1-74	
2.1-75		2.1-76	
2.1-77		2.1-78	
2.1-79		2.1-80	
2.1-81		2.1-82	
2.1-83		2.1-84	
2.1-85		2.1-86	
2.1-87		2.1-88	
2.1-89		2.1-90	

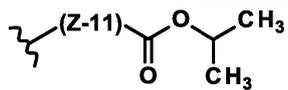
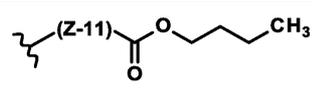
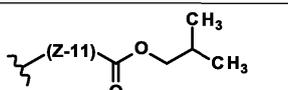
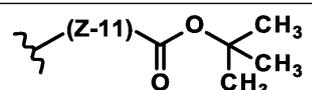
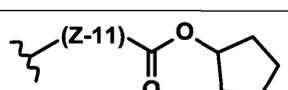
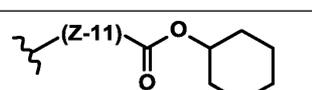
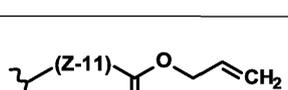
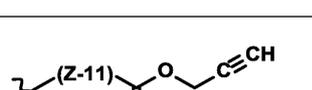
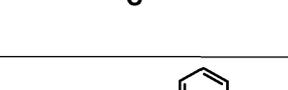
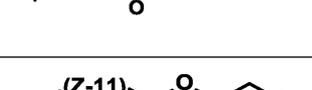
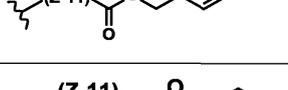
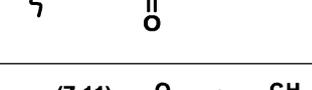
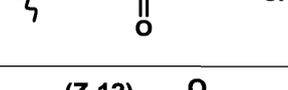
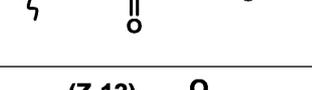
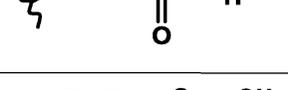
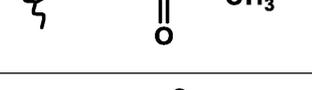
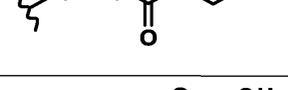
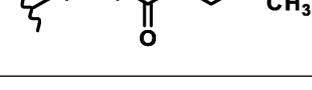
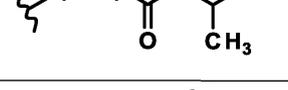
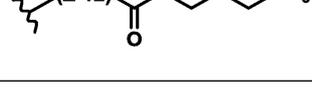
2.1-91		2.1-92	
2.1-93		2.1-94	
2.1-95		2.1-96	
2.1-97		2.1-98	
2.1-99		2.1-100	
2.1-101		2.1-102	
2.1-103		2.1-104	
2.1-105		2.1-106	
2.1-107		2.1-108	

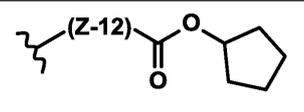
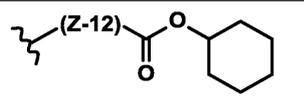
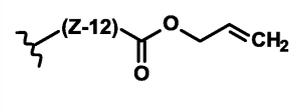
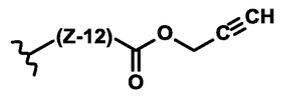
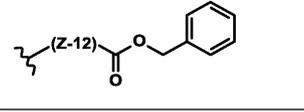
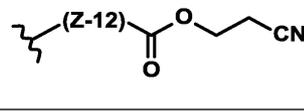
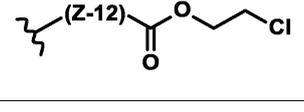
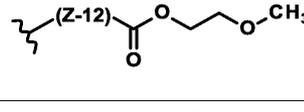
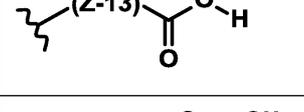
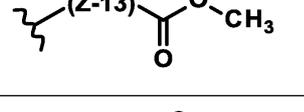
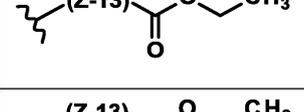
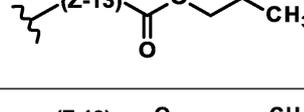
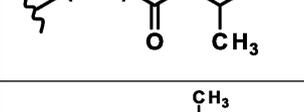
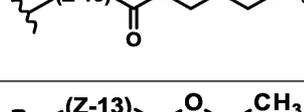
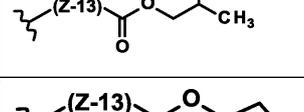
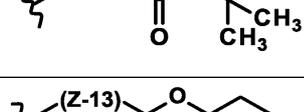
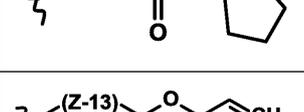
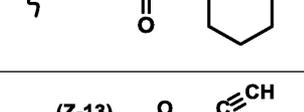
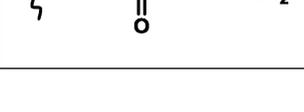
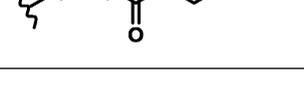
2.1-109		2.1-110	
2.1-111		2.1-112	
2.1-113		2.1-114	
2.1-115		2.1-116	
2.1-117		2.1-118	
2.1-119		2.1-120	
2.1-121		2.1-122	
2.1-123		2.1-124	
2.1-125		2.1-126	

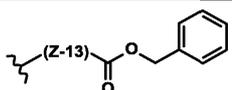
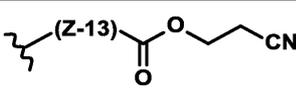
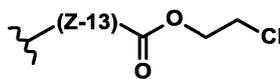
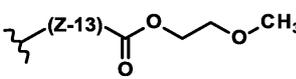
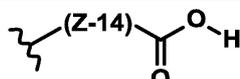
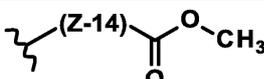
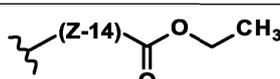
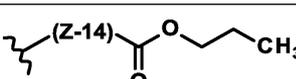
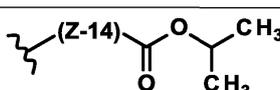
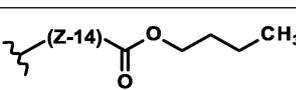
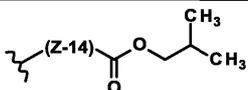
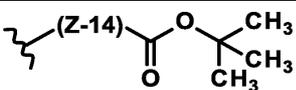
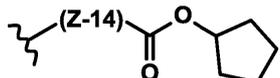
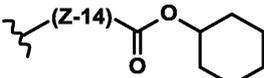
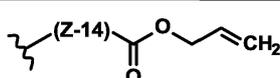
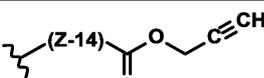
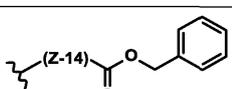
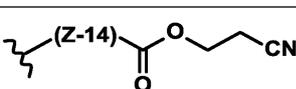
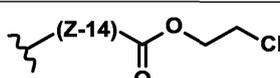
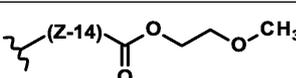
2.1-127		2.1-128	
2.1-129		2.1-130	
2.1-131		2.1-132	
2.1-133		2.1-134	
2.1-135		2.1-136	

2.1-137		2.1-138	
2.1-139		2.1-140	
2.1-141		2.1-142	
2.1-143		2.1-144	

2.1-145		2.1-146	
2.1-147		2.1-148	
2.1-149		2.1-150	
2.1-151		2.1-152	
2.1-153		2.1-154	
2.1-155		2.1-156	
2.1-157		2.1-158	
2.1-159		2.1-160	
2.1-161		2.1-162	
2.1-163		2.1-164	

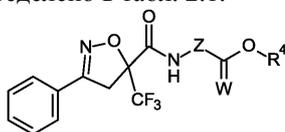
2.1-165		2.1-166	
2.1-167		2.1-168	
2.1-169		2.1-170	
2.1-171		2.1-172	
2.1-173		2.1-174	
2.1-175		2.1-176	
2.1-177		2.1-178	
2.1-179		2.1-180	
2.1-181		2.1-182	
2.1-183		2.1-184	

2.1-185		2.1-186	
2.1-187		2.1-188	
2.1-189		2.1-190	
2.1-191		2.1-192	
2.1-193		2.1-194	
2.1-195		2.1-196	
2.1-197		2.1-198	
2.1-199		2.1-200	
2.1-201		2.1-202	
2.1-203		2.1-204	

2.1-205		2.1-206	
2.1-207		2.1-208	
2.1-209		2.1-210	
2.1-211		2.1-212	
2.1-213		2.1-214	
2.1-215		2.1-216	
2.1-217		2.1-218	
2.1-219		2.1-220	
2.1-221		2.1-222	
2.1-223		2.1-224	

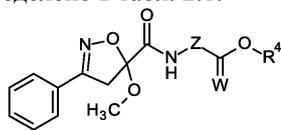
2.1-225		2.1-226	
2.1-227		2.1-228	
2.1-229		2.1-230	
2.1-231		2.1-232	
2.1-233		2.1-234	
2.1-235		2.1-236	
2.1-237		2.1-238	
2.1-239		2.1-240	

Таблица 2.2: Соединения 2.2-1 - 2.2-240 согласно изобретению общей формулы (I.2), где  $Z(C=W)-O-R^4$  имеет значение, как определено в табл. 2.1.



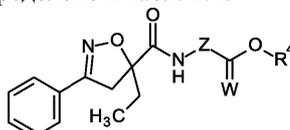
(I.2),

Таблица 2.3: Соединения 2.3-1 - 2.3-240 согласно изобретению общей формулы (I.3), где  $Z(C=W)-O-R^4$  имеет значение, как определено в табл. 2.1.



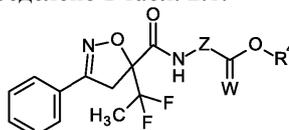
(I.3),

Таблица 2.4: Соединения 2.4-1 - 2.4-240 согласно изобретению общей формулы (I.4), где  $Z(C=W)-O-R^4$  имеет значение, как определено в табл. 2.1.



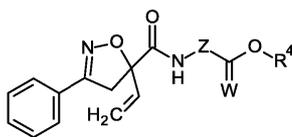
(I.4),

Таблица 2.5: Соединения 2.5-1 - 2.5-240 согласно изобретению общей формулы (I.5), где  $Z(C=W)-O-R^4$  имеет значение, как определено в табл. 2.1.



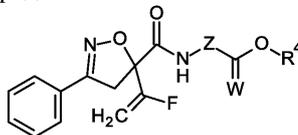
(I.5),

Таблица 2.6: Соединения 2.6-1 - 2.6-240 согласно изобретению общей формулы (I.6), где  $Z(C=W)-O-R^4$  имеет значение, как определено в табл. 2.1.



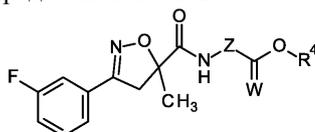
(I.6),

Таблица 2.7: Соединения 2.7-1 - 2.7-240 согласно изобретению общей формулы (I.7), где  $Z(C=W)-O-R^4$  имеет значение, как определено в табл. 2.1.



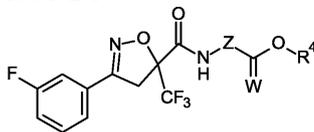
(I.7),

Таблица 2.8: Соединения 2.8-1 - 2.8-240 согласно изобретению общей формулы (I.8), где  $Z(C=W)-O-R^4$  имеет значение, как определено в табл. 2.1.



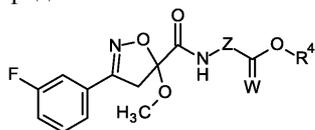
(I.8),

Таблица 2.9: Соединения 2.9-1 - 2.9-240 согласно изобретению общей формулы (I.9), где  $Z(C=W)-O-R^4$  имеет значение, как определено в табл. 2.1.



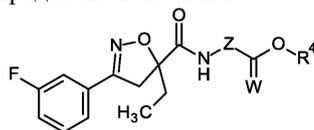
(I.9),

Таблица 2.10: Соединения 2.10-1 - 2.10-240 согласно изобретению общей формулы (I.10), где  $Z(C=W)-O-R^4$  имеет значение, как определено в табл. 2.1.



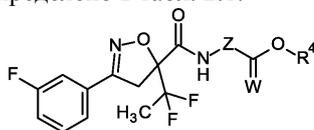
(I.10),

Таблица 2.11: Соединения 2.11-1 - 2.11-240 согласно изобретению общей формулы (I.11), где  $Z(C=W)-O-R^4$  имеет значение, как определено в табл. 2.1.



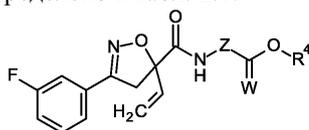
(I.11),

Таблица 2.12: Соединения 2.12-1 - 2.12-240 согласно изобретению общей формулы (I.12), где  $Z(C=W)-O-R^4$  имеет значение, как определено в табл. 2.1.



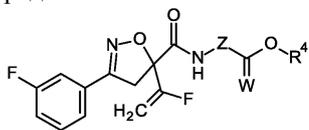
(I.12),

Таблица 2.13: Соединения 2.13-1 - 2.13-240 согласно изобретению общей формулы (I.13), где  $Z(C=W)-O-R^4$  имеет значение, как определено в табл. 2.1.



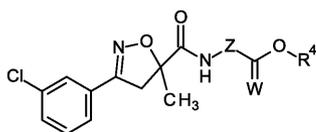
(I.13),

Таблица 2.14: Соединения 2.14-1 - 2.14-240 согласно изобретению общей формулы (I.14), где  $Z(C=W)-O-R^4$  имеет значение, как определено в табл. 2.1.



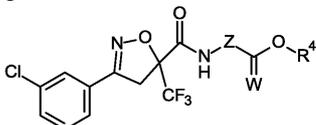
(I.14),

Таблица 2.15: Соединения 2.15-1 - 2.15-240 согласно изобретению общей формулы (I.15), где  $Z(C=W)-O-R^4$  имеет значение, как определено в табл. 2.1.



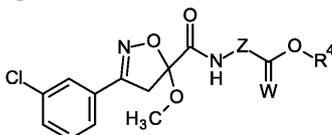
(I.15),

Таблица 2.16: Соединения 2.16-1 - 2.16-240 согласно изобретению общей формулы (I.16), где  $Z(C=W)-O-R^4$  имеет значение, как определено в табл. 2.1.



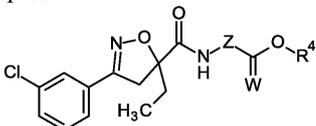
(I.16),

Таблица 2.17: Соединения 2.17-1 - 2.17-240 согласно изобретению общей формулы (I.17), где  $Z(C=W)-O-R^4$  имеет значение, как определено в табл. 2.1.



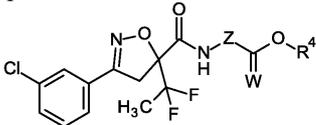
(I.17),

Таблица 2.18: Соединения 2.18-1 - 2.18-240 согласно изобретению общей формулы (I.18), где  $Z(C=W)-O-R^4$  имеет значение, как определено в табл. 2.1.



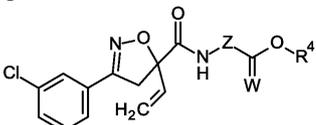
(I.18),

Таблица 2.19: Соединения 2.19-1 - 2.19-240 согласно изобретению общей формулы (I.19), где  $Z(C=W)-O-R^4$  имеет значение, как определено в табл. 2.1.



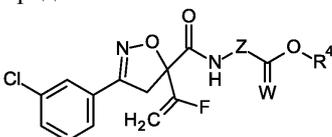
(I.19),

Таблица 2.20: Соединения 2.20-1 - 2.20-240 согласно изобретению общей формулы (I.20), где  $Z(C=W)-O-R^4$  имеет значение, как определено в табл. 2.1.



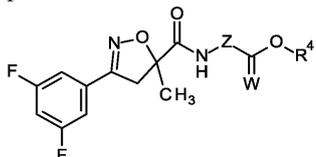
(I.20),

Таблица 2.21: Соединения 2.21-1 - 2.21-240 согласно изобретению общей формулы (I.21), где  $Z(C=W)-O-R^4$  имеет значение, как определено в табл. 2.1.



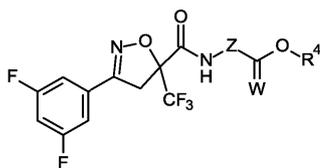
(I.21),

Таблица 2.22: Соединения 2.22-1 - 2.22-240 согласно изобретению общей формулы (I.22), где  $Z(C=W)-O-R^4$  имеет значение, как определено в табл. 2.1.



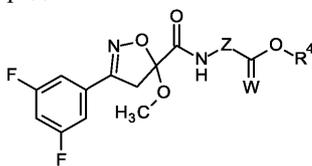
(I.22),

Таблица 2.23: Соединения 2.23-1 - 2.23-240 согласно изобретению общей формулы (I.23), где  $Z(C=W)-O-R^4$  имеет значение, как определено в табл. 2.1.



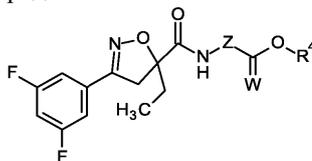
(I.23),

Таблица 2.24: Соединения 2.24-1 - 2.24-240 согласно изобретению общей формулы (I.24), где  $Z(C=W)-O-R^4$  имеет значение, как определено в табл. 2.1.



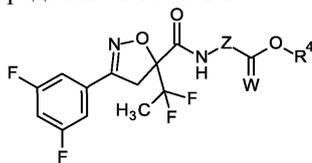
(I.24),

Таблица 2.25: Соединения 2.25-1 - 2.25-240 согласно изобретению общей формулы (I.25), где  $Z(C=W)-O-R^4$  имеет значение, как определено в табл. 2.1.



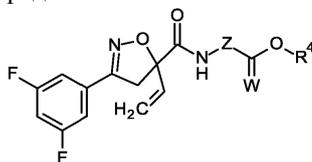
(I.25),

Таблица 2.26: Соединения 2.26-1 - 2.26-240 согласно изобретению общей формулы (I.26), где  $Z(C=W)-O-R^4$  имеет значение, как определено в табл. 2.1.



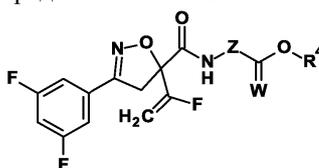
(I.26),

Таблица 2.27: Соединения 2.27-1 - 2.27-240 согласно изобретению общей формулы (I.27), где  $Z(C=W)-O-R^4$  имеет значение, как определено в табл. 2.1.



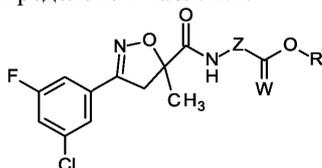
(I.27),

Таблица 2.28: Соединения 2.28-1 - 2.28-240 согласно изобретению общей формулы (I.28), где  $Z(C=W)-O-R^4$  имеет значение, как определено в табл. 2.1.



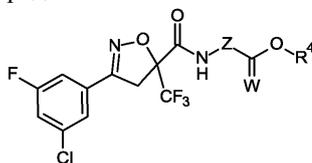
(I.28),

Таблица 2.29: Соединения 2.29-1 - 2.29-240 согласно изобретению общей формулы (I.29), где  $Z(C=W)-O-R^4$  имеет значение, как определено в табл. 2.1.



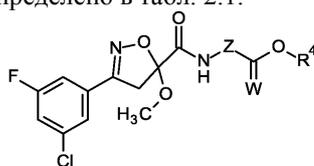
(I.29),

Таблица 2.30: Соединения 2.30-1 - 2.30-240 согласно изобретению общей формулы (I.30), где  $Z(C=W)-O-R^4$  имеет значение, как определено в табл. 2.1.



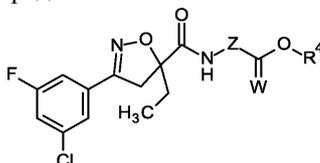
(I.30),

Таблица 2.31: Соединения 2.31-1 - 2.31-240 согласно изобретению общей формулы (I.31), где  $Z(C=W)-O-R^4$  имеет значение, как определено в табл. 2.1.



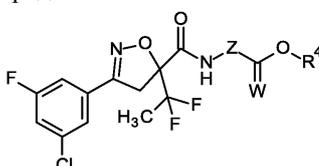
(I.31),

Таблица 2.32: Соединения 2.32-1 - 2.32-240 согласно изобретению общей формулы (I.32), где  $Z(C=W)-O-R^4$  имеет значение, как определено в табл. 2.1.



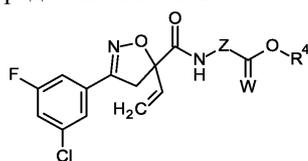
(I.32),

Таблица 2.33: Соединения 2.33-1 - 2.33-240 согласно изобретению общей формулы (I.33), где  $Z(C=W)-O-R^4$  имеет значение, как определено в табл. 2.1.



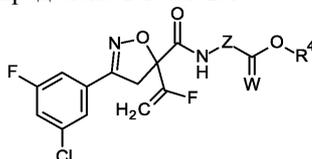
(I.33),

Таблица 2.34: Соединения 2.34-1 - 2.34-240 согласно изобретению общей формулы (I.34), где  $Z(C=W)-O-R^4$  имеет значение, как определено в табл. 2.1.



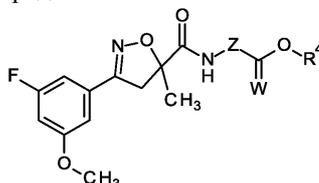
(I.34),

Таблица 2.35: Соединения 2.35-1 - 2.35-240 согласно изобретению общей формулы (I.35), где  $Z(C=W)-O-R^4$  имеет значение, как определено в табл. 2.1.



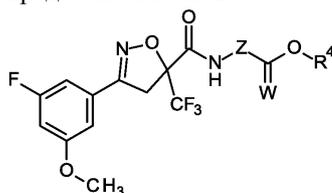
(I.35),

Таблица 2.36: Соединения 2.36-1 - 2.36-240 согласно изобретению общей формулы (I.36), где  $Z(C=W)-O-R^4$  имеет значение, как определено в табл. 2.1.



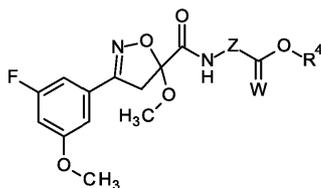
(I.36),

Таблица 2.37: Соединения 2.37-1 - 2.37-240 согласно изобретению общей формулы (I.37), где  $Z(C=W)-O-R^4$  имеет значение, как определено в табл. 2.1.



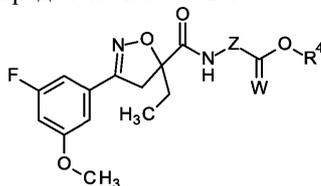
(I.37),

Таблица 2.38: Соединения 2.38-1 - 2.38-240 согласно изобретению общей формулы (I.38), где  $Z(C=W)-O-R^4$  имеет значение, как определено в табл. 2.1.



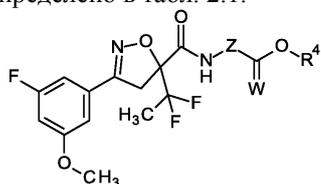
(I.38),

Таблица 2.39: Соединения 2.39-1 - 2.39-240 согласно изобретению общей формулы (I.39), где  $Z(C=W)-O-R^4$  имеет значение, как определено в табл. 2.1.



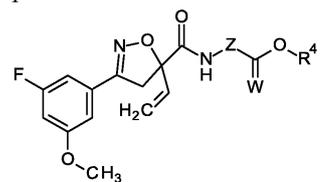
(I.39),

Таблица 2.40: Соединения 2.40-1 - 2.40-240 согласно изобретению общей формулы (I.40), где  $Z(C=W)-O-R^4$  имеет значение, как определено в табл. 2.1.



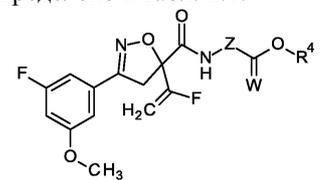
(I.40),

Таблица 2.41: Соединения 2.41-1 - 2.41-240 согласно изобретению общей формулы (I.41), где  $Z(C=W)-O-R^4$  имеет значение, как определено в табл. 2.1.



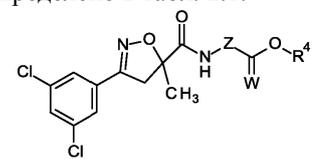
(I.41),

Таблица 2.42: Соединения 2.42-1 - 2.42-240 согласно изобретению общей формулы (I.42), где  $Z(C=W)-O-R^4$  имеет значение, как определено в табл. 2.1.



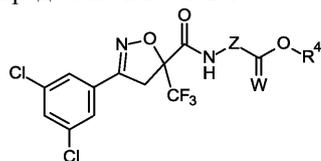
(I.42),

Таблица 2.43: Соединения 2.43-1 - 2.43-240 согласно изобретению общей формулы (I.43), где  $Z(C=W)-O-R^4$  имеет значение, как определено в табл. 2.1.



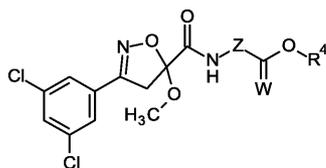
(I.43),

Таблица 2.44: Соединения 2.44-1 - 2.44-240 согласно изобретению общей формулы (I.44), где  $Z(C=W)-O-R^4$  имеет значение, как определено в табл. 2.1.



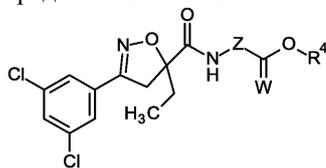
(I.44),

Таблица 2.45: Соединения 2.45-1 - 2.45-240 согласно изобретению общей формулы (I.45), где  $Z(C=W)-O-R^4$  имеет значение, как определено в табл. 2.1.



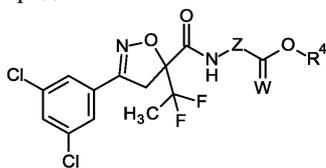
(I.45),

Таблица 2.46: Соединения 2.46-1 - 2.46-240 согласно изобретению общей формулы (I.46), где  $Z(C=W)-O-R^4$  имеет значение, как определено в табл. 2.1.



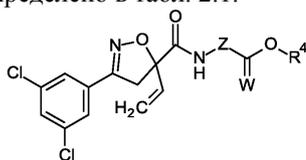
(I.46),

Таблица 2.47: Соединения 2.47 - 2.47-240 согласно изобретению общей формулы (I.47), где  $Z(C=W)-O-R^4$  имеет значение, как определено в табл. 2.1.



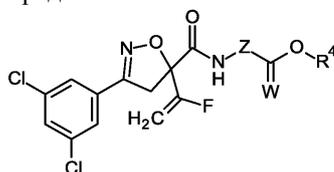
(I.47),

Таблица 2.48: Соединения 2.48-1 - 2.48-240 согласно изобретению общей формулы (I.48), где  $Z(C=W)-O-R^4$  имеет значение, как определено в табл. 2.1.



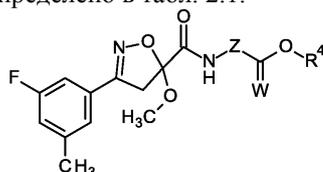
(I.48),

Таблица 2.49: Соединения 2.49-1 - 2.49-240 согласно изобретению общей формулы (I.49), где  $Z(C=W)-O-R^4$  имеет значение, как определено в табл. 2.1.



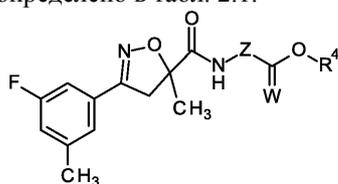
(I.49),

Таблица 2.50: Соединения 2.50-1 - 2.50-240 согласно изобретению общей формулы (I.50), где  $Z(C=W)-O-R^4$  имеет значение, как определено в табл. 2.1.



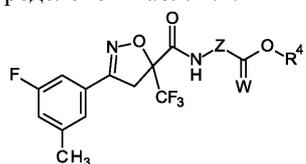
(I.50),

Таблица 2.51: Соединения 2.51-1 - 2.51-240 согласно изобретению общей формулы (I.51), где  $Z(C=W)-O-R^4$  имеет значение, как определено в табл. 2.1.



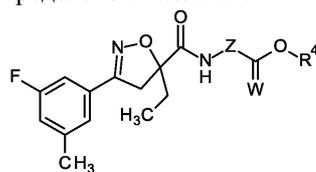
(I.51),

Таблица 2.52: Соединения 2.52-1 - 2.52-240 согласно изобретению общей формулы (I.52), где  $Z(C=W)-O-R^4$  имеет значение, как определено в табл. 2.1.



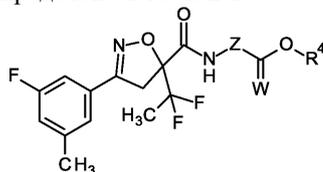
(I.52),

Таблица 2.53: Соединения 2.53-1 - 2.53-240 согласно изобретению общей формулы (I.53), где Z(C=W)-O-R<sup>4</sup> имеет значение, как определено в табл. 2.1.



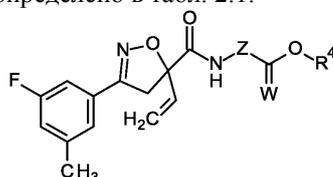
(I.53),

Таблица 2.54: Соединения 2.54-1 - 2.54-240 согласно изобретению общей формулы (I.54), где Z(C=W)-O-R<sup>4</sup> имеет значение, как определено в табл. 2.1.



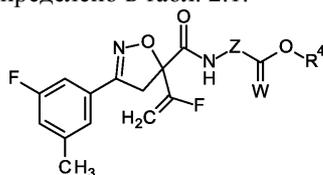
(I.54),

Таблица 2.55: Соединения 2.55-1 - 2.55-240 согласно изобретению общей формулы (I.55), где Z(C=W)-O-R<sup>4</sup> имеет значение, как определено в табл. 2.1.



(I.55),

Таблица 2.56: Соединения 2.56-1 - 2.56-240 согласно изобретению общей формулы (I.56), где Z(C=W)-O-R<sup>4</sup> имеет значение, как определено в табл. 2.1.



(I.56),

#### В. Примеры препаративных форм.

##### 1. Средства для опыления.

Средство для опыления может быть получено при смешивании 10 мас. ч. соединения общей формулы (I) и 90 мас. ч. талька в качестве инертного вещества и измельчении в молотковой дробилке.

##### 2. Диспергируемый порошок

Диспергируемый в воде, смачиваемый порошок получают при смешивании 25 мас. ч. соединения общей формулы (I), 64 мас. ч. содержащего каолин кварца в качестве инертного вещества, 10 мас. ч. лигнинсульфокислого калия и 1 мас. ч. олеилметилтауринкислого натрия в качестве смачивателя и диспергатора и измельчают в штифтовой дробилке.

##### 3. Дисперсионный концентрат.

Легкодиспергируемый в воде дисперсионный концентрат получают при смешивании 20 мас. ч. соединения общей формулы (I), 6 мас. ч. алкилфенолполигликолевого эфира (Triton® X 207), 3 мас. ч. изотридеканолполигликолевого эфира (8 EO) и 71 мас. части парафинового минерального масла (диапазон кипения, например, примерно 255-277°C) и измельчении в шаровой мялке до тонкости помола 5 мкм.

##### 4. Эмульгируемый концентрат.

Эмульгируемый концентрат получают из 15 мас. ч. соединения общей формулы (I), 75 мас. ч. циклогексана в качестве растворителя и 10 мас. ч. оксоэтилированного нонилфенола в качестве эмульгатора.

##### 5. Вододиспергируемый гранулят.

Диспергируемый в воде гранулят получают при смешивании 75 мас. ч. соединения формулы (I), 10" лигнинсульфокислого кальция, 5" лаурилсульфата натрия, 3" поливинилового спирта и 7" каолина, измельчении в штифтовой дробилке и гранулировании порошка в псевдооживленном слое с помощью разбрызгивания воды в качестве гранулирующей жидкости.

Также получают диспергируемый в воде гранулят, в котором 25 мас. ч. соединения формулы (I), 5" 2,2"-динафтил-6,6"-дисульфонокислого натрия, 2" олеилметилтауринкислого натрия, 1" поливинилового спирта, 17" карбоната кальция и 50" воды гомогенизируют на коллоидной мельнице и предварительно измельчают, затем измельчают в бисерной мельнице и полученную таким образом суспензию распыляют и в скруббере и с помощью моносола и высушивают.

#### С. Биологические примеры.

Описание опытов.

1. Гербицидное действие и совместимость с культурными растениями в предвсходовый период.

Семена одно- или двудольных сорных или культурных растений поместили в пластиковые горшки или горшки из древесного волокна и присыпали землей. На поверхность земли нанесли соединения согласно изобретению, представленные порошком для смачивания (WP) или эмульсионным концентратом (EC), в виде водной суспензии или эмульсии с добавлением 0,5% добавок с нормой расхода воды, рассчитанной как 600 л/га. После обработки горшки поместили в теплицу и создали хорошие условия роста для испытуемых растений. Примерно 3 недели визуально оценили действие препаратов по сравнению с необработанной контрольной группой в процентном отношении. Например, 100% действие = растения погибли, 0% действие = как контрольные растения.

В следующей таблице использовались следующие сокращения.

Нежелательные растения/сорняки:

ABUTH: *Abutilon theophrasti* ALOMY: *Alopecurus myosuroides*

AMARE: *Amaranthus retroflexus* AVEFA: *Avena fatua*

ECHCG: *Echinochloa crus-galli* HORMU: *Hordeum murinum*

LOLRI: *Lolium rigidum* PHBPU: *Pharbitis purpurea*

POLCO: *Polygonum convolvulus* SETVI: *Setaria viridis*

STEME: *Stellaria media* VERPE: *Veronica persica*

VIOTR: *Viola tricolor*

Таблица С1. Гербицидное действие в предвсходовый период против ALOMY в %

Пример №	Дозировка [г/га]	ALOMY
I-49	80	100
I-11	80	100
I-48	80	100
I-35	80	100
I-36	80	100
I-37	80	100
I-38	80	100
I-45	80	100
I-42	80	100
I-10	80	100
I-44	80	100
I-12	80	100
I-43	80	100
I-41	80	100
I-21	80	100
I-46	80	100
I-09	80	100
I-26	80	100
I-30	80	100
I-28	80	100
I-29	80	90
I-27	80	90
I-06	80	80

I-01	80	100
I-34	80	100
I-32	80	100
I-33	80	100
I-19	80	90
I-23	80	90

Таблица С2. Гербицидное действие в предвсходовый период против AVEVA в %

Пример №	Дозировка [г/га]	AVEVA
I-49	80	100
I-11	80	100
I-48	80	100
I-35	80	100
I-36	80	100
I-37	80	100
I-38	80	90
I-45	80	100
I-42	80	90
I-10	80	100
I-44	80	90
I-12	80	100
I-43	80	100
I-41	80	100
I-21	80	90
I-46	80	80
I-09	80	90
I-26	80	90
I-30	80	80
I-28	80	100
I-29	80	80
I-27	80	90
I-06	80	90
I-01	80	90
I-34	80	80
I-19	80	80
I-23	80	90

Таблица С3. Гербицидное действие в предвсходовый период против ECHCG в %

Пример №	Дозировка [г/га]	ECHCG
I-49	80	100
I-11	80	100
I-48	80	90
I-35	80	100
I-36	80	100
I-37	80	90
I-38	80	100
I-45	80	100
I-42	80	100
I-10	80	100
I-44	80	90
I-12	80	90
I-43	80	100
I-41	80	100
I-21	80	100
I-46	80	90
I-09	80	90
I-26	80	90
I-28	80	90
I-06	80	80
I-01	80	80
I-34	80	80

Таблица С4. Гербицидное действие в предвсходовый период против LOLRI в %

Пример №	Дозировка [г/га]	LOLRI
I-49	80	100
I-11	80	100
I-48	80	100
I-35	80	100
I-36	80	100
I-37	80	100
I-38	80	100
I-45	80	100
I-42	80	100
I-10	80	100
I-44	80	100
I-12	80	100
I-43	80	100
I-41	80	100
I-46	80	100
I-30	80	100
I-34	80	100
I-32	80	100
I-39	80	100

Таблица С5. Гербицидное действие в предсходный период против SETVI в %

Пример №	Дозировка [г/га]	SETVI
I-49	80	100
I-11	80	100
I-48	80	100
I-35	80	100
I-36	80	100
I-37	80	100
I-38	80	100
I-45	80	100
I-42	80	100
I-10	80	100
I-44	80	100
I-12	80	100
I-43	80	100
I-41	80	100
I-21	80	90
I-46	80	100
I-09	80	80
I-26	80	100
I-30	80	100
I-34	80	90
I-32	80	100
I-33	80	100
I-05	80	90

Таблица С6. Гербицидное действие в предсходный период против ABUTH в %

Пример №	Дозировка [г/га]	ABUTH
I-11	80	80
I-10	80	100
I-09	80	100
I-06	80	100
I-08	80	100
I-04	80	100
I-02	80	100
I-14	80	100

Таблица С7. Гербицидное действие в предвсходовый период против AMARE в %

Пример №	Дозировка [г/га]	AMARE
I-49	80	100
I-11	80	100
I-48	80	100
I-35	80	100
I-36	80	100
I-37	80	100
I-38	80	100
I-45	80	100
I-42	80	100
I-10	80	90
I-44	80	90
I-12	80	100
I-43	80	90
I-41	80	90
I-21	80	100
I-46	80	90
I-09	80	80
I-26	80	100
I-30	80	80
I-28	80	90
I-29	80	90
I-27	80	90
I-32	80	90
I-23	80	80
I-03	80	80
I-24	80	80
I-07	80	90

Таблица С8. Гербицидное действие в предсходный период против РНВРУ в %

Пример №	Дозировка [г/га]	РНВРУ
I-49	80	90
I-11	80	100
I-48	80	90
I-35	80	90
I-36	80	90
I-37	80	90
I-45	80	90
I-42	80	90
I-10	80	80
I-44	80	80
I-41	80	90
I-21	80	80
I-26	80	90
I-28	80	90
I-06	80	80

Таблица С9. Гербицидное действие в предсходный период против POLCO в %

Пример №	Дозировка [г/га]	POLCO
I-49	80	100
I-11	80	100
I-48	80	100
I-35	80	100
I-36	80	100
I-37	80	100

039486

I-38	80	100
I-45	80	100
I-42	80	100
I-44	80	100
I-12	80	100
I-43	80	100
I-41	80	90
I-10	80	100
I-21	80	90
I-46	80	90
I-09	80	100
I-30	80	90
I-29	80	100
I-27	80	80
I-06	80	100
I-01	80	80
I-34	80	90
I-32	80	90
I-33	80	90
I-19	80	90
I-39	80	80
I-08	80	80
I-47	80	90
I-03	80	80
I-04	80	90
I-05	80	80
I-07	80	80

Таблица С10. Гербицидное действие в предвсходовый период против STEME в %

Пример №	Дозировка [г/га]	STEME
I-49	80	100
I-11	80	100
I-48	80	100
I-35	80	100
I-36	80	100
I-37	80	100
I-38	80	100
I-45	80	100
I-42	80	100
I-10	80	100
I-44	80	90
I-12	80	100
I-43	80	100
I-41	80	100
I-21	80	100
I-46	80	100
I-26	80	100
I-30	80	90
I-28	80	100
I-29	80	90
I-27	80	90
I-01	80	90
I-34	80	90
I-32	80	90
I-33	80	100
I-19	80	80
I-25	80	100

Таблица С11. Гербицидное действие в предвсходовый период против VIOTR в %

Пример №	Дозировка [г/га]	VIOTR
I-49	80	100
I-11	80	100
I-48	80	100
I-35	80	100
I-36	80	100
I-37	80	100
I-38	80	100
I-45	80	100
I-42	80	100
I-10	80	100
I-44	80	80
I-12	80	100
I-43	80	90
I-27	80	90
I-06	80	80

Таблица С12. Гербицидное действие в предвсходовый период против VERPE в %

Пример №	Дозировка [г/га]	VERPE
I-49	80	100
I-11	80	100
I-48	80	100
I-35	80	100
I-36	80	100
I-37	80	100
I-38	80	100
I-45	80	80
I-42	80	90
I-10	80	100
I-44	80	80
I-12	80	100
I-43	80	90
I-21	80	100
I-46	80	80
I-09	80	90
I-26	80	100
I-28	80	90
I-29	80	100
I-27	80	90
I-01	80	80
I-33	80	100
I-19	80	90
I-08	80	90
I-25	80	100
I-24	80	100

Таблица С13. Гербицидное действие в предвсходовый период против NORMU в %

Пример №	Дозировка [г/га]	NORMU
I-49	80	100
I-11	80	100
I-48	80	100
I-35	80	100
I-36	80	90
I-37	80	100

I-38	80	90
I-45	80	100
I-42	80	100
I-10	80	100
I-44	80	100
I-12	80	100
I-43	80	90
I-41	80	100
I-46	80	100
I-30	80	90
I-33	80	80
I-39	80	100
I-47	80	90

Как показывают результаты, соединения согласно изобретению, как, например, соединения № I-21 и другие соединения из таблиц (I-10, I-26, I-09, I-30, I-28, I-29, I-27, I-01, I-06, I-34, I-32, I-33, I-19, I-11, I-12, I-35, I-36, I-37, I-38, I-41, I-42, I-43, I-44, I-46, I-49), при обработке в предсходовой период показывают очень хорошую эффективность (80-100% гербицидное действие) против вредных растений, как *Abutilon theophrasti*, *Alopecurus myosuroides*, *Amaranthus retroflexus*, *Avena fatua*, *Echinochloa crus-galli*, *Hordeum murinum*, *Lolium rigidum*, *Pharbitis purpurea*, *Polygonum convolvulus*, *Setaria viridis*, *Stellaria media*, *Veronica persica* и *Viola tricolor* при норме расхода 0.08 кг активного действующего вещества или менее на гектар.

## 2. Гербицидное действие и совместимость с культурными растениями в послевсходовый период.

Семена одно- или двудольных сорных или культурных растений поместили в пластиковые или деревянные горшки в песчаный суглинок, присыпали землей и выращивали в теплице, контролируя условия роста. Через 2-3 недели после посева испытуемые растения обработали на стадии первого листа. На зеленые части растений распылили соединения согласно изобретению, представленные порошком для смачивания (WP) или эмульсионным концентратом (EC), в виде водной суспензии или эмульсии с добавлением 0,5% добавок с нормой расхода воды, рассчитанной как 600 л/га. Примерно 3 недели испытуемые растения находились в теплице, в оптимальных условиях роста, визуально оценили действие препаратов по сравнению с необработанной контрольной группой. Например, 100% действие = растения погибли, 0% действие = как контрольные растения.

Таблица С14. Гербицидное действие в послевсходовый период против АЛОМУ в %

Пример №	Дозировка [г/га]	АЛОМУ
I-54	320	90
I-10	320	100
I-56	320	90
I-53	320	90
I-52	320	90
I-48	320	90
I-55	320	90
I-50	320	90
I-46	320	100
I-51	320	100
I-42	320	100
I-36	320	90
I-43	320	100
I-44	320	100
I-45	320	100
I-19	320	90
I-06	320	90
I-41	320	100
I-28	320	90
I-35	320	100
I-01	320	100
I-38	320	90

039486

I-39	320	100
I-47	320	100
I-32	320	90
I-11	320	90
I-12	320	90
I-29	320	90
I-26	320	90
I-33	320	100
I-34	320	100
I-21	320	90
I-49	320	90
I-09	320	90
I-04	320	90
I-30	320	100
I-14	320	100
I-05	320	90
I-03	320	90
I-20	320	90
I-27	320	90
I-40	320	90
I-07	320	90
I-23	320	100
I-25	320	100
I-13	320	90
I-02	320	80
I-24	320	90
I-18	320	80

Таблица С15. Гербицидное действие в послевсходовый период против AVEFA в %

Пример №	Дозировка [г/га]	AVEFA
I-54	320	90
I-10	320	100
I-56	320	100
I-53	320	90
I-52	320	90
I-48	320	80
I-55	320	90
I-50	320	100
I-46	320	100
I-51	320	100
I-42	320	100
I-36	320	90
I-43	320	100
I-44	320	100
I-45	320	100
I-19	320	100
I-06	320	90
I-41	320	100
I-28	320	100
I-35	320	100
I-01	320	100
I-38	320	90
I-39	320	100
I-47	320	100
I-32	320	100
I-11	320	100
I-12	320	100
I-37	320	100

I-29	320	90
I-26	320	90
I-33	320	100
I-34	320	100
I-21	320	90
I-49	320	80
I-09	320	90
I-04	320	100
I-30	320	100
I-14	320	100
I-05	320	100
I-03	320	80
I-20	320	90
I-27	320	90
I-07	320	90
I-23	320	100
I-25	320	100
I-13	320	90
I-08	320	100
I-24	320	90
I-18	320	100
I-17	320	80

Таблица С16. Гербицидное действие в послевсходовый период против ЕСНСГ в %

Пример №	Дозировка [г/га]	ЕСНСГ
I-54	320	90
I-10	320	100
I-56	320	90

039486

I-53	320	90
I-52	320	90
I-48	320	90
I-55	320	90
I-50	320	90
I-46	320	100
I-51	320	90
I-42	320	100
I-36	320	90
I-43	320	100
I-44	320	100
I-45	320	100
I-19	320	90
I-06	320	90
I-41	320	100
I-28	320	80
I-35	320	100
I-01	320	90
I-38	320	90
I-39	320	100
I-47	320	100
I-32	320	90
I-11	320	90
I-12	320	90
I-37	320	90
I-29	320	90
I-26	320	90
I-33	320	80
I-34	320	90
I-21	320	80
I-49	320	80
I-09	320	80
I-04	320	90
I-30	320	80
I-14	320	80
I-05	320	90
I-03	320	80
I-20	320	80
I-40	320	80
I-07	320	80
I-23	320	90
I-13	320	80
I-02	320	90
I-08	320	90

Таблица С17. Гербицидное действие в послевсходовый период против LOLRI в %

Пример №	Дозировка [г/га]	LOLRI
I-54	320	90
I-10	320	100
I-56	320	90
I-53	320	90
I-52	320	90
I-48	320	90
I-55	320	90
I-50	320	90
I-46	320	100
I-51	320	90
I-42	320	100
I-36	320	90
I-43	320	100
I-44	320	100
I-45	320	100
I-41	320	100
I-35	320	100
I-38	320	90
I-39	320	100
I-47	320	100
I-32	320	100
I-11	320	100
I-12	320	100
I-37	320	90
I-33	320	100
I-34	320	90
I-49	320	90
I-30	320	100
I-23	320	90
I-24	320	90

Таблица С18. Гербицидное действие в послевсходовый период против SETVI в %

Пример №	Дозировка [г/га]	SETVI
I-54	320	90
I-10	320	90
I-56	320	90
I-53	320	90
I-52	320	90
I-48	320	80

039486

I-55	320	90
I-50	320	90
I-46	320	80
I-51	320	90
I-42	320	90
I-36	320	80
I-43	320	80
I-44	320	90
I-45	320	90
I-19	320	80
I-06	320	80
I-41	320	90
I-28	320	80
I-35	320	90
I-01	320	90
I-38	320	100
I-39	320	90
I-47	320	80
I-32	320	90
I-11	320	90
I-12	320	90
I-37	320	80
I-29	320	80
I-26	320	80
I-33	320	90
I-34	320	90
I-21	320	80
I-09	320	80
I-04	320	80
I-30	320	90
I-14	320	80
I-05	320	90
I-03	320	80
I-20	320	80
I-27	320	80
I-40	320	80
I-07	320	80
I-13	320	80
I-02	320	80
I-08	320	80

Таблица С19. Гербицидное действие в послевсходовый период против АВУТН в %

Пример №	Дозировка [г/га]	АВУТН
I-54	320	90
I-10	320	90
I-56	320	90
I-53	320	90
I-52	320	90
I-48	320	80
I-55	320	90
I-50	320	90
I-46	320	80
I-51	320	80
I-42	320	80
I-36	320	90
I-43	320	80
I-44	320	80
I-45	320	80
I-19	320	80
I-41	320	80
I-28	320	80
I-35	320	80
I-01	320	80
I-38	320	80
I-39	320	80
I-47	320	80
I-32	320	80
I-11	320	90
I-12	320	90
I-37	320	80
I-29	320	80
I-34	320	80
I-25	320	80

Таблица С20. Гербицидное действие в послевсходовый период против АМАРЕ в %

Пример №	Дозировка [г/га]	АМАРЕ
I-54	320	80
I-10	320	80
I-56	320	90
I-53	320	90
I-52	320	90
I-48	320	80
I-55	320	80
I-50	320	80
I-46	320	80

039486

I-51	320	80
I-42	320	80
I-36	320	90
I-43	320	80
I-44	320	80
I-45	320	80
I-19	320	90
I-06	320	80
I-41	320	100
I-28	320	80
I-35	320	90
I-01	320	80
I-38	320	100
I-39	320	80
I-32	320	80
I-11	320	90
I-12	320	90
I-37	320	80
I-26	320	80
I-33	320	90
I-34	320	80
I-21	320	100
I-20	320	80
I-40	320	80
I-23	320	80

Таблица С21. Гербицидное действие в послевсходовый период против РНВРУ в %

Пример №	Дозировка [г/га]	РНВРУ
I-54	320	90
I-10	320	90
I-56	320	90
I-53	320	90
I-52	320	90
I-48	320	80
I-55	320	90
I-50	320	90
I-46	320	90
I-51	320	90
I-42	320	90
I-36	320	80
I-43	320	90
I-44	320	90
I-45	320	90
I-19	320	80
I-06	320	90
I-41	320	90
I-28	320	80
I-35	320	90
I-01	320	90
I-38	320	90
I-39	320	90
I-47	320	90
I-32	320	90
I-11	320	90
I-12	320	90
I-37	320	90

I-29	320	80
I-26	320	80
I-33	320	90
I-34	320	90
I-21	320	80
I-49	320	80
I-09	320	90
I-04	320	90
I-30	320	90
I-14	320	80
I-05	320	90
I-03	320	90
I-20	320	80
I-27	320	80
I-40	320	90
I-07	320	90
I-23	320	90
I-25	320	80
I-13	320	90
I-02	320	90
I-08	320	90
I-24	320	80

Таблица С22. Гербицидное действие в послевсходовый период против POLCO в %

Пример №	Дозировка [г/га]	POLCO
I-54	320	90
I-10	320	80
I-56	320	90

039486

I-53	320	90
I-52	320	90
I-48	320	80
I-55	320	90
I-50	320	90
I-46	320	80
I-51	320	90
I-42	320	80
I-36	320	80
I-43	320	80
I-44	320	80
I-45	320	80
I-19	320	80
I-06	320	80
I-41	320	90
I-28	320	80
I-01	320	80
I-39	320	80
I-47	320	80
I-32	320	80
I-11	320	90
I-12	320	90
I-29	320	80
I-33	320	80
I-49	320	80
I-09	320	80
I-04	320	80
I-30	320	80
I-14	320	90
I-05	320	90
I-03	320	80
I-20	320	80
I-27	320	80
I-40	320	80
I-07	320	80
I-23	320	90
I-25	320	90
I-13	320	80
I-02	320	90
I-08	320	80
I-24	320	90
I-17	320	90
I-22	320	90

Таблица С23. Гербицидное действие в послевсходовый период против STEME в %

Пример №	Дозировка [г/га]	STEME
I-54	320	90
I-10	320	90
I-56	320	90
I-53	320	90
I-52	320	90
I-48	320	90
I-55	320	90
I-50	320	90
I-46	320	90
I-51	320	90
I-42	320	90
I-36	320	90
I-43	320	100
I-44	320	90
I-45	320	90
I-19	320	90
I-06	320	80
I-41	320	90
I-28	320	80
I-35	320	90
I-01	320	90
I-38	320	90
I-39	320	90
I-47	320	90
I-32	320	90
I-11	320	90
I-12	320	90
I-37	320	90
I-29	320	80
I-26	320	90
I-33	320	90
I-34	320	90
I-21	320	80
I-49	320	90
I-09	320	90
I-04	320	90
I-30	320	90
I-14	320	90
I-05	320	90
I-03	320	90
I-20	320	80
I-27	320	80

## 039486

I-40	320	80
I-07	320	90
I-23	320	90
I-25	320	90

Таблица С24. Гербицидное действие в послевсходовый период против VIOTR в %

Пример №	Дозировка [г/га]	VIOTR
I-54	320	90
I-56	320	90
I-53	320	90
I-52	320	90
I-48	320	80
I-55	320	90
I-50	320	90
I-46	320	90
I-51	320	90
I-42	320	90
I-36	320	90
I-43	320	90
I-44	320	90
I-45	320	90
I-19	320	80
I-06	320	90
I-41	320	80
I-28	320	80
I-35	320	80
I-01	320	90
I-38	320	80
I-39	320	80
I-47	320	80
I-11	320	90
I-12	320	100
I-37	320	80
I-29	320	80
I-26	320	80
I-21	320	80
I-49	320	80
I-09	320	80
I-04	320	80
I-10	320	80
I-27	320	80
I-02	320	80
I-08	320	80

Таблица С25. Гербицидное действие в послевсходовый период против VERPE в %

Пример №	Дозировка [г/га]	VERPE
I-54	320	90
I-56	320	90
I-53	320	90
I-52	320	90
I-48	320	80
I-55	320	90
I-50	320	90
I-46	320	80
I-51	320	90
I-42	320	80
I-36	320	90
I-43	320	90
I-44	320	80
I-45	320	80
I-19	320	80
I-06	320	80
I-41	320	80
I-28	320	90
I-35	320	80
I-01	320	80
I-38	320	80
I-39	320	80
I-47	320	80
I-32	320	80
I-37	320	80
I-29	320	90
I-26	320	90
I-33	320	80
I-34	320	80
I-21	320	100
I-49	320	80
I-09	320	80
I-04	320	80
I-30	320	80
I-14	320	80
I-10	320	80
I-05	320	80
I-03	320	80
I-20	320	90
I-27	320	80
I-40	320	80
I-07	320	80

I-25	320	80
I-13	320	80
I-02	320	80
I-08	320	80
I-18	320	80

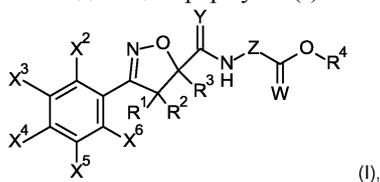
Таблица С26: Гербицидное действие в послевсходовый период против НОРМУ в %

Пример №	Дозировка [г/га]	НОРМУ
I-54	320	90
I-10	320	100
I-56	320	90
I-53	320	90
I-52	320	90
I-48	320	90
I-55	320	100
I-50	320	100
I-46	320	100
I-51	320	90
I-42	320	100
I-36	320	90
I-43	320	100
I-44	320	100
I-45	320	100
I-41	320	100
I-35	320	100
I-38	320	90
I-39	320	100
I-47	320	100
I-32	320	90
I-11	320	100
I-12	320	90
I-37	320	80
I-33	320	90
I-34	320	100
I-30	320	100
I-40	320	90
I-23	320	100
I-24	320	90

Как показывают результаты, соединения согласно изобретению, как, например, соединения № I-35 и другие соединения из таблиц (например, I-04, I-10, I-15, I-18, I-19, I-20, I-21, I-21, I-22, I-23, I-24, I-26, I-27, I-28, I-29), при обработке в послевсходовый период показывают очень хорошую эффективность (80-100% гербицидное действие) против вредных растений, как *Abitilon theophrasti*, *Alopecurus myosuroides*, *Amaranthus retroflexus*, *Avena fatua*, *Echinochloa crus-galli*, *Hordeum murinum*, *Lolium rigidum*, *Pharbitis purpurea*, *Polygonum convolvulus*, *Setaria viridis*, *Stellaria media*, *Veronica persica* и *Viola tricolor* при норме расхода 0.32 кг активного действующего вещества или менее на 1 га.

## ФОРМУЛА ИЗОБРЕТЕНИЯ

## 1. 3-Фенилизоксазолин-5-карбоксамид общей формулы (I)



(I).

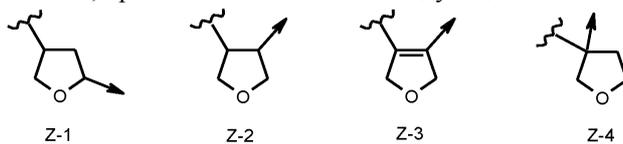
и его агрохимически приемлемые соли,

в которой R<sup>1</sup> и R<sup>2</sup> означают соответственно водород;R<sup>3</sup> означает (C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)алкил, (C<sub>3</sub>-C<sub>4</sub>)циклоалкил, (C<sub>2</sub>-C<sub>3</sub>)алкенил, (C<sub>2</sub>-C<sub>3</sub>)алкинил или (C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)алкокси, которые замещены соответственно m остатками, выбранными из группы, состоящей из фтора, хлора, брома, циано, (C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>)алкокси и гидроксид;R<sup>4</sup> означает водород или означает (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)алкил, (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)циклоалкил, (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)циклоалкил(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)алкил, (C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)алкенил, (C<sub>5</sub>-C<sub>6</sub>)циклоалкенил или (C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)алкинил, которые замещены соответственно m остатками, выбранными из группы, состоящей из фтора, хлора, брома, циано, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)алкокси, гидроксид и арила, причем арил означает фенил, при необходимости, замещенный 0-5 остатками, выбранными из группы, включающей фтор, хлор, бром, йод, циано, гидроксид, (C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)алкил, (C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)алкокси, (C<sub>3</sub>-C<sub>4</sub>)циклоалкил, (C<sub>2</sub>-C<sub>3</sub>)алкенил и (C<sub>2</sub>-C<sub>3</sub>)алкинил;

Y означает кислород;

W означает кислород;

Z означает группу Z-1 - Z-4, причем Z-1 - Z-4 имеют следующее значение:



причем стрелка означает соответственно связь с группой C=W формулы (I);

X<sup>2</sup>, X<sup>4</sup> и X<sup>6</sup> означают независимо друг от друга водород или фтор;X<sup>3</sup> и X<sup>5</sup> означают независимо друг от друга водород, фтор, хлор, бром, гидроксид или циано или (C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)алкил, (C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)алкокси, (C<sub>3</sub>-C<sub>4</sub>)циклоалкил, (C<sub>2</sub>-C<sub>3</sub>)алкенил или (C<sub>2</sub>-C<sub>3</sub>)алкинил, которые замещены соответственно m остатками, выбранными из группы, состоящей из фтора, хлора и брома; и m равен порядковому числу 0, 1, 2 или 3.

2. Гербицидное средство, отличающееся тем, что оно содержит одно или более соединений общей формулы (I) или их солей по п.1.

3. Гербицидное средство по п.2, которое дополнительно содержит вспомогательное средство для препаративных форм.

4. Гербицидное средство по п.2 или 3, содержащее по меньшей мере одно дополнительное биологически активное вещество из группы инсектицидов, акарицидов, гербицидов, фунгицидов, защитных средств и/или регуляторов роста растений.

5. Гербицидное средство по п.3 или 4, содержащее защитное средство.

6. Гербицидное средство по п.5, отличающееся тем, что защитное средство выбрано из группы, состоящей из мефенпир-диэтила, ципросульфамида, изоксадифен-этила, клоквиносет-мексила, беноксакура и дихлормида.

7. Средство, регулирующее рост растений, отличающееся тем, что оно содержит одно или более соединений общей формулы (I) или их солей по п.1.

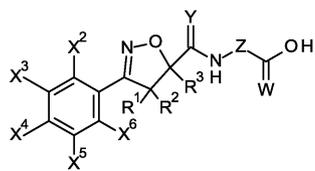
8. Способ борьбы с нежелательными растениями, отличающийся тем, что эффективное количество по меньшей мере одного соединения формулы (I) по п.1 или одного гербицидного средства по одному из пп.2-6 наносят на нежелательные растения или на место произрастания нежелательных растений.

9. Применение соединений формулы (I) по п.1 или гербицидного средства по одному из пп.2-6 для борьбы с нежелательными растениями.

10. Применение по п.9, отличающееся тем, что соединения формулы (I) применяют для борьбы с нежелательными растениями в культурах полезных растений.

11. Применение по п.10, отличающееся тем, что полезные растения представляют собой трансгенные полезные растения.

12. Соединение формулы (II) и его агрохимически приемлемые соли:



в которой остатки  $X^2$ ,  $X^3$ ,  $X^4$ ,  $X^5$ ,  $X^6$ ,  $R^1$ ,  $R^2$ ,  $R^3$ ,  $Y$ ,  $Z$  и  $W$  имеют значения, как определено в п.1.

