

(19)



Евразийское
патентное
ведомство

(21) 202193237 (13) A1

(12) ОПИСАНИЕ ИЗОБРЕТЕНИЯ К ЕВРАЗИЙСКОЙ ЗАЯВКЕ

(43) Дата публикации заявки
2022.07.07(51) Int. Cl. C07D 403/04 (2006.01)
C07D 401/14 (2006.01)
A01N 43/56 (2006.01)(22) Дата подачи заявки
2020.05.22

(54) ПИРАЗОЛ-ЗАМЕЩЕННЫЕ ПИРРОЛИДИНОНЫ В КАЧЕСТВЕ ГЕРБИЦИДОВ

(31) 62/852,971

(72) Изобретатель:

(32) 2019.05.24

Моррис Джеймс Алан, Макмахон

(33) US

Тревис Чендлер, Стивенсон Томас

(86) PCT/US2020/034232

Мартин, Кемпбелл Мэттью Джеймс,

(87) WO 2020/242946 2020.12.03

Нг Шон, Расселл Салли Элизабет (US)

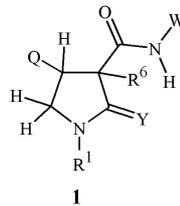
(71) Заявитель:

(74) Представитель:

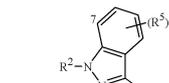
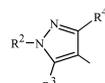
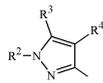
ФМК КОРПОРЕЙШН (US)

Медведев В.Н. (RU)

(57) В изобретении раскрыты соединения формулы 1, в том числе все их стереоизомеры, N-оксиды и соли



где Q выбран из группы, состоящей из



и R¹, R², R³, Y, R⁴, R⁵, n, R⁶, W и R⁹ раскрыты в данном документе. Также в данном документе раскрыты композиции, содержащие соединения формулы 1, и способы осуществления контроля нежелательной растительности, включающие приведение нежелательной растительности или ее среды произрастания в контакт с эффективным количеством соединения или композиции по настоящему изобретению.

A1

202193237

202193237

A1

ОПИСАНИЕ ИЗОБРЕТЕНИЯ

2420-572068EA/032

ПИРАЗОЛ-ЗАМЕЩЕННЫЕ ПИРРОЛИДИНОНЫ В КАЧЕСТВЕ ГЕРБИЦИДОВ ОБЛАСТЬ ТЕХНИКИ, К КОТОРОЙ ОТНОСИТСЯ ИЗОБРЕТЕНИЕ

Настоящее изобретение относится к определенным пиразол-замещенным пирролидинонам, их *N*-оксидам, солям и композициям и способам их применения для осуществления контроля нежелательной растительности.

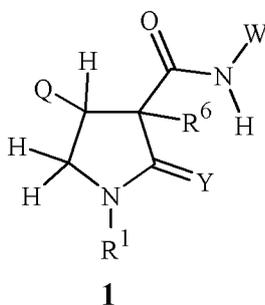
ПРЕДПОСЫЛКИ ИЗОБРЕТЕНИЯ

Контроль нежелательной растительности является чрезвычайно важным для достижения высокой продуктивности сельскохозяйственной культуры. Очень необходимо достичь селективного контроля роста сорняков, особенно в таких полезных сельскохозяйственных культурах, как, среди прочих, рис, соя, сахарная свекла, маис, картофель, пшеница, ячмень, томат и плантационные культуры. Бесконтрольный рост сорняков в таких полезных сельскохозяйственных культурах может обуславливать значительное снижение продуктивности и тем самым приводить к повышению стоимости для потребителя. Контроль нежелательной растительности на незасаемых территориях также является важным. Многие продукты являются коммерчески доступными для таких целей, но продолжает существовать необходимость в новых соединениях, которые являются более эффективными, менее дорогими, менее токсичными, более безопасными в отношении окружающей среды или которые характеризуются другими местами приложения действия.

В WO 2015/084796 и WO 2016/196593 раскрыты определенные замещенные циклические амиды и их применение в качестве гербицидов. Пиразол-замещенные пирролидиноны по настоящему изобретению не раскрыты в этих публикациях.

КРАТКОЕ ОПИСАНИЕ ИЗОБРЕТЕНИЯ

Настоящее изобретение направлено на соединение формулы **1**, включая все его стереоизомеры, *N*-оксиды и соли, композиции для применения в сельском хозяйстве, содержащие их, и их применение в качестве гербицидов,



где Q выбран из группы, состоящей из

изобретению (т. е. в гербицидно эффективном количестве) и по меньшей мере один компонент, выбранный из группы, состоящей из поверхностно-активных веществ, твердых разбавителей и жидких разбавителей. Настоящее изобретение дополнительно относится к способу осуществления контроля роста нежелательной растительности, включающему приведение растительности или ее среды произрастания в контакт с гербицидно эффективным количеством соединения по настоящему изобретению (например, в виде композиции, описанной в данном документе).

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

ПОДРОБНОЕ ОПИСАНИЕ ИЗОБРЕТЕНИЯ

Применяемые в данном документе термины "предусматривает", "предусматривающий", "включает", "включающий", "имеет", "имеющий", "содержит", "содержащий", "характеризуется" или любые другие их вариации предназначены охватывать неисключительное включение при условии, что какое-либо ограничение не указано явно. Например, композиция, смесь, процесс или способ, которые включают перечень элементов, не обязательно ограничен только этими элементами, а может включать другие элементы, явно не перечисленные или не свойственные для такой композиции, смеси, процесса или способа.

Переходная фраза "состоящий из" исключает любые неуказанные элемент, стадию или ингредиент. Если упомянутая фраза присутствует в пункте формулы изобретения, она будет ограничивать включение в пункт формулы изобретения материалов, отличных от тех, которые указаны, за исключением примесей, обычно связанных с ними. Если фраза "состоящий из" появляется в формулировке отличительной части формулы изобретения, а не непосредственно после вводной части, она ограничивает только элемент, представленный в этой формулировке; другие элементы в целом не исключаются из пункта формулы изобретения.

Переходная фраза "по сути состоящий из" применяется для определения композиции или способа, которые включают материалы, стадии, черты, компоненты или элементы в дополнение к тем, которые буквально раскрыты, при условии, что такие дополнительные материалы, стадии, черты, компоненты или элементы существенно не влияют на основную(основные) и новую(новые) характеристику(характеристики) заявленного изобретения. Термин "по сути состоящий из" занимает промежуточное положение между "содержащий" и "состоящий из".

При этом заявители определили изобретение или его часть с помощью неограничивающего термина, такого как "содержащий", следует уверенно понимать, что (если не указано иное) описание следует интерпретировать как такое, которое также описывает такое изобретение с применением терминов "по сути состоящий из" или "состоящий из".

Кроме того, если явно не указано иное, "или" относится к включающему или и не к исключаящему или. Например, условие А или В удовлетворяется любым из следующего: А является верным (или присутствует), а В является ложным (или не присутствует), А является ложным (или не присутствует), а В является верным (или присутствует), и оба А и В являются верными (или присутствуют).

Также, элемент или компонент по настоящему изобретению в форме единственного числа предусматривается как неограничивающий, независимо от количества представлений (т. е. появлений) элемента или компонента. Следовательно форму единственного числа следует читать как такую, которая включает один или по меньшей мере один, и форма единственного числа элемента или компонента также включает форму множественного числа, если количество очевидно не предусматривает форму единственного числа.

Указанный в данном документе термин "всходы", применяемый либо отдельно, либо в комбинации слов, означает раннюю стадию развития растения из зародыша семени.

Указанный в данном документе термин "широколиственный", применяемый либо отдельно, либо в словах, таких как "широколиственный сорняк", означает двудольное растение или двусемядольное растение, термин, применяемый для описания группы покрытосеменных растений, характеризующихся зародышем, содержащим две семядоли.

Применяемый в данном документе термин "алкилирующее средство" относится к химическому соединению, в котором углерод-содержащий радикал связан посредством атома углерода с уходящей группой, такой как галогенид или сульфонат, которая способна замещаться путем связывания нуклеофильного соединения с указанным атомом углерода. Если не указано иное, термин "алкилирующий" не ограничивает углерод-содержащий радикал алкилом; углерод-содержащие радикалы в алкилирующих средствах включают различные связанные с углеродом радикалы-заместители, указанные для R³ и R⁴.

В указанных выше перечислениях термин "алкил", применяемый либо отдельно, либо в составных словах, таких как "алкилтио" или "галогеналкил", включает алкил с прямой или разветвленной цепью, такой как метил, этил, *n*-пропил, *изо*пропил или разные изомеры бутила, пентила или гексила. "Алкенил" включает алкены с прямой или разветвленной цепью, такие как этенил, 1-пропенил, 2-пропенил и разные изомеры бутенила, пентенила и гексенила. "Алкенил" также включает полиены, такие как 1,3-бутадиенил и 2,4-гексадиенил. "Алкинил" включает алкины с прямой или разветвленной цепью, такие как этинил, 1-пропинил, 2-пропинил и разные изомеры бутинила, пентинила и гексинила. "Алкинил" может также включать фрагменты, содержащие несколько тройных связей, такие как 2,5-гексадиинил.

"Алкокси" включает, например, метокси, этокси, *n*-пропилокси, *изо*пропилокси и разные изомеры бутокси, пентокси и гексилокси. "Алкоксиалкил" обозначает замещение алкокси при алкиле. Примеры "алкоксиалкила" включают CH₃OCH₂, CH₃OCH₂CH₂, CH₃CH₂OCH₂, CH₃CH₂CH₂CH₂OCH₂ и CH₃CH₂OCH₂CH₂. "Алкенилокси" включает фрагменты алкенилокси с прямой или разветвленной цепью. Примеры "алкенилокси"

включают $\text{H}_2\text{C}=\text{CHCH}_2\text{O}$, $(\text{CH}_3)_2\text{C}=\text{CHCH}_2\text{O}$, $(\text{CH}_3)\text{CH}=\text{CHCH}_2\text{O}$, $(\text{CH}_3)\text{CH}=\text{C}(\text{CH}_3)\text{CH}_2\text{O}$ и $\text{CH}_2=\text{CHCH}_2\text{CH}_2\text{O}$. "Алкинилокси" включает фрагменты алкинилокси с прямой или разветвленной цепью. Примеры "алкинилокси" включают $\text{HC}\equiv\text{CCH}_2\text{O}$, $\text{CH}_3\text{C}\equiv\text{CCH}_2\text{O}$ и $\text{CH}_3\text{C}\equiv\text{CCH}_2\text{CH}_2\text{O}$. "Алкилтио" включает фрагменты алкилтио с разветвленной или прямой цепью, такие как метилтио, этилтио и разные изомеры пропилтио, бутилтио, пентилтио и гексилтио. "Алкилсульфинил" включает оба энантиомера алкилсульфинильной группы. Примеры "алкилсульфинила" включают $\text{CH}_3\text{S}(\text{O})-$, $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{S}(\text{O})-$, $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{CH}_2\text{S}(\text{O})-$, $(\text{CH}_3)_2\text{CHS}(\text{O})-$ и разные изомеры бутилсульфинила, пентилсульфинила и гексилсульфинила. Примеры "алкилсульфонила" включают $\text{CH}_3\text{S}(\text{O})_2-$, $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{S}(\text{O})_2-$, $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{CH}_2\text{S}(\text{O})_2-$, $(\text{CH}_3)_2\text{CHS}(\text{O})_2-$ и разные изомеры бутилсульфонила, пентилсульфонила и гексилсульфонила. "Алкиламино", "диалкиламино" и т. п. определены аналогично указанным выше примерам.

"Циклоалкил" включает, например, циклопропил, циклобутил, циклопентил и циклогексил. Термин "алкилциклоалкил" обозначает замещение алкилом при циклоалкильном фрагменте и включает, например, этилциклопропил, *изо*пропилциклобутил, 3-метилциклопентил и 4-метилциклогексил. Термин "циклоалкилалкил" обозначает замещение циклоалкилом при алкильном фрагменте. Примеры "циклоалкилалкила" включают циклопропилметил, циклопентилэтил и другие циклоалкильные фрагменты, связанные с алкильными группами с прямой или разветвленной цепью. Термин "циклоалкокси" обозначает циклоалкил, присоединенный посредством атома кислорода, такой как циклопентилокси и циклогексилокси. "Циклоалкилалкокси" обозначает циклоалкилалкил, присоединенный посредством атома кислорода, присоединенного к алкильной цепи. Примеры "циклоалкилалкокси" включают циклопропилметокси, циклопентилэтокси и другие циклоалкильные фрагменты, связанные с алкоксигруппами с прямой или разветвленной цепью.

Термин "галоген" либо отдельно, либо в составных словах, таких как "галогеналкил", или если применяется в описаниях, таких как "алкил, замещенный галогеном", включает фтор, хлор, бром или йод. Кроме того, если применяется в составных словах, таких как "галогеналкил", или если применяется в описаниях, таких как "алкил, замещенный галогеном", указанный алкил может быть частично или полностью замещен атомами галогена, которые могут быть одинаковыми или разными. Примеры "галогеналкила" или "алкила, замещенного галогеном" включают F_3C , ClCH_2 , CF_3CH_2 и CF_3CCl_2 . Термины "галогенциклоалкил", "галогеналкокси", "галогеналкилтио", "галогеналкилсульфинил", "галогеналкилсульфонил", "галогеналкенил", "галогеналкинил" и т. п. определены аналогично термину "галогеналкил". Примеры "галогенциклоалкила" включают 2-хлорциклопропил и 2-бромциклобутил. Примеры "галогеналкокси" включают $\text{CF}_3\text{O}-$, $\text{CCl}_3\text{CH}_2\text{O}-$, $\text{HCF}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{O}-$ и $\text{CF}_3\text{CH}_2\text{O}-$. Примеры "галогеналкилтио" включают $\text{CCl}_3\text{S}-$, $\text{CF}_3\text{S}-$, $\text{CCl}_3\text{CH}_2\text{S}-$ и $\text{ClCH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{S}-$. Примеры "галогеналкилсульфинила" включают $\text{CF}_3\text{S}(\text{O})-$, $\text{CCl}_3\text{S}(\text{O})-$, $\text{CF}_3\text{CH}_2\text{S}(\text{O})-$ и $\text{CF}_3\text{CF}_2\text{S}(\text{O})-$. Примеры "галогеналкилсульфонила" включают $\text{CF}_3\text{S}(\text{O})_2-$, $\text{CCl}_3\text{S}(\text{O})_2-$, $\text{CF}_3\text{CH}_2\text{S}(\text{O})_2-$ и $\text{CF}_3\text{CF}_2\text{S}(\text{O})_2-$.

Примеры "галогеналкенила" включают $(\text{Cl})_2\text{C}=\text{CHCH}_2-$ и $\text{CF}_3\text{CH}_2\text{CH}=\text{CHCH}_2-$. Примеры "галогеналкинила" включают $\text{HC}\equiv\text{CCHCl}-$, $\text{CF}_3\text{C}\equiv\text{C}-$, $\text{CCl}_3\text{C}\equiv\text{C}-$ и $\text{FCH}_2\text{C}\equiv\text{CCH}_2-$.

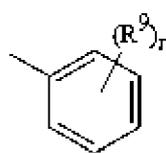
"Алкилкарбонил" обозначает алкильные фрагменты с прямой или разветвленной цепью, связанные с фрагментом $\text{C}(=\text{O})$. Примеры "алкилкарбонила" включают $\text{CH}_3\text{C}(=\text{O})-$, $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{CH}_2\text{C}(=\text{O})-$ и $(\text{CH}_3)_2\text{CHC}(=\text{O})-$. Примеры "алкоксикарбонила" включают $\text{CH}_3\text{OC}(=\text{O})-$, $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{OC}(=\text{O})-$, $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{CH}_2\text{OC}(=\text{O})-$, $(\text{CH}_3)_2\text{CHOC}(=\text{O})-$ и разные изомеры бутокси- или пентоксикарбонила.

Общее число атомов углерода в группе-заместителе указано префиксом " $\text{C}_i\text{-C}_j$ ", где i и j представляют собой числа от 1 до 8. Например, $\text{C}_1\text{-C}_4$ алкилсульфонил обозначает метилсульфонил-бутилсульфонил; C_2 алкоксиалкил обозначает CH_3OCH_2- ; C_3 алкоксиалкил обозначает, например, $\text{CH}_3\text{CH}(\text{OCH}_3)-$, $\text{CH}_3\text{OCH}_2\text{CH}_2-$ или $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{OCH}_2-$; и C_4 алкоксиалкил обозначает разные изомеры алкильной группы, замещенной алкоксигруппой, в общем содержащей четыре атома углерода, при этом примеры включают $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{CH}_2\text{OCH}_2-$ и $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{OCH}_2\text{CH}_2-$.

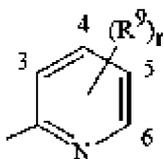
Если соединение замещено заместителем, несущим нижний индекс, который указывает на число указанных заместителей, которое может превышать 1, указанные заместители (если их количество превышает 1) независимо выбраны из группы определенных заместителей, например, $([\text{R}^{(5)}]_n)$, n равняется 1, 2, 3 или 4). Если группа содержит заместитель, который может представлять собой водород, например (R^1 или R^4), то, если данный заместитель принимается как водород, следует понимать, что это является эквивалентным указанной группе, которая является незамещенной. Термин "необязательно замещенный" по отношению к фенилу или пиридилу относится к группе, которая является незамещенной или содержит по меньшей мере один заместитель, отличный от водорода, который не устраняет биологическую активность, проявляемую незамещенным аналогом. Будут применяться следующие применяемые в данном документе определения, если не указано иное. Термин "необязательно замещенный" применяется взаимозаменяемо с фразой "замещенный или незамещенный" или с термином "(не)замещенный". Если не указано иное, необязательно замещенная группа, может содержать заместитель при каждом замещаемом положении группы, и при этом каждое замещение является независимым от другого.

Как указано выше, W может представлять собой фенил или пиридил, при этом каждый фенил или пиридил необязательно замещен не более 5 R^9 . Примеры фенила или пиридила включают следующее.

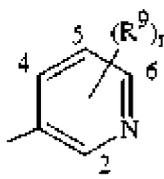
Приложение 1



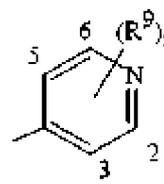
U-1



U-49



U-50



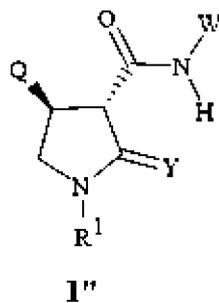
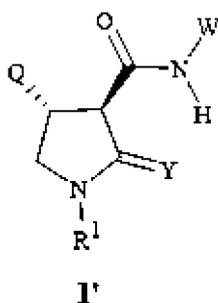
U-51

Хотя группы R⁹ и показаны в структурах U-1, U-49, U-50 и U-51, следует отметить, что их присутствие не является необходимым, поскольку они являются необязательными заместителями. Следует указать, что если точка присоединения между (R⁹)_r и группой U проиллюстрирована как плавающая, (R⁹)_r может быть присоединен к любому доступному атому углерода группы U.

В уровне техники известно широкое разнообразие способов синтеза для обеспечения получения ароматических и неароматических гетероциклических колец и кольцевых систем; для содержательного обзора см. сборник из восьми томов *Comprehensive Heterocyclic Chemistry*, A. R. Katritzky and C. W. Rees editors-in-chief, Pergamon Press, Oxford, 1984 и сборник из двенадцати томов *Comprehensive Heterocyclic Chemistry II*, A. R. Katritzky, C. W. Rees and E. F. V. Scriven editors-in-chief, Pergamon Press, Oxford, 1996.

Соединения по настоящему изобретению могут существовать в виде одного или нескольких стереоизомеров. Разные стереоизомеры включают энантимеры, диастереомеры, атропоизомеры и геометрические изомеры. Стереоизомеры представляют собой изомеры идентичного состава, но отличающиеся конфигурацией их атомов в пространстве, и включают энантимеры, диастереомеры, цис-транс-изомеры (также известные как геометрические изомеры) и атропоизомеры. Атропоизомеры образуются вследствие ограниченного вращения вокруг одинарной связи, где вращательный барьер является достаточно высоким, чтобы позволять выделение изомерных соединений. Специалист в данной области поймет, что один стереоизомер может быть более активным и/или может проявлять благоприятные эффекты при обогащении относительно другого(других) стереоизомера(стереоизомеров) или при отделении от другого(других) стереоизомера(стереоизомеров). Кроме того, специалисту в данной области известно, как разделять, обогащать и/или селективно получать указанные стереоизомеры. Соединения по настоящему изобретению могут находиться в виде смеси стереоизомеров, отдельных стереоизомеров или в виде оптически активной формы.

Например, как показано далее, фрагмент C(O)NH(W), связанный с углеродом в 3-положении кольца пирролидинона, и Q, связанный с углеродом в 4-положении кольца, в общем обнаруживаются в *транс*-конфигурации. Оба из таких двух атомов углерода обладают хиральным центром. Наиболее распространенная пара энантимеров изображена как формула 1' и формула 1". В то время, как настоящее изобретение относится ко всем стереоизомерам, предпочтительный энантиомер для обеспечения биологической действенности идентифицирован как формула 1' (также называемый в данном документе как (3*S*,4*R*) или "*S*, *R*" в колонке "стерео (3,4)" таблицы индексов А), где амидный фрагмент (т. е. C(O)NH(W)) выступает по направлению к смотрящему, и фрагмент Q выступает по направлению от смотрящего. Для исчерпывающего разбора всех аспектов стереоизомерии см. Ernest L. Eliel and Samuel H. Wilen, *Stereochemistry of Organic Compounds*, John Wiley & Sons, 1994.



Изображения молекул, изображенные в данном документе, соответствуют стандартным условным обозначениям для изображения стереохимии. Для указания стереоконфигурации связи, возвышающиеся с плоскости изображения и по направлению к смотрящему, обозначены с помощью сплошных клинообразных линий, где широкий конец клинообразной линии присоединен к атому, возвышающемуся от плоскости изображения по направлению к смотрящему. Связи, направленные под плоскость изображения и по направлению от смотрящего, обозначены пунктирными клинообразными линиями, где узкий конец клинообразной линии присоединен к атому, отдаленному от смотрящего. Линии с постоянной шириной указывают на связи с противоположным или нейтральным направлением относительно связей, показанных с помощью сплошных или пунктирных клинообразных линий; линии с постоянной шириной также изображают связи в молекулах или частях молекул, в которых не предусмотрено указание конкретной стереоконфигурации.

В настоящем изобретении предусмотрены рацемические смеси, например равные количества энантиомеров формулы **1'** и **1''**. Кроме того, в настоящее изобретение включены соединения, которые обогащены энантиомером формулы **1** по сравнению с рацемической смесью. Также включены по сути чистые энантиомеры соединений формулы **1**, например формулы **1'** и формулы **1''**.

В случае энантиомерного обогащения, один энантиомер присутствует в больших количествах, чем другой, и степень обогащения может быть определена выражением энантиомерный избыток ("ee"), который определяется как $(2x-1) \cdot 100\%$, где x представляет собой молекулярная доля превалирующего энантиомера в смеси (например, ee 20% соответствует соотношению энантиомеров 60:40).

Предпочтительно композиции по настоящему изобретению характеризуются энантиомерным избытком, составляющим по меньшей мере 50%; более предпочтительно энантиомерным избытком, составляющим по меньшей мере 75%; еще более предпочтительно энантиомерным избытком, составляющим по меньшей мере 90%; и наиболее предпочтительно энантиомерным избытком, составляющим по меньшей мере 94% (ee >99%) более активного изомера. Отдельно стоит отметить по сути энантиомерно чистые варианты осуществления более активного изомера.

Соединения формулы **1** могут содержать дополнительные хиральные центры. Например, заместители и другие молекулярные составляющие, такие как R^2 и R^3 , сами по себе могут содержать хиральные центры. В настоящем изобретении предусмотрены

рацемические смеси, а также обогащенные и по сути чистые стереоконфигурации при таких дополнительных хиральных центрах.

Соединения по настоящему изобретению могут существовать в виде одного или нескольких конформационных изомеров вследствие ограниченного вращения вокруг амидной связи (например, $C(O)NH(W)$) в формуле 1. В настоящем изобретении предусмотрены смеси конформационных изомеров. Кроме того, настоящее изобретение включает соединения, которые обогащены одним конформером относительно другого.

Соединения формулы 1 как правило существуют в более чем одной форме, и формула 1 таким образом включает все кристаллические и некристаллические формы соединений, которые они представляют. Некристаллические формы включают варианты осуществления, которые представляют собой твердые вещества, такие как виды воска и смолы, а также варианты осуществления, которые представляют собой жидкости, такие как растворы и расплавы. Кристаллические формы включают варианты осуществления, которые представляют по сути монокристаллический тип, и варианты осуществления, которые представляет собой смесь полиморфов (т. е. разных кристаллических типов). Термин "полиморф" относится к конкретной кристаллической форме химического соединения, которое может кристаллизоваться в разные кристаллические формы, при этом такие формы характеризуются разными группировками и/или конформациями молекул в кристаллической решетке. Хотя полиморфы могут иметь одинаковую химическую композицию, они также могут отличаться в отношении композиции вследствие присутствия или отсутствия сокристаллизованной воды или других молекул, которые могут быть слабо или сильно связаны в решетке. Полиморфы могут отличаться в отношении химических, физических и биологических свойств, таких как кристаллическая форма, плотность, твердость, цвет, химическая стабильность, точка плавления, гигроскопичность, суспензируемость, скорость растворения и биологическая доступность. Специалист в данной области поймет, что конкретный полиморф соединения формулы 1 может проявлять благоприятные эффекты (например, пригодность для получения применимых составов, улучшенная биологическая эффективность) по сравнению с другим полиморфом или смесью полиморфов того же соединения формулы 1. Получения и выделения конкретного полиморфа соединения формулы 1 можно достичь с помощью способов, известных специалистам в данной области, в том числе, например, кристаллизации с применением выбранных растворителей и температур. Для исчерпывающего разбора полиморфизма см. R. Hilfiker, Ed., *Polymorphism in the Pharmaceutical Industry*, Wiley-VCH, Weinheim, 2006.

Специалист в данной области поймет, что не все азот-содержащие гетероциклы способны образовывать *N*-оксиды, поскольку азот требует доступную неподеленную пару для окисления до оксида; специалист в данной области отличит те азот-содержащие гетероциклы, которые способны образовывать *N*-оксиды. Специалист в данной области также отличит те третичные амины, которые способны образовывать *N*-оксиды. Способы синтеза для получения *N*-оксидов гетероциклов и третичных аминов очень широко известны специалисту в данной области, в том числе окисление гетероциклов и третичных

аминов с помощью пероксикислот, таких как перуксусная и *m*-хлорнадбензойная кислота (MCPBA), пероксида водорода, алкилгидропероксидов, таких как *трет*-бутилгидропероксид, пербората натрия и диоксиранов, таких как диметилдиоксиран. Такие способы получения *N*-оксидов были содержательно описаны и рассмотрены в литературе, см., например, T. L. Gilchrist в *Comprehensive Organic Synthesis*, том 7, стр. 748-750, S. V. Ley, Ed., Pergamon Press; M. Tisler и B. Stanovnik в *Comprehensive Heterocyclic Chemistry*, том 3, стр. 18-20, A. J. Boulton и A. McKillop, Eds., Pergamon Press; M. R. Grimmett и B. R. T. Keene в *Advances in Heterocyclic Chemistry*, том 43, стр. 149-161, A. R. Katritzky, Ed., Academic Press; M. Tisler и B. Stanovnik в *Advances in Heterocyclic Chemistry*, том 9, стр. 285-291, A. R. Katritzky и A. J. Boulton, Eds., Academic Press; и G. W. H. Cheeseman и E. S. G. Werstiuk в *Advances in Heterocyclic Chemistry*, том 22, стр. 390-392, A. R. Katritzky и A. J. Boulton, Eds., Academic Press.

Специалист в данной области понимает, что поскольку в окружающей среде и в физиологических условиях соли химических соединений находятся в равновесии с их соответствующими несолевыми формами, при этом соли демонстрируют биологическую полезность несолевых форм. Таким образом, широкое разнообразие солей соединения формулы **1** применимы для контроля нежелательной растительности (т. е. являются подходящими с точки зрения сельского хозяйства). Соли соединения формулы **1** включают соли присоединения кислот с неорганическими или органическими кислотами, такими как бромистоводородная, хлористоводородная, азотная, фосфорная, серная, уксусная, масляная, фумаровая, молочная, малеиновая, малоновая, щавелевая, пропионовая, салициловая, винная, 4-толуолсульфоновая или валериановая кислоты. Если соединение формулы **1** содержит кислотный фрагмент, такой как карбоновая кислота или фенол, соли также включают такие, которые образованы с органическими или неорганическими основаниями, такими как пиридин, триэтиламин, или аммиак, или амиды, гидриды, гидроксиды или карбонаты натрия, калия, лития, кальция, магния или бария. Соответственно, в настоящем изобретении предусмотрены соединения, выбранные из формулы **1**, их *N*-оксидов и подходящих с точки зрения сельского хозяйства солей.

Варианты осуществления настоящего изобретения, описанные в кратком описании изобретения, включают (т. е. где формула **1**, как применяется в следующих вариантах осуществления, включает *ее N*-оксиды и соли) следующее.

Вариант осуществления 1. Соединение формулы **1**, описанное в кратком описании настоящего изобретения.

Вариант осуществления 2. Соединение по варианту осуществления 1, где Q выбран из группы, состоящей из Q-1 и Q-2.

Вариант осуществления 3. Соединение по варианту осуществления 1, где Q представляет собой Q-1.

Вариант осуществления 4. Соединение по любому из вариантов осуществления 1-3, где Y представляет собой O.

Вариант осуществления 5. Соединение по любому из вариантов осуществления 1-4,

где R^1 представляет собой H, C_1 - C_6 алкил, C_1 - C_6 галогеналкил или C_4 - C_8 циклоалкилалкил.

Вариант осуществления 6. Соединение по варианту осуществления 5, где R^1 представляет собой H, C_1 - C_4 алкил или C_4 - C_5 циклоалкилалкил.

Вариант осуществления 7. Соединение по варианту осуществления 6, где R^1 представляет собой H, CH_3 или циклопропилметил.

Вариант осуществления 8. Соединение по варианту осуществления 7, где R^1 представляет собой H или CH_3 .

Вариант осуществления 9. Соединение по варианту осуществления 8, где R^1 представляет собой CH_3 .

Вариант осуществления 10. Соединение по любому из вариантов осуществления 1-9, где R^2 представляет собой C_1 - C_3 алкил или C_1 - C_3 галогеналкил.

Вариант осуществления 11. Соединение по любому из вариантов осуществления 1-10, где R^2 представляет собой C_1 - C_2 алкил или C_1 - C_2 галогеналкил.

Вариант осуществления 12. Соединение по варианту осуществления 11, где R^2 представляет собой CH_3 или CH_2CF_3 .

Вариант осуществления 13. Соединение по варианту осуществления 12, где R^2 представляет собой CH_3 .

Вариант осуществления 14. Соединение по любому из вариантов осуществления 1-13, где R^3 представляет собой галоген, C_1 - C_6 алкил или C_1 - C_6 галогеналкил.

Вариант осуществления 15. Соединение по варианту осуществления 14, где R^3 представляет собой галоген, C_1 - C_3 алкил или C_1 - C_3 галогеналкил.

Вариант осуществления 16. Соединение по варианту осуществления 15, где R^3 представляет собой Cl, CH_3 или CF_3 .

Вариант осуществления 17. Соединение по варианту осуществления 16, где R^3 представляет собой CH_3 или CF_3 .

Вариант осуществления 18. Соединение по варианту осуществления 17, где R^3 представляет собой CF_3 .

Вариант осуществления 19. Соединение по любому из вариантов осуществления 1-18, где R^4 представляет собой H или Cl.

Вариант осуществления 20. Соединение по варианту осуществления 19, где R^4 представляет собой H.

Вариант осуществления 21. Соединение по любому из вариантов осуществления 1-20, где R^5 представляет собой F, Cl или Br.

Вариант осуществления 22. Соединение по варианту осуществления 21, где R^5 представляет собой F или Cl.

Вариант осуществления 23. Соединение по варианту осуществления 22, где R^5 представляет собой F.

Вариант осуществления 24. Соединение по любому из вариантов осуществления 1-23, где R^6 представляет собой H, галоген, гидроксильная группа, C_1 - C_4 алкокси или C_1 - C_4 алкил.

Вариант осуществления 25. Соединение по варианту осуществления 24, где R^6

представляет собой H, Cl, гидроксигруппы, OCH₃ или CH₃.

Вариант осуществления 26. Соединение по варианту осуществления 25, где R⁶ представляет собой H.

Вариант осуществления 27. Соединение по варианту осуществления 25, где R⁶ представляет собой Cl.

Вариант осуществления 28. Соединение по варианту осуществления 25, где R⁶ представляет собой гидроксигруппы.

Вариант осуществления 29. Соединение по варианту осуществления 25, где R⁶ представляет собой OCH₃.

Вариант осуществления 30. Соединение по варианту осуществления 25, где R⁶ представляет собой CH₃.

Вариант осуществления 31. Соединение по любому из вариантов осуществления 21-30, где n равняется 1, 2 или 3.

Вариант осуществления 32. Соединение по варианту осуществления 31, где n равняется 1 или 2.

Вариант осуществления 33. Соединение по варианту осуществления 32, где n равняется 1.

Вариант осуществления 34. Соединение по любому из вариантов осуществления 1-33, где W представляет собой фенил, 3-пиридил или 4-пиридил, при этом каждый из фенила, 3-пиридила или 4-пиридила необязательно замещен не более 4 R⁹.

Вариант осуществления 35. Соединение по варианту осуществления 34, где W представляет собой фенил или 3-пиридил, при этом каждый из фенила или 3-пиридила необязательно замещен не более 3 R⁹.

Вариант осуществления 36. Соединение по варианту осуществления 35, где W представляет собой фенил, замещенный не более 3 R⁹.

Вариант осуществления 37. Соединение по любому из вариантов осуществления 1-36, где каждый R⁹ независимо представляет собой галоген, циано, нитро, C₁-C₄алкил, C₁-C₄галогеналкил, C₂-C₄алкоксиалкил, C₂-C₄галогеналкоксиалкил, C₃-C₄циклоалкил, C₃-C₄галогенциклоалкил, циклопропилметил, метилциклопропил, C₁-C₄алкокси, C₁-C₄галогеналкокси, C₃-C₄циклоалкокси, C₁-C₄алкилтио, C₁-C₄галогеналкилтио, C₁-C₄алкилсульфинил, C₁-C₄галогеналкилсульфинил, C₁-C₄алкилсульфонил, C₁-C₄галогеналкилсульфонил, гидроксигруппы, формил, C₂-C₄алкилкарбонил, C₂-C₄алкилкарбонилокси, C₁-C₄алкилсульфонилокси, C₁-C₄галогеналкилсульфонилокси.

Вариант осуществления 38. Соединение по варианту осуществления 37, где каждый R⁹ независимо представляет собой галоген, циано, нитро, C₁-C₄алкил, C₁-C₄галогеналкил, C₁-C₄алкокси, C₁-C₄алкилтио, C₁-C₄алкилсульфинил или C₁-C₄алкилсульфонил.

Вариант осуществления 39. Соединение по варианту осуществления 38, где каждый R⁹ независимо представляет собой галоген, C₁-C₄алкил, C₁-C₄галогеналкил или C₁-C₄алкилсульфонил.

Вариант осуществления 40. Соединение по варианту осуществления 39, где каждый

R⁹ независимо представляет собой F, Cl, CH₃, CF₃ или SO₂CH₃.

Вариант осуществления 41. Соединение по варианту осуществления 40, где каждый R⁹ независимо представляет собой F или CF₃.

Вариант осуществления 42. Соединение по любому из вариантов осуществления 34-41, где R⁹ находится в *орто*-, *мета*- или *пара*-положении по отношению к W (относительно связи с остальной частью формулы 1).

Вариант осуществления 43. Соединение по любому из вариантов осуществления 34-41, где R⁹ находится в *орто*- и *мета*-положении по отношению к W (относительно связи с остальной частью формулы 1).

Вариант осуществления 44. Соединение по краткому описанию изобретения, где если R¹ представляет собой C₁-C₆алкил, то R² представляет собой C₁-C₆галогеналкил.

Конкретный вариант осуществления настоящего изобретения представляет собой соединение формулы 1, где Y представляет собой O; R¹ представляет собой CH₃; Q представляет собой Q-1; R² представляет собой CH₃; R³ представляет собой CF₃; R⁴ представляет собой H; W представляет собой фенил, замещенный 1 R⁹ при 2-положении и 1 R⁹ при 3-положении; при этом оба R⁹ независимо представляют собой F; и R⁶ представляет собой H.

Настоящее изобретение также включает гербицидную смесь, содержащую (a) соединение, выбранное из соединения формулы 1, его N-оксидов и солей (описанных в кратком описании изобретения), и (b) по меньшей мере один дополнительный активный ингредиент, выбранный из (b1) ингибиторов фотосистемы II, (b2) ингибиторов синтазы ацетогидроксикислоты (AHAS), (b3) ингибиторов ацетил-CoA-карбоксилазы (ACCase), (b4) имитаторов ауксинов, (b5) ингибиторов синтазы 5-енол-пирувилшикимат-3-фосфата (EPSP), (b6) диверторов электронов фотосистемы I, (b7) ингибиторов протопорфириногенаоксидазы (PPO), (b8) ингибиторов синтетазы глутамина (GS), (b9) ингибиторов элонгазы жирных кислот с очень длинной цепью (VLCFA), (b10) ингибиторов транспорта ауксинов, (b11) ингибиторов фитоендесатуразы (PDS), (b12) ингибиторов 4-гидроксифенил-пируватдиоксигеназы (HPPD), (b13) ингибиторов гомогентизатсоланезилтрансферазы (HST), (b14) ингибиторов биосинтеза целлюлозы, (b15) других гербицидов, в том числе средств, прерывающих митоз, органических соединений, содержащих мышьяк, асулама, бромобутида, цинметилина, кумилурона, дазомета, 2-[(2,5-дихлорфенил)метил]-4,4-диметил-3-изоксазолидинона, дифензоквата, димрона, этобензанида, флуренола, фосамина, фосамин-аммония, гидантоцидина, метама, метилдимрона, олеиновой кислоты, оксазикломефона, пеларгоновой кислоты и пирибутикарба, (b16) антидотов гербицидов и солей соединений (b1) - (b16).

Варианты осуществления данного изобретения, в том числе варианты осуществления 1-44, а также любые другие варианты осуществления, описанные в данном документе, можно объединять любым образом, и описания переменных в вариантах осуществления касаются не только соединений формулы 1, а также промежуточных соединений, применимых для получения соединений формулы 1. Комбинации вариантов

осуществления 1-44 проиллюстрированы следующим образом.

Вариант осуществления А. Соединение формулы 1, где

R^1 представляет собой H, C_1 - C_6 алкил, C_1 - C_6 галогеналкил или C_4 - C_8 циклоалкилалкил;

R^2 представляет собой C_1 - C_3 алкил или C_1 - C_3 галогеналкил;

R^3 представляет собой галоген, C_1 - C_6 алкил или C_1 - C_6 галогеналкил;

Y представляет собой O;

R^4 представляет собой H или Cl;

R^5 представляет собой F, Cl или Br;

n равняется 1, 2 или 3;

R^6 представляет собой H, галоген, гидроксигруппа, C_1 - C_4 алкокси или C_1 - C_4 алкил;

W представляет собой фенил, 3-пиридил или 4-пиридил, при этом каждый из фенила, 3-пиридила или 4-пиридила необязательно замещен не более 4 R^9 ; и

каждый R^9 независимо представляет собой галоген, циано, нитро, C_1 - C_4 алкил, C_1 - C_4 галогеналкил, C_2 - C_4 алкоксиалкил, C_2 - C_4 галогеналкоксиалкил, C_3 - C_4 циклоалкил, C_3 - C_4 галогенциклоалкил, циклопропилметил, метилциклопропил, C_1 - C_4 алкокси, C_1 - C_4 галогеналкокси, C_3 - C_4 циклоалкокси, C_1 - C_4 алкилтио, C_1 - C_4 галогеналкилтио, C_1 - C_4 алкилсульфинил, C_1 - C_4 галогеналкилсульфинил, C_1 - C_4 алкилсульфонил, C_1 - C_4 галогеналкилсульфонил, гидроксигруппа, формил, C_2 - C_4 алкилкарбонил, C_2 - C_4 алкилкарбонилокси, C_1 - C_4 алкилсульфонилокси, C_1 - C_4 галогеналкилсульфонилокси.

Вариант осуществления В. Соединение по варианту осуществления А, где

Q выбран из группы, состоящей из Q-1 и Q-2;

R^1 представляет собой H, C_4 - C_5 циклоалкилалкил или C_1 - C_4 алкил;

R^2 представляет собой C_1 - C_2 алкил или C_1 - C_2 галогеналкил;

R^3 представляет собой галоген, C_1 - C_3 алкил или C_1 - C_3 галогеналкил;

R^4 представляет собой H;

n равняется 1 или 2;

R^6 представляет собой H, Cl, гидроксигруппа, OCH_3 или CH_3 ;

W представляет собой фенил или 3-пиридил, при этом каждый из фенила или 3-пиридила необязательно замещен не более 3 R^9 ; и

каждый R^9 независимо представляет собой галоген, циано, нитро, C_1 - C_4 алкил, C_1 - C_4 галогеналкил, C_1 - C_4 алкокси, C_1 - C_4 алкилтио, C_1 - C_4 алкилсульфинил или C_1 - C_4 алкилсульфонил.

Вариант осуществления С. Соединение по варианту осуществления В, где

Q представляет собой Q-1;

R^1 представляет собой H, циклопропилметил или CH_3 ;

R^2 представляет собой CH_3 или CH_2CF_3 ;

R^3 представляет собой Cl, CH_3 или CF_3 ;

R^6 представляет собой H;

W представляет собой фенил, замещенный не более 3 R^9 ; и

каждый R⁹ независимо представляет собой галоген, C₁-C₄алкил, C₁-C₄галогеналкил или C₁-C₄алкилсульфонил.

Вариант осуществления D. Соединение по варианту осуществления C, где

R¹ представляет собой H или CH₃;

R² представляет собой CH₃;

R³ представляет собой CH₃ или CF₃;

R⁶ представляет собой H;

каждый R⁹ независимо представляет собой F или CF₃; и

R⁹ находится в *орто*-, *мета*- или *пара*-положении по отношению к W (относительно связи с остальной частью формулы 1).

Конкретный вариант осуществления представляет собой соединение формулы 1, которое представляет собой

(3*S*,4*R*)-*N*-(2,3-дифторфенил)-1-метил-4-[1-метил-5-(трифторметил)-1*H*-пиразол-3-ил]-2-оксо-3-пирролидинкарбоксамид.

Настоящее изобретение также относится к способу осуществления контроля нежелательной растительности, включающему применение в отношении участка растительности гербицидно эффективных количеств соединений по настоящему изобретению (например, в виде композиции, описанной в данном документе). Как варианты осуществления, относящиеся к способам применения, стоит отметить такие, в которые вовлечены соединения по вариантам осуществления, описанным выше. Соединения по настоящему изобретению, в частности, являются применимыми для селективного контроля сорняков в сельскохозяйственных культурах, таких как пшеница, ячмень, маис, соя, подсолнечник, хлопок, масличный рапс и рис, и сельскохозяйственных культурах специального назначения, таких как сахарный тростник, цитрусовые, плодовые и орехоплодные сельскохозяйственные культуры.

Также в качестве вариантов осуществления следует отметить гербицидные композиции по настоящему изобретению, содержащие соединения по вариантам осуществления, описанным выше.

Настоящее изобретение также включает гербицидную смесь, содержащую (a) соединение, выбранное из соединения формулы 1, его *N*-оксидов и солей, и (b) по меньшей мере один дополнительный активный ингредиент, выбранный из (b1) ингибиторов фотосистемы II, (b2) ингибиторов синтазы ацетогидроксикислоты (AHAS), (b3) ингибиторов ацетил-СоА-карбоксилазы (АССазы), (b4) имитаторов ауксинов, (b5) ингибиторов синтазы 5-енол-пирувилшикимат-3-фосфата (EPSP), (b6) диверторов электронов фотосистемы I, (b7) ингибиторов протопорфириногенаоксидазы (PPO), (b8) ингибиторов синтазы глутамина (GS), (b9) ингибиторов элонгазы жирных кислот с очень длинной цепью (VLCFA), (b10) ингибиторов транспорта ауксинов, (b11) ингибиторов фитоендесатуразы (PDS), (b12) ингибиторов 4-гидроксифенил-пируватдиоксигеназы (HPPD), (b13) ингибиторов гомогентизатсоланезилтрансферазы (HST), (b14) ингибиторов биосинтеза целлюлозы, (b15) других гербицидов, в том числе средств, прерывающих митоз,

органических соединений, содержащих мышьяк, асулама, бромобутида, цинметилина, кумилулона, дазомета, дифензоквата, димрона, этобензанида, флуренола, фосамина, фосамин-аммония, гидантоцидина, метама, метилдимрона, олеиновой кислоты, оксацикломефона, пеларгоновой кислоты и пирибутикарба, (b16) антидотов гербицидов и солей соединений (b1) - (b16).

"Ингибиторы фотосистемы II" (b1) представляют собой химические соединения, которые связываются с белком D-1 в Q_B -области связывания и таким образом сдерживают транспорт электронов из Q_A в Q_B в хлоропластах тилакоидной мембраны. Электроны, пропускание которых через фотосистему II было сдержано, проходят через ряд реакций с образованием токсичных соединений, которые разрушают клеточные мембраны и обуславливают набухание хлоропластов, протекание мембран и в конечном итоге разрушение клеток. Q_B -область связывания содержит три различные сайта связывания: сайт связывания А связывает триазины, такие как атразин, триазиноны, такие как гексазинон, и урацилы, такие как бромацил, сайт связывания В связывает фенилмочевины, такие как диурон, и сайт связывания С связывает бензотиадиазолы, такие как бентазон, нитрилы, такие как бромоксинил, и фенил-пиридазины, такие как пиридат. Примеры ингибиторов фотосистемы II включают аметрин, амикарбазон, атразин, бентазон, бромацил, бромофеноксим, бромоксинил, хлорбромурон, хлоридазон, хлоротолурон, хлороксурон, кумилурон, цианазин, даимурон, десмедифам, десметрин, димефурон, диметаметрин, диурон, этидимурон, фенурон, флуометурон, гексазинон, иоксинил, изопротурон, изоурон, ленацил, линурон, метамитрон, метабензтиазурон, метобромурон, метоксурон, метрибузин, монолинурон, небурон, пентанохлор, фенмедифам, прометон, прометрин, пропанил, пропазин, пиридафол, пиридат, сидурон, симазин, симетрин, тебутиурон, тербацил, тербуметон, тербутилазин, тербутрин и триэтазин.

"Ингибиторы АНАС" (b2) представляют собой химические соединения, которые ингибируют синтазу ацетогидроксикислоты (АНАС), также известную как ацетолактатсинтаза (ALS), и таким образом уничтожают растения путем ингибирования образования алифатических аминокислот с разветвленной цепью, таких как валин, лейцин и изолейцин, которые требуются для синтеза белка и роста клеток. Примеры ингибиторов АНАС включают амидосульфурон, азимсульфурон, бенсульфурон-метил, биспирибак натрия, клорансулам-метил, хлоримурон-этил, хлорсульфурон, циноссульфурон, циклосульфамурон, диклосулам, этаметсульфурон-метил, этокиссульфурон, флазасульфурон, флорасулам, флукарбазон натрия, флуметсулам, флупирсульфурон-метил, флупирсульфурон натрия, форамсульфурон, галосульфурон-метил, имазаметабенз-метил, имазамокс, имазапик, имазапир, имазаквин, имазетапир, имазосульфурон, йодосульфурон-метил (в том числе натриевую соль), иофенсульфурон-(2-йод-*N*-[[4-метокси-6-метил-1,3,5-триазин-2-ил)амино]карбонил]бензолсульфонамид), мезосульфурон-метил, метазосульфурон-(3-хлор-4-(5,6-дигидро-5-метил-1,4,2-диоксазин-3-ил)-*N*-[[4,6-диметокси-2-пиримидинил)амино]карбонил]-1-метил-1*H*-пиразол-5-сульфонамид), метосулам, метсульфурон-метил, никосульфурон, оксасульфурон,

пеносулам, примисульфурон-метил, пропоксикарбазон натрия, пропирисульфурон-(2-хлор-*N*-[[4,6-диметокси-2-пиримидинил)амино]карбонил]-6-пропилимидазо[1,2-*b*]пиридазин-3-сульфонамид), просульфурон, пиразосульфурон-этил, пирибензоксим, пирифталид, пириминобак-метил, пиритиобак-натрий, римсульфурон, сульфометурон-метил, сульфосульфурон, тиенкарбазон, тифенсульфурон-метил, триафамон-(*N*-[2-[(4,6-диметокси-1,3,5-триазин-2-ил)карбонил]-6-фторфенил]-1,1-дифтор-*N*-метилметансульфонамид), триасульфурон, трибенурон-метил, трифлорисульфурон (в том числе натриевую соль), трифлусульфурон-метил и тритосульфурон.

"Ингибиторы АССазы" (b3) представляют собой химические соединения, которые ингибируют фермент, представляющий собой ацетил-СоА-карбоксилазу, который осуществляет катализирование ранней стадии в синтезе липидов и жирных кислот у растений. Липиды являются важными компонентами клеточной мембраны, и без них не могут образовываться новые клетки. Ингибирование ацетил-СоА-карбоксилазы и последующий недостаток образования липидов приводит к утрате целостности клеточной мембраны, особенно в участках активного роста, таких как меристемы. В конечном итоге прекращается рост побегов и корневищ, и меристемы побегов и почки корневищ начинают отмирать. Примеры ингибиторов АССазы включают аллоксидим, бутроксидим, клетодим, клодинафоп, циклоксидим, цигалофоп, диклофоп, феноксапроп, флуазифоп, галоксифоп, пиноксаден, профоксидим, пропаквизафоп, квизалофоп, сетоксидим, тепралоксидим и тралкоксидим, в том числе измененные формы, такие как феноксапроп-П, флуазифоп-П, галоксифоп-П и квизалофоп-П, и сложноеэфирные формы, такие как клодинафоп-пропаргил, цигалофоп-бутил, диклофоп-метил и феноксапроп-П-этил.

Ауксин представляет собой растительный гормон, который контролирует рост в многих тканях растений. "Имитаторы ауксина" (b4) представляют собой химические соединения, имитирующие гормон роста растений, представляющий собой ауксин, таким образом обуславливающие неконтролируемый и беспорядочный рост, что приводит к смерти растений чувствительных видов. Примеры имитаторов ауксина включают аминоклопирахлор-(6-амино-5-хлор-2-циклопропил-4-пиримидинкарбоновая кислота), и его сложные метиловый и этиловый эфиры, и его натриевые и калиевые соли, аминоклопиралид, бензолин-этил, хлорамбен, клацифос, кломепроп, клопиралид, диамбу, 2,4-D, 2,4-DB, дихлорпроп, флуороксибир, галауоксифен-(4-амино-3-хлор-6-(4-хлор-2-фтор-3-метоксифенил)-2-пиридинкарбоновая кислота), галауоксифен-метил-(метил-4-амино-3-хлор-6-(4-хлор-2-фтор-3-метоксифенил)-2-пиридинкарбоксилат), МСРА, МСРВ, мекопроп, пихлорам, квинклолак, квинмерак, 2,3,6-ТВА, трихлопир и метил-4-амино-3-хлор-6-(4-хлор-2-фтор-3-метоксифенил)-5-фтор-2-пиридинкарбоксилат.

"Ингибиторы синтазы EPSP" (b5) представляют собой химические соединения, которые ингибируют фермент, представляющий собой 5-енол-пирувилшикимат-3-фосфатсинтазу, который вовлечен в синтез ароматических аминокислот, таких как тирозин, триптофан и фенилаланин. Гербициды на основе ингибиторов EPSP легко поглощаются через надземную часть растения и переносятся в флоэму к точкам роста. Глифосат является

относительно неселективным гербицидом, влияющим на послевсходовый период, который принадлежит к данной группе. Глифосат включает сложные эфиры и соли, такие как аммониевая, изопропиламмониевая, калиевая, натриевая (в том числе сесквинатрий) и тримесиевая (альтернативно называемая сульфосат).

"Диверторы электронов фотосистемы I" (b6) представляют собой химические соединения, которые принимают электроны из фотосистемы I и через несколько циклов образуют гидроксильные радикалы. Такие радикалы являются чрезвычайно реакционноспособными и легко разрушают ненасыщенные липиды, в том числе жирные кислоты мембран и хлорофилл. Это нарушает целостность клеточных мембран, следовательно, клетки и органеллы "протекают", что приводит к быстрому увяданию листьев и обезвоживанию, и в конечном итоге к смерти растения. Примеры данного ингибитора фотосинтеза второго типа включают дикват и паракват.

"Ингибиторы РРО" (b7) представляют собой химические соединения, которые ингибируют фермент, представляющий собой протопорфириногенаксидазу, что быстро приводит к образованию высоко реакционноспособных соединений в растениях, которые разрывают клеточные мембраны, обуславливая вытекание клеточных жидкостей. Примеры ингибиторов РРО включают ацифлуорфен натрия, азафенидин, бензфендизон, бифенокс, бутафенацил, карфентразон, карфентразон-этил, хлومتоксифен, цинидон-этил, флуазолат, флуфенпир-этил, флумиклорак-пентил, флумиоксазин, флуорогликофен-этил, флутиацетметил, фомесафен, галосафен, лактофен, оксадиаргил, оксадиазон, оксифлуорфен, пентоксазон, профлуазол, пираклонил, пирафлуфен-этил, сафлуфенацил, сульфентразон, тидиазимин, трифлудимоксазин-(дигидро-1,5-диметил-6-тиоксо-3-[2,2,7-трифтор-3,4-дигидро-3-оксо-4-(2-пропин-1-ил)-2H-1,4-бензоксазин-6-ил]-1,3,5-триазин-2,4(1H,3H)-дион) и тиафенацил-(метил-N-[2-[[2-хлор-5-[3,6-дигидро-3-метил-2,6-диоксо-4-(трифторметил)-1(2H)-пиримидинил]-4-фторфенил]тио]-1-оксопропил]-β-аланилат).

"Ингибиторы GS" (b8) представляют собой химические соединения, которые подавляют активность фермента, представляющего собой глутаминсинтетазу, который применяется у растений для превращения аммиака в глутамин. Следовательно, аммиак накапливается, и уменьшаются уровни глутамин. Повреждение растений, вероятно, возникает вследствие объединенных эффектов токсичности аммиака и дефицита аминокислот, требуемых для других метаболических процессов. Ингибиторы GS включают глюфосинат и его сложные эфиры и соли, такие как глюфозинат аммония, и другие фосфинотрициловые производные, глюфозинат-II-((2S)-2-амино-4-(гидроксиметилфосфинил)бутановая кислота) и биланафос.

"Ингибиторы элонгазы жирных кислот с очень длинной цепью (VLCFA)" (b9) представляют собой гербициды, характеризующиеся широким разнообразием химических структур, которые ингибируют элонгазу. Элонгаза представляет собой один из ферментов, расположенных в или возле хлоропластов, который вовлечен в биосинтез жирных кислот с очень длинной цепью. У растений жирные кислоты с очень длинной цепью являются основными составляющими гидрофобных полимеров, которые предупреждают

обезвоживание на поверхности листьев и обеспечивают стабильность пыльцевому зерну. Такие гербициды включают ацетохлор, алахлор, анилофос, бутахлор, кафенстрол, диметахлор, диметенамид, дифенамид, феноксасульфон-(3-[[[(2,5-дихлор-4-этоксифенил)метил]сульфонил]-4,5-дигидро-5,5-диметилизоксазол), фентразамид, флуфенацет, инданофан, мефенацет, метазахлор, метолахлор, напроанилид, напропамид, напропамид-М-((2R)-*N,N*-диэтил-2-(1-нафталинилокси)пропанамид), петоксамид, пиперофос, претилахлор, пропахлор, пропизохлор, пироксасульфон и тенилхлор, в том числе измененные формы, такие как *C*-метолахлор, и хлорацетамиды и оксиацетамиды.

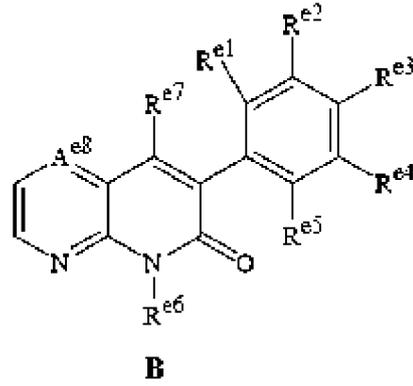
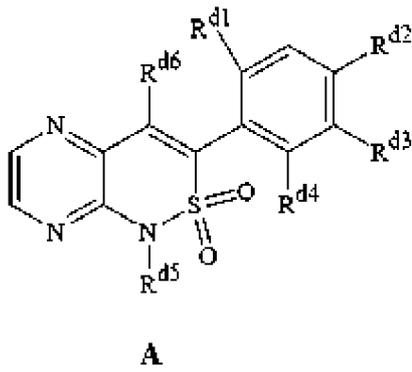
"Ингибиторы транспорта ауксина" (b10) представляют собой химические вещества, которые подавляют транспорт ауксина у растений, как, например, путем связывания с белком-переносчиком ауксина. Примеры ингибиторов транспорта ауксина включают дифлуфензопир, напалам (также известный как *N*-(1-нафтил)фталевая кислота и 2-[(1-нафталиниламино)карбонил]бензойная кислота).

"Ингибиторы PDS" (b11) представляют собой химические соединения, которые подавляют путь биосинтеза каротиноидов на стадии фитоендесатуразы. Примеры ингибиторов PDS включают бефлубутамид, бефлубутамид-М, дифлуфеникан, флуридон, флуорохлоридон, флуртамон, норфлурзон и пиколинафен.

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

"Ингибиторы HST" (b13) нарушают способность растения превращать гомогентизат в 2-метил-6-соланил-1,4-бензохинон, тем самым нарушая биосинтез каротиноидов. Примеры ингибиторов HST включают галоксидин, пирихлор, 3-(2-хлор-3,6-дифторфенил)-4-гидрокси-1-метил-1,5-нафтиридин-2(1*H*)-он, 7-(3,5-дихлор-4-пиридинил)-5-(2,2-дифторэтил)-8-гидроксипиридо[2,3-*b*]пиразин-6(5*H*)-он и 4-(2,6-диэтил-4-метилфенил)-5-гидрокси-2,6-диметил-3(2*H*)-пиридазинон.

Ингибиторы HST также включают соединения формул **A** и **B**.



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

"Ингибиторы биосинтеза целлюлозы" (b14) подавляют биосинтез целлюлозы у определенных растений. Они наиболее эффективны, когда применяются на предвсходовой стадии или на ранней послевсходовой стадии в отношении молодых или быстрорастущих растений. Примеры ингибиторов биосинтеза целлюлозы включают хлортиамид, дихлобензил, флупоксам, индазифлам-(N^2 -[(1*R*,2*S*)-2,3-дигидро-2,6-диметил-1*H*-инден-1-ил]-6-(1-фторэтил)-1,3,5-триазин-2,4-диамин), изоксабен и триазифлам.

"Другие гербициды" (b15) включают гербициды, которые действуют с помощью разных различных механизмов действия, такие как средства, прерывающие митоз (например, флампроп-М-метил и флампроп-М-изопропил), органические мышьяковистые препараты (например, DSMA и MSMA), ингибиторы синтазы 7,8-дигидроптероата, ингибиторы синтеза хлоропластных изопреноидов и ингибиторы биосинтеза клеточной стенки. Другие гербициды включают такие гербициды, которые обладают неизвестным механизмом действия, или не подпадают под конкретную категорию, которые перечислены в (b1) - (b14), или действуют с помощью комбинации механизмов действия, перечисленных выше. Примеры других гербицидов включают аклонифен, асулам, амитрол, бикслозон, бромобутид, цинметилин, кломазон, кумилурон, циклопириморат-(6-хлор-3-(2-циклопропил-6-метилфеноксид)-4-пиридазинил-4-морфолинкарбоксилат), даимулон, дифензокват, этобензанид, флуометурон, флуренол, фосамин, фосамин-аммоний, дазомет, димрон, ипфенкарбазон-(1-(2,4-дихлорфенил)-*N*-(2,4-дифторфенил)-1,5-дигидро-*N*-(1-метилэтил)-5-оксо-4*H*-1,2,4-триазол-4-карбоксамид), метам, метилдимрон, олеиновую кислоту, оксацикломефон, пеларгоновую кислоту, пирибутикарб и 5-[[[(2,6-дифторфенил)метокси]метил]-4,5-дигидро-5-метил-3-(3-метил-2-тиенил)изоксазол.

"Антидоты гербицидов" (b16) представляют собой вещества, добавляемые в гербицидный состав для устранения или снижения фитотоксичных эффектов гербицида в отношении определенных сельскохозяйственных культур. Такие соединения защищают сельскохозяйственные культуры от повреждения гербицидами, но, как правило, не предупреждают контроль гербицидом нежелательной растительности. Примеры антидотов гербицидов включают без ограничения беноксакор, клоквиносет-мексил, кумилурон, циометринил, ципросульфамид, даимурон, дихлормид, дициклонон, диетолат, димепиперат, фенхлоразол-этил, фенклорим, флуразол, флуксофеним, фурилазол, изоксадифен-этил, мефенпир-диэтил, мефенат, метоксифенон, нафталиновый ангидрид, оксабетринил, *N*-(аминокарбонил)-2-метилбензолсульфонамид и *N*-(аминокарбонил)-2-фторбензолсульфонамид, 1-бром-4-[(хлорметил)сульфонил]бензол, 2-(дихлорметил)-2-метил-1,3-диоксолан (MG 191), 4-(дихлорацетил)-1-окса-4-азоспиро[4.5]декан (MON 4660), *2,2-дихлор-1-(2,2,5-триметил-3-оксазолидинил)-этанон* и *2-метокси-N-[[4-[[[(метиламино)карбонил]амино]фенил]сульфонил]-бензамид*.

Соединения формулы **1** можно получать с помощью общих способов, известных в области синтетической органической химии. Один или несколько из следующих способов и вариаций, описанных на схемах 1-19, можно применять для получения соединений формулы **1**. Определения Q, R¹, R², R³, Y, R⁴, R⁵, n, R⁶, W и R⁹ в соединениях формул **1-28** ниже являются такими, как определено выше в кратком описании изобретения, если не указано иное. Соединения формул **1A**, **1B**, **1C**, **4A**, **5A**, **5A'**, **5A''**, **5C** и **8A** являются подмножеством соединений формулы **1**, и все заместители для формул **1A**, **1B**, **1C**, **4A**, **5A**, **5A'**, **5A''**, **5C** и **8A** являются такими, как определено выше для формулы **1**, если не указано иное.

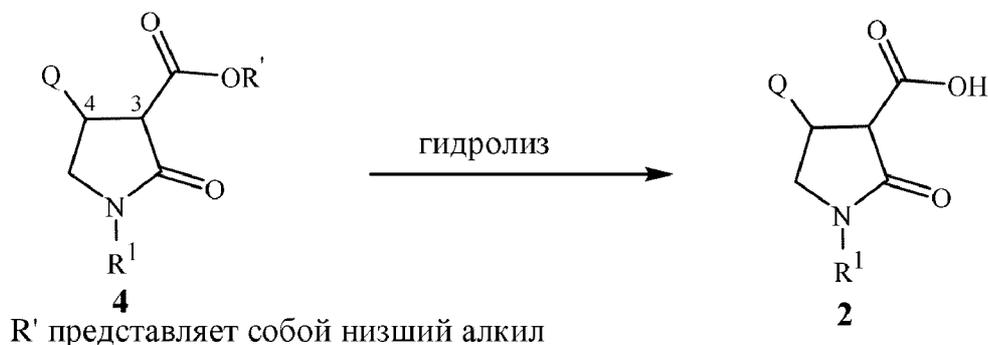
Как показано на схеме 1, соединение формулы **1A** (т. е. соединение формулы **1**, где Y представляет собой O) можно получать путем осуществления реакции кислот формулы **2** с амином формулы **3** в присутствии реагента для дегидратационной реакции сочетания, такого как пропилфосфоновый ангидрид, дициклогексилкарбодиимид, *N*-(3-диметиламинопропил)-*N'*-этилкарбодиимид, *N*, *N'*-карбонилдиимидазол, хлорид 2-хлор-1,3-диметилимидазолия или йодид 2-хлор-1-метилпиридиния. Также подходящими являются реагенты на полимерной подложке, такие как циклогексилкарбодиимид на полимерной подложке. Такие реакции как правило осуществляют при температурах, находящихся в диапазоне от 0-60°C, в растворителе, таком как дихлорметан, ацетонитрил, *N*, *N*-диметилформамид или этилацетат, в присутствии основания, такого как триэтиламин, *N*, *N*-диизопропиламин или 1,8-диазабицикло[5.4.0]ундец-7-ен. Условия реакции сочетания, в которой используется пропилфосфоновый ангидрид, см. в *Organic Process Research & Development* **2009**, *13*, 900-906.

Схема 1



Как показано на схеме 2, соединения формулы **2** можно получать путем осуществления гидролиза сложных эфиров формулы **4** с помощью способов, известных специалистам в данной области. Гидролиз проводят с помощью водного основания или водной кислоты, как правило, в присутствии соразтворителя. Подходящие основания для реакции включают без ограничения гидроксиды, такие как гидроксид натрия и калия, и карбонаты, такие как карбонат натрия и калия. Подходящие кислоты для реакции включают без ограничения неорганические кислоты, такие как хлористоводородная кислота, бромистоводородная кислота и серная кислота, и органические кислоты, такие как уксусная кислота и трифторуксусная кислота. Широкое разнообразие соразтворителей является подходящим для реакции, в том числе без ограничения метанол, этанол и тетрагидрофуран. Реакцию осуществляют при температурах, находящихся в диапазоне от -20°C до точки кипения растворителя и, как правило, от 0 до 100°C . Кроме того, соединения формулы **2**, где R^1 представляет собой H , можно дополнительно превращать в соединения формулы **2**, где R^1 представляет собой алкил, галогеналкил, циклоалкил, циклоалкилалкил, путем осуществления реакции алкилирования. Возможно использовать разнообразие оснований и алкилирующих средств, но предпочтительным способом является обработка соединения формулы **2** (где R^1 представляет собой H) избытком калий-*трет*-бутоксид в тетрагидрофуране при 0°C и добавление алкилирующего реагента.

Схема 2



Как показано на схеме 3, соединение формулы **4A** (соединение формулы **4**, где R^1 представляет собой H) можно получать путем осуществления восстановления соединения

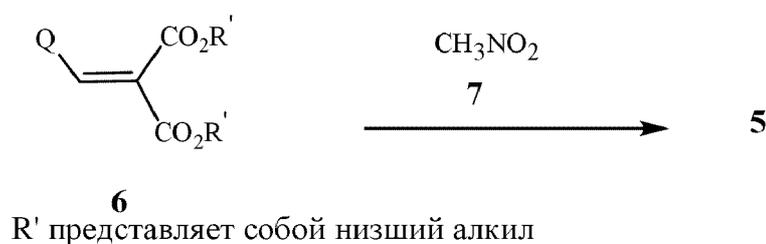
формулы **5** и последующей циклизации *in situ* полученного промежуточного амина. Широкое разнообразие способов восстановления алифатической нитрогруппы в соединениях формулы **5** известно в литературе. Способы, известные специалистам в данной области, включают каталитическую гидрогенизацию в присутствии палладия на углеороде или никеля Ренея, металлического железа или цинка в кислотной среде (см., например, *Berichte der Deutschen Chemischen Gesellschaft* **1904**, 37, 3520-3525) и алюмогидрида лития. Восстановление алифатической нитрогруппы также может быть достигнуто с помощью йодида самария(II) в присутствии источника протонов, такого как метанол (см. например, *Tempahedron Letters* **1991**, 32 (14), 1699-1702). В качестве альтернативы можно применять борогидрид натрия в присутствии никелевого катализатора, такого как ацетат никеля(II) или хлорид никеля(II) (см. например, *Tempahedron Letters* **1985**, 26 (52), 6413-6416).

Схема 3



Как показано на схеме 4, соединение формулы **5** можно получать путем осуществления реакции сложных диэфиров формулы **6** с нитроалканами формулы **7**, как правило, в присутствии основания. Подходящие основания для реакции включают низшие алкоксиды щелочных металлов, такие как метоксид натрия в метаноле или этоксид натрия в этаноле. Предпочтительно сложнодиэфирное соединение формулы **6** и низшие алкоксидные основания получают из одного и то же спирта. Соединения формулы **6** можно получать с помощью способов, известных специалистам в данной области, например, путем осуществления конденсации Кневенагеля альдегидов и малонатов (см., например, G. Jones, *Organic Reactions* Volume 15, John Wiley and Sons, 1967).

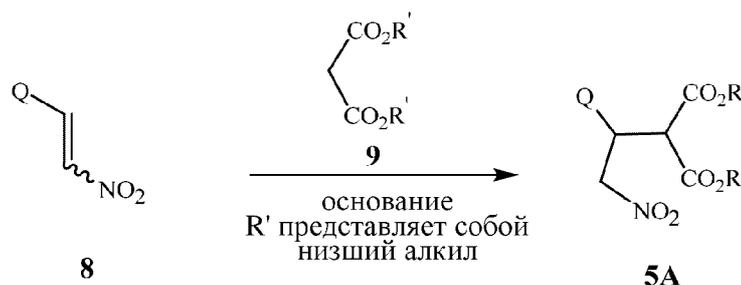
Схема 4



Соединения формулы **5A** можно получать путем осуществления реакции соединений формулы **8** с малонатами формулы **9** в присутствии основания, как показано на схеме 5. Подходящие основания для данной реакции включают без ограничения низшие

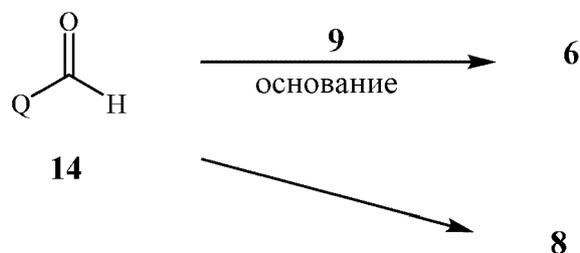
алкоксиды щелочных металлов, такие как метоксид натрия в метаноле или этоксид натрия в этаноле, или основания, такие как бис(триметилсилил)амид лития, бис(триметилсилил)амид натрия и диизопропиламид лития, в растворителях, таких как тетрагидрофуран. Как правило, реакцию проводят в диапазоне температур от -78°C до 23°C . Условия, способствующие данному преобразованию, см. в *Synthesis* **2005**, 2239-2245. Условия, способствующие данному преобразованию в конденсированной воде при отсутствии катализатора, приведены в *Synthetic Communications* **2013**, *43*, 744-748.

Схема 5



Соединения формулы **6** можно получать путем осуществления конденсации Кневенагеля альдегидов формулы **14** и малонатов формулы **9**, как показано на схеме 6. Соединение формулы **8** можно получать путем осуществления конденсации Кневенагеля альдегидов формулы **14** и нитрометана, что также показано на схеме 6.

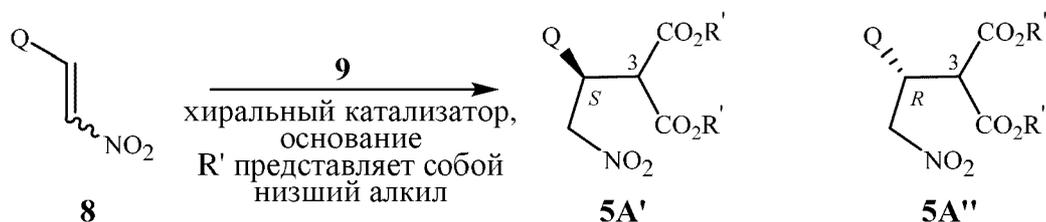
Схема 6



Соединения формул **5A'** и **5A''** можно стереоселективно получать путем осуществления реакции нитроалкенов формулы **8** с малонатами формулы **9** в присутствии хирального катализатора и необязательно в присутствии подходящего основания, как показано на схеме 7. Подходящие катализаторы включают без ограничения лиганды на основе Ni(II) с вицинальными диаминами, такие как Ni(II)-бис[(*R, R*)-*N, N'*-дибензилциклогексан-1,2-диамин]дибромид, Ni(II)-бис[(*S, S*)-*N, N'*-дибензилциклогексан-1,2-диамин]дибромид или бромид никеля(II) с хиральными диаминами типа 1,1'-би(тетрагидроизохинолина). Подходящие органические основания для данной реакции включают без ограничения пиперидин, морфолин, триэтиламин, 4-метилморфолин или *N, N*-диизопропилэтиламин. Данное преобразование может быть совершено в чистом виде или в растворителях, таких как тетрагидрофуран, толуол или дихлорметан. Как правило, реакцию проводят в диапазоне температур от -78°C до 80°C с применением 0-1 эквивалента

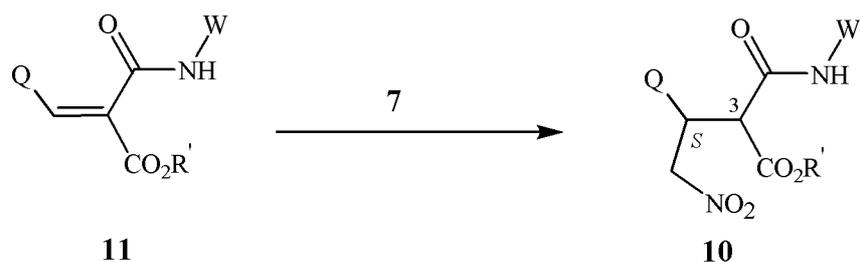
катализатора и необязательно 0-1 эквивалента основания. Условия, способствующие данному преобразованию, были приведены в *J. Am. Chem. Soc.* **2005**, 9958-9959 или *Eur. J. Org. Chem.* **2011**, 5441-5446. Нитроалкены формулы **8** можно получать из альдегидов и нитрометана с помощью способов, известных специалистам в данной области.

Схема 7



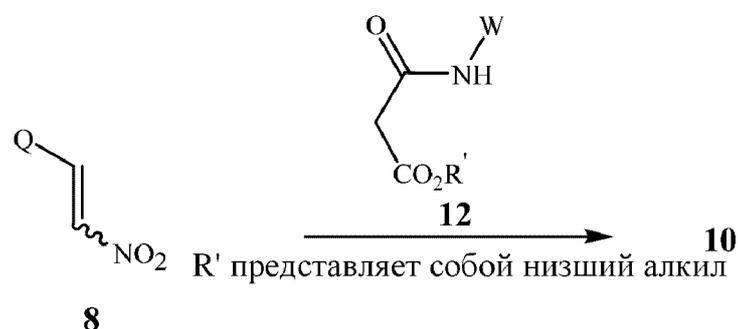
Как показано на схеме 8, соединение формулы **10** можно получать путем осуществления реакции соединения формулы **11** с соединением формулы **7** в растворителе, в присутствии основания, аналогично способу, описанному на схеме 4.

Схема 8



Как показано на схеме 9, соединение формулы **10** можно получать аналогично способу на схеме 5, путем осуществления реакции нитроалкена формулы **8** с соединением формулы **12**.

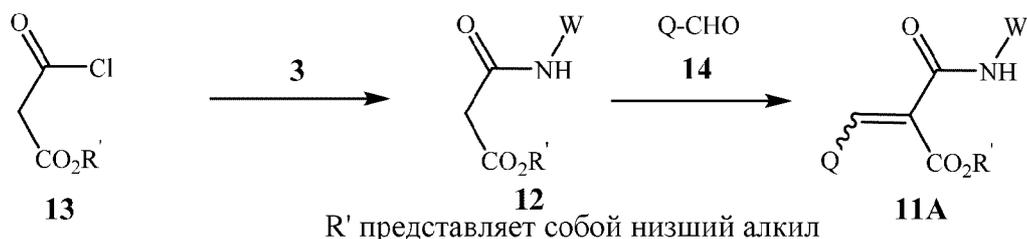
Схема 9



Как показано на схеме 10, соединение формулы **11A** можно получать путем осуществления реакции малонового амида формулы **12** с альдегидом формулы **14** с помощью способов, известных специалистам в данной области. Малоновые амиды формулы **12** можно легко получать из низших алкилмалонилхлоридов формулы **13**, таких как метилмалонилхлорид, и аминов формулы **3** с помощью способов, известных

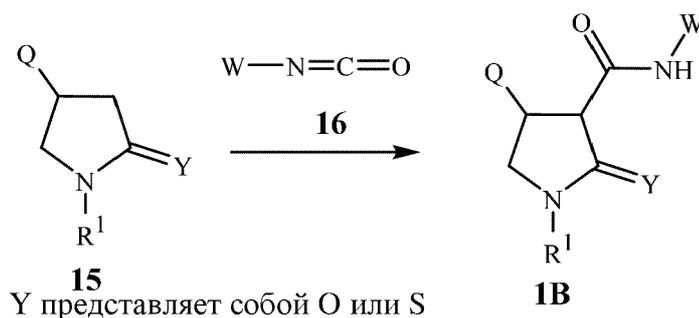
специалистам в данной области, что также показано на схеме 10.

Схема 10



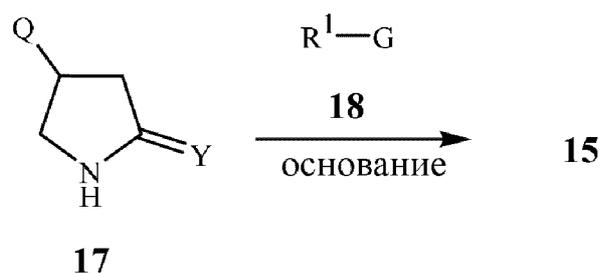
Как показано на схеме 11, соединение формулы **1B** можно получать путем осуществления реакции соединения формулы **15** с изоцианатом формулы **16** в присутствии основания. Примеры основания, которое можно применять для данного способа, включают те, которые перечислены для способа на схеме 4. Температура реакции может быть выбрана из значений в диапазоне от -78°C до точки кипения применяемого инертного растворителя. Как правило, реакцию проводят при температурах, находящихся в диапазоне от -78°C до 100°C , в растворителях, таких как толуол.

Схема 11



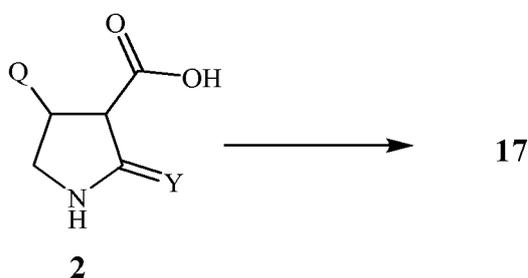
Как показано на схеме 12, соединение формулы **15** можно получать путем осуществления реакции соединения формулы **17** с соответствующими электрофильными соединениями формулы **18** в присутствии основания. В формуле **18** G обозначает уходящую группу, т. е. нуклеофуг. В зависимости от выбора R^1 , подходящие электрофильные соединения для реакции могут включать алкилгалогениды, такие как хлориды, бромиды и йодиды, алкилсульфонаты. Подходящие основания для реакции включают неорганические основания, такие как щелочной или щелочноземельный металл (например, литий, натрий, калий и цезий) гидроксиды, алкоксиды, карбонаты и фосфаты, и органические основания, такие как триэтиламин, *N,N*-диизопропилэтиламин и 1,8-диазабцикло[5.4.0]ундец-7-ен. Широкое разнообразие растворителей является подходящим для реакции, в том числе без ограничения тетрагидрофуран, дихлорметан, *N,N*-диметилформаид, *N,N*-диметилацетамид, *N*-метилпирролидинон, ацетонитрил, C_2 - C_6 спирты и ацетон, а также смеси таких растворителей. Данную реакцию осуществляют при температурах, находящихся в диапазоне от -20 до 200°C и, как правило, от 0 до 50°C .

Схема 12



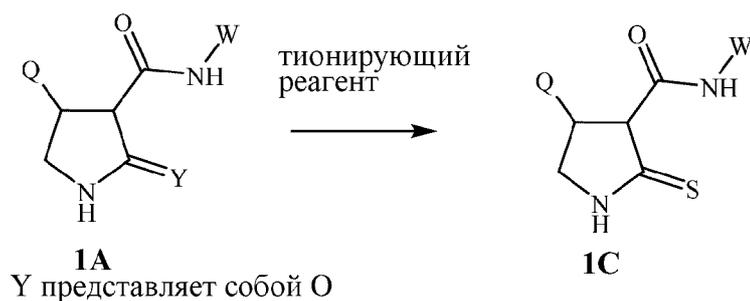
Как показано на схеме 13, соединение формулы **17** можно получать путем декарбосилирования кислоты формулы **2** с помощью способов, известных специалистам в данной области. Декарбосилирование проводят путем нагревания соединения формулы **2** в растворителе, как правило, в присутствии кислоты. Подходящие кислоты для реакции включают без ограничения *n*-толуолсульфоновую кислоту. Широкое разнообразие соразтворителей является подходящим для реакции, в том числе без ограничения толуол, изопропилацетат и метилизобутилкетон. Реакцию осуществляют при температурах, находящихся в диапазоне от -20°C до точки кипения растворителя и, как правило, от 0 до 150°C .

Схема 13



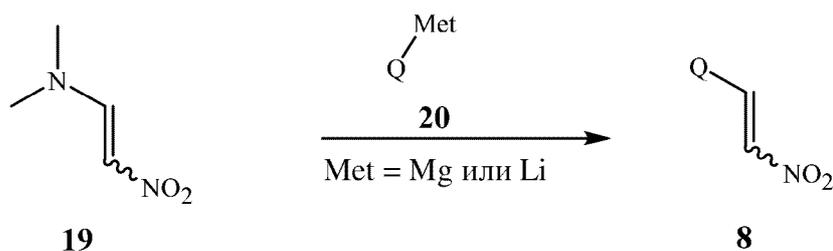
Как показано на схеме 14, соединение формулы **1C** (т. е. соединение формулы **1**, где R^1 представляет собой H, и Y представляет собой S) можно получать путем осуществления реакции соединения формулы **1A** с по меньшей мере одним эквивалентом тионирующего реагента, такого как реагент Лавессона, декасульфид тетрафосфора или пентасульфид дифосфора, в растворителе, таком как тетрагидрофуран или толуол. Как правило, реакцию проводят при температурах, находящихся в диапазоне от 0 до 115°C .

Схема 14



Соединения формулы **8** также можно получать с помощью реакции нитроэнаминов формулы **19** с реагентом Гриньяра или реагентами на основе лития формулы **20**, как подробно описано на схеме 15. См. Severin в *Chem. Ber.* **1969**, *102*, 2966-71 для примеров данной реакции и условий. Реагент Гриньяра и реагенты на основе лития можно изготавливать путем осуществления реакции обмена галоген-металл в отношении известных или коммерчески доступных бромидов и йодидов.

Схема 15

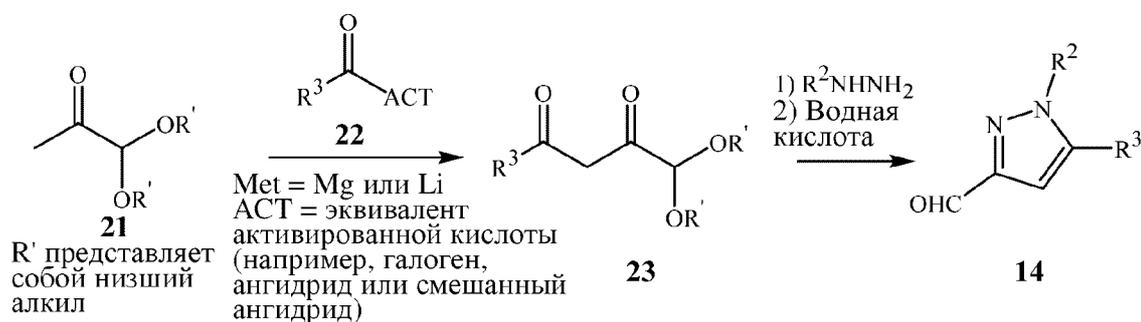


Альдегиды формулы **14** и галогениды (предшественники для получения соединения формулы **20**), применяемые в качестве исходных материалов для соединений формул **6** и **8**, являются коммерчески доступными или известными специалистам в данной области. Применимый способ для синтеза исходных соединений, в которых Q представляет собой Q-1, и где R⁴ представляет собой алкил или галогеналкил, можно найти в *J. Heterocyclic Chem.* **1989**, *26*, 895-98. Обзор способов для синтеза пиразольных исходных материалов, где Q представляет собой Q-1 или Q-2, можно найти в *Chem. Rev.* **2011**, *111*, 6984-7034 и источниках, в нем упомянутых. Применимые способы для синтеза индазольных соединений, где Q представляет собой Q-3, можно найти в международных заявках на патенты WO 2011/050245 и WO 2018/177781, и в *Molecules* **2018**, *23*(11), 2783, и источниках, в них упомянутых. Реакции металлизации пиразолов для их функционализации при 3-, 4- и 5-положениях были детально описаны в научной работе Christina Despotopoulou, Мюнхенский университет (LMU), 2009 г. и источниках, в ней указанных.

Синтез соединения формулы **14**, где Q представляет собой Q-1, и R³ представляет собой алкил или галогеналкил, показан на схеме 16. Соединение формулы **21** можно вводить в реакцию с соединением формулы **22** в присутствии основания с получением промежуточных соединений формулы **23**. В свою очередь можно осуществлять

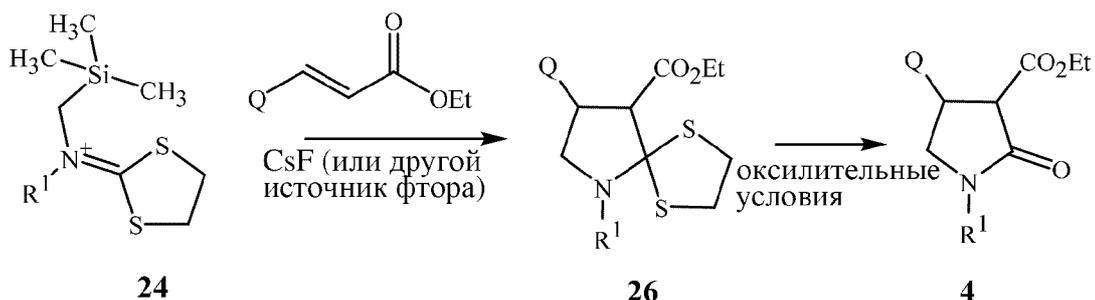
циклизацию соединения формулы **23** путем осуществления реакции с алкилгидразинами с образованием пиразолинов (когда R^3 представляет собой галогеналкил) и пиразолов (когда R^3 представляет собой алкил), которые можно гидролизовать и дегидрировать за одну стадию с применением водной кислоты с получением соединений формулы **14**, где Q представляет собой Q-1. Основания, применяемые в циклизации, могут представлять собой без ограничения гидроксиды и низшие алкоксиды щелочных металлов, такие как метоксид натрия, трет-бутоксид калия и натрия, гидриды щелочных металлов, такие как гидрид натрия, гексаметилдисилазид натрия, гексаметилдисилазид калия и гексаметилдисилзид лития. Водные кислоты, такие как без ограничения хлористоводородная, серная, уксусная и трифторуксусная кислоты, являются подходящими для стадии гидролиза/дегидратации.

Схема 16



Альтернативный путь синтеза соединения формулы **4** показан на схеме 17. Реакция циклоприсоединения соединений формулы **24** с акрилатами формулы **25** приводит к получению пирролидиноновой кольцевой системы с защитной группой при тиокарбониле (например, соединение формулы **26**). Тиокарбонил можно гидролизовать до карбонила в условиях окисления с помощью реагентов, таких как оксон и пероксид водорода. См. Fishwick, *Tet. Lett.* **1995**, 36, 9409-9412 и упомянутые документы, такие как *Eur. J. Org. Chem.* **2001**, 3533-3544, для условий проведения таких реакций циклоприсоединения и способов синтеза соединения формулы **24**. Акрилаты формулы **25** можно легко изготавливать путем осуществления реакций Виттига или Хорнера-Вадсворта-Эммонса альдегидов формулы **14** или путем осуществления реакций Хека соответствующих галогенированных материалов.

Схема 17



Другой применимый способ синтеза соединения формулы **1** показан на схеме 18.

Катализируемое родием присоединение бороновых кислот формулы **27** к ненасыщенным пирролидинонам формулы **28** непосредственно приводит к получению соединения формулы **1** в присутствии родиевого катализатора (реакция Хаяси). Широкое разнообразие условий и катализаторов для проведения реакций Хаяси представлено Frost et al. в *Chem.Soc.Rev.* **2010**, *39*, 2093-2105 и источниках, в нем упомянутых. В данной обзорной статье также описаны условия для получения энантимерно чистых продуктов. Ненасыщенные пирролидиноны формулы **28** можно изготавливать из широко известных насыщенных пирролидинонов с помощью многих типов условий дегидрогенизации, например отщепления фенилселенида.

Схема 18



Специалист в данной области понимает, что разные функциональные группы можно превращать в другие с получением других соединений формулы **1**. Что касается ценного ресурса, в котором проиллюстрировано взаимное превращение функциональных групп простым и незамысловатым образом, см. Larock, R. C., *Comprehensive Organic Transformations: A Guide to Functional Group Preparations*, 2nd Ed., Wiley-VCH, New York, 1999. Например, промежуточные соединения для получения соединений формулы **1** могут содержать ароматические нитрогруппы, которые можно восстанавливать до аминогрупп, и затем превращать посредством реакций, широко известных в уровне техники, таких как реакция Зандмейера, в разные галогениды с получением соединений формулы **1**. Указанные выше реакции также во многих случаях можно осуществлять в измененном порядке.

Известно, что некоторые реагенты и условия реакций, описанные выше для получения соединений формулы **1**, могут быть не совместимыми с некоторыми функциональными группами, присутствующими в промежуточных соединениях. В таких случаях ряд реакций внедрения защитной группы/удаления защитной группы или взаимные превращения функциональных групп во время синтеза помогут получить требуемые продукты. Применение и выбор защитных групп будет очевидным специалисту в области химического синтеза (см., например, Greene, T. W.; Wuts, P. G. M. *Protective Groups in Organic Synthesis*, 2nd ed.; Wiley: New York, 1991). Специалист в данной области поймет, что в некоторых случаях после введения указанного реагента, изображенного на любой отдельной схеме, может быть необходимо провести дополнительные обычные стадии синтеза, не описанные подробно, для завершения синтеза соединений формулы **1**. Специалист в данной области также поймет, что может быть необходимо провести

комбинацию стадий, проиллюстрированных на схемах выше, в порядке, отличном от такого, который подразумевается представленным конкретно, для получения соединений формулы 1.

Специалист в данной области также поймет, что соединения формулы 1 и промежуточные соединения, описанные в данном документе, можно подвергать разным реакциям с электрофильными соединениями, нуклеофильными соединениями, радикалами, металлоорганическими соединениями, реакциям окисления и восстановления для присоединения заместителей или изменения существующих заместителей.

Без дополнительного уточнения полагают, что специалист в данной области, применяя предшествующее описание, может осуществить на практике настоящее изобретение в его наиболее полной степени. Следующие неограничивающие примеры иллюстрируют настоящее изобретение. Стадии в следующих примерах иллюстрируют процедуру для каждой стадии в общем синтетическом преобразовании, и исходные материалы для каждой стадии могут быть не обязательно получены с помощью конкретного препаративного процесса, процедура которого описана в другом примере или стадии. Доли в процентах приведены по весу, за исключением случаев для хроматографической смеси растворителей или где указано иное. Части и доли в процентах для хроматографической смеси растворителей приведены по объему, если не указано иное. Спектры ^1H ЯМР приведены в ppm со слабopольным сдвигом от тетраметилсилана; "s" означает синглет, "d" означает дублет, "t" означает триплет, "q" означает квартет, "m" означает мультиплет, "dd" означает дублет дублетов, "br" означает широкий, и "br s" означает широкий синглет. Масс-спектры (MS) приведены как молекулярная масса наиболее распространенного изотопа исходного иона (M+1), образованного путем добавления H^+ (молекулярная масса составляет 1) к молекуле, или (M-1), образованного путем потери H^+ (молекулярная масса составляет 1) молекулой, наблюдаемая путем применения жидкостной хроматографии, соединенной с масс-спектрометром (LCMS) с применением либо химической ионизации при атмосферном давлении (AP+), где "а. е. м." обозначает унифицированные атомные единицы массы.

ПРИМЕР СИНТЕЗА 1

Получение (3*S*,4*R*)-*N*-(2,3-дифторфенил)-1-метил-4-[1-метил-5-(трифторметил)-1*H*-пирозол-3-ил]-2-оксо-3-пирролидинкарбоксоамида (соединение 13)

Стадия А. Получение 4,4-диэтокси-1,1,1-трифтор-3-бутен-2-она

В раствор триэтилортоацетата (450 г, 2,77 моль) и пиридина (550 г, 6,9 моль) в дихлорметане (3500 мл) при 0°C по каплям добавляли трифторуксусный ангидрид (1135 г, 5,54 моль). Реакционную смесь перемешивали при температуре окружающей среды в течение ночи, затем гасили холодным насыщенным раствором NaHCO_3 , затем промывали водой. Органический слой высушивали над сульфатом натрия, концентрировали при пониженном давлении и высушивали под вакуумом с получением указанного в заголовке соединения в виде масла (500 г, 85%).

^1H ЯМР (300 МГц, CDCl_3) δ 4,94 (s, 1H), 4,37 (q, 2H), 4,15 (q, 2H), 1,46 (t, 3H), 1,42 (t,

3H). LC-MS (ESI) масса/заряд 213 (M+H)⁺.

Стадия В. Получение (3*E*)-4-амино-4-этокси-1,1,1-трифтор-3-бутен-2-она

В раствор 4,4-диэтокси-1,1,1-трифтор-3-бутен-2-она (т. е. продукта, полученного на стадии А, 500 г, 2,35 моль) в ацетонитриле (2500 мл) при комнатной температуре по каплям добавляли 28% раствор NH₄OH в воде (500 мл). Реакционную смесь перемешивали при температуре окружающей среды в течение ночи. Растворитель удаляли при пониженном давлении и добавляли дихлорметан, затем промывали водой. Органический слой высушивали над сульфатом натрия и концентрировали при пониженном давлении с получением указанного в заголовке соединения в виде твердого вещества (325 г, 75%).

¹H ЯМР (300 МГц, CDCl₃) δ 9,79 (br, 1H), 5,66 (br, 1H), 5,13 (s, 1H), 4,15 (q, 2H), 1,38 (t, 3H). LC-MS (ESI) масса/заряд 184 (M+H)⁺.

Стадия С. Получение 1-метил-5-(трифторметил)-1*H*-пиразол-3-амина

В суспензию (3*E*)-4-амино-4-этокси-1,1,1-трифтор-3-бутен-2-она (т. е. продукта, полученного на стадии В, 325 г, 1,76 моль) и сульфата метилгидразина (1:1, 299 г, 2,11 моль) в этаноле (1500 мл) добавляли триэтиламин (285 г, 2,8 моль) при температуре окружающей среды. Реакционную смесь нагревали и перемешивали при 95°C в течение 7 ч. Реакционную смесь концентрировали при пониженном давлении, и полученный осадок разбавляли водой, и повышали основность с помощью раствора NaHCO₃, и экстрагировали дихлорметаном. Органические экстракты высушивали над сульфатом натрия, затем концентрировали при пониженном давлении. Полученный неочищенный продукт очищали посредством хроматографии на силикагеле с элюированием с помощью смеси 5-25% этилацетат/гексан в качестве элюентов с получением указанного в заголовке соединения в виде коричневого легкоплавкого твердого вещества (75 г, 25%).

¹H ЯМР (300 МГц, CDCl₃) δ 5,94 (s, 1H), 3,78 (s, 3H), 3,67 (br, 2H). LC-MS (ESI) масса/заряд 166 (M+H)⁺.

Стадия D. Получение 3-йод-1-метил-5-(трифторметил)-1*H*-пиразола

В раствор 1-метил-5-(трифторметил)-1*H*-пиразол-3-амина (75 г, 0,454 моль) в хлористоводородной кислоте (концентрированная, 750 мл) по каплям добавляли раствор нитрита натрия (38 г, 0,545 моль), растворенный в воде (50 мл), при -10°C. Реакционную смесь перемешивали при -10°C в течение 30 мин., затем по каплям добавляли раствор йодида калия (162 г, 0,98 моль) в воде (200 мл) при -10°C. Температуру реакционной массы медленно доводили до температуры окружающей среды в течение 1 ч. Реакционную смесь разбавляли водой и дихлорметаном. Добавляли насыщенный раствор тиосульфата натрия, что приводило к получению прозрачного раствора. Органический слой отделяли, высушивали над сульфатом натрия и концентрировали при пониженном давлении. Неочищенный продукт очищали посредством хроматографии на силикагеле с элюированием с помощью смеси 5-10% этилацетата в гексанах с получением указанного в заголовке соединения в виде светло-желтой жидкости (70 г, 55%).

¹H ЯМР (400 МГц, CDCl₃) δ 4,01 (d, *J*=0,61 Гц, 3H) 6,76 (s, 1H). LC-MS (ESI) масса/заряд 277 (M+H)⁺.

Стадия Е. Получение 1-метил-3-[(1*E*)-2-нитроэтинил]-5-(трифторметил)-1*H*-пиразола

Комплекс хлорида изопропилмагния и хлорида лития (1,3 М раствор в тетрагидрофуране, 293 мл, 0,382 ммоль) по каплям добавляли к 3-йод-1-метил-5-(трифторметил)-1*H*-пиразолу (т. е. продукту стадии D, 70 г, 0,254 моль) в тетрагидрофуране (700 мл) при -20°C и перемешивали в течение 2 ч. при той же температуре. Добавляли раствор 1-(диметиламино)-2-нитроэтилена (44,5 г 0,382 моль) в тетрагидрофуране (200 мл) и реакционную смесь медленно нагревали до комнатной температуры в течение периода времени, составлявшего 1 ч. Реакционную смесь осторожно гасили водной хлористоводородной кислотой (2 М), затем перемешивали в течение 1 ч. и экстрагировали этилацетатом. Органические слои промывали соевым раствором, высушивали над сульфатом натрия, фильтровали и концентрировали на силикагеле с очищением посредством хроматографии на силикагеле с элюированием с помощью смеси 10% этилацетат/петролейный эфир с получением указанного в заголовке соединения в виде желтого масла (35 г, 62%).

¹H ЯМР (400 МГц, CDCl₃) δ 7,89 (d, J=13,7 Гц, 1H), 7,63 (d, J=13,7 Гц, 1H), 6,88 (s, 1H), 4,05 (d, J=0,6 Гц, 3H). LC-MS (ESI) масса/заряд 222 (M+H)⁺.

Стадия F. Получение 1,3-диэтил-2-[(1*S*)-1-[1-метил-5-(трифторметил)-1*H*-пиразол-3-ил]-2-нитроэтил]пропандиоата

В раствор 1-метил-3-[(1*E*)-2-нитроэтинил]-5-(трифторметил)-1*H*-пиразола (т. е. продукта, полученного на стадии Е, 35 г, 0,158 моль) в толуоле (100 мл) добавляли диэтилмалонат (32,8 г 0,205 моль), затем бис[(1*R*,2*R*)-N1,N2-бис(фенилметил)-1,2-циклогександиамин-N1,N2]дибром-(OC-6-12)-2 никеля (0,02 экв., 2,5 г, 3,16 ммоль) и смесь перемешивали при температуре окружающей среды в течение 16 ч. Затем реакционную смесь концентрировали при пониженном давлении и полученный осадок очищали посредством колоночной хроматографии с элюированием с помощью смеси 25% этилацетат/петролейный эфир с получением указанного в заголовке соединения в виде бледного розовато-желтого масла (55 г, 92%).

¹H ЯМР: (400 МГц, CDCl₃) δ 6,53 (s, 1H), 5,01 (dd, 1H), 4,88 (dd, J=4,3, 13,9 Гц, 1H), 4,35 (dd, J=4,4, 7,7, 9,0 Гц, 1H), 4,22 (q, 2H), 4,16 (q, J=7,1 Гц, 2H), 3,90 (s, 3H), 3,89 (d, 1H), 1,26 (t, 3H), 1,20 (t, J=7,2 Гц, 3H). LC-MS (ESI) масса/заряд 382 (M+H)⁺.

Стадия G. Получение этил-(3*R*,4*R*)-4-[1-метил-5-(трифторметил)-1*H*-пиразол-3-ил]-2-оксо-3-пирролидинкарбоксилата

В раствор 1,3-диэтил-2-[(1*S*)-1-[1-метил-5-(трифторметил)-1*H*-пиразол-3-ил]-2-нитроэтил]пропандиоата (т. е. продукта, полученного на стадии F, 55 г, 21,9 ммоль) в этаноле (500 мл) при 0-5°C (ледяная баня) в атмосфере азота добавляли гексагидрат хлорида никеля(II) (5,45 г, 22,9 ммоль). Затем порциями добавляли борогидрид натрия (2,5 г, 65,7 ммоль) (с выделением пузырьков газа) в бледный зеленовато-синий раствор. Реакционная смесь становилась черной, как только добавляли первую порцию борогидрида натрия. Через 30 мин. охлаждение убирали и обеспечивали нагревание реакционной смеси до

температуры окружающей среды. Реакционную смесь перемешивали при температуре окружающей среды в течение дополнительных 3 ч. Реакционную смесь охлаждали до приблизительно 5-10°C в бане со льдом и водой и медленно гасили раствором NH₄Cl. Смесь разбавляли этилацетатом (2000 мл) и фильтровали через слой фильтрующего материала из диатомовой земли Celite® с промыванием с помощью порций воды и этилацетата. Органический слой отделяли, промывали водой, насыщенным соевым раствором, высушивали над сульфатом натрия и концентрировали при пониженном давлении. Остаток очищали посредством колоночной хроматографии с элюированием с помощью смеси 50% этилацетат/петролейный эфир с получением указанного в заголовке соединения в виде желтого масла (23 г, 52%).

¹H ЯМР: (400 МГц, CDCl₃) δ 6,91 (br s, 1H), 6,47 (s, 1H), 4,28 (q, *J*=7,2 Гц, 2H), 4,14 (q, 1H), 3,94 (d, 3H), 3,80 (d, *J*=1,0, 9,0 Гц, 1H), 3,63 (d, *J*=9,3 Гц, 1H), 3,52 (dd, *J*=8,2, 9,5 Гц, 1H), 1,32 (t, *J*=7,2 Гц, 3H). LC-MS (ESI) масса/заряд 306 (M+H)⁺.

Стадия Н. Получение (3*R*,4*R*)-4-[1-метил-5-(трифторметил)-1*H*-пиразол-3-ил]-2-оксо-3-пирролидинкарбоновой кислоты

В раствор этил-(3*R*,4*R*)-4-[1-метил-5-(трифторметил)-1*H*-пиразол-3-ил]-2-оксо-3-пирролидинкарбоксилата (т. е. продукта, полученного на стадии G, 20 г, 65,5 ммоль) в смеси метанола и тетрагидрофурана (1:1, 150 мл) добавляли гидроксид лития (3,73 г, 98,3 ммоль) в 50 мл воды при 0°C. Затем реакционную массу перемешивали при температуре окружающей среды в течение 2 ч., затем разбавляли водой и промывали метил-трет-бутиловым эфиром. Водный слой подкисляли водной хлористоводородной кислотой (1,5 н.) и экстрагировали этилацетатом. Слой этилацетата промывали насыщенным соевым раствором, высушивали над сульфатом натрия и концентрировали при пониженном давлении с получением указанного в заголовке соединения в виде бледно-желтой жидкости 14 г (77%).

¹H ЯМР: (400 МГц, CDCl₃) δ 6,59 (s, 1H), 4,09 (q, 1H), 3,94 (s, 3H), 3,85-3,77 (m, 1H), 3,72 (d, *J*=10,0 Гц, 1H), 3,66-3,58 (m, 1H). LC-MS (ESI) масса/заряд 278 (M+H)⁺.

Стадия I. Получение (3*R*,4*R*)-1-метил-4-[1-метил-5-(трифторметил)-1*H*-пиразол-3-ил]-2-оксо-3-пирролидинкарбоновой кислоты

Раствор (3*R*,4*R*)-4-[1-метил-5-(трифторметил)-1*H*-пиразол-3-ил]-2-оксо-3-пирролидинкарбоновой кислоты (т. е. продукта, полученного на стадии Н, 14 г, 50,5 ммоль) в сухом тетрагидрофуране (75 мл) добавляли в раствор *трет*-бутоксид калия (1 М раствор в тетрагидрофуране, 126 мл) в тетрагидрофуране (75 мл) при 0°C. По каплям добавляли йодметан (7,2 г 101 ммоль) при 0°C. Реакционную смесь перемешивали при температуре окружающей среды в течение 2 ч., затем разбавляли водой, подкисляли водной хлористоводородной кислотой (1,5 н.) и экстрагировали этилацетатом. Органический слой промывали насыщенным соевым раствором, высушивали над сульфатом натрия и концентрировали при пониженном давлении с получением 10 г указанного в заголовке соединения в виде бледно-желтой жидкости (68%).

¹H ЯМР: (400 МГц, CDCl₃) δ 6,68 (s, 1H), 3,97 (q, 1H), 3,94 (s, 3H), 3,76-3,68 (m, 3H),

2,99 (s, 3H). LC-MS (ESI) масса/заряд 292 (M+H)⁺.

Стадия J. Получение (3*S*,4*R*)-*N*-(2,3-дифторфенил)-1-метил-4-[1-метил-5-(трифторметил)-1*H*-пиразол-3-ил]-2-оксо-3-пирролидинкарбоксамид

В раствор (3*R*,4*R*)-1-метил-4-[1-метил-5-(трифторметил)-1*H*-пиразол-3-ил]-2-оксо-3-пирролидинкарбоновой кислоты (10 г, 34,3 ммоль) в этилацетате (100 мл) добавляли триэтиламин (10,41 г, 103 ммоль) при температуре окружающей среды. По каплям добавляли ТЗР (50% раствор в этилацетате, 32,7 г, 51,5 ммоль) при 0°C. Реакционную массу перемешивали при температуре окружающей среды в течение 12 ч., затем промывали водой, насыщенным соевым раствором, высушивали над сульфатом натрия и концентрировали при пониженном давлении. Полученный остаток очищали посредством колоночной хроматографии с элюированием с помощью смеси 50% этилацетат/петролейный эфир с получением указанного в заголовке соединения в виде светло-розового твердого вещества (10 г, 68%).

¹H ЯМР: (400 МГц, CDCl₃) δ 10,16 (br s, 1H), 8,08-8,01 (m, 1H), 7,02 (ddt, *J*=2,1, 5,9, 8,3 Гц, 1H), 6,93-6,84 (m, 1H), 6,69 (s, 1H), 4,09 (q, 1H), 3,94 (s, 3H), 3,78 (d, *J*=9,5 Гц, 1H), 3,76-3,65 (m, 2H), 2,98 (s, 3H). LC-MS (ESI) масса/заряд 403 (M+H)⁺.

ПРИМЕР СИНТЕЗА 2

Альтернативное получение (3*S*,4*R*)-*N*-(2,3-дифторфенил)-1-метил-4-[1-метил-5-(трифторметил)-1*H*-пиразол-3-ил]-2-оксо-3-пирролидинкарбоксамид (соединение 13)

Стадия А. Получение 1-метил-5-(трифторметил)-1*H*-пиразол-3-карбоксальдегида

Перемешиваемый раствор 1-метил-5-(трифторметил)-1*H*-пиразол-3-метанола (6,7 г) в дихлорметане (60 мл) охлаждали с помощью ледяной бани. Частями добавляли хлорхромат пиридиния (9,6 г) в течение 5 минут. Добавляли фильтрующий материал из диатомовой земли Celite® (15 г) и реакционную смесь перемешивали при температуре окружающей среды в течение 2,5 ч. Реакционную смесь фильтровали через пробку из фильтрующего материала из диатомовой земли Celite®, затем концентрировали при пониженном давлении при 16°C. Полученное черное масло поглощали в диэтиловом эфире и пропускали через пробку из диоксида кремния, затем концентрировали при пониженном давлении при 16°C с получением указанного в заголовке соединения в виде прозрачного масла (4,8 г).

¹H ЯМР (500 МГц, CDCl₃) δ 9,95 (s, 1H), 7,14 (s, 1H), 4,11 (m, 3H).

Альтернативное получение 1-метил-5-(трифторметил)-1*H*-пиразол-3-карбоксальдегида

Стадия А1. Получение 5,5,5-трифтор-4-гидрокси-1,1-диметокси-3-пентен-2-она

Смесь метилглиоксаль-1,1-диметилацетата (17,7 г) и этилтрифторацетата (27 г) в диэтиловом эфире (90 мл) по каплям добавляли в течение 30 мин. в перемешиваемый раствор метоксида натрия (30 вес.% в метаноле, 40 г) в диэтиловом эфире (210 мл) в атмосфере азота при -5°C. Реакционную смесь перемешивали при температуре от -5°C до 4°C в течение 2 ч., затем выливали в перемешиваемую взвесь концентрированной хлористоводородной кислоты (30 мл) и ледяной крошки (150 г). Слои разделяли и водную

фазу экстрагировали диэтиловым эфиром и метил-*трет*-бутиловым эфиром, затем объединенные органические экстракты промывали насыщенным водным раствором хлорида аммония, высушивали над сульфатом натрия и концентрировали при пониженном давлении с получением указанного в заголовке соединения в виде светло-оранжевого масла (30,5 г), которое применяли на следующей стадии без дополнительной очистки.

^1H ЯМР (500 МГц, CDCl_3 , енольный таутомер) δ 6,33 (s, 1H), 4,82 (s, 1H), 3,43 (s, 6H).

Стадия А2. Получение 3-(диметоксиметил)-4,5-дигидро-1-метил-5-(трифторметил)-1*H*-пиразол-5-ола

Раствор метилгидразина (6,9 г) в метаноле (75 мл) по каплям добавляли в течение 15 мин. в перемешиваемый раствор 5,5,5-трифтор-4-гидрокси-1,1-диметокси-3-пентен-2-она (т. е. продукта стадии А, 30,5 г) в метаноле (150 мл) в атмосфере азота при -5°C . Реакционную смесь перемешивали при температуре от -5°C до 4°C в течение 1 ч., затем концентрировали при пониженном давлении с получением оранжевого масла (34 г). Масло подвергали хроматографии на силикагеле с элюированием с помощью 0-30% метил-*трет*-бутилового эфира в дихлорметане с получением указанного в заголовке соединения в виде светло-желтого масла (23,7 г).

^1H ЯМР (500 МГц, CDCl_3) δ 4,92 (s, 1H), 3,43 (s, 3H), 3,37 (s, 3H), 3,25-3,21 (m, 1H), 2,99 (s, 3H), 2,95-2,92 (m, 1H).

Стадия А3. Получение 1-метил-5-(трифторметил)-1*H*-пиразол-3-карбоксальдегида

Концентрированную хлористоводородную кислоту (100 мл) по каплям добавляли в течение 10 мин. в перемешиваемый раствор 3-(диметоксиметил)-4,5-дигидро-1-метил-5-(трифторметил)-1*H*-пиразол-5-ола (т. е. продукта стадии А2, 31,1 г) в диэтиловом эфире (300 мл) при -36°C . Затем обеспечивали нагревание реакционной смеси до комнатной температуры и энергично перемешивали в течение 2 ч. Затем слои разделяли и водную фазу дважды экстрагировали диэтиловым эфиром. Объединенные органические экстракты промывали насыщенным водным раствором хлорида аммония (1×), высушивали над сульфатом натрия и концентрировали при пониженном давлении при температуре ниже 25°C с получением указанного в заголовке соединения в виде светло-желтого масла (18,9 г).

^1H ЯМР (500 МГц, CDCl_3) δ 9,95 (s, 1H), 7,14 (s, 1H), 4,11 (br s, 3H).

Стадия В. Получение 1-метил-3-[(1*E*)-2-нитроэтинил]-5-(трифторметил)-1*H*-пиразола

В перемешиваемый раствор 1-метил-5-(трифторметил)-1*H*-пиразол-3-карбоксальдегида (т. е. продукта стадии А или А3, 4,8 г) в метаноле (50 мл) добавляли нитрометан (1,5 мл). Смесь охлаждали до -5°C и по каплям добавляли водный гидроксид натрия (50 вес.%, 2,3 г), разбавленный водой (10 мл), в течение 15 мин. С поддержанием температуры ниже 0°C . Перемешивание продолжали в течение дополнительных 3 ч. при от 0°C до 5°C , затем реакционную смесь выливали в 1 н. водную хлористоводородную кислоту (50 мл). Реакционную смесь переносили в делительную воронку и водную фазу экстрагировали этилацетатом (3 × 50 мл). Объединенные органические экстракты

промывали соевым раствором, высушивали над сульфатом магния и концентрировали при пониженном давлении с получением желтого масла (5,5 г).

Промежуточное соединение (5,5 г), полученное таким образом, поглощали в толуоле (50 мл). Раствор охлаждали до -10°C с помощью бани с сухим льдом/ацетоном и с помощью шприца добавляли метансульфонилхлорид (2,0 мл). Затем по каплям добавляли триэтиламин (7,3 мл) в течение 15 мин. с поддержанием температуры при 0°C или ниже. Затем полученный раствор перемешивали в течение 2 ч. при той же температуре. Реакционную смесь выливали в 1 н. водную хлористоводородную кислоту (60 мл) и переносили в делительную воронку. Водную фазу экстрагировали этилацетатом (3×50 мл), затем объединенные органические экстракты промывали соевым раствором, высушивали над сульфатом магния и концентрировали при пониженном давлении. Неочищенный материал подвергали хроматографии на силикагеле с элюированием с помощью градиента, 0-10% этилацетата в гексанах, с получением указанного в заголовке соединения в виде масла янтарного цвета (3,2 г).

^1H ЯМР (500 МГц, CDCl_3) δ 7,90-7,87 (m, 1H), 7,64-7,62 (m, 1H), 6,88 (s, 1H), 4,06 (m, 3H).

Стадия С. Получение 1,3-диэтил-2-[(1*S*)-1-[1-метил-5-(трифторметил)-1*H*-пиразол-3-ил]-2-нитроэтил]пропандиоата

В перемешиваемую смесь 1-метил-3-[(1*E*)-2-нитроэтил]-5-(трифторметил)-1*H*-пиразола (т. е. продукта стадии В, 3,2 г) и диэтилмалоната (3,3 мл) в толуоле (25 мл) добавляли Ni(II)-бис[(*R, R*)-*N, N'*-дибензилциклогексан-1,2-диамин]бромид (полученный как описано в *J. Am. Chem. Soc.* **2005**, *127*, 9958-9959; 0,232 г). Полученный раствор перемешивали при температуре окружающей среды в течение 16 ч. Затем летучие вещества удаляли при пониженном давлении с получением указанного в заголовке соединения в виде масла янтарного цвета (5,7 г) которое применяли без очистки.

^1H ЯМР (500 МГц, CDCl_3) δ 6,53 (s, 1H), 5,03-4,98 (m, 1H), 4,90-4,86 (m, 1H), 4,37-4,33 (m, 1H), 4,25-4,14 (m, 4H), 3,90-3,88 (m, 4H), 1,28-1,19 (m, 6H).

Стадия D. Получение этил-(3*R,4R*)-4-[1-метил-5-(трифторметил)-1*H*-пиразол-3-ил]-2-оксо-3-пирролидинкарбоксилата

Перемешиваемую смесь 1,3-диэтил-2-[(1*S*)-1-[1-метил-5-(трифторметил)-1*H*-пиразол-3-ил]-2-нитроэтил]пропандиоата (т. е. продукта стадии С, 5,7 г), гексагидрата хлорида никеля(II) (3,55 г) и этанола (60 мл) охлаждали в ледяной бане и порциями обрабатывали борогидридом натрия (1,7 г) в течение 10 мин. Полученную смесь перемешивали при температуре окружающей среды в течение 18 ч. Затем добавляли насыщенный водный раствор хлорида аммония (100 мл) и этилацетат (100 мл) и смесь перемешивали в течение 2 ч. Слои разделяли и водный слой экстрагировали этилацетатом (2×100 мл). Объединенные органические экстракты промывали насыщенным раствором хлорида аммония (100 мл) и соевым раствором (100 мл), высушивали над сульфатом магния и концентрировали при пониженном давлении с получением указанного в заголовке соединения в виде вязкого масла слегка зеленого цвета (5,2 г) которое применяли без

очистки.

^1H ЯМР (500 МГц, CDCl_3) δ 6,67 (br s, 1H), 6,47 (s, 1H), 4,30-4,25 (m, 2H), 4,16-4,10 (m, 1H), 3,94-3,93 (m, 3H), 3,81-3,76 (m, 1H), 3,63-3,61 (m, 1H), 3,54-3,50 (m, 1H), 1,33-1,30 (m, 3H).

Стадия Е. Получение (3*R*,4*R*)-4-[1-метил-5-(трифторметил)-1*H*-пиразол-3-ил]-2-оксо-3-пирролидинкарбоновой кислоты

Смесь этил-(3*R*,4*R*)-4-[1-метил-5-(трифторметил)-1*H*-пиразол-3-ил]-2-оксо-3-пирролидинкарбоксилата (т. е. продукта стадии D, 5,2 г) и водного гидроксида натрия (50 вес.%, 4,1 г) в этаноле (50 мл) перемешивали при температуре окружающей среды в течение 3 ч. Затем реакцию смесь разбавляли водой (50 мл) и промывали диэтиловым эфиром (2 × 50 мл). Водную фазу подкисляли концентрированной хлористоводородной кислотой до pH 2 и экстрагировали этилацетатом (3 × 50 мл). Объединенные экстракты этилацетата промывали солевым раствором, высушивали над сульфатом магния и концентрировали при пониженном давлении с получением указанного в заголовке соединения в виде белого твердого вещества (3,5 г), которое применяли без дополнительной очистки.

^1H ЯМР (500 МГц, CDCl_3) δ 6,66 (s, 1H), 6,34 (br s, 1H), 4,08-4,03 (m, 1H), 3,94 (m, 3H), 3,82-3,78 (m, 1H), 3,72-3,67 (m, 2H).

Стадия F. Получение (3*R*,4*R*)-1-метил-4-[1-метил-5-(трифторметил)-1*H*-пиразол-3-ил]-2-оксо-3-пирролидинкарбоновой кислоты

Раствор (3*R*,4*R*)-4-[1-метил-5-(трифторметил)-1*H*-пиразол-3-ил]-2-оксо-3-пирролидинкарбоновой кислоты (т. е. продукта стадии E, 3,5 г) в тетрагидрофуране (10 мл) по каплям добавляли в охлажденную на ледяной бане суспензию *трет*-бутоксид калия (1 М в тетрагидрофуране, 30,3 мл) с поддержанием температуры ниже 5°C во время добавления. Полученный густой раствор перемешивали при 0°C в течение 10 мин. С помощью шприца добавляли йодметан (1,34 мл) и реакцию смесь перемешивали при температуре окружающей среды в течение дополнительных 4 ч. Растворитель удаляли при пониженном давлении и полученное твердое вещество поглощали водой (50 мл) и насыщенным водным раствором бикарбоната натрия (30 мл) и экстрагировали диэтиловым эфиром (2 × 50 мл). Водную фазу подкисляли концентрированной хлористоводородной кислотой до pH 2 и экстрагировали этилацетатом (3 × 50 мл). Объединенные экстракты этилацетата промывали солевым раствором, высушивали над сульфатом магния и концентрировали при пониженном давлении с получением указанного в заголовке соединения в виде масла янтарного цвета (3,5 г).

^1H ЯМР (500 МГц, CDCl_3) δ 6,68 (s, 1H), 3,98-3,88 (m, 4H), 3,77-3,67 (m, 3H), 2,99 (m, 3H).

Стадия G. Получение (3*S*,4*R*)-*N*-(2,3-дифторфенил)-1-метил-4-[1-метил-5-(трифторметил)-1*H*-пиразол-3-ил]-2-оксо-3-пирролидинкарбоксамид

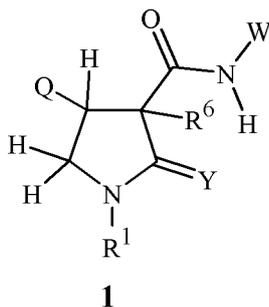
Смесь (3*R*,4*R*)-1-метил-4-[1-метил-5-(трифторметил)-1*H*-пиразол-3-ил]-2-оксо-3-пирролидинкарбоновой кислоты (т. е. продукта стадии F, 3,5 г), триэтиламина (5 мл) и 2,3-дифторанилина (1,3 мл) в дихлорметане (40 мл) охлаждали с помощью ледяной бани и

затем обрабатывали пропилфосфоновым ангидридом (50 вес.% в этилацетате, 13,0 г). Полученную смесь перемешивали при температуре окружающей среды в течение 18 ч., затем концентрировали при пониженном давлении. Неочищенный материал подвергали хроматографии на силикагеле с элюированием с помощью градиента, 0-50% этилацетат в гексанах, с получением маслянистого твердого вещества (2,3 г). Затем данный материал растирали в порошок с горячими гексанами с получением указанного в заголовке соединения в виде белого твердого вещества (2,1 г).

^1H ЯМР (500 МГц, CDCl_3) δ 10,16 (br s, 1H), 8,06-8,03 (m, 1H), 7,03-7,00 (m, 1H), 6,91-6,86 (m, 1H), 6,69 (s, 1H), 4,12-4,06 (m, 1H), 3,94 (m, 3H), 3,79-3,66 (m, 3H), 2,98 (m, 3H).

С помощью процедур, описанных в данном документе, вместе со способами, известными в уровне техники, можно получать следующие соединения из таблиц 1-16. В следующих таблицах применяются следующие сокращения. *i* означает изо, Me означает метил, Et означает этил, Pr означает пропил, *изо*-Pr означает изопропил, Ph означает фенил, OMe означает метокси, OEt означает этокси, SMe означает метилтио, S(O)Me означает метилсульфинил, и S(O)₂Me означает метилсульфонил.

ТАБЛИЦА 1



R^1 представляет собой Me, R^6 представляет собой H, W представляет собой Ph(2-F); Y представляет собой O; и Q представляет собой

| | |
|--|--|
| Пиразол-3-ил(1-Me, 5-CF ₃) | Пиразол-3-ил(1-Me, 5-OCF ₂ CF ₂ H) |
| Пиразол-3-ил(1-Et, 5-CF ₃) | Пиразол-3-ил(1-Me, 5-OCH ₂ CF ₃) |
| Пиразол-3-ил(1- <i>изо</i> -Pr, 5-CF ₃) | Пиразол-3-ил(1-Me, 4-Cl, 5-OCF ₂ H) |
| Пиразол-3-ил(1-CH ₂ CF ₃ , 5-CF ₃) | Пиразол-3-ил(1-Me, 4-Br, 5-OCF ₂ H) |
| Пиразол-3-ил(1-CHF ₂ , 5-CF ₃) | Пиразол-3-ил(1,5-диметил) |
| Пиразол-3-ил(1-Me, 5-CF ₂ CF ₃) | Пиразол-3-ил(1,5-диметил-4-Cl) |
| Пиразол-3-ил(1-Me, 5-CH ₂ CF ₃) | Пиразол-3-ил(1-Me, 5-Et) |
| Пиразол-3-ил(1-Me, 4-Cl, 5-CF ₃) | Пиразол-3-ил(1-Me, 5- <i>изо</i> -Pr) |
| Пиразол-3-ил(1-Me, 4-Br, 5-CF ₃) | Пиразол-3-ил(1-Me, 5-OMe) |
| Пиразол-3-ил(1-Me, 4-Me, 5-CF ₃) | Пиразол-3-ил(1-Me, 4-Cl, 5-OMe) |
| Пиразол-3-ил(1-Me, 5-OCF ₂ H) | Пиразол-3-ил(1-Me, 5-OEt) |
| Пиразол-3-ил(1-Me, 5-OCF ₃) | Пиразол-3-ил(1-Me, 5-O- <i>изо</i> -Pr) |

| | |
|--|--|
| Пиразол-3-ил(1-Me, 5-Cl) | Индазол-3-ил(1-CH ₂ CF ₃) |
| Пиразол-3-ил(1-Me, 5-F) | Индазол-3-ил(1-Me, 4-F) |
| Пиразол-3-ил(1-Me, 5-Br) | Индазол-3-ил(1-Me, 4-Cl) |
| Пиразол-3-ил(1-Me, 5-I) | Индазол-3-ил(1-Me, 4-Br) |
| Пиразол-3-ил(1-Et, 5-Cl) | Индазол-3-ил(1-Me, 5-F) |
| Пиразол-3-ил(1-CH ₂ CF ₃ , 5-Cl) | Индазол-3-ил(1-Me, 5-Cl) |
| Пиразол-3-ил(1-Me, 4,5-ди-Cl) | Индазол-3-ил(1-Me, 6-F) |
| Пиразол-4-ил(1-Me, 5-CF ₃) | Индазол-3-ил(1-Me, 6-Cl) |
| Пиразол-4-ил(1,5-диметил) | Индазол-3-ил(1-Me, 7-F) |
| Пиразол-4-ил(1-Me, 5-OCF ₂ H) | Индазол-3-ил(1-Me, 7-Cl) |
| Пиразол-4-ил(1,5-диметил, 3-Cl) | Индазол-3-ил(1-Me, 4,7-ди-Fl) |
| Индазол-3-ил(1-Me) | Индазол-3-ил(1-Me, 4,7-ди-Cl) |
| Индазол-3-ил(1-Et) | Индазол-3-ил(1-Me, 4,6-ди-F) |
| Индазол-3-ил(1- <i>изо</i> -Pr) | Индазол-3-ил(1-Me, 5,6-ди-Cl) |
| Индазол-3-ил(1-CF ₂ H) | |

Таблица 2 построена аналогично таблице 1 с той разницей, что заголовок строки "R¹ представляет собой Me, R⁶ представляет собой H, Y представляет собой O, W представляет собой Ph(2-F) и Q представляет собой" заменен заголовком строки, указанным для таблицы 2 ниже (т. е. W представляет собой Ph(2,3-ди-F); и Q представляет собой"). Следовательно первая запись в таблице 2 представляет собой соединение формулы **1**, где R¹ представляет собой Me, R⁶ представляет собой H, Y представляет собой O, W представляет собой Ph(2,3-ди-F); Q представляет собой пиразол-3-ил(1-Me, 5-CF₃). Таблицы 3-16 построены аналогично.

| Таблица | Заголовок строки |
|---------|---|
| 2 | R ¹ представляет собой Me, R ⁶ представляет собой H, Y представляет собой O, W представляет собой Ph(2,3-ди-F) и Q представляет собой |
| 3 | R ¹ представляет собой Me, R ⁶ представляет собой H, Y представляет собой O, W представляет собой Ph(2,4-ди-F) и Q представляет собой |
| 4 | R ¹ представляет собой Me, R ⁶ представляет собой H, Y представляет собой O, W представляет собой Ph(2,3,4-три-F) и Q представляет собой |
| 5 | R ¹ представляет собой Me, R ⁶ представляет собой H, Y представляет собой O, W представляет собой Ph(2-CF ₃) и Q представляет собой |
| 6 | R ¹ представляет собой Me, R ⁶ представляет собой H, Y представляет собой O, W представляет собой Ph(2-Me) и Q представляет собой |
| 7 | R ¹ представляет собой Me, R ⁶ представляет собой H, Y представляет собой O, W представляет собой Ph(2-NO ₂) и Q представляет собой |

| | |
|----|---|
| 8 | R ¹ представляет собой Me, R ⁶ представляет собой H, Y представляет собой O, W представляет собой Ph(2-Cl) и Q представляет собой |
| 9 | R ¹ представляет собой Me, R ⁶ представляет собой H, Y представляет собой O, W представляет собой Ph(2-SO ₂ Me) и Q представляет собой |
| 10 | R ¹ представляет собой Me, R ⁶ представляет собой H, Y представляет собой O, W представляет собой Ph(2-F,3-Cl) и Q представляет собой |
| 11 | R ¹ представляет собой Me, R ⁶ представляет собой H, Y представляет собой O, W представляет собой Ph(2-SOMe) и Q представляет собой |
| 12 | R ¹ представляет собой Me, R ⁶ представляет собой H, Y представляет собой O, W представляет собой Ph(2-SMe) и Q представляет собой |
| 13 | R ¹ представляет собой Me, R ⁶ представляет собой H, Y представляет собой O, W представляет собой Ph(2-Me,3-F) и Q представляет собой |
| 14 | R ¹ представляет собой Me, R ⁶ представляет собой H, Y представляет собой O, W представляет собой 3-пиридинил(2,6-ди-F) и Q представляет собой |
| 15 | R ¹ представляет собой Me, R ⁶ представляет собой H, Y представляет собой O, W представляет собой 3-пиридинил(2-F) и Q представляет собой |
| 16 | R ¹ представляет собой Me, R ⁶ представляет собой H, Y представляет собой O, W представляет собой 2-пиридинил(6-F) и Q представляет собой |

Соединение по настоящему изобретению в общем будет применяться в качестве гербицидного активного ингредиента в композиции, т. е. составе, с по меньшей мере одним дополнительным компонентом, выбранным из группы, состоящей из поверхностно-активных веществ, твердых разбавителей и жидких разбавителей, которые служат носителем. Ингредиенты состава или композиции выбирают так, чтобы они соответствовали физическим свойствам активного ингредиента, механизму нанесения и факторам окружающей среды, таким как тип почвы, влага и температура.

Применимые составы включают как жидкие, так и твердые композиции. Жидкие композиции включают растворы (в том числе эмульгируемые концентраты), суспензии, эмульсии (в том числе микроэмульсии, эмульсии типа "масло-в-воде", текучие концентраты и/или суспоэмульсии) и т. п., которые необязательно можно делать более густыми с образованием гелей. Общие типы водных жидких композиций представляют собой растворимый концентрат, концентрат суспензии, капсульную суспензию, концентрированную эмульсию, микроэмульсию, эмульсию типа "масло-в-воде", текучий концентрат и суспоэмульсию. Общие типы неводных жидких композиций представляют собой эмульгируемый концентрат, микроэмульгируемый концентрат, диспергируемый концентрат и масляную дисперсию.

Общие типы твердых композиций представляют собой пылевидные препараты, порошки, гранулы, пеллеты, приллированные препараты, пастилки, таблетки, заполненный

пленки (в том числе покрытия для семян) и т. п., которые могут быть диспергируемыми в воде ("смачиваемыми") или водорастворимыми. Пленки и покрытия, образованные из пленкообразующих растворов или текущих суспензий, в частности, являются применимыми для обработки семян. Активный ингредиент может быть (микро)инкапсулированным и дополнительно составленным в суспензию или твердый состав; в качестве альтернативы весь состав активного ингредиента может быть инкапсулированным (или "покрытым"). Инкапсуляция способна контролировать или замедлять высвобождение активного ингредиента. В эмульгируемой грануле объединены преимущества как состава, представляющего собой эмульгируемый концентрат, так и сухого гранулированного состава. Концентрированные композиции в основном применяются в качестве промежуточных соединений для дальнейшего составления.

Распыляемые составы, как правило, разбавляют в подходящей среде перед распылением. Такие жидкие и твердые составы составляют так, чтобы они легко разбавлялись в среде в виде спрея, обычно воде, но иногда в другой подходящей среде, такой как, ароматический или парафиновый углеводород или растительное масло. Объемы спрея могут находиться в диапазоне от приблизительно одного до нескольких тысяч литров на гектар, но более преимущественно находятся в диапазоне от приблизительно десяти до нескольких сотен литров на гектар. Распыляемые составы могут быть смешаны в баке с водой или другой подходящей средой для обработки надземной части путем применения в отношении воздуха или земли или для применения в отношении среды произрастания растения. Жидкие и сухие составы можно вносить в определенном количестве непосредственно в системы капельного орошения или вносить в определенном количестве в борозду во время высаживания.

Составы, как правило, будут содержать эффективные количества активного ингредиента, разбавителя и поверхностно-активного вещества в пределах следующих приблизительных диапазонов, сумма которых составляет не более 100 процентов по весу.

Процент по весу

| | <u>Активный ингредиент</u> | <u>Разбавитель</u> | <u>Поверхностно- активное вещество</u> |
|---|--------------------------------|--------------------|--|
| Диспергируемые в воде и водорастворимые гранулы, таблетки и порошки | 0,001-90 | 0-99,999 | 0-15 |
| Масляные дисперсии, суспензии, эмульсии, растворы (в том числе эмульгируемые | 1-50 | 40-99 | 0-50 |

концентраты)

| | | | |
|------------------------------|----------|----------|------|
| Пылевидные препараты | 1-25 | 70-99 | 0-5 |
| Гранулы и пеллеты | 0,001-99 | 5-99,999 | 0-15 |
| Концентрированные композиции | 90-99 | 0-10 | 0-2 |

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

Жидкие разбавители включают, например, воду, *N*, *N*-диметилалканамиды (например, *N*, *N*-диметилформамид), лимонен, диметилсульфоксид, *N*-алкилпирролидоны (например, *N*-метилпирролидинон), алкилфосфаты (например, триэтилфосфат), этиленгликоль, триэтиленгликоль, пропиленгликоль, дипропиленгликоль, полипропиленгликоль, пропиленкарбонат, бутиленкарбонат, парафины (например, белые минеральные масла, нормальные парафины, изопарафины), алкилбензолы, алкилнафталины, глицерин, триацетат глицерина, сорбит, ароматические углеводороды, деароматизированные алифатические углеводороды, алкилбензолы, алкилнафталины, кетоны, такие как циклогексанон, 2-гептанон, изофорон и 4-гидрокси-4-метил-2-пентанон, ацетаты, такие как изоамилацетат, гексилацетат, гептилацетат, октилацетат, нонилацетат, тридецилацетат и изоборнилацетат, другие сложные эфиры, такие как алкилированные сложные эфиры лактата, двухосновные сложные эфиры, алкил- и арилбензоаты и γ -бутиролактон, и спирты, которые могут быть линейные, разветвленные, насыщенные или ненасыщенные, такие как метанол, этанол, *n*-пропанол, изопропиловый спирт, *n*-бутанол, изобутиловый спирт, *n*-гексанол, 2-этилгексанол, *n*-октанол, деканол, изодециловый спирт, изооктадеканол, цетиловый спирт, лауриловый спирт, тридециловый спирт, олеиловый спирт, циклогексанол, тетрагидрофуруриловый спирт, диацетоновый спирт, крезол и бензиловый спирт. Жидкие разбавители также включают сложные эфиры глицерина и насыщенных и ненасыщенных жирных кислот (как правило,

C_6-C_{22}), такие как масло из семян и плодов растений (например, масла оливы, клещевины, льна, кунжута, кукурузы (маиса), арахиса, подсолнечника, виноградной косточки, сафлора, семени хлопка, сои, семени рапса, кокоса и ядра кокосового ореха), жиры животного происхождения (например, говяжий жир, свиной жир, топленый свиной жир, жир печени трески, рыбий жир) и их смеси. Жидкие разбавители также включают алкилированные жирные кислоты (например, метилированные, этилированные, бутилированные), где жирные кислоты можно получать путем осуществления гидролиза сложных эфиров глицерина из растительных и животных источников и можно очищать с помощью перегонки. Типичные жидкие разбавители описаны в Marsden, *Solvents Guide*, 2nd

Ed., Interscience, New York, 1950.

Твердые и жидкие композиции по настоящему изобретению часто содержат одно или несколько поверхностно-активных веществ. При добавлении в жидкость поверхностно-активные вещества (также известные как "поверхностно-активные средства") в общем изменяют, чаще всего снижают, поверхностное натяжение жидкости. В зависимости от природы гидрофильных и липофильных групп в молекуле поверхностно-активного вещества, поверхностно-активные вещества можно применять в качестве смачивающих средств, диспергирующих веществ, эмульгаторов или антивспенивающих средств.

Поверхностно-активные вещества можно классифицировать как неионогенные, анионные или катионные. Неионогенные поверхностно-активные вещества, применимые для данных композиций, включают без ограничения алкоксилаты спиртов, такие как алкоксилаты спиртов на основе природных и синтетических спиртов (которые могут быть разветвленными или линейными) и полученные из спиртов и оксида этилена, оксида пропилена, оксида бутилена или их смесей; этоксилаты аминов, алканоламиды и этоксилированные алканоламиды; алкоксилированные триглицериды, такие как этоксилированное соевое, касторовое и рапсовое масла; алкоксилаты алкилфенолов, такие как этоксилаты октилфенола, этоксилаты нонилфенола, этоксилаты динонилфенол и этоксилаты додецилфенола (полученные из фенолов и оксида этилена, оксида пропилена, оксида бутилена или их смесей); блок-полимеры, полученные из оксида этилена или оксида пропилена, и блок-полимеры обратного типа, где терминальные блоки получены из оксида пропилена; этоксилированные жирные кислоты; этоксилированные сложные эфиры жирных кислот и масла; этоксилированные сложные метиловые эфиры; этоксилированный тристирилфенол (в том числе те, которые получены из оксида этилена, оксида пропилена, оксида бутилена или их смесей); сложные эфиры жирных кислот, сложные эфиры глицерина, производные на основе ланолина, полиэтоксилированные сложные эфиры, такие как полиэтоксилированные сложные эфиры сорбитана и жирных кислот, полиэтоксилированные сложные эфиры сорбита и жирных кислот и полиэтоксилированные сложные эфиры глицерина и жирных кислот; другие производные сорбитана, такие как сложные эфиры сорбитана; полимерные поверхностно-активные вещества, такие как статистический сополимеры, блок-сополимеры, алкидные смолы PEG (полиэтиленгликоля), графт- или гребнеобразные полимеры и звездообразные полимеры; полиэтиленгликоли (PEG); сложные эфиры полиэтиленгликоля и жирных кислот; поверхностно-активные вещества на основе силикона и производные сахаров, такие как сложные эфиры сахарозы, алкилполигглизозиды и алкилполисахариды.

Применимые анионные поверхностно-активные вещества включают без ограничения алкиларилсульфоновые кислоты и их соли; карбоксилированные этоксилаты спирта или алкилфенола; производные дифенилсульфоната; лигнин и производные лигнина, такие как лигносульфонаты; малеиновую или янтарную кислоты или их ангидриды; олефинсульфонаты; сложные фосфатные эфиры, такие как сложные фосфатные эфиры алкоксилатов спиртов, сложные фосфатные эфиры алкоксилатов алкилфенолов и

сложные фосфатные эфиры этоксилов стирилфенола; поверхностно-активные вещества на основе белков; производные саркозина; сульфат эфира стирилфенола; сульфаты и сульфонаты масел и жирных кислот; сульфаты и сульфонаты этоксилированных алкилфенолов; сульфаты спиртов; сульфаты этоксилированных спиртов; сульфонаты аминов и амидов, такие как *N*, *N*-алкилтаураты; сульфонаты бензола, кумола, толуола, ксилола и додецил- и тридецилбензолов; сульфонаты конденсированных нафталинов; сульфонаты нафталина и алкилнафталина; сульфонаты фракционированного нефтепродукта; сульфосукцинаматы и сульфосукцинаты и их производные, такие как соли диалкилсульфосукцината.

Применимые катионные поверхностно-активные вещества включают без ограничения амиды и этоксилированные амиды; амины, такие как *N*-алкилпропандиамины, трипропилентриамины и дипропилентетраамины, и этоксилированные амины, этоксилированные диамины и пропоксилированные амины (полученные из аминов и оксида этилена, оксида пропилена, оксида бутилена или их смесей); соли аминов, такие как аминацетаты, и соли диаминов; соли четвертичного аммония, такие как четвертичные соли, этоксилированные четвертичные соли и дичетвертичные соли; и оксиды аминов, такие как оксиды алкилдиметиламинов и оксиды бис-(2-гидроксиэтил)-алкиламинов.

Также применимыми для данных композиций являются смеси неионогенных и анионных поверхностно-активных веществ или смеси неионогенных и катионных поверхностно-активных веществ. Неионогенные, анионные и катионные поверхностно-активные вещества и варианты их рекомендуемого применения раскрыты в различных опубликованных источниках, в том числе *McCutcheon's Emulsifiers and Detergents*, ежегодные американские и международные издания, публикуемые McCutcheon's Division, The Manufacturing Confectioner Publishing Co.; Sisely and Wood, *Encyclopedia of Surface Active Agents*, Chemical Publ. Co., Inc., New York, 1964; и A. S. Davidson and B. Milwidsky, *Synthetic Detergents*, Seventh Edition, John Wiley and Sons, New York, 1987.

Композиции по настоящему изобретению также могут содержать вспомогательные вещества и добавки для составления, известные специалистам в данной области как вспомогательные средства для составления (некоторые из которых можно рассматривать как функционирующие в качестве твердых разбавителей, жидких разбавителей или поверхностно-активных веществ). Такие вспомогательные вещества и добавки для составления могут обеспечивать контроль: pH (буферы), пенообразования во время обработки (противовспениватели, такие как полиорганосилоксаны), осаждения активных ингредиентов (суспендирующие средства), вязкости (тиксотропные загустители), роста микроорганизмов в контейнере (противомикробные вещества), замораживания продукта (антифризы), цвета (дисперсии красителя/пигмента), вымывания (пленкообразователи или связующие вещества), испарения (замедлитель испарения) и других свойств состава. Пленкообразователи включают, например, поливинилацетаты, сополимеры поливинилацетата, сополимер поливинилпирролидона и винилацетата, поливиниловые спирты, сополимеры поливинилового спирта и виды воска. Примеры вспомогательных

веществ и добавок для составления включают те, которые перечислены в *McCutcheon's Volume 2: Functional Materials*, ежегодные международные и североамериканские издания, публикуемые McCutcheon's Division, The Manufacturing Confectioner Publishing Co.; и публикации согласно РСТ WO 03/024222.

Соединение формулы 1 и любые другие активные ингредиенты, как правило, включают в данные композиции путем растворения активного ингредиента в растворителе или путем измельчения в жидком или сухом разбавителе. Растворы, в том числе эмульгируемые концентраты, можно получать путем простого смешивания ингредиентов. Если растворитель в жидкой композиции, предназначенной для применения в качестве эмульгируемого концентрата, является несмешиваемым с водой, то, как правило, добавляют эмульгатор для эмульгирования содержащего активный ингредиент растворителя при разбавлении водой. Взвеси активного ингредиента с диаметрами частиц, составляющими не более 2000 мкм, можно размалывать мокрым способом с применением мельницы со средой с получением частиц со средними диаметрами ниже 3 мкм. Водные взвеси можно превращать в готовые концентраты суспензии (см., например, патент США № 3060084) или дополнительно обрабатывать путем высушивания распылением с образованием диспергируемых в воде гранул. Для сухих составов обычно требуется способ размалывания сухим способом, с помощью которого получают средние диаметры частиц, находящиеся в диапазоне от 2 до 10 мкм. Пылевидные препараты и порошки можно получать путем смешивания и обычно измельчения (как, например, с помощью молотковой мельницы или струйной мельницы). Гранулы и пеллеты можно получать путем напыления активного материала на предварительно сформированные гранулированные носители или с помощью методик агломерирования. См. Browning, "Agglomeration", *Chemical Engineering*, December 4, 1967, pp 147-48, *Perry's Chemical Engineer's Handbook*, 4th Ed., McGraw-Hill, New York, 1963, страницы 8-57 и далее, и WO 91/13546. Пеллеты можно получать как описано в патенте США № 4172714. Диспергируемые в воде и водорастворимые гранулы можно получать как проинформировано в патентах США № 4144050, №3920442 и в патенте Германии № 3246493. Таблетки можно получать как проинформировано в патентах США № 5180587, № 5232701 и № 5208030. Пленки можно получать как проинформировано в патенте Великобритании № 2095558 и патенте США № 3299566.

Для дополнительной информации, касающейся области составления, см. T. S. Woods, "The Formulator's Toolbox - Product Forms for Modern Agriculture" в *Pesticide Chemistry and Bioscience, The Food-Environment Challenge*, T. Brooks and T. R. Roberts, Eds., Proceedings of the 9th International Congress on Pesticide Chemistry, The Royal Society of Chemistry, Cambridge, 1999, pp. 120-133. См. также патент США № 3235361, от кол. 6, строка 16 до кол. 7, строка 19 и примеры 10-41; патент США № 3309192, от кол. 5, строка 43 до кол. 7, строка 62 и примеры 8, 12, 15, 39, 41, 52, 53, 58, 132, 138-140, 162-164, 166, 167 и 169-182; патент США № 2891855, от кол. 3, строка 66 до кол. 5, строка 17 и примеры 1-4; Klingman, *Weed Control as a Science*, John Wiley and Sons, Inc., New York, 1961, pp 81-96;

Hance et al., *Weed Control Handbook*, 8th Ed., Blackwell Scientific Publications, Oxford, 1989; и *Developments in formulation technology*, PJB Publications, Richmond, UK, 2000.

В следующих примерах все доли в процентах приведены по весу, и все составы получены традиционными путями. Номера соединений относятся к соединениям в таблице индексов А. Без дополнительного уточнения полагают, что специалист в данной области, применяя предшествующее описание, может осуществить на практике настоящее изобретение в его наиболее полной степени. Следующие примеры, следовательно, следует рассматривать как исключительно иллюстративные и абсолютно не ограничивающие раскрытие каким-либо образом. Доли в процентах приведены по весу, за исключением случаев, где указано иное.

Пример А

Концентрат с высокой концентрацией

| | |
|--|-------|
| Соединение 13 | 98,5% |
| Аэрогель на основе диоксида кремния | 0,5% |
| Синтетический аморфный мелкодисперсный диоксид кремния | 1,0% |

Пример В

Смачиваемый порошок

| | |
|---|-------|
| Соединение 13 | 65,0% |
| Полиэтиленгликолевый эфир додецилфенола | 2,0% |
| Лигнинсульфонат натрия | 4,0% |
| Алюмосиликат натрия | 6,0% |
| Монтмориллонит (кальцинированный) | 23,0% |

Пример С

Гранула

| | |
|--|-------|
| Соединение 13 | 10,0% |
| Аттапульгитовые гранулы (нелетучее вещество, 0,71/0,30 мм; № 25-50 сита согласно U.S.S.) | 90,0% |

Пример D

Экструдированная пеллета

| | |
|-------------------------------------|-------|
| Соединение 13 | 25,0% |
| Безводный сульфат натрия | 10,0% |
| Неочищенный лигнинсульфонат кальция | 5,0% |
| Алкилнафталинсульфонат натрия | 1,0% |
| Кальциевый/магниевый бентонит | 59,0% |

Пример E

Эмульгируемый концентрат

| | |
|---------------|-------|
| Соединение 13 | 10,0% |
|---------------|-------|

| | |
|---|-------|
| Гексаолеат полиоксиэтиленсорбита | 20,0% |
| Сложный метиловый эфир C ₆ -C ₁₀ жирной кислоты | 70,0% |

Пример F

Микроэмульсия

| | |
|---|-------|
| Соединение 13 | 5,0% |
| Сополимер поливинилпирролидона и винилацетата | 30,0% |
| Алкилполиглизозид | 30,0% |
| Глицерилмоноолеат | 15,0% |
| Вода | 20,0% |

Пример G

Концентрат суспензии

| | |
|---|-------|
| Соединение 13 | 35% |
| Блок-сополимер бутилполиоксиэтилена и полипропилена | 4,0% |
| Сополимер стеариновой кислоты и полиэтиленгликоля | 1,0% |
| Стирол-акриловый полимер | 1,0% |
| Ксантановая камедь | 0,1% |
| Пропиленгликоль | 5,0% |
| Пеногаситель на основе силикона | 0,1% |
| 1,2-Бензизотиазолин-3-он | 0,1% |
| Вода | 53,7% |

Пример H

Эмульсия в воде

| | |
|---|-------|
| Соединение 13 | 10,0% |
| Блок-сополимер бутилполиоксиэтилена и полипропилена | 4,0% |
| Сополимер стеариновой кислоты и полиэтиленгликоля | 1,0% |
| Стирол-акриловый полимер | 1,0% |
| Ксантановая камедь | 0,1% |
| Пропиленгликоль | 5,0% |
| Пеногаситель на основе силикона | 0,1% |
| 1,2-Бензизотиазолин-3-он | 0,1% |
| Ароматический углеводород на основе нефтепродуктов | 20,0% |
| Вода | 58,7% |

Пример I

Масляная дисперсия

| | |
|---------------|-----|
| Соединение 13 | 25% |
|---------------|-----|

| | |
|---|-------|
| Гексаолеат полиоксиэтиленсорбита | 15% |
| Органически модифицированная бентонитовая глина | 2,5% |
| Сложный метиловый эфир жирной кислоты | 57,5% |

Настоящее изобретение также включает примеры А - I выше, с той разницей, что "соединение 13" заменено на "соединение 1", "соединение 2", "соединение 3", "соединение 4", "соединение 5", "соединение 6", "соединение 7", "соединение 8", "соединение 9", "соединение 10", "соединение 11", "соединение 12", "соединение 14", "соединение 15", "соединение 16", "соединение 17", "соединение 18", "соединение 19", "соединение 20", "соединение 21", "соединение 22", "соединение 23", "соединение 24", "соединение 25", "соединение 26", "соединение 27", "соединение 28", "соединение 29", "соединение 30", "соединение 31" и "соединение 32" выше, как описано в таблице индексов А. Результаты испытания указывают на то, что соединения по настоящему изобретению являются высокоактивными гербицидами, используемыми на предсвходовой и/или послевсходовой стадии, и/или регуляторами роста растений. Соединения по настоящему изобретению в общем демонстрируют наиболее высокую активность для контроля сорняков на послевсходовой стадии (т. е. при применении после появления всходов сорняков из почвы) и контроля сорняков на предсвходовой стадии (т. е. при применении до появления всходов сорняков из почвы). Многие из них характеризуются практической применимостью для контроля сорняков широкого спектра на пред- и/или послевсходовой стадиях на территориях, где необходим полный контроль всей растительности, как, например, около резервуаров для хранения топлива, промышленных складских участков, мест парковки, автокинотеатров, аэродромов, берегов рек, оросительных систем и других каналов для пропуска воды, около рекламных щитов и автодорожных и железнодорожных структур. Многие из соединений по настоящему изобретению являются применимыми для селективного контроля трав и широколистных сорняков в пределах смешанного комплекса сельскохозяйственных культур/сорняков на основании селективного метаболизма у сельскохозяйственных культур относительно сорняков, на основании селективной активности в участке физиологического ингибирования у сельскохозяйственных культур и сорняков, или на основании селективного размещения на или в окружающей среде смешанного комплекса сельскохозяйственных культур и сорняков. Специалист в данной области поймет, что предпочтительную комбинацию таких факторов селективности в рамках соединения или группы соединений можно легко определить путем проведения общеиспользуемых биологических и/или биохимических анализов. Соединения по настоящему изобретению могут демонстрировать толерантность в отношении важных агрономических сельскохозяйственных культур, в том числе без ограничения люцерны, ячменя, хлопка, пшеницы, рапса, видов сахарной свеклы, кукурузы (маиса), сорго, видов сои, риса, видов овса, видов арахиса, овощей, томата, картофеля, многолетних плантационных культур, в том числе кофейного дерева, дерева какао, масличной пальмы, каучуконосных растений, сахарного тростника, цитрусовых растений, видов винограда, плодовых деревьев, орехоплодных деревьев, бананового дерева, плантана, ананаса, видов

хмеля, чайного куста и лесных растений, таких как эвкалипт и хвойные растения (например, сосны ладанной), и видов дерновых растений (например, мятлика лугового, августиновой травы, овсяницы тростниковой и пальчатника). Соединения по настоящему изобретению можно применять в сельскохозяйственных культурах, генетически трансформированных или выведенных с приобретением устойчивости к гербицидам, экспрессирующих белки, токсичные для беспозвоночных вредителей (такие как токсин *Bacillus thuringiensis*), и/или экспрессирующих другие применимые признаки. Специалист в данной области поймет, что не все соединения равноценно эффективны в отношении всех сорняков. В качестве альтернативы заявляемые соединения являются применимыми для изменения роста растения.

Соединения по настоящему изобретению характеризуются как предвсходовой, так и послевсходовой гербицидной активностью с осуществлением контроля нежелательной растительности путем уничтожения или повреждения растительности или снижения в отношении ее роста, при этом соединения можно практически применять с помощью различных способов, в которые вовлечено приведение гербицидно эффективного количества соединения по настоящему изобретению или композиции, содержащей указанное соединение и по меньшей мере одно из поверхностно-активного вещества, твердого разбавителя или жидкого разбавителя, в контакт с надземной частью или другой частью нежелательной растительности или со средой произрастания нежелательной растительности, такой как почва или вода, в которой растет нежелательная растительность или которая окружает семя или другие части для размножения нежелательной растительности.

Гербицидно эффективное количество соединений по настоящему изобретению определяется числом факторов. Такие факторы включают выбранный состав, способ применения, количество и тип присутствующей растительности, условия выращивания и т. д. В целом гербицидно эффективное количество соединений по настоящему изобретению составляет от приблизительно 0,001 до 20 кг/га с предпочтительным диапазоном, составляющим от приблизительно 0,004 до 1 кг/га. Специалист в данной области может легко определить гербицидно эффективное количество, необходимое для требуемого уровня контроля сорняков.

В одном обычном варианте осуществления соединения по настоящему изобретению применяют, как правило, в составленной композиции в отношении участка, содержащего желательную растительность (например, сельскохозяйственные культуры) и нежелательную растительность (т. е. сорняки), обе из которых могут представлять собой семена, всходы и/или растения на более поздней стадии, в контакте со средой роста (например, почвой). В данном участке композицию, содержащую соединение по настоящему изобретению, можно непосредственно применять в отношении растения или его части, в частности нежелательной растительности, и/или в отношении среды роста в контакте с растением.

Хотя, как правило, соединения по настоящему изобретению применяют для

контроля нежелательной растительности, при этом контакт желательной растительности в обрабатываемом участке с соединениями по настоящему изобретению может привести к сверхаддитивным или синергетическим эффектам с генетическими признаками у желательной растительности, в том числе признаками, включенными посредством генетической модификации. Например, устойчивость к травоядным вредителям-насекомым или заболеваниям растений, толерантность к биотическим/абиотическим стрессовым факторам или стабильность при хранении могут быть большими, чем ожидаемые вследствие генетических признаков у желаемой растительности.

Соединения по настоящему изобретению также можно смешивать с одним или несколькими другими биологически активными соединениями или средствами, в том числе гербицидами, антидотами гербицидов, фунгицидами, инсектицидами, нематоцидами, бактерицидами, акарицидами, регуляторами роста, такими как ингибиторы линьки насекомых и стимуляторы корнеобразования, химическими стерилизаторами, химическими сигнальными веществами, репеллентами, аттрактантами, феромонами, стимуляторами поедания, питательными веществами для растений, другими биологически активными соединениями или энтомопатогенными бактериями, вирусом или грибами, с образованием многокомпонентного пестицида, который обеспечивает еще более широкий спектр защиты в области сельского хозяйства. Смеси соединений по настоящему изобретению с другими гербицидами могут расширять спектр активности в отношении дополнительных видов сорняков и подавлять распространение любых устойчивых биотипов. Таким образом настоящее изобретение также относится к композиции, которая содержит соединение формулы **1** (в гербицидно эффективном количестве) и по меньшей мере одно дополнительное биологически активное соединение или средство (в биологически эффективном количестве) и может дополнительно содержать по меньшей мере одно из поверхностно-активного вещества, твердого разбавителя или жидкого разбавителя. Другие биологически активные соединения или средства можно составлять в композиции, содержащие по меньшей мере одно из поверхностно-активного вещества, твердого или жидкого разбавителя. Для смесей по настоящему изобретению одно или несколько других биологически активный соединений или средств могут быть составлены вместе с соединением формулы **1** с образованием предварительной смеси, или одно или несколько других биологически активных соединений или средств можно составлять отдельно от соединения формулы **1** и объединять составы вместе перед применением (например, в резервуаре опрыскивателя) или в качестве альтернативы применять последовательно.

Смесь одного или нескольких из следующих гербицидов с соединением по данному изобретению может быть, в частности, применима для контроля сорняков: ацетохлор, ацифлуорфен и его натриевая соль, аклонифен, акролеин (2-пропеналь), алахлор, аллоксидим, аметрин, амикарбазон, амидосульфурон, аминоклопирахлор и его сложные эфиры (например, метиловый, этиловый) и соли (например, натриевая, калиевая), аминокпиралид, амитрол, сульфамат аммония, анилофос, асулам, атразин, азимсульфурон,

бифлубутамид, бифлебутамид-М, беназолин, беназолин-этил, бенкарбазон, бенфлуралин, бенфуресат, бенсульфурон-метил, бенсулид, бентазон, бензобициклон, бензофенап, бициклопирон, бифенокс, биланафос, биспирибак и его натриевая соль, бромацил, бромобутид, бромофеноксим, бромоксинил, октаноат бромоксинила, бутахлор, бутафенацил, бутамифос, бутралин, бутроксидим, бутилат, кафенстрол, карбетамид, карфентразон-этил, катехин, хлометоксифен, хлорамбен, хлорбромурон, хлорфлуренол-метил, хлоридазон, хлоримурон-этил, хлоротолурон, хлорпрофам, хлорсульфурон, хлортал-диметил, хлортиамид, цинидон-этил, цинметилин, циносульфурон, клацифос, клефоксидим, клетодим, клодинафоп-пропаргил, кломазон, кломепроп, клопиралид, клопиралид-оламин, клорансулам-метил, кумилурон, цианазин, циклоат, циклопириморат, циклосульфамурон, циклоксидим, цигалофоп-бутил, 2,4-D и его бутотиловый, бутиловый, изоктиловый и изопропиловый сложные эфиры и его диметиламмониевая, диоламиновая и троламиновая соли, даимурон, далапон, далапон-натрий, дазомет, 2,4-DB и его диметиламмониевая, калиевая и натриевая соли, десмедифам, десметрин, дикамба и ее дигликольаммониевая, диметиламмониевая, калиевая и натриевая соли, дихлобенил, дихлорпроп, диклофоп-метил, диклосулам, метилсульфат дифензоквата, дифлуфеникан, дифлуфензопир, димефурон, димепиперат, диметахлор, диметаметрин, диметенамид, диметенамид-П, диметипин, диметиларсиновая кислота и ее натриевая соль, динитрамин, динотерб, дифенамид, дибромид диквата, дитиопир, диурон, DNOC, эндотал, ЕРТС, эспрокарб, эталфлуралин, этаметсульфурон-метил, этиозин, этофумезат, этоксифен, этокисульфурон, этобензанид, феноксапроп-этил, феноксапроп-П-этил, феноксасульфен, фенквинотрион, фентразамид, фенурон, фенурон-ТСА, флампроп-метил, флампроп-М-изопропил, флампроп-М-метил, флазасульфурон, флорасулам, флуазифоп-бутил, флуазифоп-П-бутил, флуазолат, флукарбазон, флусетосульфурон, флухлоралин, флуфенацет, флуфенпир, флуфенпир-этил, флуметсулам, флумиклорак-пентил, флумиоксазин, флуометурон, флуорогликофен-этил, флупоксам, флупирсульфурон-метил и его натриевая соль, флуренол, флуренол-бутил, флуридон, флуорохлоридон, флуороксибир, флуртамон, флутиацет-метил, фомесафен, форамсульфурон, фосамин-аммоний, глюфосинат, глюфосинат-аммоний, глюфосинат-П, глифосат и его соли, такие как аммониевая, изопропиламмониевая, калиевая, натриевая (в том числе сесквинатриевая) и тримесиевая (в качестве альтернативы называемая сульфосат), галауксифен, галауксифен-метил, галосульфурон-метил, галоксифоп-этиол, галоксифоп-метил, гексазиносин, гидантоцидин, имазаметабенз-метил, имазамокс, имазапик, имазапир, имазапир, имазапир-аммоний, имазетапир, имазетапир-аммоний, имазосульфурон, инданофан, индизифлам, иофенсульфурон, йодосульфурон-метил, иоксинил, октаноат иоксинила, иоксинил-натрий, ипфенкарбазон, изопротурон, изоурон, изоксабен, изоксафлютол, изоксахлортол, лактофен, ленацил, линурон, малеиновый гидразид, МСРА и его соли (например, МСРА-диметиламмоний, МСРА-калий и МСРА-натрий, сложные эфиры (например, МСРА-2-этилгексил, МСРА-бутотил) и сложные тиоэфиры (например, МСРА-тиоэтил), МСРВ и его соли (например, МСРВ-натрий) и сложные эфиры (например, МСРВ-

этил), мекопроп, мекопроп-П, мефенацет, мефлуидид, мезосульфурон-метил, мезотрион, метам-натрий, метамифоп, метамитрон, метазахлор, метазосульфурон, метабензтиазурон, метиларсоновая кислота и ее кальциевая, моноаммониевая, моносодиевая и динатриевая соли, метилдимрон, метобензурон, метобромурон, метолахлор, *C*-метолахлор, метосулам, метоксурон, метрибузин, метсульфурон-метил, молинат, монолинурон, напроанилид, напропамид, напропамид-М, напталам, небурон, никосульфурон, норфлуразон, орбенкарб, ортосульфамурон, оризалин, оксадиаргил, оксадиазон, оксасульфурон, оксазикломефон, оксифлуорфен, дихлорид параквата, пебулат, пеларгоновая кислота, пендиметалин, пеносулам, пентанохлор, пентоксазон, перфлуидон, петоксамид, петоксиамид, фенмедифам, пихлорам, пихлорам-калий, пиколинафен, пиноксаден, пиперофос, претилахлор, примисульфурон-метил, продиамин, профоксидим, прометон, прометрин, пропахлор, пропанил, пропаквизафоп, пропазин, профам, пропизохлор, пропоксикарбазон, пропирисульфурон, пропизамид, просульфоккарб, просульфурон, пираклонил, пирафлуфен-этил, пирасульфотол, пиразогил, пиразолинат, пиразоксифен, пиразосульфурон-этил, пирибензоксим, пирибутикарб, пиридат, пирифталид, пириминобак-метил, пиримисульфам, пиритиобак, пиритиобак-натрий, пироксасульфам, пироксулам, квинкларак, квинмерак, квинокламин, квизалофоп-этил, квизалофоп-П-этил, квизалофоп-П-тефурил, римсульфурон, сафлуфенацил, сетоксидим, сидурон, симазин, симетрин, сулькотрион, сульфентразон, сульфометурон-метил, сульфосульфурон, 2,3,6-ТВА, ТСА, ТСА-натрий, тебутам, тебутиурон, тефурилтрион, темботрион, тепралоксидим, тербацил, тербуметон, тербутилазин, тербутрин, тенилхлор, тиазопир, тиенкарбазон, тифенсульфурон-метил, тиобенкарб, тиафенацил, тиокарбазил, толпиралат, топрамезон, тралкоксидим, триаллат, триафамон, триасульфурон, триазифлам, трибенурон-метил, трихлопир, трихлопир-бутотил, трихлопир-триэтиламмоний, тридифан, триэтазин, трифлорисульфурон, трифлудимоксазин, трифлуралин, трифлусульфурон-метил, тритосульфурон, вернолат, 3-(2-хлор-3,6-дифторфенил)-4-гидрокси-1-метил-1,5-нафтиридин-2(1*H*)-он, 5-хлор-3-[(2-гидрокси-6-оксо-1-циклогексен-1-ил)карбонил]-1-(4-метоксифенил)-2(1*H*)-хиноксалинон, 2-хлор-*N*-(1-метил-1*H*-тетразол-5-ил)-6-(трифторметил)-3-пиридинкарбоксамид, 7-(3,5-дихлор-4-пиридинил)-5-(2,2-дифторэтил)-8-гидроксипиридо[2,3-*b*]пиразин-6(5*H*)-он, 4-(2,6-диэтил-4-метилфенил)-5-гидрокси-2,6-диметил-3(2*H*)-пиридазинон, 5-[[2,6-дифторфенил)метокси]метил]-4,5-дигидро-5-метил-3-(3-метил-2-тиенил)изоксазол (ранее метиоксолин), 4-(4-фторфенил)-6-[(2-гидрокси-6-оксо-1-циклогексен-1-ил)карбонил]-2-метил-1,2,4-триазин-3,5(2*H*,4*H*)-дион, метил-4-амино-3-хлор-6-(4-хлор-2-фтор-3-метоксифенил)-5-фтор-2-пиридинкарбоксилат, 2-метил-3-(метилсульфонил)-*N*-(1-метил-1*H*-тетразол-5-ил)-4-(трифторметил)бензамид и 2-метил-*N*-(4-метил-1,2,5-оксадиазол-3-ил)-3-(метилсульфинил)-4-(трифторметил)бензамид.

Другие гербициды также включают биогербициды, такие как *Alternaria destruens* Simmons, *Colletotrichum gloeosporioides* (Penz.) Penz. и Sacc., *Drechslera monoceras* (MTB-951), *Myrothecium verrucaria* (Albertini & Schweinitz) Ditmar: Fries, *Phytophthora palmivora* (Butl.) Butl. и *Puccinia thlaspeos* Schub.

Соединения по настоящему изобретению также можно применять в комбинации с регуляторами роста растений, такими как авиглицин, *N*-(фенилметил)-1*H*-пурин-6-амин, эпоколеон, гиббереллиновая кислота, гибберелин А₄ и А₇, белок гарпин, хлорид мепиквата, прогексадион-кальций, прогидрожасмон, нитрофенолат натрия и тринексапак-метил, и организмами-модификаторами роста растений, такими как *Bacillus cereus*, штамм ВР01.

Общие источники, касающиеся защитных средств, применяемых в области сельского хозяйства (т. е. гербицидов, антидотов гербицидов, инсектицидов, фунгицидов, нематоцидов, акарицидов и биологических средств), включают *The Pesticide Manual, 13th Edition*, С. D. S. Tomlin, Ed., British Crop Protection Council, Farnham, Surrey, U.K., 2003 и *The BioPesticide Manual, 2nd Edition*, L. G. Copping, Ed., British Crop Protection Council, Farnham, Surrey, U.K., 2001.

Для вариантов осуществления, где применяют один или несколько таких различных партнеров для смешивания, партнеры для смешивания, как правило, применяют в количестве, аналогичном количеству, общепринятому в случае, когда партнеры для смешивания применяют отдельно. Более конкретно в смесях активные ингредиенты часто применяют в норме внесения, составляющей от половины до полной нормы внесения, указанной на маркировках продуктов для применения активного ингредиента отдельно. Такие количества перечислены в источниках, таких как *The Pesticide Manual* и *The BioPesticide Manual*. Весовое соотношение таких различных партнеров для смешивания (в общем) и соединения формулы 1, как правило, составляет от приблизительно 1:3000 до приблизительно 3000:1. Стоит отметить весовые соотношения от приблизительно 1:300 до приблизительно 300:1 (например, соотношения от приблизительно 1:30 до приблизительно 30:1). Специалист в данной области может легко определить путем простого экспериментирования биологически эффективные количества активных ингредиентов, необходимых для требуемого спектра биологической активности. Будет очевидно, что включение таких дополнительных компонентов может расширять спектр контролируемых сорняков сверх спектра, контролируемого соединением формулы 1 отдельно.

В некоторых случаях комбинации соединения по настоящему изобретению с другими биологически активными (в частности, гербицидными) соединениями или средствами (т. е. активными ингредиентами) могут приводить к большему, чем аддитивный (т. е. синергетическому), эффекту в отношении сорняков и/или менее, чем аддитивному эффекту (т. е. предохраняющему), в отношении сельскохозяйственных культур или других желательных растений. Снижение количества активных ингредиентов, высвобождаемых в окружающую среду с обеспечением эффективного контроля вредителей, всегда является необходимым. Возможность применять большие количества активных ингредиентов с получением более эффективного контроля сорняков без избыточного повреждения сельскохозяйственных культур также является необходимой. Если возникает синергетический эффект гербицидных активных ингредиентов в отношении сорняков при нормах применения, обеспечивающих с агрономической точки зрения удовлетворительные уровни контроля сорняков, то такие комбинации могут быть преимущественными для

снижения цены производства сельскохозяйственных культур и уменьшения нагрузки на окружающую среду. Если возникает предохраняющий эффект гербицидных активных ингредиентов в отношении сельскохозяйственных культур, то такие комбинации могут быть преимущественными для повышения защиты сельскохозяйственных культур путем снижения конкуренции с сорняками.

Следует отметить комбинацию соединения по настоящему изобретению с по меньшей мере одним другим гербицидным активным ингредиентом. Отдельно стоит отметить такую комбинацию, где другой гербицидный активный ингредиент характеризуется местом приложения действия, отличным от такового соединения по настоящему изобретению. В некоторых случаях комбинация с по меньшей мере одним другим гербицидным активным ингредиентом, характеризующимся аналогичным спектром контроля, но отличным местом приложения действия, в частности, будет преимущественной для регулирования устойчивости. Таким образом, композиция по настоящему изобретению может дополнительно содержать (в гербицидно эффективном количестве) по меньшей мере один дополнительный гербицидный активный ингредиент, характеризующийся аналогичным спектром контроля, но отличным местом приложения действия.

Соединения по настоящему изобретению также можно применять в комбинации с антидотами гербицидов, такими как аллидохлор, беноксакор, клоквиносет-мексил, кумилурон, циометринил, ципросульфонамид, даимурон, дихлормид, дициклонон, диэтолат, димепиперат, фенхлоразол-этил, фенклорим, флуразол, флуксофеним, фурилазол, изоксадифен-этил, мефенпир-диэтил, мефенат, нафталиновый ангидрид метоксифенона (1,8-нафталиновый ангидрид), оксабетринил, *N*-(аминокарбонил)-2-метилбензолсульфонамид, *N*-(аминокарбонил)-2-фторбензолсульфонамид, 1-бром-4-[(хлорметил)сульфонил]бензол (BCS), 4-(дихлорацетил)-1-окса-4-азоспиро[4.5]декан (MON 4660), 2-(дихлорметил)-2-метил-1,3-диоксолан (MG 191), этил-1,6-дигидро-1-(2-метоксифенил)-6-оксо-2-фенил-5-пиримидинкарбоксилат, 2-гидрокси-*N*, *N*-диметил-6-(трифторметил)пиридин-3-карбоксамид и 3-оксо-1-циклогексен-1-ил-1-(3,4-диметилфенил)-1,6-дигидро-6-оксо-2-фенил-5-пиримидинкарбоксилат, 2,2-дихлор-1-(2,2,5-триметил-3-оксазолидинил)-этанон и 2-метокси-*N*-[[4-[[[метиламино]карбонил]амино]фенил]сульфонил]-бензамид, с повышением безопасности в отношении определенных сельскохозяйственных культур. Эффективные с точки зрения обеспечения эффекта антидота количества антидотов гербицидов можно применять в то же время, что и соединения по настоящему изобретению, или применять в качестве средств для обработки семян. Следовательно, один аспект настоящего изобретения относится к гербицидной смеси, содержащей соединение по настоящему изобретению и эффективное с точки зрения обеспечения эффекта антидота количество антидота гербицида. Обработка семян является, в частности, применимой для селективного контроля сорняков, поскольку она физически ограничивает обеспечение эффекта антидота сельскохозяйственными культурами растений. Следовательно, в частности, применимый вариант осуществления

настоящего изобретения представляет собой способ осуществления селективного контроля роста нежелательной растительности в сельскохозяйственной культуре, включающий приведение участка с сельскохозяйственной культурой в контакт с гербицидно эффективным количеством соединения по настоящему изобретению, где семя, из которого выращена сельскохозяйственная культура, обрабатывают эффективным с точки зрения обеспечения эффекта антидота количеством антидота. Эффективные с точки зрения обеспечения эффекта антидота количества антидотов могут быть легко определены специалистом в данной области путем простого экспериментирования.

Соединения по настоящему изобретению также можно смешивать с (1) полинуклеотидами, включая без ограничения ДНК, РНК и/или химически модифицированные нуклеотиды, влияющие на количество конкретной мишени посредством регуляции по типу отрицательной связи, интерференции, подавления или сайленсинга генетически получаемого транскрипта, что оказывает гербицидный эффект; или (2) полинуклеотидами, включая без ограничения ДНК, РНК и/или химически модифицированные нуклеотиды, влияющие на количество конкретной мишени посредством регуляции по типу отрицательной связи, интерференции, подавления или сайленсинга генетически получаемого транскрипта, что оказывает предохраняющий эффект.

Следует отметить композицию, содержащую соединение по настоящему изобретению (в гербицидно эффективном количестве), по меньшей мере один дополнительный активный ингредиент, выбранный из группы, состоящей из других гербицидов и антидотов гербицидов (в эффективном количестве) и по меньшей мере один компонент, выбранный из группы, состоящей из поверхностно-активных веществ, твердых разбавителей и жидких разбавителей.

Для лучшего контроля нежелательной растительности (например, более низкой нормы применения, например, вследствие синергизма, более широкого спектра контролируемых сорняков или усиленной безопасности в отношении сельскохозяйственных культур) или для предотвращения развития устойчивых сорняков предпочтительными являются смеси соединения по настоящему изобретению с гербицидом, выбранным из группы, состоящей из атразина, азимсульфурина, бифлутамида, *S*-бифлутамида, бензизотиазолинона, бикслозона, карфентразон-этила, хлоримурон-этила, хлорсульфурон-метила, кломазона, клопиралид-калия, клорансулам-метила, 2-[(2,5-дихлорфенил)метил]-4,4-диметил-3-изоксазолидинона, этаметсульфурон-метила, флуметсулама, 4-(4-фторфенил)-6-[(2-гидрокси-6-оксо-1-циклогексен-1-ил)карбонил]-2-метил-1,2,4-триазин-3,5-(2*H*,4*H*)-диона, флупирсульфурон-метила, флутиацет-метила, фомесафена, имазетапира, ленацила, мезотриона, метрибузина, метсульфурон-метила, петоксамида, пихлорама, пироксасульфона, квинклорака, римсульфурина, *S*-метолахлора, сульфентразона, тифенсульфурон-метила, трифлусульфурон-метила и трибенурон-метила.

В таблице А1 перечислены конкретные комбинации компонента (а) с компонентом

(b), являющиеся иллюстрациями смесей, композиций и способов по настоящему изобретению. Соединение 13 в столбце компонент (a) определено в таблице индексов А. Во втором столбце таблицы А1 перечислено конкретное соединение, представляющее собой компонент (b) (например, "2,4-D" в первой строке). В третьей, четвертой и пятой колонках таблицы А1 перечислены диапазоны весовых соотношений для норм, при которых соединение, представляющее собой компонент (a), как правило, применяют для выращиваемой на полях сельскохозяйственной культуры по отношению к таким для компонента (b) (т. е. (a):(b)). Таким образом, например, в первой строке таблицы А1 конкретно раскрыта комбинация компонента (a) (т. е. соединение 13 в таблице индексов А) с 2,4-D, как правило, применяемая в весовом соотношении 1:192-6:1. Остальные строки таблицы А1 следует истолковывать подобным образом.

ТАБЛИЦА А1

| Компонент (a) (№ соединения) | Компонент (b) | Типичное весовое соотношение | Более типичное весовое соотношение | Наиболее типичное весовое соотношение |
|------------------------------------|--------------------|------------------------------------|---|--|
| 13 | 2,4-D | 1:192-6:1 | 1:64-2:1 | 1:24-1:3 |
| 13 | Ацетохлор | 1:768-2:1 | 1:256-1:2 | 1:96-1:11 |
| 13 | Ацифлуорфен | 1:96-12:1 | 1:32-4:1 | 1:12-1:2 |
| 13 | Аклонифен | 1:857-2:1 | 1:285-1:3 | 1:107-1:12 |
| 13 | Алахлор | 1:768-2:1 | 1:256-1:2 | 1:96-1:11 |
| 13 | Аметрин | 1:384-3:1 | 1:128-1:1 | 1:48-1:6 |
| 13 | Амикарбазон | 1:192-6:1 | 1:64-2:1 | 1:24-1:3 |
| 13 | Амидосульфурон | 1:6-168:1 | 1:2-56:1 | 1:1-11:1 |
| 13 | Аминоциклопирахлор | 1:48-24:1 | 1:16-8:1 | 1:6-2:1 |
| 13 | Аминопиралид | 1:20-56:1 | 1:6-19:1 | 1:2-4:1 |
| 13 | Амитрол | 1:768-2:1 | 1:256-1:2 | 1:96-1:11 |
| 13 | Анилофос | 1:96-12:1 | 1:32-4:1 | 1:12-1:2 |
| 13 | Асулам | 1:960-2:1 | 1:320-1:3 | 1:120-1:14 |
| 13 | Атразин | 1:192-6:1 | 1:64-2:1 | 1:24-1:3 |
| 13 | Азимсульфурон | 1:6-168:1 | 1:2-56:1 | 1:1-11:1 |
| 13 | Бефлубутамид | 1:342-4:1 | 1:114-2:1 | 1:42-1:5 |
| 13 | Бефлубутамид-М | 1:171-4:0,5 | 1:62-2:0,5 | 1:21-1: |
| 13 | Бенфуресат | 1:617-2:1 | 1:205-1:2 | 1:77-1:9 |
| 13 | Бенсульфурон-метил | 1:25-45:1 | 1:8-15:1 | 1:3-3:1 |
| 13 | Бентазон | 1:192-6:1 | 1:64-2:1 | 1:24-1:3 |

| | | | | |
|----|----------------------|------------|-----------|------------|
| 13 | Бензобициклон | 1:85-14:1 | 1:28-5:1 | 1:10-1:2 |
| 13 | Бензофенап | 1:257-5:1 | 1:85-2:1 | 1:32-1:4 |
| 13 | Бициклопирон | 1:42-27:1 | 1:14-9:1 | 1:5-2:1 |
| 13 | Бифенокс | 1:257-5:1 | 1:85-2:1 | 1:32-1:4 |
| 13 | Биспирибак-натрий | 1:10-112:1 | 1:3-38:1 | 1:1-7:1 |
| 13 | Бикслозон | 1:384-3:1 | 1:128-1:1 | 1:48-1:6 |
| 13 | Бромацил | 1:384-3:1 | 1:128-1:1 | 1:48-1:6 |
| 13 | Бромобутид | 1:384-3:1 | 1:128-1:1 | 1:48-1:6 |
| 13 | Бромоксинил | 1:96-12:1 | 1:32-4:1 | 1:12-1:2 |
| 13 | Бутахлор | 1:768-2:1 | 1:256-1:2 | 1:96-1:11 |
| 13 | Бутафенацил | 1:42-27:1 | 1:14-9:1 | 1:5-2:1 |
| 13 | Бутилат | 1:1542-1:2 | 1:514-1:5 | 1:192-1:22 |
| 13 | Карфенстрол | 1:192-6:1 | 1:64-2:1 | 1:24-1:3 |
| 13 | Карфентразон-этил | 1:128-9:1 | 1:42-3:1 | 1:16-1:2 |
| 13 | Хлоримурон-этил | 1:8-135:1 | 1:2-45:1 | 1:1-9:1 |
| 13 | Хлоротолурон | 1:768-2:1 | 1:256-1:2 | 1:96-1:11 |
| 13 | Хлорсульфурон | 1:6-168:1 | 1:2-56:1 | 1:1-11:1 |
| 13 | Цинкосульфурон | 1:17-68:1 | 1:5-23:1 | 1:2-5:1 |
| 13 | Цинидон-этил | 1:384-3:1 | 1:128-1:1 | 1:48-1:6 |
| 13 | Цинметилин | 1:34-34:1 | 1:11-12:1 | 1:4-3:1 |
| 13 | Клацифос | 1:34-34:1 | 1:11-12:1 | 1:4-3:1 |
| 13 | Клетодим | 1:48-24:1 | 1:16-8:1 | 1:6-2:1 |
| 13 | Клодинафоп-пропаргил | 1:20-56:1 | 1:6-19:1 | 1:2-4:1 |
| 13 | Кломазон | 1:384-3:1 | 1:128-1:1 | 1:48-1:6 |
| 13 | Кломепроп | 1:171-7:1 | 1:57-3:1 | 1:21-1:3 |
| 13 | Клопиралид | 1:192-6:1 | 1:64-2:1 | 1:24-1:3 |
| 13 | Клорансулам-метил | 1:12-96:1 | 1:4-32:1 | 1:1-6:1 |
| 13 | Кумилурон | 1:384-3:1 | 1:128-1:1 | 1:48-1:6 |
| 13 | Цианазин | 1:384-3:1 | 1:128-1:1 | 1:48-1:6 |
| 13 | Циклопириморат | 1:17-68:1 | 1:5-23:1 | 1:2-5:1 |
| 13 | Циклосульфамурон | 1:17-68:1 | 1:5-23:1 | 1:2-5:1 |
| 13 | Циклоксидим | 1:96-12:1 | 1:32-4:1 | 1:12-1:2 |
| 13 | Цигалофоп | 1:25-45:1 | 1:8-15:1 | 1:3-3:1 |

| | | | | |
|----|-----------------------|------------|-----------|------------|
| 13 | Даимурон | 1:192-6:1 | 1:64-2:1 | 1:24-1:3 |
| 13 | Десмедифам | 1:322-4:1 | 1:107-2:1 | 1:40-1:5 |
| 13 | Дикамба | 1:192-6:1 | 1:64-2:1 | 1:24-1:3 |
| 13 | Дихлобенил | 1:1371-1:2 | 1:457-1:4 | 1:171-1:20 |
| 13 | Дихлорпроп | 1:925-2:1 | 1:308-1:3 | 1:115-1:13 |
| 13 | Диклофоп-метил | 1:384-3:1 | 1:128-1:1 | 1:48-1:6 |
| 13 | Диклосулам | 1:10-112:1 | 1:3-38:1 | 1:1-7:1 |
| 13 | Дифензокват | 1:288-4:1 | 1:96-2:1 | 1:36-1:4 |
| 13 | Дифлуфеникан | 1:857-2:1 | 1:285-1:3 | 1:107-1:12 |
| 13 | Дифлуфензопир | 1:12-96:1 | 1:4-32:1 | 1:1-6:1 |
| 13 | Диметахлор | 1:768-2:1 | 1:256-1:2 | 1:96-1:11 |
| 13 | Диметаметрин | 1:192-6:1 | 1:64-2:1 | 1:24-1:3 |
| 13 | Диметенамид-П | 1:384-3:1 | 1:128-1:1 | 1:48-1:6 |
| 13 | Дитиопир | 1:192-6:1 | 1:64-2:1 | 1:24-1:3 |
| 13 | Диурон | 1:384-3:1 | 1:128-1:1 | 1:48-1:6 |
| 13 | ЕРТС | 1:768-2:1 | 1:256-1:2 | 1:96-1:11 |
| 13 | Эспрокарб | 1:1371-1:2 | 1:457-1:4 | 1:171-1:20 |
| 13 | Эталфлуралин | 1:384-3:1 | 1:128-1:1 | 1:48-1:6 |
| 13 | Этаметсульфурон-метил | 1:17-68:1 | 1:5-23:1 | 1:2-5:1 |
| 13 | Этоксифен | 1:8-135:1 | 1:2-45:1 | 1:1-9:1 |
| 13 | Этоксисульфурон | 1:20-56:1 | 1:6-19:1 | 1:2-4:1 |
| 13 | Этобензанид | 1:257-5:1 | 1:85-2:1 | 1:32-1:4 |
| 13 | Феноксапроп-этил | 1:120-10:1 | 1:40-4:1 | 1:15-1:2 |
| 13 | Феноксасульфон | 1:85-14:1 | 1:28-5:1 | 1:10-1:2 |
| 13 | Фенквинотрион | 1:17-68:1 | 1:5-23:1 | 1:2-5:1 |
| 13 | Фентразамид | 1:17-68:1 | 1:5-23:1 | 1:2-5:1 |
| 13 | Флазасульфурон | 1:17-68:1 | 1:5-23:1 | 1:2-5:1 |
| 13 | Флорасулам | 1:2-420:1 | 1:1-140:1 | 2:1-27:1 |
| 13 | Флуазифоп-бутил | 1:192-6:1 | 1:64-2:1 | 1:24-1:3 |
| 13 | Флукарбазон | 1:8-135:1 | 1:2-45:1 | 1:1-9:1 |
| 13 | Флусетосульфурон | 1:8-135:1 | 1:2-45:1 | 1:1-9:1 |
| 13 | Флуфенацет | 1:257-5:1 | 1:85-2:1 | 1:32-1:4 |
| 13 | Флуметсулам | 1:24-48:1 | 1:8-16:1 | 1:3-3:1 |

| | | | | |
|----|-----------------------|-------------|-----------|------------|
| 13 | Флумиклорак-пентил | 1:10-112:1 | 1:3-38:1 | 1:1-7:1 |
| 13 | Флумиоксазин | 1:25-45:1 | 1:8-15:1 | 1:3-3:1 |
| 13 | Флуометурон | 1:384-3:1 | 1:128-1:1 | 1:48-1:6 |
| 13 | Флупирсульфурон-метил | 1:3-336:1 | 1:1-112:1 | 2:1-21:1 |
| 13 | Флуридон | 1:384-3:1 | 1:128-1:1 | 1:48-1:6 |
| 13 | Флуроксипир | 1:96-12:1 | 1:32-4:1 | 1:12-1:2 |
| 13 | Флуртамон | 1:857-2:1 | 1:285-1:3 | 1:107-1:12 |
| 13 | Флутиацет-метил | 1:48-42:1 | 1:16-14:1 | 1:3-3:1 |
| 13 | Фомесафен | 1:96-12:1 | 1:32-4:1 | 1:12-1:2 |
| 13 | Форамсульфурон | 1:13-84:1 | 1:4-28:1 | 1:1-6:1 |
| 13 | Глюфосинат | 1:288-4:1 | 1:96-2:1 | 1:36-1:4 |
| 13 | Глифосат | 1:288-4:1 | 1:96-2:1 | 1:36-1:4 |
| 13 | Галосульфурон-метил | 1:17-68:1 | 1:5-23:1 | 1:2-5:1 |
| 13 | Галауксифен | 1:20-56:1 | 1:6-19:1 | 1:2-4:1 |
| 13 | Галауксифен-метил | 1:20-56:1 | 1:6-19:1 | 1:2-4:1 |
| 13 | Галоксифоп-метил | 1:34-34:1 | 1:11-12:1 | 1:4-3:1 |
| 13 | Гексазинон | 1:192-6:1 | 1:64-2:1 | 1:24-1:3 |
| 13 | Гидантоцидин | 1:1100-16:1 | 1:385-8:1 | 1:144-4:1 |
| 13 | Имазамокс | 1:13-84:1 | 1:4-28:1 | 1:1-6:1 |
| 13 | Имазапик | 1:20-56:1 | 1:6-19:1 | 1:2-4:1 |
| 13 | Имазапир | 1:85-14:1 | 1:28-5:1 | 1:10-1:2 |
| 13 | Имазаквин | 1:34-34:1 | 1:11-12:1 | 1:4-3:1 |
| 13 | Имазетабенз-метил | 1:171-7:1 | 1:57-3:1 | 1:21-1:3 |
| 13 | Имазетапир | 1:24-48:1 | 1:8-16:1 | 1:3-3:1 |
| 13 | Имазосульфурон | 1:27-42:1 | 1:9-14:1 | 1:3-3:1 |
| 13 | Инданофан | 1:342-4:1 | 1:114-2:1 | 1:42-1:5 |
| 13 | Индазифлам | 1:25-45:1 | 1:8-15:1 | 1:3-3:1 |
| 13 | Йодосульфурон-метил | 1:3-336:1 | 1:1-112:1 | 2:1-21:1 |
| 13 | Иоксинил | 1:192-6:1 | 1:64-2:1 | 1:24-1:3 |
| 13 | Ипфенкарбазон | 1:85-14:1 | 1:28-5:1 | 1:10-1:2 |
| 13 | Изопротурон | 1:384-3:1 | 1:128-1:1 | 1:48-1:6 |
| 13 | Изоксабен | 1:288-4:1 | 1:96-2:1 | 1:36-1:4 |
| 13 | Изоксафлютол | 1:60-20:1 | 1:20-7:1 | 1:7-2:1 |

| | | | | |
|----|---------------------|------------|-----------|------------|
| 13 | Лактофен | 1:42-27:1 | 1:14-9:1 | 1:5-2:1 |
| 13 | Ленацил | 1:384-3:1 | 1:128-1:1 | 1:48-1:6 |
| 13 | Линурон | 1:384-3:1 | 1:128-1:1 | 1:48-1:6 |
| 13 | МСРА | 1:192-6:1 | 1:64-2:1 | 1:24-1:3 |
| 13 | МСРВ | 1:288-4:1 | 1:96-2:1 | 1:36-1:4 |
| 13 | Мекопроп | 1:768-2:1 | 1:256-1:2 | 1:96-1:11 |
| 13 | Мефенацет | 1:384-3:1 | 1:128-1:1 | 1:48-1:6 |
| 13 | Мефлуидид | 1:192-6:1 | 1:64-2:1 | 1:24-1:3 |
| 13 | Мезосульфурон-метил | 1:5-224:1 | 1:1-75:1 | 1:1-14:1 |
| 13 | Мезотрион | 1:42-27:1 | 1:14-9:1 | 1:5-2:1 |
| 13 | Метамифоп | 1:42-27:1 | 1:14-9:1 | 1:5-2:1 |
| 13 | Метазахлор | 1:384-3:1 | 1:128-1:1 | 1:48-1:6 |
| 13 | Метазосульфурон | 1:25-45:1 | 1:8-15:1 | 1:3-3:1 |
| 13 | Метабензтиазурон | 1:768-2:1 | 1:256-1:2 | 1:96-1:11 |
| 13 | Метолахлор | 1:768-2:1 | 1:256-1:2 | 1:96-1:11 |
| 13 | Метосулам | 1:8-135:1 | 1:2-45:1 | 1:1-9:1 |
| 13 | Метрибузин | 1:192-6:1 | 1:64-2:1 | 1:24-1:3 |
| 13 | Метсульфурон-метил | 1:2-560:1 | 1:1-187:1 | 3:1-35:1 |
| 13 | Молинат | 1:1028-2:1 | 1:342-1:3 | 1:128-1:15 |
| 13 | Напропамид | 1:384-3:1 | 1:128-1:1 | 1:48-1:6 |
| 13 | Напропамид-М | 1:192-6:1 | 1:64-2:1 | 1:24-1:3 |
| 13 | Напталам | 1:192-6:1 | 1:64-2:1 | 1:24-1:3 |
| 13 | Никосульфурон | 1:12-96:1 | 1:4-32:1 | 1:1-6:1 |
| 13 | Норфлуразон | 1:1152-1:1 | 1:384-1:3 | 1:144-1:16 |
| 13 | Орбенкарб | 1:1371-1:2 | 1:457-1:4 | 1:171-1:20 |
| 13 | Ортосульфамурон | 1:20-56:1 | 1:6-19:1 | 1:2-4:1 |
| 13 | Оризалин | 1:514-3:1 | 1:171-1:2 | 1:64-1:8 |
| 13 | Оксадиаргил | 1:384-3:1 | 1:128-1:1 | 1:48-1:6 |
| 13 | Оксадиазон | 1:548-3:1 | 1:182-1:2 | 1:68-1:8 |
| 13 | Оксасульфурон | 1:27-42:1 | 1:9-14:1 | 1:3-3:1 |
| 13 | Оксазикломефон | 1:42-27:1 | 1:14-9:1 | 1:5-2:1 |
| 13 | Оксифлуорфен | 1:384-3:1 | 1:128-1:1 | 1:48-1:6 |
| 13 | Паракват | 1:192-6:1 | 1:64-2:1 | 1:24-1:3 |
| 13 | Пендиметалин | 1:384-3:1 | 1:128-1:1 | 1:48-1:6 |

| | | | | |
|----|----------------------|------------|-----------|------------|
| 13 | Пеноксулам | 1:10-112:1 | 1:3-38:1 | 1:1-7:1 |
| 13 | Пентоксамид | 1:384-3:1 | 1:128-1:1 | 1:48-1:6 |
| 13 | Пентоксазон | 1:102-12:1 | 1:34-4:1 | 1:12-1:2 |
| 13 | Фенмедифам | 1:102-12:1 | 1:34-4:1 | 1:12-1:2 |
| 13 | Пихлорам | 1:96-12:1 | 1:32-4:1 | 1:12-1:2 |
| 13 | Пиколинафен | 1:34-34:1 | 1:11-12:1 | 1:4-3:1 |
| 13 | Пиноксаден | 1:25-45:1 | 1:8-15:1 | 1:3-3:1 |
| 13 | Претилахлор | 1:192-6:1 | 1:64-2:1 | 1:24-1:3 |
| 13 | Примисульфурон-метил | 1:8-135:1 | 1:2-45:1 | 1:1-9:1 |
| 13 | Продиамин | 1:384-3:1 | 1:128-1:1 | 1:48-1:6 |
| 13 | Профоксидим | 1:42-27:1 | 1:14-9:1 | 1:5-2:1 |
| 13 | Прометрин | 1:384-3:1 | 1:128-1:1 | 1:48-1:6 |
| 13 | Пропахлор | 1:1152-1:1 | 1:384-1:3 | 1:144-1:16 |
| 13 | Пропанил | 1:384-3:1 | 1:128-1:1 | 1:48-1:6 |
| 13 | Пропаквизафоп | 1:48-24:1 | 1:16-8:1 | 1:6-2:1 |
| 13 | Пропоксикарбазон | 1:17-68:1 | 1:5-23:1 | 1:2-5:1 |
| 13 | Пропирисульфурон | 1:17-68:1 | 1:5-23:1 | 1:2-5:1 |
| 13 | Пропизамид | 1:384-3:1 | 1:128-1:1 | 1:48-1:6 |
| 13 | Просульфокарб | 1:1200-1:2 | 1:400-1:4 | 1:150-1:17 |
| 13 | Просульфурон | 1:6-168:1 | 1:2-56:1 | 1:1-11:1 |
| 13 | Пираклонил | 1:42-27:1 | 1:14-9:1 | 1:5-2:1 |
| 13 | Пирафлуфен-этил | 1:5-224:1 | 1:1-75:1 | 1:1-14:1 |
| 13 | Пирасульфотол | 1:13-84:1 | 1:4-28:1 | 1:1-6:1 |
| 13 | Пиразолинат | 1:857-2:1 | 1:285-1:3 | 1:107-1:12 |
| 13 | Пиразосульфурон-этил | 1:10-112:1 | 1:3-38:1 | 1:1-7:1 |
| 13 | Пиразоксифен | 1:5-224:1 | 1:1-75:1 | 1:1-14:1 |
| 13 | Пирибензоксим | 1:10-112:1 | 1:3-38:1 | 1:1-7:1 |
| 13 | Пирибутикарб | 1:384-3:1 | 1:128-1:1 | 1:48-1:6 |
| 13 | Пиридат | 1:288-4:1 | 1:96-2:1 | 1:36-1:4 |
| 13 | Пирифталид | 1:10-112:1 | 1:3-38:1 | 1:1-7:1 |
| 13 | Пириминобак-метил | 1:20-56:1 | 1:6-19:1 | 1:2-4:1 |
| 13 | Пиримисульфан | 1:17-68:1 | 1:5-23:1 | 1:2-5:1 |

| | | | | |
|----|----------------------|------------|-----------|------------|
| 13 | Пиритиобак | 1:24-48:1 | 1:8-16:1 | 1:3-3:1 |
| 13 | Пироксасульфен | 1:85-14:1 | 1:28-5:1 | 1:10-1:2 |
| 13 | Пироксулам | 1:5-224:1 | 1:1-75:1 | 1:1-14:1 |
| 13 | Квинклолак | 1:192-6:1 | 1:64-2:1 | 1:24-1:3 |
| 13 | Квизалофоп-этил | 1:42-27:1 | 1:14-9:1 | 1:5-2:1 |
| 13 | Римсульфурон | 1:13-84:1 | 1:4-28:1 | 1:1-6:1 |
| 13 | Сафлуфенацил | 1:25-45:1 | 1:8-15:1 | 1:3-3:1 |
| 13 | Сетоксидим | 1:96-12:1 | 1:32-4:1 | 1:12-1:2 |
| 13 | Симазин | 1:384-3:1 | 1:128-1:1 | 1:48-1:6 |
| 13 | Сулькотрион | 1:120-10:1 | 1:40-4:1 | 1:15-1:2 |
| 13 | Сульфентразон | 1:147-8:1 | 1:49-3:1 | 1:18-1:3 |
| 13 | Сульфометурон-метил | 1:34-34:1 | 1:11-12:1 | 1:4-3:1 |
| 13 | Сульфосульфурон | 1:8-135:1 | 1:2-45:1 | 1:1-9:1 |
| 13 | Тебутиурон | 1:384-3:1 | 1:128-1:1 | 1:48-1:6 |
| 13 | Тефурилтрион | 1:42-27:1 | 1:14-9:1 | 1:5-2:1 |
| 13 | Темботрион | 1:31-37:1 | 1:10-13:1 | 1:3-3:1 |
| 13 | Тепралоксидим | 1:25-45:1 | 1:8-15:1 | 1:3-3:1 |
| 13 | Тербацил | 1:288-4:1 | 1:96-2:1 | 1:36-1:4 |
| 13 | Тербутилазин | 1:857-2:1 | 1:285-1:3 | 1:107-1:12 |
| 13 | Тербутрин | 1:192-6:1 | 1:64-2:1 | 1:24-1:3 |
| 13 | Тенилхлор | 1:85-14:1 | 1:28-5:1 | 1:10-1:2 |
| 13 | Тиазопир | 1:384-3:1 | 1:128-1:1 | 1:48-1:6 |
| 13 | Тиенкарбазон | 1:3-336:1 | 1:1-112:1 | 2:1-21:1 |
| 13 | Тифенсульфурон-метил | 1:5-224:1 | 1:1-75:1 | 1:1-14:1 |
| 13 | Тиафенацил | 1:17-68:1 | 1:5-23:1 | 1:2-5:1 |
| 13 | Тиобенкарб | 1:768-2:1 | 1:256-1:2 | 1:96-1:11 |
| 13 | Толпиралат | 1:31-37:1 | 1:10-13:1 | 1:3-3:1 |
| 13 | Топрамзон | 1:6-168:1 | 1:2-56:1 | 1:1-11:1 |
| 13 | Тралкоксидим | 1:68-17:1 | 1:22-6:1 | 1:8-2:1 |
| 13 | Триафамон | 1:2-420:1 | 1:1-140:1 | 2:1-27:1 |
| 13 | Триаллат | 1:768-2:1 | 1:256-1:2 | 1:96-1:11 |
| 13 | Триасульфурон | 1:5-224:1 | 1:1-75:1 | 1:1-14:1 |
| 13 | Триазифлам | 1:171-7:1 | 1:57-3:1 | 1:21-1:3 |

| | | | | |
|----|-----------------------|-----------|-----------|----------|
| 13 | Трибенурон-метил | 1:3-336:1 | 1:1-112:1 | 2:1-21:1 |
| 13 | Трихлопир | 1:192-6:1 | 1:64-2:1 | 1:24-1:3 |
| 13 | Трифлорисульфурон | 1:2-420:1 | 1:1-140:1 | 2:1-27:1 |
| 13 | Трифлудимоксазин | 1:25-45:1 | 1:8-15:1 | 1:3-3:1 |
| 13 | Трифлуралин | 1:288-4:1 | 1:96-2:1 | 1:36-1:4 |
| 13 | Трифлусульфурон-метил | 1:17-68:1 | 1:5-23:1 | 1:2-5:1 |
| 13 | Тритосульфурон | 1:13-84:1 | 1:4-28:1 | 1:1-6:1 |

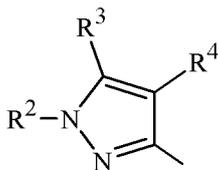
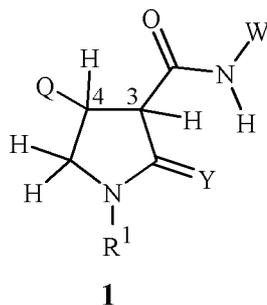
Таблица А2 построена так же как таблица А1 выше с той разницей, что записи ниже заголовка столбца "компонент (а)" заменены соответствующей записью в столбце компонент (а), показанной ниже. Соединение 1 в столбце компонент (а) определено в таблице индексов А. Таким образом, например, в записях таблицы А2 ниже все заголовки столбца "компонент (а)" указывают на "соединение 2" (т. е. соединение 2, определенное в таблице индексов А), и первая строка, ниже заголовков столбца в таблице А2, конкретно раскрывает смесь соединения 2 с 2,4-D. Таблицы А3 - А31 построены подобным образом.

| Номер таблицы | Записи в столбце компонент (а) | Номер таблицы | Записи в столбце компонент (а) |
|------------------|---|------------------|---|
| А2 | Соединение 2 | А20 | Соединение 21 |
| А3 | Соединение 3 | А21 | Соединение 22 |
| А4 | Соединение 4 | А22 | Соединение 23 |
| А5 | Соединение 5 | А23 | Соединение 24 |
| А6 | Соединение 6 | А24 | Соединение 25 |
| А7 | Соединение 7 | А25 | Соединение 26 |
| А8 | Соединение 8 | А26 | Соединение 27 |
| А9 | Соединение 9 | А27 | Соединение 28 |
| А10 | Соединение 10 | А28 | Соединение 29 |
| А11 | Соединение 11 | А29 | Соединение 30 |
| А12 | Соединение 12 | А30 | Соединение 31 |
| А13 | Соединение 14 | А31 | Соединение 32 |
| А14 | Соединение 15 | | |
| А15 | Соединение 16 | | |
| А16 | Соединение 17 | | |
| А17 | Соединение 18 | | |
| А18 | Соединение 19 | | |
| А19 | Соединение 20 | | |

Для лучшего контроля нежелательной растительности (например, более низкой нормы применения, например, вследствие синергизма, более широкого спектра контролируемых сорняков или усиленной безопасности в отношении сельскохозяйственных культур) или для предотвращения развития устойчивых сорняков предпочтительными являются смеси соединения по настоящему изобретению с гербицидом, выбранным из группы, состоящей из хлорсульфурина, этаметсульфурина, хлоримурон-этила, мезотриона, тифенсульфурион-метила, флупирсульфурион-метила, трибенурион-метила, метсульфурион-метила, трифлусульфурон-метила, пироксасульфона, пиноксадена, темботриона, пироксулама, метолахлора и *S*-метолахлора.

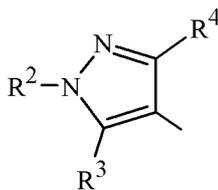
Следующие испытания демонстрируют эффективность контроля, обеспечиваемого соединениями по настоящему изобретению, в отношении конкретных сорняков. Контроль сорняков, предоставляемый соединениями, однако, не ограничен этими видами. См. таблицы индексов А и В для описаний соединений. В следующей таблице индексов применяются следующие сокращения. Et представляет собой этил. (*R*) или (*S*) обозначает абсолютную хиральность асимметричного центра, представляющего собой атом углерода. "Rac." означает рацемическую смесь. "Стерео (3,4)" описывает стереохимию при 3- и 4-положениях пирролидинонового кольца. Сокращение "№ соед." значит "номер соединения". Аббревиатура "пр." значит "пример", и за ней следует число, указывающее в каком примере синтеза получено соединение. Масс-спектры приведены с приблизительной точностью в пределах $\pm 0,5$ Да в виде молекулярной массы наиболее распространенного изотопа исходного иона ($M+1$), образованного путем добавления H^+ (молекулярная масса составляет 1) к молекуле, наблюдаемой с применением химической ионизации при атмосферном давлении (AP+).

ТАБЛИЦА ИНДЕКСОВ А



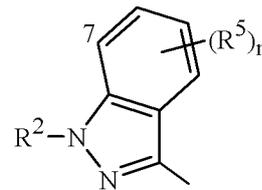
Q-1

;



Q-2

и



Q-3

;

| № соед. | Q | R ¹ | R ² | R ³ | R ⁴ | (R ⁵) _n | Y | W | Стерео (3,4) | М.Р. (M.S.) |
|---------------|-----|-----------------|-----------------|-----------------|----------------|--------------------------------|---|--|-----------------|----------------|
| 1 | Q-1 | H | CH ₃ | трет- Bu | H | - | O | 2-пир(6-F) | <i>S, R</i> | * |
| 2 | Q-3 | CH ₃ | CH ₃ | - | - | 7-F | O | Ph(2,3-ди-F) | <i>S, R</i> | * |
| 3 | Q-1 | CH ₃ | CH ₃ | CF ₃ | H | - | O | Ph(2,3-ди-F) | <i>Рац.</i> | * |
| 4 | Q-3 | CH ₃ | Et | - | - | 6-F | O | Ph(2,3-ди-F) | <i>S, R</i> | * |
| 5 | Q-3 | CH ₃ | CH ₃ | - | - | 7-Cl | O | Ph(2,3-ди-F) | <i>S, R</i> | * |
| 6 | Q-1 | CH ₃ | CH ₃ | CF ₃ | H | - | O | Ph(2,4-ди-F) | <i>Рац.</i> | * |
| 7 | Q-3 | CH ₃ | Et | - | - | 4-F | O | Ph(2,3-ди-F) | <i>S, R</i> | * |
| 8 | Q-3 | CH ₃ | Et | - | - | 5-F | O | Ph(2,3-ди-F) | <i>S, R</i> | * |
| 9 | Q-1 | CH ₃ | CH ₃ | CF ₃ | H | - | O | Ph(2-F) | <i>Рац.</i> | * |
| 10 | Q-3 | CH ₃ | Et | - | - | 7-F | O | Ph(2,3-ди-F) | <i>Рац.</i> | * |
| 11 | Q-3 | CH ₃ | Et | - | - | 7-F | O | 3-пир(2,6-ди- F) | <i>S, R</i> | * |
| 12 | Q-1 | CH ₃ | CH ₃ | CF ₃ | H | - | O | Ph(2,3-ди-F) | <i>R, R</i> | * |
| 13 (пр. 1) | Q-1 | CH ₃ | CH ₃ | CF ₃ | H | - | O | Ph(2,3-ди-F) | <i>S, R</i> | (403 (+))** |
| 14 | Q-3 | CH ₃ | Et | - | - | 7-F | O | Ph(2,3-ди-F) | <i>S, S</i> | * |
| 15 | Q-3 | CH ₃ | Et | - | - | 7-F | O | Ph(2,3-ди-F) | <i>R, R</i> | * |
| 16 | Q-1 | CH ₃ | CH ₃ | CF ₃ | H | - | O | Ph(3-F,2- OCF ₃) | <i>Рац.</i> | * |
| 17 | Q-1 | CH ₃ | CH ₃ | CF ₃ | H | - | O | Ph(2,3,4-три- F) | <i>Рац.</i> | * |
| 18 | Q-1 | CH ₃ | CH ₃ | CF ₃ | H | - | O | Ph(3-F,2- OCH ₃) | <i>Рац.</i> | * |
| 19 | Q-1 | CH ₃ | CH ₃ | CF ₃ | H | - | O | Ph(3-F,2-CF ₃) | <i>Рац.</i> | * |
| 20 | Q-1 | CH ₃ | CH ₃ | CF ₃ | H | - | O | Ph(2-CH ₂ CH ₃) | <i>Рац.</i> | * |
| 21 | Q-3 | CH ₃ | CH ₃ | - | - | 7-F | O | Ph(2,3-ди-F) | <i>Рац.</i> | * |
| 22 | Q-1 | CH ₃ | CH ₃ | CF ₃ | H | - | O | 3-пир(2,6-ди- F) | <i>Рац.</i> | * |
| 23 | Q-1 | CH ₃ | CH ₃ | CF ₃ | H | - | O | Ph(3-F,2- OCHF ₂) | <i>Рац.</i> | * |
| 24 | Q-1 | CH ₃ | CH ₃ | CF ₃ | H | - | O | 2-пир(6-F) | <i>Рац.</i> | * |
| 25 | Q-2 | CH ₃ | CH ₃ | CF ₃ | H | - | O | Ph(2,3-ди-F) | <i>Рац.</i> | * |

| | | | | | | | | | | |
|----|-----|-----------------|-----------------|-----------------|----|---|---|--|------|---|
| 26 | Q-1 | CH ₃ | CH ₃ | CF ₃ | H | - | O | Ph(4-F,2-CF ₂ CH ₃) | Рац. | * |
| 27 | Q-1 | CH ₃ | CH ₃ | Cl | H | - | O | Ph(2,3-ди-F) | Рац. | * |
| 28 | Q-1 | CH ₃ | CH ₃ | Cl | Br | - | O | Ph(2,3-ди-F) | Рац. | * |
| 29 | Q-1 | CH ₃ | CH ₃ | Cl | H | - | O | Ph(2,4-ди-F) | Рац. | * |
| 30 | Q-1 | CH ₃ | CH ₃ | Cl | Br | - | O | Ph(2,4-ди-F) | Рац. | * |
| 31 | Q-1 | CH ₃ | CH ₃ | Cl | H | - | O | Ph(2,3,4-три-F) | Рац. | * |
| 32 | Q-1 | CH ₃ | CH ₃ | Cl | Br | - | O | Ph(2,3,4-три-F) | Рац. | * |

* См. таблицу индексов В для данных ¹H ЯМР.

** См. пример синтеза для данных ¹H ЯМР.

ТАБЛИЦА ИНДЕКСОВ В

| № | ¹ H ЯМР (ppm) | |
|-------|--|--|
| соед. | | |
| 1 | δ 9,81 (br.s, 1H), 8,07 (dd, 1H), 7,75 (q, 1H), 6,63 (dd, 1H), 6,53 (br.s, 1H), 5,98 (s, 1H), 4,17 (q, 1H), 3,92 (s, 3H), 3,78 (q, 1H), 3,76 (dt, 1H), 3,57 (t, 1H), 1,36 (s, 9H). | |
| 2 | δ 9,96-10,06 (m, 1H), 8,02 (ddt, J=8,34, 6,66, 1,54, 1,54 Гц, 1H), 7,55-7,62 (m, 1H), 7,03-7,07 (m, 2H), 6,96-7,02 (m, 2H), 6,83-6,91 (m, 2H), 4,56 (td, J=8,93, 7,83 Гц, 1H), 4,20 (d, J=0,98 Гц, 3H), 4,10 (d, J=8,44 Гц, 1H), 3,73-3,91 (m, 2H), 3,01 (d, J=0,73 Гц, 4H). | |
| 3 | δ 10,15 (br s, 1H), 8,04 (tdd, J=1,6, 6,6, 8,3 Гц, 1H), 7,02 (ddt, J=2,1, 5,9, 8,3 Гц, 1H), 6,93-6,85 (m, 1H), 6,69 (s, 1H), 4,09 (q, 1H), 3,94 (s, 3H), 3,81-3,65 (m, 3H), 2,98 (d, 3H) | |
| 4 | δ 9,86-10,05 (m, 1H), 7,99-8,05 (m, 1H), 7,82 (dd, J=9,05, 5,01 Гц, 1H), 6,98-7,04 (m, 2H), 6,84-6,97 (m, 2H), 4,58 (q, J=8,60 Гц, 1H), 4,32 (q, J=7,21 Гц, 2H), 4,05 (d, J=8,31 Гц, 1H), 3,81-3,89 (m, 2H), 3,02 (d, J=0,73 Гц, 3H), 1,48 (t, J=7,27 Гц, 3H). | |
| 5 | δ 9,97 (br s, 1H), 7,98-8,04 (m, 1H), 7,71-7,76 (m, 1H), 7,32-7,40 (m, 2H), 7,04-7,11 (m, 2H), 6,94-7,04 (m, 2H), 6,81-6,94 (m, 2H), 4,52-4,61 (m, 1H), 4,36 (s, 3H), 4,11 (d, J=8,68 Гц, 1H), 3,73-3,91 (m, 3H), 3,01 (d, J=0,73 Гц, 3H). | |
| 6 | δ 9,98 (br s, 1H), 8,22 (dt, J=6,0, 8,9 Гц, 1H), 6,90-6,80 (m, 2H), 6,69 (s, 1H), 4,09 (q, 1H), 3,94 (d, 3H), 3,80-3,65 (m, 3H), 2,97 (d, J=0,7 Гц, 3H). | |
| 7 | δ 10,01 (s, 1H), 8,04 (s, 1H), 8,01-7,93 (m, 1H), 7,23 (s, 1H), 7,05-6,96 (m, 1H), 6,93-6,83 (m, 1H), 6,76 (dd, J=0,7, 10,7 Гц, 1H), 4,43 (q, J=7,3 Гц, 2H), 4,24 (q, 1H), 3,85 (t, J=9,8 Гц, 1H), 3,71 (d, J=8,9 Гц, 1H), 3,53 (dd, J=7,8, 10,2 Гц, 1H), 3,03 (s, 3H), | |

- 1,53 (t, J=7,3 Гц, 3H).
 8 δ 10,01 (brs, 1H), 8,08-8,01 (m, 1H), 7,50 (dd, J=1,9, 8,7 Гц, 1H), 7,31 (d, J=4,0 Гц, 1H), 7,17 (td, J=2,4 Гц, 1H), 7,05-6,97 (m, 1H), 6,92-6,82 (m, 1H), 4,53 (q, J=8,4 Гц, 1H), 4,37 (q, J=7,2 Гц, 2H), 4,07 (d, J=8,6 Гц, 1H), 3,84 (d, J=8,6 Гц, 2H), 3,02 (s, 3H), 1,49 (t, J=7,3 Гц, 3H).
- 9 δ 10,04 (br s, 1H), 8,31-8,25 (m, 1H), 7,13-7,00 (m, 3H), 6,69 (s, 1H), 4,11 (q, 1H), 3,94 (s, 3H), 3,80-3,65 (m, 3H), 2,98 (d, 3H).
- 10 δ 10,05-9,90 (m, 1H), 8,03 (tdd, J=1,6, 6,6, 8,3 Гц, 1H), 7,64-7,56 (m, 1H), 7,10-6,94 (m, 3H), 6,93-6,82 (m, 1H), 4,62-4,50 (m, 3H), 4,10 (d, J=8,6 Гц, 1H), 3,89-3,79 (m, 2H), 3,02 (d, J=0,7 Гц, 3H), 1,49 (t, J=7,0 Гц, 4H).
- 11 δ 10,02 (brs, 1H), 8,84-8,74 (m, 1H), 7,48 (dd, J=1,9, 8,7 Гц, 1H), 7,33 (dd, J=3,9, 9,0 Гц, 1H), 7,18 (dt, J=2,3, 8,9 Гц, 1H), 6,79 (dd, J=2,9, 8,6 Гц, 1H), 4,49 (q, J=8,6 Гц, 1H), 4,38 (q, J=7,2 Гц, 2H), 4,08 (d, J=8,9 Гц, 1H), 3,85 (d, J=8,8 Гц, 2H), 3,02 (s, 3H), 1,49 (t, J=7,3 Гц, 3H).
- 12 Энантиомер соедин. № 13. δ 10,15 (br s, 1H), 8,04 (dd, J=6,6, 8,3 Гц, 1H), 7,06-6,99 (m, 1H), 6,89 (br dd, J=1,1, 8,6 Гц, 1H), 6,69 (s, 1H), 4,09 (q, 1H), 3,94 (s, 3H), 3,78 (d, J=9,5 Гц, 1H), 3,76-3,65 (m, 2H), 2,98 (d, 3H).
- 13 δ 10,15 (br s, 1H), 8,04 (dd, J=6,6, 8,3 Гц, 1H), 7,06-6,99 (m, 1H), 6,89 (br dd, J=1,1, 8,6 Гц, 1H), 6,69 (s, 1H), 4,09 (q, 1H), 3,94 (s, 3H), 3,78 (d, J=9,5 Гц, 1H), 3,76-3,65 (m, 2H), 2,98 (d, 3H).
- 14 δ 10,00 (br s, 1H), 8,03 (tdd, J=1,6, 6,6, 8,3 Гц, 1H), 7,65-7,57 (m, 1H), 7,10-6,96 (m, 3H), 6,87 (dddd, J=1,5, 7,3, 8,5, 9,8 Гц, 1H), 4,59-4,51 (m, 3H), 4,10 (d, J=8,7 Гц, 1H), 3,91-3,79 (m, 2H), 3,01 (d, J=0,7 Гц, 3H), 1,49 (t, J=7,2 Гц, 3H).
- 15 δ 10,00 (br s, 1H), 8,08-7,98 (m, 1H), 7,65-7,56 (m, 1H), 7,10-6,95 (m, 3H), 6,94-6,83 (m, 1H), 4,62-4,51 (m, 3H), 4,10 (d, J=8,6 Гц, 1H), 3,90-3,79 (m, 2H), 3,02 (d, J=0,6 Гц, 3H), 1,49 (t, J=7,1 Гц, 3H).
- 16 δ 10,40 (s, 1H), 8,17 (td, J=1,5, 8,5 Гц, 1H), 7,26-7,19 (m, 1H), 6,92 (ddd, J=1,4, 8,4, 9,7 Гц, 1H), 6,69 (s, 1H), 4,07 (q, J=9,0 Гц, 1H), 3,94 (s, 3H), 3,77 (d, 1H), 3,74-3,64 (m, 2H), 2,98 (s, 3H).
- 17 δ 10,08 (br s, 1H), 8,01-7,94 (m, 1H), 6,92 (ddt, J=2,4, 7,7, 9,7 Гц, 1H), 6,68 (s, 1H), 4,07 (q, 1H), 3,94 (s, 3H), 3,77 (d, 1H), 3,75-3,65 (m, 2H), 2,98 (d, 3H).
- 18 δ 10,21 (s, 1H), 8,13 (td, J=1,3, 8,4 Гц, 1H), 6,96 (dt, J=5,7, 8,3 Гц, 1H), 6,81 (ddd, J=1,5, 8,4, 11,1 Гц, 1H), 6,68 (s, 1H), 4,13 (q, J=9,0 Гц, 1H), 4,03 (d, J=1,7 Гц, 3H), 3,94 (d, 3H), 3,78-3,63 (m, 3H), 2,97 (d, J=0,7 Гц, 3H).
- 19 δ 10,16 (br s, 1H), 7,99 (d, J=8,3 Гц, 1H), 7,46 (dt, J=6,0, 8,4 Гц, 1H), 7,00-6,92 (m,

1H), 6,68 (s, 1H), 4,09 (q, J=8,9 Гц, 1H), 3,94 (s, 3H), 3,79-3,66 (m, 3H), 2,98 (d, 3H)
 20 δ 9,73 (s, 1H), 8,05 (d, 1H), 7,34-7,27 (m, 1H), 7,22-7,16 (m, 1H), 7,10-7,05 (m, 1H),
 6,72 (s, 1H), 4,17-4,07 (m, 1H), 3,94 (s, 3H), 3,77-3,66 (m, 3H), 2,97 (d, 3H), 2,77-
 2,65 (m, 2H), 1,27 (t, 3H).

21 δ 10,02 (br s, 1H), 8,02 (tdd, J=1,6, 6,6, 8,3 Гц, 1H), 7,62-7,55 (m, 1H), 7,09-6,96 (m,
 3H), 6,92-6,82 (m, 1H), 4,56 (dt, J=7,9, 8,9 Гц, 1H), 4,20 (d, J=0,9 Гц, 3H), 4,10 (d,
 J=8,4 Гц, 1H), 3,89-3,75 (m, 2H), 3,01 (d, J=0,7 Гц, 3H).

22 δ 10,17 (br s, 1H), 8,83-8,76 (m, 1H), 6,80 (dd, J=2,9, 8,6 Гц, 1H), 6,67 (s, 1H), 4,07
 (q, J=8,9 Гц, 1H), 3,95 (d, 3H), 3,83-3,65 (m, 3H), 2,98 (d, 3H).

23 δ 10,29 (s, 1H), 8,17 (td, J=1,3, 8,4 Гц, 1H), 7,17 (dt, J=5,9, 8,5 Гц, 1H), 6,89 (ddd, J
 1,3, 8,5, 10,0 Гц, 1H), 6,68 (s, 1H), 6,67 (t [сильное сопряжение с F], 1H), 4,09 (q,
 J=9,0 Гц, 1H), 3,94 (s, 3H), 3,78 (d, J=9,5 Гц, 1H), 3,75-3,63 (m, 2H), 2,98 (m, 3H).

24 δ 10,04 (s, 1H), 8,01 (dd, J=1,8, 7,9 Гц, 1H), 7,75 (q, J=8,1 Гц, 1H), 6,65 (s, 1H), 6,64
 (dd, 1H), 4,12 (q, J=9,0 Гц, 1H), 3,94 (s, 3H), 3,77-3,61 (m, 3H), 2,96 (s, 3H).

25 δ 10,05 (br s, 1H), 8,04-7,97 (m, 1H), 7,46 (s, 1H), 7,01 (ddt, J=2,1, 5,9, 8,3 Гц, 1H),
 6,93-6,84 (m, 1H), 4,21 (q, J=8,8 Гц, 1H), 4,00 (s, 3H), 3,75 (t, J=9,5 Гц, 1H), 3,64 (d,
 J=9,4 Гц, 1H), 3,27 (dd, J=8,1, 9,9 Гц, 1H), 2,97 (s, 3H).

26 δ 9,75 (br s, 1H), 8,11 (dd, J=5,1, 9,0 Гц, 1H), 7,21 (dd, J=2,9, 9,2 Гц, 1H), 7,13-7,06
 (m, 1H), 6,67 (s, 1H), 4,13 (q, J=8,9 Гц, 1H), 3,94 (s, 3H), 3,76-3,64 (m, 3H), 2,97 (s,
 3H), 1,98 (t, 3H).

27 δ 10,14 (s, 1H), 8,09-7,97 (m, 1H), 7,08-6,97 (m, 1H), 6,92-6,82 (m, 1H), 4,10-3,97
 (m, 1H), 3,88-3,75 (m, 1H), 3,80 (s, 3H), 3,74-3,60 (m, 2H), 2,95 (s, 3H).

28 δ 10,05 (brs, 1H), 8,09-8,01 (m, 1H), 7,04-6,96 (m, 1H), 6,91-6,82 (m, 1H), 4,23-4,10
 (m, 2H), 3,83 (s, 3H), 3,85-3,77 (m, 1H), 3,41-3,34 (m, 1H), 2,96 (s, 3H).

29 δ 9,96 (brs, 1H), 8,28-8,18 (m, 1H), 6,91-6,77 (m, 2H), 6,27 (s, 1H), 4,05 (q, J=9,0 Гц,
 1H), 3,83-3,60 (m, 3H), 3,79 (s, 3H), 2,96 (s, 3H).

30 δ 9,88 (brs, 1H), 8,28-8,17 (m, 1H), 6,91-6,77 (m, 2H), 4,19-4,13 (m, 2H), 3,85-3,75
 (m, 1H), 3,84 (s, 3H), 3,41-3,34 (m, 1H), 2,96 (s, 3H).

31 δ 10,06 (s, 1H), 8,03-7,93 (m, 1H), 6,98-6,85 (m, 1H), 6,27 (s, 1H), 4,03 (q, 1H), 3,83-
 3,60 (m, 3H), 3,80 (s, 3H), 2,97 (s, 3H).

32 δ 9,97 (br s, 1H), 8,03-7,93 (m, 1H), 6,95-6,84 (m, 1H), 4,21-4,09 (m, 2H), 3,87-3,76
 (m, 1H), 3,83 (s, 3H), 3,45-3,33 (m, 1H), 2,96 (s, 3H).

БИОЛОГИЧЕСКИЕ ПРИМЕРЫ НАСТОЯЩЕГО ИЗОБРЕТЕНИЯ

ИСПЫТАНИЕ А

Протокол для предвсходовой стадии

Семена кукурузы (*Zea mays*, ZEAMX), щетинника Фабера (*Setaria faberi*, SETFA), ежовника обыкновенного (*Echinochloa crus-galli*, ECHCG), ипомеи плющевидной (*Ipomoea hederacea*, IPOHE), амаранта запрокинутого (*Amaranthus retroflexus*, AMARE) и канатника Теофраста (*Abutilon theophrasti*, ABUTH) высевали на стандартную почву в горшки. После культивирования в течение одного дня в контролируемых условиях в теплице (при 24/16°C, день/ночь; 14 ч. света; влажности 65%) растения опрыскивали водным раствором для распыления, полученным из состава технического активного ингредиента в растворе ацетон/вода (50:50), содержавшем 0,5% Tween 20 (монолаурат сорбитана полиоксиэтилена, CAS RN 9005-64-5) с получением конечной дозы, составляющей 15,625, 62,5 или 250 г/га испытуемого соединения.

Затем испытуемые растения выращивали в контролируемых условиях в теплице (при 24/16°C, день/ночь; 14 ч. света; влажности 65%) и поливали водой дважды в сутки. Через 13 д. давали оценку испытанию (100=полное повреждение растения; 0=нет повреждения растения). Результаты показаны ниже.

Протокол для послевсходовой стадии

Семена кукурузы (*Zea mays*, ZEAMX), щетинника Фабера (*Setaria faberi*, SETFA), ежовника обыкновенного (*Echinochloa crus-galli*, ECHCG), ипомеи плющевидной (*Ipomoea hederacea*, IPOHE), амаранта запрокинутого (*Amaranthus retroflexus*, AMARE) и канатника Теофраста (*Abutilon theophrasti*, ABUTH) высевали на стандартную почву в горшки. После культивирования в течение 8 д. в контролируемых условиях в теплице (при 24/16°C, день/ночь; 14 ч. света; влажности 65%) растения опрыскивали водным раствором для распыления, полученным из состава технического активного ингредиента в растворе ацетон/вода (50:50), содержавшем 0,5% Tween 20 (монолаурат сорбитана полиоксиэтилена, CAS RN 9005-64-5) с получением конечной дозы, составляющей 15,625, 62,5 или 250 г/га испытуемого соединения.

Затем испытуемые растения выращивали при контролируемых условиях в теплице (при 24/16°C, день/ночь; 14 ч. света; влажности 65%) и поливали водой дважды в сутки. Через 13 д. давали оценку испытанию (100=полное повреждение растения; 0=нет повреждения растения). Результаты показаны ниже.

Таблица А. Предвсходовая стадия при 250 г/га

| № соед. | AMARE | ABUTH | SETFA | ECHCG | ZEAMX | IPOHE |
|---------|-------|-------|-------|-------|-------|-------|
| 2 | 0 | 0 | 90 | 90 | 10 | 0 |
| 3 | 70 | 10 | 90 | 100 | 90 | 30 |
| 4 | 40 | 0 | 90 | 100 | 80 | 70 |
| 5 | 30 | 10 | 80 | 80 | 0 | 0 |
| 6 | 50 | 70 | 90 | 90 | 60 | 10 |
| 7 | 0 | 0 | 90 | 90 | 90 | 80 |

| | | | | | | |
|----|----|----|-----|-----|----|----|
| 8 | 0 | 0 | 90 | 90 | 70 | 20 |
| 9 | 20 | 0 | 90 | 90 | 20 | 0 |
| 10 | 10 | 0 | 90 | 90 | 70 | 0 |
| 11 | 0 | 0 | 90 | 90 | 20 | 10 |
| 12 | 10 | 0 | 0 | 10 | 20 | 20 |
| 14 | 0 | 0 | 90 | 90 | 70 | 70 |
| 15 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 |
| 16 | 0 | 0 | 90 | 90 | 30 | 50 |
| 17 | 20 | 10 | 90 | 100 | 90 | 20 |
| 18 | 0 | 0 | 90 | 90 | 80 | 20 |
| 19 | 0 | 0 | 90 | 90 | 20 | 10 |
| 20 | 70 | 0 | 90 | 90 | 20 | 0 |
| 22 | 20 | 0 | 90 | 90 | 40 | 0 |
| 23 | 0 | 0 | 90 | 90 | 40 | 20 |
| 24 | 0 | 0 | 90 | 100 | 80 | 40 |
| 25 | 0 | 40 | 100 | 100 | 20 | 0 |
| 26 | 0 | 0 | 90 | 90 | 90 | 70 |
| 27 | 0 | 0 | 90 | 90 | 10 | 10 |
| 28 | 0 | 0 | 90 | 90 | 0 | 0 |
| 29 | 0 | 0 | 80 | 80 | 10 | 0 |
| 30 | 10 | 0 | 10 | 20 | 0 | 10 |
| 31 | 0 | 0 | 80 | 80 | 20 | 10 |
| 32 | 0 | 0 | 90 | 70 | 10 | 10 |

Таблица А. Послеуборочная стадия при 250 г/га

| № соедин. | AMARE | ABUTH | SETFA | ECHCG | ZEAMX | ИПОНЕ |
|-----------|-------|-------|-------|-------|-------|-------|
| 2 | 0 | 0 | 80 | 90 | 40 | 0 |
| 3 | 20 | 0 | 90 | 90 | 80 | 0 |
| 4 | 20 | 20 | 90 | 90 | 90 | 20 |
| 5 | 0 | 0 | 80 | 80 | 0 | 0 |
| 6 | 10 | 60 | 70 | 70 | 60 | 10 |

| | | | | | | |
|----|----|----|----|----|----|----|
| 7 | 0 | 0 | 80 | 80 | 80 | 0 |
| 8 | 0 | 0 | 80 | 80 | 80 | 30 |
| 9 | 0 | 0 | 90 | 90 | 50 | 0 |
| 10 | 0 | 10 | 90 | 90 | 70 | 30 |
| 11 | 0 | 0 | 80 | 90 | 40 | 0 |
| 12 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 |
| 14 | 0 | 0 | 90 | 80 | 80 | 50 |
| 15 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 |
| 16 | 0 | 0 | 70 | 70 | 0 | 0 |
| 17 | 50 | 0 | 80 | 80 | 80 | 0 |
| 18 | 0 | 0 | 70 | 70 | 80 | 50 |
| 19 | 30 | 0 | 80 | 80 | 10 | 0 |
| 20 | 20 | 0 | 80 | 80 | 0 | 0 |
| 22 | 0 | 0 | 80 | 80 | 80 | 30 |
| 23 | 0 | 0 | 80 | 80 | 80 | 30 |
| 24 | 0 | 0 | 80 | 80 | 40 | 50 |
| 25 | 0 | 0 | 80 | 80 | 30 | 40 |
| 26 | 0 | 0 | 90 | 90 | 80 | 50 |
| 27 | 30 | 0 | 70 | 70 | 10 | 20 |
| 28 | 50 | 0 | 70 | 70 | 0 | 0 |
| 29 | 40 | 0 | 60 | 60 | 0 | 10 |
| 30 | 10 | 0 | 50 | 50 | 0 | 0 |
| 31 | 20 | 0 | 80 | 80 | 0 | 40 |
| 32 | 0 | 0 | 80 | 80 | 10 | 10 |

Таблица А. Предвсходовая стадия при 62,5 г/га

| № соед. | AMARE | ABUTH | SETFA | ECHCG | ZEAMX | ИПОНЕ |
|---------|-------|-------|-------|-------|-------|-------|
| 1 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 |
| 2 | 0 | 0 | 90 | 90 | 0 | 0 |
| 3 | 20 | 0 | 90 | 100 | 60 | 0 |
| 4 | 20 | 0 | 90 | 90 | 40 | 10 |

| | | | | | | |
|----|----|----|----|-----|----|----|
| 5 | 0 | 0 | 30 | 20 | 0 | 0 |
| 6 | 20 | 70 | 90 | 90 | 20 | 0 |
| 7 | 0 | 0 | 80 | 80 | 30 | 20 |
| 8 | 0 | 0 | 90 | 90 | 40 | 20 |
| 9 | 0 | 0 | 90 | 90 | 0 | 0 |
| 10 | 0 | 10 | 90 | 90 | 70 | 30 |
| 11 | 0 | 0 | 90 | 90 | 0 | 0 |
| 12 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 |
| 14 | 0 | 0 | 90 | 80 | 10 | 40 |
| 15 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 |
| 16 | 0 | 0 | 80 | 80 | 0 | 0 |
| 17 | 10 | 0 | 90 | 100 | 70 | 0 |
| 18 | 0 | 0 | 90 | 90 | 60 | 10 |
| 19 | 0 | 0 | 90 | 90 | 0 | 0 |
| 20 | 60 | 0 | 80 | 80 | 0 | 0 |
| 22 | 10 | 0 | 90 | 90 | 20 | 0 |
| 23 | 0 | 0 | 90 | 90 | 20 | 10 |
| 24 | 0 | 0 | 90 | 100 | 30 | 0 |
| 25 | 0 | 10 | 90 | 100 | 0 | 0 |
| 26 | 0 | 0 | 90 | 90 | 70 | 30 |
| 27 | 0 | 0 | 80 | 90 | 10 | 0 |
| 28 | 0 | 0 | 80 | 70 | 0 | 0 |
| 29 | 0 | 0 | 30 | 70 | 10 | 0 |
| 30 | 0 | 0 | 0 | 10 | 0 | 0 |
| 31 | 0 | 0 | 80 | 80 | 10 | 0 |
| 32 | 0 | 0 | 60 | 50 | 10 | 0 |

Таблица А. Послевсходовая стадия при 62,5 г/га

| № соедин. | AMARE | ABUTH | SETFA | ECHCG | ZEAMX | IPOHE |
|-----------|-------|-------|-------|-------|-------|-------|
| 1 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 |
| 2 | 0 | 0 | 70 | 90 | 0 | 0 |

| | | | | | | |
|----|----|----|----|----|----|----|
| 3 | 10 | 0 | 90 | 90 | 50 | 0 |
| 4 | 20 | 0 | 90 | 90 | 50 | 0 |
| 5 | 0 | 0 | 50 | 60 | 0 | 0 |
| 6 | 10 | 70 | 70 | 70 | 20 | 20 |
| 7 | 0 | 0 | 70 | 80 | 40 | 20 |
| 8 | 0 | 0 | 70 | 70 | 60 | 0 |
| 9 | 0 | 0 | 90 | 90 | 0 | 0 |
| 10 | 0 | 0 | 80 | 90 | 10 | 0 |
| 11 | 0 | 0 | 80 | 90 | 10 | 0 |
| 12 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 |
| 14 | 0 | 0 | 80 | 80 | 70 | 30 |
| 15 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 |
| 16 | 0 | 0 | 60 | 50 | 0 | 0 |
| 17 | 20 | 0 | 70 | 70 | 50 | 0 |
| 18 | 0 | 0 | 70 | 70 | 30 | 20 |
| 19 | 0 | 0 | 70 | 70 | 0 | 0 |
| 20 | 10 | 0 | 70 | 60 | 0 | 0 |
| 22 | 0 | 0 | 70 | 70 | 40 | 10 |
| 23 | 0 | 0 | 80 | 80 | 20 | 10 |
| 24 | 0 | 0 | 70 | 80 | 10 | 20 |
| 25 | 0 | 0 | 70 | 70 | 20 | 40 |
| 26 | 0 | 0 | 80 | 70 | 60 | 20 |
| 27 | 40 | 0 | 50 | 50 | 0 | 10 |
| 28 | 40 | 0 | 30 | 50 | 0 | 0 |
| 29 | 30 | 0 | 20 | 50 | 0 | 0 |
| 30 | 0 | 0 | 20 | 20 | 0 | 0 |
| 31 | 10 | 0 | 80 | 80 | 0 | 30 |
| 32 | 0 | 0 | 60 | 40 | 0 | 0 |

Таблица А. Предвсходовая стадия при 15,625 г/га

| № соед. | AMARE | ABUTH | SETFA | ECHCG | ZEAMX | ИПОНЕ |
|---------|-------|-------|-------|-------|-------|-------|
|---------|-------|-------|-------|-------|-------|-------|

| | | | | | | |
|----|----|----|----|-----|----|----|
| 1 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 |
| 2 | 10 | 0 | 90 | 90 | 0 | 0 |
| 3 | 20 | 0 | 90 | 100 | 0 | 0 |
| 4 | 0 | 0 | 80 | 90 | 0 | 0 |
| 5 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 |
| 6 | 20 | 80 | 80 | 80 | 10 | 0 |
| 7 | 0 | 0 | 70 | 70 | 20 | 20 |
| 8 | 0 | 0 | 80 | 80 | 20 | 20 |
| 9 | 0 | 0 | 70 | 80 | 50 | 50 |
| 10 | 0 | 0 | 80 | 50 | 0 | 0 |
| 11 | 0 | 0 | 80 | 20 | 0 | 0 |
| 12 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 |
| 14 | 0 | 0 | 60 | 60 | 20 | 30 |
| 16 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 |
| 17 | 0 | 0 | 90 | 90 | 60 | 0 |
| 18 | 0 | 0 | 90 | 90 | 30 | 10 |
| 19 | 0 | 0 | 80 | 70 | 0 | 0 |
| 20 | 50 | 0 | 50 | 50 | 0 | 0 |
| 22 | 0 | 0 | 80 | 70 | 0 | 0 |
| 23 | 0 | 0 | 70 | 70 | 10 | 0 |
| 24 | 0 | 0 | 70 | 90 | 0 | 0 |
| 25 | 0 | 0 | 80 | 90 | 0 | 0 |
| 26 | - | - | - | - | - | - |
| 27 | 0 | 0 | 60 | 70 | 0 | 0 |
| 28 | 0 | 0 | 20 | 30 | 0 | 0 |
| 29 | 0 | 0 | 20 | 30 | 0 | 0 |
| 30 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 |
| 31 | 0 | 0 | 40 | 60 | 0 | 0 |
| 32 | 0 | 0 | 20 | 30 | 0 | 0 |

Таблица А. Послевсходовая стадия при 15,625 г/га

| № соед. | AMARE | ABUTH | SETFA | ECHCG | ZEAMX | IPOHE |
|---------|-------|-------|-------|-------|-------|-------|
| 1 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 |
| 2 | 0 | 0 | 0 | 0 | 10 | 0 |
| 3 | 0 | 0 | 80 | 90 | 0 | 0 |
| 4 | 0 | 0 | 90 | 80 | 20 | 0 |
| 5 | 0 | 0 | 10 | 0 | 0 | 0 |
| 6 | 0 | 60 | 0 | 70 | 10 | 40 |
| 7 | 0 | 0 | 60 | 60 | 20 | 20 |
| 8 | 0 | 0 | 70 | 60 | 20 | 20 |
| 9 | 0 | 0 | 40 | 60 | 20 | 10 |
| 10 | 0 | 0 | 50 | 60 | 0 | 0 |
| 11 | 0 | 0 | 60 | 50 | 10 | 0 |
| 12 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 |
| 14 | 0 | 0 | 80 | 80 | 70 | 10 |
| 15 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 |
| 16 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 |
| 17 | 0 | 0 | 60 | 60 | 10 | 0 |
| 18 | 0 | 0 | 50 | 50 | 0 | 10 |
| 19 | 0 | 0 | 70 | 60 | 0 | 0 |
| 20 | 10 | 0 | 30 | 20 | 0 | 0 |
| 22 | 0 | 0 | 50 | 60 | 20 | 0 |
| 23 | 0 | 0 | 60 | 50 | 0 | 0 |
| 24 | 0 | 0 | 20 | 40 | 0 | 10 |
| 25 | 0 | 0 | 30 | 30 | 0 | 10 |
| 26 | - | - | - | - | - | - |
| 27 | 30 | 0 | 10 | 20 | 0 | 10 |
| 28 | 30 | 0 | 10 | 30 | 0 | 0 |
| 29 | 10 | 0 | 10 | 20 | 0 | 0 |
| 30 | 0 | 0 | 10 | 0 | 0 | 0 |
| 31 | 0 | 0 | 40 | 50 | 0 | 20 |

| | | | | | | |
|----|---|---|----|----|---|---|
| 32 | 0 | 0 | 20 | 10 | 0 | 0 |
|----|---|---|----|----|---|---|

ИСПЫТАНИЕ В

Семена видов растений, выбранных из лисохвоста мышехвостниковидного (*Alopecurus myosuroides*), плевела многолетнего (*Lolium multiflorum*), пшеницы, озимой (озимая пшеница, *Triticum aestivum*), кукурузы (*Zea mays*), росички кроваво-красной (Lg) (*Digitaria sanguinalis*), щетинника Фабера (*Setaria faberi*), сорго алеппского (*Sorghum halepense*), амброзии полыннолистной (обычная амброзия полыннолистная, *Ambrosia elatior*), сои (*Glycine max*), ежовника обыкновенного (*Echinochloa crus-galli*), щирицы бугорчатой (обычная щирица бугорчатая, *Amaranthus rudis*), щирицы Палмера (*Amaranthus palmeri*) и ветвянки стелющейся (*Brachiaria decumbens*), высаживали в илисто-глинистую почву и обрабатывали на предвсходовой стадии испытуемыми химическими соединениями, составленными в смеси нефитотоксичных растворителей, которая включала поверхностно-активное вещество.

Обработанные растения и контрольные растения выдерживали в теплице в течение 19-21 дня, после чего все виды сравнивали с контрольными растениями и визуально оценивали. Оценки ответа растений, кратко сформулированные в таблице В, представлены на основе шкалы от 0 до 100, где 0 представляет собой отсутствие эффекта, и 100 представляет собой полный контроль.

Таблица В Соединение

125 г а. и./га 13

Предвсходовая стадия

Ежовник обыкновенный 97

Лисохвост мышехвостниковидный 18

Кукуруза 48

Росичка кроваво-красная 100

Щетинник Фабера 98

Сорго алеппское 55

Щирица Палмера 0

Амброзия полыннолистная 0

Плевел многолетний 92

Соя 8

Ветвянка стелющаяся 93

Щирица бугорчатая 15

Пшеница 63

Таблица В Соединение

31 г а. и./га 13

Предвсходовая стадия

Таблица В Соединение

62 г а. и./га 13

Предвсходовая стадия

Ежовник обыкновенный 95

Лисохвост мышехвостниковидный 13

Кукуруза 13

Росичка кроваво-красная 100

Щетинник Фабера 98

Сорго алеппское 15

Щирица Палмера 0

Амброзия полыннолистная 0

Плевел многолетний 65

Соя 0

Ветвянка стелющаяся 95

Щирица бугорчатая 0

Пшеница 40

Таблица В Соединение

16 г а. и./га 13

Предвсходовая стадия

| | |
|---------------------------------|---------------------------------|
| Ежовник обыкновенный 95 | Ежовник обыкновенный 85 |
| Лисохвост мышехвостниковидный 0 | Лисохвост мышехвостниковидный 0 |
| Кукуруза 5 | Кукуруза 3 |
| Росичка кроваво-красная 100 | Росичка кроваво-красная 100 |
| Щетинник Фабера 95 | Щетинник Фабера 90 |
| Сорго алеппское 8 | Сорго алеппское 0 |
| Щирица Палмера 0 | Щирица Палмера 0 |
| Амброзия полыннолистная 0 | Амброзия полыннолистная 0 |
| Плевел многолетний 25 | Плевел многолетний 0 |
| Соя 0 | Соя 0 |
| Ветвянка стелющаяся 78 | Ветвянка стелющаяся 65 |
| Щирица бугорчатая 0 | Щирица бугорчатая 0 |
| Пшеница 20 | Пшеница 3 |

ИСПЫТАНИЕ С

Семена видов растений, выбранных из кукурузы (*Zea mays*), сои (*Glycine max*), канатника Теофраста (*Abutilon theophrasti*), щирицы Палмера (*Amaranthus palmeri*), щирицы бугорчатой (обычная щирица бугорчатая, *Amaranthus rudis*), ветвянки стелющейся (*Brachiaria decumbens*), росички кроваво-красной (Lg) (*Digitaria sanguinalis*), проса раздвоенноцветкового (*Panicum dichotomiflorum*), щетинника Фабера (*Setaria faberi*), амброзии полыннолистной (обычная амброзия полыннолистная, *Ambrosia elatior*), ежовника обыкновенного (*Echinochloa crus-galli*), паслена черного (*Solanum ptycanthum*) и мелколепестника канадского (*Conyza canadensis*), высаживали в илисто-глинистую почву и обрабатывали на предвсходовой стадии испытываемыми химическими соединениями, составленными в смеси нефитотоксичных растворителей, которая включала поверхностно-активное вещество.

Обработанные растения и контрольные растения выдерживали в теплице в течение 19-21 дня, после чего все виды сравнивали с контрольными растениями и визуально оценивали. Оценки ответа растений, кратко сформулированные в таблице С, представлены на основе шкалы от 0 до 100, где 0 представляет собой отсутствие эффекта, и 100 представляет собой полный контроль.

| Таблица С Соединение | Таблица С Соединение | Таблица С Соединение |
|----------------------------|----------------------------|----------------------------|
| 125 г а. и./га 13 | 62 г а. и./га 13 | 31 г а. и./га 13 |
| Предвсходовая стадия | Предвсходовая стадия | Предвсходовая стадия |
| Ежовник обыкновенный 97 | Ежовник обыкновенный 97 | Ежовник обыкновенный 68 |
| Кукуруза 15 | Кукуруза 0 | Кукуруза 0 |
| Росичка кроваво-красная 98 | Росичка кроваво-красная 98 | Росичка кроваво-красная 98 |
| Щетинник Фабера 95 | Щетинник Фабера 95 | Щетинник Фабера 88 |

| | | |
|--|---|---|
| Мелколепестник канадский 65 | Мелколепестник канадский 45 | Мелколепестник канадский 30 |
| Паслен черный 63 | Паслен черный 0 | Паслен черный 0 |
| Просо 48 | Просо 53 | Просо 0 |
| Щирица Палмера 28 | Щирица Палмера 0 | Щирица Палмера 0 |
| Амброзия полыннолистная 0 | Амброзия полыннолистная 0 | Амброзия полыннолистная 0 |
| Соя 0 | Соя 0 | Соя 0 |
| Ветвянка стелющаяся 99 | Ветвянка стелющаяся 89 | Ветвянка стелющаяся 90 |
| Канатник Теофраста 0 | Канатник Теофраста 0 | Канатник Теофраста 0 |
| Щирица бугорчатая 20 | Щирица бугорчатая 20 | Щирица бугорчатая 0 |
| Таблица С Соединение 16 г а. и./га 13 | Таблица С Соединение 8 г а. и./га 13 | Таблица С Соединение 4 г а. и./га 13 |
| Предвсходовая стадия | Предвсходовая стадия | Предвсходовая стадия |
| Ежовник обыкновенный 63 | Ежовник обыкновенный 28 | Ежовник обыкновенный 0 |
| Кукуруза 0 | Кукуруза 0 | Кукуруза 0 |
| Росичка кроваво-красная 98 | Росичка кроваво-красная 89 | Росичка кроваво-красная 70 |
| Щетинник Фабера 73 | Щетинник Фабера 55 | Щетинник Фабера 0 |
| Мелколепестник канадский 0 | Мелколепестник канадский 0 | Мелколепестник канадский 0 |
| Паслен черный 0 | Паслен черный 0 | Паслен черный 0 |
| Просо 0 | Просо 0 | Просо 0 |
| Щирица Палмера 0 | Щирица Палмера 0 | Щирица Палмера 0 |
| Амброзия полыннолистная 0 | Амброзия полыннолистная 0 | Амброзия полыннолистная 0 |
| Соя 0 | Соя 0 | Соя 0 |
| Ветвянка стелющаяся 58 | Ветвянка стелющаяся 30 | Ветвянка стелющаяся 30 |
| Канатник Теофраста 0 | Канатник Теофраста 0 | Канатник Теофраста 0 |
| Щирица бугорчатая 0 | Щирица бугорчатая 0 | Щирица бугорчатая 0 |

ИСПЫТАНИЕ D

Состав, содержащий 50 г/л испытуемого химического соединения, получали путем растворения активного ингредиента в смеси органических растворителей и эмульгатора, подробности чего представлены в таблице. Затем данный состав смешивали с небольшим, не фиксированным количеством ацетона для содействия растворению, затем добавляли 0,2 об./об.% водный раствор вспомогательного средства в качестве водного разбавителя с образованием водного раствора для распыления, который содержал предварительно

определенную концентрацию активного ингредиента.

| Химическое описание | Регистрационный номер согласно CAS | Количество (вес/вес%) |
|--------------------------------------|------------------------------------|-----------------------|
| Этоксилат касторового масла | 61791-12-6 | 10,6 |
| 1-Метил-2-пирролидон | 872-50-4 | 42,2 |
| Монометиловый эфир дипропиленгликоля | 34590-94-8 | 42,2 |

Затем этот водный раствор для распыления распыляли на растения, в том числе маис и пшеницу, которые на стадии семени обрабатывали антидотом гербицида, после однодневного культивирования (для предвсходовой стадии) или после приблизительно 12-дневного культивирования (для послевсходовой стадии). Растения выращивали из семян, высеянных в стандартную почву, помещенных в теплицу при контролируемых условиях (при 24/18°C или 20/16°C, день/ночь; 16 ч. света; влажности 65%). Затем после нанесения распылением растения выращивали в теплице при тех же условиях и поливали водой дважды в сутки. Через 15 д. для послевсходовой стадии и 20 ДАА для предвсходовой стадии давали оценку испытанию (100=полное повреждение растения; 0=нет повреждения растения).

| Код | Вид | Научное название |
|-------|---------------------------------|--|
| EPPO | | |
| TRZAW | Озимая пшеница | <i>Triticum aestivum L.</i> |
| HORVW | Озимый ячмень | <i>Hordeum vulgare L.</i> |
| AVEFA | Овес пустой | <i>Avena fatua L.</i> |
| SINAR | Горчица полевая | <i>Sinapis arvensis L.</i> |
| BEAVA | Сахарная свекла | <i>Beta vulgaris L.</i> |
| ALOMY | Лисохвост мышехвостниковидный | <i>Alopecurus myosuroides HUDS.</i> |
| BRSNN | Рапс | <i>Brassica napus L.</i> |
| BROTE | Костер кровельный | <i>Bromus tectorum L.</i> |
| GALAP | Подмаренник цепкий или липучник | <i>Galium aparine L.</i> |
| LOLPE | Плевел многолетний | <i>Lolium perenne L.</i> |
| STEME | Звездчатка средняя | <i>Stellaria media (L.) VILL./CYR.</i> |
| VERPE | Вероника дубравная | <i>Veronica persica POIR.</i> |
| KCHSC | Кохия | <i>Bassia scoparia</i> |
| CHEAL | Марь белая | <i>Chenopodium album L.</i> |
| POAAN | Мятлик однолетний | <i>Poa annua L.</i> |
| POLCO | Гречишка вьюнковая | <i>Polygonum convolvulus L.</i> |

| | | | | | | | | | |
|----|-----|----|----|----|----|----|----|----|----|
| 4 | 60 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 |
| 4 | 30 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 |
| 4 | 15 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 |
| 6 | 500 | 10 | 20 | 20 | 10 | 0 | 40 | 0 | 0 |
| 6 | 250 | 0 | 10 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 |
| 6 | 130 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 |
| 6 | 60 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 |
| 6 | 30 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 |
| 6 | 15 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 |
| 7 | 500 | 0 | 0 | 50 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 |
| 7 | 250 | 0 | 0 | 20 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 |
| 7 | 130 | 0 | 0 | 10 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 |
| 7 | 60 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 |
| 7 | 30 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 |
| 7 | 15 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 |
| 8 | 500 | 0 | 10 | 10 | 0 | 0 | 10 | 10 | 0 |
| 8 | 250 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 |
| 8 | 130 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 |
| 8 | 60 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 |
| 8 | 30 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 |
| 8 | 15 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 |
| 9 | 500 | 0 | 0 | 20 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 |
| 9 | 250 | 0 | 0 | 10 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 |
| 9 | 130 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 |
| 9 | 60 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 |
| 9 | 30 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 |
| 9 | 15 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 |
| 14 | 500 | 90 | 90 | 60 | 0 | 10 | 70 | 10 | 50 |
| 14 | 250 | 60 | 60 | 30 | 0 | 0 | 10 | 0 | 10 |
| 14 | 130 | 0 | 10 | 10 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 |
| 14 | 60 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 |
| 14 | 30 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 |
| 14 | 15 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 |
| 17 | 500 | 90 | 90 | 80 | 0 | 10 | 80 | 20 | 60 |
| 17 | 250 | 60 | 40 | 70 | 0 | 0 | 60 | 0 | 40 |

| | | | | | | | | | |
|----|-----|----|----|----|----|----|----|----|----|
| 3 | 30 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 20 | 0 |
| 3 | 15 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 |
| 4 | 500 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 90 | 20 |
| 4 | 250 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 80 | 0 |
| 4 | 130 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 50 | 0 |
| 4 | 60 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 40 | 0 |
| 4 | 30 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 |
| 4 | 15 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 |
| 6 | 500 | 20 | 30 | 10 | 20 | 10 | 20 | 70 | 0 |
| 6 | 250 | 10 | 20 | 10 | 10 | 0 | 10 | 20 | 0 |
| 6 | 130 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 10 | 0 |
| 6 | 60 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 |
| 6 | 30 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 |
| 6 | 15 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 |
| 7 | 500 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 |
| 7 | 250 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 |
| 7 | 130 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 |
| 7 | 60 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 |
| 7 | 30 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 |
| 7 | 15 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 |
| 8 | 500 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 60 | 0 |
| 8 | 250 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 |
| 8 | 130 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 |
| 8 | 60 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 |
| 8 | 30 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 |
| 8 | 15 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 |
| 9 | 500 | 10 | 20 | 80 | 0 | 0 | 0 | 50 | 0 |
| 9 | 250 | 0 | 30 | 10 | 0 | 0 | 0 | 10 | 0 |
| 9 | 130 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 10 | 0 |
| 9 | 60 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 |
| 9 | 30 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 |
| 9 | 15 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 |
| 14 | 500 | 0 | 80 | 60 | 20 | 0 | 50 | 80 | 80 |
| 14 | 250 | 0 | 50 | 10 | 0 | 0 | 0 | 80 | 50 |
| 14 | 130 | 0 | 40 | 0 | 0 | 0 | 0 | 20 | 20 |

| | | | | | | | | | |
|----|-----|----|----|----|----|---|----|----|----|
| 24 | 15 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 |
| 25 | 500 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 20 | 10 |
| 25 | 250 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 |
| 25 | 130 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 |
| 25 | 60 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 |
| 25 | 30 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 |
| 25 | 15 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 |
| 26 | 500 | 30 | 30 | 90 | 0 | 0 | 70 | 10 | 10 |
| 26 | 250 | 70 | 40 | 50 | 0 | 0 | 70 | 0 | - |
| 26 | 130 | 10 | 10 | 10 | 0 | 0 | 10 | 0 | 0 |
| 26 | 60 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 |
| 26 | 30 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 |
| 26 | 15 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 |
| 31 | 500 | 0 | 20 | 10 | 20 | 0 | 0 | 0 | 10 |
| 31 | 250 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 |
| 31 | 130 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 |
| 31 | 60 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 |
| 31 | 30 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 |
| 31 | 15 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 |

Таблица D1. "Злаки" предвсходовая стадия (продолжение)

| № соед. | Норм | GALA | LOLP | STEM | VERP | KCHS | CHEA | POAAN |
|---------|------|------|------|------|------|------|------|-------|
| | ы | Р | Е | Е | Е | С | Л | |
| 24 | 500 | 0 | 10 | 70 | 60 | 10 | 50 | 40 |
| 24 | 250 | 0 | 0 | 10 | 50 | 0 | 40 | 20 |
| 24 | 130 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 |
| 24 | 60 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 |
| 24 | 30 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 |
| 24 | 15 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 |
| 25 | 500 | 0 | 0 | 50 | 10 | 0 | 50 | 0 |
| 25 | 250 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 20 | 0 |
| 25 | 130 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 |
| 25 | 60 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 |
| 25 | 30 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 |
| 25 | 15 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 |
| 26 | 500 | 20 | 90 | 70 | 80 | 0 | 10 | 100 |

| | | | | | | | | |
|----|-----|---|----|----|----|---|----|----|
| 26 | 250 | 0 | 90 | 40 | 10 | 0 | 10 | 60 |
| 26 | 130 | 0 | 30 | 10 | 0 | 0 | 0 | 30 |
| 26 | 60 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 |
| 26 | 30 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 |
| 26 | 15 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 |
| 31 | 500 | 0 | 0 | 10 | 50 | 0 | 20 | 10 |
| 31 | 250 | 0 | 0 | 0 | 30 | 0 | 0 | 0 |
| 31 | 130 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 |
| 31 | 60 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 |
| 31 | 30 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 |
| 31 | 15 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 |

Таблица D2. "Злаки" послевсходовая стадия

| № | TRZA | HORV | AVEF | SINA | BEAV | ALO | BRSN | BRO | |
|-------|-------|------|------|------|------|-----|------|-----|----|
| соед. | Нормы | W | W | A | R | A | MY | N | TE |
| 2 | 500 | 60 | 30 | 40 | - | 10 | 30 | 40 | 30 |
| 2 | 250 | 20 | 20 | 10 | - | 20 | 10 | 50 | 0 |
| 2 | 130 | 20 | 0 | 0 | - | 10 | 0 | 40 | 0 |
| 3 | 500 | 50 | 30 | 30 | 10 | 10 | 20 | 0 | 0 |
| 3 | 250 | 0 | 0 | 0 | 0 | 10 | 0 | 10 | 0 |
| 3 | 130 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 10 | 0 |
| 6 | 500 | 20 | 30 | 10 | 40 | 0 | 0 | 10 | 10 |
| 6 | 250 | 10 | 10 | 0 | - | 0 | 0 | 0 | 0 |
| 6 | 130 | 0 | 0 | 0 | - | 0 | 0 | 0 | 0 |
| 14 | 500 | 80 | 70 | 80 | - | 20 | 70 | 40 | 30 |
| 14 | 250 | 70 | 70 | 70 | - | 30 | 60 | 50 | 10 |
| 14 | 130 | 10 | 20 | 30 | - | 30 | 40 | 40 | 0 |
| 17 | 500 | 70 | 80 | 60 | 60 | 20 | 70 | 20 | 20 |
| 17 | 250 | 40 | 40 | 30 | - | 20 | 50 | 20 | 10 |
| 17 | 130 | 0 | 10 | 0 | - | 10 | 30 | 0 | 0 |
| 18 | 500 | 40 | 50 | 40 | 40 | 0 | 40 | 20 | 0 |
| 18 | 250 | 10 | 30 | 20 | - | 0 | 30 | 10 | 0 |
| 18 | 130 | 0 | 0 | 0 | - | 0 | 10 | 10 | 0 |
| 19 | 500 | 20 | 40 | 40 | 20 | 10 | 30 | 10 | 0 |
| 19 | 250 | 0 | 0 | 10 | - | 10 | 0 | 20 | 0 |
| 19 | 130 | 0 | 0 | 0 | - | 0 | 0 | 0 | 0 |

| | | | | | | | | | |
|----|-----|----|----|----|----|----|----|----|---|
| 22 | 500 | 10 | 20 | 10 | 20 | 10 | 10 | 10 | 0 |
| 22 | 250 | 0 | 10 | 0 | - | 0 | 0 | 10 | 0 |
| 22 | 130 | 0 | 0 | 0 | - | 0 | 0 | 10 | 0 |
| 24 | 500 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 |
| 24 | 250 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 |
| 24 | 130 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 |
| 26 | 500 | 40 | 40 | 60 | 10 | 0 | 40 | 0 | 0 |
| 26 | 250 | 0 | 0 | 10 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 |
| 26 | 130 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 |

Таблица D2. "Злаки" послевсходовая стадия (продолжение)

| № | | GAL | LOL | STEM | VERP | KCH | CHEA | POAA | POLC |
|-------|-------|-----|-----|------|------|-----|------|------|------|
| соед. | Нормы | AP | PE | E | E | SC | L | N | O |
| 2 | 500 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 20 | 80 | 40 |
| 2 | 250 | 10 | 0 | 0 | 10 | 0 | 0 | 70 | 20 |
| 2 | 130 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | - | 20 | 0 |
| 3 | 500 | 0 | 0 | 10 | 60 | 0 | 0 | 50 | 0 |
| 3 | 250 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 20 | 0 |
| 3 | 130 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 |
| 6 | 500 | 20 | 0 | 10 | 20 | 10 | 0 | 10 | 0 |
| 6 | 250 | 10 | 0 | 0 | 10 | 0 | 0 | 0 | 0 |
| 6 | 130 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 |
| 14 | 500 | 20 | 50 | 70 | 60 | 20 | 40 | 90 | 40 |
| 14 | 250 | 10 | 20 | 50 | 50 | 20 | - | 90 | 30 |
| 14 | 130 | 0 | 0 | - | 50 | 10 | 50 | 80 | 20 |
| 17 | 500 | 30 | 60 | 30 | 60 | 20 | 50 | 90 | 10 |
| 17 | 250 | 40 | 30 | 0 | 70 | 0 | 60 | 80 | 0 |
| 17 | 130 | 0 | 0 | 0 | 30 | 0 | 0 | 60 | 0 |
| 18 | 500 | 40 | 10 | 20 | 40 | 0 | 20 | 70 | 0 |
| 18 | 250 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 50 | 0 |
| 18 | 130 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 |
| 19 | 500 | 20 | 10 | 0 | 10 | 0 | 40 | 40 | 0 |
| 19 | 250 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 30 | 0 |
| 19 | 130 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 |
| 22 | 500 | 10 | 0 | 30 | 60 | 0 | 30 | 0 | 10 |
| 22 | 250 | 40 | 0 | 0 | 50 | 0 | 20 | 0 | 0 |

| | | | | | | | | | |
|----|-----|----|----|---|----|---|----|----|---|
| 22 | 130 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 |
| 24 | 500 | 20 | 0 | 0 | 20 | 0 | 40 | 0 | 0 |
| 24 | 250 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 10 | 0 | 0 |
| 24 | 130 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 |
| 26 | 500 | 60 | 60 | 0 | 80 | 0 | 10 | 80 | 0 |
| 26 | 250 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 20 | 0 |
| 26 | 130 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 30 | 0 |

Таблица D3. "Маис" предвсходовая стадия

| № | GLXM | ZEAM | IPOH | BID | CYP | SORV | BRAP | EPHH | |
|-------|-------|------|------|-----|-----|------|------|------|----|
| соед. | Нормы | A | X | E | PI | ES | U | L | L |
| 2 | 500 | 0 | 10 | 0 | 0 | 0 | 0 | 90 | 10 |
| 2 | 250 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 90 | 0 |
| 2 | 130 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 80 | 0 |
| 2 | 60 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 80 | 0 |
| 2 | 30 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 70 | 0 |
| 2 | 15 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 |
| 3 | 500 | 10 | 0 | 0 | 0 | 10 | 0 | 100 | 10 |
| 3 | 250 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 100 | 10 |
| 3 | 130 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 100 | 0 |
| 3 | 60 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 90 | 0 |
| 3 | 30 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 50 | 0 |
| 3 | 15 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 20 | 0 |
| 4 | 500 | 0 | 10 | 10 | 0 | 0 | 50 | 90 | 10 |
| 4 | 250 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 40 | 90 | 0 |
| 4 | 130 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 10 | 80 | 0 |
| 4 | 60 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 10 | 60 | 0 |
| 4 | 30 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 40 | 0 |
| 4 | 15 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 40 | 0 |
| 6 | 500 | 0 | 0 | 0 | 0 | 80 | 0 | 90 | 0 |
| 6 | 250 | 0 | 0 | 0 | 0 | 10 | 0 | 80 | 0 |
| 6 | 130 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 80 | 0 |
| 6 | 60 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 60 | 0 |
| 6 | 30 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 50 | 0 |
| 6 | 15 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 |
| 7 | 500 | 0 | 10 | 0 | 0 | 20 | 80 | 100 | 40 |

| | | | | | | | | | |
|----|-----|---|----|---|---|---|----|-----|----|
| 7 | 250 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 70 | 90 | 10 |
| 7 | 130 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 20 | 80 | - |
| 7 | 60 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 80 | 0 |
| 7 | 30 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 60 | 0 |
| 7 | 15 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 |
| 8 | 500 | 0 | 10 | 0 | 0 | 0 | 30 | 100 | 70 |
| 8 | 250 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 20 | 90 | 0 |
| 8 | 130 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 10 | 80 | 0 |
| 8 | 60 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | - | 70 | 0 |
| 8 | 30 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | - | 70 | 0 |
| 8 | 15 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 20 | 0 |
| 9 | 500 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 100 | 10 |
| 9 | 250 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 100 | - |
| 9 | 130 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 90 | 0 |
| 9 | 60 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 30 | 0 |
| 9 | 30 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 10 | 0 |
| 9 | 15 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 |
| 14 | 500 | 0 | 50 | 0 | 0 | 0 | 30 | 90 | 20 |
| 14 | 250 | 0 | 20 | 0 | 0 | 0 | 0 | 90 | 10 |
| 14 | 130 | 0 | 10 | 0 | 0 | 0 | 0 | 90 | 0 |
| 14 | 60 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 60 | 0 |
| 14 | 30 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 40 | 0 |
| 14 | 15 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 30 | 0 |
| 17 | 500 | 0 | 30 | 0 | 0 | 0 | 0 | 90 | 10 |
| 17 | 250 | 0 | 10 | 0 | 0 | 0 | 0 | 80 | 0 |
| 17 | 130 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 80 | 0 |
| 17 | 60 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 80 | 0 |
| 17 | 30 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 60 | 0 |
| 17 | 15 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 20 | 0 |
| 18 | 500 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 10 | 90 | 20 |
| 18 | 250 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 80 | 10 |
| 18 | 130 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 80 | 0 |
| 18 | 60 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 70 | 0 |
| 18 | 30 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 60 | 0 |
| 18 | 15 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 10 | 0 |

| | | | | | | | | | |
|----|-----|---|---|---|---|---|---|----|---|
| 19 | 500 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 90 | 0 |
| 19 | 250 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 80 | 0 |
| 19 | 130 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 80 | 0 |
| 19 | 60 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 70 | 0 |
| 19 | 30 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 40 | 0 |
| 19 | 15 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 |
| 22 | 500 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 90 | 0 |
| 22 | 250 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 90 | 0 |
| 22 | 130 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 80 | 0 |
| 22 | 60 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 70 | 0 |
| 22 | 30 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 20 | 0 |
| 22 | 15 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 |

Таблица D3. "Маис" предвсходовая стадия (продолжение)

| № | ОРУ | ЕСН | СЕТ | АВУ | ДИГ | АМА | РАН | СИД | ЕЛЕ | |
|-------|-------|-----|-----|-----|-----|-----|-----|-----|-----|----|
| соед. | Нормы | СА | СГ | ФА | ТН | СА | РЕ | МИ | СП | ИН |
| 2 | 500 | 0 | 90 | 90 | 20 | 90 | 0 | 0 | 0 | 0 |
| 2 | 250 | 0 | 90 | 80 | 0 | 90 | 0 | 0 | 0 | 0 |
| 2 | 130 | 0 | 90 | 80 | 0 | 90 | 0 | 0 | 0 | 0 |
| 2 | 60 | 0 | 80 | 80 | 0 | 90 | 0 | 0 | 0 | 0 |
| 2 | 30 | 0 | 50 | 80 | 0 | 90 | 0 | 0 | 0 | 0 |
| 2 | 15 | 0 | 50 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 |
| 3 | 500 | 0 | 100 | 90 | 0 | 100 | - | 0 | 60 | 0 |
| 3 | 250 | 0 | 100 | 90 | 0 | 100 | - | 0 | 60 | 0 |
| 3 | 130 | 0 | 90 | 90 | 0 | 100 | - | 0 | 0 | 0 |
| 3 | 60 | 0 | 90 | 80 | 0 | 90 | - | 0 | - | 0 |
| 3 | 30 | 0 | 90 | 30 | 0 | 90 | - | 0 | 0 | 0 |
| 3 | 15 | 0 | 20 | 0 | 0 | 20 | - | 0 | 0 | 0 |
| 4 | 500 | 0 | 90 | 90 | 0 | 90 | - | 40 | 0 | 10 |
| 4 | 250 | 0 | 90 | 90 | 0 | 90 | - | 20 | - | 10 |
| 4 | 130 | 0 | 90 | 80 | 0 | 90 | - | 0 | - | - |
| 4 | 60 | 0 | 80 | 70 | 0 | 80 | - | 0 | 0 | - |
| 4 | 30 | 0 | 40 | 70 | 0 | 60 | - | 0 | 0 | 0 |
| 4 | 15 | 0 | 0 | 10 | 0 | 0 | - | 0 | 0 | 0 |
| 6 | 500 | 0 | 100 | 90 | 0 | 100 | 0 | 0 | | 0 |
| 6 | 250 | 0 | 90 | 90 | 0 | 90 | 0 | 0 | | 0 |

| | | | | | | | | | | |
|----|-----|---|-----|-----|----|-----|---|----|----|----|
| 6 | 130 | 0 | 80 | 80 | 0 | 90 | 0 | 0 | 0 | 0 |
| 6 | 60 | 0 | 20 | 10 | 0 | 90 | 0 | 0 | 0 | 0 |
| 6 | 30 | 0 | 20 | 0 | 0 | 30 | 0 | 0 | 0 | 0 |
| 6 | 15 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 |
| 7 | 500 | 0 | 100 | 100 | 10 | 100 | 0 | 20 | 10 | 70 |
| 7 | 250 | 0 | 100 | 90 | 0 | 100 | 0 | 0 | 0 | 50 |
| 7 | 130 | 0 | 100 | 90 | 0 | 100 | 0 | 0 | 0 | 60 |
| 7 | 60 | 0 | 90 | 80 | 0 | 90 | 0 | 0 | 0 | 10 |
| 7 | 30 | 0 | 90 | 80 | 0 | 80 | 0 | 0 | 0 | 0 |
| 7 | 15 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 |
| 8 | 500 | 0 | 100 | 100 | 0 | 100 | 0 | 30 | 0 | 0 |
| 8 | 250 | 0 | 90 | 100 | 0 | 100 | 0 | 0 | 0 | 0 |
| 8 | 130 | 0 | 90 | 90 | 0 | 100 | 0 | 0 | 0 | 0 |
| 8 | 60 | 0 | 90 | 70 | 0 | 100 | 0 | 0 | 0 | 0 |
| 8 | 30 | 0 | 90 | 80 | 0 | 90 | 0 | 0 | 0 | 0 |
| 8 | 15 | 0 | 30 | 10 | 0 | 10 | 0 | 0 | 0 | 0 |
| 9 | 500 | 0 | 90 | 90 | 10 | 100 | 0 | 0 | 0 | 0 |
| 9 | 250 | 0 | 90 | 70 | 10 | 90 | - | 0 | 0 | 0 |
| 9 | 130 | 0 | 90 | 50 | 0 | 100 | - | 0 | 0 | 0 |
| 9 | 60 | 0 | 80 | 0 | 0 | 80 | - | 0 | 0 | 0 |
| 9 | 30 | 0 | 20 | 0 | 0 | 80 | 0 | 0 | 0 | 0 |
| 9 | 15 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 |
| 14 | 500 | 0 | 90 | 90 | 20 | 90 | 0 | 80 | 80 | 0 |
| 14 | 250 | 0 | 90 | 90 | 10 | 90 | 0 | 30 | 80 | 0 |
| 14 | 130 | 0 | 90 | 80 | 0 | 90 | 0 | 0 | 30 | 0 |
| 14 | 60 | 0 | 70 | 80 | 0 | 90 | 0 | 0 | 30 | 0 |
| 14 | 30 | 0 | 50 | 70 | 0 | 80 | 0 | 0 | 10 | 0 |
| 14 | 15 | 0 | 30 | 30 | 0 | 60 | 0 | 0 | 10 | 0 |
| 17 | 500 | 0 | 100 | 90 | 10 | 90 | 0 | 0 | 0 | 0 |
| 17 | 250 | 0 | 100 | 90 | 0 | 90 | 0 | 0 | 0 | 0 |
| 17 | 130 | 0 | 90 | 90 | 0 | 90 | 0 | 0 | 0 | 0 |
| 17 | 60 | 0 | 90 | 90 | 0 | 90 | 0 | 0 | 0 | 0 |
| 17 | 30 | 0 | 90 | 80 | 0 | 90 | 0 | 0 | 0 | 0 |
| 17 | 15 | 0 | 0 | 0 | 0 | 30 | 0 | 0 | 0 | 0 |
| 18 | 500 | 0 | 90 | 90 | 30 | 100 | 0 | 0 | 0 | 0 |

| | | | | | | | | | |
|----|-----|---|---|---|---|---|---|----|---|
| 26 | 60 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 80 | 0 |
| 26 | 30 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 70 | 0 |
| 26 | 15 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 |
| 31 | 500 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 90 | 0 |
| 31 | 250 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 80 | 0 |
| 31 | 130 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 80 | 0 |
| 31 | 60 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 60 | 0 |
| 31 | 30 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 10 | 0 |
| 31 | 15 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 |

Таблица D3. "Маис" предвсходовая стадия (продолжение)

| № соедин. | Норм | ORYS | ECHC | SETF | ABUT | DIGS | AMAR | PANMI |
|-----------|------|------|------|------|------|------|------|-------|
| | ы | А | G | А | Н | А | Е | |
| 24 | 500 | 0 | 90 | 90 | 20 | 90 | 10 | 0 |
| 24 | 250 | 0 | 90 | 60 | 20 | 90 | 0 | 0 |
| 24 | 130 | 0 | 70 | 30 | 0 | 90 | 0 | 0 |
| 24 | 60 | 0 | 50 | 0 | 0 | 80 | 0 | 0 |
| 24 | 30 | 0 | 10 | 0 | 0 | 30 | 0 | 0 |
| 24 | 15 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 |
| 25 | 500 | 0 | 90 | 90 | 0 | 90 | 0 | 0 |
| 25 | 250 | 0 | 90 | 60 | 0 | 90 | 0 | 0 |
| 25 | 130 | 0 | 90 | 60 | 0 | 90 | 0 | 0 |
| 25 | 60 | 0 | 60 | 10 | 0 | 80 | 0 | 0 |
| 25 | 30 | 0 | 20 | 0 | 0 | 60 | 0 | 0 |
| 25 | 15 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 |
| 26 | 500 | 0 | 90 | 90 | 0 | 90 | 60 | 0 |
| 26 | 250 | 0 | 60 | 90 | 0 | 90 | 70 | 0 |
| 26 | 130 | 0 | 20 | 90 | 0 | 90 | 0 | 0 |
| 26 | 60 | 0 | 30 | 70 | 0 | 90 | 0 | 0 |
| 26 | 30 | 0 | 10 | 20 | 0 | 90 | 0 | 0 |
| 26 | 15 | 0 | 0 | 0 | 0 | 20 | 0 | 0 |
| 31 | 500 | 0 | 90 | 90 | 0 | 90 | 0 | 0 |
| 31 | 250 | 0 | 80 | 20 | 0 | 90 | 0 | 0 |
| 31 | 130 | 0 | 30 | 30 | 0 | 90 | 0 | 0 |
| 31 | 60 | 0 | 30 | 10 | 0 | 50 | 0 | 0 |
| 31 | 30 | 0 | 0 | 0 | 0 | 10 | 0 | 0 |

31 15 0 0 0 0 0 0 0

Таблица D4. "Маис" послевсходовая стадия

| № соед. | Норм | GLXM | ZEAM | IPON | BID | CYP | SORV | BRAP | EPHH |
|---------|------|------|------|------|-----|-----|------|------|------|
| | ы | A | X | E | PI | ES | U | L | L |
| 2 | 500 | 10 | 20 | 30 | 10 | 0 | 0 | 80 | 40 |
| 2 | 250 | 0 | 0 | 20 | 0 | 0 | 0 | 80 | 10 |
| 2 | 130 | 0 | 0 | 10 | 0 | 0 | 0 | 70 | 0 |
| 3 | 500 | 20 | 10 | 0 | 0 | 10 | 0 | 70 | 0 |
| 3 | 250 | 10 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 60 | 0 |
| 3 | 130 | 10 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 40 | 0 |
| 6 | 500 | 0 | 20 | 20 | 0 | 0 | 0 | 70 | 30 |
| 6 | 250 | 0 | 10 | 10 | 0 | 0 | 0 | 60 | 20 |
| 6 | 130 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 50 | 10 |
| 14 | 500 | 0 | 20 | 20 | 30 | 0 | 20 | 80 | 50 |
| 14 | 250 | 0 | 0 | 10 | 20 | 0 | 0 | 70 | 30 |
| 14 | 130 | 0 | 0 | 0 | 10 | 0 | 0 | 80 | 20 |
| 17 | 500 | 10 | 0 | 10 | 0 | 10 | 0 | 80 | 30 |
| 17 | 250 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 80 | 20 |
| 17 | 130 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 70 | 10 |
| 18 | 500 | 0 | 10 | 30 | 20 | 0 | 0 | 80 | 20 |
| 18 | 250 | 0 | 0 | 20 | 0 | 0 | 0 | 70 | 10 |
| 18 | 130 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 60 | 0 |
| 19 | 500 | 20 | 30 | 20 | 10 | 0 | 20 | 80 | 30 |
| 19 | 250 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 70 | 10 |
| 19 | 130 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 60 | 0 |
| 22 | 500 | 40 | 20 | 50 | 20 | 10 | 0 | 70 | 30 |
| 22 | 250 | 10 | 0 | 30 | 0 | 0 | 0 | 50 | 20 |
| 22 | 130 | 0 | 0 | 10 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 |
| 24 | 500 | 10 | 20 | 10 | 0 | 10 | 0 | 50 | 20 |
| 24 | 250 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 40 | 0 |
| 24 | 130 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 |
| 26 | 500 | 0 | 10 | 0 | 0 | 0 | 0 | 80 | 10 |
| 26 | 250 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 60 | 10 |
| 26 | 130 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 50 | 0 |

Таблица D4. "Маис" послевсходовая стадия (продолжение)

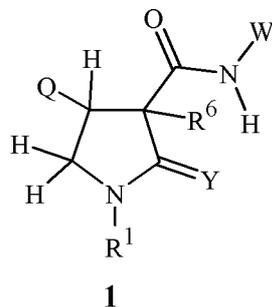
| № соедин. | Норм | ORY | ECH | SET | ABU | DIG | AMA | PAN | SID | ELE |
|-----------|------|-----|-----|-----|-----|-----|-----|-----|-----|-----|
| | ы | SA | CG | FA | TH | SA | RE | MI | SP | IN |
| 2 | 500 | 10 | 80 | 80 | 0 | 70 | 30 | 0 | 0 | 0 |
| 2 | 250 | 0 | 80 | 70 | - | 70 | 10 | 0 | 0 | 0 |
| 2 | 130 | 0 | - | 70 | - | 60 | 0 | 0 | 0 | 0 |
| 3 | 500 | 20 | 80 | 60 | 0 | 60 | 10 | 0 | 0 | 0 |
| 3 | 250 | 0 | 60 | 0 | 0 | 10 | 0 | 0 | 0 | 0 |
| 3 | 130 | 0 | 40 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 |
| 6 | 500 | 0 | 70 | 70 | 20 | 70 | 20 | 0 | - | 0 |
| 6 | 250 | 0 | 50 | 20 | 10 | 60 | - | 0 | - | 0 |
| 6 | 130 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | - | 0 |
| 14 | 500 | 0 | 80 | 70 | 10 | 70 | 30 | 0 | 30 | 0 |
| 14 | 250 | 0 | 80 | 70 | 0 | 70 | 0 | 0 | 0 | 0 |
| 14 | 130 | 0 | - | 70 | 0 | 60 | 0 | 0 | 0 | 0 |
| 17 | 500 | 10 | 80 | 70 | 20 | 80 | 40 | 0 | - | 20 |
| 17 | 250 | 0 | 80 | 70 | 0 | 80 | 20 | 0 | - | 10 |
| 17 | 130 | 0 | 80 | 60 | 0 | 70 | - | 0 | - | 0 |
| 18 | 500 | 0 | 70 | 70 | 30 | 70 | 20 | 10 | - | 0 |
| 18 | 250 | 0 | 60 | 30 | 0 | 60 | 10 | 10 | - | 0 |
| 18 | 130 | 0 | 0 | 0 | 0 | 30 | 0 | 0 | - | 0 |
| 19 | 500 | 10 | 70 | 70 | 20 | 80 | 20 | 40 | - | 60 |
| 19 | 250 | 0 | 20 | 50 | 10 | 70 | 10 | 10 | - | 10 |
| 19 | 130 | 0 | 10 | 0 | 0 | 60 | 0 | 0 | - | 10 |
| 22 | 500 | 0 | 50 | 20 | 30 | 60 | 0 | 40 | - | 40 |
| 22 | 250 | 0 | 40 | 0 | 10 | 60 | 0 | 20 | - | 10 |
| 22 | 130 | 0 | 0 | 0 | 0 | 40 | 0 | 70 | - | 10 |
| 24 | 500 | 10 | 0 | 10 | 10 | 0 | 0 | 10 | - | 0 |
| 24 | 250 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | - | 0 |
| 24 | 130 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | - | 0 |
| 26 | 500 | 0 | 10 | 60 | 0 | 60 | 0 | 0 | - | 10 |
| 26 | 250 | 0 | 0 | 60 | 0 | 10 | 0 | 0 | - | 0 |
| 26 | 130 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | - | 0 |

Таблица D4. "Маис" послеуборочная стадия (продолжение)

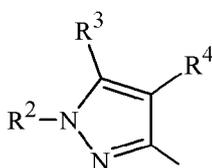
| № соедин. | Норм | GLXM | ZEAM | IPOH | BID | CYP | SORV | BRAP | EPHH |
|-----------|------|------|------|------|-----|-----|------|------|------|
| | ы | A | X | E | PI | ES | U | L | L |

ФОРМУЛА ИЗОБРЕТЕНИЯ

1. Соединение, выбранное из формулы 1, включая все его стереоизомеры, *N*-оксиды и соли,

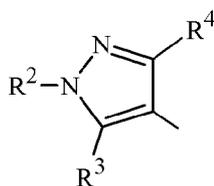


где Q выбран из группы, состоящей из



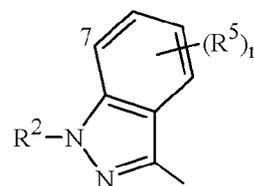
Q-1

;



Q-2

и



Q-3

R^1 представляет собой H, C_1 - C_6 алкил, C_1 - C_6 галогеналкил, C_3 - C_7 циклоалкил или C_4 - C_8 циклоалкилалкил;

R^2 представляет собой C_1 - C_6 алкил или C_1 - C_6 галогеналкил;

R^3 представляет собой галоген, C_1 - C_6 алкил, C_1 - C_6 галогеналкил, C_1 - C_6 алкокси или C_1 - C_6 галогеналкокси;

Y представляет собой O или S;

R^4 представляет собой H, галоген, C_1 - C_4 алкил или C_1 - C_4 галогеналкил;

R^5 представляет собой галоген, C_1 - C_4 алкил или C_1 - C_4 галогеналкил;

n равняется 1, 2, 3 или 4;

R^6 представляет собой H, галоген, гидроксильная группа, C_1 - C_4 алкокси, C_1 - C_4 галогеналкил или C_1 - C_4 алкил;

W представляет собой фенил или пиридил, при этом каждый из фенила или пиридила необязательно замещен не более 5 R^9 ; и

каждый R^9 независимо представляет собой галоген, циано, нитро, C_1 - C_4 алкил, C_1 - C_4 галогеналкил, C_2 - C_4 алкенил, C_2 - C_4 галогеналкенил, C_2 - C_4 алкинил, C_2 - C_4 галогеналкинил, C_1 - C_4 нитроалкил, C_2 - C_4 нитроалкенил, C_2 - C_4 алкоксиалкил, C_2 - C_4 галогеналкоксиалкил, C_3 - C_4 циклоалкил, C_3 - C_4 галогенциклоалкил, циклопропилметил, метилциклопропил, C_1 - C_4 алкокси, C_1 - C_4 галогеналкокси, C_2 - C_4 алкенилокси, C_2 - C_4 галогеналкенилокси, C_3 - C_4 алкинилокси, C_3 - C_4 галогеналкинилокси, C_3 - C_4 циклоалкокси, C_1 - C_4 алкилтио, C_1 - C_4 галогеналкилтио, C_1 - C_4 алкилсульфинил, C_1 - C_4 галогеналкилсульфинил, C_1 - C_4 алкилсульфонил, C_1 - C_4 галогеналкилсульфонил, гидроксильная группа, формил, C_2 - C_4 алкилкарбонил,

C₂-C₄алкилкарбонилокси, C₁-C₄алкилсульфонилокси, C₁-C₄галогеналкилсульфонилокси, amino, C₁-C₄алкиламино, C₂-C₄диалкиламино, формиламино, C₂-C₄алкилкарбониламино, -SF₅, -SCN, C₃-C₄триалкилсиллил, триметилсиллилметил или триметилсиллилметокси;

при условии, что соединение является отличным от соединения формулы 1, где Q представляет собой Q-1; R¹ представляет собой H; R² представляет собой CH₃; R³ представляет собой C(CH₃)₃; R⁴ представляет собой H; R⁶ представляет собой H; Y представляет собой O, W представляет собой фенил, замещенный R⁹ при 2-положении; и R⁹ представляет собой F.

2. Соединение по п. 1, где

R¹ представляет собой H, C₁-C₆алкил, C₁-C₆галогеналкил или C₄-C₈циклоалкилалкил;

R² представляет собой C₁-C₃алкил или C₁-C₃галогеналкил;

R³ представляет собой галоген, C₁-C₆алкил или C₁-C₆галогеналкил;

Y представляет собой O;

R⁴ представляет собой H или Cl;

R⁵ представляет собой F, Cl или Br;

n равняется 1, 2 или 3;

R⁶ представляет собой H, галоген, гидроксильная группа, C₁-C₄алкокси или C₁-C₄алкил;

W представляет собой фенил, 3-пиридил или 4-пиридил, при этом каждый из фенила, 3-пиридила или 4-пиридила необязательно замещен не более 4 R⁹; и

каждый R⁹ независимо представляет собой галоген, циано, нитро, C₁-C₄алкил, C₁-C₄галогеналкил, C₂-C₄алкоксиалкил, C₂-C₄галогеналкоксиалкил, C₃-C₄циклоалкил, C₃-C₄галогенциклоалкил, циклопропилметил, метилциклопропил, C₁-C₄алкокси, C₁-C₄галогеналкокси, C₃-C₄циклоалкокси, C₁-C₄алкилтио, C₁-C₄галогеналкилтио, C₁-C₄алкилсульфинил, C₁-C₄галогеналкилсульфинил, C₁-C₄алкилсульфонил, C₁-C₄галогеналкилсульфонил, гидроксильная группа, формил, C₂-C₄алкилкарбонил, C₂-C₄алкилкарбонилокси, C₁-C₄алкилсульфонилокси, C₁-C₄галогеналкилсульфонилокси.

3. Соединение по п. 2, где

Q выбран из группы, состоящей из Q-1 и Q-2;

R¹ представляет собой H, C₁-C₄алкил или C₄-C₅циклоалкилалкил;

R² представляет собой C₁-C₂алкил или C₁-C₂галогеналкил;

R³ представляет собой галоген, C₁-C₃алкил или C₁-C₃галогеналкил;

R⁴ представляет собой H;

n равняется 1 или 2;

R⁶ представляет собой H, Cl, гидроксильная группа, OCH₃ или CH₃;

W представляет собой фенил или 3-пиридил, при этом каждый из фенила или 3-пиридила необязательно замещен не более 3 R⁹; и

каждый R⁹ независимо представляет собой галоген, циано, нитро, C₁-C₄алкил, C₁-C₄галогеналкил, C₁-C₄алкокси, C₁-C₄алкилтио, C₁-C₄алкилсульфинил или C₁-C₄алкилсульфонил.

4. Соединение по п. 3, где
 Q представляет собой Q-1;
 R^1 представляет собой H, CH_3 или циклопропилметил;
 R^2 представляет собой CH_3 или CH_2CF_3 ;
 R^3 представляет собой Cl, CH_3 или CF_3 ;
 R^6 представляет собой H;
 W представляет собой фенил, замещенный не более 3 R^9 ; и
 каждый R^9 независимо представляет собой галоген, C_1 - C_4 алкил, C_1 - C_4 галогеналкил или C_1 - C_4 алкилсульфонил.

5. Соединение по п. 4, где
 R^1 представляет собой H или CH_3 ;
 R^2 представляет собой CH_3 ;
 R^3 представляет собой CH_3 или CF_3 ;
 R^6 представляет собой H;
 каждый R^9 независимо представляет собой F или CF_3 ; и
 R^9 находится в *орто*-, *мета*- или *пара*-положении по отношению к W (относительно связи с остальной частью формулы 1).

6. Соединение по п. 1, которое представляет собой
 (3*S*,4*R*)-*N*-(2,3-дифторфенил)-1-метил-4-[1-метил-5-(трифторметил)-1*H*-пиразол-3-ил]-2-оксо-3-пирролидинкарбоксамид.

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

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

9. Гербицидная смесь, содержащая (а) соединение по п. 1 и (б) по меньшей мере один дополнительный активный ингредиент, выбранный из (b1) ингибиторов фотосистемы II, (b2) ингибиторов синтазы ацетогидроксикислот (AHAS), (b3) ингибиторов ацетил-СоА-карбоксилазы (АССазы), (b4) имитаторов ауксинов, (b5) ингибиторов синтазы 5-енол-пирувиллицимат-3-фосфата (EPSP), (b6) диверторов электронов фотосистемы I, (b7) ингибиторов протопорфириногенаксидазы (PPO), (b8) ингибиторов синтазы глутамина (GS), (b9) ингибиторов элонгазы жирных кислот с очень длинной цепью (VLCFA), (b10) ингибиторов транспорта ауксинов, (b11) ингибиторов фитоендесатуразы (PDS), (b12) ингибиторов 4-гидроксифенил-пируватдиоксигеназы (HPPD), (b13) ингибиторов гомогентизатсоланезилтрансферазы (HST), (b14) ингибиторов биосинтеза целлюлозы, (b15) других гербицидов, в том числе средств, прерывающих митоз, органических соединений, содержащих мышьяк, асулама, бромобутида, цинметилина, кумилурона,

дазомета, 2-[(2,5-дихлорфенил)метил]-4,4-диметил-3-изоксазолидинона, дифензоквата, димрона, этобензанида, флуренола, фосамина, фосамин-аммония, гидантоцидина, метама, метилдимрона, олеиновой кислоты, оксазикломефона, пеларгоновой кислоты и пирибутикарба, (b16) антидотов гербицидов и солей соединений (b1) - (b16).

10. Способ осуществления контроля роста нежелательной растительности, включающий приведение растительности или ее среды произрастания в контакт с гербицидно эффективным количеством соединения по п. 1.

По доверенности