

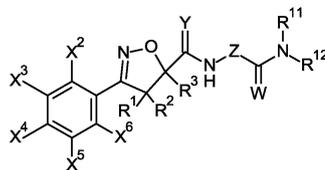
(19)



**Евразийское
патентное
ведомство**

(11) **040946**(13) **B1**(12) **ОПИСАНИЕ ИЗОБРЕТЕНИЯ К ЕВРАЗИЙСКОМУ ПАТЕНТУ**(45) Дата публикации и выдачи патента
2022.08.22(51) Int. Cl. **C07D 413/12 (2006.01)**
A01N 43/80 (2006.01)(21) Номер заявки
202090018(22) Дата подачи заявки
2018.06.11**(54) ГЕРБИЦИДНО АКТИВНЫЕ 3-ФЕНИЛИЗОКСАЗОЛИН-5-КАРБОКСАМИДЫ
ТЕТРАГИДРО- И ДИГИДРОФУРАНОВЫХ КАРБОКСАМИДОВ И ИХ ПРИМЕНЕНИЕ**(31) **17175780.0**(56) **WO-A1-2012130798**(32) **2017.06.13**(33) **EP**(43) **2020.05.26**(86) **PCT/EP2018/065334**(87) **WO 2018/228986 2018.12.20**(71)(73) Заявитель и патентовладелец:
**БАЙЕР АКЦИЕНГЕЗЕЛЬШАФТ;
БАЙЕР КРОПСАЙЕНС
АКЦИЕНГЕЗЕЛЬШАФТ (DE)**(72) Изобретатель:
**Петерс Олаф, Хааф Клаус Бернхард,
Бояк Гидо, Ляв Катеринэ Розе,
Мачеттира Ану Бемая, Дитрих
Хансйорг, Гатцвайлер Эльмар,
Розингер Кристофер Хью, Асмус
Элизабет (DE)**(74) Представитель:
Беляева Е.Н. (BY)

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



и его агрохимически приемлемых солей, в которых радикалы R^1 , R^2 , R^3 , R^5 - R^8 , R^{11} , R^{12} , Y , W , X^2 - X^6 , а также m , n , p и g имеют значения, как определено в п.1. Кроме того, настоящее изобретение касается гербицидного средства и средства, регулирующего рост растений, содержащих одно или более вышеуказанных соединений общей формулы (I) или их соли, а также способа борьбы с нежелательными растениями с применением вышеуказанного соединения или указанного гербицидного средства, и применения указанного соединения формулы (I) или указанного гербицидного средства для борьбы с нежелательными растениями.

B1**040946****040946****B1**

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 замещенного 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, и применения указанного соединения или указанного гербицидного средства для борьбы с нежелательными растениями.

WO 1995/014681 A1, WO 1995/014680 A1, WO 2008/035315 A1, WO 2005/051931 A1 и WO 2005/021515 A1 описывают, помимо прочего, 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 0 520 371 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 описывает 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 (гербицид и фунгицид).

WO 2014/048940 имеет хиолин в качестве особого гетероцикла в 3-позиции (фунгицид), WO 2014/048882 имеет алкокси в качестве особого остатка в 5-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.

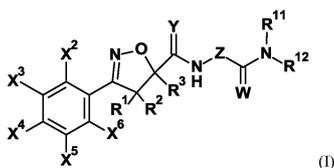
В результате названных причин существует потребность в более сильных гербицидах и/или регуляторах роста растений для селективного применения в культурах растений или для применения в области некультурных растений, причем эти действующие вещества предпочтительно должны обладать другими предпочтительными 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 ниженазванные 3-фенилизоксазолин-5-карбоксамиды амидов тетрагидро- и дигидрофуранкарбоновых кислот 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-карбоксамид общей формулы (I)



(I)

и его агрохимически приемлемые соли, в которых

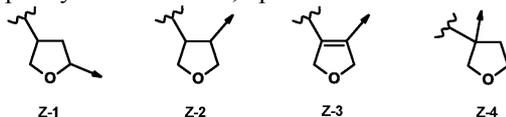
R^1 и R^2 означают соответственно водород,

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 m остатками, выбранными из группы, состоящей из фтора, хлора, брома, циано, (C_1-C_2) алкокси и гидрокси;

Y означает кислород;

W означает кислород;

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



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

R^{11} означают водород, или

(C_1-C_3) алкил или (C_3-C_6) циклоалкил, которые замещены m остатками, выбранными из группы, состоящей из фтора и хлора,

R^{12} означает водород или циано, или

OR^7 , $S(O)_nR^5$, NR^6R^8 , NR^6COR^8 , (C_1-C_6) алкил, (C_3-C_6) циклоалкил, (C_2-C_3) алкенил или (C_2-C_3) алкинил, которые замещены m остатками, выбранными из группы, состоящей из фтора, хлора, брома, циано и гидрокси; или

R^{11} и R^{12} вместе с атомом азота, к которому они присоединены, образуют насыщенное, частично или полностью ненасыщенное пяти- или шестичленное кольцо, которое помимо указанного атома азота содержит g атомов углерода, n атомов кислорода и p элементов из группы, состоящей из NR^7 и $NCOR^7$, в качестве кольцевых атомов; причем атом углерода несет p оксогрупп;

X^2 , X^4 и X^6 означают независимо друг от друга соответственно 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 m остатками из группы, состоящей из фтора, хлора и брома;

R^5 означает (C_1-C_6) алкил, (C_3-C_6) циклоалкил или фенил, которые замещены m остатками, выбранными из группы, состоящей из фтора, хлора и гидрокси;

R^6 означает водород или R^5 ;

R^7 означает водород, или

(C_1-C_6) алкил или (C_3-C_6) циклоалкил, которые замещены m остатками, выбранными из группы, состоящей из фтора, хлора и (C_1-C_2) алкокси;

R^8 означает водород, или

(C_1-C_6) алкил, (C_3-C_6) циклоалкил или фенил, которые замещены m остатками, выбранными из группы, состоящей из фтора, хлора и (C_1-C_2) алкокси;

m равен порядковому числу 0, 1, 2 или 3;

n равен порядковому числу 0, 1 или 2;

p равен порядковому числу 0 или 1; и

g равен порядковому числу 3, 4 или 5.

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-метил-пропил, 2-метилпропил, 1,1-диметилэтил, 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, C₂-C₆-алкенил, как этинил, 1-пропенил, 2-пропенил, 1-метилэтинил, 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, C₂-C₆-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 алкилиденовая 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-циклогексадиенил или 1,4-циклогексадиенил, причем также присутствуют заместители с двойной связью на циклоалкенильном остатке, например, такая алкилиденовая 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, C₁-C₆-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 соответственно указанным количеством атомов углерода, причем в этих группах атомы водорода могут быть частично или полностью замещены атомами галогена, например, C₁-C₂-галогеналкокси, как хлорметокси, бромметокси, дихлорметокси, трихлорметокси, фторметокси, дифторметокси, трифторметокси, хлорфторметокси, дихлор-фторметокси, 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, пентафтор-этокси и 1,1,1-трифторпроп-2-окси.

Понятие "арил" означает, при необходимости, замещенную моно-, би- или полициклическую аро-

матическую систему предпочтительно с 6-14, особенно предпочтительно 6-10 кольцевыми С-атомами, например, фенил, нафтил, антринил, фенантренил, и подобные, предпочтительно фенил.

Понятие "при необходимости, замещенный арил" включает также многоциклические системы, как тетрагидронафтил, инденил, инденил, фторенил, бифенилил, причем место соединения находится на ароматической системе. Согласно систематике "арил", как правило, также включает понятие "при необходимости, замещенный фенил".

Вышеуказанные арилы предпочтительно замещены, например, водородом, галогеном, алкилом, галоалкилом, гидроксильной, алкоксильной, циклоалкоксильной, арилоксильной, алкоксиалкилом, алкоксиалкоксильной, циклоалкилом, галоциклоалкилом, арилом, арилалкилом, гетероарилом, гетероциклоалкилом, алкенилом, алкилкарбонилем, циклоалкилкарбонилем, арилкарбонилем, гетероарилкарбонилем, алкоксикарбонилем, гидроксикарбонилем, циклоалкоксикарбонилем, циклоалкилалкоксикарбонилем, алкоксикарбонилалкилом, арилалкоксикарбонилем, арилалкоксикарбонилалкилом, алкинилом, алкинилалкилом, алкилалкилином, трис-алкилсилалкилином, нитро-, амино-, циано-, галоалкоксильной, галоалкилтио-, алкилтио-, гидротии-, гидроксикарбонилалкиламином, алкоксикарбонилалкиламином, арилалкоксикарбонилалкиламином, алкоксикарбонилалкил(алкил)амино-, аминокарбонилем, алкиламинокарбонилем, бис-алкиламинокарбонилем, циклоалкиламинокарбонилем, гидроксикарбонилалкиламинокарбонилем, алкоксикарбонилалкиламинокарбонилем, арилалкоксикарбонилалкиламинокарбонилем.

Гетероциклический остаток (гетероцикл) содержит по меньшей мере одно гетероциклическое кольцо (=карбоциклическое кольцо, в котором по меньшей мере один С-атом замещен гетероатомом, предпочтительно одним гетероатомом из группы N, O, S, P), который является насыщенным, ненасыщенным, частично насыщенным или гетероароматическим и при этом может быть незамещенным или замещенным, причем место соединения находится на кольцевом атоме. Если гетероциклический остаток или гетероциклическое кольцо, при необходимости, являются замещенными, они могут быть аннелированы другими карбоциклическими или гетероциклическими кольцами. Если, при необходимости, присутствует замещенный гетероцикл, то также присутствуют многоциклические системы, как, например, 8-аза-бицикло[3.2.1]октанил, 8-аза-бицикло[2.2.2]октанил или 1-аза-бицикло[2.2.1]гептил. Если, при необходимости, присутствует замещенный гетероцикл, то также присутствуют спироциклические системы, как, например, 1-окса-5-аза-спиро[2.3]гексил. Если не указано другого, то гетероциклическое кольцо предпочтительно содержит 3-9 кольцевых атома, особенно предпочтительно 3-6 кольцевых атома, и один или несколько, предпочтительно 1-4, особенно предпочтительно 1, 2 или 3 гетероатома в гетероциклическом кольце, предпочтительно из группы N, O, и S, причем однако два атома кислорода не должны находиться рядом друг с другом, как, например, с одним гетероатомом из группы N, O и S 1- или 2- или 3-пирролидинил, 3,4-дигидро-2Н-пиррол-2- или 3-ил, 2,3-дигидро-1Н-пиррол-1- или 2-, или 3-, или 4- или 5-ил; 2,5-дигидро-1Н-пиррол-1- или 2- или 3-ил, 1- или 2-, или 3-, или 4- или 5-, или 6-ил; 1,2,3,4-тетрагидропиридин-1- или 2-, или 3-, или 4-, или 5-, или 6-ил; 1,4-дигидропиридин-1- или 2-, или 3-, или 4-ил; 2,3-дигидропиридин-2- или 3- или 4-, или 5-, или 6-ил; 2,5-дигидропиридин-2- или 3-или 4-, или 5-, или 6-ил, 1- или 2-, или 3-, или 4-азепанил; 2,3,4,5-тетрагидро-1Н-азепин-1- или 2-, или 3-, или 4-, или 5-, или 6-, или 7-ил; 2,3,4,7-тетрагидро-1Н-азепин-1- или 2-, или 3-, или 4-, или 5-, или 6-, или 7-ил; 2,3,6,7-тетрагидро-1Н-азепин-1- или 2-, или 3-, или 4-ил; 3,4,5,6-тетрагидро-2Н-азепин-2- или 3- или 4-, или 5-, или 6-, или 7-ил; 4,5-дигидро-1Н-азепин-1- или 2-, или 3-, или 4-ил; 2,5-дигидро-1Н-азепин-1- или 2-, или 3-, или 4-, или 5-, или 6-, или 7-ил; 2,7-дигидро-1Н-азепин-1- или 2-, или 3-, или 4-ил; 2,3-дигидро-1Н-азепин-1- или 2-, или 3-, или 4-, или 5-, или 6-, или 7-ил; 3,4-дигидро-2Н-азепин-2- или 3- или 4-, или 5-, или 6-, или 7-ил; 3,6-дигидро-2Н-азепин-2- или 3- или 4-, или 5-, или 6-, или 7-ил; 5,6-дигидро-2Н-азепин-2- или 3- или 4-, или 5-, или 6-, или 7-ил; 4,5-дигидро-3Н-азепин-2- или 3-, или 4-, или 5-, или 6-, или 7-ил; 1Н-азепин-1- или 2- или 3-, или 4-, или 5-, или 6-, или 7-ил; 2Н-азепин-2- или 3-, или 4-, или 5-, или 6-, или 7-ил; 3Н-азепин-2- или 3-, или 4-, или 5-, или 6-, или 7-ил; 4Н-азепин-2- или 3-, или 4-, или 5-, или 6-, или 7-ил, 2- или 3-оксоланил (= 2- или 3-тетрагидрофуранил); 2,3-дигидрофуран-2- или 3-, или 4-, или 5-ил; 2,5-дигидрофуран-2- или 3-ил, 2- или 3-, или 4-оксанил (= 2- или 3-, или 4-тетрагидропиранил); 3,4-дигидро-2Н-пиран-2-или 3-, или 4-, или 5-, или 6-ил; 3,6-дигидро-2Н-пиран-2- или 3-или 4-, или 5-, или 6-ил; 2Н-пиран-2- или 3-, или 4-, или 5-, или 6-ил; 4Н-пиран-2- или 3-, или 4-ил, 2-или 3-, или 4-оксепанил; 2,3,4,5-тетрагидрооксепин-2- или 3-, или 4-, или 5-, или 6-, или 7-ил; 2,3,4,7-тетрагидрооксепин-2- или 3-, или 4-, или 5-, или 6-, или 7-ил; 2,3,6,7-тетрагидрооксепин-2- или 3-, или 4-ил; 2,3-дигидрооксепин-2- или 3-, или 4-, или 5-, или 6-, или 7-ил; 4,5-дигидрооксепин-2- или 3-, или 4-ил; 2,5-дигидрооксепин-2- или 3-, или 4-, или 5-, или 6-, или 7-ил; оксепин-2- или 3-, или 4-, или 5-, или 6-, или 7-ил; 2- или 3-тетрагидротииофенил; 2,3-дигидротииофен-2- или 3-, или 4-, или 5-ил; 2,5-дигидротииофен-2- или 3-ил; тетрагидро-2Н-тиопиран-2- или 3-, или 4-ил; 3,4-дигидро-2Н-тиопиран-2- или 3-, или 4-, или 5-, или 6-ил; 3,6-дигидро-2Н-тиопиран-2- или 3-, или 4-, или 5-, или 6-ил; 2Н-тиопиран-2- или 3-, или 4-, или 5-, или 6-ил; 4Н-тиопиран-2- или 3-, или 4-ил. Предпочтительными 3-кольцевыми и 4-кольцевыми гетероциклами являются, например, 1- или 2-азиринил,

или 5-, или 6-, или 7-ил; 4,7-дигидро-1,4-оксазепин-2- или 3-, или 4-, или 5-, или 6-, или 7-ил; 6,7-дигидро-1,4-оксазепин-2- или 3-, или 5-, или 6-, или 7-ил; 1,4-оксазепин-2- или 3-, или 5-, или 6-, или 7-ил; изотиазолидин-2- или 3-, или 4-, или 5-ил; 2,3-дигидроизотиазол-2- или 3-, или 4-, или 5-ил; 2,5-дигидроизотиазол-2- или 3-, или 4-, или 5-ил; 4,5-дигидроизотиазол-3- или 4-, или 5-ил; 1,3-тиазолидин-2- или 3-, или 4-, или 5-ил; 2,3-дигидро-1,3-тиазол-2- или 3-, или 4-, или 5-ил; 2,5-дигидро-1,3-тиазол-2- или 4-, или 5-ил; 4,5-дигидро-1,3-тиазол-2- или 4-, или 5-ил; 1,3-тиазинан-2- или 3-, или 4-, или 5-, или 6-ил; 3,4-дигидро-2Н-1,3-тиазин-2- или 3-, или 4-, или 5-, или 6-ил; 3,6-дигидро-2Н-1,3-тиазин-2- или 3-, или 4-, или 5-, или 6-ил; 5,6-дигидро-2Н-1,3-тиазин-2- или 4-, или 5-, или 6-ил; 5,6-дигидро-4Н-1,3-тиазин-2- или 4-, или 5-, или 6-ил; 2Н-1,3-тиазин-2- или 4-, или 5-, или 6-ил; 6Н-1,3-тиазин-2- или 4-, или 5-, или 6-ил; 4Н-1,3-тиазин-2- или 4-, или 5-, или 6-ил. Другими примерами "гетероциклила" является частично или полностью гидрированный гетероциклический остаток с 3 гетероатомами из группы N, O и S, как, например, 1,4,2-диоксазолидин-2- или 3-, или 5-ил; 1,4,2-диоксазол-3- или 5-ил; 1,4,2-диоксазинан-2- или -3-, или 5-, или 6-ил; 5,6-дигидро-1,4,2-диоксазин-3- или 5-, или 6-ил; 1,4,2-диоксазин-2- или 5-, или 6-ил; 1,4,2-диоксазепан-2- или 3-, или 5-, или 6-, или 7-ил; 6,7-дигидро-5Н-1,4,2-диоксазепин-3-, или 5-, или 6-, или 7-ил; 2,3-дигидро-7Н-1,4,2-диоксазепин-2- или 3-, или 5-, или 6-, или 7-ил; 2,3-дигидро-5Н-1,4,2-диоксазепин-2- или 3-, или 5-, или 6-, или 7-ил; 5Н-1,4,2-диоксазепин-3-, или 5-, или 6-, или 7-ил; 7Н-1,4,2-диоксазепин-3-, или 5-, или 6-, или 7-ил. Примеры структур для замещенных, при необходимости, гетероциклов также указаны ниже.

Вышеуказанные гетероциклы предпочтительно замещены, например, водородом, галогеном, алкилом, галоалкилом, гидроксильной, алкокси-, циклоалкокси-, арилокси-, алкоксиалкилом, алкоксиалкокси-, циклоалкилом, галоциклоалкилом, арилом, арилалкилом, гетероариллом, гетероциклилом, алкенилом, алкилкарбониллом, циклоалкилкарбониллом, арилкарбониллом, гетероарилкарбониллом, алкоксикарбониллом, гидроксикарбониллом, циклоалкоксикарбониллом, циклоалкилалкоксикарбониллом, алкоксикарбонилалкилом, арилалкоксикарбониллом, арилалкоксикарбонилалкилом, алкиниллом, алкинилалкилом, алкилалкиниллом, трис-алкилсилалкиниллом, нитро-, амино-, циано-, галоалкокси-, галоалкилтио-, алкилтио-, гидроттио-, гидроксикарбониллом, оксо-, гетероарилалкокси-, арилалкокси-, гетероциклилалкокси-, гетероциклилалкилтио-, гетероциклилокси-, гетероциклилтио-, гетероариллокси-, бис-алкиламино-, алкиламино-, циклоалкиламино-, гидроксикарбонилалкиламино-, алкоксикарбонилалкиламино-, арилалкоксикарбонилалкиламино-, алкоксикарбонилалкил(алкил)амино-, аминокарбониллом, алкиламинокарбониллом, бисалкиламинокарбониллом, циклоалкил-аминокарбониллом, гидроксикарбонилалкиламинокарбониллом, алкоксикарбонилалкиламинокарбониллом, арилалкоксикарбонилалкиламинокарбониллом.

Если основное вещество замещено "одним или более остатками" из перечня остатков (= групп) или из основной группы остатков, то соответственно оно может быть одновременно замещено несколькими одинаковыми и/или структурно различными остатками.

Если речь идет о частично или полностью насыщенном гетероцикле азота, то он может быть связан с остатком молекулы как с помощью углерода, так и с помощью азота.

В качестве заместителей для замещенного гетероциклического остатка принимают во внимание названные ниже заместители, также дополнительно оксо- и тиоксо-. Оксогруппа в качестве заместителя на кольцевом С-атоме означает тогда, например, карбонильную группу в гетероциклическом кольце. Которая также предпочтительно включает лактоны и лактамы. Оксогруппа также может возникнуть на кольцевых гетероатомах, которые могут находиться на разных этапах окисления, например, при N и S, и образовать в этом случае, например, дивалентную группу N(O), S(O) (также сокращенно SO) и S(O)₂ (также сокращенно SO₂) в гетероциклическом кольце. В случае -N(O)- и -S(O)-групп соответственно присутствуют оба энантиомера.

Согласно изобретению понятие "гетероарил" означает гетероароматические соединения, т.е. полностью ненасыщенные ароматические гетероциклические соединения, предпочтительно 5-7-членные кольца с 1-4, предпочтительно 1 или 2 одинаковыми или различными гетероатомами, предпочтительно O, S или N. Гетероарилами согласно изобретению являются, например, 1Н-пиррол-1-ил; 1Н-пиррол-2-ил; 1Н-пиррол-3-ил; фуран-2-ил; фуран-3-ил; тиен-2-ил; тиен-3-ил, 1Н-имидазол-1-ил; 1Н-имидазол-2-ил; 1Н-имидазол-4-ил; 1Н-имидазол-5-ил; 1Н-пиразол-1-ил; 1Н-пиразол-3-ил; 1Н-пиразол-4-ил; 1Н-пиразол-5-ил, 1Н-1,2,3-триазол-1-ил, 1Н-1,2,3-триазол-4-ил, 1Н-1,2,3-триазол-5-ил, 2Н-1,2,3-триазол-2-ил, 2Н-1,2,3-триазол-4-ил, 1Н-1,2,4-триазол-1-ил, 1Н-1,2,4-триазол-3-ил, 4Н-1,2,4-триазол-4-ил, 1,2,4-оксадиазол-3-ил, 1,2,4-оксадиазол-5-ил, 1,3,4-оксадиазол-2-ил, 1,2,3-оксадиазол-4-ил, 1,2,3-оксадиазол-5-ил, 1,2,5-оксадиазол-3-ил, азепинил, пиридин-2-ил, пиридин-3-ил, пиридин-4-ил, пиразин-2-ил, пиразин-3-ил, пиримидин-2-ил, пиримидин-4-ил, пиримидин-5-ил, пиридазин-3-ил, пиридазин-4-ил, 1,3,5-триазин-2-ил, 1,2,4-триазин-3-ил, 1,2,4-триазин-5-ил, 1,2,4-триазин-6-ил, 1,2,3-триазин-4-ил, 1,2,3-триазин-5-ил, 1,2,4-, 1,3,2-, 1,3,6- и 1,2,6-оксазинил, изоксазол-3-ил, изоксазол-4-ил, изоксазол-5-ил, 1,3-оксазол-2-ил, 1,3-оксазол-4-ил, 1,3-оксазол-5-ил, изотиазол-3-ил, изотиазол-4-ил, изотиазол-5-ил, 1,3-тиазол-2-ил, 1,3-тиазол-4-ил, 1,3-тиазол-5-ил, оксепинил, тиепинил, 1,2,4-триазолонил и 1,2,4-диазепинил, 2Н-1,2,3,4-тетразол-5-ил, 1Н-1,2,3,4-тетразол-5-ил, 1,2,3,4-оксатриазол-5-ил, 1,2,3,4-тиатриазол-5-ил, 1,2,3,5-оксатриазол-4-ил, 1,2,3,5-тиатриазол-4-ил. Далее гетероарильные группы согласно изобретению могут быть замещены одним или несколькими, одинаковыми или различными остатками. Если два соседних

атома углерода являются компонентом другого ароматического кольца, то речь идет об аннелированных гетероароматических системах, как бензоконденсированные или несколько раз аннелированные гетероароматические соединения. Предпочтительными, например, являются хинолины (например, хинолин-2-ил, хинолин-3-ил, хинолин-4-ил, хинолин-5-ил, хинолин-6-ил, хинолин-7-ил, хинолин-8-ил); изохинолины (например, изохинолин-1-ил, изохинолин-3-ил, изохинолин-4-ил, изохинолин-5-ил, изохинолин-6-ил, изохинолин-7-ил, изохинолин-8-ил); хиноксалин; хиназолин; циннолин; 1,5-нафтиридин; 1,6-нафтиридин; 1,7-нафтиридин; 1,8-нафтиридин; 2,6-нафтиридин; 2,7-нафтиридин; фталазин; пиридопирозин; пиридопиримидин; пиридопиридазин; птеридины; пиримидопиримидин. Примерами гетероарила также являются 5- или 6-членные бензоконденсированные кольца из группы 1Н-индол-1-ила, 1Н-индол-2-ила, 1Н-индол-3-ила, 1Н-индол-4-ила, 1Н-индол-5-ила, 1Н-индол-6-ила, 1Н-индол-7-ила, 1-бензофуран-2-ила, 1-бензофуран-3-ила, 1-бензофуран-4-ила, 1-бензофуран-5-ила, 1-бензофуран-6-ила, 1-бензофуран-7-ила, 1-бензотиофен-2-ила, 1-бензотиофен-3-ила, 1-бензотиофен-4-ила, 1-бензотиофен-5-ила, 1-бензотиофен-6-ила, 1-бензотиофен-7-ила, 1Н-индазол-1-ила, 1Н-индазол-3-ила, 1Н-индазол-4-ила, 1Н-индазол-5-ила, 1Н-индазол-6-ила, 1Н-индазол-7-ила, 2Н-индазол-2-ила, 2Н-индазол-3-ила, 2Н-индазол-4-ила, 2Н-индазол-5-ила, 2Н-индазол-6-ила, 2Н-индазол-7-ила, 2Н-изоиндол-2-ила, 2Н-изоиндол-1-ила, 2Н-изоиндол-3-ила, 2Н-изоиндол-4-ила, 2Н-изоиндол-5-ила, 2Н-изоиндол-6-ил, 2Н-изоиндол-7-ила, 1Н-бензимидазол-1-ила, 1Н-бензимидазол-2-ила, 1Н-бензимидазол-4-ила, 1Н-бензимидазол-5-ила, 1Н-бензимидазол-6-ила, 1Н-бензимидазол-7-ила, 1,3-бензоксазол-2-ила, 1,3-бензоксазол-4-ила, 1,3-бензоксазол-5-ила, 1,3-бензоксазол-6-ила, 1,3-бензоксазол-7-ила, 1,3-бензтиазол-2-ила, 1,3-бензтиазол-4-ила, 1,3-бензтиазол-5-ила, 1,3-бензтиазол-6-ила, 1,3-бензтиазол-7-ила, 1,2-бензизоксазол-3-ила, 1,2-бензизоксазол-4-ила, 1,2-бензизоксазол-5-ила, 1,2-бензизоксазол-6-ила, 1,2-бензизоксазол-7-ила, 1,2-бензизотиазол-3-ила, 1,2-бензизотиазол-4-ила, 1,2-бензизотиазол-5-ила, 1,2-бензизотиазол-6-ила, 1,2-бензизотиазол-7-ил.

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 вышеназванных 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 (C₁-C₄)алкильными группами, моно-, ди- и триалканоламины (C₁-C₄)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 (C₁-C₄)триалкилсульфония и (C₁-C₄)триалкилсульфоксония.

Соединения формулы (I) во время присоединения подходящих неорганических или органических кислот, как, например, минеральных кислот, как, например, HCl, HBr, H₂SO₄, H₃PO₄ или HNO₃, или органических кислот, например, карбоновых кислот, как муравьиная кислота, уксусная кислота, пропионовая кислота, щавелевая кислота, молочная или салициловая кислота или сульфокислоты, как, например, р-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 аминогруппы.

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

Во всех нижеуказанных 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.

R^{12} предпочтительно означает гидроксигруппу.

В рамках данного изобретения возможно комбинирование отдельных предпочтительных, особенно предпочтительных и наиболее предпочтительных значений для заместителей R^1 - R^3 , R^5 - R^8 , R^{10} - R^{12} , X^2 - X^6 , W , Y и Z , а также порядковых чисел m , n , p и g любым способом друг с другом.

Это значит, что в настоящем изобретении представлены соединения общей формулы (I), в которых, например, заместитель R^1 имеет предпочтительное значение, и заместители R^5 - R^7 имеют общие значения, или заместитель R^2 имеет предпочтительное значение, заместитель R^3 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.

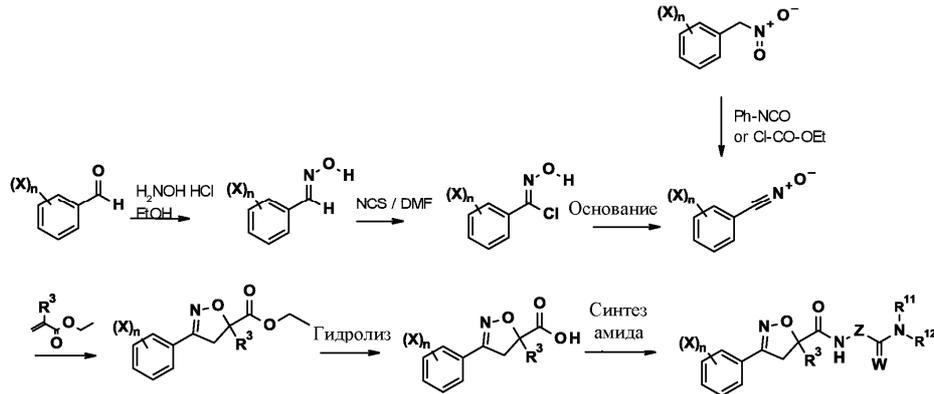
Таблица 1

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

Пример – №	X^3	X^5	R^3	Z	R^{11}	R^{12}
I-1	F	F	CH ₃	Z-4	H	цик-пропил
I-2	F	F	CH=CH ₂	Z-1	H	CH ₃
I-3	F	F	CH ₃	Z-1	-(CH ₂) ₄ -	
I-4	F	F	CH ₃	Z-1	H	цик-пропил
I-5	F	F	CH ₃	Z-1	H	CH ₃
I-6	F	F	CH=CH ₂	Z-1	-(CH ₂) ₄ -	
I-7	F	F	CH ₃	Z-2	H	CH ₃
I-8	F	F	CH ₃	Z-2	H	цик-пропил
I-9	F	F	CH ₃	Z-2	-(CH ₂) ₄ -	
I-10	F	H	CH ₃	Z-1	H	O-CH ₃
I-11	F	F	(S) - CH=CH ₂	Z-1	H	O-CH ₃
I-12	F	F	(S) - CH=CH ₂	Z-1	H	O-C ₂ H ₅
I-13	F	F	(S) - CH=CH ₂	Z-1	H	O-CH(CH ₃) ₂
I-14	F	F	(S) - CH=CH ₂	Z-1	H	SO ₂ CF ₃
I-15	F	F	(S) - CH=CH ₂	Z-1	H	N(CH ₃) ₂
I-16	F	F	(S) - CH=CH ₂	Z-1	H	SO ₂ CH ₃
I-17	F	F	(S) - CH=CH ₂	Z-1	CH ₃	CH ₃
I-18	F	F	(S) - CH=CH ₂	Z-1	H	цик-пропил
I-19	F	F	(S) - CH=CH ₂	Z-1	H	NH-(C=O)-OC(CH ₃) ₃
I-20	F	F	(S) - CH=CH ₂	Z-1	H	CH ₂ -CH ₂ -CO ₂ Me
I-21	F	F	(S) - CH=CH ₂	Z-1	H	CH ₂ -CO ₂ Me
I-22	F	F	(S) - CH=CH ₂	Z-1	H	(3S)-CH(CH ₃)-CH ₂ -CO ₂ Et
I-23	F	F	(R) - CH ₃	Z-1	H	SO ₂ Me
I-24	F	F	(R) - CH ₃	Z-1	H	OMe
I-25	F	F	(R) - CH ₃	Z-1	Me	Me
I-26	F	F	(R) - CH ₃	Z-1	H	NMe ₂
I-27	F	F	(R) - CH ₃	Z-1	H	[3-хлоро-5-(трифторметил)-пиридин-2-ил]метил
I-28	F	F	(R) - CH ₃	Z-1	H	SO ₂ CH ₂ -CH ₂ -CH ₃
I-29	F	F	(S) - CH=CH ₂	Z-1	H	SO ₂ CH ₂ -CH ₂ -CH ₃
I-30	F	F	(R) - CH ₃	Z-1	H	SO ₂ CF ₃

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

Схема 1

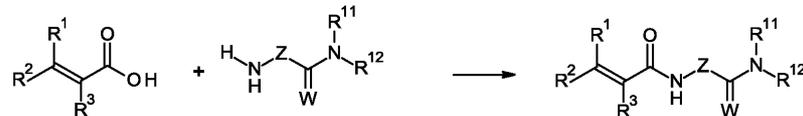


На схеме 1 и последующих схемах $(X)_n$ означает заместители X^2 , X^3 , X^4 , X^5 и X^6 . Такие 1,3-диполярные циклоприсоединения нитрилоксидов с подходящими диполярофилами описаны, например, в обзоре: 1,3 dipolar Cycloaddition Chemistry, Padwa, ed. Wiley, Нью-Йорк, 1984; Kanemasa and Tsuge, Heterocycles 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 изоксазолиновой кольцевой системы, также могут быть получены с помощью 1,3-диполярного циклоприсоединения, в котором применяют подходящие 1,2-дизамещенные олефины 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).

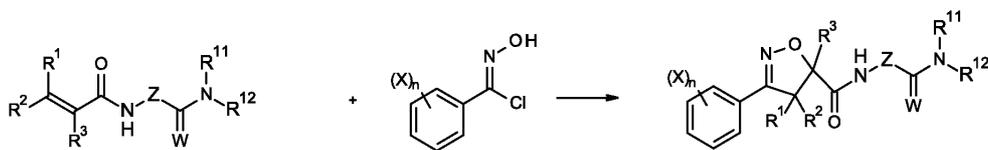
Для получения соединений согласно изобретению также можно применять замещенные амиды 2-алкоксиакриловой кислоты (схема 3). Описанные на схеме 2 эфиры акриловых кислот получают после гидролиза и образования амидов.

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 2,521,902, JP60112746, 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 вышеуказанных 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. Tiesbe in Combinatorial Chemistry - Synthesis, Analysis, Screening (Herausgeber Günther Jung), Verlag Wiley 1999, с. 1-34.

Предметом настоящего изобретения также является средство, регулирующее рост растений, содержащее одно или более вышеуказанных соединений общей формулы (I) или их соли.

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, содержащее одно или более вышеуказанных соединений общей формулы (I) или их соли.

В предпочтительном выполнении изобретения гербицидное средство дополнительно содержит вспомогательное средство для препаративных форм.

В предпочтительном выполнении изобретения 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, вышеуказанное гербицидное средство содержит защитное средство.

В предпочтительном выполнении изобретения защитное средство выбрано из группы, состоящей из мефенпир-диэтила, ципросульфамида, изоксадифенэтила, клоквинтосет-мексила, беноксакура и дихлорамида.

Предметом настоящего изобретения также является способ борьбы с нежелательными растениями, в котором эффективное количество по меньшей мере одного вышеуказанного соединения формулы (I) или одного вышеуказанного гербицидного средства наносят на нежелательные растения или на место произрастания нежелательных растений.

В предпочтительном варианте выполнения вышеуказанного способа борьбы с нежелательными растениями 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), *Cynodon* (свинойрой), *Cyperus* (сыть), *Dactyloctenium* (дактилоктениум), *Digitaria* (росичка), *Echinochloa* (ежовник), *Eleocharis* (болотница), *Eleusine* (дагусса), *Eragrostis* (полевичка), *Eriochloa* (шерстяк), *Festuca* (овсяница), *Fimbristylis* (фимбристилис), *Heteranthera* (гетерантера), *Imperata* (императа), *Ischaetum* (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), *Egysimum* (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), *Rorippa* (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 или 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 генной инженерии или обычного мутагенеза. Трансгенные растения отличаются, как правило, особенно предпочтительными свойствами, например, своей резистентностью к определенным применяемым в перерабатывающей сельскохозяйственной продукции промышленности 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, известные 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 генной 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 генной 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 5,013,659) 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 определенным 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 или 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 адапторы 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 генов 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, ацетолатат синтаза (ALS), EPSP синтаза, глутамин синтаза (ГС) или гидроксифенилпируват диоксигеназа (ГФПДГ), или к гербицидам из группы сульфанил-мочевины, глифосата, глюфосината или бензоилоксазола 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 сульфанилмочевины 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 соединения формулы (I) согласно изобретению или вышеуказанного гербицидного средства для борьбы с нежелательными растениями.

Предпочтительно соединение формулы (I) согласно изобретению 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. Задачей изобретения поэтому также являются гербицидные и регулирующие рост растений средства, которые содержат соединения согласно изобретению.

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), 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, "Encyclopedia of Surface Active Agents", Chem. Publ. Co. Inc., N.Y. 1964, Schönfeldt, "Grenzflächenaktive Äthylenoxid-addukte", Wiss. Verlagsgesell., Штуттгарт 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 ацетолататсинтазы,

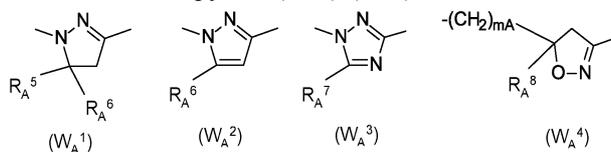
энзима ацетил-СоА-карбоксилазы, целлюлозосинтазы, энолпируват шикимат-3-фосфат-синтазы, глутамин-синтазы, р-гидроксифенилпируват-диоксигеназы, фитоен-десатуразы, фотосистемы I, фотосистемы II, протопорфириноген-оксидазы, как описано, например, в Weed Research 26 (1986) 441-445 или "The Pesticide Manual", 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 или указаны 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-карбоксихлоридная кислота, аминоциклопирапирахлор, аминоциклопирахлор-калий, аминоциклопирахлор-метил, аминопирилатид, амитрол, сульфамат аммония, анилофос, асулам, атразин, азаденидин, азимсульфурон, бифлутурамид, беназолин, беназолин-этил, бенфлуралин, бенфуресат, бенсульфурон, бенсульфурон-метил, бенсулид, бентазон, бензобциклоп, бензофенап, бициклопирон, бифенокс, биланафос, биланафос-натрий, биспирибак, биспирибак-натрий, бромацил, бромобтид, 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, клодинафоп, 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, глюфосинат, глюфосинат-аммоний, глюфосинат-Р-натрий, глюфосинат-Р-аммоний, глюфосинат-Р-натрий, глифосат, глифосат-аммоний, -изопропиламмоний, -диаммоний, диметиламмоний, -калий, -натрий и -тримезиум, H-9201, т.е. O-(2,4-диметил-6-нитрофенил)-O-этил-изопропилфосфорамидотиоат, галауоксифен, галауоксифен-метил, галосафен, галосульфурон, галосульфурон-метил, галоксифоп, галоксифоп-Р, галоксифоп-этоксизтил, галоксифоп-Р-этоксизтил, галоксифоп-метил, галоксифоп-Р-метил, гексазион, HW-02, т.е. 1-(диметоксифосфорил)-этил-(2,4-дихлорфенокси)ацетат, имазаметабенз, имазаметабенз-метил, имазамокс, имазамокс-аммоний, имазапик, имазапик-аммоний, имазапир, имазапир-изопропиламмоний, имазакин, имазакин-аммоний, имазетапир, имазетапир-иммоний, имазосульфурон, инданофан, индазифлам, йодосульфурон, йодосульфурон-метил-натрий, иоксинил, иоксинил-октаноат, -калий и натрий, ипфенкарбазон, изопротурон, изоурон, изоксабен, изоксафлутол, карбутилат, KUH-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-

R_A^1 означает галоген, (C₁-C₄)алкил, (C₁-C₄)алкокси, нитро или (C₁-C₄)галоалкил;

W_A означает незамещенный или замещенный дивалентный гетероциклический остаток из группы частично ненасыщенных или ароматических гетероциклов с пятью кольцами 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 с по меньшей мере одним атомом N и содержащий до 3 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 (C₁-C₄)алкила, (C₁-C₄)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, (C₁-C₆)алкил, (C₁-C₆)алкокси или замещенный или незамещенный фенил;

R_A^5 означает H, (C₁-C₈)алкил, (C₁-C₈)галоалкил, (C₁-C₄)алкокси(C₁-C₈)алкил, циано или $COOR_A^9$, где R_A^9 означает водород, (C₁-C₈)алкил, (C₁-C₈)галоалкил, (C₁-C₄)алкокси-(C₁-C₄)алкил, (C₁-C₆)гидроксиалкил, (C₃-C₁₂)циклоалкил или три-(C₁-C₄)алкил-силил;

R_A^6 , R_A^7 , R_A^8 означают или отличны от водорода, (C₁-C₈)алкила, (C₁-C₈)галоалкила, (C₃-C₁₂)циклоалкила или замещенного или незамещенного фенила;

предпочтительно:

а) соединения типа дихлорфенилпиразолин-3-карбоновой кислоты (S1^a), 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-A-91/07874;

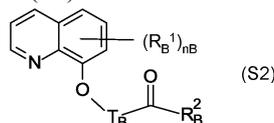
б) производные дихлорфенилпиразолкарбоновой кислоты (S1^b), предпочтительно такие соединения, как этиловый эфир 1-(2,4-дихлорфенил)-5-метилпиразол-3-карбоновой кислоты (S1-2), этиловый эфир 1-(2,4-дихлорфенил)-5-изопропилпиразол-3-карбоновой кислоты (S1-3), этиловый эфир 1-(2,4-дихлорфенил)-5-(1,1-диметил-этил)пиразол-3-карбоновой кислоты (S1-4) и родственные соединения, которые описаны в EP-A-333131 и EP-A-269806;

в) производные 1,5-дифенилпиразол-3-карбоновой кислоты (S1^c), 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;

г) соединения типа триазолкарбоновой кислоты (S1^d), 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;

е) соединения типа 5-бензил- или 5-фенил-2-изоксазолин-3-карбоновой кислоты, или 5,5-дифенил-2-изоксазолин-3-карбоновой кислоты (S1^e), 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-A-91/08202, или 5,5-дифенил-2-изоксазолин-карбонвая кислота (S1-10) или этиловый эфир 5,5-дифенил-2-изоксазолин-3-карбоновой кислоты (S1-11) ("изоксафифен-этил") или -н-пропиловый эфир (S1-12) или этиловый эфир 5-(4-фторфенил)-5-фенил-2-изоксазолин-3-карбоновой кислоты (S1-13), как описывает патентная заявка WO-A-95/07897.

S2) производные хинолина формулы (S2)



причем символы и индексы имеют следующие значения:

R_B^1 означает галоген, (C₁-C₄)алкил, (C₁-C₄)алкокси, нитро или (C₁-C₄)галоалкил;

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

R_B^2 означает OR_B^3 , SR_B^3 или $NR_B^3R_B^4$ или насыщенный

или ненасыщенный 3-6-членный гетероцикл с по меньшей мере одним атомом N и содержащий до

3 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 (C₁-C₄)алкила, (C₁-C₄)алкокси или при необходимости, замещен фенолом, предпочтительно означает остаток формулы OR_B³, NHR_B⁴ или N(CH₃)₂, особенно предпочтительно формулы OR_B³

R_B³ означает водород или незамещенный или замещенный алифатический углеводородный остаток, предпочтительно с 1-18 C-атомами;

R_B⁴ означает водород, (C₁-C₆)алкил, (C₁-C₆)алкокси или замещенный или незамещенный фенол;

T_B означает (C₁ или C₂)алкандиильную цепь, которая является незамещенной или может быть замещена одним или двумя (C₁-C₄)алкильными остатками или [(C₁-C₃)алкокси]карбонилем;

предпочтительно:

а) соединения типа 8-хинолиноксиуксусной кислоты (S2^a), предпочтительно

(1-метилгексильный)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),

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

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

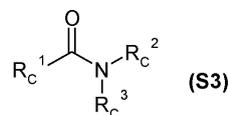
2-(2-пропилиден-иминокси)-1-этиловый эфир (5-хлор-8-хинолинокси)уксусной кислоты (S2-8),

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

родственные соединения, как описанные в EP-A-86 750, EP-A-94 349 и EP-A-191 736 или EP-A-0 492 366, 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-A-2002/34048;

б) соединения типа (5-хлор-8-хинолинокси)малоновой кислоты (S2^b), 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-0582198.

S3) Соединения формулы (S3)



причем символы и индексы имеют следующие значения:

R_c¹ означает (C₁-C₄)алкил, (C₁-C₄)галоалкил, (C₂-C₄)алкенил, (C₂-C₄)галоалкенил, (C₃-C₇)циклоалкил, предпочтительно дихлорметил;

R_c², R_c³ равны или отличны от водорода, (C₁-C₄)алкила, (C₂-C₄)алкенила, (C₂-C₄)алкинила, (C₁-C₄)галоалкила, (C₂-C₄)галоалкенила, (C₁-C₄)алкилкарбамоил-(C₁-C₄)алкила, (C₂-C₄)алкенилкарбамоил-(C₁-C₄)алкила, (C₁-C₄)алкокси-(C₁-C₄)алкила, диоксоланил-(C₁-C₄)алкила, тиазолила, фурила, фурилалкила, тиенила, пиперидила, замещенного или незамещенного фенола, или R_c² и R_c³ 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, "дихлорацетамид" (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),

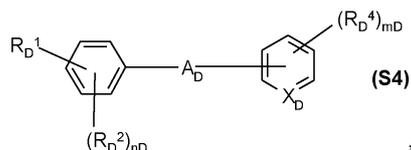
"AD-67" или "MON 4660" (3-дихлорацетил-1-окса-3-аза-спиро[4,5]декан) фирмы Nitrokemia или Monsanto (S3-7),

"TI-35" (1-дихлорацетил-азепан) фирмы TRI-Chemical RT (S3-8), "диклонон" (дициклонон) или "BAS145138" или "LAB145138" (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-диметил-оксазолидин) (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-NRD_3-CO или $CO-NRD_3-SO_2$;

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 гетероатом 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, гидрокси, (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;

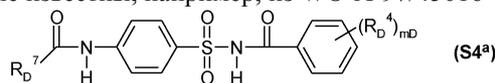
R_D^7 представляет собой водород, (C_1-C_4) алкиламино, ди (C_1-C_4) алкиламино, (C_1-C_6) алкил, (C_3-C_6) циклоалкил, причем 2 последних остатка замещены v_D заместителями из группы галогена, (C_1-C_4) алкокси, (C_1-C_6) галоалкокси и (C_1-C_4) алкилтио и в случае циклических остатков также замещены (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^a), которые известны, например, из WO-A-97/45016



где R_D^7 означает (C_1-C_6) алкил, (C_3-C_6) циклоалкил, причем 2 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) алкил и (C_1-C_4) галоалкил;

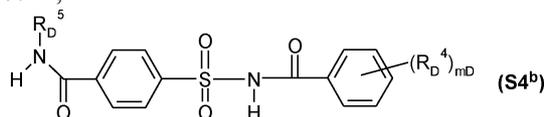
R_D^4 означает галоген, (C_1-C_4) алкил, (C_1-C_4) алкокси, CF_3 ;

m_D означает 1 или 2;

v_D означает 0, 1, 2 или 3;

а также

амиды ацилсульфамоилбензойной кислоты, например, следующей формулы (S4^b), которые, например, известны из WO-A-99/16744,



например, такие, где

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

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

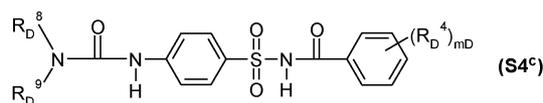
R_D^5 = этил и $(R_D^4) = 2-OMe$ (S4-3),

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

R_D^5 = этил и $(R_D^4) = 2-OMe$ (S4-5),

а также

соединения типа N-ацилсульфамоилфенилмочевины формулы (S4^c), которые, например, известны из EP-A-365484



где R_D^8 и R_D^9 независимо друг от друга водород, (C_1-C_8) алкил, (C_3-C_8) циклоалкил, (C_3-C_6) алкенил, (C_3-C_6) алкинил,

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

m_D означает 1 или 2;

например,

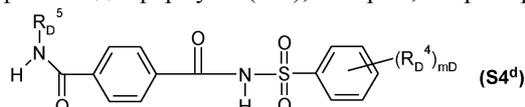
1-[4-(N-2-метоксибензоилсульфамоил)фенил]-3-метилмочевина,

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

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

а также

N-фенилсульфонилтерефталамиды формулы (S4^d), которые, например, известны из CN 101838227



например, такие, где

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

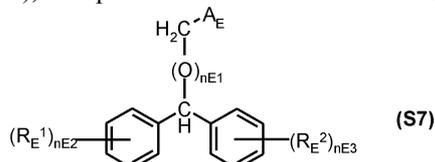
m_D означает 1 или 2;

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.

S5) действующие вещества из класса гидроксид-ароматических соединений и ароматически-алифатических производных карбоновой кислоты (S5), например, этиловый эфир 3,4,5-триацетоксибензойной кислоты, 3,5-диметокси-4-гидроксibenзойная кислота, 3,5-дигидроксibenзойная кислота, 4-гидроксисалициловая кислота, 4-фторсалициловая кислота, 2-гидроксикоричная кислота, 2,4-дихлоркоричная кислота, которые описаны в WO-A-2004/084631, WO-A-2005/015994, WO-A-2005/016001.

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-дигидро-хиноксалин-2-он-гидрохлорид, 1-(2-метилсульфониламиноэтил)-3-(2-тиенил)-1,2-дигидро-хиноксалин-2-он, которые описаны в WO-A-2005/112630.

S7) Соединения формулы (S7), которые описаны в WO-A-1998/38856



где символы и индексы имеют следующие значения:

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

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

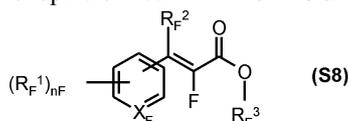
R_E^3 , R_E^4 независимо друг от друга означают водород, (C_1-C_4) алкил, (C_2-C_6) алкенил, (C_2-C_4) алкинил, цианоалкил, (C_1-C_4) галоалкил, фенил, нитрофенил, бензил, галобензил, пиридинилалкил и алкиламмоний,

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-A-98/27049



где X_F означает CH 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_1-C_4) алкил, (C_1-C_4) галоалкил, (C_1-C_4) алкокси, (C_1-C_4) галоалкокси, нитро, (C_1-C_4) алкилтио, (C_1-C_4) алкилсульфонил, (C_1-C_4) алкоксикарбонил, при необходимости, замещенный фенил, при необходимости, замещенный фенокси,

R_F^2 означает водород или (C_1-C_4) алкил,

R_F^3 означает водород, (C_1-C_8) алкил, (C_2-C_4) алкенил, (C_2-C_4) алкинил или арил, причем каждый из предварительно названных С-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 CH ,

n_F означает целое число 0-2,

R_F^1 означает галоген, (C_1-C_4) алкил, (C_1-C_4) галоалкил, (C_1-C_4) алкокси, (C_1-C_4) галоалкокси,

R_F^2 означает водород или (C_1-C_4) алкил,

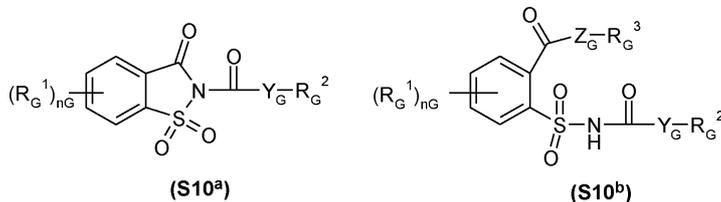
R_F^3 означает водород, (C_1-C_8) алкил, (C_2-C_4) алкенил, (C_2-C_4) алкинил или арил, причем каждый из предварительно названных С-содержащих остатков является незамещенным или замещен одним или несколькими, предпочтительно -до трех одинаковыми или различными остатками из группы, состоящей из галогена 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 (Per. № CAS 219479-18-2), 1,2-дигидро-4-гидрокси-1-метил-3-(5-тетразолил-карбонил)-2-хинолон (Per. № CAS 95855-00-8), которые описаны в WO-A-1999/000020.

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

которые описаны в WO-A-2007/023719 и WO-A-2007/023764



где R_G^1 означает галоген, (C_1-C_4) алкил, метокси, нитро, циано, CF_3 , OCF_3

Y_G, Z_G независимо друг от друга означают O или S,

n_G означает целое число 0-4,

R_G^2 означает (C_1-C_{16}) алкил, (C_2-C_6) алкенил, (C_3-C_6) циклоалкил, арил, бензил, галогенбензил,

R_G^3 означает водород или (C_1-C_6) алкил.

S11) действующие вещества типа оксиимино-соединений (S11), которые используют в качестве протравочных средств для семян, как, например,

"оксабетринил" ((Z)-1,3-диоксолан-2-илметоксиимино(фенил)ацетонитрил) (S11-1), который используют в качестве защитного средства для протравки семян для проса от повреждений, вызванных метолахлором,

"флуксофеним" (1-(4-хлорфенил)-2,2,2-трифтор-1-этанон-O-(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" ((Z)-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-1H-2-бензотиопиран-4(3H)-илиден)метокси]ацетат (Per. № CAS 205121-04-6) (S12-1) и родственные соединения из WO-A-1998/13361.

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" (Per. № CAS 31541-57-8),

(4-карбокси-3,4-дигидро-2H-1-бензопиран-4-уксусная кислота) (S13-4) фирмы American Cyanamid, который используют в качестве защитного средства для кукурузы от повреждений, вызванных имидазолинонами,

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

"MG 838" (Per. № 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-этилтиоэтилфосфодитиоат) (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,

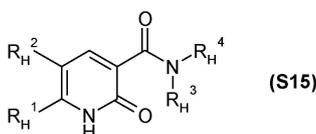
"даимурон" или "SK 23" (1-(1-метил-1-фенилэтил)-3-р-толил-мочевина), который является защитным средством для риса от повреждений, вызванных гербицидом имазосульфуроном,

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

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

"CSB" (1-бром-4-(хлорметилсульфонил)бензол) фирмы Kumiai, (Рег. № 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-A-2008/131861 и WO-A-2008/131860



где R_H^1 означает (C₁-C₆)галоалкильный остаток, и

R_H^2 означает водород или галоген, и

R_H^3 , R_H^4 независимо друг от друга означают водород, (C₁-C₁₆)алкил, (C₂-C₁₆)алкенил или (C₂-C₁₆)алкинил,

причем каждый из трех названных последними остатков является незамещенным или может быть замещен одним или более остатками из группы галогена, гидроксид, циано, (C₁-C₄)алкокси, (C₁-C₄)галоалкокси, (C₁-C₄)алкилтио, (C₁-C₄)алкиламино, ди[(C₁-C₄)алкил]амино, [(C₁-C₄)алкокси]карбонила, [(C₁-C₄)галоалкокси]карбонила, (C₃-C₆)циклоалкила, который является незамещенным или замещенным, фенила, который является незамещенным или замещенным, и гетероциклила, который является незамещенным или замещенным,

или (C₃-C₆)циклоалкил, (C₄-C₆)циклоалкенил, (C₃-C₆)циклоалкил, который на стороне кольца конденсируется одним 4-6-членным насыщенным или ненасыщенным карбоциклическим кольцом, или (C₄-C₆)циклоалкенил, который на стороне кольца конденсируется одним 4-6-членным насыщенным или ненасыщенным карбоциклическим кольцом,

причем каждый из 4 названных последними остатков является незамещенным или может быть замещен одним или более остатками из группы галогена, гидроксид, циано, (C₁-C₄)алкила, (C₁-C₄)галоалкила, (C₁-C₄)алкокси, (C₁-C₄)галоалкокси, (C₁-C₄)алкилтио, (C₁-C₄)алкиламино, ди[(C₁-C₄)алкил]амино, [(C₁-C₄)алкокси]карбонила, [(C₁-C₄)галоалкокси]карбонила, (C₃-C₆)циклоалкила, который является незамещенным или замещенным, фенила, который является незамещенным или замещенным, и гетероциклила, который является незамещенным или замещенным,

означает или

R_H^3 означает (C₁-C₄)алкокси, (C₂-C₄)алкенилокси, (C₂-C₆)алкинилокси или (C₂-C₄)галоалкокси, и

R_H^4 означает водород или (C₁-C₄)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 2 других кольцевых гетероатомов из группы N, O и S, и которое является незамещенным или замещено одним или более остатками из группы галогена, циано, нитро, (C₁-C₄)алкил, (C₁-C₄)галоалкила, (C₁-C₄)алкокси, (C₁-C₄)галоалкокси и (C₁-C₄)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 (MCPA),

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, беноксакор и дихлорамид.

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, полиоксэтилированные алифатические спирты, полиоксэтилированные алифатические амины, полигликольэфирсульфаты жирного спирта, алкансульфонаты, алкилбензолсульфонаты, лигнинсульфокислый 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, воздуходушная 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 алкиларилсульфокислоты, 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 нанесением 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, с. 147 и др., "Perry's Chemical Engineer's Handbook", 5-е изд., McGraw-Hill, Нью-Йорк 1973, с. 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, с. 81-96 и J.D. Freyer, S.A. Evans, "Weed Control Handbook", 5-е изд., Blackwell Scientific Publications, Оксфорд, 1968, с. 101-103.

Агрохимические препаративные формы содержат, как правило, 0.1-99 мас.%, особенно 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 мере 5-20 мас.% действующего вещества, растворы для рассыпания содержат, примерно 0.05-80, предпочтительно 2-50 мас.% действующего 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, краси-

тели, 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 препаративной 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, т.д. необходимые нормы соединения 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, особенно 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 неорганической и органической 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 галогенуглеводороды, а также бутан, пропан, азот и диоксид углерода.

В препаративных формах могут быть использованы такие средства, улучшающие адгезию, как карбоксиметилцеллюлозу, 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 глицерин, 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 средства 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 полиэтоксилированных 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 следы 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 мас.%, 0,01-98 мас.%, предпочтительно 0,1-95 мас.%, особенно предпочтительно 0,5-90% 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 опрыскивания, 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 с по меньшей мере 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, гибберелинами, а также другими технологическими добавками.

Средства согласно изобретению содержат 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, окутанием, (разбрызгиванием) опрыскиванием, распылением, орошением, распылением жидкости, пульверизацией, опыливанием, (рассеиванием) осыпанием, вспениванием, обмазыванием, предварительное промазывание, поливом (сплошным поливом), капельным орошением также на материал размножения растений, особенно 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.

Одним из преимуществ настоящего изобретения является то, что благодаря особым системным свойствам действующих веществ или средств согласно изобретению обработка семенного материала этими действующими веществами или средствами защищает не только семенной материал, но также и полученные из него растения после прорастания от фитопатогенных грибов. Таким способом можно не проводить непосредственную обработку культур в момент посева или сразу после него.

Также предпочтительным считается, что действующие вещества или средства согласно изобретению особенно также можно применять на трансгенном семенном материале, причем вырастающие из этого семенного материала растения способны экспримировать протеин, который оказывает воздействие на вредителей. С помощью обработки такого семенного материала действующими веществами или средствами согласно изобретению с помощью экспрессии, например инсектицидного протеина, можно бороться с определенными вредителями. При этом неожиданно наблюдали другой синергический эффект, который дополнительно увеличивает эффективность защиты от поражения вредителями.

Средства согласно изобретению подходят для защиты семенного материала любых растений, кото-

рые выращивают в сельском хозяйстве, в теплице, в лесных угодьях или в садоводстве и в виноградарстве. При этом речь идет, в частности, о семенном материале зерновых культур (как пшеница, ячмень, рожь, тритикале, просо и овес), кукурузе, хлопке, сое, рисе, картофеле, подсолнечнике, бобах, кофе, свекле (например, сахарной свекле и кормовой свекле), арахисе, рапсе, маке, оливках, кокосовом орехе, какао, сахарном тростнике, табаке, овощных культурах (как томаты, огурцы, репчатый лук и салат), газонной траве и декоративных растениях (см. также ниже). Особое значение имеет обработка семенного материала зерновых культур (как пшеницы, ячменя, ржи, тритикале и овса), кукурузы и риса.

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 (*Euroean 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, оболочки, 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 выбрать количество наносимого на семенной материал средства согласно изобретению и/или других добавок не вредило прорастанию семян или не наносило 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 средства 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 препаративные формы сверхмалого объема.

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, гибберелинами, 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 алкилнафталин-сульфонаты, как диизопропил- или диизобутил-нафталин-сульфонаты.

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, поливинилацетат, 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, выщипанная 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.

бретению 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 асSEMBлирован 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 расположением 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.

При определенных нормах расхода комбинации действующих веществ согласно изобретению также могут оказывать сильное действие на растения. Поэтому они подходят для мобилизации растительной защитной системы от поражения нежелательными фитопатогенными грибами и/или микроорганизмами и/или вирусами. При необходимости, это может быть одной из причин повышенной эффективности комбинации согласно изобретению, например, от грибов. Укрепляющие растения (индуцирующие защитные свойства) вещества в данном контексте также должны означать такие вещества или комбинации веществ, которые способны стимулировать защитную систему растений таким образом, что обработанные растения, если они в дополнение к этому привиты нежелательными фитопатогенными грибами, обнаруживают значительную устойчивость к этим нежелательным фитопатогенным грибам. Поэтому вещества согласно изобретению можно применять для защиты растения от поражения упомянутыми патогенами в течение определенного периода времени после обработки. Период времени, на протяжении которого оказывается защитное воздействие, в общем составляет 1-10 дней, предпочтительно 1-7 дней после обработки растений действующими веществами.

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).

Растения и сорта растения, которые также можно обрабатывать согласно изобретению, устойчивые к одному или нескольким биотическим стрессовым факторам, т.е. эти растения обнаруживают улучшенную защиту от животных и микробиологических вредителей, как нематоды, насекомые, клещи, фитопатогенные грибов, бактерии, вирусы и/или вириды.

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 и сорта растения, которые также можно обрабатывать согласно изобретению, являются такими растениями, которые являются устойчивыми к одному или нескольким абиотическим стрессовым факторам. К абиотическим стрессовым условиям могут относиться, например, засуха, холодные и жаркие условия, осмотический стресс, застой воды, повышенное содержание соли в почве, повышенное выщелачивание минералов, озоновые условия, сильные световые условия, ограниченная доступность азотных питательных веществ, ограниченная доступность фосфорных питательных веществ или избегание тени.

Растениями и сортами растений, которые также могут быть обработаны согласно изобретению, являются такие растения, которые отличаются повышенными качествами урожая. Повышенная урожайность у этих растений может быть, например, связана с улучшенной физиологией растения,

улучшенным ростом растений и улучшенным развитием растений, такими как эффективное использование воды, эффективное удерживание воды, улучшенное использование азота, повышенное ассимилирование углерода, улучшенный фотосинтез, возросшая сила зародыша и ускоренное созревание. Наряду с этим, урожайность можно повысить, улучшая архитектуру растений (при стрессовых и не стрессовых условиях), среди которых раннее цветение, контроль цветения для производства гибридного семенного материала, способность растений к развитию зародышей, размер растений, интернодиальное число и отстояние, рост корней, размеры семян, размеры фрутков, размеры стручков, количество стручков или колосьев, количество зерен в стручке или колосе, семенная масса, усиленное заполнение семян, уменьшенное выпадение семян, уменьшенное лопание стручков, а также устойчивость при хранении. К другим признакам продуктов урожая относятся состав семян, такой как содержание углеводов, содержание белка, содержание масла и состав масла, питательность, уменьшение соединений, нежелательных для питания, улучшенная перерабатываемость и улучшенная сохраняемость продуктов урожая.

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 (то есть 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 *Varstar* 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, то есть 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, то есть 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, Science 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 глифосат-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 одного мутанта 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 гидроксифенилпируватдиоксигеназы имеются в виду энзимы, которые катализируют реакцию, при которой пара-гидроксифенилпируват (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 6,768,044. 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 нетолерантными 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, имидазолинон, 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 Tanel 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 5,198,599 или для подсолнечника WO 01/065922).

Растения или сорта растений (которые получены способами биотехнологии растений, такими как генные технологии), которые также можно обработать согласно данному изобретению, представляют собой трансгенные растения, устойчивые к насекомым, то есть растения, которые выращены устойчивыми от поражения определенными целевыми насекомыми. Такие растения могут быть получены в результате генетической трансформации, или в результате селекции растений, которая включает одну мутацию, обеспечивающую такую устойчивость к насекомым.

Понятие "устойчивое к насекомым трансгенное растение" охватывает в данном контексте любое растение, которое содержит как минимум один трансген, который включает кодирующую последовательность, кодирующую следующее:

1) инсектицидный кристаллический белок (протеин) из *Bacillus thuringiensis* или его инсектицидную часть, такие как инсектицидные кристаллические белки, перечисленные в Crickmore et al. (Microbiology and Molecular Biology Reviews 1998, 62, 807-813), обновленное описание в Crickmore et al. (2005) в *Bacillus thuringiensis* Toxin Nomenclatur, описанные онлайн в: http://www.lifesci.sussex.ac.uk/Home/Neil_Crickmore/Bt/, или его инсектицидную часть, например, класс Cry-протеинов Cry1Ab, CryAc, CryB, CryC, CryD, CryF, Cry2Ab, Cry3Aa, или Cry3Bb или их инсектицидную часть (например, EP-A 1999141 и WO 2007/107302), или такой протеин, кодированный синтетическим геном, как описанный в патентной заявке США 12/249016; или

2) кристаллический белок из *Bacillus thuringiensis* или его части, который в присутствии второго, другого кристаллического белка из *Bacillus thuringiensis* или его части действует инсектицидно, как бинарный токсин, который состоит из кристаллических белков Cy34 и Cy35; или (Nat. Biotechnol. 2001, 19, 668-72; Applied Environm. Microbiol. 2006, 71, 1765-1774) или двойного токсина, который состоит из Cry1A или Cry1F протеинов и Cry2Aa или Cry2Ab или Cry2Ae протеина (патентная заявка США 12/214022 и EP 08010791.5); или

3) инсектицидный гибридный белок, который включает части двух различных инсектицидных кристаллических белков из *Bacillus thuringiensis*, такой, например, как гибрид из белков 1), приведенных выше, или гибрид из белков 2), приведенных выше, например, белок Cry1A.105, который продуцируют из варианта кукурузы MON98034 (WO 2007/027777); или

4) протеин по одному из пп.1)-3), приведенных выше, в котором некоторые, в частности, 1-10 аминокислоты замещены другой аминокислотой, для того чтобы добиться более высокой инсектицидной эффективности по отношению к целевым насекомым и/или для того чтобы расширить спектр соответствующих целевых насекомых, и/или в связи с изменениями, которые были индуцированы в кодирующей ДНК во время клонирования или трансформации, такой как белок Cry3Bb1 в варианте кукурузы MON863 или MON88017 или белок Cry3A в варианте кукурузы MIR 604;

5) инсектицидный выделенный белок из *Bacillus thuringiensis* или *Bacillus cereus* или его инсектицидной части, такие как вегетативно действующие токсичные по отношению к насекомым белки (вегетативные инсектицидные белки, VIP), которые указаны в http://www.lifesci.sussex.ac.uk/Home/Neil_Crickmore/Bt/vip.html, например, белки класса белков VIP3Aa; или

6) выделенный белок из *Bacillus thuringiensis* или *Bacillus cereus*, который в присутствии другого выделенного белка из *Bacillus thuringiensis* или *B. cereus* действует инсектицидно, так же как бинарный токсин, который состоит из белков VIP1A и VIP2A (WO 94/21795); или

7) инсектицидный гибридный белок, который включает части различных выделенных белков из *Bacillus thuringiensis* или *Bacillus cereus*, такой как гибрид белков 1) или гибрид белков 2), приведенных выше; или

8) белок по одному из пп.5)-7), приведенных выше, в котором некоторые, особенно, 1-10 аминокислоты замещены другой аминокислотой, для того чтобы достигнуть более высокой инсектицидной эффективности по отношению к целевому виду насекомых и/или для того чтобы расширить спектр соответствующих целевых видов насекомых, и/или в связи с изменениями, которые были индуцированы в кодирующей ДНК во время клонирования или трансформации (причем, кодирование сохраняется для одного инсектицидного белка), такой как белок VIP3Aa в варианте хлопчатника COT 102; или

9) выделенный белок из *Bacillus thuringiensis* или *Bacillus cereus*, который в присутствии другого выделенного белка из *Bacillus thuringiensis* действует инсектицидно, так же как бинарный токсин, который состоит из белков VIP3 и Cry1A или Cry1F (US патентные заявки 61/126083 и 61/195019), или бинарный токсин, который состоит из белков VIP3 и Cry2Aa или Cry2Ab или белков Cry2Ae (патентная заявка США 12/214,022 и EP 08010791.5); или

10) белок по п.9), приведенному выше, в котором некоторые, в частности, 1-10 аминокислоты замещены другой аминокислотой, для того чтобы достигнуть более высокой инсектицидной эффективности по отношению к целевому виду насекомых и/или для того чтобы расширить спектр соответствующих целевых видов насекомых, и/или в связи с изменениями, которые были индуцированы в кодирующей ДНК во время клонирования или трансформации (причем, кодирование сохраняется для одного инсектицидного белка).

Естественно, что к устойчивым к инсектицидам трансгенным растениям в настоящем изобретении относится также любое растение, которое включает комбинацию генов, которые кодируют белки одного из приведенных выше классов 1-10. В одной форме выполнения изобретения устойчивое к инсектицидам растение содержит более одного трансгена, кодирующего белок одного из приведенных выше классов 1-10, для того чтобы расширить спектр соответствующих целевых видов насекомых или для того, чтобы замедлить развитие устойчивости насекомых по отношению к растению, в результате того, что встраивают различные белки, которые инсектицидно действуют на целевой вид насекомого, однако имеют отличный характер действия, такой как присоединение к различным местам присоединения рецептора у насекомого.

"Устойчивое к инсектицидам трансгенное растение" в данном контексте означает растения, которое, по меньшей мере, содержит один трансген, который содержит последовательность получения двойной спирали РНК, которая после приема пищи насекомым-вредителем препятствует росту этого вредителя.

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 PARC 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 моонуклеотид-аденилтрансферазу, никотинамидадениндинуклеотидсинтазу или никотинамидфосфоррибосилтрансферазу.

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:

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

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

с) растения, такие как растения хлопчатника, с повышенной экспрессией сахарозесинтазы;

д) растения, такие как растения хлопчатника, у которых изменен момент времени пропускания плазмодесмов у основания клетки волокна, например, в результате регулирования вниз волоконселективной β -1,3-глюканазы;

е) 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:

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

б) растения, такие как растения рапса, которые продуцируют масло с низким содержанием линоленовой кислоты;

с) 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 Tecnorplant, 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 гесут гены Nt-Inh, II-INV) или которые показывают фенотип карликовости (ген A-20 оксидаза).

Растения или сорта растений (которые были получены методами растительной биотехнологии, та-

кими как генные технологии), которые также могут быть обработаны согласно данному изобретению, представляют собой растения рапса или родственных Brassica-растения с измененными свойствами расстрескивание 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 расстрескиванием семян.

Особенно полезными трансгенными растениями, которые могут быть обработаны согласно данному изобретению, являются растения, с одним трансформирующим событием или комбинацией трансформирующих 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 рассмотрении 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. 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 трансформации.

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 прошения или могут быть получены от APHIS по запросу.

Особенно полезными трансгенными растениями, которые могут быть обработаны согласно данному изобретению, являются растения, с одним или несколькими генами, кодирующими один или несколько токсинов, являются трансгенные растения, которые продаются под торговыми названиями: YIELD GARD® (например, кукуруза, хлопчатник, соевые бобы), KnockOut® (например, кукуруза), BiteGard® (например, кукуруза), BT-Xtra® (например, кукуруза), StarLink® (например, кукуруза), Bollgard® (хлопчатник), Nucotn® (хлопчатник), Nucotn 33B® (хлопчатник), NatureGard® (например, кукуруза), Pro-tecta® 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, кукуруза).

Особенно полезными трансгенными растениями, которые могут быть обработаны согласно данному 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_browse.aspx и http://ceragmc.org/index.php?evidcode=&hstIDXCode=&gType=&AbbrCode=&atCode=&stCode=&coIDCode=&action=gm_crop_database&mode=Submit).

Действующие вещества или средства согласно данному можно также применять в защите материалов для защиты технических материалов от поражения и разрушения нежелательными микроорганизмами, как, например, грибами и насекомыми.

Далее соединения согласно данному изобретению сами по себе или в комбинации с другими биологически активными веществами могут применяться в качестве средств для борьбы с обрастанием предметов.

Под техническими материалами следует понимать в данной связи неживые материалы, которые приготовлены для применения в технике. Например, техническими материалами, которые должны быть защищены от микробного изменения или разрушения, могут быть клеящие вещества, глины, бумага, стеновой картон и картон, текстиль, ковры, кожа, древесина, лакокрасочные материалы и изделия из пластмасс, смазочно-охлаждающие средства и другие материалы, которые могут подвергаться поражению микроорганизмами или разрушаться ими. Среди защищаемых материалов следует назвать также части производственных установок и здания, например, контуры водяного охлаждения, охлаждающие и нагре-

вательные системы, и вентиляционные и кондиционирующие установки, которым может быть причинен ущерб за счет размножения микроорганизмов. В рамках настоящего изобретения следует назвать в качестве технических материалов предпочтительно клеящие вещества, глины, бумагу и картон, кожу, древесину, лакокрасочные материалы, смазочно-охлаждающие средства и жидкости-теплоносители, особенно предпочтительно древесину. Действующие вещества или средства согласно изобретению могут предотвратить нежелательные эффекты, такие как гниение, распад, окрашивание, обесцвечивание или заплесневение. Кроме того, соединения согласно данному изобретению можно применять для защиты от обрастания предметов, в частности, корпусов кораблей, сит, сетей, сооружений, причальных установок и сигнальных установок, которые могут находиться в контакте с морской водой или со сточными водами.

Способ борьбы с нежелательными грибами согласно данному изобретению можно также применять для защиты товаров, подлежащих длительному хранению (Storage Goods). Под "товарами, подлежащими длительному хранению" при этом понимают природные вещества растительного или животного происхождения, или продукты их переработки, которые получены из природы и для которых необходима долговременная защита. Товары, подлежащие длительному хранению, растительного происхождения, такие как, например, растения или части растений, например стебли, листья, клубни, семена, фрукты, зерна, могут быть защищены в виде свежесобранного урожая или после переработки с (предварительной) сушкой, увлажнением, измельчением, перемалыванием, прессованием или поджариванием. Товары, подлежащие длительному хранению, охватывают также полезную древесину, является ли она не переработанной, такой как строительный лес, мачты линий электроснабжения и ограды, или в виде готовых продуктов, таких как мебель. К товарам, подлежащим длительному хранению, животного происхождения относятся, например, шкуры животных, кожа, шубы и волосы. Действующие вещества или средства согласно изобретению могут предотвращать такие отрицательные эффекты, как гниение, разрушение, окрашивание, обесцвечивание или заплесневение.

В качестве примера, но ни в коем случае не ограничивая, следует назвать некоторых возбудителей грибковых заболеваний, которые могут быть обработаны согласно данному изобретению: заболевания, вызываемые возбудителями истинной мучнистой росы, такими как, например, виды рода блумерия (*Blumeria*), например, *Blumeria graminis*; виды рода подосфера (*Podospaera*), такие как, например, *Podospaera leucotricha*; виды рода сферотека (*Sphaerotheca*), такие как, например, *Sphaerotheca fuliginea*; виды рода унцинула (*Uncinula*), такие как, например, *Uncinula necator*; заболевания, вызываемые возбудителями болезней ржавления, такими как, например, виды рода гимноспорангиум (*Gymnosporangium*), такие как, например, *Gymnosporangium sabinae*; виды рода гемилея (*Hemileia*), такие как, например, *Hemileia vastatrix*; виды рода факоспора (*Phakopsora*), такие как, например, *Phakopsora pachyrhizi* и *Phakopsora meibomia*; виды рода пукциния (*Puccinia*), такие как, например, *Puccinia recondita* или *Puccinia triticensis*; виды рода уромисец (*Uromyces*), такие как, например, *Uromyces appendiculatus*; заболевания, вызываемые возбудителями из группы оомицетов (*Oomycetes*), такими как, например, виды рода бремия (*Bremia*), такие как, например, *Bremia lactucae*; виды рода пероноспора (*Peronospora*), такие как, например, *Peronospora pisi* или *P. brassicae*; виды рода фитофтора (*Phytophthora*), такие как, например, *Phytophthora infestans*; виды рода плазмопара (*Plasmopara*), такие как, например, *Plasmopara viticola*; виды рода псевдопероноспора (*Pseudoperonospora*), такие как, например, *Pseudoperonospora humuli* или *Pseudoperonospora cubensis*; виды рода питиум (*Pythium*), такие как, например, *Pythium ultimum*; заболевания, приводящие к образованию пятен на листьях, которые вызывают, например, виды листьев рода и увяданию альтернария (*Alternaria*), такие как, например, *Alternaria solani*; виды рода церкоспора (*Cercospora*), такие как, например, *Cercospora beticola*; виды рода кладоспориум (*Cladosporium*), такие как, например, *Cladosporium cucumerinum*; виды рода кохлиоболус (*Cochliobolus*), такие как, например, *Cochliobolus sativus* (конидиальная форма: Дрекслера, син: гельминтоспориум); виды рода коллетотрихум (*Colletotrichum*), такие как, например, *Colletotrichum lindemuthianum*; виды рода циклоконииум (*Cycloconium*), такие как, например, *Cycloconium oleaginum*; виды рода диапорте (*Diaporthe*), такие как, например, *Diaporthe citri*; виды рода элсиное (*Elsinoe*), такие как, например, *Elsinoe fawcettii*; виды рода глеоспориум (*Gloeosporium*), такие как, например, *Gloeosporium laeticolor*; виды рода гломерелла (*Glomerella*), такие как, например, *Glomerella singulata*; виды рода гуигнардия (*Guignardia*), такие как, например, *Guignardia bidwellii*; виды рода лептосфера (*Leptosphaeria*), такие как, например, *Leptosphaeria maculans*; виды рода магнапорте (*Magnaporthe*), такие как, например, *Magnaporthe grisea*; виды рода микродохиум (*Microdochium*), такие как, например, *Microdochium nivale*; виды рода микосфераелла (*Mycosphaerella*), такие как, например, *Mycosphaerella graminicola* и *M. fijiensis*; виды рода феосфера (*Phaeosphaeria*), такие как, например, *Phaeosphaeria nodomm*; виды рода пиренофора (*Pyrenophora*), такие как, например, *Pyrenophora teres*; виды рода рамулария (*Ramularia*), такие как, например, *Ramularia collo-cygni*; виды рода ринхоспориум (*Rhynchosporium*), такие как, например, *Rhynchosporium secalis*; виды рода септория (*Septoria*), такие как, например, *Septoria arii*; виды рода тифула (*Typhula*), такие как, например, *Typhula incarnata*; виды рода вентурия (*Venturia*), такие как, например, *Venturia inaequalis*; заболевания корней и стеблей, которые вызывают, например, виды рода кортициум (*Corticium*), такие как, например, *Corticium graminearum*; виды рода фузариум (*Fusarium*), такие как, например, *Fusarium oxysporum*; виды рода гаеуманномисец (*Gaeumannomyces*), такие как, например, *Gaeumannomyces graminis*; виды рода ризоктония (*Rhizoctonia*), такие

как, например, *Rhizoctonia solani*; виды рода тапезия (*Tapesia*), такие как, например, *Tapesia acuformis*; виды рода тиелавиопсис (*Thielaviopsis*), такие как, например, *Thielaviopsis basicola*; заболевания колосьев и метелок (включая кочаны кукурузы), которые вызывают, например, виды рода алтернария (*Alternaria*), такие как, например, *Alternaria* spp.; виды рода аспергиллус (*Aspergillus*), такие как, например, *Aspergillus flavus*; виды рода кладоспориум (*Cladosporium*), такие как, например, *Cladosporium cladosporioides*; виды рода клавицепс (*Claviceps*), такие как, например, *Claviceps purpurea*; виды рода фузариум (*Fusarium*), такие как, например, *Fusarium culmorum*; виды рода гибберелла (*Gibberella*), такие как, например, *Gibberella zeae*; виды рода монографелла (*Monographella*), такие как, например, *Monographella nivalis*; виды рода септория (*Septoria*), такие как, например, *Septoria nodorum*; заболевания, вызываемые головневыми грибами, такими как, например, виды рода сфацелотека (*Sphaelotheca*), такие как, например, *Sphaelotheca reiliana*; виды рода тиллетия (*Tilletia*), такие как, например, *Tilletia caries*, *T. controversa*; виды рода уроцистис (*Urocystis*), такие как, например, *Urocystis occulta*; виды рода устилага (*Ustilago*), такие как, например, *Ustilago nuda*, *U. nuda tritici*; гниение фруктов, которое вызывают, например, виды рода аспергиллус (*Aspergillus*), такие как, например, *Aspergillus flavus*; виды рода ботритис (*Botrytis*), такие как, например, *Botrytis cinerea*; виды рода пенициллиум (*Penicillium*), такие как, например, *Penicillium expansum* и *P. purpurogenum*; виды рода склеротиния (*Sclerotinia*), такие как, например, *Sclerotinia sclerotiorum*; виды рода вертицилиум (*Verticillium*), такие как, например, *Verticillium albo-atrum*; происходящие от семян и почвы гнили заболевания сеянцев, которые вызывают, фузариум (*Fusarium*), такие как, например, и увядания, а например, виды *Fusarium culmorum*; также рода виды рода фитофтора (*Phytophthora*), такие как, например, *Phytophthora cactorum*; виды рода питиум (*Pythium*), такие как, например, *Pythium ultimum*; виды рода ризоктония (*Rhizoctonia*), такие как, например, *Rhizoctonia solani*; виды рода склеротиум (*Sclerotium*), такие как, например, *Sclerotium rolfsii*; раковые заболевания, галлы (наросты) и ведьмины метелки, которые вызывают, например, виды рода нектрия (*Nectria*), такие как, например, *Nectria galligena*; заболевания увядания, которые вызывают, например, виды рода монилия (*Monilinia*), такие как, например, *Monilinia laxa*; деформации листьев, соцветий и фруктов, которые вызывают, например, виды рода тафрина (*Taphrina*), такие как, например, *Taphrina deformans*; дегенерационные заболевания древесных растений, которые вызывают, например, виды рода эска (*Esca*), такие как, например, *Phaeoniella clamadospora*, *Phaeoacremonium aleophilum* и *Fomitiporia mediterranea*; заболевания цветов и семян, которые вызывают, например, виды рода ботритис (*Botrytis*), такие как, например, *Botrytis cinerea*; заболевания клубней растений, которые вызывают, например, виды рода ризоктония (*Rhizoctonia*), такие как, например, *Rhizoctonia solani*; виды рода гельминтоспориум (*Helminthosporium*), такие как, например, *Helminthosporium solani*; заболевания, которые вызывают бактериальные возбудители, например, виды рода ксантомонас (*Xanthomonas*), такие как, например, *Xanthomonas campestris* pv. *oryzae*; виды рода псевдомонас (*Pseudomonas*), такие как, например, *Pseudomonas syringae* pv. *lachrymans*; виды рода эрвиния (*Ergwinia*), такие как, например, *Ergwinia amylovora*;

Предпочтительно можно бороться со следующими болезнями соевых бобов:

грибковые заболевания листьев, стеблей, стручков и семян, которые вызывают, например, пятна на листьях, вызываемые видом рода алтернария (*Alternaria* spec. *atrans tenuissima*), антракнозе (*Anthracoise*) (*Colletotrichum gloeosporoides dematium* var. *truncatum*), коричневые пятна (*Septoria glycines*), пятна на листьях и увядание листьев, вызываемые видом рода церкоспора (*Cercospora kikuchii*), увядание листьев, вызываемые видом рода хоанефора (*Choanephora infundibulifera trispora* (син.)), пятна на листьях, вызываемые видом рода дактилиофора (*Dactuliophora glycines*), пушистая плесень, вызываемые видом рода пероноспора (*Peronospora manshurica*), увядание, вызываемое видом рода дрекслера (*Drechslera glycini*), ленточные пятна на листьях, вызываемые видом рода церкоспора (*Cercospora sojae*), пятна на листьях, вызываемые видом рода лептосферулина (*Leptosphaerulina trifolii*), пятна на листьях, вызываемые видом рода филлостикта (*Phyllosticta sojaecola*), увядание стручков и стеблей, вызываемое видом рода фомопсис (*Phomopsis sojae*), пылевидная мучнистая роса, вызываемая видом рода микросфера (*Microsphaera diffusa*), пятна на листьях, вызываемые видом рода пиренохаета (*Pyrenochaeta glycines*), увядание надземных частей, листья и тканей растений, вызываемое видом рода ризоктония (*Rhizoctonia solani*), ржа, головня, вызываемые видами рода факопсора (*Phakopsora pachyrhizi*, *Phakopsora meibomiaae*), коркообразные пятна, вызываемые видом рода сфацелома (*Sphaeloma glycines*), увядание листьев, вызываемое видом рода стемфилиум (*Stemphylium botryosum*), точечные пятна, вызываемые видом рода коринеспора (*Corynespora cassiicola*).

Грибковые заболевания на корнях и стеблях, которые вызывают, например, черное гниение корней, вызываемые видом рода калонектрия (*Calonectria crotalariae*), углеводное гниение, вызываемые видом рода макрофомина (*Macrophomina phaseolina*), увядание или поникание, гниение корней и кроны и стручков, вызываемое видами рода фузариум (*Fusarium oxysporum*, *Fusarium orthoceras*, *Fusarium semitectum*, *Fusarium equiseti*), гниение корней, вызываемое видами родов миколептодискус (*Mycolopodiscus terrestris*), неокосмоспора (*Neocosmospora vasinfecta*), увядание кроны и стеблей, вызываемые видом рода диапорте (*Diaporthe phaseologum*), язва стеблей, вызываемые видом рода диапорте (*Diaporthe phaseologum* var. *caulivora*), гниение, вызываемое видом рода фитофтора (*Phytophthora megasperma*), коричневое гниение стеблей (*Phialophora gregata*), гниение, вызываемое видами рода питиум (*Pythium aphanider-*

matum, *Pythium irregulare*, *Pythium debaryanum*, *Pythium myriotylum*, *Pythium ultimum*), гниение корней, разрушение стеблей и гибель от милдью, вызываемое видом рода ризоктония (*Rhizoctonia solani*), разрушение стеблей, вызываемое видом рода склеротиния (*Sclerotinia sclerotiorum*), южное увядание, вызываемое видом рода склеротиния (*Sclerotinia rolfii*), гниение корней, вызываемое видом рода тиелавиопис (*Thielaviopsis basicola*).

В качестве микроорганизмов, которые могут вызвать деструкцию или изменение технических материалов, следует назвать, например, бактерии, грибы, дрожжи, водоросли и слизевые организмы. Преимущественно биологически активные вещества согласно данному изобретению действуют на грибы, в частности, плесневые грибы, окрашивающие и разрушающие древесину грибы (базидиомицеты), а также на слизевые организмы и водоросли. Следует назвать, например, микроорганизмы следующих родов: альтернэрия (*Alternaria*), таких видов как *Alternaria tenuis*; аспергиллус (*Aspergillus*), таких видов как *Aspergillus niger*; хетомиум (*Chaetomium*), таких видов как *Chaetomium globosum*; кониофора (*Coniophora*), таких видов как *Coniophora puetana*; лентинус (*Lentinus*), таких видов как *Lentinus tigrinus*; пенициллиум (*Penicillium*), таких видов как *Penicillium glaucum*; полипорус (*Polyporus*), таких видов как *Polyporus versicolor*; ауреобазидиум (*Aureobasidium*), таких видов как *Aureobasidium pullulans*; склерофома (*Sclerophoma*), таких видов как *Sclerophoma pityophila*; триходерма (*Trichoderma*), таких видов как *Trichoderma viride*; эшерихия (*Escherichia*), таких видов как *Escherichia coli*; псевдомонас (*Pseudomonas*), таких видов как *Pseudomonas aeruginosa*; стафилококкус (*Staphylococcus*), таких видов как *Staphylococcus aureus*.

Наряду с этим, биологически активные вещества согласно данному изобретению проявляют очень хорошее антимикотическое действие. Они обладают очень широким антимикотическим спектром, в частности, против дерматофитов и побеговых грибов, плесени и дифазных грибов (например, против видов кандиды (*Candida*), таких как *Candida albicans*, *Candida glabrata*), а также *Epidermophyton floccosum*, видов аспергиллус (*Aspergillus*), таких как *Aspergillus niger* и *Aspergillus fumigatus*, видов трихофитон (*Trichophyton*), таких как *Trichophyton mentagrophytes*, видов микроспорой (*Microsporon*), таких как *Microsporon canis* и *audouinii*. Перечисление этих грибов ни в коем случае не является ограничением охватываемого микотического спектра, а носит только пояснительный характер.

Биологически активные вещества в связи с этим могут применяться как для медицинских, так и для не медицинских применений.

Соединения согласно изобретению, при необходимости, в определенных концентрациях, соответственно, расходных количествах могут применяться в качестве гербицидов, защитных веществ, регуляторов роста растений или средств для улучшения свойств растений, или в качестве микробицидов, например, в качестве фунгицидов, антимикотиков, бактерицидов, вирицидов (включая средства против вириодов) или средств против MLO (организмы, подобные микоплазме) и RLO (организмы подобные риккетсии (*Rickettsia*)). При необходимости, они могут быть использованы в качестве промежуточных и предшествующих продуктов для синтеза других биологически активных веществ.

А. Химические примеры.

Данные ЯМР опубликованных примеров представлены или в классической форме (δ -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 δ -значение в ч. на тыс. (ppm) и затем интенсивность сигнала отдельно через знак пробела. Пара данных δ -величина-интенсивность сигнала различных сигнальных пигов отделены друг от друга точкой с запятой.

Поэтому список пигов примеров имеет форму:

$$\delta_1 (\text{интенсивность}); \delta_2 (\text{интенсивность}); \dots; \delta_i (\text{интенсивность}); \dots; \delta_n (\text{интенсивность})$$

Интенсивность четких сигналов находится в отношении корреляции с высотой сигналов в печатном 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 ^1H -ЯМР-спектров мы использовали тетраметилсилан и/или химический сдвиг растворителя, в частности, в случае спектров, которые измеряют в ДМСО. Поэтому в пики списков ЯМР может встречаться тетраметилсилан, но это является необязательным.

Списки пигов ^1H -ЯМР схожи с классическими печатными списками ^1H -ЯМР и обычно содержат все пики, которые упоминают классические ЯМР-интерпретации.

Кроме того, они могут, как и классические печатные списки ^1H -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 наших ^1H -ЯМР-пиках показаны обычные пики растворителей, например, пики ДМСО в ДМСО- D_6 и пик воды, которые в среднем обычно обнаруживают высокую интенсивность.

Пики стереоизомеров мишеневидных соединений и/или пигов примесей обычно имеют более низ-

кую интенсивность, чем пики необходимых соединений (например, с чистотой >90%).

Такие стереоизомеры и/или примеси могут быть типичными для соответствующих способов получения. Таким образом их пики могут помогать при распознавании воспроизведения нашего 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, применяют дополнительный фильтр интенсивности. Такое изолирование было бы похоже на упомянутое отображение пиков в классической интерпретации ¹H-ЯМР.

Другие детали ¹H-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 в 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 3-(3,5-дифторфенил)-5-метил-4Н-изоксазол-5-метил-эфир карбоновой кислоты из 3,5-дифторбензальдегида в 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 превращением с 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 3-(3,5-дифторфенил)-5-(1-гидроксиэтил)-4Н-изоксазол-5-метилового эфира карбоновой кислоты.

19.9 г (104 ммоль) 3,5-дифтор-N-гидроксибензимидаоилхлорида (s. промежуточное соединение 1) растворили в 330 мл 2-пропанола и смешали с 15.0 г (104 ммоль) метилового эфира 3-гидрокси-2-метилбутановой кислоты. После добавления 43.8 г (522 ммоль) гидрокарбоната натрия нагрели суспензию до 50°C и поддерживали температуру в течение 2 ч, до полного превращения исходного материала. Суспензию отфильтровали и сгустили фильтрат в вакууме. Полученный остаток поместили в дихлорметан, затем промыли насыщенным раствором хлорида натрия, органическую фазу высушили над сульфатом натрия и после фильтрования выпарили в вакууме. Полученный таким образом неочищенный продукт поместили в толуол и кристаллизовали добавлением n-гептана. Таким образом получили 25.5 г (86%) 3-(3,5-дифторфенил)-5-(1-гидроксиэтил)-4Н-изоксазол-5-метилового эфира карбоновой кислоты в виде бесцветных кристаллов.

Диастереоизомер 1: ¹H NMR (CDCl₃): δ = 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: ¹H NMR (CDCl₃): δ = 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 3-(3,5-дифторфенил)-5-[1-(трифторметилсульфонил)этил]-4Н-изоксазол-5-метил-эфир карбоновой кислоты.

29.9 (105 ммоль) 3-(3,5-дифторфенил)-5-(1-гидроксиэтил)-4Н-изоксазол-5-метилового эфира карбоновой кислоты в 660 мл дихлорметана охладил до 0°C и смешали с 16.3 г (210 ммоль) пиридина. Затем медленно добавили раствор из 38.6 г (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 1 N 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: $^1\text{H NMR}$ (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: $^1\text{H NMR}$ (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 3-(3,5-дифторфенил)-5-винил-4Н-изоксазол-5-метилового эфира карбоновой кислоты.

43.0 г (103 ммоль) неочищенного продукта последнего этапа (3-(3,5-дифторфенил)-5-[1-(трифторметилсульфонилокси)этил]-4Н-изоксазол-5-метилового эфира карбоновой кислоты) растворили в 500 мл диметилацетамида и по каплям в течение 20 мин смешивали с раствором из 18.8 г (124 ммоль) DBU в 50 мл диметилацетамида. Реакционную смесь перемешивали при комнатной температуре в течение 2 ч, затем до 1 л добавили ледяную 2N 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.

$^1\text{H NMR}$ (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 (28.0 ммоль) 3-(3,5-дифторфенил)-5-винил-4Н-изоксазол-5-метилового эфира карбоновой кислоты смешали с 21 мл 2N натрового щёлоча и нагревали в течение 8 ч обратным потоком. После охлаждения реакционную смесь промыли этилацетатом, в водной фазе с помощью 2N соляной кислоты установили уровень pH 1, отфильтровали бесцветный осадок и высушили на воздухе. Выход составил 6.8 г (96%).

$^1\text{H NMR}$ (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-метил-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 затем 2.03 г (15.9 ммоль) оксалилхлорида. Наблюдалось активное газообразование. Смесь перемешивали в течение 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 4-аминотетрагидрофуран-3-метилового эфира карбоновой кислоты.

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

Промежуточное соединение 11.

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

Цис-4-аминотетрагидрофуран-2-метилвый эфир карбоновой кислоты гидрохлорид может быть получен согласно описанным в DP. Walker et al., *Synthesis* 2011, 1113-1119 методам.

Промежуточное соединение 12.

Получение [цис-4-аминотетрагидрофуран-2-ил](пирролидин-1-ил)метанон гидрохлорида.

К 100 мг (0.55 ммоль) цис-4-аминотетрагидрофуран-2-метилового эфира карбоновой кислоты гидрохлорида добавили 1.15 мл (13.7 ммоль) пирролидина и перемешивали 3 дня при комнатной температуре. Затем реакционную смесь выпарили в вакууме. Таким образом получили указанное в заголовке соединение в виде неочищенного продукта, который применяли без дополнительной очистки на следующем этапе.

Промежуточное соединение 13.

Получение цис-4-амино-N-циклопропилтетрагидрофуран-2-карбоксамид гидрохлорида.

К 100 мг (0.55 ммоль) цис-4-аминотетрагидрофуран-2-метилового эфира карбоновой кислоты гидрохлорида добавили 0.95 мл (13.7 ммоль) циклопропиламина и перемешивали 3 дня при комнатной температуре. Затем реакционную смесь выпарили в вакууме. Таким образом получили указанное в заголовке соединение в виде неочищенного продукта, который применяли без дополнительной очистки на следующем этапе.

Промежуточное соединение 14.

Получение цис-4-амино-N-метилтетрагидрофуран-2-карбоксамид гидрохлорида.

К 100 мг (0.55 ммоль) цис-4-аминотетрагидрофуран-2-метилового эфира карбоновой кислоты гидрохлорида в 2.5 мл метанола добавили 0.20 мл (2.75 ммоль) 40%-ного раствора метиламина в метаноле и перемешивали 3 дня при комнатной температуре. Затем реакционную смесь выпарили в вакууме. Таким образом получили указанное в заголовке соединение в виде неочищенного продукта, который применяли

без дополнительной очистки на следующем этапе.

Промежуточное соединение 15.

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

К 601 мг (4.14 ммоль) цис-4-аминотетрагидрофуран-2-метилового эфира карбоновой кислоты гидрохлорида в 12.5 мл дихлорметана добавили 1.15 мл триэтиламина, затем при 0°C добавили 750 мг (2.76 ммоль) хлорида карбоновой кислоты к Промежуточному соединению 9 в 12.5 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 получили 1.00 г (91%) метилового эфира цис-4-[[3-(3,5-дифторфенил)-5-винил-4Н-изоксазол-5-карбонил]амино]тетрагидрофуран-2-карбоновой кислоты.

Промежуточное соединение 16.

Получение цис-4-[[3-(3,5-дифторфенил)-5-метил-4Н-изоксазол-5-карбонил]амино]тетрагидрофуран-2-метилового эфира 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 для комнатной температуры и затем добавили воду. Органическую фазу отделили, высушили сульфатом натрия и выпарили в вакууме. После хроматографии выпаренного остатка на силикагеле получили 75 мг (21%) метилового эфира цис-4-[[3-(3,5-дифторфенил)-5-метил-4Н-изоксазол-5-карбонил]амино]тетрагидрофуран-2-карбоновой кислоты.

Промежуточное соединение 17.

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

По аналогии с получением промежуточного соединения 9 сначала получили соответствующий хлорид карбоновой кислоты, который превратили аналогично промежуточному соединению 15 в упомянутое в заголовке соединение.

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

Промежуточное соединение 18.

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

По аналогии с получением промежуточного соединения 4 сначала получили соответствующий хлорид карбоновой кислоты, который аналогично промежуточному соединению 16 превратили в целевое соединение. Таким образом из 169 мг (0.93 ммоль) цис-4-аминотетрагидрофуран-2-метилового эфира карбоновой кислоты гидрохлорида и 150 мг (0.62 ммоль) хлорида карбоновой кислоты получили 171 мг (75%) цис-4-[[3-(3-фторфенил)-5-метил-4Н-изоксазол-5-карбонил]амино]тетрагидрофуран-2-метилового эфира карбоновой кислоты.

Промежуточное соединение 19.

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

85 мг (0.24 ммоль) цис-4-[[3-(3-фторфенил)-5-метил-4Н-изоксазол-5-карбонил]амино]тетрагидрофуран-2-метилового эфира карбоновой кислоты смешали с 1 мл 2N 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.

Промежуточное соединение 20.

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

Сначала получили хлорид карбоновой кислоты промежуточное соединение 4, которое превратили аналогично промежуточному соединению 16 в упомянутое в заголовке соединение.

Таким образом из 787 мг (4.33 ммоль) 3-аминотетрагидрофуран-3-метилового эфира карбоновой кислоты - гидрохлорида и 750 мг (2.88 ммоль) хлорида карбоновой кислоты после переработки и хроматографии на силикагеле получили 223 мг (21%) 3-[[3-(3,5-дифторфенил)-5-метил-4Н-изоксазол-5-карбонил]амино]тетрагидрофуран-3-метилового эфира карбоновой кислоты и 535 мг (47%) 3-[[3-(3,5-дифторфенил)-5-метил-4Н-изоксазол-5-карбонил]амино]тетрагидрофуран-3-карбоновой кислоты.

Промежуточное соединение 21.

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

Сначала получили соответствующий хлорид карбоновой кислоты, который превратили аналогично получению промежуточного соединения 16 с помощью 4-аминотетрагидрофуран-3-метилового эфира карбоновой кислоты в упомянутое в заголовке соединение.

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

Промежуточное соединение 22.

Получение цис-4-[[[(5S)-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 переработки поместили в 2 М водный натровый щёлоч 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).

Аналитические данные промежуточных соединений.

Промежуточное соединение №	NMR
Промежуточное соединение – 16	¹ H-NMR(400.0 MHz, CDCl ₃): δ= 7.518(1.0);7.260(181.8);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(14.5);3.785(16.0);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(11.3);1.687(10.3); 1.541(35.4);0.008(2.1);0.000(68.8);-0.008(1.9)
Промежуточное соединение – 17	¹ H-NMR(400.0 MHz, CDCl ₃): 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(9.2);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)
Промежуточное соединение – 18	¹ H-NMR(400.0 MHz, CDCl ₃): 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);2.520(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)
Промежуточное соединение – 19	¹ H-NMR(400.0 MHz, d ₆ -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)
Промежуточное соединение – 20	¹ H-NMR(400.0 MHz, CDCl ₃): δ= 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)
Промежуточное соединение – 21	¹ H-NMR(400.0 MHz, CDCl ₃): 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)

Промежуточное соединение – 22	¹ H-NMR(400.0 MHz, CDCl ₃): δ = 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);6.0 98(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);4.5 98(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);4.09 0(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);2.1 84(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)
----------------------------------	---

Пример I-01.

Получение N-[3-(циклопропилкарбамоил)тетрагидрофуран-3-ил]-3-(3,5-дифторфенил)-5-метил-4Н-изоксазол-5-карбоксамид.

100 мг (0.28 ммоль) 3-[[3-(3,5-дифторфенил)-5-метил-4Н-изоксазол-5-карбонил]амино]тетрагидрофуран-3-карбоновой кислоты, 20 мг (0.35 ммоль) циклопропиламина, 11.4 мг (0.08 ммоль) 1-гидрокси-1Н-бензотриазола и 65 мг (0.33 ммоль) 1-(3-диметиламинопропил)-3-этилкарбодиимид гидрохлорида добавили при комнатной температуре в 5 мл дихлорметана. Затем добавили 41 мг (0.35 ммоль) N,N-диэтилизопропиламина, и реакционную смесь 16 ч перемешивали при комнатной температуре. Затем снова добавили 2 мл дихлорметана, 20 мг (0.35 ммоль) циклопропиламина, 11.4 мг (0.08 ммоль) 1-гидрокси-1Н-бензотриазола и 65 мг (0.33 ммоль) 1-(3-диметиламинопропил)-3-этилкарбодиимид гидрохлорида и 16 ч перемешивали при комнатной температуре. Затем реакционную смесь смешали с водой, отделили органическую фазу, высушили сульфатом натрия и выпарили в вакууме. Выпаренный остаток очистили с помощью хроматографии на силикагеле (растворитель: этилацетат/н-гептан). Таким образом получили 91 мг (82%) указанного в заголовке соединения.

Пример I-02.

Получение 3-(3,5-дифторфенил)-N-[цис-5-(метилкарбамоил)тетрагидрофуран-3-ил]-5-винил-4Н-изоксазол-5-карбоксамид.

100 мг (0.26 ммоль) метилового эфира карбоновой кислоты промежуточное соединение 15 в 2 мл метанола смешали с 0.47 мл (6.57 ммоль) 40%-ного раствора метиламина в метаноле и 16 ч перемешивали при комнатной температуре. Затем реакционную смесь выпарили в вакууме. Таким образом получили 73 мг (72%) указанного в заголовке соединения.

Пример I-03.

Получение 3-(3,5-дифторфенил)-5-метил-N-[цис-5-(пирролидин-1-карбонил)тетрагидрофуран-3-ил]-4Н-изоксазол-5-карбоксамид.

К 100 мг (0.38 ммоль) хлорида карбоновой кислоты промежуточное соединение 4 в 8 мл дихлорметана добавили 106 мг (0.57 ммоль) амида карбоновой кислоты промежуточное соединение 12, затем при 0°C добавили 117 мг (1.15 ммоль) триэтиламина и перемешивали в течение 6 ч при нагревании до комнатной температуры. Реакционную смесь выпарили в вакууме, и полученный остаток очистили посредством хроматографии на силикагеле (элюент н-гептан/этилацетат). Таким образом получили 96 мг (61%) 3-(3,5-дифторфенил)-5-метил-N-[цис-5-(пирролидин-1-карбонил)тетрагидрофуран-3-ил]-4Н-изоксазол-5-карбоксамид.

Пример I-04.

Получение N-[цис-5-(циклопропилкарбамоил)тетрагидрофуран-3-ил]-3-(3,5-дифторфенил)-5-метил-4Н-изоксазол-5-карбоксамид.

К 100 мг (0.38 ммоль) хлорида карбоновой кислоты промежуточное соединение 4 в 8 мл дихлорметана добавили 98 мг (0.57 ммоль) амида карбоновой кислоты промежуточное соединение 13, затем при 0°C добавили 117 мг (1.15 ммоль) триэтиламина и перемешивали в течение 6 ч при нагревании до комнатной температуры. Реакционную смесь выпарили в вакууме, и полученный остаток очистили посредством хроматографии на силикагеле (элюент н-гептан/этилацетат). Таким образом получили 101 мг (65%) N-[цис-5-(циклопропилкарбамоил)тетрагидрофуран-3-ил]-3-(3,5-дифторфенил)-5-метил-4Н-изоксазол-5-карбоксамид.

Пример I-05.

Получение 3-(3,5-дифторфенил)-5-метил-N-[цис-5-(метилкарбамоил)тетрагидрофуран-3-ил]-4Н-изоксазол-5-карбоксамида.

К 100 мг (0.38 ммоль) хлорида карбоновой кислоты промежуточное соединение 4 в 8 мл дихлорметана добавили 83 мг (0.57 ммоль) амида карбоновой кислоты промежуточное соединение 14, затем при 0°C добавили 117 мг (1.15 ммоль) триэтиламина и перемешивали в течение 6 ч при нагревании до комнатной температуры. Реакционную смесь выпарили в вакууме, и полученный остаток очистили посредством хроматографии на силикагеле (элюент н-гептан/этилацетат). Таким образом получили 50 мг (34%) 3-(3,5-дифторфенил)-5-метил-N-[цис-5-(метилкарбамоил)тетрагидрофуран-3-ил]-4Н-изоксазол-5-карбоксамида.

Пример I-06.

Получение 3-(3,5-дифторфенил)-N-[цис-5-(пирролидин-1-карбонил)тетрагидрофуран-3-ил]-5-винил-4Н-изоксазол-5-карбоксамида.

100 мг (0.26 ммоль) метилового эфира карбоновой кислоты промежуточное соединение 15 смешали с 0.52 мл (6.57 ммоль) пирролидина и в течение 16 ч перемешивали при комнатной температуре. Затем реакционную смесь выпарили в вакууме, и полученный остаток очистили посредством хроматографии на силикагеле (элюент н-гептан/этилацетат). Таким образом получили 57 мг (48%) указанного в заголовке соединения.

Пример I-07.

Получение 3-(3,5-дифторфенил)-5-метил-N-[4-(метилкарбамоил)тетрагидрофуран-3-ил]-4Н-изоксазол-5-карбоксамида.

К 150 мг (0.40 ммоль) метилового эфира карбоновой кислоты промежуточное соединение 21 в 5 мл метанола добавили 0.15 мл (2.00 ммоль) 40%-ного раствора метиламина в метаноле и перемешивали 3 дня при комнатной температуре. Затем реакционную смесь выпарили в вакууме. Таким образом получили 125 мг (84%) неочищенного упомянутого в заголовке соединения.

Пример I-08.

Получение N-[4-(циклопропилкарбамоил)тетрагидрофуран-3-ил]-3-(3,5-дифторфенил)-5-метил-4Н-изоксазол-5-карбоксамида.

150 мг (0.40 ммоль) метилового эфира карбоновой кислоты промежуточное соединение 21 смешали с 0.51 мл (6.10 ммоль) циклопропиламина и перемешивали 3 дня при комнатной температуре. Затем реакционную смесь выпарили в вакууме. Таким образом получили 193 мг неочищенного упомянутого в заголовке соединения.

Пример I-09.

Получение 3-(3,5-дифторфенил)-5-метил-N-[4-(пирролидин-1-карбонил)тетрагидрофуран-3-ил]-4Н-изоксазол-5-карбоксамида.

150 мг (0.40 ммоль) метилового эфира карбоновой кислоты промежуточное соединение 21 смешали с 0.51 мл (6.10 ммоль) пирролидина и перемешивали 3 дня при комнатной температуре. Затем реакционную смесь выпарили в вакууме, и полученный остаток очистили посредством хроматографии на силикагеле (элюент н-гептан/этилацетат). Таким образом получили 58 мг (34%) указанного в заголовке соединения.

Пример I-10.

Получение 3-(3-фторфенил)-N-[цис-5-(метоксикарбамоил)тетрагидрофуран-3-ил]-5-метил-4Н-изоксазол-5-карбоксамида.

0.11 г карбоновой кислоты промежуточное соединение 19 и 30 мг (аминокси)метагидрохлорида растворили в дихлорметане и по очереди смешали с 0.08 г триэтиламина и 0.28 г раствора ангидрида пропилфосфоновой кислоты (50%-ый) в тетрагидрофуране. Реакционную смесь перемешивали в течение 2.5 ч при комнатной температуре. Затем реакционную смесь промыли насыщенным водным раствором гидрокарбоната натрия, высушили и сконцентрировали в вакууме. Исходный продукт очистили посредством хроматографии на силикагеле. Таким образом получили 0.10 г (86%) эфира гидроксамовой кислоты.

Пример I-11.

Получение (5S)-3-(3,5-дифторфенил)-N-[цис-5-(метоксикарбамоил)тетрагидрофуран-3-ил]-5-винил-4Н-изоксазол-5-карбоксамида.

100 мг карбоновой кислоты промежуточное соединение 22 и 27 мг (аминокси)метагидрохлорида растворили в дихлорметане и по очереди смешали с 0.08 г триэтиламина и 0.26 г раствора ангидрида пропилфосфоновой кислоты (50%-ой) в тетрагидрофуране. Реакционную смесь перемешивали в течение 3 ч при комнатной температуре. Затем реакционную смесь промыли насыщенным водным раствором гидрокарбоната натрия, высушили и сконцентрировали в вакууме. Исходный продукт очистили посредством хроматографии на силикагеле. Получили 96 мг эфира гидроксамовой кислоты (89% выхода).

Пример I-12.

Получение (5S)-3-(3,5-дифторфенил)-N-[цис-5-(этоксикарбамоил)тетрагидрофуран-3-ил]-5-винил-4Н-изоксазол-5-карбоксамида.

80 мг карбоновой кислоты промежуточное соединение 22 и 26 мг гидрохлорида (аминоокси)этана растворили в дихлорметане и по очереди смешали с 0.07 г триэтиламина и 0.21 г раствора ангидрида пропилфосфоновой кислоты (50%-ой) в тетрагидрофуране. Реакционную смесь перемешивали в течение 3 ч при комнатной температуре. Затем реакционную смесь промыли насыщенным водным раствором гидрокарбоната натрия, высушили и сконцентрировали в вакууме. Исходный продукт очистили посредством хроматографии на силикагеле. Получили 87 мг эфира гидроксамовой кислоты (98% выхода).

Пример I-13.

Получение (5S)-3-(3,5-дифторфенил)-N-[цис-5-(изопропоксикарбамоил)тетрагидрофуран-3-ил]-5-винил-4Н-изоксазол-5-карбоксамида.

96 мг карбоновой кислоты промежуточное соединение 22 и 29 мг 2-(аминоокси)пропангидрохлорида растворили в дихлорметане и по очереди смешали с 0.07 г триэтиламина и 0.21 г раствора ангидрида пропилфосфоновой кислоты (50%-ного) в тетрагидрофуране. Реакционную смесь перемешивали в течение 3 ч при комнатной температуре. Затем реакционную смесь промыли насыщенным водным раствором гидрокарбоната натрия, высушили и сконцентрировали в вакууме. Исходный продукт очистили посредством хроматографии на силикагеле. Получили 95 мг эфира гидроксамовой кислоты (86% выхода).

Пример I-14.

Получение (5S)-3-(3,5-дифторфенил)-N-[цис-5-(трифторметилсульфонил-карбамоил)тетрагидрофуран-3-ил]-5-винил-4Н-изоксазол-5-карбоксамида.

0.11 г карбоновой кислоты промежуточное соединение 22 и 6 мг 4-диметиламинопиридина растворили в 5 мл дихлорметана. Затем во время помешивания при комнатной температуре добавили 65 мг 1-(3-диметиламинопропил)-3-этилкарбодимид гидрохлорида за 0.17 г 1,1,1-трифторметансульфонамида, и реакционную смесь оставили на 2 ч при комнатной температуре и затем перемешивали еще в течение 3 дней при этой температуре. Реакционную смесь промыли 0.5 М водного раствора соляной кислоты, высушили и сконцентрировали в вакууме. Исходный продукт очистили посредством хроматографии на силикагеле. Получили 94 мг ацилсульфонамида (81% выхода).

Пример I-15.

Получение (5S)-3-(3,5-дифторфенил)-N-[цис-5-(диметиламинокарбамоил)тетрагидрофуран-3-ил]-5-винил-4Н-изоксазол-5-карбоксамида и

пример I-16.

Получение (5S)-3-(3,5-дифторфенил)-N-[цис-5-(метилсульфонил-карбамоил)тетрагидрофуран-3-ил]-5-винил-4Н-изоксазол-5-карбоксамида.

0.12 г карбоновой кислоты промежуточное соединение 22 и 94 мг 1-гидроксibenзотриазол 86%-ного растворили в 3 мл дихлорметана и медленно перемешивали при комнатной температуре в течение 15 мин. Затем добавили 0,16 г метансульфонамида, затем раствор 94 мг 1-(3-диметиламинопропил)-3-этилкарбодимид гидрохлорида и 0,09 г N-этил-N-изопропилпропан-2-амина в 3 мл дихлорметана. Реакционную смесь перемешивали в течение 0,5 ч при комнатной температуре и оставили на 2 дня. Затем реакционную смесь промыли 0.5 М водного раствора соляной кислоты, высушили и сконцентрировали в вакууме. Исходный продукт очистили посредством хроматографии на силикагеле. Получили 43 мг ацилсульфонамида (29% выхода).

Пример I-17.

Получение (5S)-3-(3,5-дифторфенил)-N-[цис-5-(диметилкарбамоил)тетрагидрофуран-3-ил]-5-винил-4Н-изоксазол-5-карбоксамида.

97 мг карбоновой кислоты промежуточное соединение 22 и 24 мг 1,1-диметилгидразина растворили в 5 мл дихлорметана. Затем при помешивании при комнатной температуре добавили 80 мг триэтиламина за 0.51 г раствора ангидрида пропилфосфоновой кислоты (50%-ного) в тетрагидрофуране, и потом реакционную смесь перемешивали 4 ч при комнатной температуре. Затем реакционную смесь промыли насыщенным водным раствором гидрокарбоната натрия, высушили и сконцентрировали в вакууме. Исходный продукт очистили посредством хроматографии на силикагеле. Получили 0.08 г диметилгидразида I-15 (73% выхода), а также 0.01 г диметиламида I-17 (9% выхода).

Пример I-18.

Получение (5S)-N-[Цис-5-(циклопропилкарбамоил)тетрагидрофуран-3-ил]-3-(3,5-дифторфенил)-5-винил-4Н-изоксазол-5-карбоксамида.

93 мг карбоновой кислоты промежуточное соединение 22 и 17 мг циклопропиламина растворили в 5 мл дихлорметана. Затем при помешивании при комнатной температуре добавили 77 мг триэтиламина за 0.48 г раствора ангидрида пропилфосфоновой кислоты (50%-ного) в тетрагидрофуране, и потом реакционную смесь перемешивали 2.5 ч при комнатной температуре. Затем реакционную смесь промыли насыщенным водным раствором гидрокарбоната натрия, высушили и сконцентрировали в вакууме. Исходный продукт очистили посредством хроматографии на силикагеле. Получили 95 мг циклопропиламида (91% выхода).

Пример I-19.

Получение трет-бутил N-[[цис-4-[[5S)-3-(3,5-дифторфенил)-5-винил-4Н-изоксазол-5-

карбонил]амино]тетрагидрофуран-2-карбонил]амино]карбамата.

0.18 г карбоновой кислоты промежуточное соединение 22 и 84 мг 1-гидроксibenзотриазола (86%-ного) растворили в 8 мл дихлорметана и перемешивали при комнатной температуре 30 мин. Затем добавили 77 мг трет-бутил-гидразинкарбоксилата, затем раствор 141 мг 1-(3-диметиламинопропил)-3-этилкарбодиимид гидрохлорида и 95 мг N-этил-N-изопропилпропан-2-амина в 4 мл дихлорметана. Реакционную смесь перемешивали в течение 0.5 ч при комнатной температуре, оставили на ночь и повторно перемешивали последующие 6 ч при комнатной температуре. Затем реакционную смесь промыли 0.5 М водного раствора соляной кислоты, высушили и сконцентрировали в вакууме. Исходный продукт очистили посредством хроматографии на силикагеле. Получили 112 мг продукта (47% выхода).

Примеры I-20 - I-30 из табл. 1.

Получение осуществляли аналогично вышеуказанным названным примерам получения.

Аналитические данные примеров I-01 - I-30.

I-01	¹ H-NMR(400.0 MHz, CDCl ₃): δ= 7.717(1.5);7.519(1.0);7.260(176.6);7.193(0.5);7.181(2.9);7.178(1.9);7.175(3.2);7.172(1.8);7.164(1.7);7.161(3.3);7.155(2.8);7.143(0.5);6.996(1.0);6.908(0.5);6.904(0.6);6.902(0.9);6.889(0.7);6.886(1.0);6.883(1.2);6.880(1.7);6.877(0.7);6.875(0.8);6.864(0.5);6.861(0.6);6.859(0.9);6.483(0.5);6.466(0.7);5.299(5.5);4.073(2.4);4.060(2.0);4.049(5.0);4.039(2.9);4.032(2.4);4.026(1.2);4.022(1.3);4.016(0.9);4.014(1.0);3.991(2.7);3.988(3.6);3.967(1.6);3.964(2.1);3.768(2.8);3.758(1.9);3.725(3.3);3.715(2.2);3.201(2.9);3.192(2.0);3.158(2.6);3.149(1.8);2.719(0.6);2.709(1.1);2.699(1.2);2.691(1.3);2.682(0.9);2.414(1.0);2.399(2.0);2.388(1.0);2.383(2.1);2.379(1.6);2.368(2.0);2.360(0.8);2.347(0.8);2.335(0.6);1.720(10.9);1.709(16.0);1.545(3.5);1.259(0.6);0.790(0.6);0.785(0.8);0.781(1.2);0.778(1.9);0.774(1.7);0.772(2.7);0.768(1.6);0.764(1.6);0.760(2.0);0.757(2.0);0.754(2.2);0.750(1.0);0.743(0.6);0.739(0.6);0.464(0.6);0.461(1.0);0.454(1.2);0.451(2.4);0.448(2.6);0.444(2.4);0.441(1.9);0.438(2.5);0.435(1.8);0.430(1.0);0.421(0.6);0.008(2.4);0.000(80.2);-0.008(2.1)
I-02	¹ H-NMR(400.0 MHz, CDCl ₃): δ= 7.264(29.0);7.174(1.0);7.170(1.6);7.168(1.6);7.165(1.6);7.162(0.8);7.157(0.8);7.154(1.6);7.151(1.6);7.148(1.4);7.145(1.0);6.924(0.6);6.918(0.7);6.913(0.9);6.907(0.9);6.902(0.8);6.897(0.9);6.891(0.9);6.886(1.0);6.880(0.6);6.186(0.9);6.159(1.0);6.142(1.1);6.128(0.8);6.116(1.1);6.101(0.9);6.085(0.9);6.058(1.0);5.532(1.4);5.531(1.5);5.521(1.3);5.519(1.3);5.489(1.3);5.488(1.2);5.478(1.2);5.476(1.2);5.367(1.2);5.340(2.2);5.315(1.1);5.313(1.2);5.300(16.0);4.460(0.6);4.449(0.8);4.437(1.3);4.426(1.2);4.414(0.7);4.403(0.5);4.027(0.7);4.015(0.7);4.004(1.0);3.991(1.0);3.987(0.6);3.975(0.6);3.963(0.9);3.951(0.8);3.934(1.4);3.908(0.5);3.904(0.6);3.891(1.6);3.870(1.6);3.826(2.0);3.322(1.5);3.303(1.3);3.278(1.3);3.260(1.1);2.900(3.4);2.899(3.4);2.888(3.4);2.887(3.3);2.854(3.9);2.853(4.0);2.848(1.0);2.847(1.0);2.841(4.0);2.840(3.8);2.836(1.0);2.835(0.9);2.812(1.5);2.811(1.6);2.799(1.5);2.575(0.5);2.198(0.6);1.978(3.0);0.000(12.6)
I-03	Два диастереоизомера представлены в смеси, указание суммы сигналов указано с округлением. ¹ H-NMR(400.0 MHz, CDCl ₃): δ= 8.51 – 8.39 (br, 1 H), 7.21 - 7.14 (m, 2 H), 6.88 - 6.82 (m, 1 H), 4.72 – 4.69 (m, 1 H), 4.63 - 4.54 (m, 1 H), 4.02 - 3.93 (m, 1 H), 3.89 - 3.67 (m, 3 H), 3.58 - 3.44 (m, 3 H), 3.16 – 2.88 (m, 2 H), 2.34 - 2.20 (m, 2 H), 2.01 – 1.80 (m, 3 H), 1.72 - 1.70 (m, 3 H).
I-04	Два диастереоизомера представлены в смеси, указание суммы сигналов указано с округлением. ¹ H-NMR(400.0 MHz, CDCl ₃):

	<p>δ= 7.20 - 7.13 (m, 2 H), 6.92 - 6.85 (m, 1 H), 6.77 - 6.69 (br, 1 H), 4.49 - 4.34 (m, 2 H), 4.02 - 3.93 (m, 1 H), 3.88 - 3.69 (m, 2 H), 3.20 - 3.05 (m, 1 H), 2.99 - 2.65 (m, 2 H), 2.62 - 2.48 (m, 1 H), 2.26 - 2.08 (m, 1 H), 1.71 - 1.69 (m, 3 H), 0.88 - 0.73 (m, 2 H), 0.65 - 0.47 (m, 2 H).</p>
I-05	<p>¹H-NMR(499.9 MHz, d₆-DMSO):</p> <p>δ= 7.483(3.5);7.469(4.2);7.294(4.8);7.269(11.7);7.254(8.5);7.240(6.2);7.219(14.9);7.205(6.8);4.962(2.7);4.946(2.8);4.830(2.2);4.800(3.5);4.776(2.4);4.551(4.7);4.542(9.5);4.536(6.4);4.526(7.7);4.519(10.5);4.499(2.9);4.457(3.7);4.423(5.8);4.392(3.1);4.111(2.9);4.077(2.4);3.750(4.0);3.714(3.6);3.368(2.0);3.344(3.1);3.320(2.0);3.298(50.8);3.276(0.4);2.923(1.6);2.898(4.4);2.875(7.2);2.844(8.7);2.814(7.7);2.806(7.5);2.784(16.0);2.776(7.7);2.760(2.3);2.753(3.0);2.744(1.3);2.616(2.0);2.502(12.6);2.499(17.3);2.496(13.3);2.084(0.5);1.706(9.0);1.676(9.6);1.647(12.4);1.403(6.2);1.384(5.6);1.352(7.1);1.335(8.5);1.315(8.2);1.298(5.5);1.179(3.5);1.174(3.5);0.000(8.4)</p>
I-06	<p>¹H-NMR(400.0 MHz, CDCl₃):</p> <p>δ= 7.265(29.8);7.200(1.0);7.197(0.7);7.194(1.2);7.191(0.7);7.183(0.7);7.180(1.8);7.178(1.2);7.174(1.7);7.164(0.6);7.160(1.0);7.155(0.8);6.877(0.8);6.861(0.9);6.855(1.6);6.849(0.8);6.833(0.8);6.215(0.8);6.188(1.0);6.186(1.0);6.172(1.0);6.159(1.0);6.145(1.1);6.142(1.1);6.116(1.1);5.593(1.2);5.591(1.2);5.562(1.4);5.560(1.5);5.550(1.1);5.548(1.1);5.519(1.3);5.517(1.3);5.335(1.0);5.333(1.1);5.324(1.2);5.323(1.2);5.308(1.1);5.306(1.2);5.300(16.0);5.298(2.0);5.296(1.4);4.715(1.0);4.707(0.8);4.694(0.7);4.687(1.0);4.601(0.5);4.014(0.7);4.001(0.7);3.991(1.0);3.982(0.8);3.978(1.0);3.969(0.7);3.959(1.0);3.951(0.5);3.946(0.9);3.942(1.7);3.900(1.9);3.888(1.3);3.872(0.6);3.867(0.6);3.845(1.8);3.810(0.5);3.805(0.6);3.712(0.6);3.687(0.8);3.539(1.1);3.534(0.7);3.529(0.6);3.520(1.4);3.514(1.1);3.503(0.8);3.494(0.9);3.480(0.8);3.476(0.7);3.467(0.6);3.462(0.6);3.455(0.6);3.298(1.4);3.294(1.6);3.267(0.6);3.256(1.3);3.251(1.5);2.956(1.1);2.321(0.6);2.313(0.7);2.303(1.5);2.291(1.0);2.284(0.6);2.280(0.6);2.250(0.6);2.050(1.5);2.014(0.7);1.991(0.6);1.987(0.6);1.979(0.8);1.971(0.8);1.964(1.1);1.957(0.8);1.954(0.8);1.950(1.1);1.933(0.7);1.898(0.8);1.882(1.2);1.866(1.2);1.847(0.8);1.778(0.6);1.769(0.7);1.761(1.4);1.753(0.7);1.744(0.5);0.000(12.3)</p>
I-07	<p>¹H-NMR(400.0 MHz, d₆-DMSO):</p> <p>δ= 8.328(1.3);8.314(1.6);8.310(1.6);8.296(1.2);7.910(0.6);7.899(0.8);7.888(0.9);7.864(0.6);7.855(0.8);7.844(0.8);7.419(1.9);7.414(3.9);7.410(2.2);7.405(4.3);7.400(5.6);7.396(6.0);7.388(4.2);7.384(2.0);7.380(4.0);7.377(3.5);7.370(0.9);5.756(16.0);4.467(0.6);4.453(1.4);4.439(1.8);4.435(1.6);4.426(0.9);4.422(1.3);4.418(0.9);4.023(1.1);4.016(1.2);4.002(2.5);3.996(2.6);3.981(1.3);3.975(1.4);3.910(0.7);3.902(0.7);3.875(0.5);3.871(0.5);3.856(1.7);3.850(0.8);3.843(0.7);3.840(1.5);3.835(2.0);3.824(1.4);3.818(1.5);3.806(1.6);3.802(1.6);3.793(0.6);3.784(3.6);3.775(2.7);3.747(0.8);3.740(3.1);3.731(3.2);3.703(0.8);3.669(1.6);3.661(0.7);3.653(1.6);3.648(1.5);3.644(1.7);3.632(1.6);3.628(1.8);3.623(1.6);3.617(0.9);3.607(1.8);3.588(1.5);3.575(1.5);3.566(1.3);3.558(0.6);3.553(1.3);3.507(1.4);3.494(1.4);3.486(1.3);3.472(1.2);3.420(0.7);3.404(0.8);3.389(3.3)</p>

	1);3.380(2.9);3.359(0.8);3.345(2.8);3.336(3.0);3.320(19.5);3.006(0.6);2.989(0.8);2.985(0.8);2.976(0.8);2.972(0.9);2.954(0.9);2.941(0.7);2.938(0.8);2.933(0.8);2.925(0.8);2.920(0.8);2.917(0.7);2.904(0.6);2.602(0.6);2.594(2.7);2.586(10.1);2.583(3.8);2.574(9.8);2.538(10.5);2.526(11.0);2.520(2.0);2.512(23.8);2.507(53.0);2.502(74.2);2.498(51.2);2.493(22.4);2.452(0.6);2.394(2.3);2.383(2.4);2.366(4.0);2.150(1.1);1.553(15.0);1.541(15.0);1.514(3.7);1.235(1.0);0.000(6.6)
I-08	¹ H-NMR(400.0 MHz, d ₆ -DMSO): δ = 8.293(1.4);8.025(1.0);7.958(1.2);7.839(1.0);7.412(3.2);7.403(4.8);7.397(5.0);7.387(3.7);7.378(3.0);4.534(1.3);4.521(3.1);4.508(1.5);4.440(1.3);4.426(1.9);4.408(1.1);3.999(1.0);3.993(1.1);3.979(2.1);3.972(2.3);3.958(1.1);3.951(1.2);3.894(0.9);3.857(1.6);3.840(1.6);3.835(1.9);3.819(2.3);3.798(1.4);3.782(2.5);3.756(2.4);3.738(2.5);3.712(3.0);3.700(0.9);3.670(1.4);3.654(1.5);3.643(1.6);3.632(1.8);3.626(1.6);3.622(1.7);3.605(1.5);3.599(2.0);3.583(3.3);3.570(3.3);3.566(2.0);3.560(1.6);3.553(2.3);3.538(1.2);3.509(1.1);3.494(1.3);3.487(1.2);3.473(1.2);3.436(1.1);3.430(1.3);3.394(3.2);3.378(2.7);3.367(1.5);3.349(2.4);3.333(4.5);3.316(477.3);3.266(2.6);2.909(0.8);2.892(0.9);2.847(0.9);2.675(3.0);2.670(4.3);2.665(3.0);2.615(2.0);2.606(1.5);2.592(1.6);2.583(1.1);2.574(1.8);2.564(1.7);2.556(2.2);2.546(2.4);2.536(1.5);2.523(10.9);2.519(15.3);2.510(219.7);2.505(486.3);2.501(679.4);2.496(468.6);2.492(204.7);2.455(3.4);2.451(4.1);2.446(3.1);2.401(1.2);2.332(2.7);2.328(4.1);2.323(2.8);2.177(2.9);2.161(5.6);2.144(2.6);2.074(1.2);2.009(0.8);1.990(0.9);1.741(11.8);1.560(3.5);1.549(11.6);1.538(16.0);1.236(1.0);0.980(1.2);0.961(2.4);0.942(1.2);0.614(1.2);0.604(2.0);0.600(2.8);0.588(3.2);0.584(4.7);0.579(3.4);0.571(3.1);0.566(4.0);0.554(2.7);0.549(2.1);0.543(1.7);0.536(1.8);0.530(1.6);0.526(1.5);0.380(1.4);0.368(3.4);0.363(3.5);0.358(4.0);0.346(2.3);0.341(2.3);0.314(0.9);0.301(2.3);0.296(2.5);0.292(2.6);0.286(2.1);0.242(0.8);0.008(1.1);0.000(51.9);-0.008(1.6)

I-09	¹ H-NMR(400.0 MHz, CDCl ₃): δ = 7.520(1.8);7.280(0.5);7.278(0.6);7.277(0.6);7.276(0.8);7.275(0.8);7.274(0.9);7.274(1.1);7.273(1.2);7.272(1.2);7.271(1.4);7.271(1.4);7.270(1.5);7.269(2.0);7.268(2.4);7.267(2.8);7.266(3.3);7.266(4.0);7.265(5.4);7.264(7.3);7.261(310.2);7.258(4.3);7.257(2.6);7.256(2.1);7.255(1.5);7.254(1.2);7.254(0.9);7.253(0.8);7.252(0.9);7.251(0.7);7.250(0.5);7.227(0.5);7.211(1.2);7.184(0.8);7.176(2.3);7.170(2.3);7.164(2.9);7.158(3.4);7.150(2.2);7.148(2.5);7.144(3.1);7.138(2.6);7.125(1.0);7.094(0.5);6.997(1.8);6.925(0.8);6.919(0.7);6.913(0.8);6.909(0.9);6.904(1.5);6.897(1.6);6.892(1.7);6.886(0.9);6.882(0.9);6.875(1.2);6.870(1.1);4.652(0.5);4.645(0.6);4.639(0.6);4.572(0.8);4.567(0.7);4.246(0.6);4.239(0.8);4.227(0.7);4.218(1.6);4.205(1.0);4.197(1.0);4.184(1.5);4.163(0.9);4.083(0.6);4.077(0.5);4.062(1.5);4.054(0.7);4.040(1.1);4.027(1.0);4.021(0.5);4.014(1.5);4.005(1.7);3.991(1.8);3.981(1.3);3.968(1.2);3.947(1.1);3.932(1.2);3.926(1.0);3.915(1.2);3.910(1.2);3.899(1.2);3.893(1.0);3.877(1.0);3.833(0.9);3.828(1.0);3.809(0.8);3.804(0.8);3.791(1.1);3.782(3.1);3.767(3.4);3.742(1.8);3.739(3.1);3.733(0.9);3.729(1.5);3.724(3.5);3.710(1.0);3.699(2.4);3.686(1.9);3.669(0.8);3.652(0.6);3.551(0.9);3.538(1.2);3.520(2.0);3.509(1.1);3.503(1.5);3.483(1.4);3.468(1.8);3.450(2.0);3.434(1.0);3.422(1.4);3.404(1.4);3.389(0.9);3.382(1.0);3.372(1.0);3.353(0.9);3.332(0.6);3.313(0.8);3.306(0.7);3.288(0.6);3.220(2.7);3.212(2.6);3.177(2.5);3.169(2.5);3.166(1.7);3.152(1.3);3.123(1.6);3.109(1.8);3.036(0.5);3.031(0.7);2.022(0.6);2.005(1.4);1.990(1.7);1.973(1.4);1.957(0.6);1.927(0.8);1.910(1.3);1.891(1.9);1.874(1.9);1.868(1.8);1.860(2.1);1.842(1.2);1.825(0.6);1.718(15.5);1.715(16.0);1.698(6.4);1.652(6.8);1.255(0.6);0.008(4.0);0.006(1.3);0.005(1.5);0.004(2.1);0.000(138.3);-0.005(1.2);-0.006(1.0);-0.007(0.8);-0.008(3.7);-0.050(0.6)
I-10	¹ H-NMR(400.6 MHz, CDCl ₃): δ = 9.764(1.2);9.707(1.3);7.404(1.4);7.397(1.6);7.393(1.6);7.390(1.7);7.384(2.1);7.379(2.0);7.369(3.1);7.365(4.8);7.360(6.5);7.356(6.0);7.352(4.6);7.346(2.0);7.340(3.2);7.310(1.3);7.148(0.6);7.142(1.1);7.136(1.1);7.129(1.1);7.127(1.1);7.121(1.7);7.115(1.2);7.112(1.2);7.106(1.0);7.098(1.0);4.532(0.7);4.521(0.9);4.508(1.2);4.498(1.8);4.488(1.7);4.477(1.8);4.465(1.5);4.026(0.7);4.013(0.8);4.002(1.2);3.989(1.1);3.973(0.7);3.960(0.7);3.949(1.3);3.943(1.4);3.936(2.0);3.920(0.8);3.912(0.7);3.890(1.2);3.885(1.1);3.866(0.8);3.861(0.8);3.840(3.0);3.834(12.0);3.808(1.2);3.803(1.5);3.797(2.3);3.790(2.3);3.781(1.2);3.778(1.5);3.774(0.9);3.758(0.7);3.743(15.7);3.335(0.8);3.316(0.8);3.274(0.9);3.271(0.9);3.240(2.5);3.227(2.5);3.197(2.2);3.184(2.2);2.627(0.5);2.622(0.7);2.610(0.7);2.605(0.8);2.594(0.8);2.588(0.9);2.570(0.9);2.327(0.6);2.317(0.7);2.284(0.5);2.239(0.6);1.713(1.1);1.707(2.2);1.702(1.9);1.693(15.1);1.689(16.0);1.287(0.6);1.259(2.8);0.000(0.9)
I-11	¹ H-NMR(400.0 MHz, CDCl ₃): δ = 8.80 (br d, J=4.13 Hz, 1 H), 7.20 - 7.13 (m, 2 H), 7.00 - 6.93 (m, 1 H), 6.92 - 6.85 (m, 1 H), 6.19 - 6.06 (m, 1 H), 5.51 (dd, J=17.17, 1.91 Hz, 1 H), 5.34 (dd, J=10.65, 8.42 Hz, 1 H), 4.54 -

	4.41 (m, 2 H), 4.18 (sept, J=6.04 Hz, 1 H), 4.05 - 3.96 (m, 1 H), 3.93 - 3.77 (m, 2 H), 3.34 - 3.26 (m, 1 H), 2.71 - 2.58 (m, 1 H), 2.22 - 2.13 (m, 1 H), 1.32 - 1.22 (m, 6 H)
I-12	¹ H-NMR(400.0 MHz, CDCl ₃): δ= 8.93 (br d, J=7.31 Hz, 1 H), 7.20 - 7.13 (m, 2 H), 7.00 - 6.93 (m, 1 H), 6.93 - 6.85 (m, 1 H), 6.20 - 6.06 (m, 1 H), 5.51 (dd, J=17.32, 3.66 Hz, 1 H), 5.34 (dd, J=10.33, 8.42 Hz, 1 H), 4.54 - 4.41 (m, 2 H), 4.08 - 3.95 (m, 3 H), 3.93 - 3.79 (m, 2 H), 3.34 - 3.27 (m, 1 H), 2.69 - 2.56 (m, 1 H), 2.25 - 2.17 (m, 1 H), 1.34 - 1.24 (m, 3 H)
I-13	¹ H-NMR(400.0 MHz, CDCl ₃): δ= 9.01 (br d, J=10.49 Hz, 1 H), 7.20 - 7.12 (m, 2 H), 7.02 - 6.94 (m, 1 H), 6.93 - 6.85 (m, 1 H), 6.19 - 6.07 (m, 1 H), 5.51 (dd, J=17.33, 4.29 Hz, 1 H), 5.35 (dd, J=10.65, 8.11 Hz, 1 H), 4.55 - 4.41 (m, 2 H), 4.03 - 3.95 (m, 1 H), 3.94 - 3.79 (m, 5 H), 3.34 - 3.26 (m, 1 H), 2.68 - 2.55 (m, 1 H), 2.27 - 2.19 (m, 1 H).
I-14	¹ H-NMR(400.0 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 8.339(1.3);8.319(1.5);8.313(1.7);8.293(1.5);7.445(0.8);7.428(5.5);7.422(3.9);7.416(3.3);7.410(5.0);7.406(5.3);7.392(2.0);7.386(3.2);7.381(2.1);7.369(0.7);7.364(1.3);7.358(0.9);6.158(2.0);6.152(2.6);6.132(2.3);6.126(2.9);6.115(2.3);6.109(3.1);6.088(2.3);6.082(3.0);5.753(3.3);5.411(3.4);5.408(3.6);5.404(2.9);5.402(3.0);5.368(3.0);5.365(3.2);5.361(2.5);5.358(2.7);5.316(0.7);5.304(2.7);5.301(2.8);5.298(3.4);5.296(3.2);5.289(0.7);5.277(2.6);5.275(2.6);5.271(3.2);5.269(3.0);4.346(1.2);4.326(1.1);4.313(1.0);4.306(1.0);4.292(0.8);4.171(1.7);4.158(2.5);4.149(2.3);4.146(2.0);4.136(2.1);4.125(1.4);3.893(15.9);3.881(16.0);3.864(9.4);3.836(7.4);3.820(5.8);3.814(4.7);3.800(3.8);3.793(2.9);3.778(2.3);3.666(0.6);3.646(0.5);3.633(2.0);3.627(1.8);3.622(1.8);3.614(1.9);3.606(1.4);3.601(1.5);3.594(1.2);3.574(1.0);3.558(5.2);3.529(0.7);3.514(4.0);2.674(1.9);2.670(2.6);2.665(1.8);2.661(0.9);2.523(11.0);2.519(15.3);2.510(144.2);2.505(295.0);2.501(402.4);2.496(275.2);2.492(123.6);2.387(1.0);2.366(0.9);2.354(0.9);2.347(0.9);2.337(1.8);2.332(2.7);2.328(3.2);2.323(2.0);2.314(0.8);2.308(0.9);2.288(0.5);1.827(0.6);1.813(1.5);1.800(1.8);1.780(1.4);1.767(1.5);1.755(0.6);1.236(1.0);0.008(3.1);0.000(95.5);-0.008(2.9)
I-15	¹ H-NMR(400.0 MHz, CDCl ₃): δ= 7.263(36.9);7.174(0.5);7.170(1.1);7.162(1.5);7.156(1.4);7.153(1.3);7.150(1.3);7.144(1.3);7.142(1.3);7.137(1.0);6.921(0.7);6.915(0.8);6.912(0.7);6.906(0.8);6.900(0.8);6.894(0.8);6.890(0.7);6.884(0.9);6.878(0.6);6.182(0.8);6.155(0.9);6.138(1.0);6.128(0.7);6.112(1.0);6.102(0.7);6.085(0.8);6.058(0.8);5.529(1.2);5.528(1.3);5.517(1.5);5.486(1.1);5.485(1.1);5.474(1.2);5.370(1.3);5.344(1.8);5.319(1.1);4.456(0.7);4.443(1.1);4.432(1.0);4.429(1.1);4.419(1.0);4.405(0.7);4.148(0.6);4.131(1.9);4.113(1.9);4.095(0.6);4.020(0.7);4.007(0.7);3.996(0.9);3.983(1.1);3.972(0.6);3.961(0.8);3.948(0.8);3.937(1.3);3.894(1.6);3.882(1.9);3.839(1.6);3.834(0.6);3.327(1.4);3.314(1.3);3.284(1.2);3.271(1.1);2.668(0.5);2.654(15.4);2.645(1.2);2.634(16.0);2.621(0.5);2.610(0.7)

	;2.548(1.0);2.532(0.5);2.044(8.4);1.603(1.0);1.277(2.4);1.259(5.6);1.241(2.3);0.008(0.5);0.000(13.7)
I-16	¹ H-NMR(400.0 MHz, CDCl ₃): δ = 8.922(0.9);7.518(2.7);7.295(0.5);7.260(481.5);7.208(1.0);7.181(1.5);7.176(1.8);7.162(2.2);7.144(1.7);7.138(1.4);6.996(2.6);6.919(0.9);6.914(0.7);6.903(0.8);6.897(1.6);6.892(1.5);6.876(0.8);6.870(0.7);6.800(1.0);6.170(1.2);6.143(2.4);6.127(1.3);6.116(1.3);6.100(2.9);6.073(1.6);5.540(2.0);5.527(2.2);5.497(1.7);5.483(2.0);5.379(3.7);5.352(3.5);4.541(1.0);4.529(1.2);4.518(1.6);4.508(1.2);4.496(0.9);4.434(0.7);4.092(0.9);4.079(0.9);4.067(1.9);4.054(1.7);4.042(1.4);4.029(1.2);3.978(0.9);3.969(0.8);3.954(0.6);3.931(0.8);3.925(0.9);3.916(2.2);3.899(2.5);3.873(2.4);3.856(2.3);3.492(1.7);3.376(16.0);3.350(14.7);3.331(2.2);3.328(2.2);3.288(2.0);3.284(1.9);2.699(0.6);2.682(0.7);2.661(0.7);2.641(0.8);2.621(0.6);2.314(0.7);2.261(0.6);2.225(0.5);1.548(1.3.3);1.256(1.3);1.242(0.6);0.008(5.3);0.000(176.6);-0.008(5.2);-0.150(0.6)
I-17	¹ H-NMR(400.6 MHz, CDCl ₃): δ = 8.303(0.5);8.282(0.9);8.261(0.5);7.271(4.1);7.205(1.4);7.199(1.7);7.188(1.2);7.185(1.9);7.179(2.8);7.174(2.0);7.162(1.2);7.160(1.8);7.154(1.4);6.888(0.7);6.883(1.2);6.877(0.6);6.867(1.4);6.861(2.3);6.855(1.2);6.845(0.7);6.839(1.2);6.833(0.6);6.213(1.2);6.186(1.4);6.180(1.2);6.170(1.4);6.153(1.3);6.143(1.5);6.137(1.4);6.110(1.4);5.594(1.9);5.593(2.0);5.551(3.6);5.510(1.6);5.508(1.6);5.342(2.0);5.341(2.0);5.323(1.8);5.322(1.8);5.316(1.8);5.314(1.8);5.297(1.6);5.296(1.6);4.850(1.7);4.843(1.6);4.829(2.0);4.822(1.7);4.586(0.7);4.581(0.7);4.573(0.8);4.568(1.1);4.562(0.9);4.555(0.8);4.549(0.7);4.010(1.0);3.998(1.1);3.988(2.2);3.975(2.2);3.965(1.4);3.952(1.4);3.941(2.1);3.898(2.4);3.883(2.2);3.845(1.1);3.840(3.4);3.822(0.7);3.818(0.7);3.793(1.0);3.788(0.9);3.770(0.8);3.765(0.7);3.304(4.4);3.261(3.8);3.137(14.7);3.133(16.0);3.027(0.5);3.002(14.1);2.992(13.2);2.357(0.8);2.352(1.3);2.331(0.8);2.322(0.8);2.314(1.8);2.311(1.7);2.308(1.5);2.293(1.1);2.291(1.2);2.288(1.0);2.270(0.8);2.045(2.1);1.853(1.0);1.334(0.9);1.286(1.5);1.277(1.0);1.256(4.5);1.242(0.9);0.880(0.8);0.000(3.1)

I-18	¹ H-NMR(400.0 MHz, CDCl ₃): δ = 7.519(2.5);7.315(0.8);7.260(401.6);7.258(381.2);7.170(16.6);7.155(17.2);6.996(2.3);6.883(6.9);6.863(9.3);6.845(7.2);6.719(4.5);6.693(5.1);6.180(3.8);6.153(4.1);6.135(7.3);6.108(7.9);6.089(4.4);6.064(4.4);5.532(12.0);5.489(10.4);5.372(8.6);5.346(13.4);5.322(8.8);4.448(3.4);4.422(7.0);4.405(8.8);4.399(9.3);4.371(4.7);4.002(3.8);3.990(3.8);3.978(5.9);3.966(9.0);3.954(4.3);3.942(5.4);3.927(9.7);3.879(16.0);3.859(4.3);3.835(9.4);3.812(5.4);3.790(4.0);3.322(9.3);3.307(8.8);3.278(7.9);3.264(7.7);2.786(2.8);2.776(4.0);2.768(4.6);2.760(4.5);2.752(4.6);2.744(4.8);2.735(4.7);2.727(3.1);2.632(1.9);2.615(4.1);2.597(5.1);2.591(5.0);2.581(5.3);2.574(5.4);2.557(5.0);2.538(2.4);2.196(3.5);2.161(6.4);2.125(3.3);1.548(100.8);1.333(1.1);1.283(1.5);1.256(4.6);0.879(1.6);0.843(3.0);0.827(9.9);0.808(13.3);0.787(8.2);0.617(11.2);0.601(4.7);0.591(6.6);0.581(5.7);0.563(5.8);0.000(138.7);-0.002(131.1);-0.152(0.8)
I-19	¹ H-NMR(400.0 MHz, CDCl ₃): δ = 8.214(1.2);8.106(1.4);7.518(2.9);7.293(1.2);7.260(529.3);7.227(1.7);7.221(2.0);7.208(2.6);7.188(2.3);7.182(2.6);7.168(2.6);7.163(2.2);6.996(3.2);6.916(1.7);6.900(1.8);6.895(3.0);6.888(1.6);6.873(1.5);6.171(1.7);6.158(1.5);6.145(2.0);6.128(2.2);6.115(1.8);6.101(1.9);6.088(1.8);5.538(3.0);5.529(3.3);5.494(2.6);5.487(2.8);5.359(4.2);5.332(3.8);4.580(1.4);4.437(1.5);4.049(0.9);4.037(0.9);4.025(1.9);4.013(2.0);3.997(2.1);3.984(2.1);3.968(2.5);3.928(3.1);3.924(3.3);3.885(3.0);3.324(2.9);3.295(2.8);3.281(2.6);3.252(2.6);2.553(0.7);2.447(1.1);2.424(0.9);2.410(0.8);2.364(1.1);2.044(1.5);1.541(30.8);1.507(52.0);1.500(32.6);1.464(1.0);1.266(9.4);0.899(4.9);0.882(16.0);0.864(6.2);0.146(1.0);0.008(6.7);0.000(193.0);-0.008(6.3)
I-20	¹ H-NMR(400.0 MHz, CDCl ₃): δ = 7.5193 (0.6); 7.2604 (100.9); 7.1884 (0.7); 7.1762 (1.8); 7.1698 (2.6); 7.1635 (2.2); 7.1601 (2.0); 7.1565 (2.2); 7.1503 (2.4); 7.1438 (1.6); 7.0179 (1.0); 6.9965 (1.4); 6.9101 (0.9); 6.9045 (0.9); 6.8940 (0.8); 6.8884 (1.9); 6.8829 (1.8); 6.8773 (0.7); 6.8667 (0.9); 6.8611 (0.9); 6.1799 (1.2); 6.1531 (1.3); 6.1367 (1.5); 6.1321 (1.2); 6.1100 (1.5); 6.1053 (1.4); 6.0889 (1.4); 6.0621 (1.5); 5.5268 (2.0); 5.5255 (2.0); 5.5113 (2.3); 5.4837 (1.8); 5.4824 (1.7); 5.4680 (1.9); 5.3594 (2.1); 5.3440 (1.9); 5.3326 (2.0); 5.3173 (1.8); 4.4620 (0.9); 4.4432 (1.6); 4.4327 (1.3); 4.4199 (1.7); 4.4091 (1.8); 4.3969 (1.0); 4.3858 (0.8); 4.0356 (0.9); 4.0228 (0.9); 4.0117 (1.4); 4.0034 (1.1); 3.9990 (1.3); 3.9909 (0.9); 3.9794 (1.4); 3.9669 (1.2); 3.9270 (2.1); 3.9098 (0.9); 3.9031 (0.9); 3.8840 (3.2); 3.8778 (3.5); 3.8522 (0.6); 3.8478 (0.6); 3.8348 (2.5); 3.7243 (16.0); 3.7111 (15.6); 3.6112 (1.2); 3.6027 (0.5); 3.5953 (1.3); 3.5871 (1.4); 3.5716 (1.8); 3.5609 (1.1); 3.5562 (1.3); 3.5463 (1.0); 3.5385 (0.8); 3.3163 (2.2); 3.3043 (2.2); 3.2733 (1.9); 3.2613 (1.9); 2.6165 (2.4); 2.6103 (1.4); 2.6011 (4.7); 2.5938 (2.6); 2.5860 (2.3); 2.5787 (1.4); 2.5639 (0.7); 2.5592 (0.9); 2.5536 (0.7); 2.5418 (0.8); 2.5363 (0.7); 2.2238 (0.6); 2.1888 (0.5); 2.1623 (0.6); 2.1280 (0.5); 1.5572 (6.4); 1.2563 (1.1); 0.0079 (1.2); -0.0002 (33.7); -0.0085 (1.1)
I-21	¹ H-NMR(400.0 MHz, CDCl ₃):

	<p>δ= 7.2608 (68.6); 7.1807 (0.5); 7.1751 (0.8); 7.1685 (2.1); 7.1626 (3.6); 7.1571 (3.1); 7.1529 (2.8); 7.1484 (3.0); 7.1428 (4.0); 7.1371 (2.4); 7.1245 (0.8); 7.0700 (0.6); 7.0533 (0.6); 7.0156 (0.6); 6.9967 (0.9); 6.9102 (0.9); 6.9049 (0.9); 6.8938 (0.8); 6.8885 (1.8); 6.8832 (1.7); 6.8777 (0.7); 6.8668 (0.9); 6.8616 (0.9); 6.1800 (1.2); 6.1532 (1.3); 6.1368 (1.5); 6.1325 (1.3); 6.1100 (1.6); 6.1057 (1.4); 6.0893 (1.4); 6.0625 (1.5); 5.5114 (2.2); 5.5018 (2.4); 5.4690 (1.9); 5.4588 (2.1); 5.3527 (2.3); 5.3259 (4.2); 5.2990 (1.9); 4.5138 (0.9); 4.5037 (1.0); 4.4891 (1.5); 4.4783 (1.9); 4.4710 (0.7); 4.4646 (1.7); 4.4607 (1.2); 4.4541 (2.0); 4.4479 (1.2); 4.4420 (1.0); 4.4367 (0.8); 4.4307 (0.6); 4.1635 (0.8); 4.1487 (0.8); 4.1380 (1.8); 4.1242 (1.8); 4.1176 (1.6); 4.1092 (1.7); 4.1027 (1.6); 4.0953 (1.7); 4.0798 (1.0); 4.0669 (1.0); 4.0557 (1.5); 4.0497 (0.6); 4.0428 (1.4); 4.0174 (1.8); 4.0044 (1.6); 3.9944 (1.6); 3.9823 (1.6); 3.9700 (1.6); 3.9580 (0.8); 3.9502 (0.7); 3.9409 (2.5); 3.9288 (1.0); 3.9250 (1.0); 3.8979 (2.9); 3.8705 (2.2); 3.8275 (2.6); 3.8001 (16.0); 3.7868 (15.7); 3.3070 (2.4); 3.2866 (2.3); 3.2639 (2.0); 3.2436 (2.0); 2.6322 (0.5); 2.6156 (0.5); 2.6087 (0.5); 2.5978 (0.7); 2.5917 (0.6); 2.5808 (0.6); 2.5739 (0.7); 2.5569 (0.7); 2.5539 (0.6); 2.5472 (0.5); 2.5360 (0.7); 2.5305 (0.6); 2.5192 (0.6); 2.5127 (0.6); 2.4959 (0.6); 2.2739 (1.1); 2.2666 (1.2); 2.2392 (0.9); 2.2321 (0.9); 1.5678 (1.1); 1.2583 (0.9); 0.0079 (0.9); -0.0002 (22.3); -0.0085 (0.6)</p>
I-22	<p>¹H-NMR(400.0 MHz, CDCl₃):</p> <p>δ= 7.5193 (0.6); 7.2605 (104.8); 7.2594 (101.9); 7.2228 (2.2); 7.2086 (1.5); 7.1842 (2.0); 7.1701 (4.3); 7.1659 (4.7); 7.1520 (7.7); 7.1384 (4.6); 6.9958 (0.6); 6.9514 (1.3); 6.9334 (1.4); 6.8996 (1.4); 6.8922 (1.8); 6.8861 (2.4); 6.8822 (2.4); 6.8777 (2.4); 6.8717 (1.8); 6.8653 (1.4); 6.1851 (1.6); 6.1589 (1.7); 6.1424 (1.8); 6.1300 (1.6); 6.1156 (2.0); 6.1034 (1.8); 6.0871 (1.9); 6.0601 (2.0); 5.5101 (4.2); 5.5046 (4.2); 5.4669 (3.6); 5.4615 (3.8); 5.3541 (3.6); 5.3266 (6.0); 5.2986 (3.5); 4.4793 (2.3); 4.4734 (2.1); 4.4671 (2.0); 4.4120 (1.8); 4.4009 (2.5); 4.3947 (2.5); 4.3886 (3.0); 4.3776 (3.1); 4.3711 (3.7); 4.3527 (2.3); 4.3353 (1.9); 4.3187 (0.9); 4.2141 (0.9); 4.2043 (1.2); 4.1967 (2.6); 4.1858 (4.2); 4.1790 (3.2); 4.1680 (7.4); 4.1502 (6.0); 4.1324 (2.0); 4.0309 (1.2); 4.0173 (1.3); 4.0072 (3.8); 3.9945 (3.7); 3.9842 (2.3); 3.9713 (2.1); 3.9575 (2.4); 3.9521 (2.4); 3.9337 (1.4); 3.9209 (3.4); 3.8839 (3.5); 3.8778 (4.1); 3.8415 (5.4); 3.8249 (1.5); 3.8186 (1.5); 3.3108 (5.7); 3.2676 (4.9); 2.6780 (1.2); 2.6649 (1.3); 2.6401 (2.4); 2.6273 (2.3); 2.6194 (1.2); 2.6139 (1.3); 2.6029 (1.3); 2.5955 (1.3); 2.5845 (2.0); 2.5736 (1.5); 2.5553 (7.3); 2.5416 (6.4); 2.5297 (3.3); 2.5150 (2.5); 2.4914 (1.5); 2.4772 (1.4); 2.1670 (2.1); 2.1415 (1.9); 2.1330 (2.0); 1.9583 (0.9); 1.5574 (5.4); 1.3281 (9.5); 1.3104 (14.3); 1.2918 (12.0); 1.2850 (8.0); 1.2729 (7.6); 1.2671 (12.9); 1.2493 (16.0); 1.2326 (10.6); -0.0002 (38.6); -0.0015 (37.8)</p>
I-23	<p>¹H-NMR(400.0 MHz, CDCl₃):</p> <p>δ= 8.9621 (1.0); 7.5207 (2.6); 7.2955 (0.6); 7.2862 (0.8); 7.2619 (459.9); 7.1725 (1.8); 7.1668 (2.2); 7.1527 (2.6); 7.1471 (2.1); 7.1352 (0.7); 6.9978 (2.5); 6.9156 (0.8); 6.8995 (0.8); 6.8939 (1.5); 6.8721 (1.1); 6.8525 (0.7); 4.5515 (1.0); 4.5405 (1.0); 4.5285 (1.1); 4.5168 (1.1); 4.4210</p>

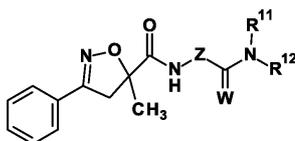
	(0.8); 4.4138 (0.8); 4.0623 (1.0); 4.0489 (0.9); 4.0378 (1.3); 4.0249 (1.3); 3.9220 (0.9); 3.9143 (0.9); 3.8967 (0.7); 3.8904 (0.7); 3.7760 (2.6); 3.7591 (0.5); 3.7327 (3.0); 3.7157 (0.7); 3.3935 (13.3); 3.3551 (3.1); 3.2023 (3.1); 3.1589 (2.7); 2.6827 (0.6); 2.6663 (0.6); 2.6590 (0.6); 2.6481 (0.7); 2.6429 (0.7); 2.6315 (0.6); 2.6247 (0.7); 2.6082 (0.6); 2.3659 (0.8); 2.3307 (0.6); 1.7042 (4.1); 1.6963 (16.0); 1.5537 (39.0); 1.3330 (1.6); 1.2844 (2.4); 1.2541 (6.3); 0.8799 (0.9); 0.1458 (0.6); 0.0080 (5.5); -0.0002 (199.1); -0.0085 (6.8); -0.1498 (0.6)
I-24	¹ H-NMR(400.6 MHz, CDCl ₃): δ = 9.5455 (1.6); 9.4925 (1.5); 7.2954 (2.3); 7.2765 (0.9); 7.2510 (0.7); 7.1743 (0.5); 7.1618 (2.9); 7.1564 (3.8); 7.1420 (3.8); 7.1367 (3.0); 7.1302 (0.6); 7.1243 (0.6); 6.9029 (0.9); 6.8969 (0.9); 6.8872 (0.8); 6.8812 (1.8); 6.8753 (1.8); 6.8693 (0.8); 6.8658 (0.6); 6.8595 (1.0); 6.8536 (0.9); 4.5375 (0.6); 4.5267 (0.8); 4.5138 (0.9); 4.5039 (1.4); 4.4931 (1.3); 4.4819 (1.5); 4.4705 (1.5); 4.0333 (0.7); 4.0204 (0.8); 4.0097 (1.1); 3.9968 (1.0); 3.9845 (0.7); 3.9717 (0.7); 3.9606 (1.1); 3.9479 (1.0); 3.9325 (1.0); 3.9258 (1.0); 3.9090 (0.6); 3.9022 (0.6); 3.8828 (1.0); 3.8776 (1.0); 3.8589 (0.8); 3.8523 (0.9); 3.8420 (11.4); 3.8184 (1.8); 3.7751 (2.1); 3.7668 (2.8); 3.7608 (16.0); 3.7237 (2.2); 3.2105 (2.2); 3.1989 (2.6); 3.1671 (1.9); 3.1556 (2.3); 2.6245 (0.5); 2.6141 (0.6); 2.6080 (0.6); 2.5978 (0.8); 2.5900 (0.7); 2.5732 (0.6); 2.3252 (0.6); 2.2563 (0.6); 2.0502 (0.9); 1.6956 (15.4); 1.6893 (15.1); 1.2612 (1.4); 1.2572 (1.9); -0.0002 (0.8)
I-25	¹ H-NMR(400.6 MHz, CDCl ₃): δ = 7.2724 (4.6); 7.2001 (1.3); 7.1944 (1.6); 7.1912 (0.9); 7.1838 (1.1); 7.1800 (1.7); 7.1742 (1.6); 7.1720 (1.7); 7.1662 (1.8); 7.1629 (1.2); 7.1550 (1.0); 7.1518 (1.7); 7.1462 (1.4); 6.8826 (0.7); 6.8768 (1.2); 6.8710 (0.6); 6.8609 (1.3); 6.8551 (2.3); 6.8492 (1.2); 6.8391 (0.7); 6.8333 (1.2); 6.8275 (0.6); 4.8488 (1.8); 4.8418 (1.6); 4.8284 (1.8); 4.8211 (1.8); 4.5763 (0.5); 4.5692 (0.5); 4.5628 (0.7); 4.5566 (0.7); 4.5500 (0.6); 4.5439 (0.7); 4.1485 (0.6); 4.1307 (1.8); 4.1128 (1.8); 4.0950 (0.6); 4.0199 (1.0); 4.0074 (1.1); 3.9970 (1.4); 3.9845 (1.3); 3.9751 (1.1); 3.9623 (1.1); 3.9520 (1.4); 3.9393 (1.3); 3.8636 (0.9); 3.8584 (0.8); 3.8407 (0.7); 3.8355 (0.6); 3.8049 (2.2); 3.7621 (3.1); 3.7472 (2.4); 3.7427 (0.8); 3.7368 (0.7); 3.7044 (2.6); 3.1654 (2.6); 3.1615 (2.7); 3.1415 (14.8); 3.1346 (16.0); 3.1225 (2.4); 3.1187 (2.4); 2.9966 (15.0); 2.9905 (14.2); 2.3855 (0.6); 2.3809 (0.9); 2.3765 (0.6); 2.3427 (0.8); 2.3247 (0.8); 2.3220 (0.8); 2.3091 (1.1); 2.3018 (2.0); 2.2964 (0.7); 2.2912 (0.6); 2.2878 (0.6); 2.2849 (1.0); 2.2822 (1.0); 2.2649 (0.8); 2.1269 (0.7); 2.1252 (0.7); 2.0455 (8.6); 1.7186 (13.2); 1.6887 (12.7); 1.4304 (0.6); 1.4163 (0.6); 1.3345 (0.5); 1.2856 (0.8); 1.2776 (2.7); 1.2598 (6.6); 1.2420 (2.5); 0.8802 (0.6); -0.0002 (3.0)

I-26	¹ H-NMR(400.6 MHz, CDCl ₃): δ = 7.3193 (0.9); 7.1666 (1.1); 7.1605 (1.9); 7.1572 (1.5); 7.1547 (1.6); 7.1511 (1.3); 7.1466 (1.4); 7.1441 (1.4); 7.1407 (2.0); 7.1349 (1.2); 7.0893 (0.6); 6.9034 (0.6); 6.8957 (0.5); 6.8896 (0.8); 6.8818 (1.0); 6.8757 (0.6); 6.8600 (0.5); 4.4759 (0.9); 4.4644 (1.0); 4.4523 (0.9); 4.4434 (1.0); 4.4413 (1.0); 4.4307 (0.8); 4.4206 (0.7); 4.4075 (0.6); 4.1305 (1.3); 4.1127 (1.3); 4.0416 (0.6); 4.0285 (0.7); 4.0180 (1.0); 4.0049 (0.8); 3.9932 (0.6); 3.9804 (0.6); 3.9693 (0.8); 3.9566 (0.8); 3.9046 (0.5); 3.8976 (0.5); 3.8144 (1.5); 3.7711 (1.4); 3.7617 (1.4); 3.7184 (1.6); 3.2169 (1.5); 3.2000 (1.3); 3.1735 (1.5); 3.1567 (1.1); 2.6648 (14.5); 2.6486 (0.6); 2.6363 (16.0); 2.6143 (0.6); 2.6108 (0.5); 2.6081 (0.6); 2.5741 (1.7); 2.5497 (0.6); 2.1183 (0.5); 2.0718 (0.6); 2.0470 (6.1); 1.6956 (13.2); 1.2782 (1.8); 1.2604 (4.0); 1.2425 (1.7); -0.0002 (0.5)
I-27	¹ H-NMR(400.6 MHz, CDCl ₃): δ = 8.8097 (1.6); 8.8075 (1.6); 8.7461 (1.5); 8.7438 (1.5); 8.0732 (0.8); 8.0589 (0.9); 7.9541 (1.8); 7.9503 (1.9); 7.9374 (1.6); 7.9336 (1.6); 7.2999 (1.3); 7.1780 (0.9); 7.1718 (0.9); 7.1604 (1.0); 7.1145 (1.4); 7.1089 (1.8); 7.1059 (1.1); 7.0979 (1.0); 7.0947 (1.8); 7.0891 (1.5); 6.9942 (1.2); 6.9886 (1.6); 6.9855 (1.0); 6.9777 (0.9); 6.9745 (1.6); 6.9689 (1.3); 6.8962 (0.6); 6.8803 (0.7); 6.8745 (1.2); 6.8687 (0.6); 6.8588 (0.5); 6.8531 (0.9); 6.8387 (0.7); 6.8329 (1.1); 6.8271 (0.5); 6.8112 (0.6); 4.8504 (0.7); 4.8364 (0.8); 4.7851 (0.7); 4.7715 (0.7); 4.7592 (0.7); 4.7478 (0.7); 4.6661 (0.7); 4.6553 (0.8); 4.6033 (0.8); 4.5945 (0.9); 4.5794 (0.8); 4.5709 (0.8); 4.5595 (0.8); 4.5498 (0.9); 4.5359 (0.9); 4.5262 (0.9); 4.5050 (0.6); 4.4993 (0.5); 4.4942 (0.6); 4.4877 (0.6); 4.4788 (0.6); 4.4734 (0.6); 4.4684 (0.5); 4.4621 (0.5); 4.1468 (1.2); 4.1290 (3.6); 4.1112 (3.6); 4.1028 (2.0); 4.0917 (3.2); 4.0848 (1.5); 4.0567 (1.7); 4.0454 (1.8); 4.0364 (1.2); 3.7225 (2.0); 3.7118 (2.3); 3.6793 (2.3); 3.6686 (2.6); 3.1364 (2.4); 3.0967 (2.3); 3.0932 (2.4); 3.0535 (1.9); 2.6157 (0.6); 2.5998 (0.9); 2.5950 (0.6); 2.5921 (0.6); 2.5840 (0.7); 2.5812 (0.8); 2.5760 (0.9); 2.5644 (0.7); 2.5605 (0.7); 2.5577 (0.7); 2.5409 (0.5); 2.4130 (0.7); 2.3006 (0.6); 2.2661 (0.5); 2.1363 (0.9); 2.1075 (0.6); 2.0440 (16.0); 1.6123 (11.4); 1.5944 (12.6); 1.2769 (4.5); 1.2591 (9.7); 1.2412 (4.3); -0.0002 (0.7)
I-28	¹ H-NMR(400.0 MHz, CDCl ₃): δ = 7.5186 (1.7); 7.3091 (1.1); 7.2917 (0.6); 7.2870 (0.5); 7.2719 (1.4); 7.2597 (290.5); 7.2108 (0.8); 7.1834 (0.6); 7.1774 (0.7); 7.1708 (1.8); 7.1652 (3.4); 7.1598 (3.0); 7.1553 (2.0); 7.1508 (2.6); 7.1454 (3.3); 7.1398 (1.8); 7.1331 (0.7); 7.1273 (0.5); 6.9957 (1.8); 6.9048 (1.1); 6.8859 (2.2); 6.8830 (2.1); 6.8772 (1.4); 6.8701 (1.3); 6.8640 (1.6); 6.8614 (1.5); 4.5156 (1.1); 4.5020 (1.6); 4.4927 (1.3); 4.4862 (1.3); 4.4788 (1.8); 4.4635 (1.2); 4.4239 (1.0); 4.4149 (1.0); 4.1207 (1.0); 4.1064 (1.0); 4.0966 (1.4); 4.0825 (1.2); 4.0733 (1.1); 4.0596 (1.0); 4.0492 (1.4); 4.0354 (1.2); 3.9396 (0.9); 3.9295 (0.9); 3.9153 (0.8); 3.9057 (0.8); 3.8876 (0.9); 3.8807 (0.9); 3.8646 (0.8); 3.8554 (0.8); 3.7763 (2.4); 3.7593 (2.3); 3.7331 (2.8); 3.7161 (2.7); 3.5188 (0.6); 3.5007 (1.3); 3.4897 (1.2); 3.4825 (1.8); 3.4793 (2.0); 3.4720 (1.6); 3.4653 (2.7); 3.4616 (2.4); 3.4506

	(1.3); 3.4472 (1.3); 3.4431 (1.8); 3.4260 (1.0); 3.1963 (2.8); 3.1936 (3.0); 3.1531 (2.5); 3.1504 (2.7); 2.7050 (0.5); 2.6998 (0.6); 2.6868 (0.6); 2.6828 (1.0); 2.6767 (0.6); 2.6708 (0.7); 2.6649 (1.2); 2.6597 (0.7); 2.6482 (1.2); 2.6424 (0.7); 2.6301 (0.6); 2.6253 (0.7); 2.3054 (0.8); 2.2925 (0.7); 2.2837 (1.0); 2.2709 (0.7); 2.2604 (0.9); 2.2466 (1.5); 2.1944 (2.8); 2.1809 (0.7); 2.1470 (0.6); 2.1326 (0.6); 1.9610 (0.6); 1.9506 (0.8); 1.9401 (1.1); 1.9321 (1.6); 1.9207 (1.4); 1.9135 (1.9); 1.8926 (1.4); 1.8741 (0.9); 1.7018 (14.9); 1.6984 (16.0); 1.5592 (1.1); 1.5035 (0.9); 1.3329 (0.6); 1.2843 (1.0); 1.2562 (3.6); 1.2133 (0.7); 1.1942 (0.5); 1.1206 (4.0); 1.1144 (4.0); 1.1020 (8.3); 1.0958 (8.0); 1.0833 (3.8); 1.0771 (3.7); 0.9470 (0.6); 0.9284 (1.2); 0.9101 (0.6); 0.8802 (0.9); 0.0079 (3.7); -0.0002 (132.2); -0.0085 (4.6)
I-29	¹ H-NMR(400.0 MHz, CDCl ₃): δ = 7.5188 (1.6); 7.3096 (0.8); 7.2599 (281.0); 7.2101 (0.8); 7.1813 (2.0); 7.1731 (3.2); 7.1672 (3.1); 7.1619 (3.1); 7.1562 (3.3); 7.1480 (2.1); 6.9959 (2.0); 6.9141 (1.1); 6.9086 (1.2); 6.8981 (1.1); 6.8926 (2.2); 6.8871 (2.1); 6.8817 (1.0); 6.8767 (0.8); 6.8708 (1.4); 6.8655 (1.4); 6.8596 (1.1); 6.8305 (1.3); 6.1736 (1.3); 6.1472 (2.0); 6.1305 (1.6); 6.1218 (1.4); 6.1041 (2.2); 6.0786 (1.5); 5.5442 (2.3); 5.5356 (2.9); 5.5011 (2.1); 5.4925 (2.5); 5.3800 (2.5); 5.3728 (2.3); 5.3534 (2.4); 5.3460 (2.2); 4.5082 (1.1); 4.5019 (1.1); 4.4943 (1.5); 4.4860 (1.9); 4.4792 (1.5); 4.4713 (1.6); 4.4651 (1.8); 4.4517 (1.0); 4.4394 (0.9); 4.1486 (1.1); 4.1307 (3.4); 4.1128 (3.5); 4.1025 (1.0); 4.0950 (1.4); 4.0888 (1.0); 4.0783 (2.2); 4.0644 (2.0); 4.0539 (1.4); 4.0398 (1.2); 3.9349 (1.1); 3.9253 (1.2); 3.9181 (2.6); 3.8997 (2.9); 3.8869 (1.2); 3.8750 (2.9); 3.8567 (2.5); 3.7302 (0.6); 3.7180 (0.6); 3.5469 (1.2); 3.5381 (0.9); 3.5350 (1.3); 3.5237 (1.0); 3.4990 (1.2); 3.4930 (1.0); 3.4825 (2.4); 3.4761 (1.9); 3.4659 (1.9); 3.4586 (1.9); 3.4538 (2.0); 3.4417 (1.4); 3.4372 (1.9); 3.4205 (1.0); 3.4019 (0.5); 3.3281 (4.2); 3.2850 (3.8); 2.7233 (0.5); 2.7124 (0.5); 2.7060 (0.6); 2.7005 (0.6); 2.6890 (1.2); 2.6832 (0.7); 2.6775 (0.8); 2.6713 (1.2); 2.6659 (0.8); 2.6599 (0.8); 2.6481 (0.6); 2.6373 (0.6); 2.2910 (0.7); 2.2840 (1.3); 2.2606 (1.1); 2.2466 (3.0); 2.2271 (1.2); 2.2184 (0.8); 2.2036 (1.3); 2.1944 (5.5); 2.1741 (0.5); 2.1671 (0.7); 2.1305 (0.9); 2.1011 (0.7); 2.0438 (16.0); 1.9565 (0.8); 1.9502 (0.8); 1.9385 (1.6); 1.9315 (1.6); 1.9147 (2.0); 1.8986 (1.7); 1.8926 (1.6); 1.8805 (1.0); 1.8748 (1.0); 1.8567 (0.5); 1.6134 (0.9); 1.5964 (1.2); 1.5798 (1.3); 1.5602 (1.2); 1.5436 (0.9); 1.5039 (0.8); 1.4094 (0.6); 1.3908 (0.8); 1.3709 (0.8); 1.3531 (0.6); 1.3331 (1.0); 1.2844 (1.6); 1.2766 (5.4); 1.2587 (13.8); 1.2409 (5.0); 1.2324 (1.0); 1.2133 (1.4); 1.1943 (1.1); 1.1231 (3.8); 1.1172 (3.8); 1.1045 (7.7); 1.0986 (7.3); 1.0858 (3.8); 1.0800 (3.6); 0.9468 (1.6); 0.9284 (3.1); 0.9100 (1.4); 0.8968 (0.6); 0.8801 (1.5); 0.8625 (0.7); 0.0080 (3.4); -0.0002 (116.8); -0.0085 (3.9)
I-30	¹ H-NMR(400.0 MHz, CDCl ₃): δ = 7.5185 (2.5); 7.3218 (0.5); 7.3181 (0.6); 7.3094 (0.9); 7.3021 (0.5); 7.2957 (0.6); 7.2941 (0.5); 7.2902 (0.7); 7.2886 (0.7); 7.2862 (0.8); 7.2854 (0.8); 7.2822 (1.0); 7.2790 (1.1); 7.2782 (1.1); 7.2759 (1.4); 7.2750 (1.5); 7.2743 (1.6); 7.2734 (1.7); 7.2727 (1.8); 7.2711 (2.2); 7.2703 (2.3);
	7.2694 (2.4); 7.2678 (3.3); 7.2670 (3.6); 7.2596 (455.4); 7.2279 (0.7); 7.2103 (0.6); 7.1464 (2.3); 6.9956 (2.7); 6.8685 (1.6); 4.5296 (0.8); 4.1304 (0.8); 4.1125 (0.8); 3.9728 (0.7); 3.7768 (0.5); 3.7375 (0.6); 3.1965 (1.0); 3.1528 (0.8); 2.0436 (2.6); 1.6706 (6.3); 1.6102 (16.0); 1.2842 (0.9); 1.2763 (1.1); 1.2584 (3.4); 1.2406 (1.0); 0.8801 (0.6); 0.1460 (0.6); 0.0102 (1.0); 0.0079 (6.0); 0.0063 (2.0); 0.0054 (2.2); 0.0046 (2.6); -0.0002 (201.3); -0.0052 (3.5); -0.0060 (2.7); -0.0068 (2.2); -0.0085 (5.9); -0.0116 (0.6); -0.0124 (0.5); -0.1496 (0.6)

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

Таблица 2.1: соединения 2.1-1 - 2.1-390 согласно изобретению общей формулы (I.1), где Z-(C=W)-N(R¹¹)-R¹² 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	

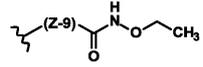
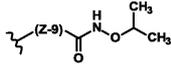
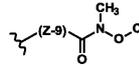
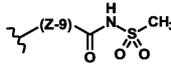
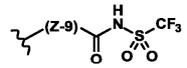
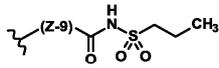
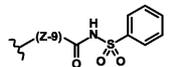
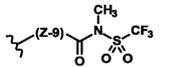
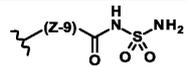
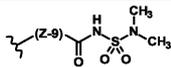
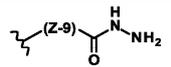
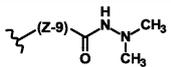
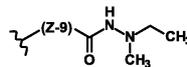
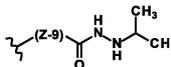
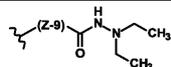
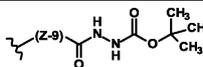
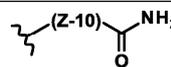
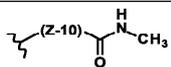
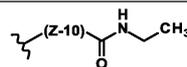
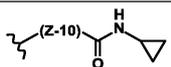
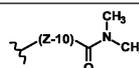
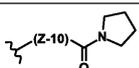
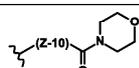
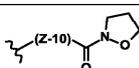
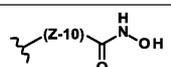
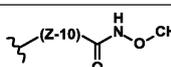
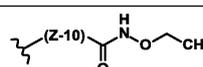
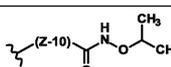
2.1-61		2.1-62	
2.1-63		2.1-64	
2.1-65		2.1-66	
2.1-67		2.1-68	
2.1-69		2.1-70	
2.1-71		2.1-72	
2.1-73		2.1-74	
2.1-75		2.1-76	
2.1-77		2.1-78	
2.1-79		2.1-80	
2.1-81		2.1-82	
2.1-83		2.1-84	
2.1-85		2.1-86	

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	

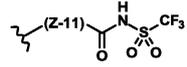
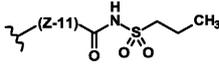
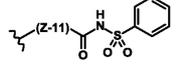
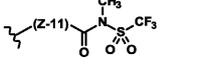
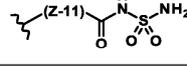
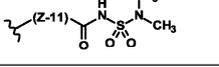
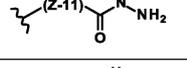
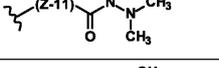
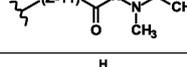
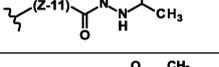
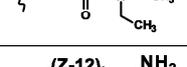
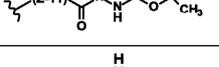
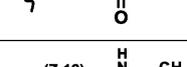
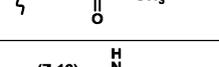
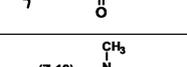
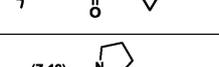
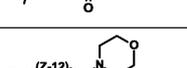
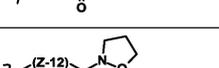
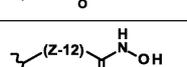
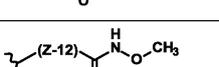
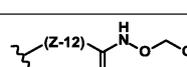
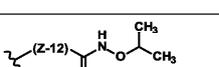
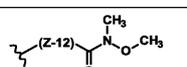
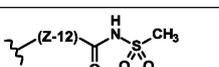
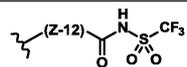
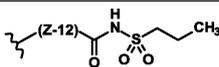
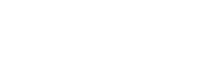
2.1-113		2.1-114	
2.1-115		2.1-116	
2.1-117		2.1-118	
2.1-119		2.1-120	
2.1-121		2.1-122	
2.1-123		2.1-124	
2.1-125		2.1-126	
2.1-127		2.1-128	
2.1-129		2.1-130	
2.1-131		2.1-132	
2.1-133		2.1-134	
2.1-135		2.1-136	
2.1-137		2.1-138	
2.1-139		2.1-140	
2.1-141		2.1-142	
2.1-143		2.1-144	
2.1-145		2.1-146	
2.1-147		2.1-148	
2.1-149		2.1-150	
2.1-151		2.1-152	

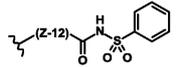
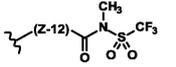
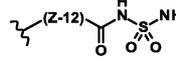
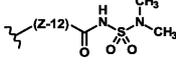
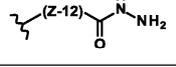
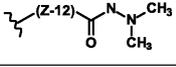
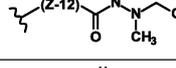
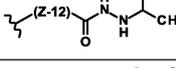
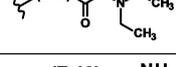
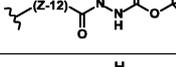
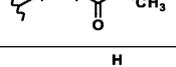
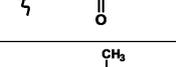
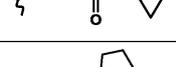
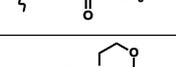
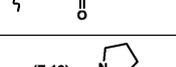
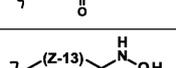
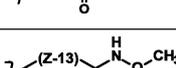
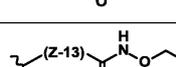
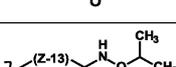
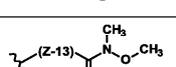
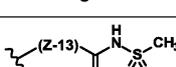
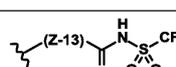
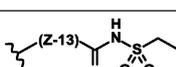
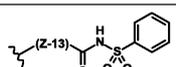
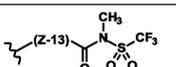
2.1-153		2.1-154	
2.1-155		2.1-156	
2.1-157		2.1-158	
2.1-159		2.1-160	
2.1-161		2.1-162	
2.1-163		2.1-164	
2.1-165		2.1-166	
2.1-167		2.1-168	
2.1-169		2.1-170	
2.1-171		2.1-172	
2.1-173		2.1-174	
2.1-175		2.1-176	
2.1-177		2.1-178	
2.1-179		2.1-180	
2.1-181		2.1-182	
2.1-183		2.1-184	
2.1-185		2.1-186	
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	
2.1-241		2.1-242	
2.1-243		2.1-244	
2.1-245		2.1-246	

2.1-247		2.1-248	
2.1-249		2.1-250	
2.1-251		2.1-252	
2.1-253		2.1-254	
2.1-255		2.1-256	
2.1-257		2.1-258	
2.1-259		2.1-260	
2.1-261		2.1-262	
2.1-263		2.1-264	
2.1-265		2.1-266	
2.1-267		2.1-268	
2.1-269		2.1-270	
2.1-271		2.1-272	
2.1-273		2.1-274	

2.1-275		2.1-276	
2.1-277		2.1-278	
2.1-279		2.1-280	
2.1-281		2.1-282	
2.1-283		2.1-284	
2.1-285		2.1-286	
2.1-287		2.1-288	
2.1-289		2.1-290	
2.1-291		2.1-292	
2.1-293		2.1-294	
2.1-295		2.1-296	
2.1-297		2.1-298	
2.1-299		2.1-300	
2.1-301		2.1-302	

2.1-303		2.1-304	
2.1-305		2.1-306	
2.1-307		2.1-308	
2.1-309		2.1-310	
2.1-311		2.1-312	
2.1-313		2.1-314	
2.1-315		2.1-316	
2.1-317		2.1-318	
2.1-319		2.1-320	
2.1-321		2.1-322	
2.1-323		2.1-324	
2.1-325		2.1-326	
2.1-327		2.1-328	
2.1-329		2.1-330	

2.1-331		2.1-332	
2.1-333		2.1-334	
2.1-335		2.1-336	
2.1-337		2.1-338	
2.1-339		2.1-340	
2.1-341		2.1-342	
2.1-343		2.1-344	
2.1-345		2.1-346	
2.1-347		2.1-348	
2.1-349		2.1-350	
2.1-351		2.1-352	
2.1-353		2.1-354	
2.1-355		2.1-356	
2.1-357		2.1-358	

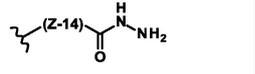
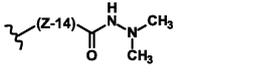
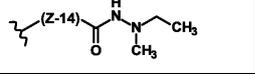
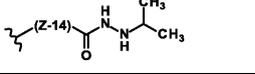
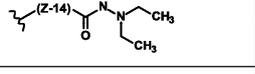
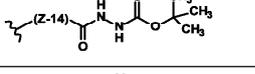
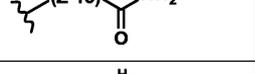
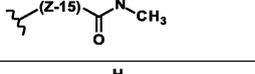
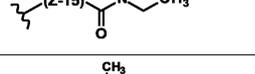
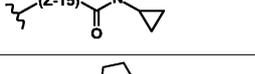
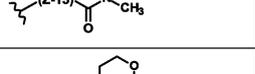
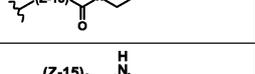
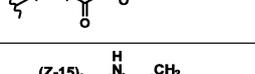
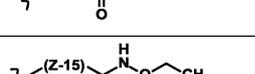
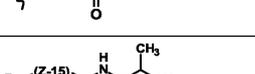
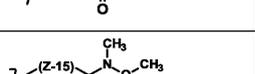
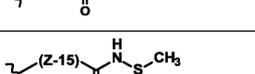
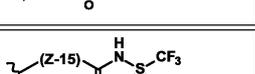
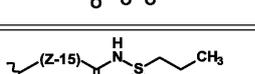
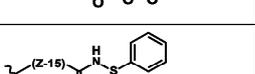
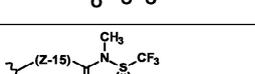
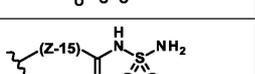
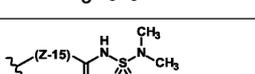
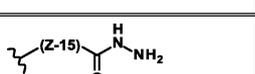
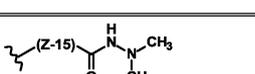
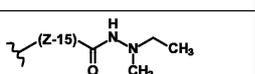
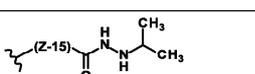
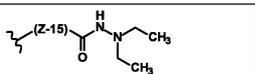
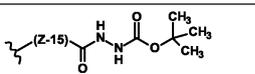
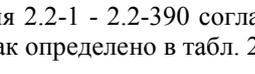
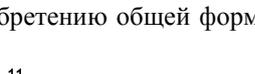
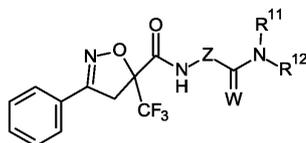
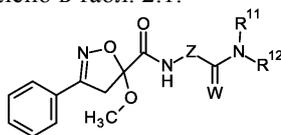
2.1-359		2.1-360	
2.1-361		2.1-362	
2.1-363		2.1-364	
2.1-365		2.1-366	
2.1-367		2.1-368	
2.1-369		2.1-370	
2.1-371		2.1-372	
2.1-373		2.1-374	
2.1-375		2.1-376	
2.1-377		2.1-378	
2.1-379		2.1-380	
2.1-381		2.1-382	
2.1-383		2.1-384	
2.1-385		2.1-386	
2.1-387		2.1-388	
2.1-389		2.1-390	

Таблица 2.2: соединения 2.2-1 - 2.2-390 согласно изобретению общей формулы (I.2), где Z-(C=W)-N(R¹¹)-R¹² имеет значение, как определено в табл. 2.1.



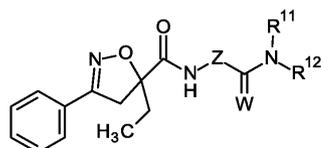
(I.2),

Таблица 2.3: соединения 2.3-1 - 2.3-390 согласно изобретению общей формулы (I.3), где Z-(C=W)-N(R¹¹)-R¹² имеет значение, как определено в табл. 2.1.



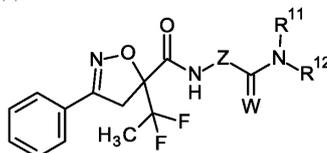
(I.3),

Таблица 2.4: соединения 2.4-1 - 2.4-390 согласно изобретению общей формулы (I.4), где Z-(C=W)-N(R¹¹)-R¹² имеет значение, как определено в табл. 2.1.



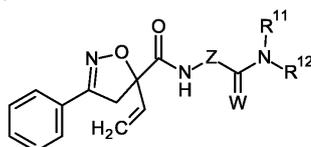
(I.4),

Таблица 2.5: соединения 2.5-1 - 2.5-390 согласно изобретению общей формулы (I.5), где Z-(C=W)-N(R¹¹)-R¹² имеет значение, как определено в табл. 2.1.



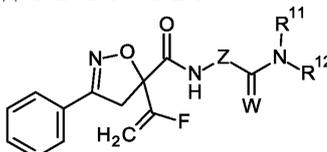
(I.5),

Таблица 2.6: соединения 2.6-1 - 2.6-390 согласно изобретению общей формулы (I.6), где Z-(C=W)-N(R¹¹)-R¹² имеет значение, как определено в табл. 2.1.



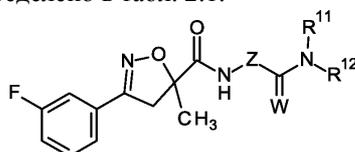
(I.6),

Таблица 2.7: соединения 2.7-1 - 2.7-390 согласно изобретению общей формулы (I.7), где Z-(C=W)-N(R¹¹)-R¹² имеет значение, как определено в табл. 2.1.



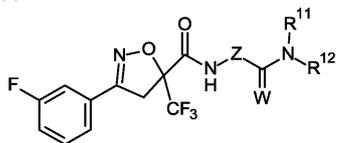
(I.7),

Таблица 2.8: соединения 2.8-1 - 2.8-390 согласно изобретению общей формулы (I.8), где Z-(C=W)-N(R¹¹)-R¹² имеет значение, как определено в табл. 2.1.



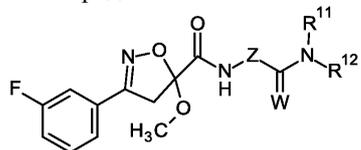
(I.8),

Таблица 2.9: соединения 2.9-1 - 2.9-390 согласно изобретению общей формулы (I.9), где Z-(C=W)-N(R¹¹)-R¹² имеет значение, как определено в табл. 2.1.



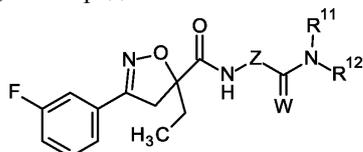
(I.9),

Таблица 2.10: соединения 2.10-1 - 2.10-390 согласно изобретению общей формулы (I.10), где Z-(C=W)-N(R¹¹)-R¹² имеет значение, как определено в табл. 2.1.



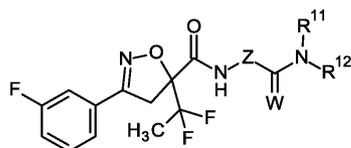
(I.10),

Таблица 2.11: соединения 2.11-1 - 2.11-390 согласно изобретению общей формулы (I.11), где Z-(C=W)-N(R¹¹)-R¹² имеет значение, как определено в табл. 2.1.



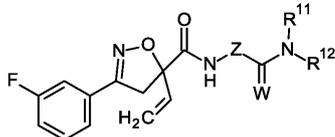
(I.11),

Таблица 2.12: соединения 2.12-1 - 2.12-390 согласно изобретению общей формулы (I.12), где Z-(C=W)-N(R¹¹)-R¹² имеет значение, как определено в табл. 2.1.



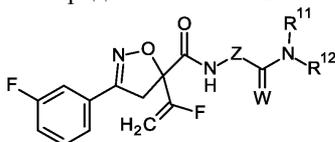
(I.12),

Таблица 2.13: соединения 2.13-1 - 2.13-390 согласно изобретению общей формулы (I.13), где Z-(C=W)-N(R¹¹)-R¹² имеет значение, как определено в табл. 2.1.



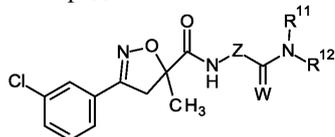
(I.13),

Таблица 2.14: соединения 2.14-1 - 2.14-390 согласно изобретению общей формулы (I.14), где Z-(C=W)-N(R¹¹)-R¹² имеет значение, как определено в табл. 2.1.



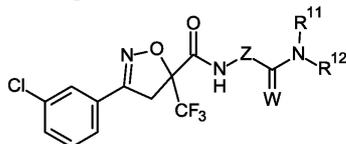
(I.14),

Таблица 2.15: соединения 2.15-1 - 2.15-390 согласно изобретению общей формулы (I.15), где Z-(C=W)-N(R¹¹)-R¹² имеет значение, как определено в табл. 2.1.



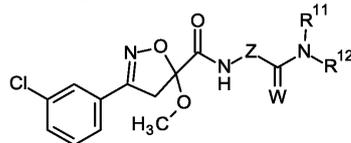
(I.15),

Таблица 2.16: соединения 2.16-1 - 2.16-390 согласно изобретению общей формулы (I.16), где Z-(C=W)-N(R¹¹)-R¹² имеет значение, как определено в табл. 2.1.



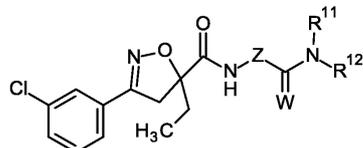
(I.16),

Таблица 2.17: соединения 2.17-1 - 2.17-390 согласно изобретению общей формулы (I.17), где Z-(C=W)-N(R¹¹)-R¹² имеет значение, как определено в табл. 2.1.



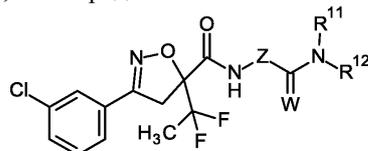
(I.17),

Таблица 2.18: соединения 2.18-1 - 2.18-390 согласно изобретению общей формулы (I.18), где Z-(C=W)-N(R¹¹)-R¹² имеет значение, как определено в табл. 2.1.



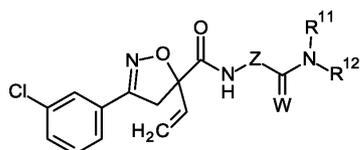
(I.18),

Таблица 2.19: соединения 2.19-1 - 2.19-390 согласно изобретению общей формулы (I.19), где Z-(C=W)-N(R¹¹)-R¹² имеет значение, как определено в табл. 2.1.



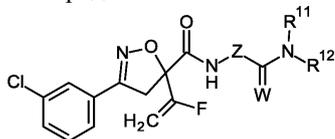
(I.19),

Таблица 2.20: соединения 2.20-1 - 2.20-390 согласно изобретению общей формулы (I.20), где Z-(C=W)-N(R¹¹)-R¹² имеет значение, как определено в табл. 2.1.



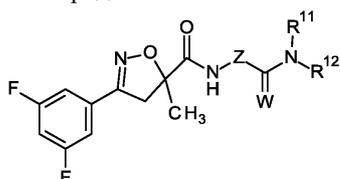
(I.20),

Таблица 2.21: соединения 2.21-1 - 2.21-390 согласно изобретению общей формулы (I.21), где Z-(C=W)-N(R¹¹)-R¹² имеет значение, как определено в табл. 2.1.



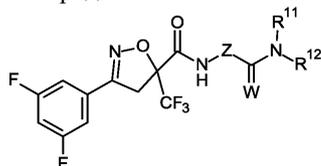
(I.21),

Таблица 2.22: соединения 2.22-1 - 2.22-390 согласно изобретению общей формулы (I.22), где Z-(C=W)-N(R¹¹)-R¹² имеет значение, как определено в табл. 2.1.



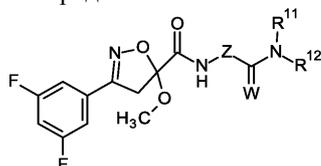
(I.22),

Таблица 2.23: соединения 2.23-1 - 2.23-390 согласно изобретению общей формулы (I.23), где Z-(C=W)-N(R¹¹)-R¹² имеет значение, как определено в табл. 2.1.



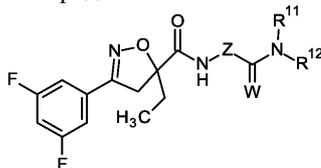
(I.23),

Таблица 2.24: соединения 2.24-1 - 2.24-390 согласно изобретению общей формулы (I.24), где Z-(C=W)-N(R¹¹)-R¹² имеет значение, как определено в табл. 2.1.



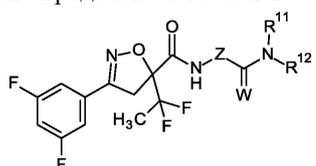
(I.24),

Таблица 2.25: соединения 2.25-1 - 2.25-390 согласно изобретению общей формулы (I.25), где Z-(C=W)-N(R¹¹)-R¹² имеет значение, как определено в табл. 2.1.



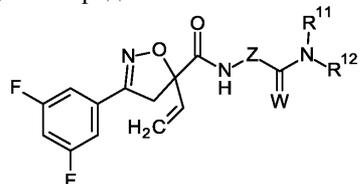
(I.25),

Таблица 2.26: соединения 2.26-1 - 2.26-390 согласно изобретению общей формулы (I.26), где Z-(C=W)-N(R¹¹)-R¹² имеет значение, как определено в табл. 2.1.



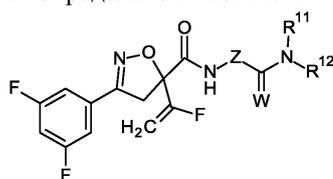
(I.26),

Таблица 2.27: соединения 2.27-1 - 2.27-390 согласно изобретению общей формулы (I.27), где Z-(C=W)-N(R¹¹)-R¹² имеет значение, как определено в табл. 2.1.



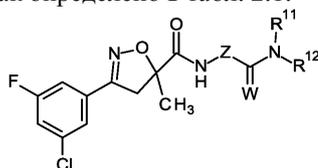
(I.27),

Таблица 2.28: соединения 2.28-1 - 2.28-390 согласно изобретению общей формулы (I.28), где Z-(C=W)-N(R¹¹)-R¹² имеет значение, как определено в табл. 2.1.



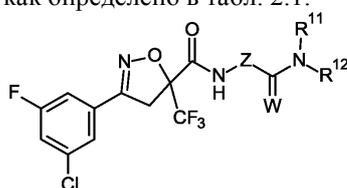
(I.28),

Таблица 2.29: соединения 2.29-1 - 2.29-390 согласно изобретению общей формулы (I.29), где Z-(C=W)-N(R¹¹)-R¹² имеет значение, как определено в табл. 2.1.



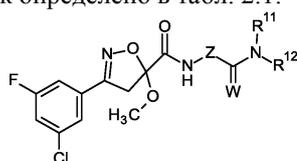
(I.29),

Таблица 2.30: соединения 2.30-1 - 2.30-390 согласно изобретению общей формулы (I.30), где Z-(C=W)-N(R¹¹)-R¹² имеет значение, как определено в табл. 2.1.



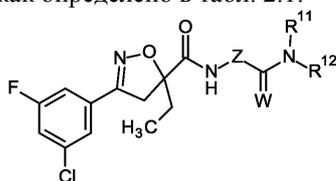
(I.30),

Таблица 2.31: соединения 2.31-1 - 2.31-390 согласно изобретению общей формулы (I.31), где Z-(C=W)-N(R¹¹)-R¹² имеет значение, как определено в табл. 2.1.



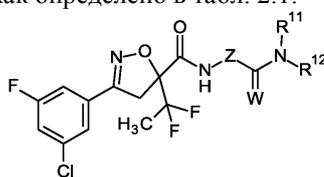
(I.31),

Таблица 2.32: соединения 2.32-1 - 2.32-390 согласно изобретению общей формулы (I.32), где Z-(C=W)-N(R¹¹)-R¹² имеет значение, как определено в табл. 2.1.



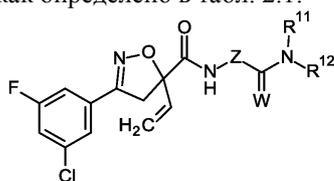
(I.32),

Таблица 2.33: соединения 2.33-1 - 2.33-390 согласно изобретению общей формулы (I.33), где Z-(C=W)-N(R¹¹)-R¹² имеет значение, как определено в табл. 2.1.



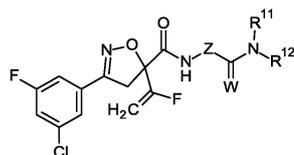
(I.33),

Таблица 2.34: соединения 2.34-1 - 2.34-390 согласно изобретению общей формулы (I.34), где Z-(C=W)-N(R¹¹)-R¹² имеет значение, как определено в табл. 2.1.



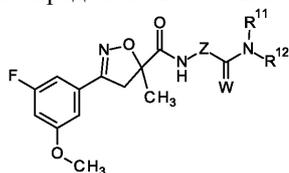
(I.34),

Таблица 2.35: соединения 2.35-1 - 2.35-390 согласно изобретению общей формулы (I.35), где Z-(C=W)-N(R¹¹)-R¹² имеет значение, как определено в табл. 2.1.



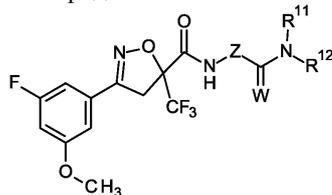
(I.35),

Таблица 2.36: соединения 2.36-1 - 2.36-390 согласно изобретению общей формулы (I.36), где Z-(C=W)-N(R¹¹)-R¹² имеет значение, как определено в табл. 2.1.



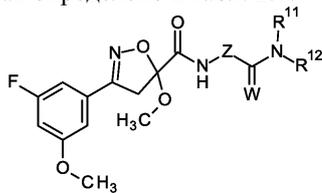
(I.36),

Таблица 2.37: соединения 2.37-1 - 2.37-390 согласно изобретению общей формулы (I.37), где Z-(C=W)-N(R¹¹)-R¹² имеет значение, как определено в табл. 2.1.



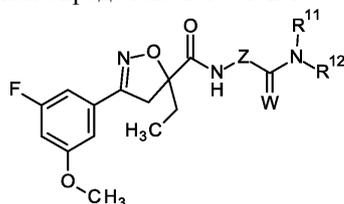
(I.37),

Таблица 2.38: соединения 2.38-1 - 2.38-390 согласно изобретению общей формулы (I.38), где Z-(C=W)-N(R¹¹)-R¹² имеет значение, как определено в табл. 2.1.



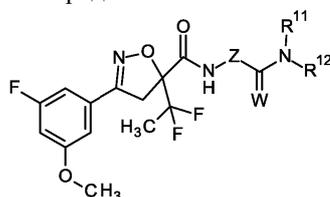
(I.38),

Таблица 2.39: соединения 2.39-1 - 2.39-390 согласно изобретению общей формулы (I.39), где Z-(C=W)-N(R¹¹)-R¹² имеет значение, как определено в табл. 2.1.



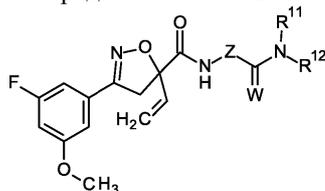
(I.39),

Таблица 2.40: соединения 2.40-1 - 2.40-390 согласно изобретению общей формулы (I.40), где Z-(C=W)-N(R¹¹)-R¹² имеет значение, как определено в табл. 2.1.



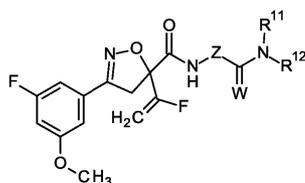
(I.40),

Таблица 2.41: соединения 2.41-1 - 2.41-390 согласно изобретению общей формулы (I.41), где Z-(C=W)-N(R¹¹)-R¹² имеет значение, как определено в табл. 2.1.



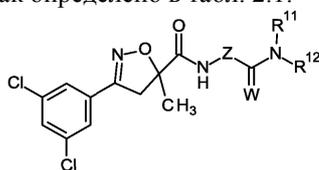
(I.41),

Таблица 2.42: соединения 2.42-1 - 2.42-390 согласно изобретению общей формулы (I.42), где Z-(C=W)-N(R¹¹)-R¹² имеет значение, как определено в табл. 2.1.



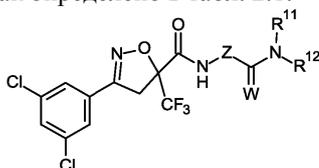
(I.42),

Таблица 2.43: соединения 2.43-1 - 2.43-390 согласно изобретению общей формулы (I.43), где Z-(C=W)-N(R¹¹)-R¹² имеет значение, как определено в табл. 2.1.



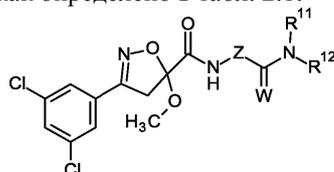
(I.43),

Таблица 2.44: соединения 2.44-1 - 2.44-390 согласно изобретению общей формулы (I.44), где Z-(C=W)-N(R¹¹)-R¹² имеет значение, как определено в табл. 2.1.



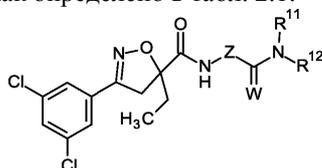
(I.44),

Таблица 2.45: соединения 2.45-1 - 2.45-390 согласно изобретению общей формулы (I.45), где Z-(C=W)-N(R¹¹)-R¹² имеет значение, как определено в табл. 2.1.



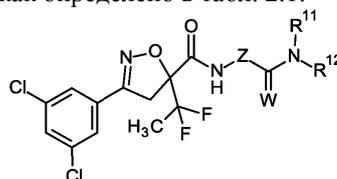
(I.45),

Таблица 2.46: соединения 2.46-1 - 2.46-390 согласно изобретению общей формулы (I.46), где Z-(C=W)-N(R¹¹)-R¹² имеет значение, как определено в табл. 2.1.



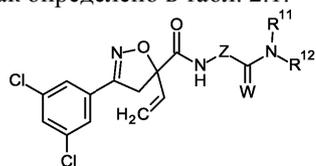
(I.46),

Таблица 2.47: соединения 2.47 - 2.47-390 согласно изобретению общей формулы (I.47), где Z-(C=W)-N(R¹¹)-R¹² имеет значение, как определено в табл. 2.1.



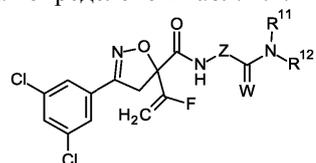
(I.47),

Таблица 2.48: соединения 2.48-1 - 2.48-390 согласно изобретению общей формулы (I.48), где Z-(C=W)-N(R¹¹)-R¹² имеет значение, как определено в табл. 2.1.



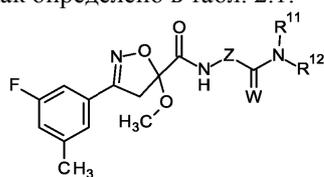
(I.48),

Таблица 2.49: соединения 2.49-1 - 2.49-390 согласно изобретению общей формулы (I.49), где Z-(C=W)-N(R¹¹)-R¹² имеет значение, как определено в табл. 2.1.



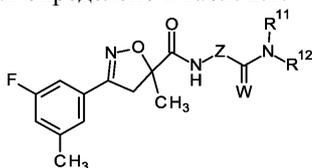
(I.49),

Таблица 2.50: соединения 2.50-1 - 2.50-390 согласно изобретению общей формулы (I.50), где Z-(C=W)-N(R¹¹)-R¹² имеет значение, как определено в табл. 2.1.



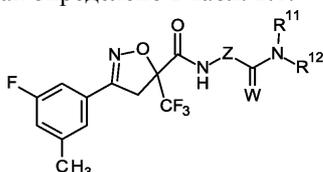
(I.50),

Таблица 2.51: соединения 2.51-1 - 2.51-390 согласно изобретению общей формулы (I.51), где Z-(C=W)-N(R¹¹)-R¹² имеет значение, как определено в табл. 2.1.



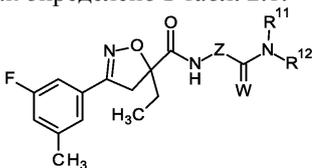
(I.51),

Таблица 2.52: соединения 2.52-1 - 2.52-390 согласно изобретению общей формулы (I.52), где Z-(C=W)-N(R¹¹)-R¹² имеет значение, как определено в табл. 2.1.



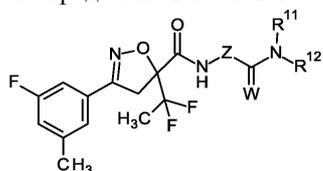
(I.52),

Таблица 2.53: соединения 2.53-1 - 2.53-390 согласно изобретению общей формулы (I.53), где Z-(C=W)-N(R¹¹)-R¹² имеет значение, как определено в табл. 2.1.



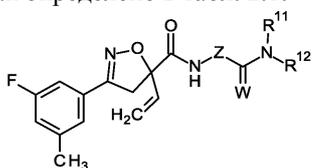
(I.53),

Таблица 2.54: соединения 2.54-1 - 2.54-390 согласно изобретению общей формулы (I.54), где Z-(C=W)-N(R¹¹)-R¹² имеет значение, как определено в табл. 2.1.



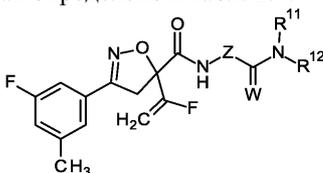
(I.54),

Таблица 2.55: соединения 2.55-1 - 2.55-390 согласно изобретению общей формулы (I.55), где Z-(C=W)-N(R¹¹)-R¹² имеет значение, как определено в табл. 2.1.



(I.55),

Таблица 2.56: соединения 2.56-1 - 2.56-390 согласно изобретению общей формулы (I.56), где Z-(C=W)-N(R¹¹)-R¹² 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.

Легко диспергируемый 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. изотридеканополигликолевого эфира (8 EO) и 71 мас.ч. 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. циклогексанона в качестве растворителя и 10 мас.ч. оксоэтилированного нонилфенола в качестве эмульгатора.

5. Вододиспергируемый гранулят.

Диспергируемый в воде гранулят получают при измельчении

75 мас.ч. соединения формулы (I),

10 " лигнинсульфокислого кальция,

5 " лаурилсульфата натрия,

3 " поливинилового спирта и

7 " каолина,

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"-динафтилметан-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 моносопла и высушивают.

С. Биологические примеры.

Описание опытов.

1. Гербицидное действие против вредных растений 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*

CYPES: *Cyperus esculentus* 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 % в предвсходовый период против ALOMY

Пример №	Дозировка [г/га]	ALOMY
I-17	80	90
I-11	80	100
I-16	80	100
I-18	80	100
I-12	80	100
I-13	80	100
I-23	80	100
I-24	80	100
I-14	80	100
I-15	80	100
I-21	80	100
I-26	80	100
I-25	80	100
I-20	80	100
I-22	80	100
I-10	80	100
I-02	80	90
I-27	80	90
I-08	80	90
I-04	80	80

Таблица С2

Гербицидное действие в % в предвсходовый период против AVEVA

Пример №	Дозировка [г/га]	AVEVA
I-17	80	100
I-11	80	100
I-16	80	100
I-18	80	90
I-12	80	100
I-13	80	100
I-23	80	100
I-24	80	100
I-14	80	90
I-15	80	90
I-21	80	100
I-26	80	90
I-25	80	90
I-20	80	100
I-22	80	100
I-10	80	80
I-19	80	90
I-02	80	100
I-05	80	100
I-27	80	80

Таблица С3

Гербицидное действие в % в предвсходовый период против CYPES

Пример №	Дозировка [г/га]	CYPES
I-16	80	100
I-09	80	100

Таблица С4

Гербицидное действие в % в предвсходовый период против ECHCG

Пример №	Дозировка [г/га]	ECHCG
I-17	80	100
I-11	80	100
I-16	80	100
I-18	80	90
I-12	80	100
I-13	80	100
I-23	80	100
I-24	80	90
I-14	80	100
I-15	80	90
I-21	80	100
I-26	80	90
I-25	80	80
I-20	80	100
I-10	80	80
I-19	80	80
I-02	80	100
I-07	80	100

Таблица С5

Гербицидное действие в % в предвсходовый период против LOLRI

Пример №	Дозировка [г/га]	LOLRI
I-17	80	100
I-11	80	100
I-16	80	100
I-18	80	100
I-12	80	100
I-13	80	100
I-23	80	100
I-24	80	100
I-14	80	100
I-15	80	100
I-21	80	100
I-26	80	100
I-25	80	100
I-20	80	100
I-22	80	100
I-10	80	100
I-19	80	100

Таблица С6
Гербицидное действие в % в предвсходовый период против SETVI

Пример №	Дозировка [г/га]	SETVI
I-17	80	100
I-11	80	100
I-16	80	100
I-18	80	100
I-12	80	100
I-13	80	100
I-23	80	100
I-24	80	100
I-14	80	100
I-15	80	100
I-21	80	100
I-26	80	90
I-25	80	100
I-20	80	100
I-22	80	100
I-10	80	90
I-19	80	90
I-05	80	90

Таблица С7
Гербицидное действие в % в предвсходовый период против ABUTH

Пример №	Дозировка [г/га]	ABUTH
I-17	80	80
I-11	80	100
I-07	80	100

Таблица С8
Гербицидное действие в % в предвсходовый период против AMARE

Пример №	Дозировка [г/га]	AMARE
I-17	80	100
I-11	80	100
I-16	80	100
I-18	80	100
I-12	80	100
I-13	80	100
I-23	80	100
I-24	80	100
I-14	80	100
I-15	80	100
I-21	80	100
I-26	80	100
I-25	80	100
I-20	80	100
I-22	80	100
I-10	80	90
I-02	80	100

Таблица С9

Гербицидное действие в % в предвсходовый период против РНВРУ

Пример №	Дозировка [г/га]	РНВРУ
I-17	80	90
I-11	80	90
I-16	80	90
I-18	80	90
I-12	80	90
I-13	80	90
I-23	80	90
I-24	80	90
I-14	80	90
I-21	80	90
I-25	80	90
I-20	80	80

Таблица С10

Гербицидное действие в % в предвсходовый период против POLCO

Пример №	Дозировка [г/га]	POLCO
I-17	80	100
I-11	80	100
I-16	80	100
I-18	80	100
I-12	80	100
I-13	80	100
I-23	80	100
I-24	80	90
I-14	80	100
I-15	80	100
I-21	80	100
I-26	80	90
I-25	80	100
I-20	80	100
I-22	80	100
I-10	80	90
I-19	80	90
I-05	80	90
I-04	80	90
I-03	80	80

Таблица С11

Гербицидное действие в % в предвсходовый период против STEME

Пример №	Дозировка [г/га]	STEME
I-17	80	100
I-11	80	100
I-16	80	100
I-18	80	100
I-12	80	100
I-13	80	100
I-23	80	100
I-24	80	90
I-14	80	90
I-15	80	100
I-21	80	90
I-26	80	100
I-25	80	100
I-20	80	100
I-22	80	90
I-10	80	90
I-19	80	90
I-02	80	100
I-05	80	80
I-27	80	90
I-03	80	80

Таблица С12

Гербицидное действие в % в предвсходовый период против VIOTR

Пример №	Дозировка [г/га]	VIOTR
I-17	80	100
I-11	80	100
I-16	80	100
I-18	80	100
I-12	80	100
I-13	80	100
I-23	80	90
I-24	80	90
I-14	80	100
I-15	80	100
I-21	80	100
I-26	80	80
I-25	80	100
I-20	80	100
I-22	80	100
I-19	80	80
I-05	80	100

Таблица С13

Гербицидное действие в % в предвсходовый период против VERPE

Пример №	Дозировка [г/га]	VERPE
I-17	80	100
I-11	80	90
I-16	80	90
I-18	80	90
I-12	80	100
I-13	80	90
I-23	80	90
I-24	80	90
I-14	80	90
I-15	80	100
I-21	80	90
I-26	80	80
I-25	80	90
I-22	80	100
I-02	80	90
I-08	80	90

Таблица С14

Гербицидное действие в % в предвсходовый период против HORMU

Пример №	Дозировка [г/га]	HORMU
I-17	80	100
I-11	80	90
I-16	80	100
I-18	80	100
I-12	80	100
I-13	80	100
I-23	80	90
I-24	80	100
I-14	80	90
I-15	80	90
I-21	80	90
I-26	80	90
I-20	80	100
I-22	80	100
I-10	80	100
I-19	80	100

Как показывают результаты, соединения согласно изобретению, как, например, соединения № I-02 и другие соединения из табл. (I-05, I-10, I-11, I-12, I-13, I-14, I-15, I-16, I-17, I-18, I-19, I-20, I-21, I-22, I-23, I-24, I-25, 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 *Abutilon theophrasti*, *Alopecurus myosuroides*, *Amaranthus retroflexus*, *Avena fatua*, *Cyperus esculentus*, *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 против вредных растений 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 испытываемые растения находились в теплице, в оптимальных условия роста, визуально оценили действие препаратов, по сравнению с необработанной контрольной группой. Например, 100% действие = растения погибли, 0% действие = как контрольные растения.

Таблица С15

Гербицидное действие в % в послевсходовый период против ALOMY

Пример №	Дозировка [г/га]	ALOMY
I-23	320	90
I-19	320	90
I-18	320	90
I-20	320	100
I-12	320	90
I-21	320	90
I-28	320	90
I-24	320	100
I-29	320	90
I-22	320	100
I-26	320	100
I-16	320	90
I-13	320	90
I-14	320	90
I-15	320	100
I-05	320	90
I-17	320	90
I-27	320	90
I-11	320	90
I-25	320	100
I-10	320	100
I-04	320	90
I-02	320	100
I-03	320	80
I-06	320	90
I-08	320	90

Таблица С16

Гербицидное действие в % в послевсходовый период против AVEFA

Пример №	Дозировка [г/га]	AVEFA
I-23	320	100
I-19	320	90
I-18	320	90
I-20	320	100
I-12	320	100
I-21	320	100
I-28	320	100
I-24	320	100
I-29	320	90
I-22	320	100
I-26	320	100
I-13	320	90
I-14	320	80
I-15	320	100
I-05	320	80
I-17	320	90
I-27	320	100
I-11	320	90
I-25	320	90
I-10	320	90
I-04	320	100
I-02	320	90
I-03	320	90
I-06	320	90
I-08	320	80

Таблица С17

Гербицидное действие в % в послевсходовый период против ECHCG

Пример №	Дозировка [г/га]	ECHCG
I-23	320	90
I-19	320	90
I-18	320	90
I-20	320	100
I-12	320	90
I-21	320	90
I-28	320	90
I-24	320	100
I-29	320	90
I-22	320	100
I-26	320	100
I-16	320	90
I-13	320	90
I-14	320	80
I-15	320	90
I-05	320	90
I-17	320	80
I-27	320	100
I-11	320	90
I-10	320	90
I-04	320	80
I-02	320	80
I-03	320	80

Таблица С18

Гербицидное действие в % в послевсходовый период против LOLRI

Пример №	Дозировка [г/га]	LOLRI
I-23	320	100
I-19	320	90
I-18	320	90
I-20	320	100
I-12	320	90
I-21	320	90
I-28	320	100
I-24	320	100
I-29	320	90
I-22	320	100
I-26	320	100
I-16	320	90
I-13	320	90
I-14	320	90
I-15	320	90
I-17	320	90
I-27	320	90
I-11	320	90
I-25	320	100
I-10	320	90

Таблица С19

Гербицидное действие в % в послевсходовый период против SETVI

Пример №	Дозировка [г/га]	SETVI
I-23	320	80
I-19	320	90
I-18	320	90
I-20	320	90
I-21	320	90
I-28	320	90
I-24	320	80
I-29	320	90
I-22	320	90
I-26	320	80
I-16	320	80
I-13	320	90
I-15	320	80
I-05	320	80
I-17	320	90
I-27	320	80
I-11	320	90
I-25	320	80
I-10	320	90
I-04	320	90
I-02	320	90
I-03	320	90
I-06	320	80

Таблица С20

Гербицидное действие в % в послевсходовый период против ABUTH

Пример №	Дозировка [г/га]	ABUTH
I-23	320	80
I-19	320	90
I-18	320	90
I-20	320	80
I-12	320	80
I-21	320	90
I-28	320	80
I-24	320	80
I-29	320	90
I-22	320	80
I-26	320	80
I-16	320	80
I-13	320	80
I-14	320	90
I-15	320	80
I-05	320	80
I-11	320	80
I-25	320	80
I-02	320	80

Таблица С21

Гербицидное действие в % в послевсходовый период против AMARE

Пример №	Дозировка [г/га]	AMARE
I-23	320	80
I-19	320	90
I-18	320	90
I-20	320	90
I-12	320	80
I-21	320	90
I-28	320	80
I-24	320	80
I-29	320	90
I-22	320	90
I-26	320	80
I-16	320	90
I-13	320	80
I-14	320	80
I-05	320	80
I-17	320	90
I-25	320	80
I-10	320	80
I-03	320	80
I-06	320	80

Таблица С22

Гербицидное действие в % в послевсходовый период против РНВРУ

Пример №	Дозировка [г/га]	РНВРУ
I-23	320	80
I-19	320	90
I-18	320	90
I-20	320	90
I-12	320	80
I-21	320	90
I-28	320	90
I-24	320	90
I-29	320	90
I-22	320	90
I-26	320	90
I-16	320	80
I-13	320	80
I-14	320	80
I-15	320	80
I-05	320	80
I-17	320	80

040946

I-27	320	90
I-11	320	80
I-25	320	90
I-10	320	90
I-04	320	80
I-02	320	90
I-03	320	80
I-06	320	80
I-08	320	80
I-07	320	80
I-09	320	80

Таблица С23

Гербицидное действие в % в послевсходовый период против POLCO

Пример №	Дозировка [г/га]	POLCO
I-23	320	90
I-19	320	90
I-18	320	90
I-20	320	80
I-12	320	80
I-21	320	90
I-28	320	80
I-24	320	80
I-29	320	90
I-22	320	80
I-26	320	80
I-13	320	80
I-14	320	80
I-15	320	90
I-05	320	80
I-17	320	80
I-27	320	80
I-11	320	80
I-25	320	80
I-04	320	80
I-03	320	80
I-06	320	80
I-08	320	80
I-07	320	80

Таблица С24

Гербицидное действие в % в послевсходовый период против STEME

Пример №	Дозировка [г/га]	STEME
I-23	320	90
I-19	320	90
I-18	320	90
I-20	320	80
I-12	320	90
I-21	320	90
I-28	320	90
I-24	320	100
I-29	320	90
I-22	320	80
I-26	320	100
I-16	320	90
I-13	320	90
I-14	320	90
I-15	320	90
I-05	320	80
I-17	320	90
I-27	320	90
I-11	320	90
I-25	320	90
I-10	320	80
I-04	320	80
I-02	320	90
I-03	320	90
I-06	320	80

Таблица С25

Гербицидное действие в % в послевсходовый период против VIOTR

Пример №	Дозировка [г/га]	VIOTR
I-23	320	80
I-19	320	90
I-18	320	80
I-20	320	80
I-12	320	80
I-21	320	90
I-28	320	90
I-24	320	90
I-29	320	90
I-22	320	80
I-26	320	90
I-16	320	80
I-13	320	80
I-14	320	100
I-15	320	80
I-05	320	80
I-17	320	80
I-27	320	80
I-11	320	80
I-04	320	80
I-02	320	80
I-03	320	80

Таблица С26

Гербицидное действие в % в послевсходовый период против VERPE

Пример №	Дозировка [г/га]	VERPE
I-23	320	80
I-19	320	80
I-18	320	80
I-20	320	80
I-12	320	80
I-21	320	80
I-28	320	90
I-24	320	80
I-29	320	90
I-22	320	80
I-26	320	80
I-16	320	80
I-13	320	80
I-14	320	90
I-15	320	80
I-05	320	80
I-17	320	80
I-27	320	80
I-11	320	80
I-25	320	80
I-10	320	80
I-04	320	80
I-02	320	80
I-03	320	90
I-06	320	80
I-08	320	80

Таблица С27

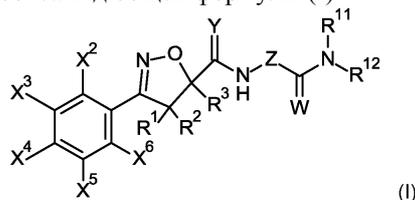
Гербицидное действие в % в послевсходовый период против НОРМУ

Пример №	Дозировка [г/га]	НОРМУ
I-23	320	100
I-19	320	90
I-18	320	90
I-20	320	100
I-12	320	90
I-21	320	100
I-28	320	90
I-24	320	100
I-29	320	90
I-22	320	100
I-26	320	100
I-16	320	80
I-13	320	90
I-14	320	80
I-15	320	90
I-17	320	80
I-27	320	100
I-25	320	90
I-10	320	90

Как показывают результаты, соединения согласно изобретению, как, например, соединения № I-02 и другие соединения из таблицы (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 *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 0.32 кг активного действующего вещества или менее на гектар.

ФОРМУЛА ИЗОБРЕТЕНИЯ

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



(I)

и его агрохимически приемлемые соли, в которых

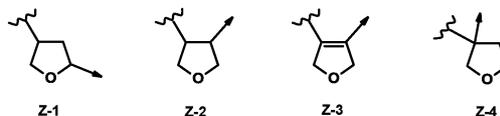
 R^1 и R^2 означают соответственно водород;

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 m остатками, выбранными из группы, состоящей из фтора, хлора, брома, циано, (C_1-C_2) алкокси и гидроксид;

Y означает кислород;

W означает кислород;

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

причем стрелка означает соответственно связь с группой $C=W$ формулы (I); R^{11} означает водород,

или

(C_1-C_3) алкил или (C_3-C_6) циклоалкил, которые замещены m остатками, выбранными из группы, состоящей из фтора и хлора;

R^{12} означает водород или циано,
или
 OR^7 , $S(O)_nR^5$, NR^6R^8 , $NR^6CO_2R^8$, (C_1-C_6) алкил, (C_3-C_6) циклоалкил, (C_2-C_3) алкенил или (C_2-C_3) алкинил, которые замещены m остатками, выбранными из группы, состоящей из фтора, хлора, брома, циано и гидроксид;

или
 R^{11} и R^{12} вместе с атомом азота, к которому они присоединены, образуют насыщенное, частично или полностью ненасыщенное пяти- или шестичленное кольцо, которое помимо указанного атома азота содержит g атомов углерода, n атомов кислорода и p элементов из группы, состоящей из NR^7 и $NCOR^7$, в качестве кольцевых атомов,

причем атом углерода несет p оксогрупп;

X^2 , X^4 и X^6 означают независимо друг от друга соответственно 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 m остатками, выбранными из группы, состоящей из фтора, хлора и брома;

R^5 означает (C_1-C_6) алкил, (C_3-C_6) циклоалкил или фенил, которые замещены m остатками из группы, состоящей из фтора, хлора и гидроксид;

R^6 означает водород или R^5 ;

R^7 означает водород,

или
 (C_1-C_6) алкил или (C_3-C_6) циклоалкил, которые замещены m остатками, выбранными из группы, состоящей из фтора, хлора и (C_1-C_2) алкокси;

R^8 означает водород,

или
 (C_1-C_6) алкил, (C_3-C_6) циклоалкил или фенил, которые замещены m остатками, выбранными из группы, состоящей из фтора, хлора и (C_1-C_2) алкокси;

m равен порядковому числу 0, 1, 2 или 3;

n равен порядковому числу 0, 1 или 2;

p равен порядковому числу 0 или 1; и

g равен порядковому числу 3, 4 или 5.

2. Соединение по п.1, отличающееся тем, что R^{12} означает гидроксид.

3. Средство, регулирующее рост растений, отличающееся тем, что оно содержит одно или более соединений общей формулы (I) или их соли по п.1 или 2.

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

5. Гербицидное средство по п.4, которое дополнительно содержит вспомогательное средство для препаративных форм.

6. Гербицидное средство по п.4 или 5, содержащее по меньшей мере одно дополнительное биологически активное вещество из группы инсектицидов, акарицидов, гербицидов, фунгицидов, защитных средств и/или регуляторов роста растений.

7. Гербицидное средство по одному из пп.4-6, содержащее защитное средство.

8. Гербицидное средство по п.7, причем защитное средство выбрано из группы, состоящей из метфенпир-диэтила, ципросульфамида, изоксадифен-этила, клоквинтосет-мексила, беноксакора и дихлорамида.

9. Способ борьбы с нежелательными растениями, отличающийся тем, что эффективное количество по меньшей мере одного соединения формулы (I) по п.1 или 2 или одного гербицидного средства по одному из пп.4-8 наносят на нежелательные растения или на место произрастания нежелательных растений.

10. Применение соединения формулы (I) по п.1 или 2 или гербицидного средства по одному из пп.4-8 для борьбы с нежелательными растениями.

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

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

