

(19)



Евразийское  
патентное  
ведомство

(21) 202290328 (13) A1

## (12) ОПИСАНИЕ ИЗОБРЕТЕНИЯ К ЕВРАЗИЙСКОЙ ЗАЯВКЕ

(43) Дата публикации заявки  
2022.06.27(22) Дата подачи заявки  
2020.07.20

(51) Int. Cl. C07D 401/12 (2006.01)  
A01N 43/54 (2006.01)  
A01N 43/76 (2006.01)  
A01N 43/78 (2006.01)  
A01N 59/14 (2006.01)  
C07D 401/14 (2006.01)  
C07D 405/14 (2006.01)  
C07D 409/14 (2006.01)  
C07D 453/02 (2006.01)  
C07F 5/02 (2006.01)  
C07D 413/14 (2006.01)  
C07D 417/14 (2006.01)  
C07D 493/04 (2006.01)  
C07D 493/08 (2006.01)

## (54) ЗАМЕЩЕННЫЕ N-ФЕНИЛ-N-АМИНОУРАЦИЛЫ И ИХ СОЛИ, А ТАКЖЕ ИХ ПРИМЕНЕНИЕ В КАЧЕСТВЕ ГЕРБИЦИДНЫХ ДЕЙСТВУЮЩИХ ВЕЩЕСТВ

(31) 19187525.1

(32) 2019.07.22

(33) EP

(86) PCT/EP2020/070464

(87) WO 2021/013800 2021.01.28

(71) Заявитель:

БАЙЕР АКЦИЕНГЕЗЕЛЬШАФТ  
(DE)

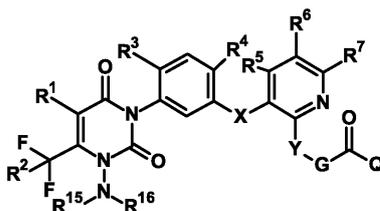
(72) Изобретатель:

Фракенполь Энс, Хайнеманн Инес,  
Вильмс Лотар, Якоби Харальд,  
Хельмке Хендрик, Розингер  
Кристофер Хью, Асмус Элизабет (DE)

(74) Представитель:

Беляева Е.Н. (BY)

(57) Настоящее изобретение касается замещенных N-фенил-N-аминоурацилов общей формулы (I) или их солей



причем остатки в общей формуле (I) соответствуют определениям, приведенным в описании, а также их применения в качестве гербицидов, в частности, для борьбы с сорняками и/или сорными травами в культурах полезных растений и/или в качестве регуляторов роста растений для влияния на рост культур полезных растений.

A1

202290328

202290328

A1

## **Замещенные N-фенил-N-аминоурацилы и их соли, а также их применение в качестве гербицидных действующих веществ**

Настоящее изобретение относится к технической области средств защиты растений, в частности, к области гербицидов для селективной защиты от сорных трав и сорных растений в культурах полезных сельскохозяйственных растений.

В частности, настоящее изобретение касается замещенных N-фенил-N-аминоурацилов, а также их солей, способа их получения и применения в качестве гербицидов, в частности, для борьбы с сорными растениями и/или сорными травами в культурах полезных растений, и/или в качестве регуляторов роста для регулирования роста полезных растений.

Известные до настоящего момента средства защиты для селективной борьбы с вредными растениями в культурах полезных растений или действующие вещества для борьбы с нежелательным ростом растений при их использовании могут обнаруживать недостатки, это значит, что они (a) не действуют или оказывают недостаточное гербицидное действие на определенные вредные растения, (b) могут использоваться для борьбы с небольшим спектром вредных растений, (c) обладают незначительной селективностью в культурах полезных растений и/или (d) обладают токсикологически нежелательным профилем. Далее некоторые действующие вещества, которые можно использовать в качестве регуляторов роста растений для некоторых полезных растений, приводят к уменьшению урожайности в культурах других полезных растений или являются несовместимыми с культурными растениями, или совместимыми лишь при использовании в небольшом диапазоне норм расхода. Некоторые из известных действующих веществ невозможно получить в промышленном масштабе из-за труднодоступных исходных продуктов и реактивов, или же они обладают недостаточной химической стабильностью. В других действующих веществах эффективность очень зависит от условий окружающей среды, таких как погодные и почвенные условия.

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

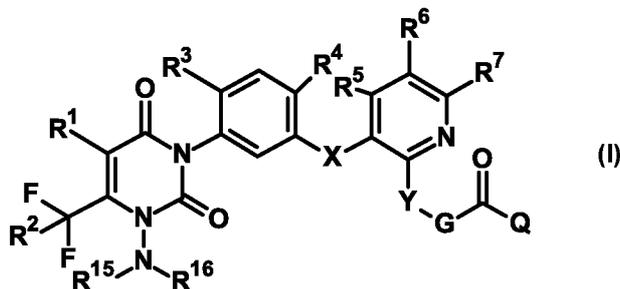
Данные, приведенные в различных работах, свидетельствуют о том, что в качестве гербицидных веществ могут применяться определенные замещенные N-связанные арилурацилы (см. EP408382, EP473551, EP648749, US4943309, US5084084, US5127935, WO91/00278, WO95/29168, WO95/30661, WO96/35679, WO97/01541, WO98/25909, WO2001/39597). Известные арилурацилы, тем не менее, демонстрируют целый ряд пробелов в части воздействия на однодольные сорные растения. Также известен целый ряд комбинаций действующих веществ на основе N-связанных арилурацилов (см. DE4437197, EP714602, WO96/07323, WO96/08151, JP11189506). Однако, свойства указанных комбинаций действующих веществ не были удовлетворительными во всех аспектах.

Также известно, что определенные N-арилурацилы, при необходимости, можно использовать в качестве гербицидных действующих веществ с далее замещенными группами молочной кислоты (см. JP2000/302764, JP2001/172265, US6403534, EP408382A1). Кроме того, известно, что N-арилурацилы также демонстрируют гербицидное действие в сочетании со специальными, при необходимости далее замещенными, группами соединений тиомолочной кислоты (см. WO2010/038953, KR2011110420). Выбранные замещенные тетрагидрофурил-эфир N-арилурацилов, при необходимости, далее замещенные группами соединений тиомолочной кислоты, описаны в заявке JP09188676.

Также известны замещенные урацилы, которые содержат N-связанные или далее замещенные группы диарилэфира или соответствующий остаток гетероарилового эфира (см. US6333296, US6121201, WO2001/85907, EP1122244A1, EP1397958A1, EP1422227A1, WO 2002/098227, WO 2018/019842). Ниже описаны высокозамещенные N-арилурацилы со специфической замещенной карбонилалкилокси-группой (см. WO2011/137088). Также известны замещенные 3-фенил-5-алкил-6-(трифторметил)пиримидин-2,4(1H,3H)-дионы (см. WO2019/101551) и родственные замещенные 3-(пиридин-2-ил)-5-алкил-6-(трифторметил)-пиримидин-2,4(1H,3H)-дионы (см. WO2019/101513).

Неожиданно было обнаружено, что определенные замещенные N-фенил-N-аминоурацилы или их соли хорошо подходят для использования в качестве гербицидов, и особенно предпочтительны для применения в качестве действующих веществ для борьбы с однодольными и двудольными сорными растениями среди полезных растений.

Таким образом, предметом настоящего изобретения являются замещенные N-фенил-N-аминоурацилы общей формулы (I) или их соли



где

R<sup>1</sup> означает водород, (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-галоалкил,

R<sup>2</sup> означает водород, фтор, хлор, бром, трифторметил, (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-алкокси,

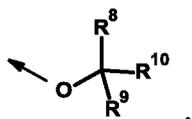
R<sup>3</sup> означает водород, галоген, (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-алкокси,

R<sup>4</sup> означает галоген, циано, NO<sub>2</sub>, C(O)NH<sub>2</sub>, C(S)NH<sub>2</sub>, (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-галоалкил, (C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>)-алкинил,

R<sup>5</sup>, R<sup>6</sup> и R<sup>7</sup> независимо друг от друга означают водород, галоген, циано, (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-алкил, (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-галоалкил, (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-алкокси, (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-галоалкокси,

G означает неразветвленный или разветвленный (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-алкилен,

Q означает гидроксильный или остаток следующей формулы



R<sup>8</sup> означает водород, (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-алкил, (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-галоалкил, арил, арил-(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-алкил, гетероарил, (C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>)-алкинил, (C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>)-алкенил, C(O)R<sup>13</sup>, C(O)OR<sup>13</sup>, (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-алкокси-(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-алкил,

R<sup>9</sup> означает водород или (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-алкил,

R<sup>10</sup> означает водород, галоген, циано, NO<sub>2</sub>, (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-алкил, (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-галоалкил, (C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)-циклоалкил, (C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)-циклоалкил-(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-алкил, (C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)-галоциклоалкил, (C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)-галоциклоалкил-(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-алкил, (C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>)-алкенил, (C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>)-алкинил, арил, арил-(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-алкил,

гетероарил, гетероарил-(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-алкил, гетероциклил, гетероциклил-(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-алкил, R<sup>11</sup>R<sup>12</sup>N-(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-алкил, R<sup>13</sup>O-(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-алкил, циано-(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-алкил, (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-алкилкарбонилокси-(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-алкил, (C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)-циклоалкилкарбонилокси-(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-алкил, арилкарбонилокси-(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-алкил, гетероарилкарбонилокси-(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-алкил, гетероциклилкарбонилокси-(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-алкил, OR<sup>13</sup>, NR<sup>11</sup>R<sup>12</sup>, SR<sup>14</sup>, S(O)R<sup>14</sup>, SO<sub>2</sub>R<sup>14</sup>, R<sup>14</sup>S-(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-алкил, R<sup>14</sup>(O)S-(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-алкил, R<sup>14</sup>O<sub>2</sub>S-(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-алкил, трис-[(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-алкил]силлил-(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-алкил, бис-[(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-алкил](арил)силлил-(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-алкил, [(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-алкил]-бис-(арил)силлил-(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-алкил, трис-[(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-алкил]силлил, бис-гидроксидборил-(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-алкил, бис-[(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-алкокси]борил-(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-алкил, тетраметил-1,3,2-диоксаборолан-2-ил, тетраметил-1,3,2-диоксаборолан-2-ил-(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-алкил, нитро-(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-алкил, C(O)OR<sup>13</sup>, C(O)R<sup>13</sup>, C(O)NR<sup>11</sup>R<sup>12</sup>, R<sup>13</sup>O(O)C-(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-алкил, R<sup>11</sup>R<sup>12</sup>N(O)C-(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-алкил, бис-(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-алкокси-(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-алкил, или

R<sup>8</sup> и R<sup>10</sup> образуют с атомом углерода, к которому они присоединены, полностью насыщенное или частично насыщенное, при необходимости, прерываемое гетероатомами и, при необходимости, дополнительно замещенное 3-10-членное моноциклическое или бициклическое кольцо,

R<sup>11</sup> и R<sup>12</sup> являются одинаковыми или различными и независимо друг от друга означают водород, (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-алкил, (C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>)-алкенил, (C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>)-алкинил, (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-цианоалкил, (C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub>)-галоалкил, (C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>)-галоалкенил, (C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)-галоалкинил, (C<sub>3</sub>-C<sub>10</sub>)-циклоалкил, (C<sub>3</sub>-C<sub>10</sub>)-галоциклоалкил, (C<sub>4</sub>-C<sub>10</sub>)-циклоалкенил, (C<sub>4</sub>-C<sub>10</sub>)-галоциклоалкенил, (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-алкокси-(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-алкил, (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-галоалкокси-(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-алкил, (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-алкилтио-(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-алкил, (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-галоалкилтио-(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-алкил, (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-алкокси-(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-галоалкил, арил, арил-(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-алкил, гетероарил, гетероарил-(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-алкил, (C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)-циклоалкил-(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-алкил, (C<sub>4</sub>-C<sub>10</sub>)-циклоалкенил-(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-алкил, COR<sup>13</sup>, SO<sub>2</sub>R<sup>14</sup>, гетероциклил, (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-алкоксикарбонил, бис-[(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-алкил]аминокарбонил-(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-алкил, (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-алкил-аминокарбонил-(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-алкил, арил-(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-алкил-аминокарбонил-(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-алкил, арил-(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-алкоксикарбонил,

гетероарил-(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-алкоксикарбонил, (C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>)-алкенилоксикарбонил, (C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>)-алкинилоксикарбонил, гетероциклил-(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-алкил, или

R<sup>11</sup> и R<sup>12</sup> образуют с атомом азота, к которому они присоединены, полностью насыщенное или частично насыщенное, при необходимости, прерываемое гетероатомами и, при необходимости, дополнительно замещенное 3-10-членное моноциклическое или бициклическое кольцо,

R<sup>13</sup> означает водород, (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-алкил, (C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>)-алкенил, (C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>)-алкинил, (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-цианоалкил, (C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub>)-галоалкил, (C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>)-галоалкенил, (C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)-галоалкинил, (C<sub>3</sub>-C<sub>10</sub>)-циклоалкил, (C<sub>3</sub>-C<sub>10</sub>)-галоциклоалкил, (C<sub>4</sub>-C<sub>10</sub>)-циклоалкенил, (C<sub>4</sub>-C<sub>10</sub>)-галоциклоалкенил, (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-алкокси-(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-алкил, (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-галоалкокси-(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-алкил, (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-алкокси-(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-галоалкил, (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-алкокси-(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-алкокси-(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-алкил, (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-алкокси-(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-алкокси-(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-алкокси-(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-алкил, (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-алкокси-(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-алкокси-(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-алкокси-(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-алкил, арил, арил-(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-алкил, арил-(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-алкокси-(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-алкил, гетероарил, гетероарил-(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-алкил, (C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)-циклоалкил-(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-алкил, (C<sub>4</sub>-C<sub>10</sub>)-циклоалкенил-(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-алкил, бис-[(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-алкил]аминокарбонил-(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-алкил, (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-алкил-аминокарбонил-(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-алкил, арил-(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-алкил-аминокарбонил-(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-алкил, бис-[(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-алкил]амино-(C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)-алкил, (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-алкил-амино-(C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)-алкил, арил-(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-алкил-амино-(C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)-алкил, R<sup>14</sup>S-(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-алкил, R<sup>14</sup>(O)S-(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-алкил, R<sup>14</sup>O<sub>2</sub>S-(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-алкил, гидроксикарбонил-(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-алкил, гетероциклил, гетероциклил-(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-алкил, трис-[(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-алкил]силил-(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-алкил, бис-[(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-алкил](арил)силил(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-алкил, [(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-алкил]-бис-(арил)силил-(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-алкил, (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-алкилкарбонилокси-(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-алкил, (C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)-циклоалкилкарбонилокси-(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-алкил, арилкарбонилокси-(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-алкил, гетероарилкарбонилокси-(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-алкил, гетероциклилкарбонилокси-(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-алкил, арилокси-(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-алкил, гетероарилокси-(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-алкил, (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-алкоксикарбонил,

R<sup>14</sup> означает водород, (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-алкил, (C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>)-алкенил, (C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>)-алкинил, (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-цианоалкил, (C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub>)-галоалкил, (C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>)-галоалкенил, (C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)-галоалкинил, (C<sub>3</sub>-C<sub>10</sub>)-циклоалкил, (C<sub>3</sub>-C<sub>10</sub>)-галоциклоалкил, (C<sub>4</sub>-C<sub>10</sub>)-

циклоалкенил, (C<sub>4</sub>-C<sub>10</sub>)-галоциклоалкенил, (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-алкокси-(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-алкил, (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-алкокси-(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-галоалкил, арил, арил-(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-алкил, гетероарил, гетероарил-(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-алкил, гетероциклил-(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-алкил, (C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)-циклоалкил-(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-алкил, (C<sub>4</sub>-C<sub>10</sub>)-циклоалкенил-(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-алкил, бис-[(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-алкил]амино, (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-алкил-амино, арил-(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-амино, арил-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-алкил-амино, арил-[(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-алкил]амино; (C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)-циклоалкил-амино, (C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)-циклоалкил-[(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-алкил]амино; N-азетидинил, N-пирролидинил, N-пиперидинил, N-морфолинил,

R<sup>15</sup> и R<sup>16</sup> независимо друг от друга означают водород, (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-алкил, (C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>)-алкенил, C(O)R<sup>13</sup>, C(O)OR<sup>13</sup>, C(O)NR<sup>11</sup>R<sup>12</sup>, SO<sub>2</sub>R<sup>14</sup>, или

R<sup>15</sup> и R<sup>16</sup> образуют с атомом азота, к которому они присоединены, при необходимости, дополнительно замещенную водородом, (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-алкилом, арил-(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-алкилом, (C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)-циклоалкилом, арилом, гетероарилом, гетероциклилом, (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-алкоксикарбонил-(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-алкилом, арил-(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-алкоксикарбонил-(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-алкилом иминогруппу,

и

X и Y независимо друг от друга означают O (кислород) или S (серу).

Предпочтительным предметом изобретения являются соединения общей формулы (I), где

R<sup>1</sup> означает водород,

R<sup>2</sup> означает водород, фтор, хлор, бром, трифторметил, (C<sub>1</sub>-C<sub>7</sub>)-алкокси,

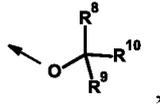
R<sup>3</sup> означает водород, галоген, (C<sub>1</sub>-C<sub>7</sub>)-алкокси,

R<sup>4</sup> означает галоген, циано, NO<sub>2</sub>, C(O)NH<sub>2</sub>, C(S)NH<sub>2</sub>, (C<sub>1</sub>-C<sub>7</sub>)-галоалкил, (C<sub>2</sub>-C<sub>7</sub>)-алкинил,

R<sup>5</sup>, R<sup>6</sup> и R<sup>7</sup> независимо друг от друга означают водород, галоген, циано, (C<sub>1</sub>-C<sub>7</sub>)-алкил, (C<sub>1</sub>-C<sub>7</sub>)-галоалкил, (C<sub>1</sub>-C<sub>7</sub>)-алкокси, (C<sub>1</sub>-C<sub>7</sub>)-галоалкокси,

G означает неразветвленный или разветвленный (C<sub>1</sub>-C<sub>7</sub>)-алкилен,

Q означает гидроксильную группу или остаток следующей формулы



R<sup>8</sup> означает водород, (C<sub>1</sub>-C<sub>7</sub>)-алкил, (C<sub>1</sub>-C<sub>7</sub>)-галоалкил, арил, арил-(C<sub>1</sub>-C<sub>7</sub>)-алкил, гетероарил, (C<sub>2</sub>-C<sub>7</sub>)-алкинил, (C<sub>2</sub>-C<sub>7</sub>)-алкенил, C(O)R<sup>13</sup>, C(O)OR<sup>13</sup>, (C<sub>1</sub>-C<sub>7</sub>)-алкокси-(C<sub>1</sub>-C<sub>7</sub>)-алкил,

R<sup>9</sup> означает водород или (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-алкил,

R<sup>10</sup> означает водород, галоген, циано, NO<sub>2</sub>, (C<sub>1</sub>-C<sub>7</sub>)-алкил, (C<sub>1</sub>-C<sub>7</sub>)-галоалкил, (C<sub>3</sub>-C<sub>7</sub>)-циклоалкил, (C<sub>3</sub>-C<sub>7</sub>)-циклоалкил-(C<sub>1</sub>-C<sub>7</sub>)-алкил, (C<sub>3</sub>-C<sub>7</sub>)-галоциклоалкил, (C<sub>3</sub>-C<sub>7</sub>)-галоциклоалкил-(C<sub>1</sub>-C<sub>7</sub>)-алкил, (C<sub>2</sub>-C<sub>7</sub>)-алкенил, (C<sub>2</sub>-C<sub>7</sub>)-алкинил, арил, арил-(C<sub>1</sub>-C<sub>7</sub>)-алкил, гетероарил, гетероарил-(C<sub>1</sub>-C<sub>7</sub>)-алкил, гетероциклил, гетероциклил-(C<sub>1</sub>-C<sub>7</sub>)-алкил, R<sup>11</sup>R<sup>12</sup>N-(C<sub>1</sub>-C<sub>7</sub>)-алкил, R<sup>13</sup>O-(C<sub>1</sub>-C<sub>7</sub>)-алкил, циано-(C<sub>1</sub>-C<sub>7</sub>)-алкил, (C<sub>1</sub>-C<sub>7</sub>)-алкилкарбонилокси-(C<sub>1</sub>-C<sub>7</sub>)-алкил, (C<sub>3</sub>-C<sub>7</sub>)-циклоалкилкарбонилокси-(C<sub>1</sub>-C<sub>7</sub>)-алкил, арилкарбонилокси-(C<sub>1</sub>-C<sub>7</sub>)-алкил, гетероарилкарбонилокси-(C<sub>1</sub>-C<sub>7</sub>)-алкил, гетероциклилкарбонилокси-(C<sub>1</sub>-C<sub>7</sub>)-алкил, OR<sup>13</sup>, NR<sup>11</sup>R<sup>12</sup>, SR<sup>14</sup>, S(O)R<sup>14</sup>, SO<sub>2</sub>R<sup>14</sup>, R<sup>14</sup>S-(C<sub>1</sub>-C<sub>7</sub>)-алкил, R<sup>14</sup>(O)S-(C<sub>1</sub>-C<sub>7</sub>)-алкил, R<sup>14</sup>O<sub>2</sub>S-(C<sub>1</sub>-C<sub>7</sub>)-алкил, трис-[(C<sub>1</sub>-C<sub>7</sub>)-алкил]силил-(C<sub>1</sub>-C<sub>7</sub>)-алкил, бис-[(C<sub>1</sub>-C<sub>7</sub>)-алкил](арил)силил-(C<sub>1</sub>-C<sub>7</sub>)-алкил, [(C<sub>1</sub>-C<sub>7</sub>)-алкил]-бис-(арил)силил-(C<sub>1</sub>-C<sub>7</sub>)-алкил, трис-[(C<sub>1</sub>-C<sub>7</sub>)-алкил]силил, бис-гидроксидборил-(C<sub>1</sub>-C<sub>7</sub>)-алкил, бис-[(C<sub>1</sub>-C<sub>7</sub>)-алкокси]борил-(C<sub>1</sub>-C<sub>7</sub>)-алкил, тетраметил-1,3,2-диоксаборолан-2-ил, тетраметил-1,3,2-диоксаборолан-2-ил-(C<sub>1</sub>-C<sub>7</sub>)-алкил, нитро-(C<sub>1</sub>-C<sub>7</sub>)-алкил, C(O)OR<sup>13</sup>, C(O)R<sup>13</sup>, C(O)NR<sup>11</sup>R<sup>12</sup>, R<sup>13</sup>O(O)C-(C<sub>1</sub>-C<sub>7</sub>)-алкил, R<sup>11</sup>R<sup>12</sup>N(O)C-(C<sub>1</sub>-C<sub>7</sub>)-алкил, бис-(C<sub>1</sub>-C<sub>7</sub>)-алкокси-(C<sub>1</sub>-C<sub>7</sub>)-алкил,

R<sup>11</sup> и R<sup>12</sup> являются одинаковыми или различными и независимо друг от друга означают водород, (C<sub>1</sub>-C<sub>7</sub>)-алкил, (C<sub>2</sub>-C<sub>7</sub>)-алкенил, (C<sub>2</sub>-C<sub>7</sub>)-алкинил, (C<sub>1</sub>-C<sub>7</sub>)-цианоалкил, (C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub>)-галоалкил, (C<sub>2</sub>-C<sub>7</sub>)-галоалкенил, (C<sub>3</sub>-C<sub>7</sub>)-галоалкинил, (C<sub>3</sub>-C<sub>10</sub>)-циклоалкил, (C<sub>3</sub>-C<sub>10</sub>)-галоциклоалкил, (C<sub>4</sub>-C<sub>10</sub>)-циклоалкенил, (C<sub>4</sub>-C<sub>10</sub>)-галоциклоалкенил, (C<sub>1</sub>-C<sub>7</sub>)-алкокси-(C<sub>1</sub>-C<sub>7</sub>)-алкил, (C<sub>1</sub>-C<sub>7</sub>)-галоалкокси-(C<sub>1</sub>-C<sub>7</sub>)-алкил, (C<sub>1</sub>-C<sub>7</sub>)-алкилтио-(C<sub>1</sub>-C<sub>7</sub>)-алкил, (C<sub>1</sub>-C<sub>7</sub>)-галоалкилтио-(C<sub>1</sub>-C<sub>7</sub>)-алкил, (C<sub>1</sub>-C<sub>7</sub>)-алкокси-(C<sub>1</sub>-C<sub>7</sub>)-галоалкил, арил, арил-(C<sub>1</sub>-C<sub>7</sub>)-алкил, гетероарил, гетероарил-

(C<sub>1</sub>-C<sub>7</sub>)-алкил, (C<sub>3</sub>-C<sub>7</sub>)-циклоалкил-(C<sub>1</sub>-C<sub>7</sub>)-алкил, (C<sub>4</sub>-C<sub>10</sub>)-циклоалкенил-(C<sub>1</sub>-C<sub>7</sub>)-алкил, COR<sup>13</sup>, SO<sub>2</sub>R<sup>14</sup>, гетероциклил, (C<sub>1</sub>-C<sub>7</sub>)-алкоксикарбонил, бис-[(C<sub>1</sub>-C<sub>7</sub>)-алкил]аминокарбонил-(C<sub>1</sub>-C<sub>7</sub>)-алкил, (C<sub>1</sub>-C<sub>7</sub>)-алкил-аминокарбонил-(C<sub>1</sub>-C<sub>7</sub>)-алкил, арил-(C<sub>1</sub>-C<sub>7</sub>)-алкил-аминокарбонил-(C<sub>1</sub>-C<sub>7</sub>)-алкил, арил-(C<sub>1</sub>-C<sub>7</sub>)-алкоксикарбонил, гетероарил-(C<sub>1</sub>-C<sub>7</sub>)-алкоксикарбонил, (C<sub>2</sub>-C<sub>7</sub>)-алкенилоксикарбонил, (C<sub>2</sub>-C<sub>7</sub>)-алкинилоксикарбонил, гетероциклил-(C<sub>1</sub>-C<sub>7</sub>)-алкил, или

R<sup>11</sup> и R<sup>12</sup> образуют с атомом азота, к которому они присоединены, полностью насыщенное или частично насыщенное, при необходимости, прерываемое гетероатомами и, при необходимости, дополнительно замещенное 3-10-членное моноциклическое или бициклическое кольцо,

R<sup>13</sup> означает водород, (C<sub>1</sub>-C<sub>7</sub>)-алкил, (C<sub>2</sub>-C<sub>7</sub>)-алкенил, (C<sub>2</sub>-C<sub>7</sub>)-алкинил, (C<sub>1</sub>-C<sub>7</sub>)-цианоалкил, (C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub>)-галоалкил, (C<sub>2</sub>-C<sub>7</sub>)-галоалкенил, (C<sub>3</sub>-C<sub>7</sub>)-галоалкинил, (C<sub>3</sub>-C<sub>10</sub>)-циклоалкил, (C<sub>3</sub>-C<sub>10</sub>)-галоциклоалкил, (C<sub>4</sub>-C<sub>10</sub>)-циклоалкенил, (C<sub>4</sub>-C<sub>10</sub>)-галоциклоалкенил, (C<sub>1</sub>-C<sub>7</sub>)-алкокси-(C<sub>1</sub>-C<sub>7</sub>)-алкил, (C<sub>1</sub>-C<sub>7</sub>)-галоалкокси-(C<sub>1</sub>-C<sub>7</sub>)-алкил, (C<sub>1</sub>-C<sub>7</sub>)-алкокси-(C<sub>1</sub>-C<sub>7</sub>)-галоалкил, (C<sub>1</sub>-C<sub>7</sub>)-алкокси-(C<sub>1</sub>-C<sub>7</sub>)-алкокси-(C<sub>1</sub>-C<sub>7</sub>)-алкил, (C<sub>1</sub>-C<sub>7</sub>)-алкокси-(C<sub>1</sub>-C<sub>7</sub>)-алкокси-(C<sub>1</sub>-C<sub>7</sub>)-алкокси-(C<sub>1</sub>-C<sub>7</sub>)-алкил, (C<sub>1</sub>-C<sub>7</sub>)-алкокси-(C<sub>1</sub>-C<sub>7</sub>)-алкокси-(C<sub>1</sub>-C<sub>7</sub>)-алкокси-(C<sub>1</sub>-C<sub>7</sub>)-алкил, арил, арил-(C<sub>1</sub>-C<sub>7</sub>)-алкил, арил-(C<sub>1</sub>-C<sub>7</sub>)-алкокси-(C<sub>1</sub>-C<sub>7</sub>)-алкил, гетероарил, гетероарил-(C<sub>1</sub>-C<sub>7</sub>)-алкил, (C<sub>3</sub>-C<sub>7</sub>)-циклоалкил-(C<sub>1</sub>-C<sub>7</sub>)-алкил, (C<sub>4</sub>-C<sub>10</sub>)-циклоалкенил-(C<sub>1</sub>-C<sub>7</sub>)-алкил, бис-[(C<sub>1</sub>-C<sub>7</sub>)-алкил]аминокарбонил-(C<sub>1</sub>-C<sub>7</sub>)-алкил, (C<sub>1</sub>-C<sub>7</sub>)-алкил-аминокарбонил-(C<sub>1</sub>-C<sub>7</sub>)-алкил, арил-(C<sub>1</sub>-C<sub>7</sub>)-алкил-аминокарбонил-(C<sub>1</sub>-C<sub>7</sub>)-алкил, бис-[(C<sub>1</sub>-C<sub>7</sub>)-алкил]амино-(C<sub>2</sub>-C<sub>5</sub>)-алкил, (C<sub>1</sub>-C<sub>7</sub>)-алкил-амино-(C<sub>2</sub>-C<sub>5</sub>)-алкил, арил-(C<sub>1</sub>-C<sub>7</sub>)-алкил-амино-(C<sub>2</sub>-C<sub>5</sub>)-алкил, R<sup>14</sup>S-(C<sub>1</sub>-C<sub>7</sub>)-алкил, R<sup>14</sup>(O)S-(C<sub>1</sub>-C<sub>7</sub>)-алкил, R<sup>14</sup>O<sub>2</sub>S-(C<sub>1</sub>-C<sub>7</sub>)-алкил, гидроксикарбонил-(C<sub>1</sub>-C<sub>7</sub>)-алкил, гетероциклил, гетероциклил-(C<sub>1</sub>-C<sub>7</sub>)-алкил, трис-[(C<sub>1</sub>-C<sub>7</sub>)-алкил]силил-(C<sub>1</sub>-C<sub>7</sub>)-алкил, бис-[(C<sub>1</sub>-C<sub>7</sub>)-алкил](арил)силил-(C<sub>1</sub>-C<sub>7</sub>)-алкил, [(C<sub>1</sub>-C<sub>7</sub>)-алкил]-бис-(арил)силил-(C<sub>1</sub>-C<sub>7</sub>)-алкил, (C<sub>1</sub>-C<sub>7</sub>)-алкилкарбонилокси-(C<sub>1</sub>-C<sub>7</sub>)-алкил, (C<sub>3</sub>-C<sub>7</sub>)-циклоалкилкарбонилокси-(C<sub>1</sub>-C<sub>7</sub>)-алкил, арилкарбонилокси-(C<sub>1</sub>-C<sub>7</sub>)-алкил, гетероарилкарбонилокси-(C<sub>1</sub>-C<sub>7</sub>)-алкил, гетероциклил-

карбонилокси-(C<sub>1</sub>-C<sub>7</sub>)-алкил, арилокси-(C<sub>1</sub>-C<sub>7</sub>)-алкил, гетероарилокси-(C<sub>1</sub>-C<sub>7</sub>)-алкил, (C<sub>1</sub>-C<sub>7</sub>)-алкоксикарбонил,

R<sup>14</sup> означает водород, (C<sub>1</sub>-C<sub>7</sub>)-алкил, (C<sub>2</sub>-C<sub>7</sub>)-алкенил, (C<sub>2</sub>-C<sub>7</sub>)-алкинил, (C<sub>1</sub>-C<sub>7</sub>)-цианоалкил, (C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub>)-галоалкил, (C<sub>2</sub>-C<sub>7</sub>)-галоалкенил, (C<sub>3</sub>-C<sub>7</sub>)-галоалкинил, (C<sub>3</sub>-C<sub>10</sub>)-циклоалкил, (C<sub>3</sub>-C<sub>10</sub>)-галоциклоалкил, (C<sub>4</sub>-C<sub>10</sub>)-циклоалкенил, (C<sub>4</sub>-C<sub>10</sub>)-галоциклоалкенил, (C<sub>1</sub>-C<sub>7</sub>)-алкокси-(C<sub>1</sub>-C<sub>7</sub>)-алкил, (C<sub>1</sub>-C<sub>7</sub>)-алкокси-(C<sub>1</sub>-C<sub>7</sub>)-галоалкил, арил, арил-(C<sub>1</sub>-C<sub>7</sub>)-алкил, гетероарил, гетероарил-(C<sub>1</sub>-C<sub>7</sub>)-алкил, гетероциклил-(C<sub>1</sub>-C<sub>7</sub>)-алкил, (C<sub>3</sub>-C<sub>7</sub>)-циклоалкил-(C<sub>1</sub>-C<sub>7</sub>)-алкил, (C<sub>4</sub>-C<sub>10</sub>)-циклоалкенил-(C<sub>1</sub>-C<sub>7</sub>)-алкил, бис-[(C<sub>1</sub>-C<sub>7</sub>)-алкил]амино, (C<sub>1</sub>-C<sub>7</sub>)-алкил-амино, арил-(C<sub>1</sub>-C<sub>7</sub>)-амино, арил-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-алкил-амино, арил-[(C<sub>1</sub>-C<sub>7</sub>)-алкил]амино; (C<sub>3</sub>-C<sub>7</sub>)-циклоалкил-амино, (C<sub>3</sub>-C<sub>7</sub>)-циклоалкил-[(C<sub>1</sub>-C<sub>7</sub>)-алкил]амино; N-азетидинил, N-пирролидинил, N-пиперидинил, N-морфолинил,

R<sup>15</sup> и R<sup>16</sup> независимо друг от друга означают водород, (C<sub>1</sub>-C<sub>7</sub>)-алкил, (C<sub>2</sub>-C<sub>7</sub>)-алкенил, C(O)R<sup>13</sup>, C(O)OR<sup>13</sup>, C(O)NR<sup>11</sup>R<sup>12</sup>, SO<sub>2</sub>R<sup>14</sup>, или

R<sup>15</sup> и R<sup>16</sup> образуют с атомом азота, к которому они присоединены, при необходимости, дополнительно замещенную водородом, (C<sub>1</sub>-C<sub>7</sub>)-алкилом, арил-(C<sub>1</sub>-C<sub>7</sub>)-алкилом, (C<sub>3</sub>-C<sub>7</sub>)-циклоалкилом, арилом, гетероарилом, гетероциклилом, (C<sub>1</sub>-C<sub>7</sub>)-алкоксикарбонил-(C<sub>1</sub>-C<sub>7</sub>)-алкилом, арил-(C<sub>1</sub>-C<sub>7</sub>)-алкоксикарбонил-(C<sub>1</sub>-C<sub>7</sub>)-алкилом иминогруппу,

и

X и Y независимо друг от друга означают O (кислород) или S (серу).

Особенно предпочтительным предметом изобретения являются соединения общей формулы (I), где

R<sup>1</sup> означает водород,

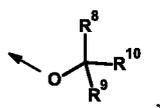
R<sup>2</sup> означает водород, фтор, хлор, бром, трифторметил, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-алкокси,

R<sup>3</sup> означает водород, галоген, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-алкокси,

R<sup>4</sup> означает галоген, циано, NO<sub>2</sub>, C(O)NH<sub>2</sub>, C(S)NH<sub>2</sub>, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-галоалкил, (C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)-алкинил,

R<sup>5</sup>, R<sup>6</sup> и R<sup>7</sup> независимо друг от друга означают водород, галоген, циано, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-алкил, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-галоалкил, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-алкокси, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-галоалкокси,

- G означает неразветвленный или разветвленный (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-алкилен,  
 Q означает гидроксильный или остаток следующей формулы



- R<sup>8</sup> означает водород, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-алкил, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-галоалкил, арил, арил-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-алкил, гетероарил, (C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)-алкинил, (C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)-алкенил, C(O)R<sup>13</sup>, C(O)OR<sup>13</sup>, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-алкокси-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-алкил,
- R<sup>9</sup> означает водород или (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-алкил,
- R<sup>10</sup> означает водород, галоген, циано, нитро, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-алкил, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-галоалкил, (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)-циклоалкил, (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)-циклоалкил-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-алкил, (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)-галоциклоалкил, (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)-галоциклоалкил-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-алкил, (C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)-алкенил, (C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)-алкинил, арил, арил-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-алкил, гетероарил, гетероарил-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-алкил, гетероциклил, гетероциклил-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-алкил, R<sup>11</sup>R<sup>12</sup>N-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-алкил, R<sup>13</sup>O-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-алкил, циано-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-алкил, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-алкилкарбонилокси-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-алкил, (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)-циклоалкилкарбонилокси-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-алкил, арилкарбонилокси-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-алкил, гетероарилкарбонилокси-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-алкил, гетероциклилкарбонилокси-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-алкил, OR<sup>13</sup>, NR<sup>11</sup>R<sup>12</sup>, SR<sup>14</sup>, S(O)R<sup>14</sup>, SO<sub>2</sub>R<sup>14</sup>, R<sup>14</sup>S-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-алкил, R<sup>14</sup>(O)S-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-алкил, R<sup>14</sup>O<sub>2</sub>S-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-алкил, трис-[(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-алкил]силил-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-алкил, бис-[(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-алкил](арил)силил-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-алкил, [(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-алкил]-бис-(арил)силил-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-алкил, трис-[(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-алкил]силил, бис-гидроксиборил-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-алкил, бис-[(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-алкокси]борил-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-алкил, тетраметил-1,3,2-диоксаборолан-2-ил, тетраметил-1,3,2-диоксаборолан-2-ил-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-алкил, нитро-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-алкил, C(O)OR<sup>13</sup>, C(O)R<sup>13</sup>, C(O)NR<sup>11</sup>R<sup>12</sup>, R<sup>13</sup>O(O)C-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-алкил, R<sup>11</sup>R<sup>12</sup>N(O)C-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-алкил, бис-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-алкокси-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-алкил, или
- R<sup>8</sup> и R<sup>10</sup> образуют с атомом углерода, к которому они присоединены, полностью насыщенное или частично насыщенное, при необходимости, прерываемое гетероатомами и, при необходимости, дополнительно замещенное 3-10-членное моноциклическое или бициклическое кольцо,

$R^{11}$  и  $R^{12}$  являются одинаковыми или различными и независимо друг от друга означают водород, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-алкил, (C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)-алкенил, (C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)-алкинил, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-цианоалкил, (C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub>)-галоалкил, (C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)-галоалкенил, (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)-галоалкинил, (C<sub>3</sub>-C<sub>10</sub>)-циклоалкил, (C<sub>3</sub>-C<sub>10</sub>)-галоциклоалкил, (C<sub>4</sub>-C<sub>10</sub>)-циклоалкенил, (C<sub>4</sub>-C<sub>10</sub>)-галоциклоалкенил, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-алкокси-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-алкил, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-галоалкокси-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-алкил, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-алкилтио-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-алкил, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-галоалкилтио-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-алкил, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-алкокси-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-галоалкил, арил, арил-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-алкил, гетероарил, гетероарил-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-алкил, (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)-циклоалкил-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-алкил, (C<sub>4</sub>-C<sub>10</sub>)-циклоалкенил-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-алкил, COR<sup>13</sup>, SO<sub>2</sub>R<sup>14</sup>, гетероциклил, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-алкоксикарбонил, бис-[(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-алкил]аминокарбонил-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-алкил, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-алкил-аминокарбонил-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-алкил, арил-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-алкил-аминокарбонил-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-алкил, арил-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-алкоксикарбонил, гетероарил-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-алкоксикарбонил, (C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)-алкенилоксикарбонил, (C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)-алкинилоксикарбонил, гетероциклил-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-алкил, или

$R^{11}$  и  $R^{12}$  образуют с атомом азота, к которому они присоединены, полностью насыщенное или частично насыщенное, при необходимости, прерываемое гетероатомами и, при необходимости, дополнительно замещенное 3-10-членное моноциклическое или бициклическое кольцо,

$R^{13}$  означает водород, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-алкил, (C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)-алкенил, (C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)-алкинил, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-цианоалкил, (C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub>)-галоалкил, (C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)-галоалкенил, (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)-галоалкинил, (C<sub>3</sub>-C<sub>10</sub>)-циклоалкил, (C<sub>3</sub>-C<sub>10</sub>)-галоциклоалкил, (C<sub>4</sub>-C<sub>10</sub>)-циклоалкенил, (C<sub>4</sub>-C<sub>10</sub>)-галоциклоалкенил, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-алкокси-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-алкил, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-галоалкокси-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-алкил, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-алкокси-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-галоалкил, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-алкокси-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-алкокси-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-алкил, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-алкокси-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-алкокси-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-алкокси-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-алкил, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-алкокси-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-алкокси-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-алкокси-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-алкокси-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-алкил, арил, арил-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-алкил, арил-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-алкокси-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-алкил, гетероарил, гетероарил-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-алкил, (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)-циклоалкил-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-алкил, (C<sub>4</sub>-C<sub>10</sub>)-циклоалкенил-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-алкил, бис-[(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-алкил]аминокарбонил-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-алкил, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-алкил-аминокарбонил-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-алкил, арил-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-алкил-аминокарбонил-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-алкил, бис-

[(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-алкил]амино-(C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>)-алкил, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-алкил-амино-(C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>)-алкил, арил-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-алкил-амино-(C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>)-алкил, R<sup>14</sup>S-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-алкил, R<sup>14</sup>(O)S-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-алкил, R<sup>14</sup>O<sub>2</sub>S-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-алкил, гидроксикарбонил-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-алкил, гетероцикл, гетероцикл-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-алкил, трис-[(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-алкил]сил-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-алкил, бис-[(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-алкил](арил)сил-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-алкил, [(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-алкил]-бис-(арил)сил-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-алкил, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-алкилкарбонилокси-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-алкил, (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)-циклоалкилкарбонилокси-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-алкил, арилкарбонилокси-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-алкил, гетероарилкарбонилокси-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-алкил, гетероциклкарбонилокси-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-алкил, арилокси-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-алкил, гетероарилокси-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-алкил, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-алкоксикарбонил,

R<sup>14</sup> означает водород, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-алкил, (C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)-алкенил, (C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)-алкинил, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-цианоалкил, (C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub>)-галоалкил, (C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)-галоалкенил, (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)-галоалкинил, (C<sub>3</sub>-C<sub>10</sub>)-циклоалкил, (C<sub>3</sub>-C<sub>10</sub>)-галоциклоалкил, (C<sub>4</sub>-C<sub>10</sub>)-циклоалкенил, (C<sub>4</sub>-C<sub>10</sub>)-галоциклоалкенил, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-алкокси-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-алкил, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-алкокси-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-галоалкил, арил, арил-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-алкил, гетероарил, гетероарил-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-алкил, гетероцикл-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-алкил, (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)-циклоалкил-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-алкил, (C<sub>4</sub>-C<sub>10</sub>)-циклоалкенил-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-алкил, бис-[(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-алкил]амино, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-алкил-амино, арил-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-амино, арил-(C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>)-алкил-амино, арил-[(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-алкил]амино; (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)-циклоалкил-амино, (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)-циклоалкил-[(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-алкил]амино; N-азетидинил, N-пирролидинил, N-пиперидинил, N-морфолинил,

R<sup>15</sup> и R<sup>16</sup> независимо друг от друга означают водород, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-алкил, (C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)-алкенил, C(O)R<sup>13</sup>, C(O)OR<sup>13</sup>, C(O)NR<sup>11</sup>R<sup>12</sup>, SO<sub>2</sub>R<sup>14</sup>, или

R<sup>15</sup> и R<sup>16</sup> образуют с атомом азота, к которому они присоединены, при необходимости, дополнительно замещенную водородом, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-алкил, арил-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-алкил, (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)-циклоалкил, арил, гетероарил, гетероцикл, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-алкоксикарбонил-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-алкил, арил-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-алкоксикарбонил-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-алкил иминогруппу,

и

X и Y независимо друг от друга означают O (кислород) или S (серу).

Весьма предпочтительным предметом изобретения являются соединения общей формулы (I), где

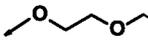
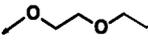
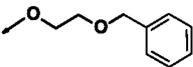
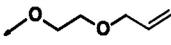
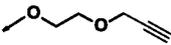
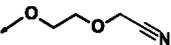
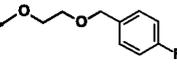
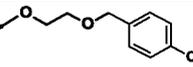
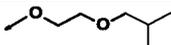
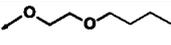
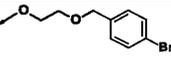
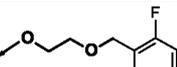
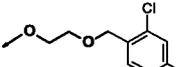
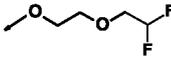
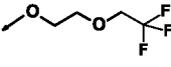
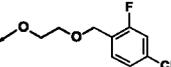
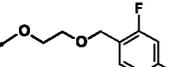
- $R^1$  означает водород,
- $R^2$  означает водород, фтор, хлор, бром, трифторметил, метокси, этокси, проп-1-илокси, бут-1-илокси,
- $R^3$  означает водород, фтор, хлор, бром, метокси, этокси, проп-1-илокси, проп-2-илокси, бут-1-илокси, бут-2-илокси, 2-метилпроп-1-илокси, 1,1-диметилэт-1-илокси,
- $R^4$  означает фтор, хлор, бром, циано,  $NO_2$ ,  $C(O)NH_2$ ,  $C(S)NH_2$ , трифторметил, дифторметил, пентафторэтил, этинил, пропин-1-ил, 1-бутин-1-ил, пентин-1-ил, гексин-1-ил,
- $R^5$ ,  $R^6$  и  $R^7$  независимо друг от друга означают водород, фтор, хлор, бром, йод, циано, метил, этил, проп-1-ил, 1-метилэтил, бут-1-ил, 1-метилпропил, 2-метилпропил, 1,1-диметилэтил, н-пентил, 1-метилбутил, 2-метилбутил, 3-метилбутил, 1,1-диметилпропил, 1,2-диметилпропил, 2,2-диметилпропил, 1-этилпропил, н-гексил, 1-метилпентил, 2-метилпентил, 3-метилпентил, 4-метилпентил, 1,1-диметилбутил, 1,2-диметилбутил, 1,3-ди-метилбутил, 2,2-диметилбутил, 2,3-диметилбутил, 3,3-диметилбутил, 1-этилбутил, 2-этилбутил, 1,1,2-триметилпропил, 1,2,2-триметилпропил, 1-этил-1-метилпропил, 1-этил-2-метилпропил, трифторметил, дифторметил, пентафторэтил, 2,2-дифторэтил, 2,2,2-трифторэтил, метокси, этокси, проп-1-илокси, проп-2-илокси, бут-1-илокси, бут-2-илокси, 2-метилпроп-1-илокси, 1,1-диметилэт-1-илокси, дифторметокси, трифторметокси, пентафторэтокси, 2,2-дифторэтокси, 2,2,2-трифторэтокси,
- G означает метилен, (метил)метилен, (этил)метилен, (проп-1-ил)метилен, (проп-2-ил)метилен, (бут-1-ил)метилен, (бут-2-ил)метилен, (пент-1-ил)метилен, (пент-2-ил)метилен, (пент-3-ил)метилен, (диметил)метилен, (диэтил)метилен, этилен, н-пропилен, (1-метил)этил-1-ен, (2-метил)этил-1-ен, н-бутилен, 1-метилпропил-1-ен, 2-метилпропил-1-ен, 3-метилпропил-1-ен, 1,1-диметилэтил-1-ен, 2,2-диметилэтил-1-ен, 1-этиэтил-1-ен, 2-этиэтил-1-ен, 1-(проп-1-

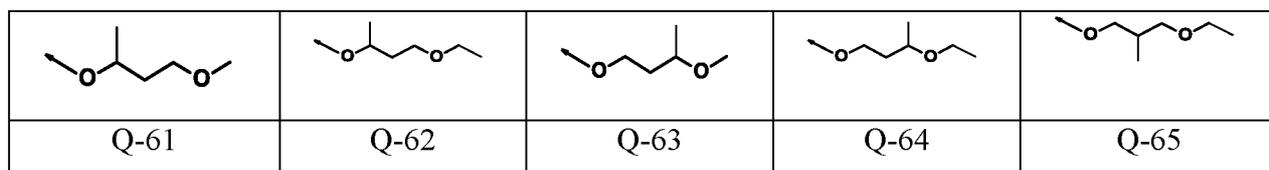
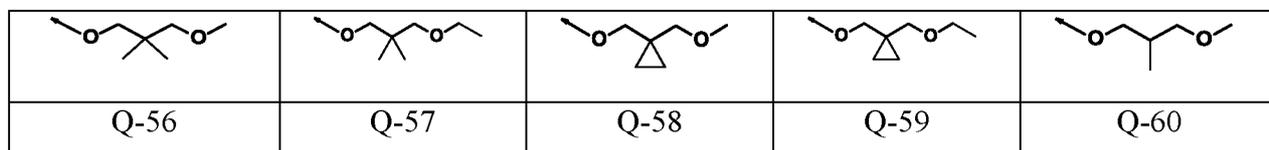
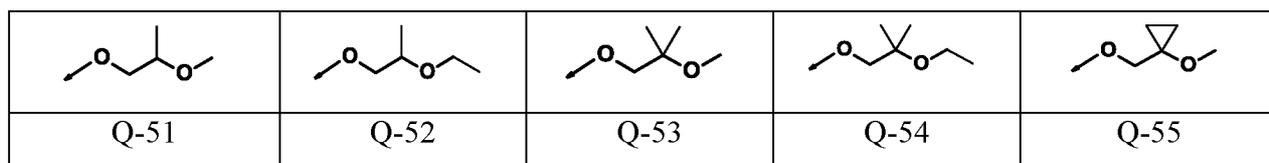
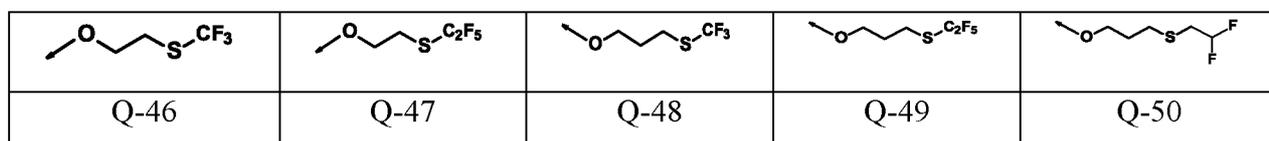
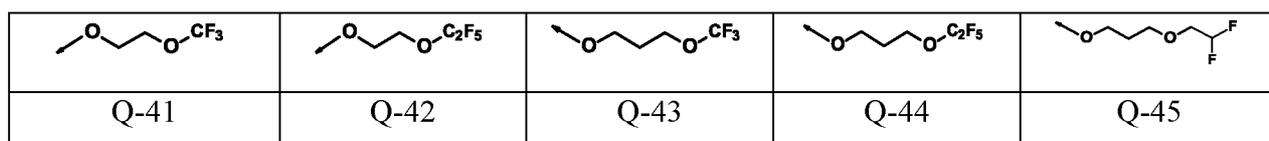
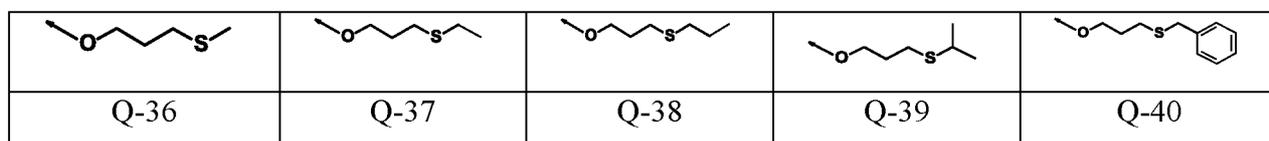
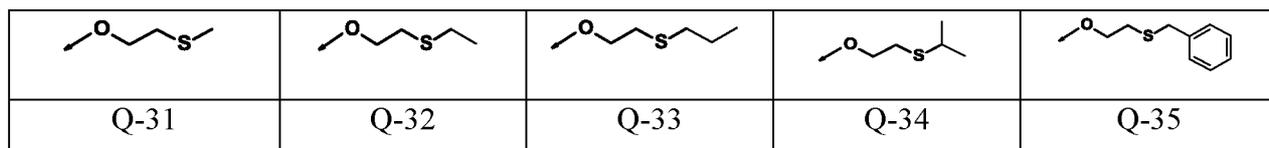
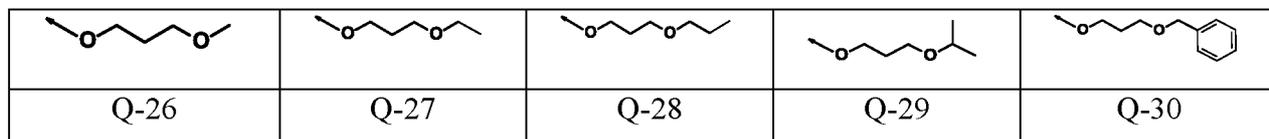
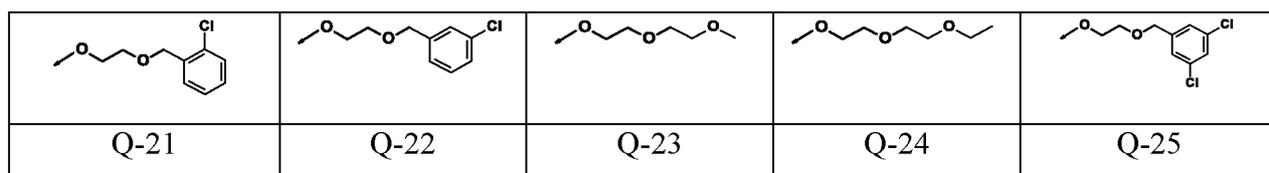
ил)этил-1-ен, 2-(проп-1-ил)этил-1-ен, 1-(проп-2-ил)этил-1-ен, 2-(проп-2-ил)этил-1-ен, 1,1,2-триметилэтил-1-ен, 1,2,2-триметилэтил-1-ен, 1,1,2,2-тетраметилэтил-1-ен, н-пентилен, 1-метилбутил-1-ен, 2-метилбутил-1-ен, 3-метилбутил-1-ен, 4-метилбутил-1-ен, 1,1-диметилпропил-1-ен, 2,2-диметилпропил-1-ен, 3,3-диметилпропил-1-ен, 1,2-диметилпропил-1-ен, 1,3-диметилпропил-1-ен, 1-этилпропил-1-ен, н-гексилен, 1-метилпентил-1-ен, 2-метилпентил-1-ен, 3-метилпентил-1-ен, 4-метилпентил-1-ен, 1,1-диметилбутил-1-ен, 1,2-диметилбутил-1-ен, 1,3-ди-метилбутил-1-ен, 2,2-диметилбутил-1-ен, 2,3-диметилбутил-1-ен, 3,3-диметилбутил-1-ен, 1-этилбутил-1-ен, 2-этилбутил-1-ен, 1,1,2-триметилпропил-1-ен, 1,2,2-триметилпропил-1-ен, 1-этил-1-метилпропил-1-ен, 1-этил-2-метилпропил-1-ен,

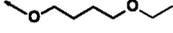
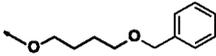
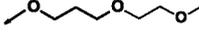
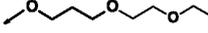
R<sup>15</sup> и R<sup>16</sup> независимо друг от друга означают водород, метил, этил, метилкарбонил, этилкарбонил, метоксикарбонил, этоксикарбонил, трет-бутилоксикарбонил,

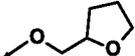
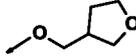
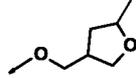
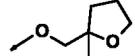
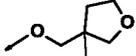
X и Y независимо друг от друга означают O (кислород) или S (серу),

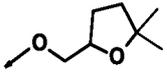
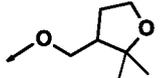
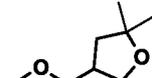
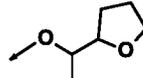
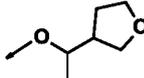
и Q означает одну из групп Q-1 - Q-486, конкретно указанных ниже:

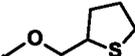
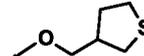
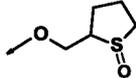
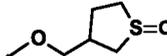
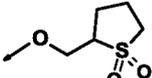
				
Q-1	Q-2	Q-3	Q-4	Q-5
				
Q-6	Q-7	Q-8	Q-9	Q-10
				
Q-11	Q-12	Q-13	Q-14	Q-15
				
Q-16	Q-17	Q-18	Q-19	Q-20

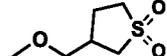
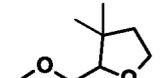
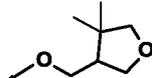
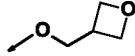
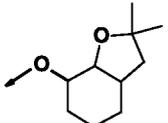


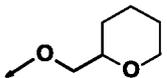
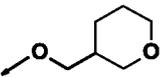
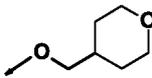
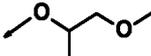
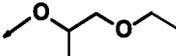
				
Q-66	Q-67	Q-68	Q-69	Q-70

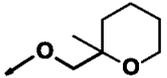
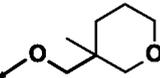
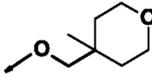
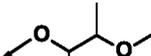
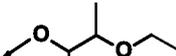
				
Q-71	Q-72	Q-73	Q-74	Q-75

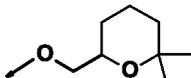
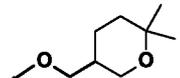
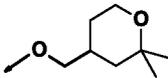
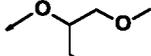
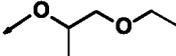
				
Q-76	Q-77	Q-78	Q-79	Q-80

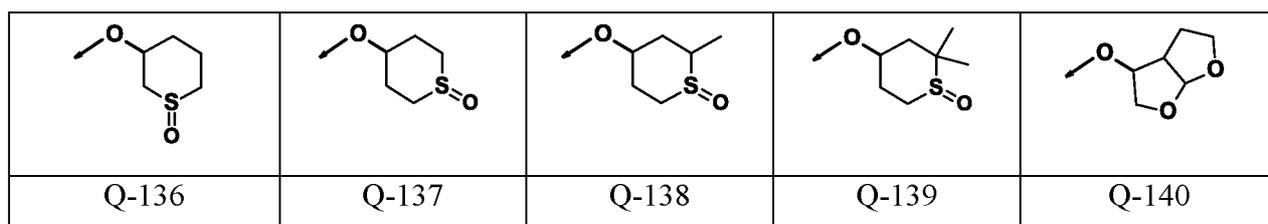
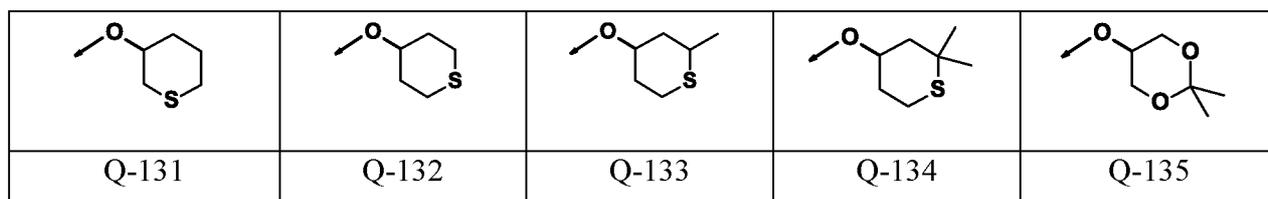
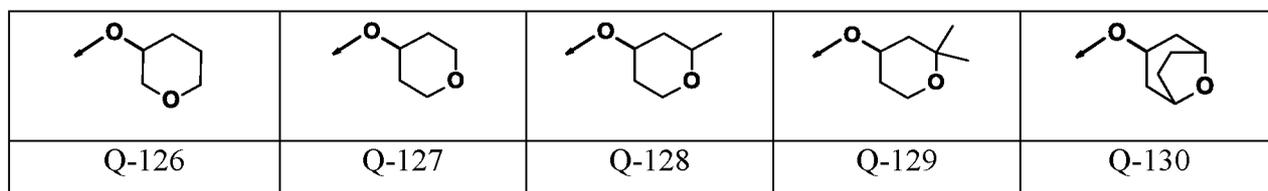
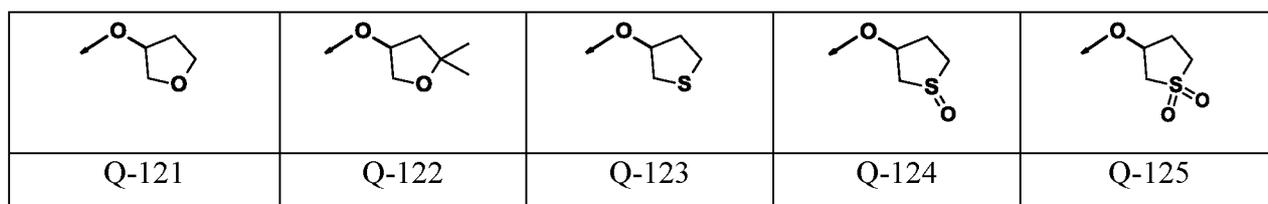
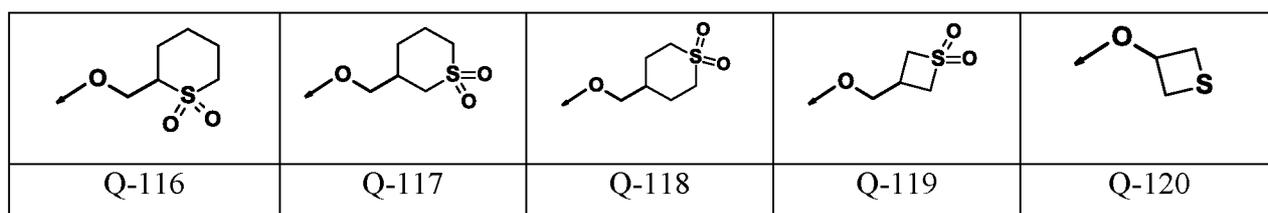
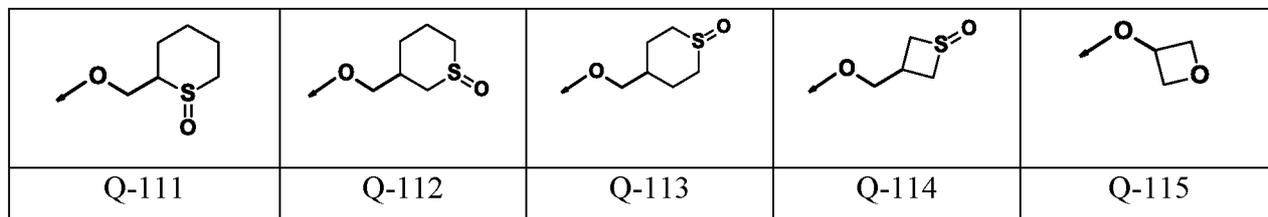
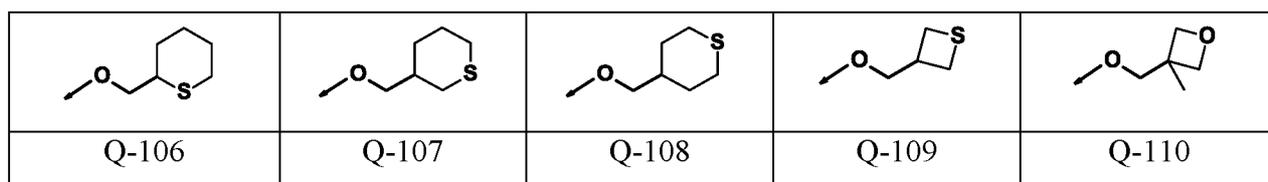
				
Q-81	Q-82	Q-83	Q-84	Q-85

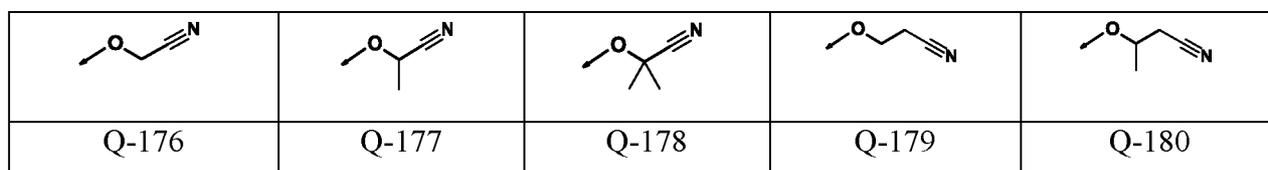
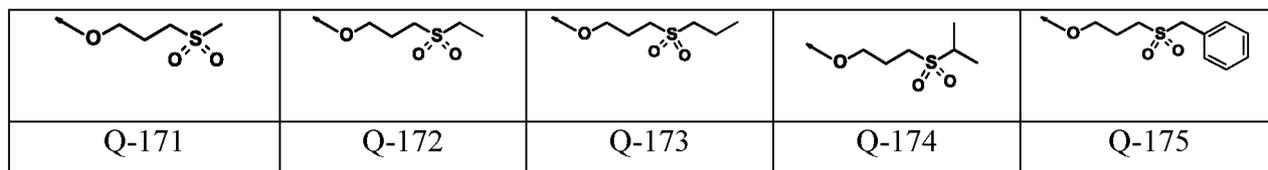
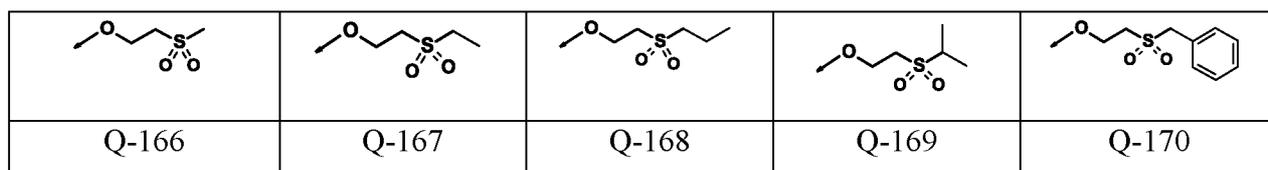
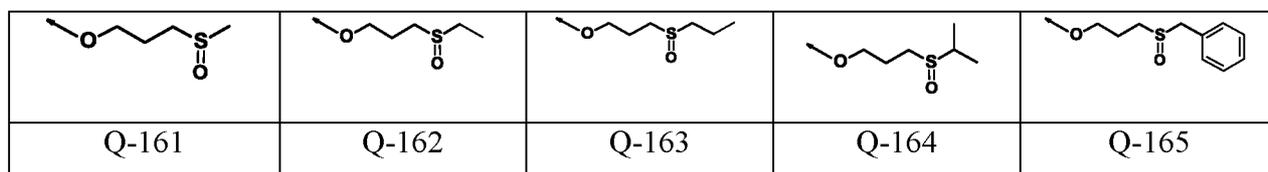
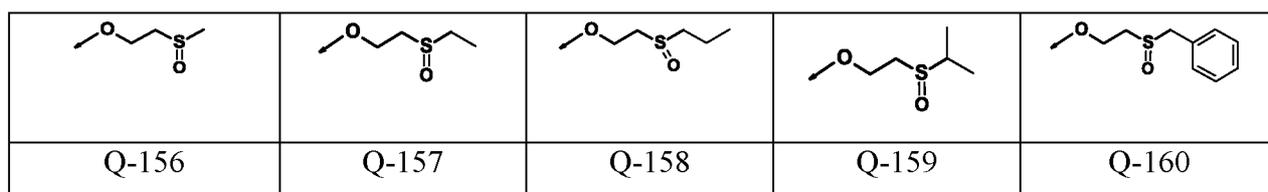
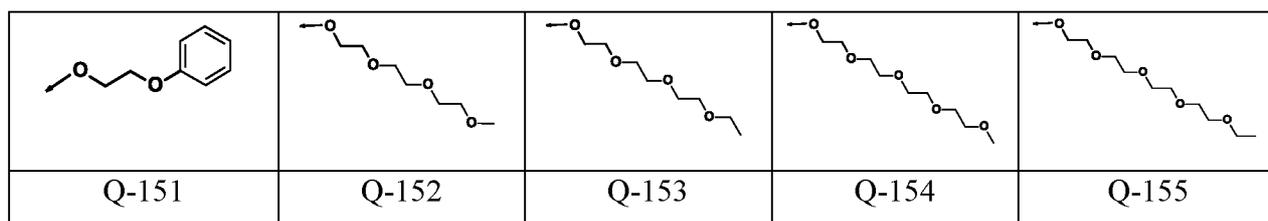
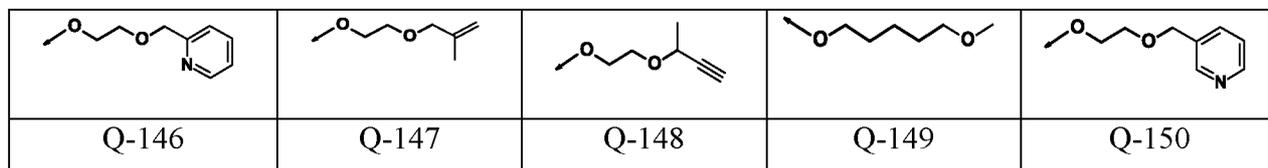
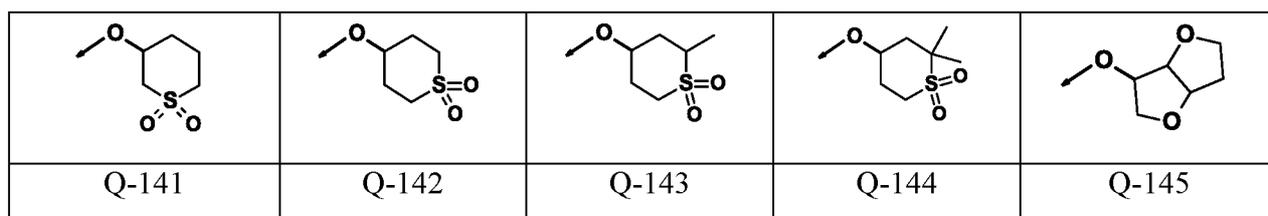
				
Q-86	Q-87	Q-88	Q-89	Q-90

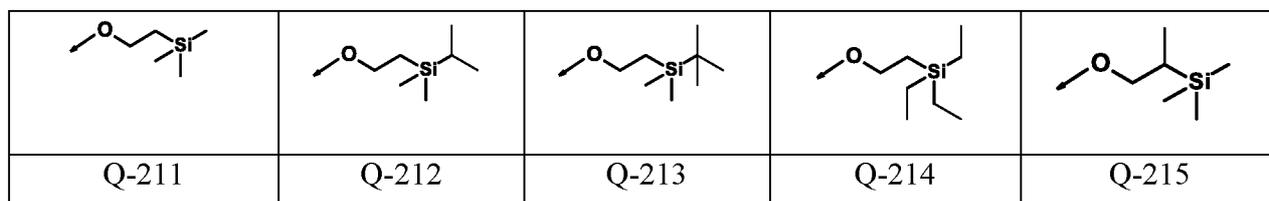
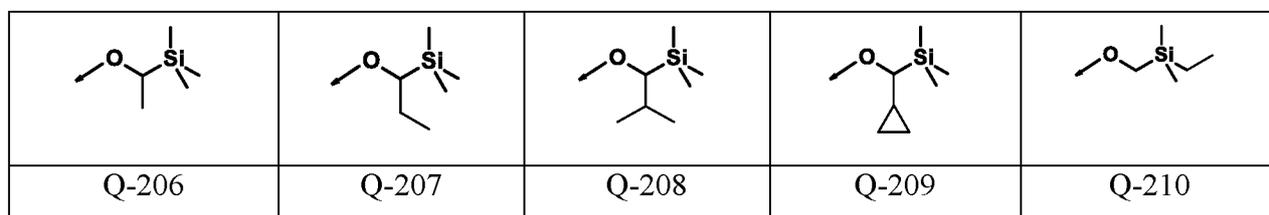
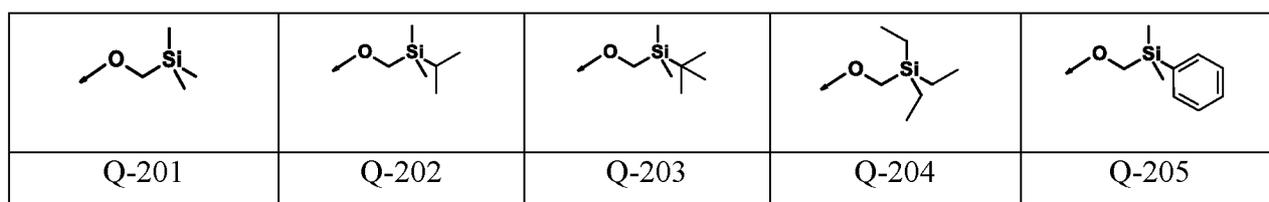
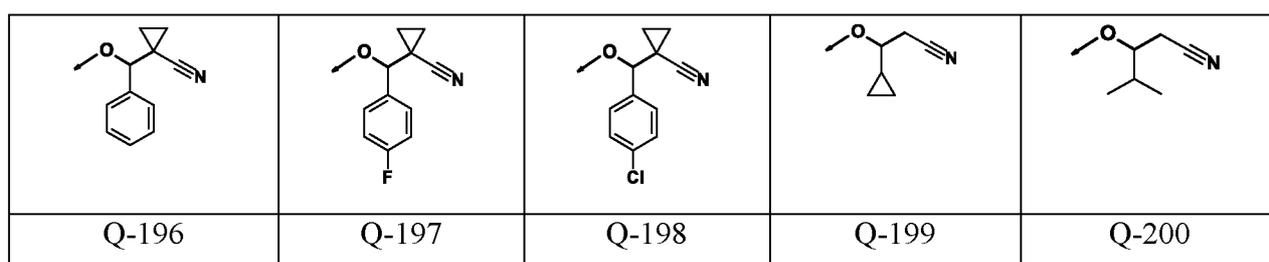
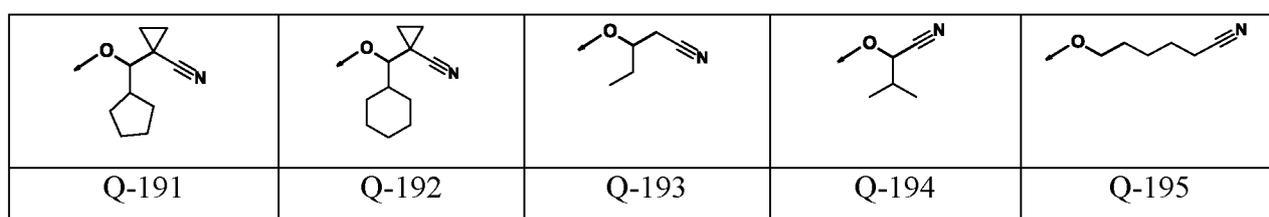
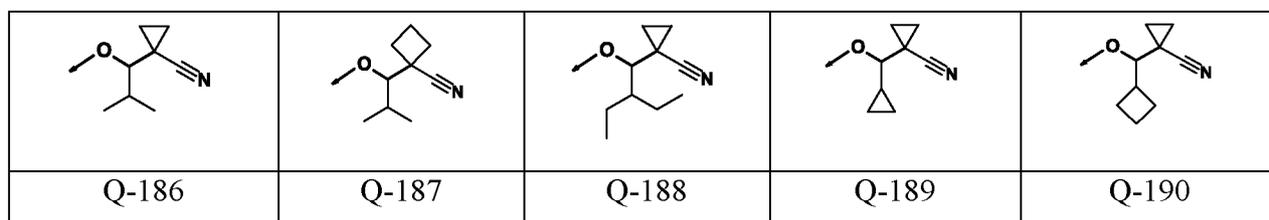
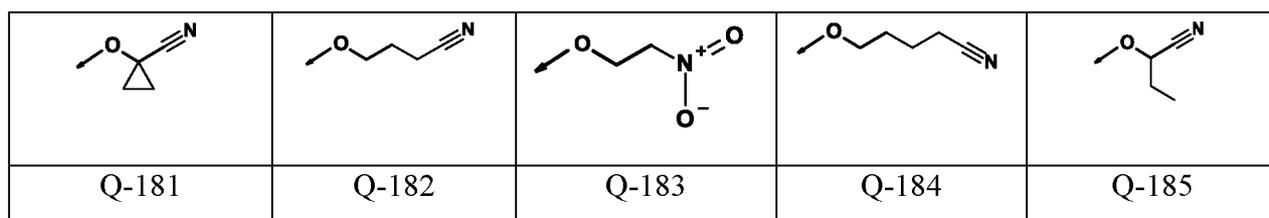
				
Q-91	Q-92	Q-93	Q-94	Q-95

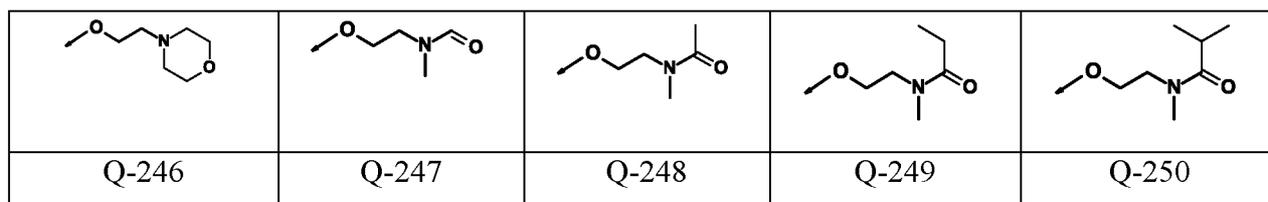
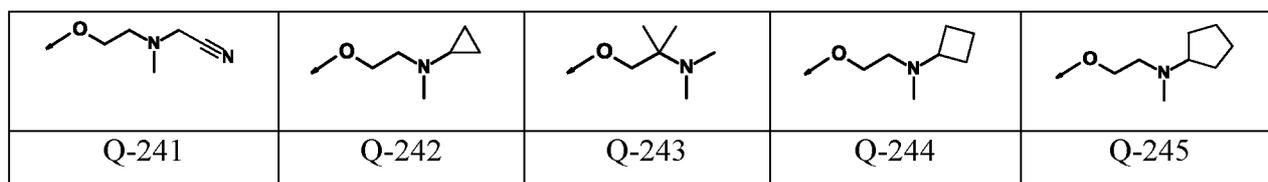
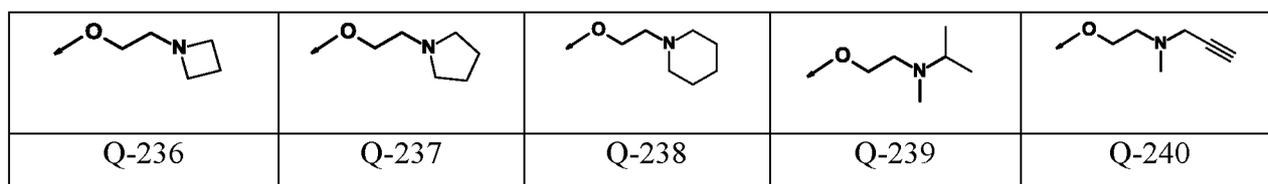
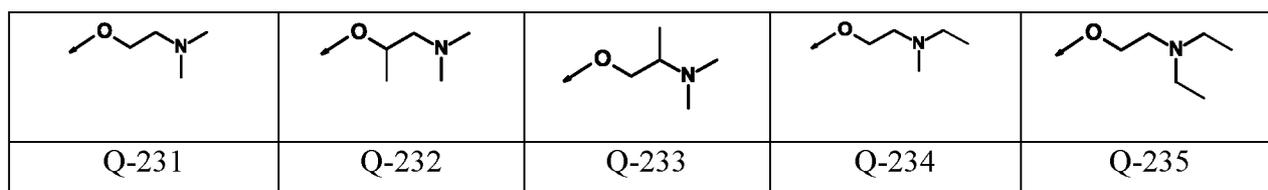
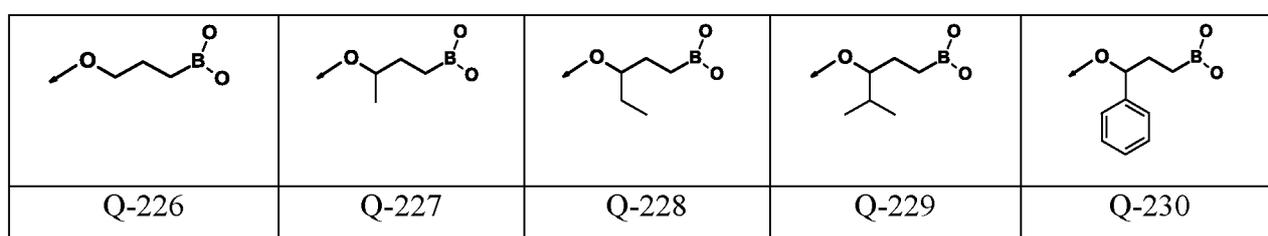
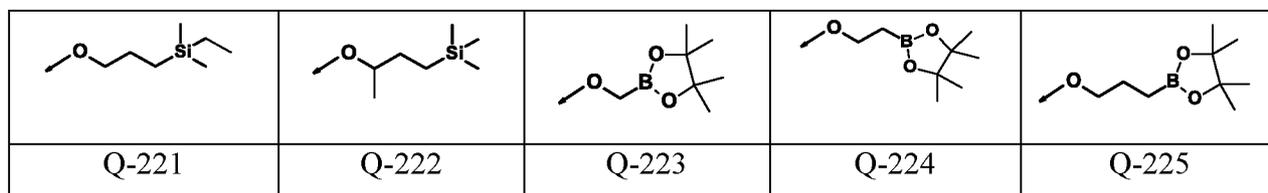
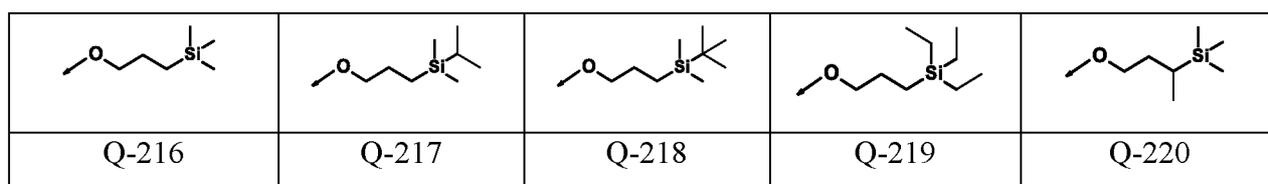
				
Q-96	Q-97	Q-98	Q-99	Q-100

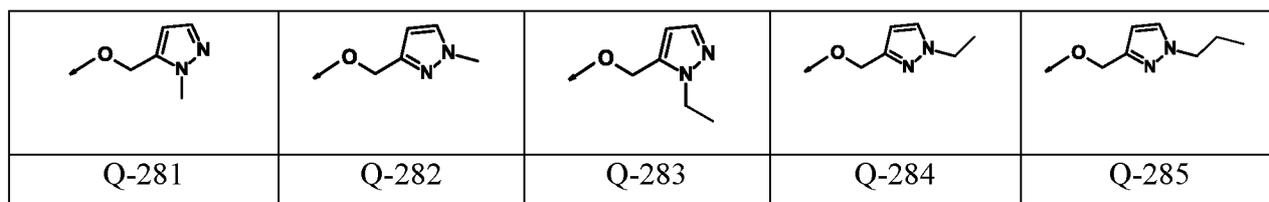
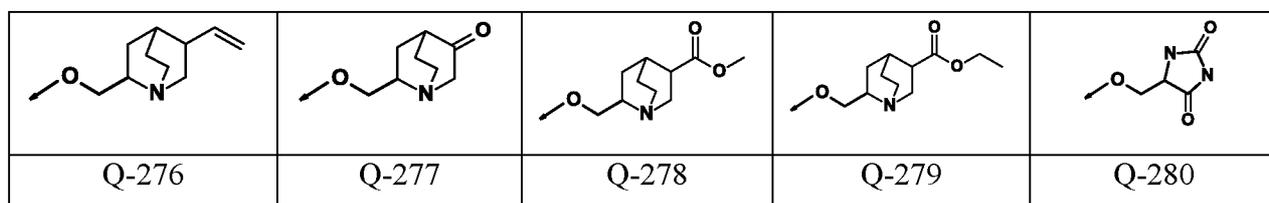
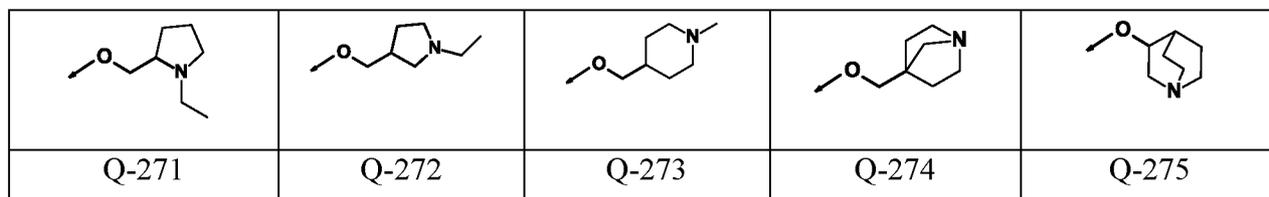
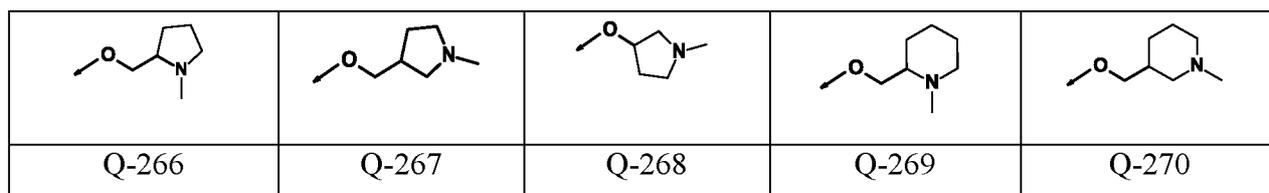
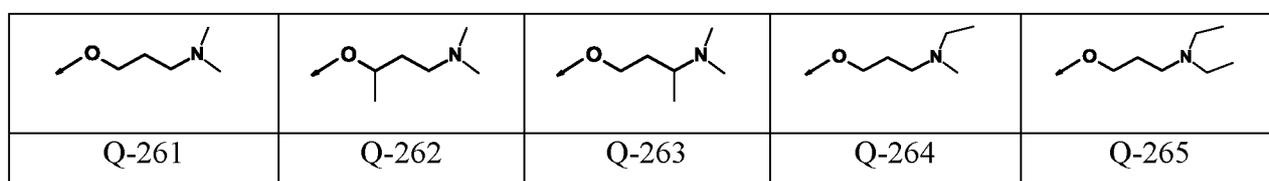
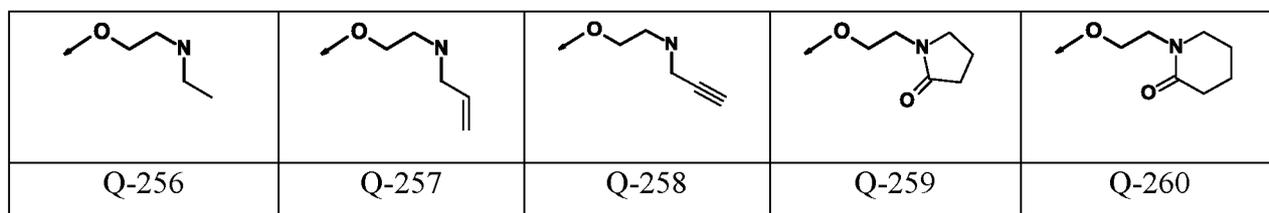
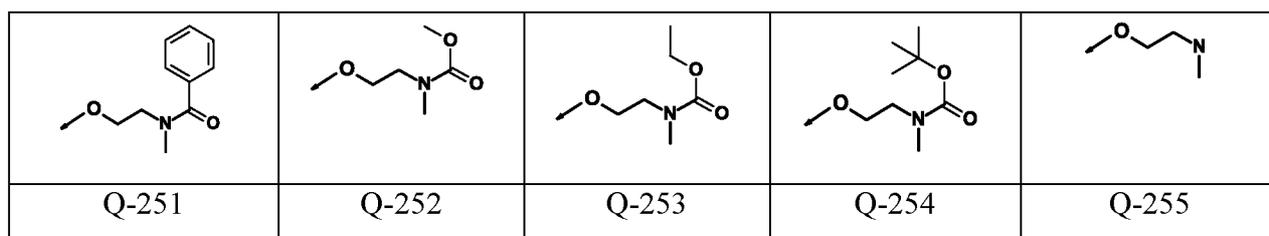
				
Q-101	Q-102	Q-103	Q-104	Q-105

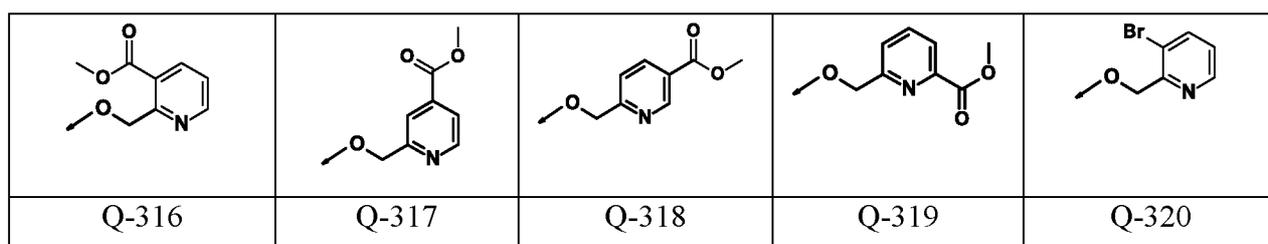
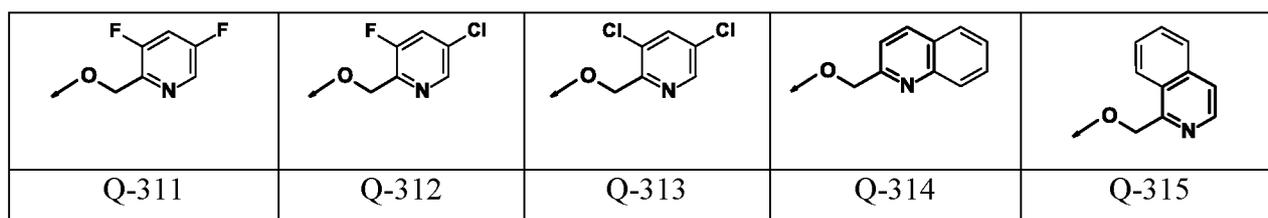
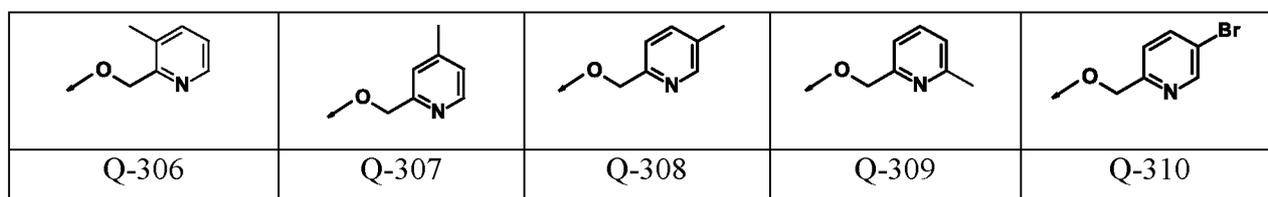
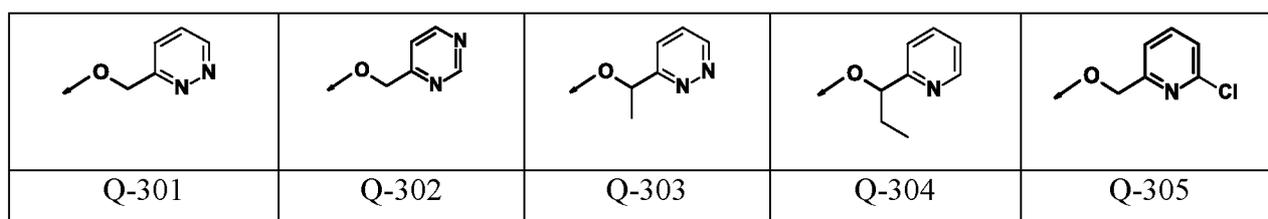
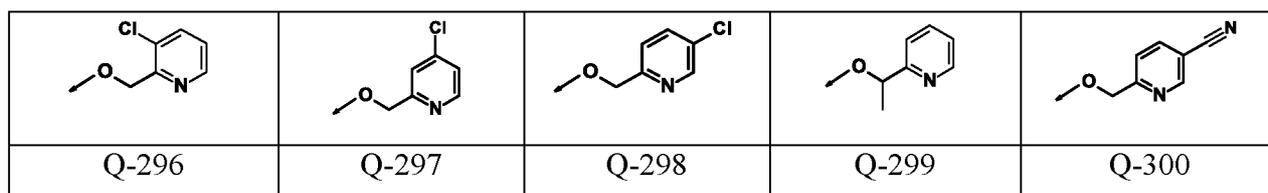
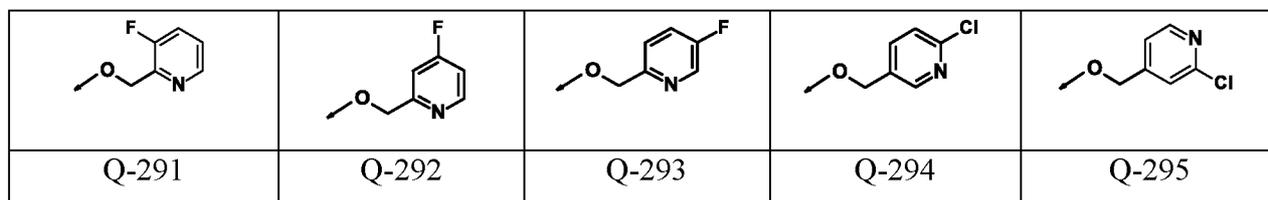
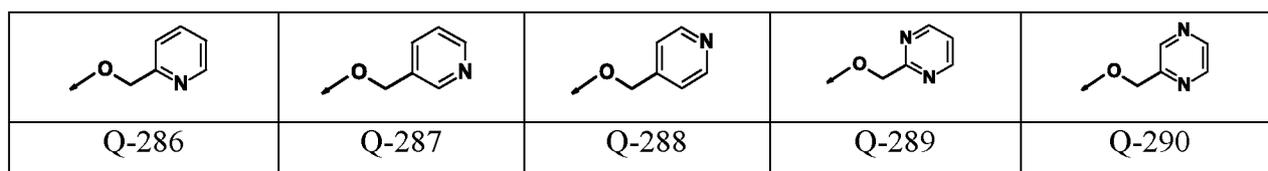


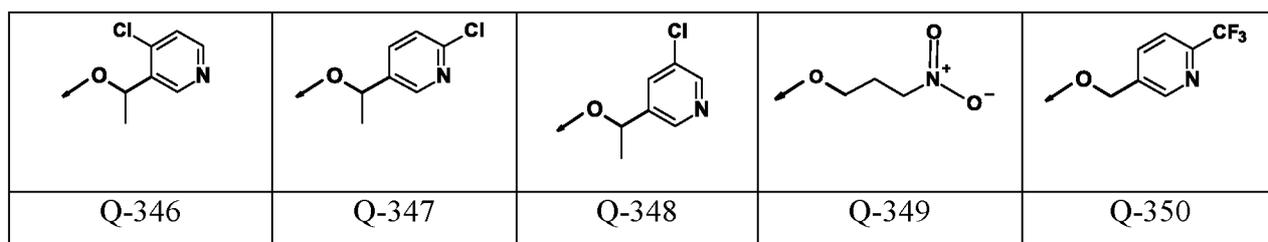
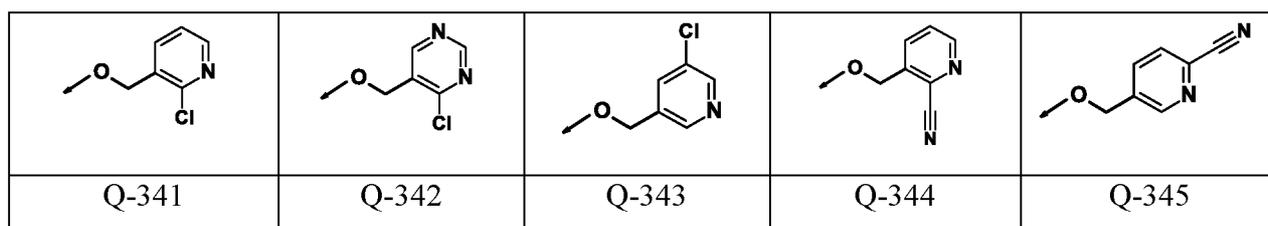
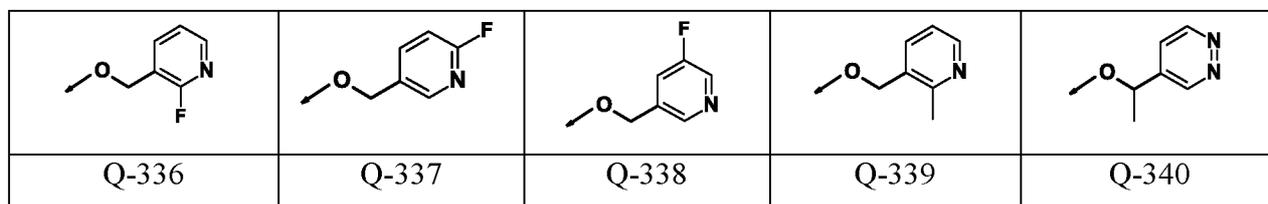
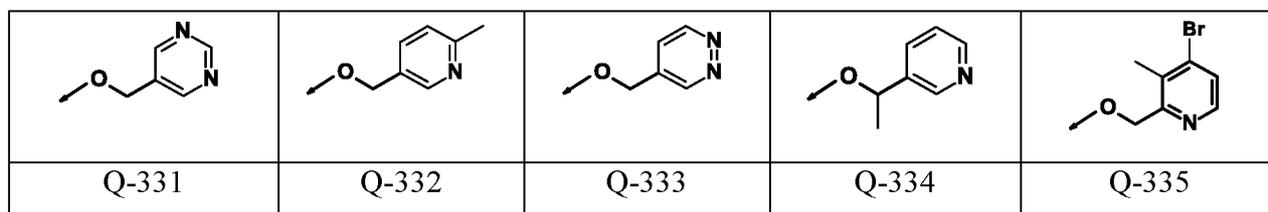
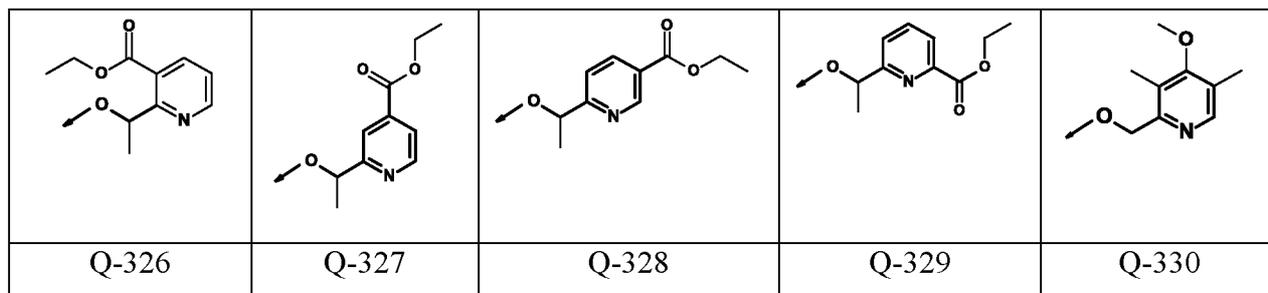
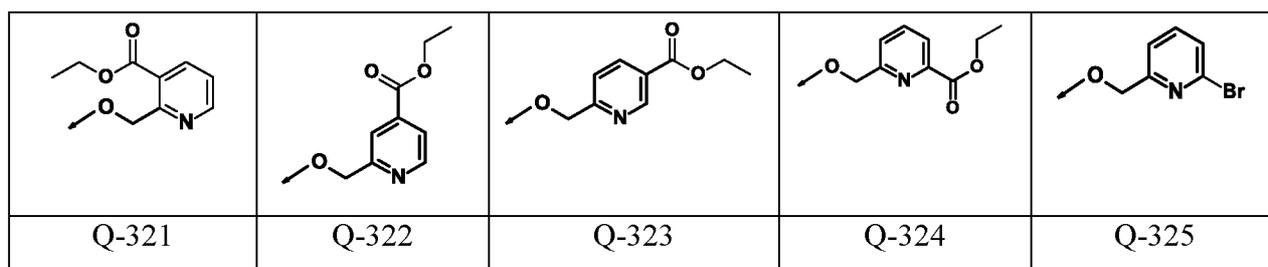


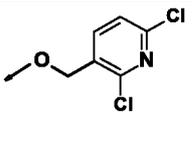
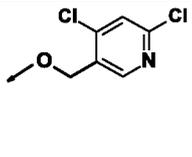
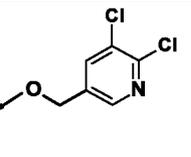
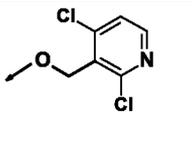
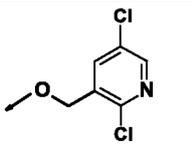


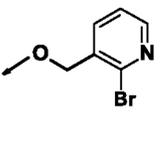
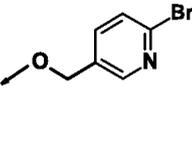
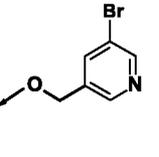
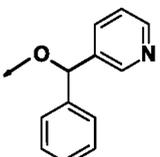
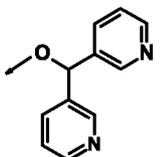


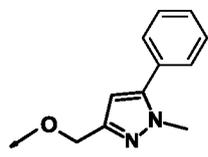
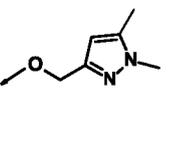
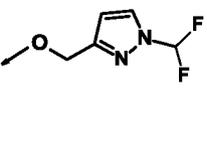
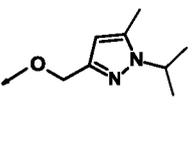
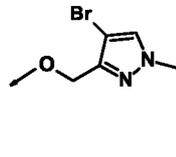


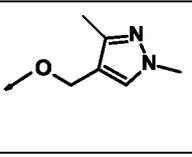
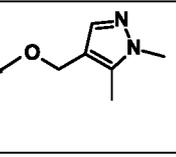
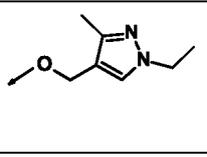
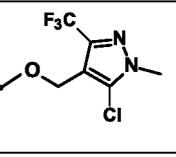
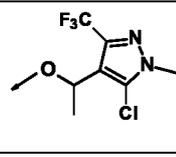


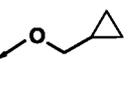
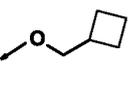
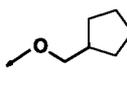
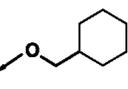
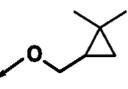


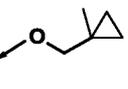
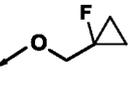
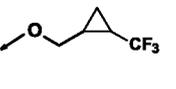
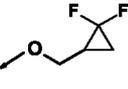
				
Q-351	Q-352	Q-353	Q-354	Q-355

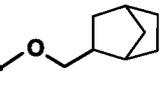
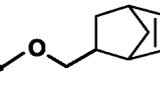
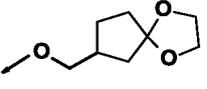
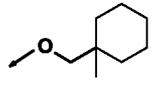
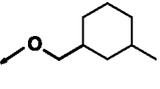
				
Q-356	Q-357	Q-358	Q-359	Q-360

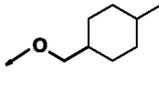
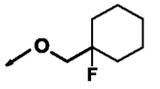
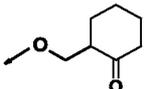
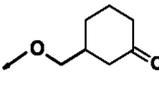
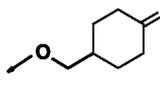
				
Q-361	Q-362	Q-363	Q-364	Q-365

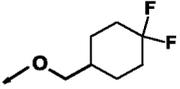
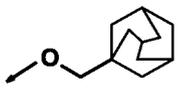
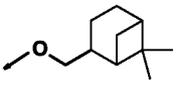
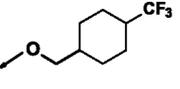
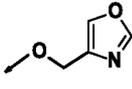
				
Q-366	Q-367	Q-368	Q-369	Q-370

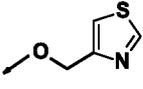
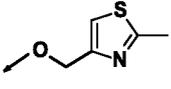
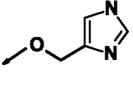
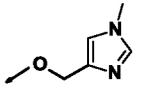
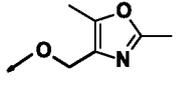
				
Q-371	Q-372	Q-373	Q-374	Q-375

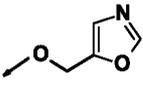
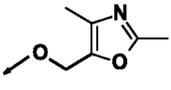
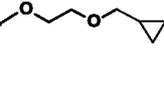
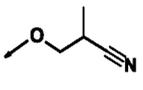
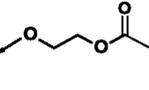
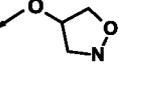
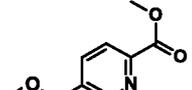
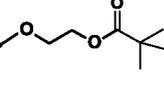
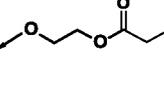
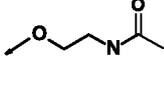
				
Q-376	Q-377	Q-378	Q-379	Q-380

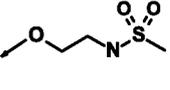
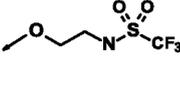
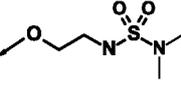
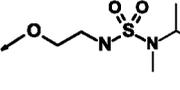
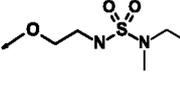
				
Q-381	Q-382	Q-383	Q-384	Q-385

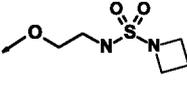
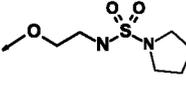
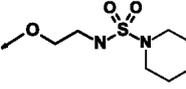
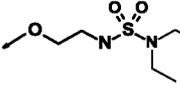
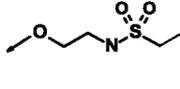
				
Q-386	Q-387	Q-388	Q-389	Q-390

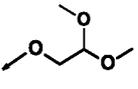
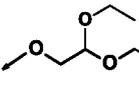
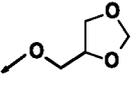
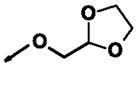
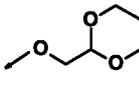
				
Q-391	Q-392	Q-393	Q-394	Q-395

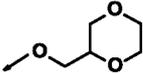
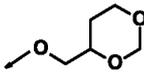
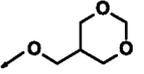
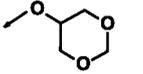
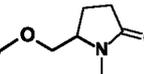
				
Q-396	Q-397	Q-398	Q-399	Q-400

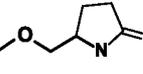
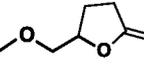
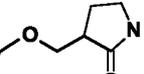
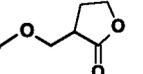
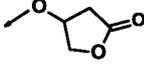
				
Q-401	Q-402	Q-403	Q-404	Q-405
				
Q-406	Q-407	Q-408	Q-409	Q-410

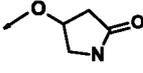
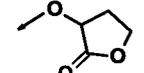
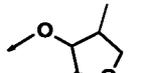
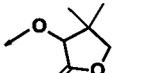
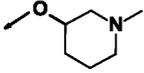
				
Q-411	Q-412	Q-413	Q-414	Q-415

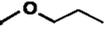
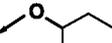
				
Q-416	Q-417	Q-418	Q-419	Q-420

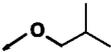
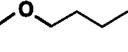
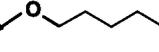
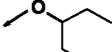
				
Q-421	Q-422	Q-423	Q-424	Q-425

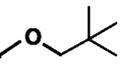
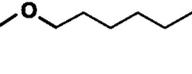
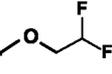
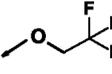
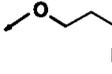
				
Q-426	Q-427	Q-428	Q-429	Q-430

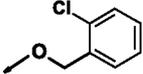
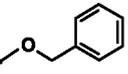
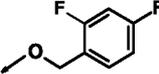
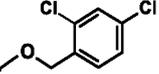
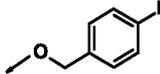
				
Q-431	Q-432	Q-433	Q-434	Q-435

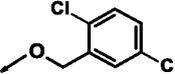
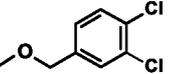
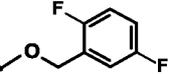
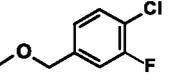
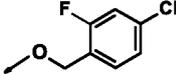
				
Q-436	Q-437	Q-438	Q-439	Q-440

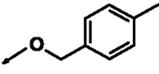
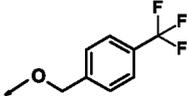
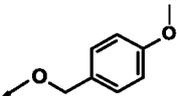
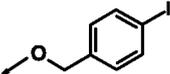
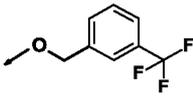
				
Q-441	Q-442	Q-443	Q-444	Q-445

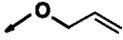
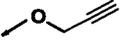
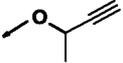
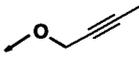
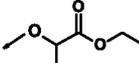
				
Q-446	Q-447	Q-448	Q-449	Q-450

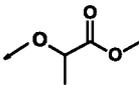
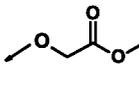
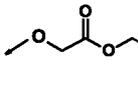
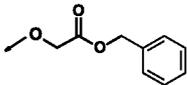
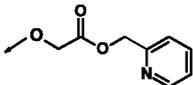
				
Q-451	Q-452	Q-453	Q-454	Q-455

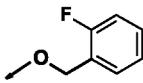
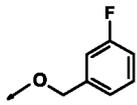
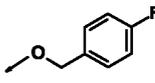
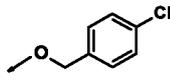
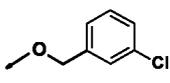
				
Q-456	Q-457	Q-458	Q-459	Q-460

				
Q-461	Q-462	Q-463	Q-464	Q-465

				
Q-466	Q-467	Q-468	Q-469	Q-470

				
Q-471	Q-472	Q-473	Q-474	Q-475

				
Q-476	Q-477	Q-478	Q-479	Q-480

				
Q-481				
				
Q-482	Q-483	Q-484	Q-485	Q-486

В частности, предпочтительным предметом изобретения являются соединения общей формулы (I), где

$R^1$  означает водород,

$R^2$  означает фтор,

$R^3$  означает водород, фтор, хлор, бром, метокси,

$R^4$  означает фтор, хлор, бром, циано,  $NO_2$ ,  $C(O)NH_2$ ,  $C(S)NH_2$ , трифторметил, этинил, пропин-1-ил,

$R^5$ ,  $R^6$  и  $R^7$  независимо друг от друга означают водород, фтор, хлор, бром, йод, циано, метил, этил, трифторметил, дифторметил, метокси, этокси, дифторметокси, трифторметокси,

G означает метилен, (метил)метилен, (этил)метилен, (диметил)метилен, этилен, н-пропилен, (1-метил)этил-1-ен, (2-метил)этил-1-ен, н-бутилен, 1-метилпропил-1-ен, 2-метилпропил-1-ен, 3-метилпропил-1-ен, 1,1-диметилэтил-1-ен, 2,2-диметилэтил-1-ен, 1-этиэтил-1-ен, 2-этиэтил-1-ен, 1-(проп-1-ил)этил-1-ен, 2-(проп-1-ил)этил-1-ен, 1-(проп-2-ил)этил-1-ен, 2-(проп-2-ил)этил-1-ен, н-пентилен, 1-метилбутил-1-ен, 2-метилбутил-1-ен, 3-метилбутил-1-ен, 4-метилбутил-1-ен, 1,1-диметилпропил-1-ен, 2,2-диметилпропил-1-ен, 3,3-диметилпропил-1-ен, 1,2-диметилпропил-1-ен, 1,3-диметилпропил-1-ен, 1-этилпропил-1-ен, н-гексилен,

R<sup>15</sup> и R<sup>16</sup> независимо друг от друга означают водород, метил,

X и Y независимо друг от друга означают O (кислород) или S (серу),

и

Q означает одну из вышеуказанных групп Q-1 - Q-486.

Особенно предпочтительным предметом изобретения являются соединения общей формулы (I), где

R<sup>1</sup> означает водород,

R<sup>2</sup> означает фтор,

R<sup>3</sup> означает фтор,

R<sup>4</sup> означает фтор, бром, циано, NO<sub>2</sub>, C(O)NH<sub>2</sub>, C(S)NH<sub>2</sub>,

R<sup>5</sup>, R<sup>6</sup> и R<sup>7</sup> независимо друг от друга означают водород, фтор, хлор, бром, циано, метил, трифторметил, метокси, трифторметокси,

G означает метилен, (метил)метилен, (этил)метилен, (диметил)метилен, этилен, н-пропилен, (1-метил)этил-1-ен, (2-метил)этил-1-ен, н-бутилен, 1-метилпропил-1-ен, 2-метилпропил-1-ен, 3-метилпропил-1-ен, н-пентилен, н-гексилен,

R<sup>15</sup> и R<sup>16</sup> означают водород,

X и Y независимо друг от друга означают O (кислород) или S (серу),

и

Q означает одну из вышеуказанных групп Q-1 - Q-486.

Особенно предпочтительным предметом изобретения являются соединения общей формулы (I), где

R<sup>1</sup> означает водород,

R<sup>2</sup> означает фтор,

R<sup>3</sup> означает фтор,

R<sup>4</sup> означает фтор, бром, циано, NO<sub>2</sub>, C(O)NH<sub>2</sub>, C(S)NH<sub>2</sub>,

R<sup>5</sup>, R<sup>6</sup> и R<sup>7</sup> независимо друг от друга означают водород, фтор, хлор, бром, циано, метил, трифторметил, метокси, трифторметокси,

G означает метилен, (метил)метилен, (этил)метилен, (диметил)метилен, этилен, н-пропилен, (1-метил)этил-1-ен, (2-метил)этил-1-ен, н-бутилен, 1-метилпропил-1-ен, 2-метилпропил-1-ен, 3-метилпропил-1-ен, н-пентилен, н-гексилен,

R<sup>15</sup> и R<sup>16</sup> означают водород,

X и Y независимо друг от друга означают O (кислород) или S (серу),

и

Q означает одну из вышеуказанных групп Q-1 - Q-486.

В высшей степени предпочтительным предметом изобретения являются соединения общей формулы (I), где

R<sup>1</sup> означает водород,

R<sup>2</sup> означает фтор,

R<sup>3</sup> означает фтор,

R<sup>4</sup> означает фтор, бром, циано, NO<sub>2</sub>,

R<sup>5</sup>, R<sup>6</sup> и R<sup>7</sup> независимо друг от друга означают водород, фтор, хлор, бром, метил,

G означает метилен, (метил)метилен, (этил)метилен, (диметил)метилен, этилен, н-пропилен, н-бутилен, н-пентилен, н-гексилен,

R<sup>15</sup> и R<sup>16</sup> означают водород,

X и Y независимо друг от друга означают O (кислород) или S (серу),

и

Q означает одну из вышеуказанных групп Q-1 - Q-486.

Чрезвычайно предпочтительным предметом изобретения являются соединения общей формулы (I), где

R<sup>1</sup> означает водород,

R<sup>2</sup> означает фтор,

R<sup>3</sup> означает фтор,

R<sup>4</sup> означает хлор, NO<sub>2</sub>,

R<sup>5</sup> означает водород,

R<sup>6</sup> означает водород, фтор,

R<sup>7</sup> означает водород,

G означает метилен, (метил)метилен, этилен, н-пропилен,

R<sup>15</sup> и R<sup>16</sup> означают водород,

X означает O (кислород) или S (серу),

Y означает O (кислород),

и

Q означает одну из вышеуказанных групп Q-1, Q-2, Q-23, Q-115, Q-176, Q-286, Q-441, Q-442, Q-447, Q-448, Q-457, Q-471, Q-481.

Перечисленные выше общие или упомянутые в предпочтительных областях определения остатков являются как конечными продуктами формулы (I), так и необходимыми веществами для получения исходных или промежуточных продуктов. Эти определения остатков можно комбинировать друг с другом, а также чередовать любым способом в указанных предпочтительных областях.

Прежде всего, благодаря высокому гербицидному действию, улучшенной селективности и/или улучшенному получению, особый интерес представляют соединения согласно изобретению указанной выше формулы (I) или их соли или их применение согласно изобретению, где отдельные остатки имеют одно из уже упомянутых или названных ниже предпочтительных значений, или особенно

предпочтительно те значения, где комбинируют одно или более из уже упомянутых или названных ниже предпочтительных значений.

Если при сдвиге водорода соединения могут образовывать таутомеры, которые структурно не охвачены формулой (I), то эти таутомеры тем не менее включены в определения соединений общей формулы (I), если определенный таутомер не является предметом изобретения. Так, например, многие карбонильные соединения могут присутствовать как в кетоформе, так и в енольной форме, причем обе формы включены в определения соединений формулы (I).

Соединения общей формулы (I) в зависимости от вида и от соединения заместителей могут присутствовать в виде стереоизомеров. Все возможные стереоизомеры, как энантиомеры, диастереомеры, Z- и E-изомеры, определенные особой пространственной формой, представлены в формуле (I). Например, присутствует одна или более алкенильных групп, таким образом могут возникать диастереомеры (Z- и E-изомеры). Например, присутствует один или более асимметричных атомов углерода, таким образом, могут возникать энантиомеры и диастереомеры. Стереоизомеры могут возникать при получении смесей обычными методами разделения. Хроматографическое разделение можно проводить как в аналитическом масштабе для определения энантиомерного или диастереомерного избытка, так и в препаративном масштабе для получения образцов для испытаний для биологической проверки. Также можно селективно получать стереоизомеры с помощью стереоселективных реакций с применением оптически активных исходных и/или вспомогательных веществ. Таким образом изобретение также касается всех стереоизомеров, которые содержатся в общей формулы (I), однако не указывают их особую стереоформу, а также их смесей.

Если соединения присутствуют в виде твердых веществ, то очистку также можно проводить с помощью перекристаллизации или выщелачивания. Если отдельные соединения общей формулы (I) не могут быть получены нижеследующими способами, то их можно получить при получении производных из других соединений общей формулы (I).

В качестве способов изолирования, очистки и способов разделения стереоизомеров соединений формулы (I) принимают во внимание методы, которые обычно использует специалист в аналогичных случаях, например, такие физические способы, как кристаллизация, методы хроматографии, прежде всего колоночная хроматография и ВЭЖХ (высокоэффективная жидкостная

хроматография), дистилляция, приводимая при необходимости при пониженном давлении, экстрагирование и другие методы, оставшиеся смеси, как правило, при необходимости можно разделить при помощи хроматографического разделения, например, на хиральные твердые фазы. Для препаративного количество или в промышленных масштабах принимают во внимание такие способы, как кристаллизация, например, диастереоизомерных солей, которые могут быть получены из смесей диастереомеров с оптически активными кислотами и при необходимости с присутствием кислотных групп с оптически активными основаниями.

Выше- и нижеиспользуемые обозначения разъясняют с учетом соединений общей формулы (I) согласно изобретению. Они известны специалистам и особенно предпочтительно имеют указанные ниже значения:

За исключением случаев, когда указано иное, в целом для обозначения химических групп принято, что связь со скелетом или остатком молекулы осуществляется с помощью названного последним структурного элемента соответствующей химической группы, т.е., например, в случае (C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>)-алкенилокси через атом кислорода, и в случае гетероцикл-ил-(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-алкила или R<sup>17</sup>O(O)C-(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-алкила соответственно через C-атом алкильной группы.

Согласно изобретению "алкилсульфонил" означает – отдельно или в качестве компонента химической группы – с прямой или разветвленной цепью алкилсульфонил, предпочтительно с 1 - 8 или с 1 - 6 атомами углерода, например, (но не ограничиваясь) (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-алкилсульфонил, как метилсульфонил, этилсульфонил, пропилсульфонил, 1-метилэтилсульфонил, бутилсульфонил, 1-метилпропилсульфонил, 2-метилпропилсульфонил, 1,1-диметилэтилсульфонил, пентилсульфонил, 1-метилбутилсульфонил, 2-метилбутилсульфонил, 3-метилбутилсульфонил, 1,1-диметилпропилсульфонил, 1,2-диметилпропилсульфонил, 2,2-диметилпропилсульфонил, 1-этилпропилсульфонил, гексилсульфонил, 1-метилпентилсульфонил, 2-метилпентилсульфонил, 3-метилпентилсульфонил, 4-метилпентилсульфонил, 1,1-диметилбутилсульфонил, 1,2-диметилбутилсульфонил, 1,3-диметилбутилсульфонил, 2,2-диметилбутилсульфонил, 2,3-диметилбутилсульфонил, 3,3-диметилбутилсульфонил, 1-этилбутилсульфонил, 2-этилбутилсульфонил, 1,1,2-триметилпропилсульфонил, 1,2,2-триметилпропилсульфонил, 1-этил-1-метилпропилсульфонил и 1-этил-2-метилпропилсульфонил.

Согласно изобретению "гетероарилсульфонил" означает, при необходимости, замещенный пиридилсульфонил, пиримидинилсульфонил, пиазинилсульфонил или, при необходимости, замещенный полициклический гетероарилсульфонил, особенно предпочтительным здесь является замещенный при необходимости хинолинилсульфонил, например, замещенный такими веществами как фтор, хлор, бром, йод, циано, нитро, алкил-, галоалкил-, галоалкокси-, amino-, алкиламино-, алкилкарбониламино-, диалкиламино- или алкоксигруппы.

Согласно изобретению "алкилтио" означает – отдельно или в качестве компонента химической группы – с прямой или разветвленной цепью S-алкил, предпочтительно с 1 - 8 или с 1 - 6 атомами углерода, как (C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub>)-, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)- или (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-алкилтио, например, (но не ограничиваясь) (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-алкилтио, как метилтио, этилтио, пропилтио, 1-метилэтилтио, бутилтио, 1-метилпропилтио, 2-метилпропилтио, 1,1-диметилэтилтио, пентилтио, 1-метилбутилтио, 2-метилбутилтио, 3-метилбутилтио, 1,1-диметилпропилтио, 1,2-диметилпропилтио, 2,2-диметилпропилтио, 1-этилпропилтио, гексилтио, 1-метилпентилтио, 2-метилпентилтио, 3-метилпентилтио, 4-метилпентилтио, 1,1-диметилбутилтио, 1,2-диметилбутилтио, 1,3-диметилбутилтио, 2,2-диметилбутилтио, 2,3-диметилбутилтио, 3,3-диметилбутилтио, 1-этилбутилтио, 2-этилбутилтио, 1,1,2-триметилпропилтио, 1,2,2-триметилпропилтио, 1-этил-1-метилпропилтио и 1-этил-2-метилпропилтио.

"Алкенилтио" означает согласно изобретению соединенный с атомом серы остаток алкенила, алкинилтио означает соединенный атомом серы алкинильный остаток, циклоалкилтио означает соединенный атомом серы циклоалкильный остаток и циклоалкенилтио означает соединенный атомом серы циклоалкенильный остаток.

"Алкилсульфинил (алкил-S(=O)-)", если не указано иное, означает согласно изобретению алкильные остатки, которые соединены с помощью -S(=O)- со скелетом, как (C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub>)-, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)- или (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-алкилсульфинил, например, (но не ограничиваясь) (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-алкилсульфинил, как метилсульфинил, этилсульфинил, пропилсульфинил, 1-метилэтилсульфинил, бутилсульфинил, 1-метилпропилсульфинил, 2-метилпропилсульфинил, 1,1-диметилэтилсульфинил, пентилсульфинил, 1-метилбутилсульфинил, 2-метилбутилсульфинил, 3-

метилбутилсульфинил, 1,1-диметилпропилсульфинил, 1,2-диметилпропилсульфинил, 2,2-диметилпропилсульфинил, 1-этилпропилсульфинил, гексилсульфинил, 1-метилпентилсульфинил, 2-метилпентилсульфинил, 3-метилпентилсульфинил, 4-метилпентилсульфинил, 1,1-диметилбутилсульфинил, 1,2-диметилбутилсульфинил, 1,3-диметилбутилсульфинил, 2,2-диметилбутилсульфинил, 2,3-диметилбутилсульфинил, 3,3-диметилбутилсульфинил, 1-этилбутилсульфинил, 2-этилбутилсульфинил, 1,1,2-триметилпропилсульфинил, 1,2,2-триметилпропилсульфинил, 1-этил-1-метилпропилсульфинил и 1-этил-2-метилпропилсульфинил.

Аналогично "алкенилсульфинил" и "алкинилсульфинил" согласно изобретению означают алкенильные или алкинильные остатки, которые с помощью  $-S(=O)-$  соединены со скелетом, такие как  $(C_2-C_{10})-$ ,  $(C_2-C_6)-$  или  $(C_2-C_4)-$  алкенилсульфинил или  $(C_3-C_{10})-$ ,  $(C_3-C_6)-$  или  $(C_3-C_4)-$  алкинилсульфинил.

Аналогично "алкенилсульфонил" и "алкинилсульфонил", согласно изобретению означает алкенильные или алкинильные остатки, которые с помощью  $-S(=O)_2-$  соединены со скелетом, такие как  $(C_2-C_{10})-$ ,  $(C_2-C_6)-$  или  $(C_2-C_4)-$  алкенилсульфонил или  $(C_3-C_{10})-$ ,  $(C_3-C_6)-$  или  $(C_3-C_4)-$  алкинилсульфонил.

"Алкокси" означает связанный через атом кислорода алкильный остаток, например, (но не ограничиваясь)  $(C_1-C_6)-$  алкокси, как метокси, этокси, пропокси, 1-метилэтокси, бутокси, 1-метилпропокси, 2-метилпропокси, 1,1-диметилэтокси, пентокси, 1-метилбутокси, 2-метилбутокси, 3-метилбутокси, 1,1-диметилпропокси, 1,2-диметилпропокси, 2,2-диметилпропокси, 1-этилпропокси, гексокси, 1-метилпентокси, 2-метилпентокси, 3-метилпентокси, 4-метилпентокси, 1,1-диметилбутокси, 1,2-диметилбутокси, 1,3-диметилбутокси, 2,2-диметилбутокси, 2,3-диметилбутокси, 3,3-диметилбутокси, 1-этилбутокси, 2-этилбутокси, 1,1,2-триметилпропокси, 1,2,2-триметилпропокси, 1-этил-1-метилпропокси и 1-этил-2-метилпропокси. Алкенилокси означает связанный через атом кислорода алкенильный остаток, алкинилокси означает связанный через атом кислорода алкинильный остаток, как  $(C_2-C_{10})-$ ,  $(C_2-C_6)-$  или  $(C_2-C_4)-$  алкенилокси или  $(C_3-C_{10})-$ ,  $(C_3-C_6)-$  или  $(C_3-C_4)-$  алкиноокси.

"Циклоалкилокси" означает связанный через атом кислорода циклоалкильный остаток, а циклоалкенилокси означает связанный через атом кислорода циклоалкенильный остаток.

"Алкилкарбонил" (Алкил-C(=O)-), если не указано иное, означает согласно изобретению алкильные остатки, которые соединены с помощью -C(=O)- со скелетом, такие как (C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub>)-, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)- или (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-алкилкарбонил. При этом количество С-атомов относится к алкильному остатку в алкил-карбонильной группе.

Аналогично "алкенилкарбонил" и "алкинилкарбонил", если не указано иное, согласно изобретению означают алкенильные или алкинильные остатки, которые с помощью -C(=O)- соединены со скелетом, такие как (C<sub>2</sub>-C<sub>10</sub>)-, (C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)- или (C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>)-алкенилкарбонил или (C<sub>2</sub>-C<sub>10</sub>)-, (C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)- или (C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>)-алкинилкарбонил. При этом количество С-атомов относится к алкенильному или алкинильному остатку в алкенил- или алкинилкарбонильной группе.

"Алкоксикарбонил (алкил-О-C(=O)-)", если не указано иное, означает алкильные остатки, которые соединены с помощью -О-C(=O)- со скелетом, такие как (C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub>)-, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)- или (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-алкоксикарбонил. При этом количество С-атомов относится к алкильному остатку в алкоксикарбонильной группе. Аналогично "алкенилоксикарбонил" и "алкинилоксикарбонил", если не указано иное, согласно изобретению означают алкенильные или алкинильные остатки, которые с помощью -C(=O)- соединены со скелетом, такие как (C<sub>2</sub>-C<sub>10</sub>)-, (C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)- или (C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>)-алкенилоксикарбонил или (C<sub>3</sub>-C<sub>10</sub>)-, (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)- или (C<sub>3</sub>-C<sub>4</sub>)-алкинилоксикарбонил. При этом количество С-атомов относится к алкенильному или алкинильному остатку в алкен- или алкинилоксикарбонильной группе.

Термин "алкилкарбонилокси" (алкил-C(=O)-), если не указано иное, означает согласно изобретению алкильные остатки, которые соединены с помощью карбонилоксигруппы (-C(=O)-О-) с кислородом со скелетом, такие как (C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub>)-, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)- или (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-алкилкарбонилокси. При этом количество С-атомов относится к алкильному остатку в алкен- или алкилкарбонилокси-группе.

Аналогично "алкенилкарбонилокси" и "алкинилкарбонилокси", согласно изобретению означает алкенильные или алкинильные остатки, которые с помощью (-C(=O)-О-) соединены со скелетом, такие как (C<sub>2</sub>-C<sub>10</sub>)-, (C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)- или (C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>)-

алкенилкарбонилокси или (C<sub>2</sub>-C<sub>10</sub>)-, (C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)- или (C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>)-алкинилкарбонилокси. При этом количество C-атомов относится к алкенильному или алкинильному остатку в алкенил- или алкинилкарбонилокси-группе.

В кратких формах, как например, C(O)R<sup>13</sup>, C(O)OR<sup>13</sup>, OC(O)NR<sup>11</sup>R<sup>12</sup>, или C(O)NR<sup>11</sup>R<sup>12</sup>, указанная в скобках краткая форма O означает соединенный с помощью двойной связью с соседним атомом углерода атом кислорода.

В кратких формах, как например, OC(S)OR<sup>13</sup>, OC(S)SR<sup>14</sup>, OC(S)NR<sup>11</sup>R<sup>12</sup>, указанная в скобках краткая форма S означает соединенный с помощью двойной связью с соседним атомом углерода атом серы.

Термин "арил" означает замещенную при необходимости моно-, би- или полициклическую ароматическую систему, предпочтительно с 6 - 14, особенно предпочтительно 6 - 10 кольцевыми-C-атомами, например фенил, нафтил, антрил, фенантренил, и т.п., предпочтительно фенил.

Понятие "замещенный при необходимости арил" включает в себя многоциклические системы, как тетрагидронафтил, инденил, инденил, фторенил, бифенилил, причем место соединения находится на ароматической системе. Согласно классификации "арил", как правило, также включает в себя понятие "замещенный при необходимости фенил". Предпочтительными заместителями арила являются, например, водород, галоген, алкил, циклоалкил, циклоалкилалкил, циклоалкенил, галоциклоалкил, алкенил, алкинил, арил, арилалкил, арилалкенил, гетероарил, гетероарилалкил, гетероциклил, гетероциклилалкил, алкоксиалкил, алкилтио, галоалкилтио, галоалкил, алкокси, галоалкокси, циклоалкокси, циклоалкилалкокси, арилокси, гетероарилокси, алкоксиалкокси, алкинилалкокси, алкенилокси, бис-алкиламиноалкокси, трис-[алкил]силил, бис-[алкил]арилсилил, бис-[алкил]алкилсилил, трис-[алкил]силилалкинил, арилалкинил, гетероарилалкинил, алкилалкинил, циклоалкилалкинил, галоалкилалкинил, гетероциклил-N-алкокси, нитро, циано, amino, алкиламино, бис-алкиламино, алкилкарбониламино, циклоалкилкарбониламино, арилкарбониламино, алкоксикарбониламино, алкоксикарбонилалкиламино, арилалкоксикарбонилалкиламино, гидроксикарбонил, алкоксикарбонил, аминокарбонил, алкиламинокарбонил, циклоалкиламинокарбонил, бис-алкиламинокарбонил, гетероарилалкокси, арилалкокси.

Гетероциклический остаток (гетероцикл) содержит, по меньшей мере, одно гетероциклическое кольцо (=карбоциклическое кольцо, в котором, по меньшей мере, один С-атом замещен гетероатомом, предпочтительно гетероатомом из группы N, O, S, P), которое может быть насыщенным, ненасыщенным, частично насыщенным или гетероароматическим и при этом незамещенным или замещенным, причем место присоединения к кольцевому атому ограничено. Если гетероциклический остаток или гетероциклическое кольцо при необходимости являются замещенными, они могут быть аннелированы другими карбоциклическими или гетероциклическими кольцами. Если при необходимости присутствует замещенный гетероцикл, то также присутствуют многоциклические системы, как например, 8-аза-бицикло[3.2.1]октанил, 8-аза-бицикло[2.2.2]октанил или 1-аза-бицикло[2.2.1]гептил. Если при необходимости присутствует замещенный гетероцикл, то также присутствуют спироциклические системы, как, например, 1-окса-5-аза-спиро[2.3]гексил. Если не указано иное, то гетероциклическое кольцо предпочтительно содержит 3 - 9 кольцевых атомов, в частности, 3 - 6 кольцевых атомов, и один или более, предпочтительно 1 - 4, в частности, 1, 2 или 3 гетероатома в гетероциклическом кольце, предпочтительно из группы N, O, и S, причем два атома кислорода не должны находиться рядом, как например, с гетероатомом из группы N, O и S 1- или 2-, или 3-пирролидинил, 3,4-дигидро-2Н-пиррол-2- или 3-ил, 2,3-дигидро-1Н-пиррол-1- или 2-, или 3-, или 4-, или 5-ил; 2,5-дигидро-1Н-пиррол-1- или 2-, или 3-ил, 1- или 2-, или 3-, или 4-пиперидинил; 2,3,4,5-тетрагидропиридин-2- или 3-, или 4-, или 5-ил или 6-ил; 1,2,3,6-тетрагидропиридин-1- или 2-, или 3-, или 4-, или 5-, или 6-ил; 1,2,3,4-тетрагидропиридин-1- или 2-, или 3-, или 4-, или 5-, или 6-ил; 1,4-дигидропиридин-1- или 2-, или 3-, или 4-ил; 2,3-дигидропиридин-2-, или 3-, или 4-, или 5-, или 6-ил; 2,5-дигидропиридин-2-, или 3-, или 4-, или 5-, или 6-ил, 1- или 2-, или 3-, или 4-азепанил; 2,3,4,5-тетрагидро-1Н-азепин-1- или 2-, или 3-, или 4-, или 5-, или 6-, или 7-ил; 2,3,4,7-тетрагидро-1Н-азепин-1- или 2-, или 3-, или 4-, или 5-, или 6-, или 7-ил; 2,3,6,7-тетрагидро-1Н-азепин-1- или 2-, или 3-, или 4-ил; 3,4,5,6-тетрагидро-2Н-азепин-2- или 3-, или 4-, или 5-, или 6-, или 7-ил; 4,5-дигидро-1Н-азепин-1- или 2-, или 3-, или 4-ил; 2,5-дигидро-1Н-азепин-1- или 2-, или 3-, или 4-, или 5-, или 6-, или 7-ил; 2,7-дигидро-1Н-азепин-1- или 2-, или 3-, или 4-ил; 2,3-дигидро-1Н-азепин-1- или 2-, или 3-, или 4-, или 5-, или 6-, или 7-ил; 3,4-дигидро-2Н-азепин-2- или 3-, или 4-, или 5-, или 6-, или 7-ил; 3,6-дигидро-2Н-азепин-2- или

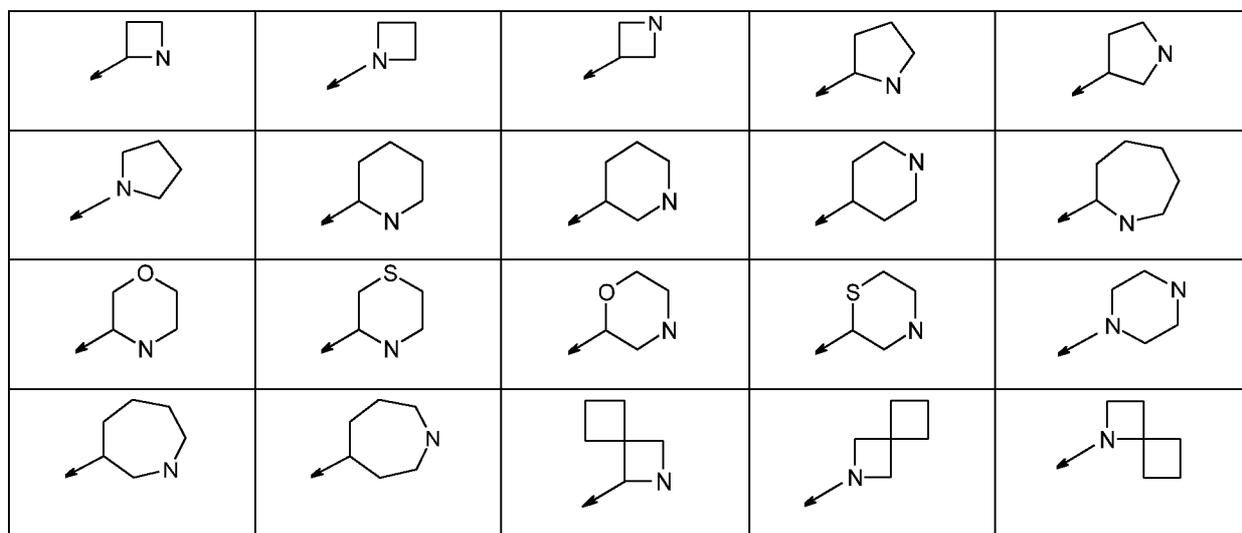
3-, или 4-, или 5-, или 6-, или 7-ил; 5,6-дигидро-2Н-азепин-2- или 3-, или 4-, или 5-, или 6-, или 7-ил; 4,5-дигидро-3Н-азепин-2- или 3-, или 4-, или 5-, или 6-, или 7-ил; 1Н-азепин-1- или 2-, или 3-, или 4-, или 5-, или 6-, или 7-ил; 2Н-азепин-2- или 3-, или 4-, или 5-, или 6-, или 7-ил; 3Н-азепин-2- или 3-, или 4-, или 5-, или 6-, или 7-ил; 4Н-азепин-2- или 3-, или 4-, или 5-, или 6-, или 7-ил, 2- или 3-оксоланил (= 2- или 3-тетрагидрофуранил); 2,3-дигидрофуран-2- или 3-, или 4-, или 5-ил; 2,5-дигидрофуран-2- или 3-ил, 2- или 3-, или 4-оксанил (= 2- или 3-, или 4-тетрагидропиранил); 3,4-дигидро-2Н-пиран-2-, или 3-, или 4-, или 5-, или 6-ил; 3,6-дигидро-2Н-пиран-2- или 3-, или 4, или 5-, или 6-ил; 2Н-пиран-2-, или 3-, или 4-, или 5-, или 6-ил; 4Н-пиран-2- или 3-, или 4-ил, 2- или 3-, или 4-оксепанил; 2,3,4,5-тетрагидрооксепин-2- или 3-, или 4-, или 5-, или 6-, или 7-ил; 2,3,4,7-тетрагидрооксепин-2- или 3-, или 4-, или 5-, или 6-, или 7-ил; 2,3,6,7-тетрагидрооксепин-2- или 3-, или 4-ил; 2,3-дигидрооксепин-2- или 3-, или 4-, или 5-, или 6-, или 7-ил; 4,5-дигидрооксепин-2- или 3-, или 4-ил; 2,5-дигидрооксепин-2- или 3-, или 4-, или 5-, или 6-, или 7-ил; оксепин-2- или 3-, или 4-, или 5-, или 6-, или 7-ил; 2- или 3-тетрагидротиофенил; 2,3-дигидротиофен-2- или 3-, или 4-, или 5-ил; 2,5-дигидротиофен-2- или 3-ил; тетрагидро-2Н-тиопиран-2- или 3-, или 4-ил; 3,4-дигидро-2Н-тиопиран-2-, или 3-, или 4-, или 5-, или 6-ил; 3,6-дигидро-2Н-тиопиран-2-, или 3-, или 4-, или 5-, или 6-ил; 2Н-тиопиран-2-, или 3-, или 4-, или 5-, или 6-ил; 4Н-тиопиран-2- или 3-, или 4-ил. Предпочтительными 3-кольцевыми и 4-кольцевыми гетероциклами являются, например, 1- или 2-азиридирил, оксиранил, тирианил, 1- или 2-, или 3-азетидинил, 2- или 3-оксетанил, 2- или 3-тиетанил, 1,3-диоксетан-2-ил. Дополнительными примерами “гетероциклила“ является частично или полностью гидрированный гетероциклический остаток с двумя гетероатомами из группы N, O и S, как, например, 1- или 2-, или 3-, или 4-пиразолидинил; 4,5-дигидро-3Н-пиразол-3- или 4, или 5-ил; 4,5-дигидро-1Н-пиразол-1- или 3-, или 4, или 5-ил; 2,3-дигидро-1Н-пиразол-1- или 2-, или 3-, или 4-, или 5-ил; 1- или 2-, или 3-, или 4- имидазолидинил; 2,3-дигидро-1Н-имидазол-1- или 2-, или 3-, или 4-ил; 2,5-дигидро-1Н-имидазол-1- или 2-, или 4, или 5-ил; 4,5-дигидро-1Н-имидазол-1- или 2-, или 4, или 5-ил; гексагидропиридазин-1- или 2-, или 3-, или 4-ил; 1,2,3,4-тетрагидропиридазин-1- или 2-, или 3-, или 4-, или 5-, или 6-ил; 1,2,3,6-тетрагидропиридазин-1- или 2-, или 3-, или 4-, или 5-, или 6-ил; 1,4,5,6-тетрагидропиридазин-1- или 3-, или 4-, или 5-, или 6-ил; 3,4,5,6-тетрагидропиридазин-3- или 4, или 5-ил; 4,5-дигидропиридазин-3- или 4-ил; 3,4-

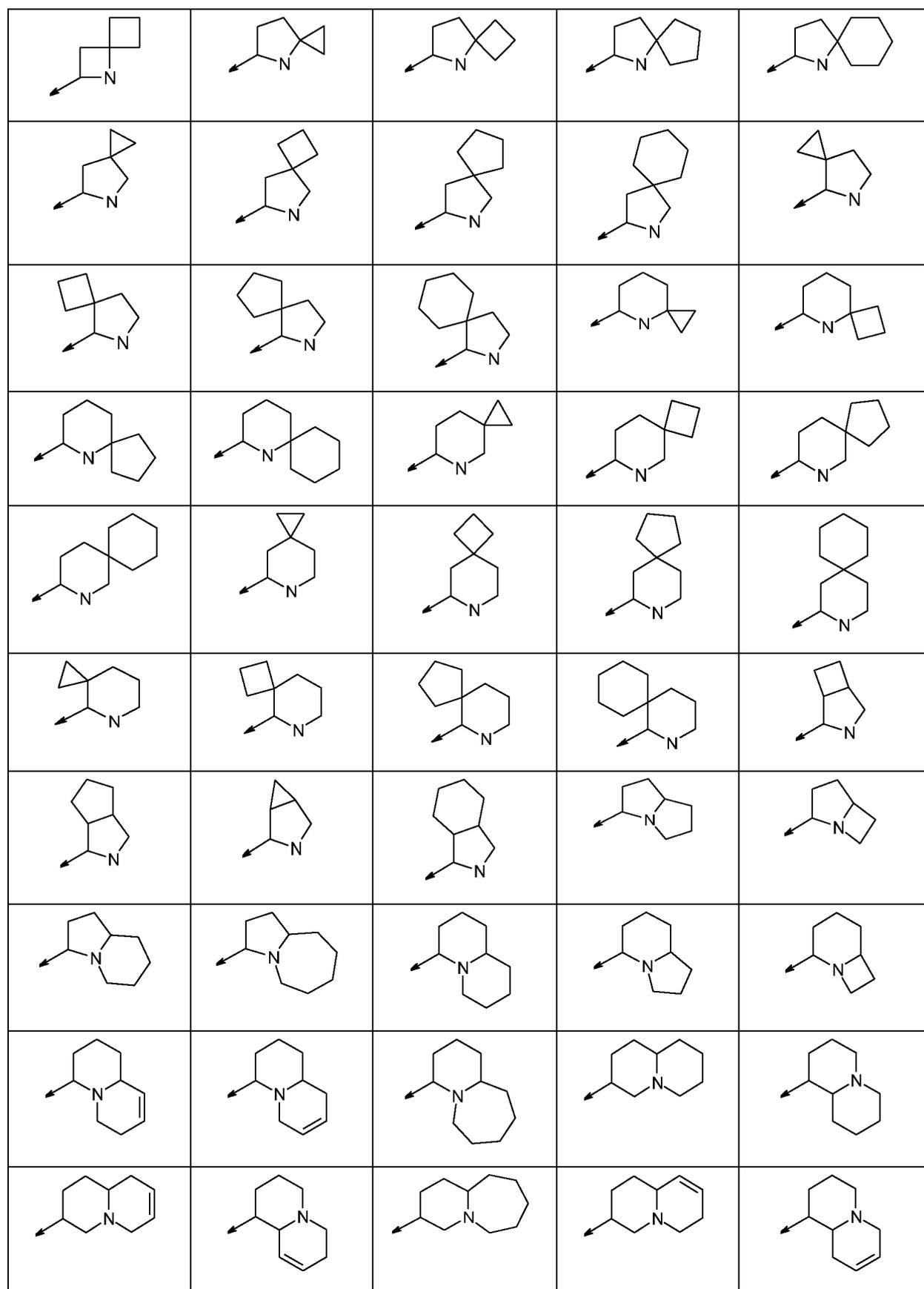
дигидропиридазин-3- или 4-, или 5-, или 6-ил; 3,6-дигидропиридазин-3- или 4-ил; 1,6-дигидропиразин-1- или 3-, или 4-, или 5-, или 6-ил; гексагидропиримидин-1- или 2-, или 3-, или 4-ил; 1,4,5,6-тетрагидропиримидин-1- или 2-, или 3-, или 4-, или 5-, или 6-ил; 1,2,5,6-тетрагидропиримидин-1- или 2-, или 3-, или 4-, или 5-, или 6-ил; 1,2,3,4-тетрагидропиримидин-1- или 2-, или 3-, или 4-, или 5-, или 6-ил; 1,6-дигидропиримидин-1- или 2-, или 3-, или 4-, или 5-, или 6-ил; 1,2-дигидропиримидин-1- или 2-, или 3-, или 4-, или 5-, или 6-ил; 2,5-дигидропиримидин-2- или 4, или 5-ил; 4,5-дигидропиримидин- 4- или 5-, или 6-ил; 1,4-дигидропиримидин-1- или 2-, или 3-, или 4-, или 5-, или 6-ил; 1- или 2-, или 3-пиперазинил; 1,2,3,6-тетрагидропиразин-1- или 2-, или 3-, или 5-, или 6-ил; 1,2,3,4-тетрагидропиразин-1- или 2-, или 3-, или 4-, или 5-, или 6-ил; 1,2-дигидропиразин-1- или 2-, или 3-, или 5-, или 6-ил; 1,4-дигидропиразин-1- или 2-, или 3-ил; 2,3-дигидропиразин-2- или 3-, или 5-, или 6-ил; 2,5-дигидропиразин-2- или 3-ил; 1,3-диоксолан-2- или 4, или 5-ил; 1,3-диоксол-2- или 4-ил; 1,3-диоксан-2- или 4, или 5-ил; 4Н-1,3-диоксин-2-, или 4-, или 5-, или 6-ил; 1,4-диоксан-2- или 3-, или 5-, или 6-ил; 2,3-дигидро-1,4-диоксин-2- или 3-, или 5-, или 6-ил; 1,4-диоксин-2- или 3-ил; 1,2-дитиолан-3- или 4-ил; 3Н-1,2-дитиол-3- или 4-, или 5-ил; 1,3-дитиолан-2- или 4-ил; 1,3-дитиол-2- или 4-ил; 1,2-дитиан-3- или 4-ил; 3,4-дигидро-1,2-дитиин-3- или 4-, или 5-, или 6-ил; 3,6-дигидро-1,2-дитиин-3- или 4-ил; 1,2-дитиин-3- или 4-ил; 1,3-дитиан-2- или 4, или 5-ил; 4Н-1,3-дитиин-2-, или 4-, или 5-, или 6-ил; изоксазолидин-2- или 3-, или 4-, или 5-ил; 2,3-дигидроизоксазол-2- или 3-, или 4-, или 5-ил; 2,5-дигидроизоксазол-2- или 3-, или 4-, или 5-ил; 4,5-дигидроизоксазол-3- или 4, или 5-ил; 1,3-оксазолидин-2- или 3-, или 4-, или 5-ил; 2,3-дигидро-1,3-оксазол-2- или 3-, или 4-, или 5-ил; 2,5-дигидро-1,3-оксазол-2- или 4-, или 5-ил; 4,5-дигидро-1,3-оксазол-2- или 4-, или 5-ил; 1,2-оксазинан-2-, или 3-, или 4-, или 5-, или 6-ил; 3,4-дигидро-2Н-1,2-оксазин-2-, или 3-, или 4-, или 5-, или 6-ил; 3,6-дигидро-2Н-1,2-оксазин-2-, или 3-, или 4-, или 5-, или 6-ил; 5,6-дигидро-2Н-1,2-оксазин-2-, или 3-, или 4-, или 5-, или 6-ил; 5,6-дигидро-4Н-1,2-оксазин-3- или 4-, или 5-, или 6-ил; 2Н-1,2-оксазин-2-, или 3-, или 4-, или 5-, или 6-ил; 6Н-1,2-оксазин-3- или 4-, или 5-, или 6-ил; 4Н-1,2-оксазин-3- или 4-, или 5-, или 6-ил; 1,3-оксазинан-2-, или 3-, или 4-, или 5-, или 6-ил; 3,4-дигидро-2Н-1,3-оксазин-2-, или 3-, или 4-, или 5-, или 6-ил; 3,6-дигидро-2Н-1,3-оксазин-2-, или 3-, или 4-, или 5-, или 6-ил; 5,6-дигидро-2Н-1,3-оксазин-2-, или 4-, или 5-, или 6-ил; 5,6-дигидро-4Н-1,3-оксазин-2-, или 4-, или 5-, или 6-ил; 2Н-1,3-оксазин-2-, или 4-, или 5-, или 6-ил; 6Н-1,3-

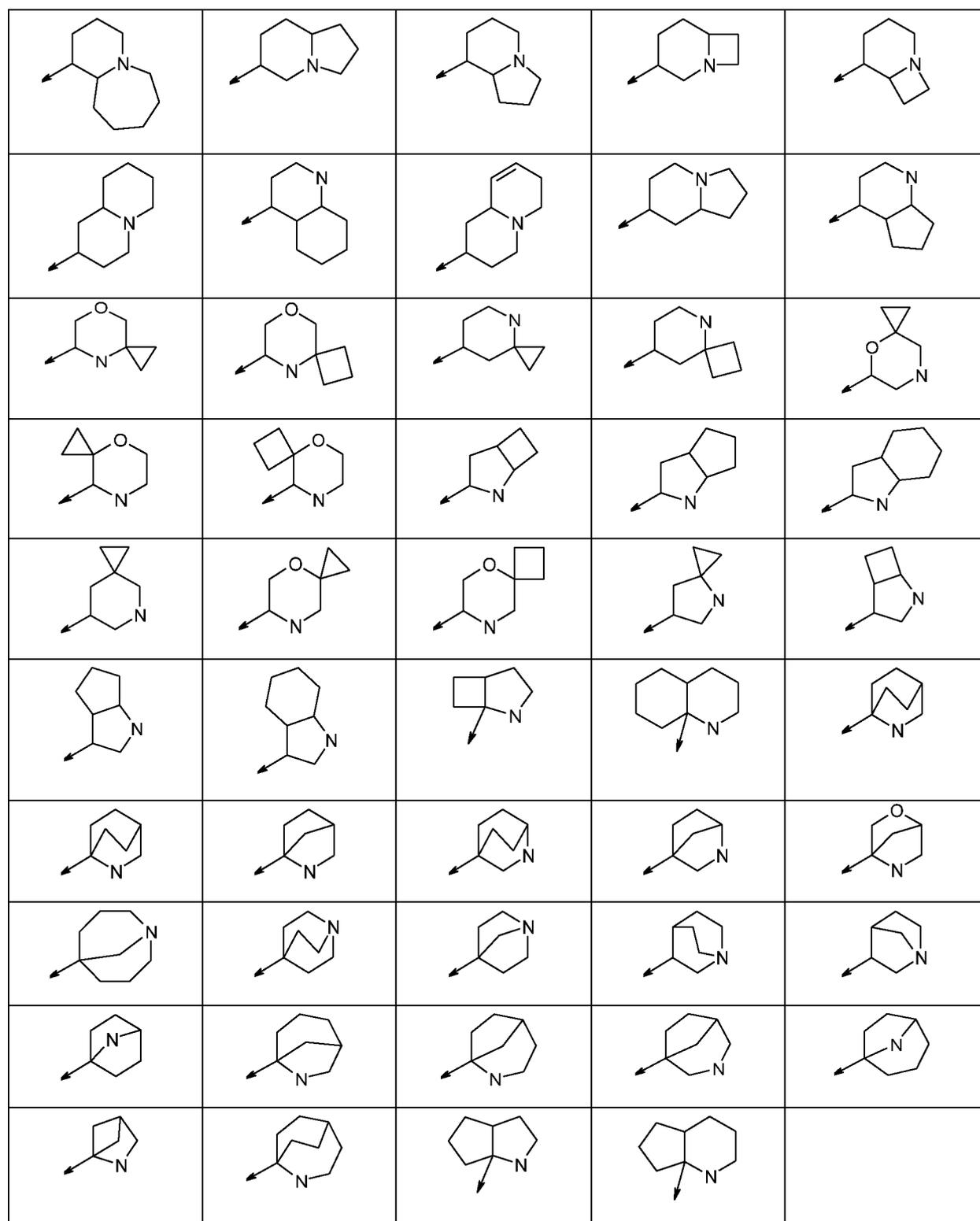


дигидро-1,4-оксазепин-2- или 3-, или 5-, или 6-, или 7-ил; 1,4-оксазепин-2- или 3-, или 5-, или 6-, или 7-ил; изотиазолидин-2- или 3-, или 4-, или 5-ил; 2,3-дигидроизотиазол-2- или 3-, или 4-, или 5-ил; 2,5-дигидроизотиазол-2- или 3-, или 4-, или 5-ил; 4,5-дигидроизотиазол-3- или 4, или 5-ил; 1,3-тиазолидин-2- или 3-, или 4-, или 5-ил; 2,3-дигидро-1,3-тиазол-2- или 3-, или 4-, или 5-ил; 2,5-дигидро-1,3-тиазол-2- или 4-, или 5-ил; 4,5-дигидро-1,3-тиазол-2- или 4-, или 5-ил; 1,3-тиазинан-2-, или 3-, или 4-, или 5-, или 6-ил; 3,4-дигидро-2Н-1,3-тиазин-2-, или 3-, или 4-, или 5-, или 6-ил; 3,6-дигидро-2Н-1,3-тиазин-2-, или 3-, или 4-, или 5-, или 6-ил; 5,6-дигидро-2Н-1,3-тиазин-2-, или 4-, или 5-, или 6-ил; 5,6-дигидро-4Н-1,3-тиазин-2-, или 4-, или 5-, или 6-ил; 2Н-1,3-тиазин-2-, или 4-, или 5-, или 6-ил; 6Н-1,3-тиазин-2-, или 4-, или 5-, или 6-ил; 4Н-1,3-тиазин-2-, или 4-, или 5-, или 6-ил. Дополнительными примерами “гетероциклила” является частично или полностью гидрированный гетероциклический остаток с тремя гетероатомами из группы N, O и S, как, например, 1,4,2-диоксазолидин-2- или 3-, или 5-ил; 1,4,2-диоксазол-3- или 5-ил; 1,4,2-диоксазинан-2- или -3-, или 5-, или 6-ил; 5,6-дигидро-1,4,2-диоксазин-3- или 5-, или 6-ил; 1,4,2-диоксазин-3- или 5-, или 6-ил; 1,4,2-диоксазепан-2- или 3-, или 5-, или 6-, или 7-ил; 6,7-дигидро-5Н-1,4,2-диоксазепин-3- или 5-, или 6-, или 7-ил; 2,3-дигидро-7Н-1,4,2-диоксазепин-2- или 3-, или 5-, или 6-, или 7-ил; 2,3-дигидро-5Н-1,4,2-диоксазепин-2- или 3-, или 5-, или 6-, или 7-ил; 5Н-1,4,2-диоксазепин-3- или 5-, или 6-, или 7-ил; 7Н-1,4,2-диоксазепин-3- или 5-, или 6-, или 7-ил.

Примеры структур для замещенных при необходимости гетероциклов также указаны ниже:







Перечисленные выше гетроциклы предпочтительно замещены, например, водородом, галогеном, алкилом, галоалкилом, гидроксигруппой, алкоксигруппой, циклоалкоксигруппой, арилоксигруппой, алкоксиалкилом, алкоксиалкоксигруппой, циклоалкилом, галоциклоалкилом, арилом, арилалкилом, гетероариллом, гетероциклилом, алкенилом, алкилкарбониллом, циклоалкилкарбониллом, арилкарбониллом, гетероарил-

карбонилем, алкоксикарбонилем, гидроксикарбонилем, циклоалкоксикарбонилем, циклоалкилалкоксикарбонилем, алкоксикарбонилалкилом, арилалкоксикарбонилем, арилалкоксикарбонилалкилом, алкинилем, алкинилалкилом, алкилалкинилом, трис-алкилсилилалкинилом, нитро, амино, циано, галоалкокси, галоалкилтио, алкилтио, гидроттио, гидроксилалкилом, оксо, гетероарилалкокси, арилалкокси, гетероциклилалкокси, гетероциклилалкилтио, гетероциклилокси, гетероциклилтио, гетероарилокси, бис-алкиламино, алкиламино, циклоалкиламино, гидроксикарбонилалкиламино, алкоксикарбонилалкиламино, арилалкоксикарбонилалкиламино, алкоксикарбонилалкил(алкил)амино, аминокарбонилем, алкиламинокарбонилем, бис-алкиламинокарбонилем, циклоалкиламинокарбонилем, гидроксикарбонилалкиламинокарбонилем, алкоксикарбонилалкиламинокарбонилем, арилалкоксикарбонилалкиламинокарбонилем.

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

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

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

Согласно изобретению понятие "гетероарил" означает гетероароматические соединения, т.е. полностью ненасыщенные ароматические гетероциклические соединения, предпочтительно 5 - 7-членные кольца с 1 - 4, предпочтительно 1 или

2 одинаковыми или различными гетероатомами, предпочтительно O, S или N. Гетероарилами согласно изобретению являются, например, 1H-пиррол-1-ил; 1H-пиррол-2-ил; 1H-пиррол-3-ил; фуран-2-ил; фуран-3-ил; тиен-2-ил; тиен-3-ил, 1H-имидазол-1-ил; 1H-имидазол-2-ил; 1H-имидазол-4-ил; 1H-имидазол-5-ил; 1H-пиразол-1-ил; 1H-пиразол-3-ил; 1H-пиразол-4-ил; 1H-пиразол-5-ил, 1H-1,2,3-триазол-1-ил, 1H-1,2,3-триазол-4-ил, 1H-1,2,3-триазол-5-ил, 2H-1,2,3-триазол-2-ил, 2H-1,2,3-триазол-4-ил, 1H-1,2,4-триазол-1-ил, 1H-1,2,4-триазол-3-ил, 4H-1,2,4-триазол-4-ил, 1,2,4-оксадиазол-3-ил, 1,2,4-оксадиазол-5-ил, 1,3,4-оксадиазол-2-ил, 1,2,3-оксадиазол-4-ил, 1,2,3-оксадиазол-5-ил, 1,2,5-оксадиазол-3-ил, азепинил, пиридин-2-ил, пиридин-3-ил, пиридин-4-ил, пиразин-2-ил, пиразин-3-ил, пиримидин-2-ил, пиримидин-4-ил, пиримидин-5-ил, пиридазин-3-ил, пиридазин-4-ил, 1,3,5-триазин-2-ил, 1,2,4-триазин-3-ил, 1,2,4-триазин-5-ил, 1,2,4-триазин-6-ил, 1,2,3-триазин-4-ил, 1,2,3-триазин-5-ил, 1,2,4-, 1,3,2-, 1,3,6- и 1,2,6-оксазинил, изоксазол-3-ил, изоксазол-4-ил, изоксазол-5-ил, 1,3-оксазол-2-ил, 1,3-оксазол-4-ил, 1,3-оксазол-5-ил, изотиазол-3-ил, изотиазол-4-ил, изотиазол-5-ил, 1,3-тиазол-2-ил, 1,3-тиазол-4-ил, 1,3-тиазол-5-ил, оксепинил, тиепинил, 1,2,4-триазолонил и 1,2,4-дiazепинил, 2H-1,2,3,4-тетразол-5-ил, 1H-1,2,3,4-тетразол-5-ил, 1,2,3,4-оксатриазол-5-ил, 1,2,3,4-тиатриазол-5-ил, 1,2,3,5-оксатриазол-4-ил, 1,2,3,5-тиатриазол-4-ил. Гетероарильные группы согласно изобретению могут далее замещаться одним или более одинаковыми или различными остатками. Если два соседних атома углерода являются компонентом другого ароматического кольца, то речь идет об анеллированных гетероароматических системах, как бензоконденсированные или несколько раз анеллированные гетероароматические соединения. Предпочтительными являются, например, хинолин (например, хинолин-2-ил, хинолин-3-ил, хинолин-4-ил, хинолин-5-ил, хинолин-6-ил, хинолин-7-ил, хинолин-8-ил); изохинолин (например, изохинолин-1-ил, изохинолин-3-ил, изохинолин-4-ил, изохинолин-5-ил, изохинолин-6-ил, изохинолин-7-ил, изохинолин-8-ил); хиноксалин; хиназолин; циннолин; 1,5-нафтиридин; 1,6-нафтиридин; 1,7-нафтиридин; 1,8-нафтиридин; 2,6-нафтиридин; 2,7-нафтиридин; фталазин; пиридопиразин; пиридопиримидин; пиридопиридазин; птеридин; пиримидопиримидин. Примерами гетероарила являются также 5- или 6-членные бензоконденсированные кольца из группы 1H-индол-1-ил, 1H-индол-2-ил, 1H-индол-3-ил, 1H-индол-4-ил, 1H-индол-5-ил, 1H-индол-6-ил, 1H-индол-7-ил, 1-бензофуран-2-ил, 1-бензофуран-3-ил, 1-бензофуран-4-ил, 1-бензофуран-5-ил, 1-

бензофуран-6-ил, 1-бензофуран-7-ил, 1-бензотиофен-2-ил, 1-бензотиофен-3-ил, 1-бензотиофен-4-ил, 1-бензотиофен-5-ил, 1-бензотиофен-6-ил, 1-бензотиофен-7-ил, 1Н-индазол-1-ил, 1Н-индазол-3-ил, 1Н-индазол-4-ил, 1Н-индазол-5-ил, 1Н-индазол-6-ил, 1Н-индазол-7-ил, 2Н-индазол-2-ил, 2Н-индазол-3-ил, 2Н-индазол-4-ил, 2Н-индазол-5-ил, 2Н-индазол-6-ил, 2Н-индазол-7-ил, 2Н-изоиндол-2-ил, 2Н-изоиндол-1-ил, 2Н-изоиндол-3-ил, 2Н-изоиндол-4-ил, 2Н-изоиндол-5-ил, 2Н-изоиндол-6-ил, 2Н-изоиндол-7-ил, 1Н-бензимидазол-1-ил, 1Н-бензимидазол-2-ил, 1Н-бензимидазол-4-ил, 1Н-бензимидазол-5-ил, 1Н-бензимидазол-6-ил, 1Н-бензимидазол-7-ил, 1,3-бензоксазол-2-ил, 1,3-бензоксазол-4-ил, 1,3-бензоксазол-5-ил, 1,3-бензоксазол-6-ил, 1,3-бензоксазол-7-ил, 1,3-бензтиазол-2-ил, 1,3-бензтиазол-4-ил, 1,3-бензтиазол-5-ил, 1,3-бензтиазол-6-ил, 1,3-бензтиазол-7-ил, 1,2-бензизоксазол-3-ил, 1,2-бензизоксазол-4-ил, 1,2-бензизоксазол-5-ил, 1,2-бензизоксазол-6-ил, 1,2-бензизоксазол-7-ил, 1,2-бензизотиазол-3-ил, 1,2-бензизотиазол-4-ил, 1,2-бензизотиазол-5-ил, 1,2-бензизотиазол-6-ил, 1,2-бензизотиазол-7-ил.

Понятие "галоген" означает, например, фтор, хлор, бром или йод. В случае использования понятия для обозначения остатка, "галоген" означает, например, атом фтора, хлора, брома или йода.

Согласно изобретению "алкил" означает с прямой цепью или разветвленный, насыщенный углеводородный остаток с открытой цепью, который при необходимости замещен один или более раз и в последнем случае называется "замещенным алкилом". Предпочтительными заместителями являются атомы галогена, алкокси-, галоалкокси-, циано-, алкилтио, галоалкилтио-, amino- или нитрогруппы, особенно предпочтительными являются метокси, метил, фторалкил, циано, нитро, фтор, хлор, бром или йод. Префикс "бис" также включает комбинации различных алкильных остатков, например, например, метил(этил) или этил(метил).

"Галоалкил", "-алкенил" и "-алкинил" означают частично или полностью замещенные одинаковыми или различными атомами галогена, алкил, алкенил или алкинил, например, моногалоалкил (= моногалогеналкил), как например,  $\text{CH}_2\text{CH}_2\text{Cl}$ ,  $\text{CH}_2\text{CH}_2\text{Br}$ ,  $\text{CHClCH}_3$ ,  $\text{CH}_2\text{Cl}$ ,  $\text{CH}_2\text{F}$ ; пергалоалкил, как например,  $\text{CCl}_3$ ,  $\text{CClF}_2$ ,  $\text{CFCl}_2$ ,  $\text{CF}_2\text{CClF}_2$ ,  $\text{CF}_2\text{CClFCF}_3$ ; полигалоалкил, как например,  $\text{CH}_2\text{CHFCl}$ ,  $\text{CF}_2\text{CClFH}$ ,  $\text{CF}_2\text{CBrFH}$ ,  $\text{CH}_2\text{CF}_3$ ; При этом понятие пергалоалкил также включает в себя понятие перфторалкил.

"Частично фторированный алкил" означает с прямой цепью или разветвленный, насыщенный углеводород, который замещен один или более раз фтором, причем соответствующие атомы фтора могут находиться в виде заместителей на одном или нескольких различных атомах углерода прямой или разветвленной углеводородной цепи, как например, как, например,  $\text{CHFCH}_3$ ,  $\text{CH}_2\text{CH}_2\text{F}$ ,  $\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CF}_3$ ,  $\text{CHF}_2$ ,  $\text{CH}_2\text{F}$ ,  $\text{CHFCH}_2\text{CF}_3$

"Частично фторированный галоалкил" означает с прямой цепью или разветвленный, насыщенный углеводород, который замещен различными атомами галогена, по меньшей мере, одним атомом фтора, причем все другие присутствующие при необходимости атомы галогена выбраны из группы фтора, хлора или брома, йода. При этом соответствующие атомы галогена могут находиться в качестве заместителей на одном или нескольких различных атомах углерода прямой или разветвленной углеводородной цепи. Частично фторированный галоалкил также включает полное замещение прямой или разветвленной цепи галогеном с участием, по меньшей мере, одного атома фтора.

"Галоалкокси" означает, например,  $\text{OCF}_3$ ,  $\text{OCHF}_2$ ,  $\text{OCH}_2\text{F}$ ,  $\text{OCF}_2\text{CF}_3$ ,  $\text{OCH}_2\text{CF}_3$  и  $\text{OCH}_2\text{CH}_2\text{Cl}$ ; эти значения, соответственно, также относятся к галоалкенилу и другим замещенным галогеном остаткам.

Например, понятие "(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-алкил" является сокращенным вариантом написания для алкила с прямой цепью или разветвленного алкила с 1 - 4 атомами углерода, соответственно данных области для C-атомов, т.е. содержит остатки метила, этила, 1-пропила, 2-пропила, 1-бутила, 2-бутила, 2-метилпропила или трет-бутила. Обычно алкильные остатки с областью C-атомов, которая превышает указанные значения, например, "(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-алкил", также соответственно содержат алкильные остатки с прямой цепью или разветвленные алкильные остатки, имеющие большее количество C-атомов, т.е. согласно примеру также алкильные остатки с 5 и 6 C-атомами.

Если не указано иное, то углеводородные остатки, как алкильные, алкенильные и алкинильные остатки, также в комбинированных остатках, низшие углеродные скелеты, например, с 1 - 6 C-атомами или в ненасыщенных группах с 2 - 6 C-атомами, предпочтительно алкильных остатках, также в таких комбинированных остатках, как алкокси, галоалкил и т.д., означают, например,

метил, этил, н- или изопропил, н-, изо-, трет- или 2-бутил, пентилы, гексилы, как н-гексил, изогексил и 1,3-диметилбутил, гептилы, как н-гептил, 1-метилгексил и 1,4-диметилпентил; алкенильные и алкинильные остатки означают ненасыщенные остатки, соответствующие алкильным остаткам, причем присутствует, по меньшей мере, одна двойная или тройная связь. Предпочтительными являются остатки с одной двойной или тройной связью.

Понятие "алкенил" также особенно предпочтительно включает в себя углеводородный остаток с прямой цепью или разветвленный углеводородный остаток с открытой цепью, имеющий более одной двойной связи, как 1,3-бутадиенил и 1,4-пентадиенил, а также алленильные или кумуленильные остатки с одной или несколькими двойными связями, как, например, алленил (1,2-пропадиенил), 1,2-бутадиенил и 1,2,3-пентатриенил. Алкенил означает, например, винил, который, при необходимости, может быть замещен дополнительным алкильным остатком, например, (но не ограничиваясь) (C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)-алкенил, как этенил, 1-пропенил, 2-пропенил, 1-метилэтенил, 1-бутенил, 2-бутенил, 3-бутенил, 1-метил-1-пропенил, 2-метил-1-пропенил, 1-метил-2-пропенил, 2-метил-2-пропенил, 1-пентенил, 2-пентенил, 3-пентенил, 4-пентенил, 1-метил-1-бутенил, 2-метил-1-бутенил, 3-метил-1-бутенил, 1-метил-2-бутенил, 2-метил-2-бутенил, 3-метил-2-бутенил, 1-метил-3-бутенил, 2-метил-3-бутенил, 3-метил-3-бутенил, 1,1-диметил-2-пропенил, 1,2-диметил-1-пропенил, 1,2-диметил-2-пропенил, 1-этил-1-пропенил, 1-этил-2-пропенил, 1-гексенил, 2-гексенил, 3-гексенил, 4-гексенил, 5-гексенил, 1-метил-1-пентенил, 2-метил-1-пентенил, 3-метил-1-пентенил, 4-метил-1-пентенил, 1-метил-2-пентенил, 2-метил-2-пентенил, 3-метил-2-пентенил, 4-метил-2-пентенил, 1-метил-3-пентенил, 2-метил-3-пентенил, 3-метил-3-пентенил, 4-метил-3-пентенил, 1-метил-4-пентенил, 2-метил-4-пентенил, 3-метил-4-пентенил, 4-метил-4-пентенил, 1,1-диметил-2-бутенил, 1,1-диметил-3-бутенил, 1,2-диметил-1-бутенил, 1,2-диметил-2-бутенил, 1,2-диметил-3-бутенил, 1,3-диметил-1-бутенил, 1,3-диметил-2-бутенил, 1,3-диметил-3-бутенил, 2,2-диметил-3-бутенил, 2,3-диметил-1-бутенил, 2,3-диметил-2-бутенил, 2,3-диметил-3-бутенил, 3,3-диметил-1-бутенил, 3,3-диметил-2-бутенил, 1-этил-1-бутенил, 1-этил-2-бутенил, 1-этил-3-бутенил, 2-этил-1-бутенил, 2-этил-2-бутенил, 2-этил-3-бутенил, 1,1,2-триметил-2-пропенил, 1-этил-1-метил-2-пропенил, 1-этил-2-метил-1-пропенил и 1-этил-2-метил-2-пропенил.

Понятие "алкинил" также, в частности, включает в себя углеводородные остатки с прямой цепью или разветвленные углеводородные остатки с открытой цепью, имеющие более одной тройной связи, или также имеющие одну или более тройных связей и одну или более двойных связей, как, например, 1,3-бутатриенил или 3-пентен-1-ин-1-ил. (C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)-алкинил означает например, этинил, 1-пропинил, 2-пропинил, 1-бутинил, 2-бутинил, 3-бутинил, 1-метил-2-пропинил, 1-пентинил, 2-пентинил, 3-пентинил, 4-пентинил, 1-метил-2-бутинил, 1-метил-3-бутинил, 2-метил-3-бутинил, 3-метил-1-бутинил, 1,1-диметил-2-пропинил, 1-этил-2-пропинил, 1-гексинил, 2-гексинил, 3-гексинил, 4-гексинил, 5-гексинил, 1-метил-2-пентинил, 1-метил-3-пентинил, 1-метил-4-пентинил, 2-метил-3-пентинил, 2-метил-4-пентинил, 3-метил-1-пентинил, 3-метил-4-пентинил, 4-метил-1-пентинил, 4-метил-2-пентинил, 1,1-ди-метил-2-бутинил, 1,1-диметил-3-бутинил, 1,2-диметил-3-бутинил, 2,2-диметил-3-бутинил, 3,3-диметил-1-бутинил, 1-этил-2-бутинил, 1-этил-3-бутинил, 2-этил-3-бутинил и 1-этил-1-метил-2-пропинил.

Понятие "циклоалкил" означает карбоциклическую, насыщенную кольцевую систему, предпочтительно, с 3-8 кольцевыми C-атомами, например, циклопропил, циклобутил, циклопентил или циклогексил, которая, при необходимости, также может быть замещена предпочтительно водородом, алкилом, алкокси, циано, нитро, алкилтио, галоалкилтио, галогеном, алкенилом, алкинилом, галоалкилом, амино, алкиламино, бисалкиламино, алкоксикарбонилем, гидроксикарбонилем, арилалкоксикарбонилем, аминокарбонилем, алкиламинокарбонилем, циклоалкиламинокарбонилем. Если, при необходимости, присутствует замещенный циклоалкил, то также содержится циклическая система с заместителями, причем также присутствуют заместители с двойной связью на циклоалкильном остатке, например, такая алкилиденная группа, как метилиден. Если присутствует замещенный, при необходимости, циклоалкил, то также содержатся многоциклические алифатические системы, как, например, бицикло[1.1.0]бутан-1-ил, бицикло[1.1.0]бутан-2-ил, бицикло[2.1.0]пентан-1-ил, бицикло[1.1.1]пентан-1-ил, бицикло[2.1.0]пентан-2-ил, бицикло[2.1.0]пентан-5-ил, бицикло[2.1.1]гексил, бицикло[2.2.1]гепт-2-ил, бицикло[2.2.2]октан-2-ил, бицикло[3.2.1]октан-2-ил, бицикло[3.2.2]нонан-2-ил, адамантан-1-ил и адамантан-2-ил, а также системы, как например, 1,1'-би(циклопропил)-1-ил, 1,1'-би(циклопропил)-2-ил. Понятие "(C<sub>3</sub>-C<sub>7</sub>)-циклоалкил"

означает сокращенный вариант написания для циклоалкила, содержащего 3 - 7 атомов углерода в соответствии с диапазонами значений для С-атомов.

Если присутствует замещенный циклоалкил, то также содержится спироциклическая алифатическая система, как, например, как, например, спиро[2.2]пент-1-ил, спиро[2.3]гекс-1-ил, спиро[2.3]гекс-4-ил, 3-спиро[2.3]гекс-5-ил, спиро[3.3]гепт-1-ил, спиро[3.3]гепт-2-ил.

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

Понятие "алкилиден", например, также в форме (C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub>)-алкилидена, означает остаток с прямой цепью или разветвленного с открытой цепью углеводородного остатка, который связан с помощью двойной связи. Естественно в качестве мест соединений для алкилиденов принимают во внимание только позиции на основном веществе, на которых два Н-атома могут быть замещены двойным соединением; остатками являются, например, =CH<sub>2</sub>, =CH-CH<sub>3</sub>, =C(CH<sub>3</sub>)-CH<sub>3</sub>, =C(CH<sub>3</sub>)-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub> или =C(C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>)-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>. Циклоалкилиден означает карбоциклический остаток, который соединен с помощью двойного соединения.

Понятие "алкилен", например, также в форме (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-алкилена, означает остаток с прямой цепью или разветвленного с открытой цепью углеводородного остатка, который в двух местах связан с другими группами.

"Циклоалкилалкилокси" означает связанный через атом кислорода циклоалкилалкильный остаток, и "арилалкилокси" означает связанный через атом кислорода арилалкильный остаток.

"Алкоксиалкил" означает связанный через алкильную группу алкокси-остаток, и "алкоксиалкокси" означает связанный через атом кислорода

алкоксиалкильный остаток, например, (но не ограничиваясь) метоксиметокси, метоксиэтокси, этоксиэтокси, метокси-н-пропилокси.

"Алкилтиоалкил" означает связанный через алкильную группу алкилтио-остаток, и "алкилтиоалкилтио" означает связанный через атом кислорода алкилтиоалкильный остаток.

"Арилалкоксиалкил" означает связанный через алкильную группу арилокси-остаток, и "гетероарилоксиалкил" означает связанный через алкильную группу гетероарилокси-остаток.

"Галоалкоксиалкил" означает связанный через алкильную группу галоалкокси-остаток, и "галоалкилтиоалкил" означает связанный через алкильную группу галоалкилтио-остаток.

"Арилалкил" означает связанный через алкильную группу арильный остаток, "гетероарилалкил" означает связанный через алкильную группу гетероарильный остаток, и "гетероциклилалкил" означает связанный через алкильную группу гетероциклильный остаток.

"Циклоалкилалкил" означает связанный через алкильную группу циклоалкильный остаток, например, (но не ограничиваясь) циклопропилметил, циклобутилметил, циклопентилметил, циклогексилметил, 1-циклопропилэт-1-ил, 2-циклопропилэт-1-ил, 1-циклопропилпроп-1-ил, 3-циклопропилпроп-1-ил.

"Арилалкенил" означает связанный через алкенильную группу арильный остаток, "гетероарилалкенил" означает связанный через алкенильную группу гетероарильный остаток, и "гетероциклилалкенил" означает связанный через алкенильную группу гетероциклильный остаток.

"Арилалкинил" означает связанный через алкинильную группу арильный остаток, "гетероарилалкинил" означает связанный через алкинильную группу гетероарильный остаток, и "гетероциклилалкинил" означает связанный через алкинильную группу гетероциклильный остаток.

Согласно изобретению "галоалкилтио" означает - отдельно или в качестве компонента химической группы - с прямой или разветвленной цепью S-галогеналкил, предпочтительно с 1 - 8, или 1 - 6 атомами углерода, как (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)- или (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-галоалкилтио, например, (но не ограничиваясь) трифторметилтио,

пентафторэтилтио, дифторметил, 2,2-дифторэт-1-илтио, 2,2,2-дифторэт-1-илтио, 3,3,3-проп-1-илтио.

"Галоциклоалкил" и "галоциклоалкенил" частично или полностью замещенные одинаковыми или различными атомами галогена, как, например, F, Cl и Br, или галоалкилом, как, например, трифторметил или дифторметил частично или полностью замещенный циклоалкил или циклоалкенил, например, 1-фторциклопроп-1-ил, 2-фторциклопроп-1-ил, 2,2-дифторциклопроп-1-ил, 1-фторциклобут-1-ил, 1-трифторметилциклопроп-1-ил, 2-трифторметилциклопроп-1-ил, 1-хлор-циклопроп-1-ил, 2-хлорциклопроп-1-ил, 2,2-дихлорциклопроп-1-ил, 3,3-дифторциклобутил,

Согласно изобретению "триалкилсиллил" означает - отдельно или в качестве компонента химической группы - с прямой или разветвленной цепью Si-галогеналкил, предпочтительно с 1 - 8, или 1 - 6 атомами углерода, как три-[(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)- или (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-алкил]силлил, например, (но не ограничиваясь) триметилсиллил, триэтилсиллил, три-(н-пропил)силлил, три-(изопропил)силлил, три-(н-бутил)силлил, три-(1-метилпроп-1-ил)силлил, три-(2-метилпроп-1-ил)силлил, три(1,1-диметилэт-1-ил)силлил, три(2,2-диметилэт-1-ил)силлил.

"Триалкилсиллилалкинил" означает соединенный алкинильной группой триалкилсиллильный остаток.

Синтез замещенных N-фенил-N-аминоурацилов общей формулы (I).

Замещенные N-фенил-N-аминоурацилы общей формулы (I) согласно изобретению можно получать с помощью известных способов.

При этом применяемые и исследованные пути синтеза используют имеющиеся в продаже или несложные в изготовлении компоненты синтеза. За исключением случаев, когда они приведены в качестве примера, группировки Q, R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup>, R<sup>3</sup>, R<sup>4</sup>, R<sup>5</sup>, R<sup>6</sup>, R<sup>7</sup>, R<sup>15</sup>, R<sup>16</sup>, X и Y общей формулы (I) в следующих схемах имеют ранее определенные значения, но не ограничиваются ими. Синтез соединений общей формулы (I) происходит с использованием различных основных промежуточных соединений. Ключевые промежуточные соединения (III), в рамках которых указанные в качестве неограничивающего примера группы R<sup>15</sup> и R<sup>16</sup>, означают водород, а X, указанный в качестве неограничивающего примера, означает серу (S), например, 3-(4-хлор-2-фтор-5-меркаптофенил)-1-амино-6-

трифторметил-1H-пиримидин-2,4-дион (IIIa), можно получить различными способами синтеза (см. US5935907, WO2004/56785, US2004/186021, WO2002/006244). При этом подходящий фталимид используют в качестве защитной группы N-аминогруппы. N-аминогруппа может высвободиться за счет расщепления фталимида (например, при помощи гидразина). Альтернативно, необходимое промежуточное соединение (III) может быть также получено в качестве основного промежуточного соединения путем прямого N-аминирования. Для этого подходящий замещенный анилин, включая, помимо прочего, 2-фтор-4-хлоранилин, вместе с соответствующим реагентом (например, трифосгеном) в составе подходящего полярно-апротического растворителя (например, дихлорметана) преобразуется в соответствующий изоцианат, который на следующем этапе, путем взаимодействия с подходящим эфиром аминокриловой кислоты, например, этил-(2Z)-3-амино-4,4,4-трифторбут-2-еноатом, путем применения соответствующего основания (например, гидроксида натрия или калий-трет-бутилата) в составе подходящего полярно-апротического растворителя (например, N,N-диметилформамид), преобразуется в соответствующий при необходимости замещенный пиримидин-2,4-дион, включая, помимо прочего, 3-(4-хлор-2-фторфенил)-6-трифторметил-1H-пиримидин-2,4-дион (Схема 1). Необходимый эфиром аминокриловой кислоты, например, этил-(2Z)-3-амино-4,4,4-трифторбут-2-еноат, можно получить путем аминирования соответствующего, при необходимости замещенного 3-оксобутаноата, например, этил-4,4,4-трифтор-3-оксобутаноата, при помощи соответствующего источника азота (например, ацетата аммония) в составе соответствующего полярно-протического растворителя (например, этанола) при повышенных значениях температуры. После этого выполняют аминирование с применением соответствующего реагента для аминирования (например, O-(мезитилсульфонил)-гидроксиламина, O-(толилсульфонил)гидроксиламина, O-(дифенилфосфорил)-гидроксиламина), а также введение SH-группы посредством хлорсульфонирования и последующего восстановления с использованием подходящего восстановителя (например, хлорида олова в кислотном растворителе, таком как, например, уксусная кислота). Еще одна возможность получить промежуточные соединения (III) заключается в преобразовании соответствующего эфира аминокриловой кислоты, например, этил-(2Z)-3-амино-4,4,4-трифторбут-2-еноата, при помощи диметилкарбамилхлорида в N,N-диметилформамид (ДМФ) с

использованием соответствующего основания (например, гидрида натрия или калий-трет-бутилата) и последующем преобразовании при помощи 2-фтор-4-хлоранилина в соответствующем кислотном растворителе (например, уксусной кислоте) при повышенной температуре. Полученный 3-(4-хлор-2-фторфенил)-6-трифторметил-1Н-пиримидин-2,4-дион также может быть преобразован в обратном порядке, путем введения SH-группы, введения защитной S-тритилгруппы, N-аминирования с использованием одного из указанных выше соответствующих реагентов для анимирования и последующего расщепления защитной S-тритилгруппы на необходимое промежуточное соединение (III). На представленной ниже Схеме 1 R<sup>1</sup> в качестве неограничивающего примера означает водород, R<sup>2</sup> в качестве неограничивающего примера означает фтор, R<sup>3</sup> в качестве неограничивающего примера означает фтор, R<sup>4</sup> в качестве неограничивающего примера означает хлор, и R<sup>15</sup>, R<sup>16</sup> в качестве неограничивающего примера означают водород.

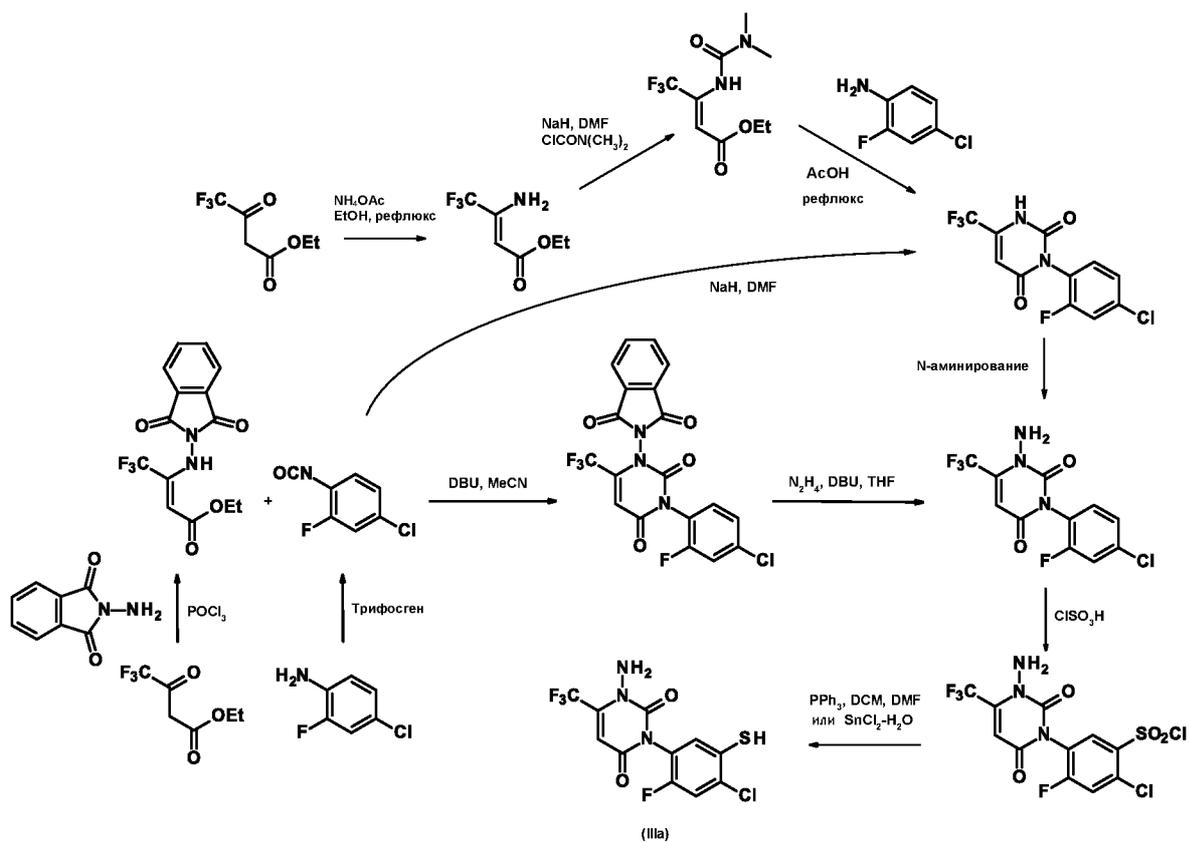


Схема 1.

Для обеспечения более длительного хранения промежуточных соединений (III) или описанной выше альтернативной последовательности протекания реакции

предпочтительной является защита меркаптогруппы при помощи соответствующей защитной тиогруппы (например, тритила). Защита меркаптогруппы может быть снята при помощи соответствующих реагентов (например, трифтор-уксусной кислоты, триизопропилсилана) (см. схему 2). Рассматриваемые промежуточные далее замещенные N-амино-5-меркаптофенил-1Н-пиримидин-2,4-дионы (III) в силу этого могут быть различными способами преобразованы в необходимые соединения общей формулы (Ia) согласно изобретению (Схема 2), для которых X означает серу (S), а Y – кислород (O), после того, как соединения (III) в рамках первого этапа были преобразованы в промежуточные соединения (IV) при помощи соответствующего при необходимости замещенного йод-пиридона с использованием соответствующего основания или соответствующего катализатора переходных металлов (например, трис(дибензилиденацетон)дипалладий(0)) с соответствующим лигандом (например, 4,5-бис(дифенилфосфино)-9,9-диметилксантен) и с соответствующим основанием (например, дииспропил(этил)амином) в соответствующем полярно-апротическом растворителе (например, диоксане). На приведенной ниже Схеме 2,  $R^1$ ,  $R^2$ ,  $R^3$ ,  $R^4$ ,  $R^{15}$  и  $R^{16}$  имеют значения согласно изобретению, приведенные выше. Далее по тексту  $R^5$ ,  $R^6$ ,  $R^7$  означают, помимо прочего, водород; X, помимо прочего, означает серу; Y, помимо прочего, означает кислород, а G, помимо прочего, означает  $CH_2$ .

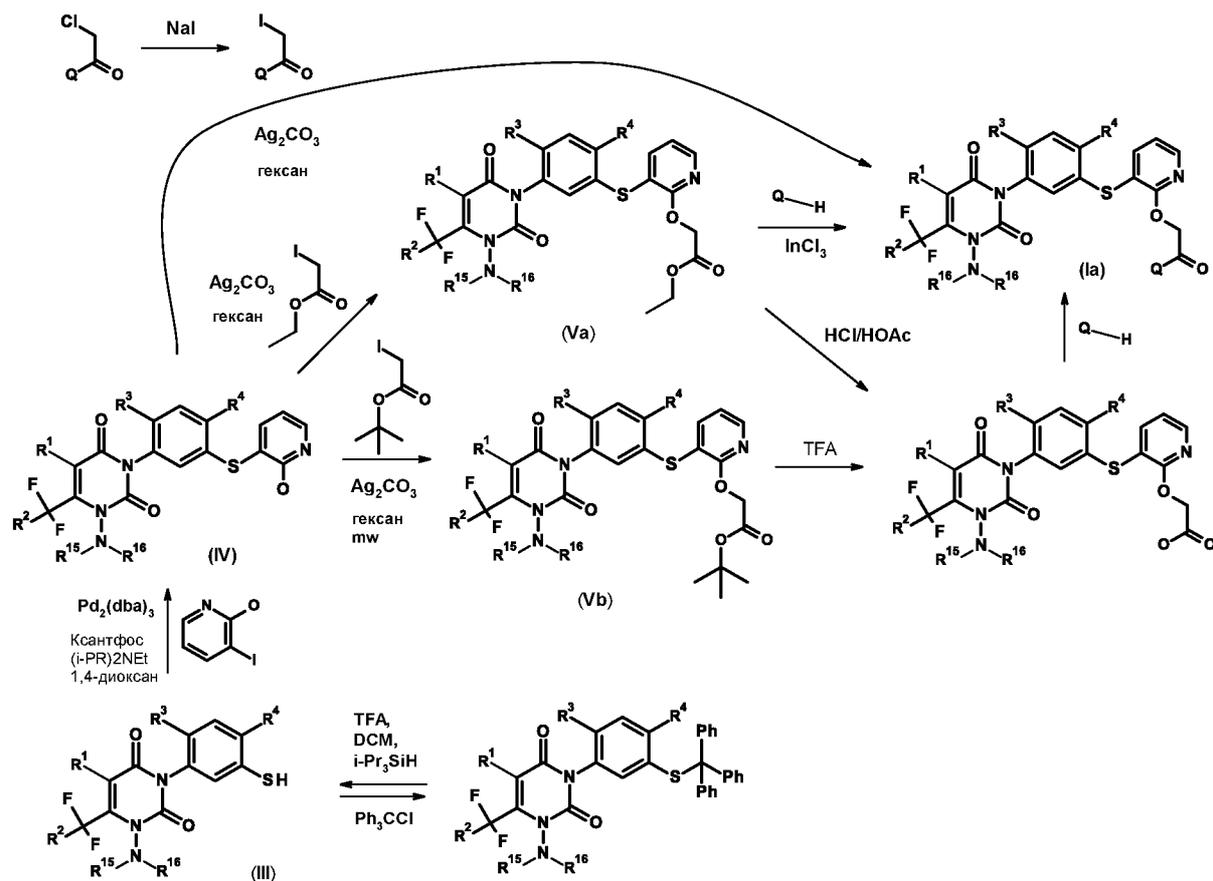


Схема 2

Приведенное в качестве неограничивающего примера и указанное на Схеме 2 промежуточное соединение (IV) может быть преобразовано посредством взаимодействия с соответствующим при необходимости замещенным эфиром йод-алкановой кислоты (на Схеме 2 указан в качестве неограничивающего примера как эфир йод-уксусной кислоты) с использованием соответствующего основания (например, карбоната серебра(I)) в полярно-апротическом растворителе (например, н-гексане или циклопентане) при повышенной температуре (например, в микроволновых условиях) в соответствующий при необходимости замещенный эфир окси-алкановой кислоты (Va, Vb) (см. *Synthesis* 2009, 2725). Соответствующий эфир йод-алкановой кислоты можно получить способами, описанными в литературе (см. *Eur. J. Org. Chem.*, 2006, 71, 8459; WO2012037573; *Organometallics*, 2009, 28, 132). Указанный в качестве неограничивающего примера этиловый эфир (Va) и трет-бутиловый эфир (Vb) затем могут быть преобразованы в соответствующие свободные кислоты общей формулы (Ia) при подходящих условиях протекания реакции [применение соответствующих кислот, как, например, соляная кислота или уксусная кислота в случае с (Va) или

трифторуксусная кислота (TFA) в случае с (Vb)]. Посредством реакции соответствующих кислот, указанных в качестве неограничивающего примера на Схеме 2, с соответствующим соединением Q-H при посредничестве соответствующих реагентов реакции сочетания (например, HOBt = 1-гидроксibenзотриазол, EDC = 1-этил-3-(3-диметиламинопропил)карбодиимид, HATU = O-(7-азабензотриазол-1-ил)-N,N,N',N'-тетраметилуроний-гексафторфосфат, T3P = 2,4,6-трипропил-1,3,5,2,4,6-триоксатрифосфоринан-2,4,6-триоксид) и соответствующими основаниями (например, диизопропилэтиламино, триэтиламино) в соответствующем полярно-апротическом растворителе (например, дихлорметане, хлороформе), можно получить необходимые замещенные N-фенил-N-аминоурацилы общей формулы (Ia). Альтернативно, указанный в качестве неограничивающего примера на Схеме 2 этиловый эфир (Va) можно преобразовать в соответствующий необходимый замещенный N-фенил-N-аминоурацил общей формулы (Ia) путем реакции сочетания с соответствующим соединением Q-H при посредничестве соответствующей кислоты Льюиса (например, хлорида индия(III) (см. WO2011/1307088).

Получение соединений общей формулы (I), в которых группы R<sup>15</sup> и R<sup>16</sup> означают водород, а X и Y в качестве неограничивающего примера означают кислород (O), осуществляется путем синтеза основных промежуточных соединений (VI) с заместителем фтора в позиции 5, как, например, 3-(2,5-дифтор-4-нитро)-1-амино-6-трифторметил-1H-пиримидин-2,4-дион (VIa). При этом подходящий фталимид можно использовать в качестве защитной группы для аминогруппы, либо получить необходимое промежуточное соединение (VI) путем прямого N-аминирования на ключевом этапе. При применении синтеза с применением фталимида необходимую N-аминогруппу можно высвободить за счет расщепления фталимида после успешного формирования замещенного пиримидин-2,4-диона (например, при помощи гидразина). При проведении N-аминирования в качестве ключевого этапа подходящий замещенный анилин, указанный в качестве неограничивающего примера, 2,5-дифторанилин вместе с соответствующим реагентом (например, трифосгеном) в составе подходящего полярно-апротического растворителя (например, дихлорметана) преобразуется в соответствующий изоцианат, который на следующем этапе, путем взаимодействия с подходящим эфиром аминокриловой кислоты путем применения

соответствующего основания (например, гидроксида натрия или калий-трет-бутилата) в составе подходящего полярно-апротического растворителя (например, N,N-диметилформамида), преобразуется в соответствующий при необходимости замещенный пиримидин-2,4-дион, указанный в качестве неограничивающего примера 3-(2,5-дифторфенил)-6-трифторметил-1H-пиримидин-2,4-дион (Схема 3). Необходимый 3-(2,5-дифтор-4-нитро)-1-амино-6-трифторметил-1H-пиримидин-2,4-дион (VIa) можно получить путем нитрирования подходящим нитрующим агентом или путем последующего N-аминирования с использованием подходящего аминирующего агента (например, O-(мезитилсульфонила)-гидроксиламина, O-(толилсульфонила)гидроксиламина, O-(дифенилфосфорил)гидроксиламина, O-(2,4-динитрофенила)гидроксиламина). На представленной ниже Схеме 3 R<sup>1</sup> означает указанный в качестве неограничивающего примера водород, R<sup>2</sup> означает указанный в качестве неограничивающего примера фтор, R<sup>3</sup> означает указанный в качестве неограничивающего примера фтор и R<sup>4</sup> означает указанный в качестве неограничивающего примера азот.

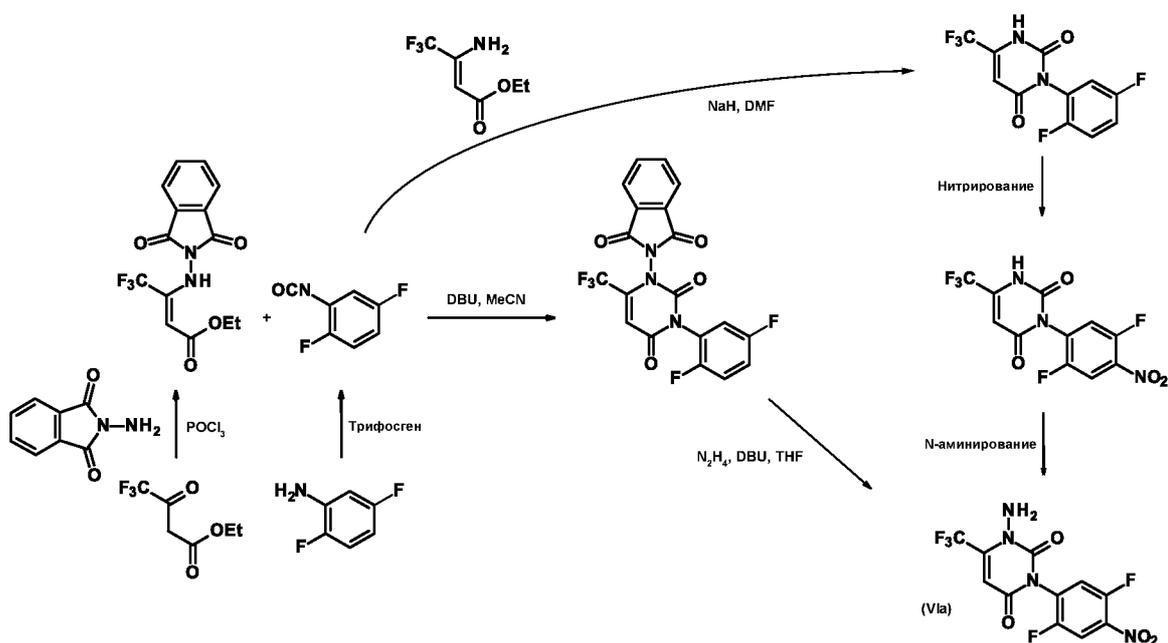


Схема 3.

Функционализация 3-(2,5-дифтор-4-нитро)-1-амино-6-трифторметил-1H-пиримидин-2,4-диона (VIa), согласно методикам, известным специалистам, происходит за счет замены одной функциональной группы на другую – к примеру,

моноалкилирование ( $R^{15} = H$ ,  $R^{16} = \text{алкил}$ ), бисалкилирование ( $R^{15} = \text{алкил}$ ,  $R^{16} = \text{алкил}$ ) - и ниже представлена на Схеме 3b.

$R^1$  и  $R^2$  имеют указанные выше значения согласно изобретению.

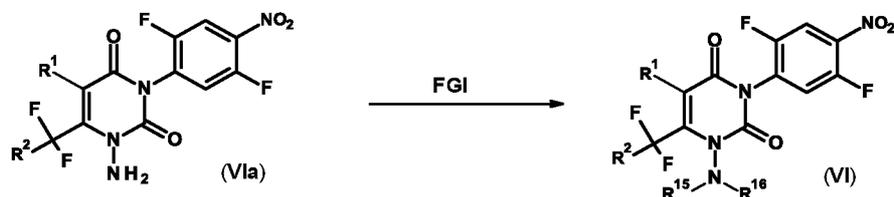


Схема 3b

Промежуточное соединение (VI), полученное указанным выше образом, при помощи соответствующего замещенного 2-карбонилалкилокси-3-гидроксипиридина (VII) с использованием соответствующего основания (например, карбоната калия) в соответствующем полярно-апротическом растворителе (например, *N,N*-диметилформамиде (DMF)) может быть преобразовано в *N*-фенил-*N*-аминоурацил (Ib,  $R^4 = \text{нитро}$ ). Применяемое для этих целей промежуточное соединение (VII) может быть получено путем многостадийного синтеза на основе имеющегося в продаже 2-хлор-3-нитропиридина путем (i) опосредованной основанием реакции сочетания (например, с гидридом натрия) с соответствующим замещенным гидроксиалкилкарбонил-реагентом в соответствующем полярно-апротическом растворителе (например, тетрагидрофуране или диоксане), (ii) восстановления нитрогруппы при помощи соответствующего восстановителя (например, водорода, палладия на угле в соответствующем полярно-апротическом растворителе), (iii) диазотирования (при помощи соответствующего диазотирующего агента, например, трет-бутилнитрита (трет-BuONO), эфирата трехфтористого бора ( $\text{BF}_3 \cdot \text{OEt}_2$ ) в соответствующем полярно-апротическом растворителе (например, дихлорметане (DCM), диметоксиэтаноле), (iv) преобразования при помощи укусного ангидрида и (v) высвобождения гидроксигруппы путем отделения защитной ацетилгруппы (например, опосредованного основанием с использованием карбоната калия в полярно-апротическом растворителе). В случае если  $\text{NR}^{15}\text{R}^{16}$  не является  $\text{NH}_2$ , нитрогруппу в соединении (Ib) можно затем преобразовать в заместители галогена (например, хлор, бром) путем реакции восстановления и последующей реакции Зандмейера, таким образом получив

необходимый замещенный N-фенил-N-аминоурацил (Ic). На приведенной ниже Схеме 4 Q, R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup>, R<sup>15</sup> и R<sup>16</sup> имеют значения согласно изобретению, приведенные выше. Далее по тексту R<sup>3</sup>, указанный в качестве неограничивающего примера, означает фтор, R<sup>4</sup>, указанный в качестве неограничивающего примера, означает хлор или нитро, R<sup>5</sup>, R<sup>6</sup>, R<sup>7</sup>, указанные в качестве неограничивающего примера, означают водород, X и Y, указанные в качестве неограничивающего примера, означают кислород, а G, указанный в качестве неограничивающего примера, означает CH<sub>2</sub>.

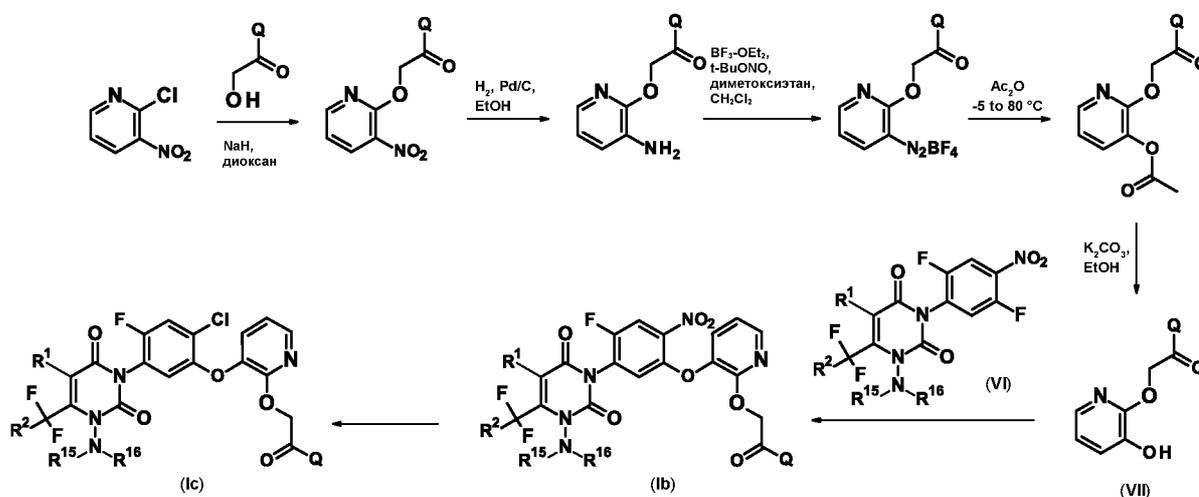


Схема 4.

Промежуточное соединение (VI), полученное указанным выше образом, при помощи соответствующего замещенного 2-карбонилалкилтио-3-гидроксипиридина (VIII) с использованием соответствующего основания (например, карбоната калия) в соответствующем полярно-апротическом растворителе (например, N,N-диметилформамиде (DMF)) может быть преобразовано в N-фенил-N-аминоурацил (Ib, R<sup>4</sup> = нитро) при помощи X=O (кислород) и Y=S (сера). Применяемое для этих целей промежуточное соединение (VIII) может быть получено путем многостадийного синтеза промежуточного соединения (VII), показанного на Схеме 4, на основе имеющегося в продаже 2-хлор-3-нитропиридина. В случае если NR<sup>15</sup>R<sup>16</sup> не является NH<sub>2</sub>, нитрогруппу в соединении (Ib) можно затем преобразовать в заместители галогена (например, хлор, бром) путем реакции восстановления и последующей реакции Зандмейера, таким образом получив необходимый замещенный N-фенил-N-аминоурацил (Ic). На приведенной ниже Схеме 5 Q, R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup>, R<sup>15</sup> и R<sup>16</sup> имеют значения согласно

изобретению, приведенные выше. Далее по тексту  $R^3$ , указанный в качестве неограничивающего примера, означает фтор,  $R^4$ , указанный в качестве неограничивающего примера, означает хлор или нитро,  $R^5$ ,  $R^6$ ,  $R^7$ , указанные в качестве неограничивающего примера, означают водород, X, указанный в качестве неограничивающего примера, означают кислород, Y, указанный в качестве неограничивающего примера, означает серу, а G, указанный в качестве неограничивающего примера, означает  $CH_2$ .

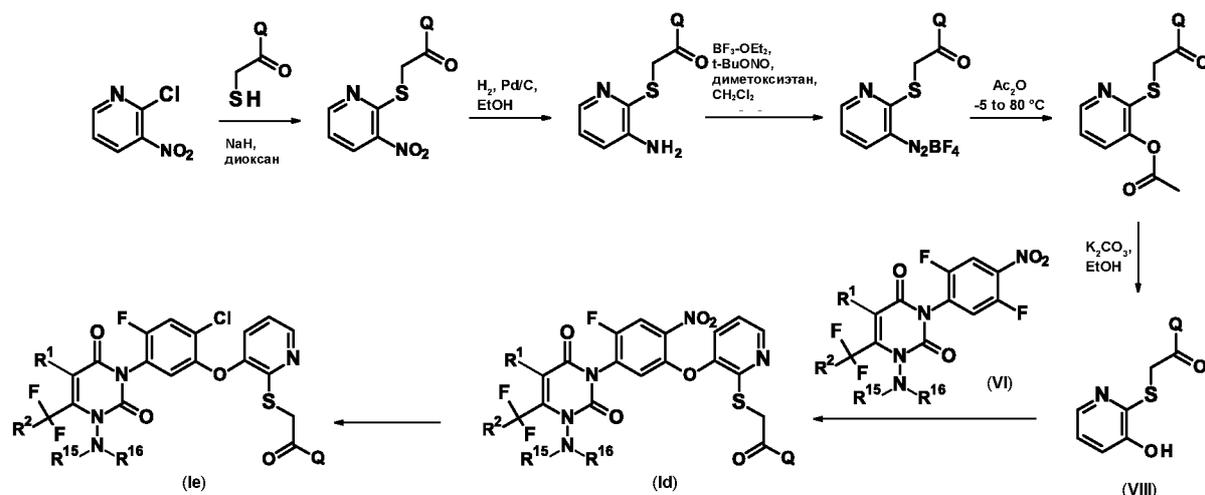


Схема 5.

Промежуточные далее замещенные N-амино-5-меркаптофенил-1H-пиримидин-2,4-дионы (III) могут быть преобразованы в необходимые соединения общей формулы (If) согласно изобретению (Схема 6), для которых X и Y означают серу (S), после того, как соединения (III) в рамках первого этапа были преобразованы в промежуточные соединения типа (IX) при помощи соответствующего при необходимости замещенного йод-тиопиридина с использованием соответствующего основания или соответствующего катализатора переходных металлов (например, трис(добензилиденацетон)дипалладия(0) с соответствующим лигандом (например, 4,5-бис(дифенилфосфино)-9,9-диметилксантоном) и с соответствующим основанием (например, дииспропил(этил)амином) в соответствующем полярно-апротическом растворителе (например, диоксане). Промежуточные соединения затем при помощи различным образом замещенных галогеналканкарбоновых кислот с использованием соответствующих оснований могут быть преобразованы в необходимые соединения общей формулы (If). На приведенной ниже Схеме 6,  $R^1$ ,

$R^2$ ,  $R^3$ ,  $R^4$ ,  $R^{15}$  и  $R^{16}$  имеют значения согласно изобретению, приведенные выше. Далее по тексту  $R^5$ ,  $R^6$ ,  $R^7$ , указанные в качестве неограничивающего примера, означают водород, X и Y, указанные в качестве неограничивающего примера, означают серу, а G, указанный в качестве неограничивающего примера, означает  $\text{CH}_2$ . Ниже на Схеме 6, для большей ясности, в качестве неограничивающего примера описаны пути реакции для йодуксусной кислоты. Для реакции сочетания с промежуточным соединением (IX) подходят также аналогичные галогеналканкарбоновые кислоты (галоген = бром или хлор).

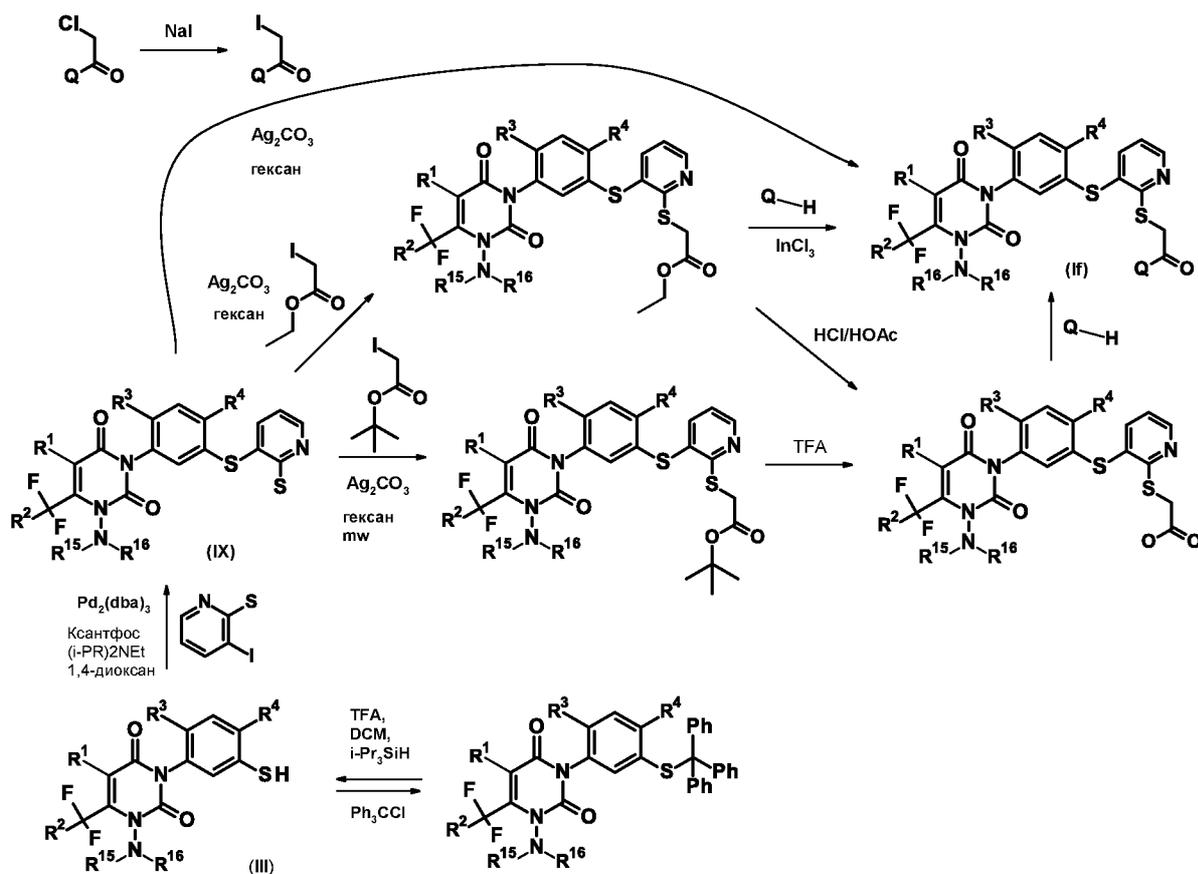


Схема 6.

Соединения общей формулы (I), в которых группы  $R^{15}$  и  $R^{16}$  означают водород, а X и Y, в качестве неограничивающего примера, означают кислород (O), получают посредством N-аминирования в качестве ключевого этапа. Для этого подходящий замещенный анилин, указанный в качестве неограничивающего примера, 2,5-дифторанилин вместе с соответствующим реагентом (например, трифосгеном) в составе подходящего полярно-апротического растворителя (например, дихлорметана) преобразуется в соответствующий изоцианат, который на следующем этапе, путем взаимодействия с подходящим эфиром

аминоакриловой кислоты путем применения соответствующего основания (например, гидрида натрия или калий-трет-бутилата) в составе подходящего полярно-апротического растворителя (например, N,N-диметилформаида), преобразуется в соответствующий при необходимости замещенный пиримидин-2,4-дион, указанный в качестве неограничивающего примера 3-(2,5-дифторфенил)-6-галоалкил-1H-пиримидин-2,4-дион. Необходимое промежуточное соединение, в качестве неограничивающего примера которого на Схеме 7 указан 3-(2,5-дифтор-4-нитро)-1-амино-6-галоалкил-1H-пиримидин-2,4-дион (X), можно получить путем нитрирования подходящим нитрующим агентом. Промежуточное соединение (X), полученное указанным выше образом, при помощи соответствующего замещенного 2-карбонилалкилокси-3-гидроксипиридина (VII) с использованием соответствующего основания (например, карбоната калия) в соответствующем полярно-апротическом растворителе (например, N,N-диметилформаида (DMF)) может быть преобразовано в N-фенил-1H-урацил ( $R^4 =$  нитро). Нитрогруппу в соединении (XIa) можно затем преобразовать в заместители галогена (например, хлор, бром) путем реакции восстановления и последующей реакции Зандмейера, таким образом получив необходимый замещенный N-фенил-1H-урацил (XIb). Впоследствии посредством N-аминирования соответствующего реагента для аминирования (например, O-(мезитилсульфонил)-гидроксиламина, O-(толилсульфонил)гидроксиламина, O-(дифенилфосфорил)гидроксиламина или O-(2,4-динитрофенил)гидроксиламина), он преобразуется в необходимый замещенный N-фенил-N аминоурацил (Ig).

На приведенной ниже Схеме 7 Q,  $R^1$  и  $R^2$  имеют значения согласно изобретению, приведенные выше. Далее по тексту  $R^4$ , указанный в качестве неограничивающего примера, означает хлор,  $R^5$ ,  $R^6$ ,  $R^7$ , указанные в качестве неограничивающего примера, означают водород, X и Y, указанные в качестве неограничивающего примера, означают кислород, а G, указанный в качестве неограничивающего примера, означает  $CH_2$ .

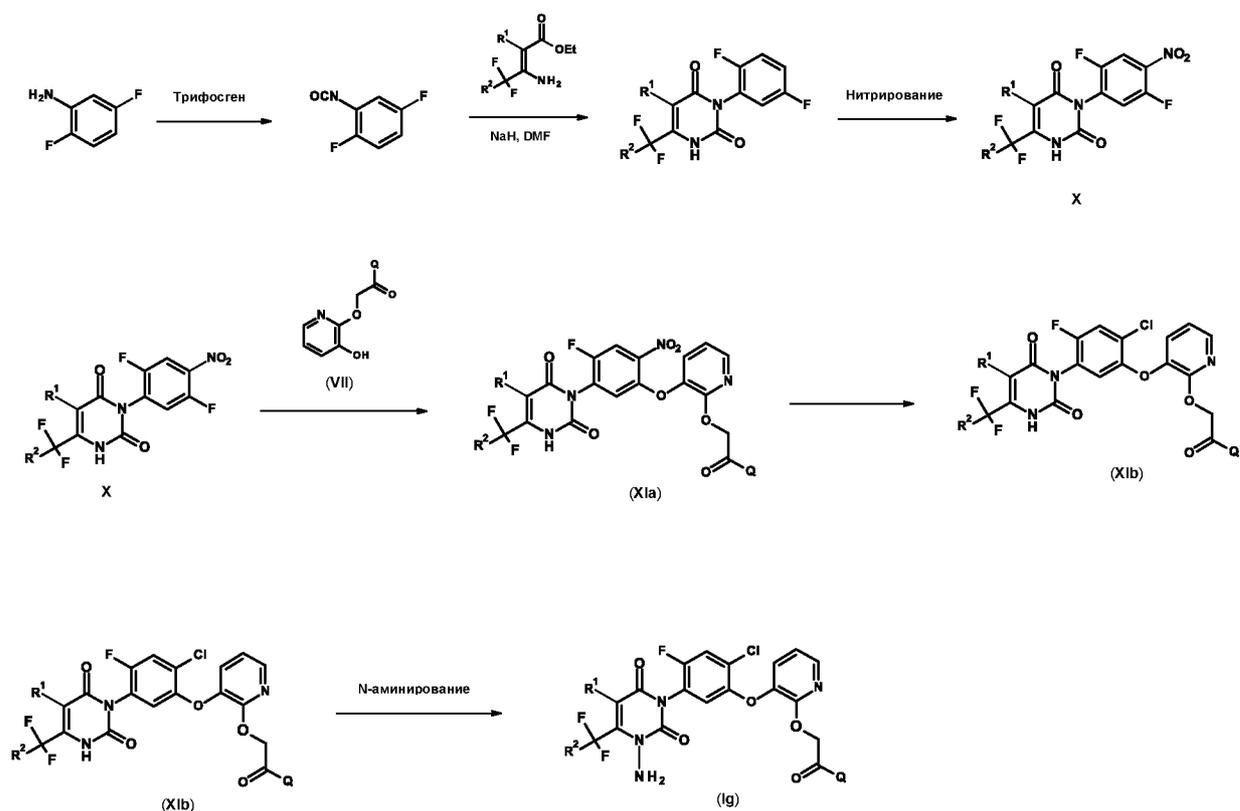


Схема 7.

Функционализация N-фенил-N' аминоурацила (Ic) в другие соединения согласно изобретению (Ic) происходит согласно методикам, известным специалистам, за счет замены одной функциональной группы на другую – к примеру, моноалкилирование ( $R^{15} = \text{H}$ ,  $R^{16} = \text{алкил}$ ), бисалкилирование ( $R^{15} = \text{алкил}$ ,  $R^{16} = \text{алкил}$ ) - и ниже представлена на Схеме 8. На приведенной ниже Схеме Q, R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup>, R<sup>15</sup> и R<sup>16</sup> имеют значения согласно изобретению, приведенные выше. Далее по тексту R<sup>3</sup>, указанный в качестве неограничивающего примера, означает фтор, R<sup>4</sup>, указанный в качестве неограничивающего примера, означает хлор, R<sup>5</sup>, R<sup>6</sup>, R<sup>7</sup>, указанные в качестве неограничивающего примера, означают водород, X и Y, указанные в качестве неограничивающего примера, означают кислород, а G, указанный в качестве неограничивающего примера, означает CH<sub>2</sub>.

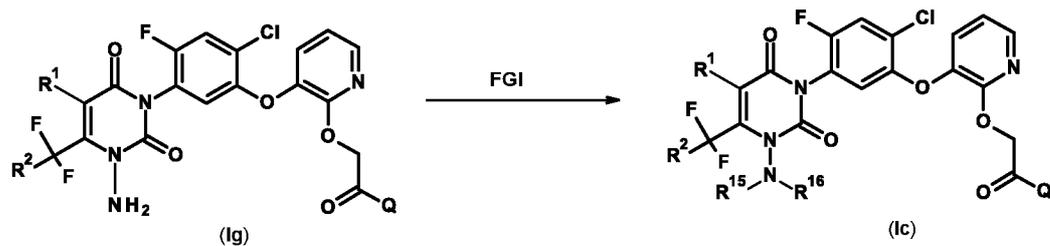
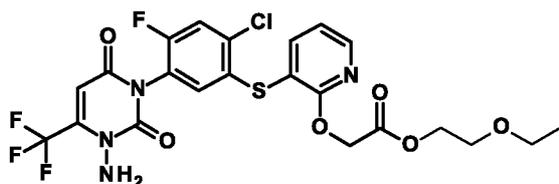


Схема 8

Выбранные подробные примеры синтеза для соединений общей формулы (I) согласно изобретению представлены ниже. Указанные номера примеров соответствуют нумерации, приведенной в Таблицах I.1 - I.34 ниже. Спектроскопические данные  $^1\text{H}$ -ЯМР,  $^{13}\text{C}$ -ЯМР- и  $^{19}\text{F}$ -ЯМР, которые приведены в составе химических примеров, описанных в приведенных ниже разделах (400 МГц при  $^1\text{H}$ -ЯМР и 150 МГц при  $^{13}\text{C}$ -ЯМР и 375 МГц при  $^{19}\text{F}$ -ЯМР, растворитель  $\text{CDCl}_3$ ,  $\text{CD}_3\text{OD}$  или  $d_6$ -ДМСО, внутрений стандарт: тетраметилсилан  $\delta = 0,00$  частей на млн.), получили с помощью прибора фирмы Bruker, и представленные сигналы имеют следующие значения: br = широкий; s = синглет, d = дублет, t = триплет, dd = двойной дублет, ddd = дублетт двойного дублета, m = мультиплет, q = квартет, квинт = квинтет, sext = секстет, sept = септет, dq = двойной квартет, dt = двойной триплет. Для смесей диастереомеров указаны или соответственно значимые сигналы двух диастереомеров, или характерные сигналы основного диастереомера. Используемые для химических групп сокращения имеют, например, следующие значения: Me =  $\text{CH}_3$ , Et =  $\text{CH}_2\text{CH}_3$ , трет-Нех =  $\text{C}(\text{CH}_3)_2\text{CH}(\text{CH}_3)_2$ , трет-Бу =  $\text{C}(\text{CH}_3)_3$ , н-Бу = неразветвленный бутил, н-Пр = неразветвленный пропил, изо-Пр = разветвленный пропил, с-Пр = циклопропил, с-Нех = циклогексил.

Примеры синтеза:

№ I.1-2: 2-этоксиэтил-{[3-({5-[3-амино-2,6-диоксо-4-(трифторметил)-3,6-дигидропиримидин-1(2H)-ил]-2-хлор-4-фторфенил}сульфанил)пиридин-2-ил]окси}ацетат.



2-фтор-4-хлоранилин (145 г, 996 ммоль) и триэтиламин (202 г, 2000 ммоль) последовательно и осторожно добавляли в раствор трифосгена (119 г, 401 ммоль)

в абс. дихлорметане (1000 мл) таким образом, чтобы температура полученной реакционной смеси оставалась менее 20 °С. По окончании такого добавления реакционную смесь перемешивали в течение ночи при комнатной температуре, после чего промывали водой (3 раза по 500 мл) и 1N соляной кислотой (500 мл), высушивали на сульфате натрия, отфильтровали и сгущали при сниженном давлении. Полученный таким образом 2-фтор-4-хлорфенилизоцианат использовали на следующем этапе без дальнейшей очистки. Гидрид натрия (5,60 г, 140 ммоль, 60%-ная дисперсия в минеральном масле) суспендировали в абс. N,N-диметилформамиде и смешивали с этил-(2E)-3-амино-4,4,4-трифторбут-2-еноатом (14,2 г, 77.5 ммоль). Реакционную смесь перемешивали в течение 1 часа при комнатной температуре, после чего охлаждали до -30 °С и смешивали с 2-фтор-4-хлорфенилизоцианатом (12.0 г, 70,0 ммоль). После добавления всего объема полученную реакционную смесь перемешивали в течение 4 часов при комнатной температуре и затем выливали на ледяную воду. После добавления этилового эфира уксусной кислоты и подкисления при помощи 1N соляной кислоты, выполняли тщательное экстрагирование водной фазы. Объединенные органические фазы промывали водой, высушивали над сульфатом натрия, отфильтровывали и выпаривали при пониженном давлении. Таким образом был получен 3-(4-хлор-2-фторфенил)-6-(трифторметил)пиримидин-2,4(1H,3H)-дион (15.2 г, 50.2 ммоль, 65%), который использовали на следующем этапе без дальнейшей очистки. Можно было также успешно получить больший объем 3-(4-хлор-2-фторфенил)-6-(трифторметил)пиримидин-2,4(1H,3H)-диона, во-первых, за счет повторения описанного выше пути реакции, либо за счет реализации следующего пути реакции, который можно без труда изменить: этил-4,4,4-трифтор-3-оксобутаноат (200 г, 1087 ммоль) растворяли в этаноле (1,3 л), смешивали с ацетатом аммония (334.7 г, 4347 ммоль), после чего его перемешивали в течение 16 часов при обратном потоке. После добавления этилового эфира и воды, выполняли тщательное экстрагирование водной фазы этиловым эфиром уксусной кислоты. Объединенные органические фазы промывали водой и насыщенным раствором NaCl, высушивали над сульфатом натрия, отфильтровывали, после чего проводили осторожную дистилляционную очистку исходного продукта (500 мм рт. ст. при температуре около 40 - 45 °С). Будучи полученным в виде слегка желтоватой жидкости, этил-(2Z)-3-амино-4,4,4-трифторбут-2-еноат (180 г, 983 ммоль) после этого использовали на следующем

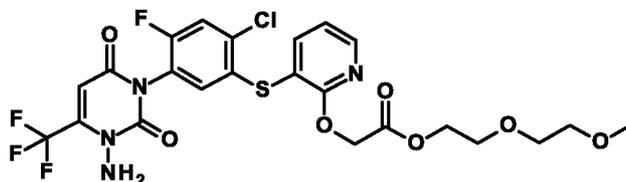
этапе реакции без дополнительной очистки и добавляли в охлажденную до 0°C суспензию гидрида натрия (98,3 г, 2458 ммоль) в абс. N,N-диметилформамиде (1,5 л). Полученную реакционную смесь перемешивали в течение 1 часа при 0 °С и в течение 1 часа при комнатной температуре. После повторного охлаждения до 0°C добавляли диметилкарбамоилхлорид (210,4 г, 1967 ммоль). Реакционную смесь перемешивали в течение 2 ч при комнатной температуре. После добавления этилового эфира и воды, выполняли тщательное экстрагирование водной фазы этиловым эфиром уксусной кислоты. Объединенные органические фазы промывали водой, высушивали над сульфатом натрия, отфильтровывали и выпаривали при пониженном давлении. Этил-(2Z)-3-[(диметилкарбамоил)амино]-4,4,4-трифторбут-2-еноат (120 г, 38% теор. выхода) был получен в виде слегка коричневатого масла путем очистки посредством колоночной хроматографии полученного исходного продукта. 2-хлор-4-фторанилин (50 г, 344,8 ммоль) и этил-(2Z)-3-[(диметилкарбамоил)амино]-4,4,4-трифторбут-2-еноат (87,6 г, 344,8 ммоль) растворяли в уксусной кислоте (500 мл) и перемешивали в течение 48 часов при обратном потоке. После окончания преобразования реакционную смесь охлаждали до комнатной температуры и помещали на ледяную воду. Водную смесь фильтровали, а полученные твердые вещества растворяли в этиловом эфире уксусной кислоты, а также промывали насыщенным раствором NaCl. Органические фазы высушивали над сульфатом натрия, отфильтровывали и сгущали при пониженном давлении. 3-(4-хлор-2-фторфенил)-6-(трифторметил)пиримидин-2,4(1H,3H)-дион (40.0 г, 38% теор. выхода) был получен в виде бесцветного твердого вещества в результате очистки в ходе колоночной хроматографии. 3-(4-хлор-2-фторфенил)-6-(трифторметил)-пиримидин-2,4(1H,3H)-дион (40 г, 130 ммоль) постепенно добавляли к хлорсульфоновой кислоте (60 мл) в прокаленной круглодонной колбе. После этого полученную реакционную смесь перемешивали в течение 5 часов при температуре 130 °С под воздействием азота, а после охлаждения до комнатной температуры помещали в ледяную воду и многократно экстрагировали этиловым эфиром уксусной кислоты (3 раза, 300 мл). Объединенные органические фазы высушивали над сульфатом натрия, отфильтровывали и сгущали при пониженном давлении. Таким образом был получен 2-хлор-5-[2,6-диоксо-4-(трифторметил)-3,6-дигидропиримидин-1(2H)-ил]-4-фторбензолсульфонилхлорид (30,0 г, 57% теор. выхода), который использовали на следующем этапе без дальнейшей очистки. <sup>1</sup>H-

ЯМР ( $\text{CDCl}_3$   $\delta$ , частей на млн.) 9.49 (br. s, 1H), 8.15 (d, 1H), 7.57 (d, 1H), 6.29 (s, 1H). 2-хлор-5-[2,6-диоксо-4-(трифторметил)-3,6-дигидропиримидин-1(2H)-ил]-4-фторбензолсульфонилхлорид (30,0 г, 74 ммоль) поместили в круглодонную колбу и последовательно смешивали с соляной кислотой (105 мл), уксусной кислотой (225 мл) и дигидратом хлорида олова (79 г, 251 ммоль). Полученную реакционную смесь перемешивали в течение 5 часов при температуре 80 °С, после охлаждения до комнатной температуры помещали в ледяную воду и тщательно экстрагировали дихлорметаном (3 раза, 400 мл). Объединенные органические фазы высушивали над сульфатом натрия, отфильтровывали и сгущали при пониженном давлении. В результате окончательной колоночной хроматографической очистки был получен в виде бесцветного твердого вещества 3-(4-хлор-2-фтор-5-сульфанилфенил)-6-(трифторметил)пиримидин-2,4(1H,3H)-дион (25.0 г, 98% теор. выхода).  $^1\text{H}$ -ЯМР ( $\text{CDCl}_3$   $\delta$ , частей на млн.) 8.85 (br. s, 1H), 7.35 (d, 1H), 7.29 (d, 1H), 6.26 (s, 1H), 3.88 (s, 1H). 3-(4-хлор-2-фтор-5-сульфанилфенил)-6-(трифторметил)пиримидин-2,4(1H,3H)-дион (25,00 г, 73,5 ммоль) был растворен в абс. дихлорметане (500 мл) и смешан с тритилхлоридом (34,15 г, 73,5 ммоль) и пиридином (5,81 г, 73,53 ммоль). Полученную реакционную смесь перемешивали в течение 3 часов при комнатной температуре, после чего смешивали с водой и тщательно экстрагировали. Объединенные органические фазы высушивали над сульфатом натрия, отфильтровывали и сгущали при пониженном давлении. В результате окончательной колоночной хроматографической очистки в форме бесцветного твердого вещества был получен 3-[4-хлор-2-фтор-5-(третилсульфанил)фенил]-6-(трифторметил)пиримидин-2,4(1H,3H)-дион (25 г, 43% теор. выхода).  $^1\text{H}$ -ЯМР ( $\text{CDCl}_3$   $\delta$ , частей на млн.) 9.40 (br. s, 1H), 7.39-7.23 (m, 15H), 7.20 (m, 1H), 6.74 (d, 1H), 6.13 (s, 1H). 3-[4-хлор-2-фтор-5-(третилсульфанил)фенил]-6-(трифторметил)пиримидин-2,4(1H,3H)-дион (25 г, 1 экв.) растворяли в абс. тетрагидрофуране (625 мл) и смешивали с карбонатом натрия (3 экв.). После этого осторожно и по частям добавляли о-мезитилсульфонилгидроксиламин (экв. 3). После этого полученную реакционную смесь перемешивали в течение 2 часов под воздействием азота. После полного превращения добавляли воду и этиловый эфир уксусной кислоты и несколько раз тщательно экстрагировали. Объединенные органические фазы высушивали над сульфатом натрия, отфильтровывали и осторожно сгущали при пониженном давлении. В результате окончательной колоночной

хроматографической очистки в виде бесцветного твердого вещества получили 1-амино-3-[4-хлор-2-фтор-5-(третилсульфанил)фенил]-6-(трифторметил)пиримидин-2,4(1H,3H)-дион (21,1 г, 82% теор. выхода).  $^1\text{H-NMR}$  ( $d_6$ -ДМСО $\delta$ , частей на млн.) 7.61 (d, 1H), 7.33-7.23 (m, 15H), 6.88 (d, 1H), 6.34 (s, 1H), 5.54 (br. s, 2H, NH $_2$ ). 1-амино-3-[4-хлор-2-фтор-5-(третилсульфанил)фенил]-6-(трифторметил)пиримидин-2,4(1H,3H)-дион (5.0 г, 8.53 ммоль) растворили в дихлорметане (50 мл) под воздействием аргона и охладили до температуры 0°C. После этого добавили трифторуксусную кислоту (2,30 мл, 29,86 ммоль) и триизопропилсилан (9,16 мл, 44.79 ммоль). Полученную реакционную смесь перемешивали около 3 часов при комнатной температуре. После полного преобразования добавили воду и дихлорметан, а также провели тщательную экстракцию. Объединенные органические фазы высушивали над сульфатом натрия, отфильтровывали и осторожно сгущали при пониженном давлении. В результате окончательной колоночной хроматографической очистки получили 1-амино-3-(4-хлор-2-фтор-5-сульфанилфенил)-6-(трифторметил)пиримидин-2,4(1H,3H)-дион (2,98 г, 98% теор. выхода) в виде бесцветного твердого вещества  $^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$   $\delta$ , частей на млн.) 7.36 (d, 1H), 7.29 (d, 1H), 6.28 (s, 1H), 4.59 (s, 2H), 3.88 (s, 1H). 1-амино-3-(4-хлор-2-фтор-5-сульфанилфенил)-6-(трифторметил)-пиримидин-2,4(1H,3H)-дион (600 мг, 1,69 ммоль) растворили под аргоном в микроволновом сосуде в диоксане (18 мЛ) и после дегазации растворителя смешали с трис(дибензилиденацетон)дипалладием (39 мг, 0,04 ммоль), 4,5-бис(дифенилфосфино)-9,9-диметилксантеном (49 мг, 0,08 ммоль), N,N-диизопропилэтиламино (0,59 мл, 3,37 ммоль) и 3-бром-2-гидроксипиридином (333 мг, 1,86 ммоль). Полученную реакционную смесь перемешивали в течение 2 ч в микроволновых условиях при температуре 160 °C. После охлаждения до комнатной температуры реакционную смесь отфильтровали, и фильтрат сконцентрировали. Путем очистки посредством колоночной хроматографии полученного исходного продукта получили 1-амино-3-{4-хлор-2-фтор-5-[(2-гидроксипиридин-3-ил)сульфанил]фенил}-6-(трифторметил)пиримидин-2,4(1H,3H)-дион (720 мг, 86 % теор. выхода) в виде бесцветного твердого вещества.  $^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$   $\delta$ , ppm) 12.64 (br. s, 1H), 7.45 (d, 1H), 7.40 (d, 1H), 7.35 (d, 1H), 7.24 (d, 1H), 6.30 (m, 1H), 6.23 (s, 1H), 4.58 (s, 2H).

К 1-амино-3-{4-хлор-2-фтор-5-[(2-гидроксипиридин-3-ил)сульфанил]-фенил}-6-(трифторметил)пиримидин-2,4(1H,3H)-диону (300 мг, 0.69 ммоль) в микроволновом сосуде под аргоном добавили н-гексан (19 мЛ). После этого осуществили добавление карбоната серебра(I) (223 мг, 0.80 ммоль) и 2-этоксиэтилоацетата (431 мг, 1.34 ммоль). Реакционную смесь перемешивали в течение 40 минут при температуре 140 °С в микроволновых условиях. После охлаждения до комнатной температуры реакционную смесь отфильтровали, и фильтрат сконцентрировали. Путем очистки посредством колоночной хроматографии полученного исходного продукта получили 2-этоксиэтил-{[3-({5-[3-амино-2,6-диоксо-4-(трифторметил)-3,6-дигидропиримидин-1(2H)-ил]-2-хлор-4-фторфенил}сульфанил)пиридин-2-ил]окси}ацетат (119 мг, 31 % теор. выхода) в виде бесцветного твердого вещества. <sup>1</sup>H-NMR (CDCl<sub>3</sub> δ, ppm) 8.12 (d, 1H), 7.77 (m, 1H), 7.32 (d, 1H), 7.24 (d, 1H), 6.95 (m, 1H), 6.19 (s, 1H), 4.99-4.87 (q, 2H), 4.62 (s, 2H), 4.36-4.29 (m, 1H), 4.17-4.11 (m, 1H), 3.64-3.61 (m, 2H), 3.53 (q, 2H), 1.20 (t, 3H).

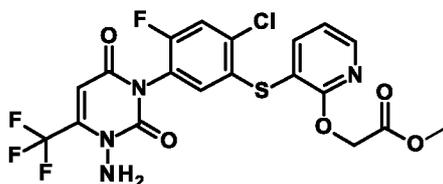
№ I.1-23: 2-(2-метоксиэтокси)этил-{[3-({5-[3-амино-2,6-диоксо-4-(трифторметил)-3,6-дигидропиримидин-1(2H)-ил]-2-хлор-4-фторфенил}сульфанил)пиридин-2-ил]окси}ацетат



К 1-амино-3-{4-хлор-2-фтор-5-[(2-гидроксипиридин-3-ил)сульфанил]-фенил}-6-(трифторметил)пиримидин-2,4(1H,3H)-диону (200 мг, 0.45 ммоль) в микроволновом сосуде под аргоном добавили н-гексан (15 мЛ). После этого осуществили добавление карбоната серебра(I) (147 мг, 0.54 ммоль) и 2-(2-метоксиэтокси)этилоацетата (257 мг, 0.89 ммоль). Реакционную смесь перемешивали в течение 48 минут при температуре 140 °С в микроволновых условиях. После охлаждения до комнатной температуры реакционную смесь отфильтровали, и фильтрат сконцентрировали при пониженном давлении. Путем очистки посредством колоночной хроматографии полученного исходного продукта получили 2-(2-метоксиэтокси)этил-{[3-({5-[3-амино-2,6-диоксо-4-(трифторметил)-3,6-дигидропиримидин-1(2H)-ил]-2-хлор-4-фторфенил}-

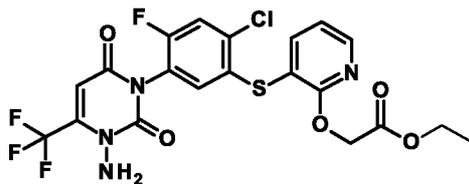
сульфанил)пиридин-2-ил]окси}ацетат (68 мг, 23 % теор. выхода) в виде бесцветного твердого вещества.  $^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$   $\delta$ , ppm) 8.12 (d, 1H), 7.78 (m, 1H), 7.34 (d, 1H), 7.26 (d, 1H), 6.95 (m, 1H), 6.19 (s, 1H), 4.98-4.87 (q, 2H), 4.66 (s, 2H), 4.35-4.30 (m, 1H), 4.16-4.11 (m, 1H), 3.71-3.66 (m, 2H), 3.62-3.59 (m, 2H), 3.54-3.51 (m, 2H), 3.36 (s, 3H).

№ I.1-441: метил-{[3-({5-[3-амино-2,6-диоксо-4-(трифторметил)-3,6-дигидропиримидин-1(2H)-ил]-2-хлор-4-фторфенил}сульфанил)пиридин-2-ил]окси}ацетат.



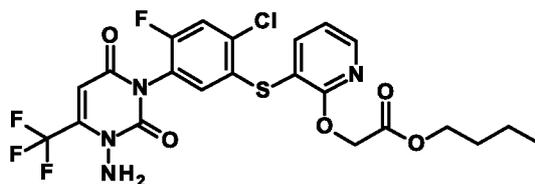
К 1-амино-3-{4-хлор-2-фтор-5-[(2-гидроксипиридин-3-ил)сульфанил]-фенил}-6-(трифторметил)пиримидин-2,4(1H,3H)-диону (150 мг, 0.33 ммоль) в микроволновом сосуде под аргоном добавили н-гексан (6 мл). После этого осуществили добавление карбоната серебра(I) (111 мг, 0.40 ммоль) и метил-2-йодацетата (0.08 мл, 0.67 ммоль). Реакционную смесь перемешивали в течение 30 минут при температуре 140 °С в микроволновых условиях. После охлаждения до комнатной температуры реакционную смесь отфильтровали, и фильтрат сконцентрировали при пониженном давлении. Путем очистки посредством колоночной хроматографии полученного исходного продукта получили метил-{[3-({5-[3-амино-2,6-диоксо-4-(трифторметил)-3,6-дигидропиримидин-1(2H)-ил]-2-хлор-4-фторфенил}сульфанил)пиридин-2-ил]окси}ацетат (34 мг, 19 % теор. выхода) в виде бесцветного твердого вещества.  $^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$   $\delta$ , ppm) 8.12 (d, 1H), 7.73 (m, 1H), 7.35 (d, 1H), 7.25 (d, 1H), 6.95 (m, 1H), 6.20 (s, 1H), 4.97-4.84 (q, 2H), 4.52 (s, 2H), 3.70 (s, 3H).

№ I.1-442: этил-{[3-({5-[3-амино-2,6-диоксо-4-(трифторметил)-3,6-дигидропиримидин-1(2H)-ил]-2-хлор-4-фторфенил}сульфанил)пиридин-2-ил]окси}ацетат.



К 1-амино-3-{4-хлор-2-фтор-5-[(2-гидроксипиридин-3-ил)сульфанил]-фенил}-6-(трифторметил)пиримидин-2,4(1Н,3Н)-диону (300 мг, 0.67 ммоль) в микроволновом сосуде под аргоном добавили н-гексан (17 мЛ). После этого осуществили добавление карбоната серебра(I) (223 мг, 0.80 ммоль) и этил-2-йодацетата (0.16 мл, 1.34 ммоль). Реакционную смесь перемешивали в течение 30 минут при температуре 140 °С в микроволновых условиях. После охлаждения до комнатной температуры реакционную смесь отфильтровали, и фильтрат сконцентрировали при пониженном давлении. Путем очистки посредством колоночной хроматографии полученного исходного продукта получили этил-{{3-((5-[3-амино-2,6-диоксо-4-(трифторметил)-3,6-дигидропиримидин-1(2Н)-ил]-2-хлор-4-фторфенил)сульфанил)пиридин-2-ил]окси}ацетат (81 мг, 32 % теор. выхода) в виде бесцветного твердого вещества. <sup>1</sup>H-NMR (CDCl<sub>3</sub> δ, ppm) 8.11 (d, 1H), 7.72 (m, 1H), 7.35 (d, 1H), 7.28 (d, 1H), 6.94 (m, 1H), 6.19 (s, 1H), 4.95-4.83 (q, 2H), 4.52 (s, 2H), 4.16-4.10 (m, 2H), 1.26 (t, 3H).

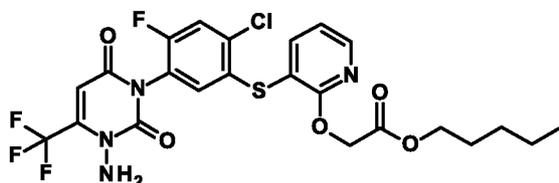
№ I.1-447: н-Бутил-{{3-((5-[3-амино-2,6-диоксо-4-(трифторметил)-3,6-дигидропиримидин-1(2Н)-ил]-2-хлор-4-фторфенил)сульфанил)пиридин-2-ил]окси}ацетат.



К 1-амино-3-{4-хлор-2-фтор-5-[(2-гидроксипиридин-3-ил)сульфанил]-фенил}-6-(трифторметил)пиримидин-2,4(1Н,3Н)-дион (200 мг, 0.45 ммоль) в микроволновом сосуде под аргоном добавили н-гексан (17 мЛ). После этого осуществили добавление карбоната серебра(I) (149 мг, 0.54 ммоль) и н-пентил-2-йодацетата (270 мг, 0.89 ммоль). Реакционную смесь перемешивали в течение 40 минут при температуре 140 °С в микроволновых условиях. После охлаждения до комнатной температуры реакционную смесь отфильтровали, и фильтрат

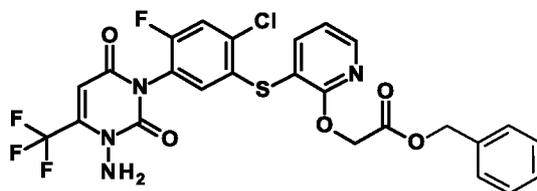
сконцентрировали при пониженном давлении. Путем очистки посредством колоночной хроматографии полученного исходного продукта получили н-Бутил-{{3-({5-[3-амино-2,6-диоксо-4-(трифторметил)-3,6-дигидропиримидин-1(2H)-ил]-2-хлор-4-фторфенил}сульфанил)пиридин-2-ил}окси}ацетат (16 мг, 6 % теор. выхода) в виде бесцветного твердого вещества.  $^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$   $\delta$ , ppm) 8.11 (d, 1H), 7.72 (m, 1H), 7.33 (d, 1H), 7.28 (d, 1H), 6.94 (m, 1H), 6.19 (s, 1H), 4.95-4.83 (q, 2H), 4.58 (s, 2H), 4.14-4.05 (m, 2H), 1.65-1.55 (m, 4H), 1.41-1.30 (m, 2H), 0.92 (t, 3H).

№ I.1-448: н-пентил-{{3-({5-[3-амино-2,6-диоксо-4-(трифторметил)-3,6-дигидропиримидин-1(2H)-ил]-2-хлор-4-фторфенил}сульфанил)пиридин-2-ил}окси}ацетат.



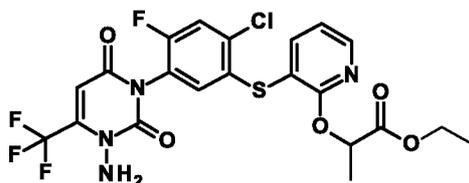
К 1-амино-3-{{4-хлор-2-фтор-5-[(2-гидроксипиридин-3-ил)сульфанил]фенил}-6-(трифторметил)пиримидин-2,4(1H,3H)-диону (180 мг, 0.40 ммоль) в микроволновом сосуде под аргоном добавили н-гексан (17 мЛ). После этого осуществили добавление карбоната серебра(I) (134 мг, 0.48 ммоль) и н-пентил-2-йодацетат (257 мг, 0.80 ммоль). Реакционную смесь перемешивали в течение 40 минут при температуре 140 °С в микроволновых условиях. После охлаждения до комнатной температуры реакционную смесь отфильтровали, и фильтрат сконцентрировали при пониженном давлении. Путем очистки посредством колоночной хроматографии полученного исходного продукта получили н-пентил-{{3-({5-[3-амино-2,6-диоксо-4-(трифторметил)-3,6-дигидропиримидин-1(2H)-ил]-2-хлор-4-фторфенил}сульфанил)пиридин-2-ил}окси}ацетат (23 мг, 10 % теор. выхода) в виде бесцветного твердого вещества.  $^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$   $\delta$ , ppm) 8.11 (d, 1H), 7.47-7.43 (m, 2H), 7.13 (d, 1H), 6.98 (m, 1H), 6.25 (s, 1H), 4.68 (s, 2H), 4.58 (s, 2H), 4.16 (t, 2H), 1.68-1.63 (m, 2H), 1.39-1.30 (m, 4H), 0.91 (t, 3H).

№ I.1-457: бензил-{{3-({5-[3-амино-2,6-диоксо-4-(трифторметил)-3,6-дигидропиримидин-1(2H)-ил]-2-хлор-4-фторфенил}сульфанил)пиридин-2-ил]окси}ацетат.



К 1-амино-3-{{4-хлор-2-фтор-5-[(2-гидроксипиридин-3-ил)сульфанил]-фенил}-6-(трифторметил)пиримидин-2,4(1H,3H)-диону (180 мг, 0.40 ммоль) в микроволновом сосуде под аргоном добавили н-гексан (17 мЛ). После этого осуществили добавление карбоната серебра(I) (134 мг, 0.48 ммоль) и бензил-ил-2-йодацетата (226 мг, 0.80 ммоль). Реакционную смесь перемешивали в течение 40 минут при температуре 140 °С в микроволновых условиях. После охлаждения до комнатной температуры реакцию смесь отфильтровали, и фильтрат сконцентрировали при пониженном давлении. Путем очистки посредством колоночной хроматографии полученного исходного продукта получили бензил-{{3-({5-[3-амино-2,6-диоксо-4-(трифторметил)-3,6-дигидропиримидин-1(2H)-ил]-2-хлор-4-фторфенил}сульфанил)пиридин-2-ил]окси}ацетат (21 мг, 9 % теор. выхода) в виде бесцветного твердого вещества. <sup>1</sup>H-NMR (CDCl<sub>3</sub> δ, ppm) 8.07 (d, 1H), 7.72 (m, 1H), 7.38-7.22 (m, 7H), 6.94 (m, 1H), 6.16 (s, 1H), 5.13 (s, 2H), 5.01-4.90 (q, 2H), 4.45 (s, 2H).

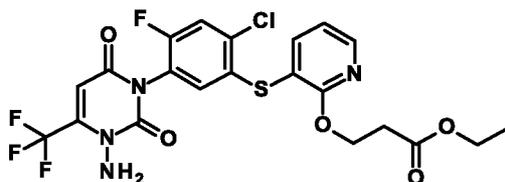
№ I.2-442: этил-2-{{3-({5-[3-амино-2,6-диоксо-4-(трифторметил)-3,6-дигидропиримидин-1(2H)-ил]-2-хлор-4-фторфенил}сульфанил)пиридин-2-ил]окси}пропаноат.



К 1-амино-3-{{4-хлор-2-фтор-5-[(2-гидроксипиридин-3-ил)сульфанил]фенил}-6-(трифторметил)пиримидин-2,4(1H,3H)-диону (160 мг, 0.36 ммоль) в микроволновом сосуде под аргоном добавили н-гексан (6 мЛ). После этого

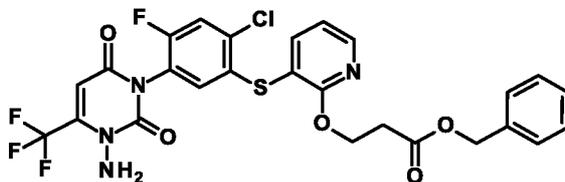
осуществили добавление карбоната серебра(I) (118 мг, 0.43 ммоль) и этил-2-йодпропионата (166 мг, 0.71 ммоль). Реакционную смесь перемешивали в течение 2 ч при температуре 140 °С в микроволновых условиях. После охлаждения до комнатной температуры реакционную смесь отфильтровали, и фильтрат сконцентрировали при пониженном давлении. Путем очистки посредством колоночной хроматографии полученного исходного продукта получили этил-2-{{3-({5-[3-амино-2,6-диоксо-4-(трифторметил)-3,6-дигидропиримидин-1(2H)-ил]-2-хлор-4-фторфенил}сульфанил)пиридин-2-ил]окси}пропаноат (96 мг, 47 % теор. выхода) в виде бесцветного твердого вещества. <sup>1</sup>H-NMR (CDCl<sub>3</sub> δ, ppm) 8.09 (m, 1H), 7.72 (m, 1H), 7.33 (d, 1H), 7.19 (d, 1H), 6.91 (m, 1H), 6.19 (s, 1H), 5.22 (m, 1H), 4.52 (s, 2H), 4.18-4.09 (m, 2H), 1.49 (d, 3H), 1.23 (t, 3H).

№ I.5-442: этил-3-{{3-({5-[3-амино-2,6-диоксо-4-(трифторметил)-3,6-дигидропиримидин-1(2H)-ил]-2-хлор-4-фторфенил}сульфанил)пиридин-2-ил]окси}пропаноат.



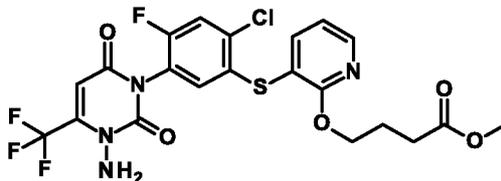
К 1-амино-3-{{4-хлор-2-фтор-5-[(2-гидроксипиридин-3-ил)сульфанил]-фенил}-6-(трифторметил)пиримидин-2,4(1H,3H)-диону (150 мг, 0.33 ммоль) в микроволновом сосуде под аргоном добавили н-гексан (7 мЛ). После этого осуществили добавление карбоната серебра(I) (111 мг, 0.40 ммоль) и этил-3-йодпропионата (161 мг, 0.67 ммоль). Реакционную смесь перемешивали в течение 30 минут при температуре 140 °С в микроволновых условиях. После охлаждения до комнатной температуры реакционную смесь отфильтровали, и фильтрат сконцентрировали при пониженном давлении. Путем очистки посредством колоночной хроматографии полученного исходного продукта получили этил-3-{{3-({5-[3-амино-2,6-диоксо-4-(трифторметил)-3,6-дигидропиримидин-1(2H)-ил]-2-хлор-4-фторфенил}сульфанил)пиридин-2-ил]окси}пропаноат (65 мг, 34 % теор. выхода) в виде бесцветного твердого вещества. <sup>1</sup>H-NMR (CDCl<sub>3</sub> δ, ppm) 8.10 (d, 1H), 7.55 (m, 1H), 7.38 (d, 1H), 7.12 (d, 1H), 6.88 (m, 1H), 6.23 (s, 1H), 4.65-4.57 (m, 4H), 4.15 (q, 2H), 2.70 (t, 2H), 1.25 (t, 3H).

№ I.5-457: бензил-3-{{3-({5-[3-амино-2,6-диоксо-4-(трифторметил)-3,6-дигидропиримидин-1(2H)-ил]-2-хлор-4-фторфенил}сульфанил)пиридин-2-ил]окси}пропаноат.



К 1-амино-3-{{4-хлор-2-фтор-5-[(2-гидроксипиридин-3-ил)сульфанил]-фенил}-6-(трифторметил)пиримидин-2,4(1H,3H)-диону (140 мг, 0.31 ммоль) в микроволновом сосуде под аргоном добавили н-гексан (5 мЛ). После этого осуществили добавление карбоната серебра(I) (103 мг, 0.37 ммоль) и бензил-3-йодпропионата (201 мг, 0.62 ммоль). Реакционную смесь перемешивали в течение 30 минут при температуре 140 °С в микроволновых условиях. После охлаждения до комнатной температуры реакционную смесь отфильтровали, и фильтрат сконцентрировали при пониженном давлении. Путем очистки посредством колоночной хроматографии полученного исходного продукта получили бензил-3-{{3-({5-[3-амино-2,6-диоксо-4-(трифторметил)-3,6-дигидропиримидин-1(2H)-ил]-2-хлор-4-фторфенил}сульфанил)пиридин-2-ил]окси}пропаноат (70 мг, 35 % теор. выхода) в виде бесцветного твердого вещества. <sup>1</sup>H-NMR (CDCl<sub>3</sub> δ, ppm) 8.09 (m, 1H), 7.57 (m, 1H), 7.37-7.30 (m, 6H), 7.09 (d, 1H), 6.88 (m, 1H), 6.21 (s, 1H), 5.22 (s, 2H), 4.68-4.62 (m, 2H), 4.50 (s, 2H), 2.77 (t, 2H).

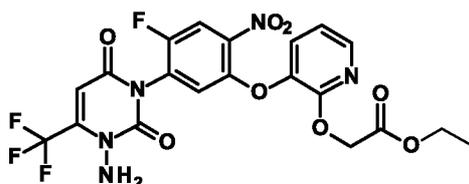
№ I.6-441: метил-4-{{3-({5-[3-амино-2,6-диоксо-4-(трифторметил)-3,6-дигидропиримидин-1(2H)-ил]-2-хлор-4-фторфенил}сульфанил)пиридин-2-ил]окси}бутаноат.



К 1-амино-3-{{4-хлор-2-фтор-5-[(2-гидроксипиридин-3-ил)сульфанил]-фенил}-6-(трифторметил)пиримидин-2,4(1H,3H)-диону (150 мг, 0.33 ммоль) в микроволновом сосуде под аргоном добавили н-гексан (7 мЛ). После этого осуществили добавление карбоната серебра(I) (111 мг, 0.40 ммоль) и этил-3-

йодпропионата (161 мг, 0.67 ммоль). Реакционную смесь перемешивали в течение 30 минут при температуре 140 °С в микроволновых условиях. После охлаждения до комнатной температуры реакционную смесь отфильтровали, и фильтрат сконцентрировали при пониженном давлении. Путем очистки посредством колоночной хроматографии полученного исходного продукта получили метил-4-{{3-({5-[3-амино-2,6-диоксо-4-(трифторметил)-3,6-дигидропиримидин-1(2H)-ил]-2-хлор-4-фторфенил}сульфанил)пиридин-2-ил]окси}бутаноат (104 мг, 54 % теор. выхода) в виде бесцветного твердого вещества. <sup>1</sup>H-NMR (CDCl<sub>3</sub> δ, ppm) 8.11 (d, 1H), 7.60 (m, 1H), 7.38 (d, 1H), 7.10 (d, 1H), 6.87 (m, 1H), 6.22 (s, 1H), 4.62 (s, 2H), 4.37-4.31 (m, 2H), 3.66 (s, 3H), 2.41-2.36 (m, 2H), 2.08-2.00 (m, 2H).

№ I.14-442: этил-[(3-{5-[3-амино-2,6-диоксо-4-(трифторметил)-3,6-дигидропиримидин-1(2H)-ил]-4-фтор-2-нитрофенокси}пиридин-2-ил)окси]ацетат.

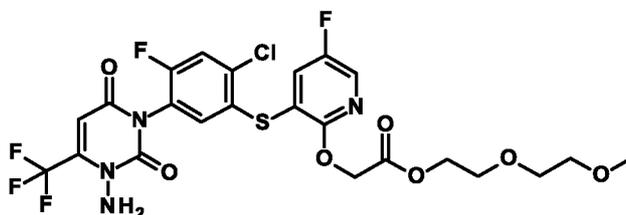


2,5-дифторанилин (1 экв.) и триэтиламин (2 экв.) последовательно и осторожно добавляли в раствор трифосгена (0,4 экв.) в абс. дихлорметане, таким образом, чтобы температура полученной реакционной смеси оставалась менее 20°С. После добавления реакционную смесь перемешивали в течение ночи при комнатной температуре, после чего промыли водой и 1N соляной кислотой, высушивали над сульфатом натрия, отфильтровывали и сгущали при пониженном давлении. Полученный таким образом 2,5-дифтофенилизотиоцианат использовали на следующем этапе без дальнейшей очистки. Гидрид натрия (2 экв., 60%-ная дисперсия в минеральном масле) суспендировали в абс. N,N-диметилформамиде и смешивали с этил-(2E)-3-амино-4,4,4-трифторбут-2-еноатом (1.1 экв.). Реакционную смесь перемешивали в течение 1 часа при комнатной температуре, после чего охладили до температуры -30°С и смешали с 2,5-дифторфенилизотиоцианатом (1 экв.) После добавления всего объема полученную реакционную смесь перемешивали в течение 4 часов при комнатной температуре и затем выливали на ледяную воду. После добавления этилового эфира уксусной кислоты и подкисления при помощи 1N соляной кислоты, выполняли тщательное

экстрагирование водной фазы. Объединенные органические фазы промывали водой, высушивали над сульфатом натрия, отфильтровывали и выпаривали при пониженном давлении. Таким образом был получен 3-(2,5-дифторфенил)-6-(трифторметил)пиримидин-2,4(1H,3H)-дион, который использовали на следующем этапе без дополнительной очистки. 3-(2,5-дифторфенил)-6-(трифторметил)-пиримидин-2,4(1H,3H)-дион (экв. 1) смешивали с серной кислотой, а полученную реакционную смесь охлаждали до 0°C. После этого осторожно постепенно добавляли нитрат калия (экв. 1.1) Полученную реакционную смесь перемешивали в течение 10 часов при температуре 100 °C, а после ее охлаждения до комнатной температуры добавляли в ледяную воду. Затем добавляли этиловый эфир уксусной кислоты, а водную фазу тщательно многократно экстрагировали этиловым эфиром уксусной кислоты. Объединенные органические фазы высушивали над сульфатом натрия, отфильтровывали и осторожно сгущали при пониженном давлении, таким образом получая 3-(2,5-дифтор-4-нитрофенил)-6-(трифторметил)пиримидин-2,4(1H,3H)-дион в виде бесцветного твердого вещества. 3-(2,5-дифтор-4-нитрофенил)-6-(трифторметил)пиримидин-2,4(1H,3H)-дион (экв. 1) растворили в абс. N,N-диметилформамиде и смешали с раствором гидрида натрия (экв. 1.2, 60%-ная дисперсия минерального масла) в N,N-диметилформамиде. После этого осторожно и по частям добавляли 2,4-динитрофенилгидроксиламин (экв. 1,5). После этого полученную реакционную смесь перемешивали в течение 2 часов под воздействием азота. После полного превращения добавляли воду и этиловый эфир уксусной кислоты и несколько раз тщательно экстрагировали. Объединенные органические фазы высушивали над сульфатом натрия, отфильтровывали и осторожно сгущали при пониженном давлении. В результате окончательной колоночной хроматографической очистки получили 1-амино-3-(2,5-дифтор-4-нитрофенил)-6-(трифторметил)пиримидин-2,4(1H,3H)-дион в виде бесцветного твердого вещества. 1-амино-3-(2,5-дифтор-4-нитрофенил)-6-(трифторметил)-пиримидин-2,4(1H,3H)-дион (150 мг, 0,43 ммоль) смешивали с N,N-диметилформамидом (5 мл) в прокаленной круглодонной колбе под воздействием аргона. После этого добавляли этил-[(3-гидроксипиримидин-2-ил)окси]ацетат (84 мг, 0.43 ммоль) и карбонат калия (65 мг, 0,47 ммоль). Реакционную смесь перемешивали в течение 3 часов при температуре 65 °C. После охлаждения до комнатной температуры реакционную смесь смешивали с водой и дихлорметаном, а также тщательно экстрагировали. Объединенные органические фазы высушивали

над сульфатом натрия, отфильтровывали и осторожно сгущали при пониженном давлении. В результате окончательной колоночной хроматографической очистки получили этил-[(3-{5-[3-амино-2,6-диоксо-4-(трифторметил)-3,6-дигидропиримидин-1(2H)-ил]-4-фтор-2-нитрофенокси} пиридин-2-ил)окси]ацетат (81 мг, 36 % теор. выхода) в виде бесцветного твердого вещества.  $^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ ,  $\delta$ , ppm) 8.01 (m, 1H), 7.89 (d, 1H), 7.72 (m, 1H), 7.53 (m, 1H), 7.18 (d, 1H), 7.00 (m, 1H), 6.19 (s, 1H), 4.99 (d, 1H), 4.85 (d, 2H), 4.51 (s, 2H), 4.15-4.10 (m, 2H), 1.26 (t, 3H).

№ I.31-23: 2-(2-метоксиэтокси)этил-{[3-({5-[3-амино-2,6-диоксо-4-(трифторметил)-3,6-дигидропиримидин-1(2H)-ил]-2-хлор-4-фторфенил}сульфанил)-5-фторпиридин-2-ил]окси}ацетат



1-амино-3-(4-хлор-2-фтор-5-сульфанилфенил)-6-(трифторметил)-пиримидин-2,4(1H,3H)-дион (800 мг, 2.25 ммоль) растворили под аргоном в микроволновом сосуде в диоксане (18 мЛ) и после дегазации растворителя добавили трис(дибензилиденацетон)дипалладий (51 мг, 0.06 ммоль), 4,5-бис(дифенилфосфино)-9,9-диметилксантен (65 мг, 0.11 ммоль), N,N-диизопропилэтиламин (0.78 мл, 4.49 ммоль) и 3-бром-5-фтор-2-гидроксипиридин (475 мг, 2.47 ммоль). Полученную реакционную смесь перемешивали в течение 2 ч в микроволновых условиях при температуре 160 °С. После охлаждения до комнатной температуры реакционную смесь отфильтровали, и фильтрат сконцентрировали. Путем очистки посредством колоночной хроматографии полученного исходного продукта получили 1-амино-3-{4-хлор-2-фтор-5-[(5-фтор-2-гидроксипиридин-3-ил)сульфанил]фенил}-6-(трифторметил)пиримидин-2,4(1H,3H)-дион (660 мг, 63 % теор. выхода) в виде бесцветного твердого вещества.  $^1\text{H-NMR}$  ( $d_6\text{-DMSO}$ ,  $\delta$ , ppm) 12.02 (br. s, 1H), 7.98 (d, 1H), 7.70 (d, 1H), 7.59 (m, 1H), 6.97 (m, 1H), 6.41 (s, 1H), 5.59 (s, 2H). К 1-амино-3-{4-хлор-2-фтор-5-[(5-фтор-2-гидроксипиридин-3-ил)сульфанил]фенил}-6-(трифторметил)пиримидин-2,4(1H,3H)-диону (220 мг, 0.47 ммоль) в микроволновом сосуде под аргоном

добавили н-гексан (15 мЛ). После этого осуществили добавление карбоната серебра(I) (156 мг, 0.57 ммоль) и 2-(2-метоксиэтокси)этилоацетат (272 мг, 0.94 ммоль). Реакционную смесь перемешивали в течение 48 минут при температуре 140 °С в микроволновых условиях. После охлаждения до комнатной температуры реакцию смесь отфильтровали, и фильтрат сконцентрировали при пониженном давлении. Путем очистки посредством колоночной хроматографии полученного исходного продукта получили 2-(2-метоксиэтокси)этил-{[3-({5-[3-амино-2,6-диоксо-4-(трифторметил)-3,6-дигидропиримидин-1(2H)-ил]-2-хлор-4-фторфенил}сульфанил)-5-фторпиридин-2-ил]окси}ацетат (33 мг, 10 % теор. выхода) в виде бесцветного твердого вещества.  $^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$   $\delta$ , ppm) 7.91 (m, 1H), 7.43 (m, 1H), 7.38 (m, 2H), 6.22 (s, 1H), 4.95 (d, 1H), 4.91 (d, 1H), 4.65 (s, 2H), 4.35-4.30 (m, 1H), 4.20-4.17 (m, 1H), 3.72-3.66 (m, 2H), 3.62-3.59 (m, 2H), 3.58-3.53 (m, 5H), 3.37 (s, 3H).

Аналогично приведенным выше и указанным в соответствующих местах примерам получения, учитывая общие данные для получения замещенных N-гетероциклических и N-гетероарилтетрагидропиримидинонов, получают следующие указанные ниже соединения. Если структурный элемент определен в Таблице 1 структурной формулой, которая содержит заштрихованную линию, то эта заштрихованная линия означает, что в этом месте соответствующая группа соединена с остатком молекулы. Если структурный элемент определен в Таблице 1 структурной формулой, которая содержит стрелку, такая стрелка означает связь соответствующей группы Q с карбонильной группой в составе общей формулы (I).

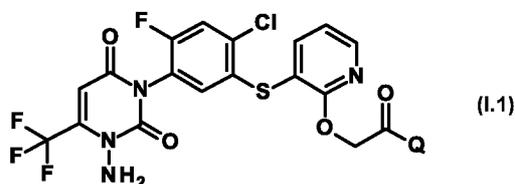


Таблица I.1: Предпочтительными соединениями формулы (I.1) являются соединения I.1-1 - I.1-486, где Q имеет значения, указанные в соответствующей строке Таблицы 1. Таким образом, соединения I.1-1 - I.1-486 Таблицы I.1 определяются значением соответствующих записей № 1 - 486 для Q Таблицы 1.

Таблица 1:

№	Q
1	Q-1
2	Q-2
3	Q-3
4	Q-4
5	Q-5
6	Q-6
7	Q-7
8	Q-8
9	Q-9
10	Q-10
11	Q-11
12	Q-12
13	Q-13
14	Q-14
15	Q-15
16	Q-16
17	Q-17
18	Q-18
19	Q-19
20	Q-20
21	Q-21
22	Q-22
23	Q-23
24	Q-24
25	Q-25
26	Q-26
27	Q-27
28	Q-28
29	Q-29
30	Q-30

№	Q
31	Q-31
32	Q-32
33	Q-33
34	Q-34
35	Q-35
36	Q-36
37	Q-37
38	Q-38
39	Q-39
40	Q-40
41	Q-41
42	Q-42
43	Q-43
44	Q-44
45	Q-45
46	Q-46
47	Q-47
48	Q-48
49	Q-49
50	Q-50
51	Q-51
52	Q-52
53	Q-53
54	Q-54
55	Q-55
56	Q-56
57	Q-57
58	Q-58
59	Q-59
60	Q-60
61	Q-61

№	Q
62	Q-62
63	Q-63
64	Q-64
65	Q-65
66	Q-66
67	Q-67
68	Q-68
69	Q-69
70	Q-70
71	Q-71
72	Q-72
73	Q-73
74	Q-74
75	Q-75
76	Q-76
77	Q-77
78	Q-78
79	Q-79
80	Q-80
81	Q-81
82	Q-82
83	Q-83
84	Q-84
85	Q-85
86	Q-86
87	Q-87
88	Q-88
89	Q-89
90	Q-90
91	Q-91
92	Q-92

№	Q
93	Q-93
94	Q-94
95	Q-95
96	Q-96
97	Q-97
98	Q-98
99	Q-99
100	Q-100
101	Q-101
102	Q-102
103	Q-103
104	Q-104
105	Q-105
106	Q-106
107	Q-107
108	Q-108
109	Q-109
110	Q-110
111	Q-111
112	Q-112
113	Q-113
114	Q-114
115	Q-115
116	Q-116
117	Q-117
118	Q-118
119	Q-119
120	Q-120
121	Q-121
122	Q-122
123	Q-123

№	Q
124	Q-124
125	Q-125
126	Q-126
127	Q-127
128	Q-128
129	Q-129
130	Q-130
131	Q-131
132	Q-132
133	Q-133
134	Q-134
135	Q-135
136	Q-136
137	Q-137
138	Q-138
139	Q-139
140	Q-140
141	Q-141
142	Q-142
143	Q-143
144	Q-144
145	Q-145
146	Q-146
147	Q-147
148	Q-148
149	Q-149
150	Q-150
151	Q-151
152	Q-152
153	Q-153
154	Q-154

№	Q
155	Q-155
156	Q-156
157	Q-157
158	Q-158
159	Q-159
160	Q-160
161	Q-161
162	Q-162
163	Q-163
164	Q-164
165	Q-165
166	Q-166
167	Q-167
168	Q-168
169	Q-169
170	Q-170
171	Q-171
172	Q-172
173	Q-173
174	Q-174
175	Q-175
176	Q-176
177	Q-177
178	Q-178
179	Q-179
180	Q-180
181	Q-181
182	Q-182
183	Q-183
184	Q-184
185	Q-185

№	Q
186	Q-186
187	Q-187
188	Q-188
189	Q-189
190	Q-190
191	Q-191
192	Q-192
193	Q-193
194	Q-194
195	Q-195
196	Q-196
197	Q-197
198	Q-198
199	Q-199
200	Q-200
201	Q-201
202	Q-202
203	Q-203
204	Q-204
205	Q-205
206	Q-206
207	Q-207
208	Q-208
209	Q-209
210	Q-210
211	Q-211
212	Q-212
213	Q-213
214	Q-214
215	Q-215
216	Q-216

№	Q
217	Q-217
218	Q-218
219	Q-219
220	Q-220
221	Q-221
222	Q-222
223	Q-223
224	Q-224
225	Q-225
226	Q-226
227	Q-227
228	Q-228
229	Q-229
230	Q-230
231	Q-231
232	Q-232
233	Q-233
234	Q-234
235	Q-235
236	Q-236
237	Q-237
238	Q-238
239	Q-239
240	Q-240
241	Q-241
242	Q-242
243	Q-243
244	Q-244
245	Q-245
246	Q-246
247	Q-247

№	Q
248	Q-248
249	Q-249
250	Q-250
251	Q-251
252	Q-252
253	Q-253
254	Q-254
255	Q-255
256	Q-256
257	Q-257
258	Q-258
259	Q-259
260	Q-260
261	Q-261
262	Q-262
263	Q-263
264	Q-264
265	Q-265
266	Q-266
267	Q-267
268	Q-268
269	Q-269
270	Q-270
271	Q-271
272	Q-272
273	Q-273
274	Q-274
275	Q-275
276	Q-276
277	Q-277
278	Q-278

№	Q
279	Q-279
280	Q-280
281	Q-281
282	Q-282
283	Q-283
284	Q-284
285	Q-285
286	Q-286
287	Q-287
288	Q-288
289	Q-289
290	Q-290
291	Q-291
292	Q-292
293	Q-293
294	Q-294
295	Q-295
296	Q-296
297	Q-297
298	Q-298
299	Q-299
300	Q-300
301	Q-301
302	Q-302
303	Q-303
304	Q-304
305	Q-305
306	Q-306
307	Q-307
308	Q-308
309	Q-309

№	Q
310	Q-310
311	Q-311
312	Q-312
313	Q-313
314	Q-314
315	Q-315
316	Q-316
317	Q-317
318	Q-318
319	Q-319
320	Q-320
321	Q-321
322	Q-322
323	Q-323
324	Q-324
325	Q-325
326	Q-326
327	Q-327
328	Q-328
329	Q-329
330	Q-330
331	Q-331
332	Q-332
333	Q-333
334	Q-334
335	Q-335
336	Q-336
337	Q-337
338	Q-338
339	Q-339
340	Q-340

№	Q
341	Q-341
342	Q-342
343	Q-343
344	Q-344
345	Q-345
346	Q-346
347	Q-347
348	Q-348
349	Q-349
350	Q-350
351	Q-351
352	Q-352
353	Q-353
354	Q-354
355	Q-355
356	Q-356
357	Q-357
358	Q-358
359	Q-359
360	Q-360
361	Q-361
362	Q-362
363	Q-363
364	Q-364
365	Q-365
366	Q-366
367	Q-367
368	Q-368
369	Q-369
370	Q-370
371	Q-371

№	Q
372	Q-372
373	Q-373
374	Q-374
375	Q-375
376	Q-376
377	Q-377
378	Q-378
379	Q-379
380	Q-380
381	Q-381
382	Q-382
383	Q-383
384	Q-384
385	Q-385
386	Q-386
387	Q-387
388	Q-388
389	Q-389
390	Q-390
391	Q-391
392	Q-392
393	Q-393
394	Q-394
395	Q-395
396	Q-396
397	Q-397
398	Q-398
399	Q-399
400	Q-400
401	Q-401
402	Q-402

№	Q
403	Q-403
404	Q-404
405	Q-405
406	Q-406
407	Q-407
408	Q-408
409	Q-409
410	Q-410
411	Q-411
412	Q-412
413	Q-413
414	Q-414
415	Q-415
416	Q-416
417	Q-417
418	Q-418
419	Q-419
420	Q-420
421	Q-421
422	Q-422
423	Q-423
424	Q-424
425	Q-425
426	Q-426
427	Q-427
428	Q-428
429	Q-429
430	Q-430
431	Q-431
432	Q-432
433	Q-433

№	Q
434	Q-434
435	Q-435
436	Q-436
437	Q-437
438	Q-438
439	Q-439
440	Q-440
441	Q-441
442	Q-442
443	Q-443
444	Q-444
445	Q-445
446	Q-446
447	Q-447
448	Q-448
449	Q-449
450	Q-450
451	Q-451
452	Q-452
453	Q-453
454	Q-454
455	Q-455
456	Q-456
457	Q-457
458	Q-458
459	Q-459
460	Q-460
461	Q-461
462	Q-462
463	Q-463
464	Q-464

№	Q
465	Q-465
466	Q-466
467	Q-467
468	Q-468
469	Q-469
470	Q-470
471	Q-471
472	Q-472
473	Q-473
474	Q-474
475	Q-475
476	Q-476
477	Q-477
478	Q-478
479	Q-479
480	Q-480
481	Q-481
482	Q-482
483	Q-483
484	Q-484
485	Q-485
486	Q-486

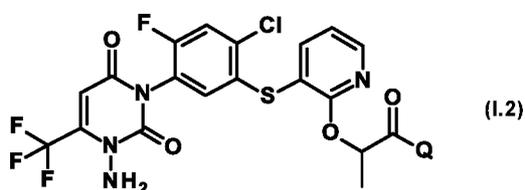


Таблица I.2: Предпочтительными соединениями формулы (I.2) являются соединения I.2-1 - I.2-486, где Q имеет значения, указанные в соответствующей строке Таблицы 1. Таким образом, соединения I.2-1 - I.2-486 Таблицы I.2 определяются значением соответствующих записей № 1 - 486 для Q Таблицы 1.

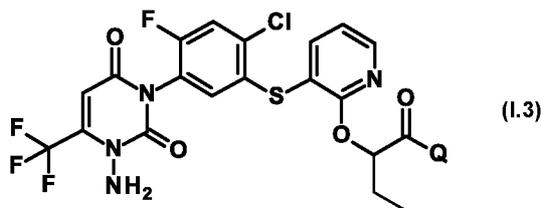


Таблица I.3: Предпочтительными соединениями формулы (I.3) являются соединения I.3-1 - I.3-486, где Q имеет значения, указанные в соответствующей строке Таблицы 1. Таким образом, соединения I.3-1 - I.3-486 Таблицы I.3 определяются значением соответствующих записей № 1 - 486 для Q Таблицы 1.

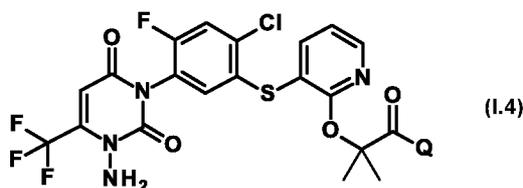


Таблица I.4: Предпочтительными соединениями формулы (I.4) являются соединения I.4-1 - I.4-486, где Q имеет значения, указанные в соответствующей строке Таблицы 1. Таким образом, соединения I.4-1 - I.4-486 Таблицы I.4 определяются значением соответствующих записей № 1 - 486 для Q Таблицы 1.

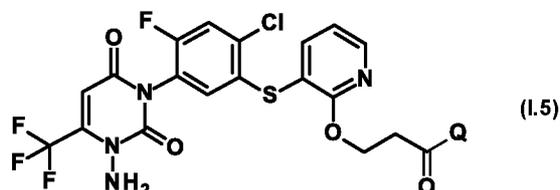


Таблица I.5: Предпочтительными соединениями формулы (I.5) являются соединения I.5-1 - I.5-486, где Q имеет значения, указанные в соответствующей строке Таблицы 1. Таким образом, соединения I.5-1 - I.5-486 Таблицы I.5 определяются значением соответствующих записей № 1 - 486 для Q Таблицы 1.

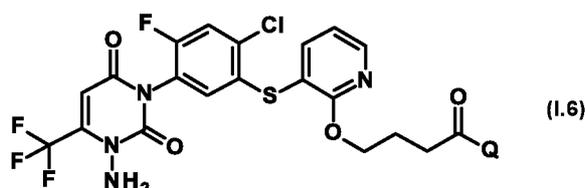


Таблица I.6: Предпочтительными соединениями формулы (I.6) являются соединения I.6-1 - I.6-486, где Q имеет значения, указанные в соответствующей строке Таблицы 1.

строке Таблицы 1. Таким образом, соединения I.6-1 - I.6-486 Таблицы I.6 определяются значением соответствующих записей № 1 - 486 для Q Таблицы 1.

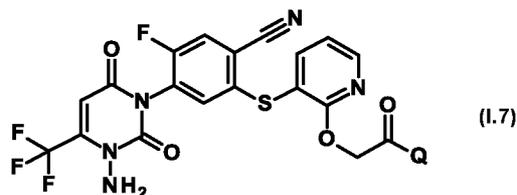


Таблица I.7: Предпочтительными соединениями формулы (I.7) являются соединения I.7-1 - I.7-486, где Q имеет значения, указанные в соответствующей строке Таблицы 1. Таким образом, соединения I.7-1 - I.7-486 Таблицы 7.1 определяются значением соответствующих записей № 1 - 486 для Q Таблицы 1.

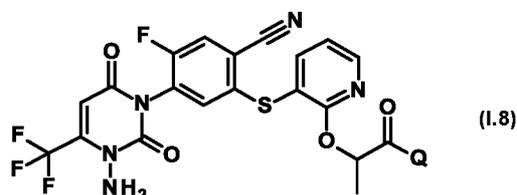


Таблица I.8: Предпочтительными соединениями формулы (I.8) являются соединения I.8-1 - I.8-486, где Q имеет значения, указанные в соответствующей строке Таблицы 1. Таким образом, соединения I.8-1 - I.8-486 Таблицы 8.1 определяются значением соответствующих записей № 1 - 486 для Q Таблицы 1.

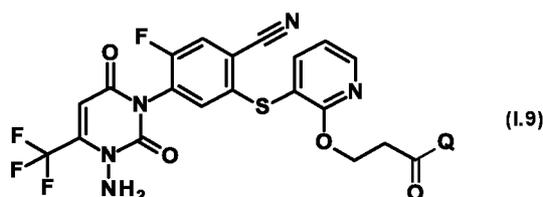


Таблица I.9: Предпочтительными соединениями формулы (I.9) являются соединения I.9-1 - I.9-486, где Q имеет значения, указанные в соответствующей строке Таблицы 1. Таким образом, соединения I.9-1 - I.9-486 Таблицы I.9 определяются значением соответствующих записей № 1 - 486 для Q Таблицы 1.

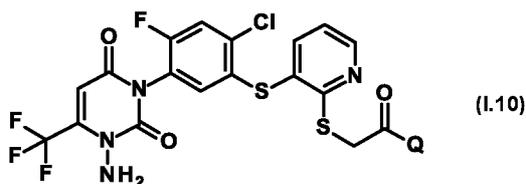


Таблица I.10: Предпочтительными соединениями формулы (I.10) являются соединения I.10-1 - I.10-486, где Q имеет значения, указанные в соответствующей строке Таблицы 1. Таким образом, соединения I.10-1 - I.10-486 Таблицы I.1 определяются значением соответствующих записей № 1 - 486 для Q Таблицы 1.

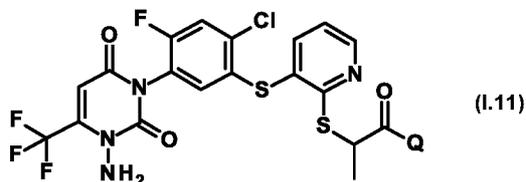


Таблица I.11: Предпочтительными соединениями формулы (I.11) являются соединения I.11-1 - I.11-486, где Q имеет значения, указанные в соответствующей строке Таблицы 1. Таким образом, соединения I.11-1 - I.11-486 Таблицы I.11 определяются значением соответствующих записей № 1 - 486 для Q Таблицы 1.

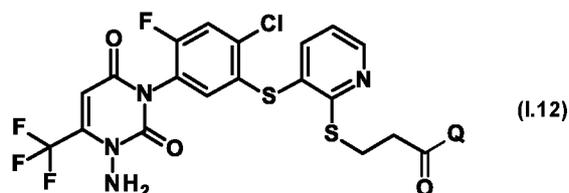


Таблица I.12: Предпочтительными соединениями формулы (I.12) являются соединения I.12-1 - I.12-486, где Q имеет значения, указанные в соответствующей строке Таблицы 1. Таким образом, соединения I.12-1 - I.12-486 Таблицы I.12 определяются значением соответствующих записей № 1 - 486 для Q Таблицы 1.

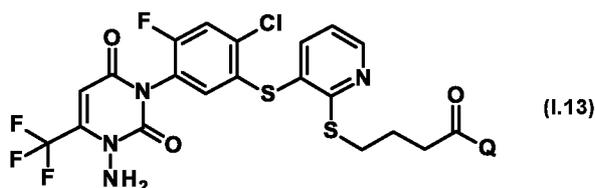


Таблица I.13: Предпочтительными соединениями формулы (I.13) являются соединения I.13-1 - I.13-486, где Q имеет значения, указанные в соответствующей строке Таблицы 1. Таким образом, соединения I.13-1 - I.13-486 Таблицы I.13 определяются значением соответствующих записей № 1 - 486 для Q Таблицы 1.

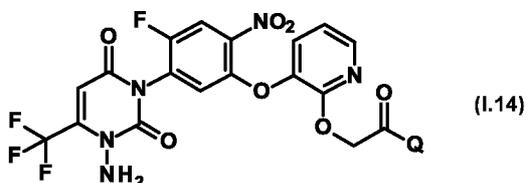


Таблица I.14: Предпочтительными соединениями формулы (I.14) являются соединения I.14-1 - I.14-486, где Q имеет значения, указанные в соответствующей строке Таблицы 1. Таким образом, соединения I.14-1 - I.14-486 Таблицы I.14 определяются значением соответствующих записей № 1 - 486 для Q Таблицы 1.

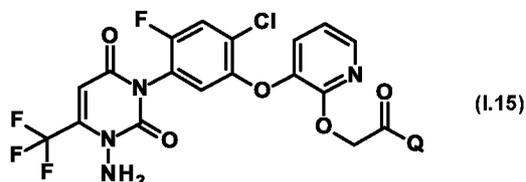


Таблица I.15: Предпочтительными соединениями формулы (I.15) являются соединения I.15-1 - I.15-486, где Q имеет значения, указанные в соответствующей строке Таблицы 1. Таким образом, соединения I.15-1 - I.15-486 Таблицы I.15 определяются значением соответствующих записей № 1 - 486 для Q Таблицы 1.

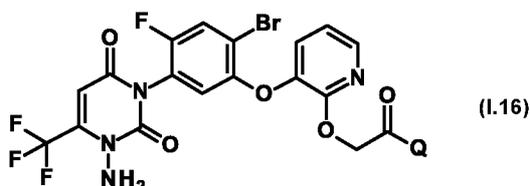


Таблица I.16: Предпочтительными соединениями формулы (I.16) являются соединения I.16-1 - I.16-486, где Q имеет значения, указанные в соответствующей строке Таблицы 1. Таким образом, соединения I.16-1 - I.16-486 Таблицы I.16 определяются значением соответствующих записей № 1 - 486 для Q Таблицы 1.

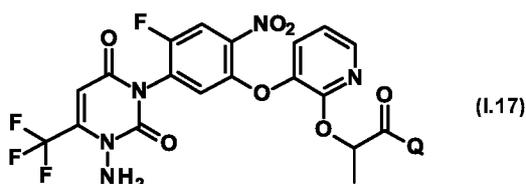


Таблица I.17: Предпочтительными соединениями формулы (I.17) являются соединения I.17-1 - I.17-486, где Q имеет значения, указанные в соответствующей строке Таблицы 1. Таким образом, соединения I.17-1 - I.17-486 Таблицы I.17 определяются значением соответствующих записей № 1 - 486 для Q Таблицы 1.

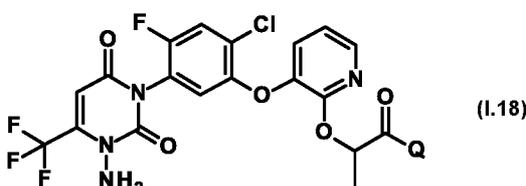


Таблица I.18: Предпочтительными соединениями формулы (I.18) являются соединения I.18-1 - I.18-486, где Q имеет значения, указанные в соответствующей строке Таблицы 1. Таким образом, соединения I.18-1 - I.18-486 Таблицы I.18 определяются значением соответствующих записей № 1 - 486 для Q Таблицы 1.

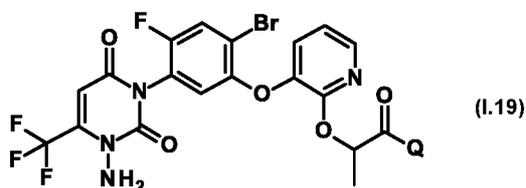


Таблица I.19: Предпочтительными соединениями формулы (I.19) являются соединения I.19-1 - I.19-486, где Q имеет значения, указанные в соответствующей строке Таблицы 1. Таким образом, соединения I.19-1 - I.19-486 Таблицы I.19 определяются значением соответствующих записей № 1 - 486 для Q Таблицы 1.

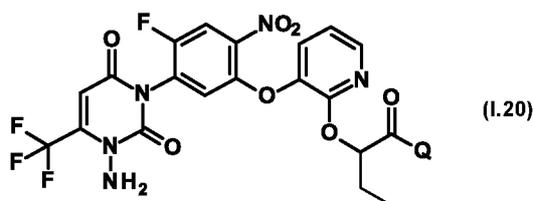


Таблица I.20: Предпочтительными соединениями формулы (I.20) являются соединения I.20-1 - I.20-486, где Q имеет значения, указанные в соответствующей строке Таблицы 1. Таким образом, соединения I.20-1 - I.20-486 Таблицы I.20 определяются значением соответствующих записей № 1 - 486 для Q Таблицы 1.

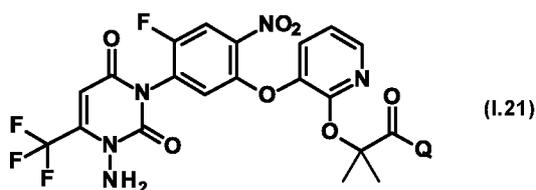


Таблица I.21: Предпочтительными соединениями формулы (I.21) являются соединения I.21-1 - I.21-486, где Q имеет значения, указанные в соответствующей строке Таблицы 1. Таким образом, соединения I.21-1 - I.21-486 Таблицы I.21 определяются значением соответствующих записей № 1 - 486 для Q Таблицы 1.

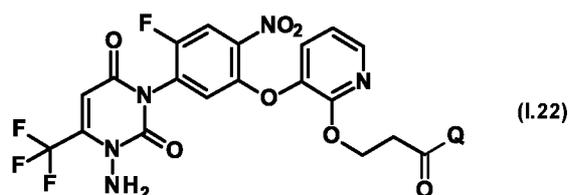


Таблица I.22: Предпочтительными соединениями формулы (I.22) являются соединения I.22-1 - I.22-486, где Q имеет значения, указанные в соответствующей строке Таблицы 1. Таким образом, соединения I.22-1 - I.22-486 Таблицы I.22 определяются значением соответствующих записей № 1 - 486 для Q Таблицы 1.

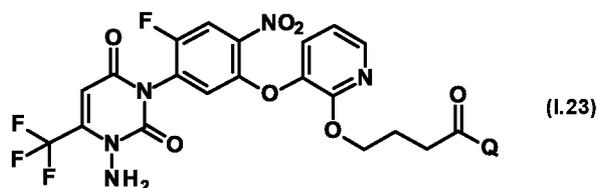


Таблица I.23: Предпочтительными соединениями формулы (I.23) являются соединения I.23-1 - I.23-486, где Q имеет значения, указанные в соответствующей строке Таблицы 1. Таким образом, соединения I.23-1 - I.23-486 Таблицы I.23 определяются значением соответствующих записей № 1 - 486 для Q Таблицы 1.

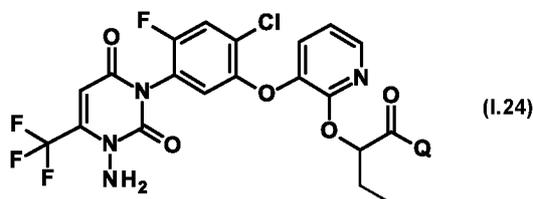


Таблица I.24: Предпочтительными соединениями формулы (I.24) являются соединения I.24-1 - I.24-486, где Q имеет значения, указанные в соответствующей строке Таблицы 1. Таким образом, соединения I.24-1 - I.24-486 Таблицы I.24 определяются значением соответствующих записей № 1 - 486 для Q Таблицы 1.

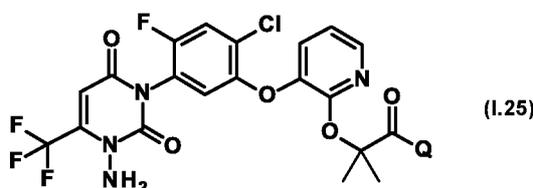


Таблица I.25: Предпочтительными соединениями формулы (I.25) являются соединения I.25-1 - I.25-486, где Q имеет значения, указанные в соответствующей строке Таблицы 1.

строке Таблицы 1. Таким образом, соединения I.25-1 - I.25-486 Таблицы I.25 определяются значением соответствующих записей № 1 - 486 для Q Таблицы 1.

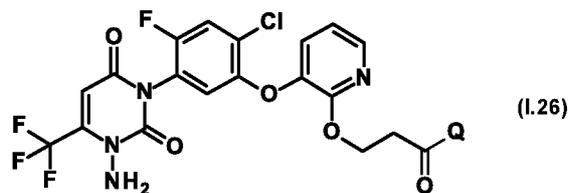


Таблица I.26: Предпочтительными соединениями формулы (I.26) являются соединения I.26-1 - I.26-486, где Q имеет значения, указанные в соответствующей строке Таблицы 1. Таким образом, соединения I.26-1 - I.26-486 Таблицы I.26 определяются значением соответствующих записей № 1 - 486 для Q Таблицы 1.

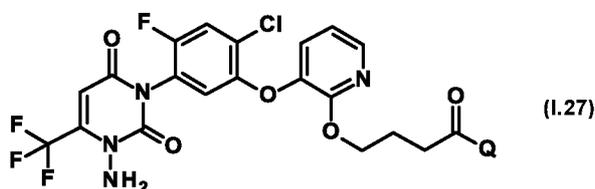


Таблица I.27: Предпочтительными соединениями формулы (I.27) являются соединения I.27-1 - I.27-486, где Q имеет значения, указанные в соответствующей строке Таблицы 1. Таким образом, соединения I.27-1 - I.27-486 Таблицы I.27 определяются значением соответствующих записей № 1 - 486 для Q Таблицы 1.

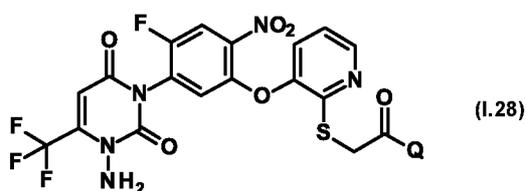


Таблица I.28: Предпочтительными соединениями формулы (I.28) являются соединения I.28-1 - I.28-486, где Q имеет значения, указанные в соответствующей строке Таблицы 1. Таким образом, соединения I.28-1 - I.28-486 Таблицы I.28 определяются значением соответствующих записей № 1 - 486 для Q Таблицы 1.

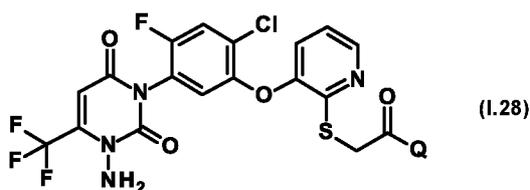


Таблица I.29: Предпочтительными соединениями формулы (I.29) являются соединения I.29-1 - I.29-486, где Q имеет значения, указанные в соответствующей строке Таблицы 1. Таким образом, соединения I.29-1 - I.29-486 Таблицы I.29 определяются значением соответствующих записей № 1 - 486 для Q Таблицы 1.

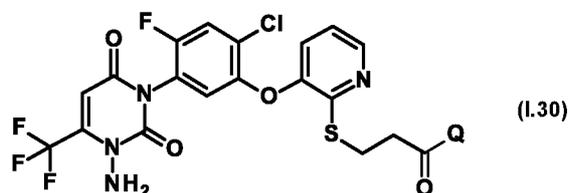


Таблица I.30: Предпочтительными соединениями формулы (I.30) являются соединения I.30-1 - I.30-486, где Q имеет значения, указанные в соответствующей строке Таблицы 1. Таким образом, соединения I.30-1 - I.30-486 Таблицы I.30 определяются значением соответствующих записей № 1 - 486 для Q Таблицы 1.

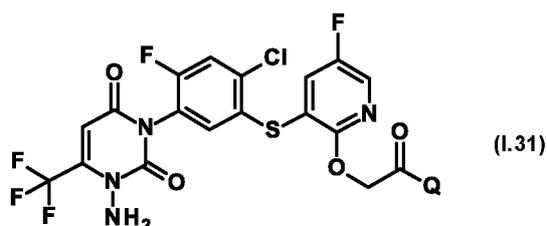


Таблица I.31: Предпочтительными соединениями формулы (I.31) являются соединения I.31-1 - I.31-486, где Q имеет значения, указанные в соответствующей строке Таблицы 1. Таким образом, соединения I.31-1 - I.31-486 Таблицы I.31 определяются значением соответствующих записей № 1 - 486 для Q Таблицы 1.

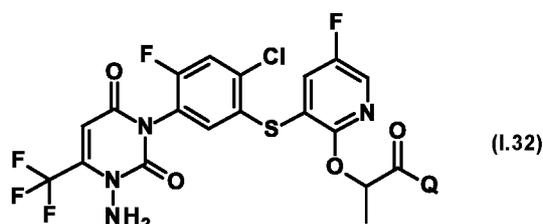


Таблица I.32: Предпочтительными соединениями формулы (I.32) являются соединения I.32-1 - I.32-486, где Q имеет значения, указанные в соответствующей строке Таблицы 1. Таким образом, соединения I.32-1 - I.32-486 Таблицы I.32 определяются значением соответствующих записей № 1 - 486 для Q Таблицы 1.

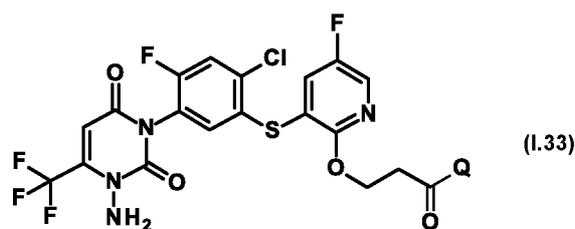


Таблица I.33: Предпочтительными соединениями формулы (I.33) являются соединения I.33-1 - I.33-486, где Q имеет значения, указанные в соответствующей строке Таблицы 1. Таким образом, соединения I.33-1 - I.33-486 Таблицы I.33 определяются значением соответствующих записей № 1 - 486 для Q Таблицы 1.

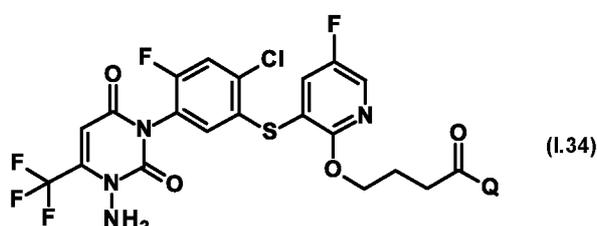


Таблица I.34: Предпочтительными соединениями формулы (I.34) являются соединения I.34-1 - I.34-486, где Q имеет значения, указанные в соответствующей строке Таблицы 1. Таким образом, соединения I.34-1 - I.34-486 Таблицы I.34 определяются значением соответствующих записей № 1 - 486 для Q Таблицы 1.

Данные ЯМР выбранных примеров: Данные  $^1\text{H}$ -ЯМР выбранных примеров общей формулы (I) приводятся различными способами, а именно (а) классическая оценка и интерпретация ЯМР, либо (b) в виде пиковых списков  $^1\text{H}$ -ЯМР в соответствии с приведенной ниже методикой.

а) классическая интерпретация ЯМР

Пример № I.1-1:

$^1\text{H}$ -NMR ( $\text{CDCl}_3$ ,  $\delta$ , ppm) 8.12 (d, 1H), 7.77 (m, 1H), 7.34 (d, 1H), 7.26 (d, 1H), 6.96 (m, 1H), 6.19 (s, 1H), 4.98-4.88 (q, 2H), 4.61 (s, 2H), 4.32-4.27 (m, 1H), 4.17-4.11 (m, 1H), 3.58-3.56 (m, 2H), 3.36 (s, 3H).

Пример № I.1-115

$^1\text{H}$ -NMR ( $\text{CDCl}_3$ ,  $\delta$ , ppm) 8.08 (m, 1H), 7.67 (m, 1H), 7.36 (d, 1H), 7.17 (d, 1H), 6.95 (m, 1H), 6.21 (s, 1H), 5.42 (квин, 1H), 5.00-4.87 (dd, 2H), 4.86-4.83 (m, 2H), 4.63-4.59 (m, 2H), 4.54 (s, 2H).

Пример № I.1-176

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ ,  $\delta$ , ppm) 8.10 (m, 1H), 7.75 (m, 1H), 7.36 (d, 1H), 7.14 (d, 1H), 6.99 (m, 1H), 6.22 (s, 1H), 4.96 (s, 2H), 4.72 (s, 1H), 4.58 (s, 2H).

Пример № I.1-286

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ ,  $\delta$ , ppm) 8.54 (m, 1H), 8.10 (m, 1H), 7.76 (m, 1H), 7.72-7.68 (m, 1H), 7.33 (d, 1H), 7.33-7.30 (m, 1H), 7.28-7.22 (m, 1H), 7.16 (d, 1H), 6.13 (s, 1H), 5.26 (d, 1H), 5.21 (d, 1H), 5.08 (d, 1H), 4.95 (d, 1H), 4.76 (s, 2H).

Пример № I.1-471:

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ ,  $\delta$ , ppm) 8.11 (d, 1H), 7.73 (m, 1H), 7.35 (d, 1H), 7.26 (d, 1H), 6.97-6.93 (m, 1H), 6.19 (s, 1H), 5.93-5.85 (m, 1H), 5.33-5.23 (m, 2H), 4.99 (d, 1H), 4.92 (d, 1H), 4.59 (m, 2H), 4.51 (s, 2H).

b) списки и способы, содержащие пики ЯМР

Данные  $^1\text{H-ЯМР}$  для выбранных примеров записывают в виде пиковых списков  $^1\text{H-ЯМР}$ . К каждому сигнальному пику сначала приводят  $\delta$ -значение в ч. на тыс. и затем указывают интенсивность сигнала в круглых скобках. Пара данных  $\delta$ -величина-интенсивность сигнала различных сигнальных пиков отделены друг от друга точкой с запятой. Поэтому пиковый список примера имеет форму:

$\delta_1$  (интенсивность $_1$ );  $\delta_2$  (интенсивность $_2$ ); .....;  $\delta_i$  (интенсивность $_i$ ); .....;  $\delta_n$  (интенсивность $_n$ )

Интенсивность четких сигналов находится в корреляции с высотой сигналов в печатном примере спектра ЯМР в см и показывает действительное соотношение интенсивности сигнала. В широких сигналах могут быть представлены несколько пиков или середина сигнала и ее относительная интенсивность по сравнению с самым интенсивным сигналом в спектре. Для калибровки химического сдвига  $^1\text{H-ЯМР}$ -спектров мы использовали тетраметилсилан и/или химический сдвиг растворителя, в частности, в случае спектров, которые измеряют в ДМСО. Поэтому в пике списков ЯМР может встречаться тетраметилсилан, но это является необязательным. Списки пиков  $^1\text{H-ЯМР}$  схожи с классическими печатными списками  $^1\text{H-ЯМР}$  и обычно содержат все пики, которые упоминают классические ЯМР-интерпретации. Кроме того, они могут, как и классические печатные списки

$^1\text{H}$ -ЯМР, показывать сигналы растворителей, стереоизомеров необходимых соединений, которые также являются предметом изобретения, и/или пики примесей. В данных сигналов соединений в дельта-области растворителей и/или воды в наших  $^1\text{H}$ -ЯМР-пиках показаны обычные пики растворителей, например, пики ДМСО в ДМСО- $\text{D}_6$  и пик воды, которые в среднем обычно обнаруживают высокую интенсивность. Пики стереоизомеров мишеневидных соединений и/или пиков примесей обычно имеют более низкую интенсивность, чем пики необходимых соединений (например, с чистотой  $>90\%$ ). Такие стереоизомеры и/или примеси могут быть типичными для соответствующих способов получения. Таким образом их пики могут помогать при распознавании воспроизведения нашего способа получения при помощи "опознания по характерным признакам" побочного продукта. Эксперт, который оценивает пики необходимых соединений с помощью известных способов (MestreC, ACD-моделирование, или с помощью полученных опытным путем, анализируемых ожидаемых значений), по мере необходимости может изолировать пики необходимых соединений, причем при необходимости применяют дополнительный фильтр интенсивности. Такое изолирование было бы похоже на упомянутое отображение пиков в классической интерпретации  $^1\text{H}$ -ЯМР. Другие детали  $^1\text{H}$ -ЯМР пиковых списков можно взять из теоретической базы научных исследований Research Disclosure Database № 564025.

I.31-1:  $^1\text{H}$ -NMR(599.6 MHz,  $\text{CDCl}_3$ ):

$\delta = 7.9013$  (8.2); 7.8966 (8.2); 7.4147 (4.0); 7.4099 (3.8); 7.4023 (4.2); 7.3976 (3.9); 7.3923 (6.3); 7.3861 (6.8); 7.3801 (6.4); 7.3711 (6.5); 7.2609 (13.8); 6.9275 (0.3); 6.2150 (13.9); 4.9445 (2.3); 4.9179 (11.7); 4.9070 (11.5); 4.8803 (2.2); 4.6156 (18.3); 4.3155 (1.5); 4.3070 (2.7); 4.2987 (1.8); 4.2956 (2.3); 4.2882 (2.5); 4.2860 (2.6); 4.2788 (2.0); 4.1948 (2.0); 4.1882 (3.0); 4.1804 (2.1); 4.1748 (1.5); 4.1677 (2.9); 4.1605 (1.4); 3.7651 (0.4); 3.7361 (0.6); 3.5981 (0.4); 3.5864 (7.1); 3.5793 (11.1); 3.5708 (5.8); 3.5581 (0.3); 3.4019 (1.1); 3.3989 (1.1); 3.3882 (0.5); 3.3651 (50.0); 2.0435 (1.3); 1.5688 (28.2); 1.2704 (0.6); 1.2651 (0.6); 1.2585 (1.1); 1.2466 (0.5); 0.8935 (0.6); 0.8820 (1.4); 0.8700 (0.7); 0.0052 (0.8); -0.0001 (18.3); -0.0056 (0.6)

I.31-442:  $^1\text{H}$ -NMR(599.6 MHz,  $\text{CDCl}_3$ ):

$\delta = 7.8899$  (11.6); 7.8852 (11.5); 7.4322 (0.4); 7.4192 (8.8); 7.4069 (9.2); 7.4005 (9.2); 7.3856 (9.0); 7.3547 (5.7); 7.3499 (5.4); 7.3422 (5.8); 7.3375 (5.1); 7.2604 (27.9); 6.2204 (19.3); 4.9135 (6.2); 4.8870 (13.8); 4.8487 (13.8); 4.8222 (6.2); 4.5478 (25.9); 4.2296 (0.3); 4.1862 (0.5); 4.1742 (1.4); 4.1683 (2.5); 4.1624 (3.8); 4.1564 (7.1); 4.1506 (7.5); 4.1444 (7.4); 4.1388 (7.2); 4.1326 (3.4); 4.1270 (3.2); 4.1209 (1.1); 4.1153 (1.0); 4.1090 (0.3); 4.1034 (0.3); 3.6847 (0.4); 2.0438 (4.4); 1.5527 (50.0); 1.3017 (0.8); 1.2919 (1.3); 1.2838 (1.4); 1.2798 (2.0); 1.2713 (18.7); 1.2594 (36.4); 1.2475 (17.6); 0.8936 (1.5); 0.8821 (3.5); 0.8701 (1.7); 0.0052 (2.2); -0.0001 (36.7); -0.0056 (1.3)

I.1-481:  $^1\text{H-NMR}$ (599.6 MHz,  $\text{CDCl}_3$ ):

$\delta$ = 8.1359 (2.5); 8.1331 (2.6); 8.1277 (2.6); 8.1248 (2.5); 7.7639 (2.5); 7.7610 (2.6); 7.7515 (2.7); 7.7486 (2.6); 7.3577 (3.9); 7.3427 (3.9); 7.2602 (39.9); 7.0566 (3.6); 7.0444 (3.6); 6.9885 (2.5); 6.9802 (2.5); 6.9761 (2.5); 6.9678 (2.4); 6.2255 (8.5); 5.2992 (6.9); 4.9646 (2.4); 4.9378 (5.0); 4.8955 (4.9); 4.8686 (2.3); 4.6087 (7.2); 2.1723 (0.5); 2.0906 (0.3); 1.3128 (0.4); 1.3016 (0.8); 1.2900 (1.0); 1.2801 (1.0); 1.2653 (2.2); 0.8937 (2.1); 0.8822 (4.9); 0.8702 (2.4); 0.0052 (2.1); -0.0001 (50.0); -0.0054 (2.0)

Далее предметом настоящего изобретения является применение одного или более соединений формулы (I) и/или их солей согласно изобретению, как описано выше, преимущественно в предпочтительной или особенно предпочтительной форме выполнения, в частности, одного или более соединений формул (I.1) - (I.34) и/или их солей, соответственно как описано выше, в качестве гербицида или регулятора роста растений, предпочтительно в культурах полезных и/или декоративных растений.

Далее предметом настоящего изобретения является способ борьбы с вредными растениями и/или регулирования роста растений, отличающийся тем, что действующее количество

- одного или более соединений формулы (I) и/или их солей согласно изобретению, как описано выше, преимущественно в предпочтительной или особенно предпочтительной форме выполнения, в частности, одного или более соединений формул (I.1) - (I.34) и/или их солей, соответственно как описано выше, или
- средства согласно изобретению, как представлено ниже, наносят на (вредные) растения, семена (вредных) растений, почву, в которой или на которой растут (вредные) растения, или на культивируемую поверхность.

Предметом настоящего изобретения также является способ борьбы с нежелательными растениями, предпочтительно в культурах полезных растений, отличающийся тем, что эффективное количество

- одного или более соединений формулы (I) и/или их солей, как описано выше, преимущественно в предпочтительной или особенно предпочтительной форме выполнения, в частности, одного или более соединений формулы (I.1) - (I.34) и/или их солей, соответственно как описано выше, или

- средства согласно изобретению, как представлено ниже, наносят на нежелательные растения (например, такие вредные растения, как одно- или двудольные сорные растения или нежелательные культурные растения), семенной материал нежелательных растений (т.е. семена растений, например, зерна, семена или вегетативные органы, как клубни или ростки с почками), на почву, в которой или на которой растут нежелательные растения, (например, на обработанную или необработанную почву) или на культивируемую поверхность (т.е. поверхность, на которой будут расти нежелательные растения).

Далее предметом настоящего изобретения является способ регулирования роста растений, предпочтительно, полезных растений, отличающийся тем, что эффективное количество

- одного или более соединений формулы (I) и/или их солей, как описано выше, преимущественно в предпочтительной или особенно предпочтительной форме выполнения, в частности, одного или более соединений формулы (I.1) - (I.34) и/или их солей, соответственно как описано выше, или
- средства согласно изобретению, как представлено ниже, наносят на растения, семенной материал (т.е. семена растений, например, зерна, семена или вегетативные органы размножения, как клубни или ростки с почками), на почву, в которой или на которой растут нежелательные растения, (например, на обработанную или необработанную почву) или на культивируемую поверхность (т.е. поверхность, на которой будут расти нежелательные растения).

При этом соединения согласно изобретению или средства согласно изобретению вносят, например, в предпосевной (при необходимости также при внесении удобрений в почву), предвсходовый и/или послевсходовый период. В частности, в качестве примеров должны быть названы представители одно- и двудольных сорных растений, которые можно контролировать с помощью соединений согласно изобретению, однако изобретение не должно ограничиваться этими названиями.

Предпочтительно в способе борьбы с вредными растениями или для регулирования роста растений применяют одно или более соединений формулы (I) и/или их соли для борьбы с вредными растениями или для регулирования роста в культурах полезных или декоративных растений, причем полезные или

декоративные растения в предпочтительной форме выполнения являются трансгенными растениями.

Соединения общей формулы (I) согласно изобретению и/или их соли подходят для борьбы со следующими видами однодольных и двудольных вредных растений:

Однодольные вредные растения видов: Aegilops (эгилопс), Agropyron (пырей), Agrostis (полевица), Alopecurus (лисохвост), Apera (метлица), Avena (овес), Brachiaria (ветвянка), Bromus (костер), Cenchrus (колючещетинник), Commelina (коммелина), Cynodon (свинойрой), Cyperus (сыть), Dactyloctenium (дактилоктениум), Digitaria (росичка), Echinochloa (ежовник), Eleocharis (болотница), Eleusine (дагусса), Eragrostis (полевица), Eriochloa (шерстяк), Festuca (овсяница), Fimbristylis (фимбристилис), Heteranthera (гетерантера), Imperata (императа), Ischaemum (бородач), Leptochloa (тонкоколосник), Lolium (плевел), Monochoria (монокория), Panicum (просо), Paspalum (паспалум), Phalaris (канареечник), Phleum (аржанец), Poa (мятлик), Rottboellia (роттбелия), Sagittaria (стрелолист), Scirpus (камыш), Setaria (щетинник), Sorghum (сорго).

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

Если соединения согласно изобретению наносят на поверхность земли перед прорастанием ростков (предвсходовый период) вредных растений (сорных трав и/или сорняков), то рост ростков сорняков полностью прекращается или сорняки растут до стадии семядоли, однако затем их рост прекращается и в конце концов они погибают в течение трех - четырех недель после начала роста.

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

Хотя соединения согласно изобретению демонстрируют отличную гербицидную активность против одно- и двудольных сорняков, культурные растения, экономически важные культуры, например, двудольные культуры вида *Arachis* (арахис), *Beta* (бета), *Brassica* (капуста), *Cucumis* (огурец), *Cucurbita* (тыква), *Helianthus* (подсолнечник), *Daucus* (морковь), *Glycine* (глицин), *Gossypium* (хлопчатник), *Ipomoea* (ипомея), *Lactuca* (латук), *Linum* (лен), *Lycopersicon* (томат), *Nicotiana* (табак), *Phaseolus* (фасоль), *Pisum* (горох), *Solanum* (паслен), *Vicia* (горошек), или однодольные культуры видов *Allium* (лук), *Ananas* (ананас), *Asparagus* (спаржа), *Avena* (овес), *Hordeum* (ячмень), *Oryza* (рис), *Panicum* (посо), *Saccharum* (сахарный тростник), *Secale* (рожь), *Sorghum* (сорго), *Triticale* (тритикале), *Triticum* (пшеница), *Zea* (кукуруза), только незначительно зависят от структуры этих соединений согласно изобретению и их норм расхода или совсем не повреждаются. Поэтому данные соединения очень хорошо подходят для селективной борьбы с нежелательным ростом растений в культурах таких растений, как сельскохозяйственных полезных, так и декоративных растений.

Кроме того, соединения общей формулы (I) согласно изобретению (в зависимости от их соответствующей структуры и применяемого количества) обнаруживают превосходные свойства регулирования роста культурных растений. Они влияют и регулируют обмен веществ растений, и это может использоваться для целенаправленного воздействия на растительные компоненты и для облегчение сбора урожая, как, например, благодаря приведению в действие десикации и прекращения роста. Далее они делают возможным общее регулирование и

задержку нежелательного вегетативного роста, не уничтожая при этом растения. Задержка нежелательного вегетативного роста играет во многих одно- и двудольных культурах большую роль, так например, этим путем сокращается или полностью прекращается их распространение.

Благодаря их гербицидным качествам и свойствам, регулирующим рост, соединения общей формулы (I) согласно изобретению также можно использовать для борьбы с вредными растениями в культурах растений, измененных с помощью генной инженерии или обычного мутагенеза. Трансгенные растения отличаются, как правило, особенно предпочтительными свойствами, например, своей резистентностью к определенным пестицидам, прежде всего, к определенным гербицидам, резистентностью к болезням растений или их возбудителям таким, как определенные насекомые или микроорганизмы, таким как грибы, бактерии или вирусы. Другие особые свойства, как правило, касаются собранного урожая, относительно количества, качества, стабильности при хранении, состава и особых компонентов. Так, известны трансгенные растения с повышенным содержанием крахмала или измененным свойством крахмала, или растения с другим составом кислоты жирного ряда в собранном урожае.

Предпочтительным относительно трансгенных культур является применение соединений согласно изобретению для экономически значимых трансгенных культурах полезных и декоративных растений, например, для таких злаковых культур, как пшеница, ячмень, рожь, овес, просо, рис, маниок и кукуруза, или также для культур сахарной свеклы, хлопка, сои, рапса, картофеля, томатов, гороха и других сортов овощей.

Предпочтительно можно применять соединения согласно изобретению в качестве гербицидов в технических культурах, которые являются устойчивыми к фитотоксичному действию гербицидов или стали устойчивыми благодаря методам генной инженерии.

Благодаря их гербицидным качествам и свойствам, регулирующим рост, действующие вещества также можно использовать для борьбы с вредными растениями в культурах известных или новых растений, измененных с помощью генной инженерии или обычного мутагенеза. Трансгенные растения отличаются, как правило, особенно предпочтительными свойствами, например, своей

резистентностью к определенным пестицидам, прежде всего, к определенным гербицидам, резистентностью к болезням растений или их возбудителям таким, как определенные насекомые или микроорганизмы, таким как грибы, бактерии или вирусы. Другие особые свойства, как правило, касаются собранного урожая, относительно количества, качества, стабильности при хранении, состава и особых компонентов. Так, известны трансгенные растения с повышенным содержанием крахмала или измененным свойством крахмала, или растения с другим составом кислоты жирного ряда в собранном урожае. Другими особыми свойствами являются толерантность или устойчивость по отношению к абиотическим стрессовым факторам, как например, жаре, холоду, засухе, повышенному содержанию солей и ультрафиолетовому излучению.

Предпочтительным является применение соединений согласно изобретению общей формулы (I) или их солей для экономически значимых трансгенных культурах полезных и декоративных растений, например, для таких злаковых культур, как пшеница, ячмень, рожь, овес, тритикале, просо, рис, маниок и кукуруза, или также для культур сахарной свеклы, хлопка, сои, рапса, картофеля, томатов, гороха и других сортов овощей.

Предпочтительно соединения общей формулы (I) можно применять в качестве гербицидов в полезных технических культурах, которые являются устойчивыми к фитотоксичному действию гербицидов или стали устойчивыми благодаря методам генной инженерии.

Обычными способами получения новых растений, которые по сравнению с ранее имеющимися растениями обнаруживают новые измененные качества, являются, например, классические методы выращивания и создания мутированных растений. Альтернативно можно получать новые растения с измененными свойствами, используя методы генной инженерии.

Специалистам известно множество молекулярно-биологических технологий, с помощью которых можно получить новые трансгенные растения с измененными свойствами. Для генно-инженерных манипуляций такого рода молекулы нуклеиновых кислот могут доставляться в плазмиды, которые допускают мутагенез или внесение изменений в нуклеотидную ДНК-последовательность. С помощью стандартных технологий может проводиться,

например, катионный обмен, удаляться частичные последовательности или добавляться природные или синтетические последовательности. Для соединения ДНК-фрагментов друг с другом к фрагментам могут прикрепляться адапторы или линкеры.

Создание клеток растений со сниженной активностью генного продукта может, например, быть достигнуто экспрессией по меньшей мере одного соответствующего антисмыслового РНК, одного смыслового РНК для извлечения РНК-интерференции или экспрессией по меньшей мере соответствующей созданной рибосомы, специфическим транскриптом указанного генного продукта.

Кроме того могут использоваться молекулы ДНК, которые охватывают общую кодированную последовательность генного продукта, включая возможные имеющиеся фланкирующие последовательности, а также и молекулы ДНК, которые охватывают только часть кодированной последовательности, причем эта часть должна быть достаточно длинной, чтобы вызвать в клетках антисмысловой эффект. Возможно также применение ДНК-последовательностей, которые указывают высокую степень гомологии кодированных последовательностей, но при этом не полностью идентичны.

При экспрессии молекул нуклеиновых кислот в растениях синтетический протеин может локализоваться в любом отделении растительной клетки. При этом, чтобы достигнуть локализации в определенном отделении, кодированная область может, например, связываться с ДНК-последовательностями, которые обеспечивают локализацию в одном определенном отделении. Такие последовательности известны специалисту (см., например, Braun et al., EMBO J. 11 (1992), 3219-3227). Экспрессия молекул нуклеиновых кислот также может происходить в органеллах растительных клеток.

Трансгенные растительные клетки могут регенерироваться известными способами в целые растения. У трансгенных растений может идти речь принципиально о растениях любых видов, т.е., как об однодольных, так и о двудольных.

Так трансгенные растения имеющиеся в продаже, могут иметь измененные свойства благодаря повышенной экспрессии, подавлению или ингибированию гомологичных (= природных) генов или генной последовательности или

экспрессии гетерологических (= чужеродных) генов или последовательности генов.

Преимущественно в трансгенных культурах могут применяться соединения согласно изобретению, которые устойчивы к стимуляторам роста, как, например, дикамба, или к гербицидам, которые сдерживают основные растительные ферменты как, например, ацетолактат-синтаза (АДС), EPSP синтаза, глутамин-синтаза (ГС) или гидроксифенилпируват диоксигеназа (ГФПДГ), или к гербицидам из группы сульфанил-мочевины, глифосата, глюфосината или бензоиллоксазола и аналогичным действующим веществам.

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

Поэтому предметом изобретения также является применение соединений общей формулы (I) и/или их солей согласно изобретению в качестве гербицидов для борьбы с вредными растениями в культурах полезных сельскохозяйственных или декоративных растений, при необходимости, в трансгенных культурных растениях.

Предпочтительным является применение в зерновых культурах, наиболее предпочтительным является применение для кукурузы, пшеницы, ячменя, овса, ржи, проса или риса в пред- или послевсходовый период.

Также предпочтительным является применение для сои в пред- или послевсходовый период.

Применение соединений согласно изобретению для борьбы с вредными растениями или для регулирования роста растений также включает в себя нанесение соединения общей формулы (I) или его соли сразу на растение, или в растение или образование в почве вещества-предшественника ("пролекарства").

Предметом изобретения также является применение одного или более соединений общей формулы (I) или их солей или средства согласно изобретению (как определено ниже) (в способе) для борьбы с вредными растениями или регулирования роста растений, отличающееся тем, что эффективное количество одного или более соединений общей формулы (I) или их солей наносят на растения (вредные растения, при необходимости вместе с полезными растениями), семена растений, на почву, в которой или на которой растут растения, или на культивируемую поверхность.

Предметом изобретения также является гербицидное средство и/или средство, регулирующее рост растений, отличающееся тем, что средство содержит

- (a) одно или более соединений общей формулы (I) и/или их соли, как описано выше, в предпочтительной или особенно предпочтительной форме выполнения, в частности, одно или более соединений формул (I.1) - (I.34) и/или их соли, соответственно как описано выше,

и

- (b) одно или более других веществ, выбранных из групп (i) и/или (ii):
  - (i) одно или более дополнительных агрохимически действующих веществ, предпочтительно выбранных из группы, состоящей из инсектидов, акарицидов, нематацидов, других гербицидов (т.е. тех, которые не соответствуют названной формуле (I)), фунгицидов, защитных средств, удобрений и/или других регуляторов роста,
  - (ii) одно или более обычных вспомогательных средств для препаративных форм.

Другие агрохимические действующие соли компонента (i) средства согласно изобретению при этом предпочтительно выбраны из группы веществ, которые указаны в "The Pesticide Manual", 16-е изд., Британский совет по растениеводству и Королевское химическое общество, 2012 г.

Гербицидное средство или средство, регулирующее рост растений, предпочтительно содержит одно, два, три или более обычных для защиты растений вспомогательных средств композиций (ii), выбранной из группы, состоящей из ПАВов, эмульгаторов, диспергаторов, плёнкообразователей, сгустителей, неорганических солей, дуста, твердых при 25 °C и 1013 мбар наполнителей,

предпочтительно абсорбирующих, гранулированных инертных материалов, смачивателей, антиокислителей, стабилизаторов, буферных веществ, активспенивателей, воды, органических растворителей, предпочтительно смешиваемых при 25 °С и 1013 мбар с водой в любом соотношении органических растворителей.

Согласно изобретению соединения общей формулы (I) могут использоваться в форме порошка для впрыскивания, эмульгируемых концентратов, растворов для опрыскивания, средств для распыления или гранулятов в виде других препаратов. Предметом изобретения поэтому также являются гербицидные и регулирующие рост растений средства, которые содержат соединения общей формулы (I) и/или их соли.

Соединения общей формулы (I) согласно изобретению могут иметь различные формулы, в зависимости от заданных биологических и/или физико-химических параметров. Например, в качестве возможных элементов формулы рассматриваются следующие компоненты: Порошки для опрыскивания (WP), водорастворимые порошки (SP), водорастворимые концентраты, концентраты, образующие эмульсии (EC), эмульсии (EW), как эмульсии типа "масло в воде" и "вода в масле", растворы для опрыскивания, концентраты суспензий (SC), диспергирование в масляной или водной фазе, растворы масляных эмульсий, капсульные суспензии (CS), средство для распыления (DP), протравители, грануляты для рассыпания и обработки почвы, грануляты (GR) в форме микрогранул, грануляты для рассеивания, грануляты в оболочке и грануляты для абсорбции, водно-диспергируемые грануляты (WG), водорастворимые грануляты (SG), ULV-композиции, микрокапсулы и воски.

Эти отдельные типы композиций и вспомогательные средства композиций, как инертные вещества, ПАВы, растворители и другие добавки в принципе являются известными специалисту и описаны, например, в Watkins, "Handbook of Insecticide Dust Diluents and Carriers", 2-ое Изд., Darland Books, Caldwell N.J., H.v. Olphen, "Introduction to Clay Colloid Chemistry"; 2-ое Изд., J. Wiley & Sons, N.Y.; C. Marsden, "Solvents Guide"; 2-ое Изд., Interscience, N.Y. 1963; McCutcheon's "Detergents and Emulsifiers Annual", MC Publ. Corp., Ridgewood N.J.; Sisley and Wood, "Encyclopedia of Surface Active Agents", Chem. Publ. Co. Inc., N.Y. 1964; Schönfeldt, "Grenzflächenaktive Äthylenoxidaddukte", Wiss. Verlagsgesellschaft,

Штуттгарт 1976; Winnacker-Küchler, "Chemische Technologie", том 7, С. Hanser Verlag München, 4. Aufl. 1986.

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

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

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

Суспензионные концентраты могут иметь водную или масляную основу. Их можно получить, например, при влажном измельчении с помощью стандартных бисерных мельниц, при необходимости с добавлением ПАВ, как например, уже было названо в других типах композиций.

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

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

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

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

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

Агрохимические композиции, предпочтительно гербицидные композиции или средства, регулирующие рост растений данного изобретения предпочтительно присутствуют, как правило, в количестве 0,1 - 99 мас.%, предпочтительно 0,5 - 95 мас.%, более предпочтительно 1 - 90 мас.%, еще более предпочтительно 2 - 80 мас.%, от количества действующих веществ общей формулы (I) и их солей.

В порошках для опыливания концентрация действующего вещества составляет, например, 10 - 90 мас.% остатка к 100 мас.% из обычных компонентов композиции. В эмульгируемых концентратах концентрация биологически активного вещества может составлять примерно 1 - 90, предпочтительно 5 - 80 массовых %. Пылевидные композиции содержат 1 - 30 мас.% действующего вещества, предпочтительно, по меньшей мере, 5 - 20 мас.% действующего вещества, растворы для рассыпания содержат, примерно 0,05 - 80, предпочтительно 2 - 50 мас.% действующего вещества. В вододиспергируемых гранулятах содержание активного компонента частично зависит от того, присутствует ли действующее соединение в жидком или твердом виде и какие гранулирующие вспомогательные вещества, наполнители, и т.д. используются. В диспергируемых в воде гранулятах содержание действующего вещества составляет, например, 1 - 95 мас.%, предпочтительно 10 - 80 мас.%.

Наряду с этим названные соединения активных действующих веществ при необходимости содержат обычные схватывающие, смачивающие, диспергирующие, эмульгирующие, проникающие, консервирующие вещества, вещества, защищающие от мороза и растворители, наполнители, носители, красители, пеногасители, тормозные испарители и антитранспираты и средства, влияющие на уровень pH и вязкость. Примеры вспомогательных средств композиции описаны также в "Chemistry and Technology of Agrochemical Formulations", изд. D. A. Knowles, Kluwer Academic Publishers (1998).

Соединения формулы (I) или их соли также можно применять в чистом виде или комбинированно в виде их смесей (композиций) с другими веществами пестицидного действия, как например, инсектициды, акарициды, нематацидами, гербициды, фунгициды, защитные средства, удобрения и/или регуляторы роста, например, в виде готовых композиций или при смешивании в емкости. При этом можно получать комбинированные композиции на основе вышеназванных

композиций, причем следует учитывать физические свойства и стабильность комбинируемых действующих веществ.

В качестве комбинирующих партнеров для соединений согласно изобретению общей формулы (I) в смешанных композициях или при смешивании в емкости применяют, например, известные действующие вещества, которые основываются, например, на ингибировании, например, фермента ацетолактатсинтазы, энзима ацетил-СоА-карбоксилазы, целлюлозосинтазы, енолпируват шикимат-3-фосфат-синтазы, глютамин-синтазы, р-гидроксифенилпируват-диоксигеназы, фитоен-десатуразы, фотосистемы I, фотосистемы II, протопорфириноген-оксидазы, как описано, например, в Weed Research 26 (1986) 441-445 или "The Pesticide Manual", 16-ое издание, The British Crop Protection Council and the Royal Soc. of Chemistry, 2012 и упомянутой там литературе.

Особый интерес представляет борьба с вредными растениями в культурах полезных сельскохозяйственных и декоративных растений. Несмотря на то, что соединения общей формулы (I) согласно изобретению во многих культурах обнаруживают очень хорошую или даже превосходную селективность, в других культурах и, прежде всего также при использовании смесей с другими гербицидами, которые являются менее селективными, на культурных растениях возникает фитотоксичность. Соответственно особый интерес представляют комбинации соединений согласно изобретению общей формулы (I), которые содержат соединения (I) или их комбинации с другими гербицидами или пестицидами и защитными средствами. Применяют защитные средства, которые являются антидотом, они уменьшают фитотоксичные побочные воздействия применяемых гербицидов/пестицидов, например, в экономически значимых культурах, таких как зерновые культуры (пшеница, овес, рожь, кукуруза, рис, ячмень), сахарной свекле, сахарном тростнике, рапсе, хлопке и сое, предпочтительно в зерновых культурах.

Массовое соотношение гербицидов (гербицидной смеси) к защитным средствам в общем зависит от нормы расхода гербицида и эффективности соответствующего защитного средства и может варьироваться в пределах широких границ, например, 200:1 - 1:200, предпочтительно 100:1 - 1:100, особенно предпочтительно 20:1 - 1:20. Защитные средства можно изготавливать аналогично

соединениям общей формулы (I) или их смесям с другими гербицидами/пестицидами и получать в виде готовой к использованию композиции или при смешивании в емкости с гербицидами и применять.

Для применения присутствующие в обычном виде гербицидные композиции или композиции гербицид-защитное средство при необходимости разбавляют обычным способом с водой, например, в виде порошков для распыления, эмульгируемых концентратов, дисперсий и диспергируемых в воде гранулятов. Пылевидные композиции, почвенные грануляты или грануляты, а также растворы для распыления перед применением обычно не разбавляют другими инертными веществами.

Внешние условия, такие как температура, влажность и т.д. частично влияют на применяемое количество соединений формулы (I) и/или их солей. При этом нормы расхода могут варьироваться в широких пределах. Для применения в качестве гербицида для борьбы с вредными растениями общее количество соединений общей формулы (I) и их солей предпочтительно составляет 0,001 - 10,0 кг/га, более предпочтительно 0,005 - 5 кг/га, еще более предпочтительно 0,01 - 1,5 кг/га, особенно предпочтительно 0,05 - 1 кг/га. Это относится к применению в предвсходовый или послевсходовый период.

При использовании соединений согласно изобретению общей формулы (I) и/или их солей в качестве регуляторов роста растений, например, в качестве средств, укорачивающих стебель растений, в культурных растениях, которые были названы выше, предпочтительно в культурах зерновых растений, как пшеница, ячмень, рожь, тритикале, овес, рис или кукуруза, общее применяемое количество предпочтительно составляет 0,001 - 2 кг/га, более предпочтительно 0,005 - 1 кг/га, еще более предпочтительно 10 - 500 г/га, особенно предпочтительно 20 - 250 г/га. Это относится к применению в предвсходовый или послевсходовый период.

Нанесение в качестве средств, укорачивающих стебель растений, можно проводить на различных стадиях роста растений. Предпочтительным, например, является применение после возникновения поросли в начале роста.

Альтернативно при применении в качестве регуляторов роста растений также принимают во внимание обработку семенного материала, которая включает в себя различные технологии протравки семян и технологии нанесения. При этом

нормы расхода зависят от отдельных технологий и могут быть заранее рассчитаны во время предварительных испытаний.

В качестве комбинирующих партнеров для соединений согласно изобретению общей формулы (I) в смешанных композициях или при смешивании в емкости применяют, например, известные действующие вещества, которые основываются, например, на ингибировании, например, фермента ацетолактатсинтазы, энзима ацетил-СоА-карбоксилазы, целлюлозосинтазы, енолпируват шикимат-3-фосфат-синтазы, глютамин-синтазы, р-гидроксифенилпируват-диоксигеназы, фитоен-десатуразы, фотосистемы I, фотосистемы II, протопорфириноген-оксидазы, которые описаны, например, в Weed Research 26 (1986) 441-445 или "The Pesticide Manual", 16-ое издание, The British Crop Protection Council und the Royal Soc. of Chemistry, 2012 и в цитируемой там литературе. Далее в качестве примеров названы известные гербициды или регуляторы роста растений, которые можно комбинировать с соединениями согласно изобретению, причем эти действующие вещества или указаны под "общим названием" в английском варианте согласно Международной организации по стандартизации (ИСО) или под химическим названием или имеют кодовый номер. При этом присутствуют все формы применения, как например, кислоты, соли, эфиры, а также все изомерные формы, как стереоизомеры и оптические изомеры, также даже если они прямо не указаны.

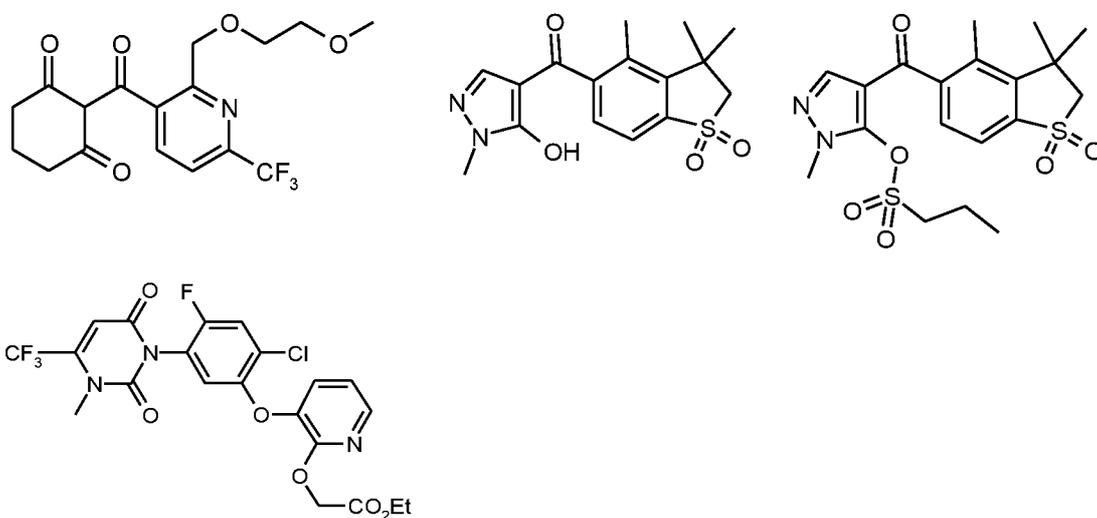
Примерами таких гербицидных партнеров для смешивания являются:

ацетохлор, ацифлуорфен, ацифлуорфен-натрий, аклонифен, алахлор, аллидохлор, аллоксидим, аллоксидим-натрий, аметрин, амикарбазон, амидохлор, амидосульфурон, 4-амино-3-хлор-6-(4-хлор-2-фтор-3-метилфенил)-5-фтор-пиридин-2-карбоновая кислота, аминоциклопирахлор, аминоциклопирахлор-калий, аминоциклопирахлор-метил, аминопиралид, амитрол, аммонийсульфамат, анилофос, асулам, атразин, азафенидин, азимсульфурон, бетфлубутамид, беназолин, беназолин-этил, бенфлуралин, бенфуресат, бенсульфурон, бенсульфурон-метил, бенсулид, бентазон, бензобициклон, бензофенап, бициклопирон, бифенокс, биланафос, биланафос-натрий, биспирибак, биспирибак-натрий, бромацил, бромобутид, бромофеноксим, бромоксинил, бромоксинил-бутират, -калий, -гептаноат и -октаноат, бусоксинон, бутахлор, бутафенацил, бутамифос, бутенахлор, бутралин, бутроксидим, бутилат, кафенстрол, карбетамид,

карфентразон, карфентразон-этил, хлорамбен, хлорбромурон, хлорфенак, хлорфенак-натрий, хлорфенпроп, хлорфлуренол, хлорфлуренол-метил, хлоридазон, хлоримурон, хлоримурон-этил, хлорофталим, хлортолурун, хлорталдиметил, хлорсульфурон, цинидон, цинидон-этил, цинметилин, циносульфурон, клацифос, клетодим, клодинафоп, клодинафоп-пропаргил, кломазон, кломепроп, клопиралид, клорансулам, клорансулам-метил, кумилурон, цианамид, цианазин, циклоат, циклопириморат, циклосульфамурон, циклоксидим, цигалофоп, цигалофоп-бутил, кипразин, 2,4-D, 2,4-D-бутиол, -бутил, -диметиламмоний, -диоламин, -этил, 2-этилгексил, -изобутил, -изооктил, -изопропиламмоний, -калий, -триизопропаноламмоний и -троламин, 2,4-DB, 2,4-DB-бутил, -диметиламмоний, изооктил, -калий и -натрий, даймурон (димрон), далапон, дазомет, н-деканол, десмедифам, детосил-пиразолат (DTP), дикамба, дихлобенил, 2-(2,4-дихлоробензил)-4,4-диметил-1,2-оксазолидин-3-он, 2-(2,5-дихлоробензил)-4,4-диметил-1,2-оксазолидин-3-он, дихлорпроп, дихлорпроп-Р, диклофоп, диклофоп-метил, диклофоп-Р-метил, диклосулам, дифензокват, дифлуфеникан, дифлуфензопир, дифлуфензопир-натрий, димефурон, димепиперат, диметахлор, диметаметрин, диметенамид, диметенамид-Р, диметрасульфурон, динитрамин, динотерб, дифенамид, дикват, дикват-дибромид, дитиопир, диурон, DNOC, эндотал, ЕРТС, эспрокарб, эталфлуралин, этаметсульфурон, этаметсульфурон-метил, этиозин, этофумезат, этоксифен, этоксифен-этил, этоксисульфурон, этобензанид, F-9600, F-5231, т.е. N-[2-хлор-4-фтор-5-[4-(3-фторпропил)-4,5-дигидро-5-оксо-1Н-тетразол-1-ил]-фенил]-этансульфонамид, F-7967, т.е. 3-[7-хлор-5-фтор-2-(трифторметил)-1Н-бензимидазол-4-ил]-1-метил-6-(трифторметил)-пиримидин-2,4(1Н,3Н)-дион, феноксапроп, феноксапроп-Р, феноксапроп-этил, феноксапроп-Р-этил, феноксасульфон, фенквинотрион, фентразамид, флампроп, флампроп-М-изопропил, флампроп-М-метил, флазасульфурон, флорасулам, флауазифоп, флауазифоп-Р, флауазифоп-бутил, флауазифоп-Р-бутил, флукарбазон, флукарбазон-натрий, флуцетосульфурон, флухлоралин, флуфенацет, флуфенпир, флуфенпир-этил, флуметсулам, флумиклорак, флумиклорак-пентил, флумиоксазин, флуометурон, флуренол, флуренол-бутил, -диметиламмоний и -метил, фторогликофен, фторогликофен-этил, флупропанат, флупирсульфурон, флупирсульфурон-метил-натрий, флуридон, флурохлоридон, флуороксопир, флуороксопир-метил, флуртамон, флутиацет, флутиацет-метил, фомесафен, фомесафен-натрий, форамсульфурон, фосамин, глюфосинат, глюфосинат-

аммоний, глюфосинат-Р-натрий, глюфосинат-Р-аммоний, глюфосинат-Р-натрий, глифосат, глифосат-аммоний, -изопропиламмоний, -диаммоний, -диметиламмоний, -калий, -натрий и -тримесий, Н-9201, т.е. О-(2,4-диметил-6-нитрофенил)-О-этил-изопропилфосфорамидотиоат, галауксифен, галауксифен-метил, галосафен, галосульфурон, галосульфурон-метил, галоксифоп, галоксифоп-Р, галоксифоп-этоксиэтил, галоксифоп-Р-этоксиэтил, галоксифоп-метил, галоксифоп-Р-метил, гексазинон, НW-02, т.е. 1-(диметоксифосфорил)-этил-(2,4-дихлорфенокси)ацетат, имазаметабенз, Имазаметабенз-метил, имазамокс, имазамокс-аммоний, имазапик, имазапик-аммоний, имазапир, имазапир-изопропиламмоний, имазаквин, имазаквин-аммоний, имазетапир, имазетапир-иммоний, имазосульфурон, инданофан, индазифлам, йодосульфурон, йодосульфурон-метил-натрий, иоксинил, иоксинил-октаноат, -калий и натрий, ипфенкарбазон, изопротурон, изоурон, изоксабен, изоксафлутол, карбутилат, КУН-043, т.е. 3-([5-(дифторметил)-1-метил-3-(трифторметил)-1Н-пиразол-4-ил]метил)сульфонил)-5,5-диметил-4,5-дигидро-1,2-оксазол, кетоспирадокс, лактофен, ленацил, линурон, МСРА, МСРА-бутотил, -диметиламмоний, -2-этилгексил, -изопропиламмоний, -калий и -натрий, МСРВ, МСРВ-метил, -этил и -натрий, мекопроп, мекопроп-натрий, и -бутотил, мекопроп-Р, мекопроп-Р-бутотил, -диметиламмоний, -2-этилгексил и -калий, мефенацет, мефлуидид, мезосульфурон, мезосульфурон-метил, мезотрион, метабензтиазурон, метам, метамифоп, метамитрон, метазахлор, метазосульфурон, метабензтиазурон, метиопирсульфурон, метиозолин, метил изотиоцианат, метобромурон, метолахлор, S-метолахлор, метосулам, метоксурон, метрибузин, метсульфурон, метсульфурон-метил, молинат, монолинурон, моноссульфурон, моноссульфурон-сложный эфир, МТ-5950, т.е. N-[3-хлор-4-(1-метилэтил)-фенил]-2-метилпентанамид, NGGC-011, напропамид, NC-310, т.е. 4-(2,4-дихлорбензоил)-1-метил-5-бензилоксипиразол, небурон, никосульфурон, нонановая кислота (пеларгоновая кислота), норфлуразон, масляная кислота (жирные кислоты), орбенкарб, ортосуотфамурон, оризалин, оксадиаргил, оксадиазон, оксасульфурон, оксазикломефон, оксифлуорфен, парактват, парактват дихлорид, пебулат, пендиметалин, пеноксулам, пентахлорфенол, пентоксазон, петоксамид, нефтяные масла, фенмедифам, пиклорам, пиколинафен, пиноксаден, пиперофос, претилахлор, примисульфурон, примисульфурон-метил, продиамин, профоксидим, прометон, прометрин, пропахлор, пропанил, пропаквизафоп, пропазин, профам, пропизохлор,

пропоксикарбазон, пропоксикарбазон-натрий, пропирисульфурон, пропизамид, просульфокарб, просульфурон, пираклонил, пирафлуфен, пирафлуфен-этил, пирасульфотол, пиразолинат (пиразолат), пиразосульфурон, пиразосульфурон-этил, пиразоксифен, прибамбенз, прибамбенз-изопропил, прибамбенз-пропил, прибензоксим, прибутикарб, придафол, пиридат, пирифталид, пириминобак, пириминобак-метил, пиримисульфан, пиритиобак, пиритиобак-натрий, пироксасульфон, пироксулам, квинклолак, квинмерак, квинокламин, квизалофоп, квизалофоп-этил, квизалофоп-Р, квизалофоп-Р-этил, квизалофоп-Р-тефурил, римсульфурон, сафлуфенацил, сетоксидим, сидурон, симазин, симетрин, SL-261, сулкотрион, сульфентразон, сульфометурон, сульфометурон-метил, сульфосульфурон, SYN-523, SYP-249, т.е. 1-этоксипропан-3-ил-1-оксопентан-2-ил-5-[2-хлор-4-(трифторметил)фенокси]-2-нитробензоат, SYP-300, т.е. 1-[7-фтор-3-оксо-4-(пропан-2-ил)-1-ил]-3,4-дигидро-2Н-1,4-бензоксазин-6-ил]-3-пропил-2-тиоксоимидазолидин-4,5-дион, 2,3,6-ТВА, ТСА (трифторуксусная кислота), ТСА-натрий, тебутиурон, тефурилтрион, темботрион, тепралоксидим, тербацил, тербукарб, тербуметон, тербутилазин, тербутрин, тенилхлор, тиазопир, тиенкарбазон, тиенкарбазон-метил, тифенсульфурон, тифенсульфурон-метил, тиобенкарб, тиафенацил, толпиралат, топрамезон, тралкоксидим, триафамон, три-аллат, триасульфурон, триазифлам, трибенурон, трибенурон-метил, триклопир, триэтазин, трифлорисульфурон, трифлорисульфурон-натрий, трифлудимоксазин, трифлуралин, трифлусульфурон, трифлусульфурон-метил, тритосульфурон, мочевиносульфат, вернолат, XDE-848, ZJ-0862, т.е. 3,4-дихлор-N-{2-[(4,6-диметоксипиримидин-2-ил)окси]бензил}анилин, а также следующие соединения:



Примерами возможных партнеров для смешивания для регуляторов роста растений являются:

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

Также в качестве партнеров для комбинирования соединений согласно изобретению общей формулы (I) рассматривают, например, следующие защитные средства:

S1) Соединения из группы гетероциклических производных карбоновой кислоты:

S1<sup>a</sup>) Соединения типа дихлорфенилпиразолин-3-карбоновой кислоты (S1<sup>a</sup>), предпочтительно такие соединения, как

1-(2,4-дихлорфенил)-5-(этоксикарбонил)-5-метил-2-пиразолин-3-карбоновая кислота, этиловый эфир 1-(2,4-дихлорфенил)-5-(этоксикарбонил)-5-метил-2-пиразолин-3-карбоновой кислоты (S1-1) ("мефенпир-диэтил"), и родственные соединения, которые описаны в WO-A-91/07874;

S1<sup>b</sup>) Производные дихлорфенилпиразолкарбоновой кислоты (S1<sup>b</sup>), предпочтительно такие соединения, как этиловый эфир 1-(2,4-дихлорфенил)-5-метилпиразол-3-карбоновой кислоты (S1-2), этиловый

- эфир 1-(2,4-дихлорфенил)-5-изопропилпиразол-3-карбоновой кислоты (S1-3), этиловый эфир 1-(2,4-дихлорфенил)-5-(1,1-диметил-этил)пиразол-3-карбоновой кислоты (S1-4) и родственные соединения, как описано, например, в EP-A-333131 и EP-A-269806;
- S1<sup>c</sup>) Производные 1,5-дифенилпиразол-3-карбоновой кислоты (S1<sup>c</sup>), предпочтительно такие соединения, как этиловый эфир 1-(2,4-дихлорфенил)-5-фенилпиразол-3-карбоновой кислоты (S1-5), метиловый эфир 1-(2-хлорфенил)-5-фенилпиразол-3-карбоновой кислоты (S1-6) и родственные соединения, как описано, например, в EP-A-268554;
- S1<sup>d</sup>) Соединения типа триазолкарбоновых кислот (S1<sup>d</sup>), предпочтительно такие соединения, как фенхлоразол(-этиловый эфир), т.е. этиловый эфир 1-(2,4-дихлорфенил)-5-трихлорметил-(1H)-1,2,4-триазол-3-карбоновой кислоты (S1-7), и родственные соединения, как описано в EP-A-174562 и EP-A-346620;
- S1<sup>e</sup>) Соединения типа 5-бензил- или 5-фенил-2-изоксазолин-3-карбоновой кислоты, или 5,5-дифенил-2-изоксазолин-3-карбоновая кислота (S1<sup>e</sup>), предпочтительно такие соединения, как этиловый эфир 5-(2,4-дихлорбензил)-2-изоксазолин-3-карбоновой кислоты (S1-8) или этиловый эфир 5-фенил-2-изоксазолин-3-карбоновой кислоты (S1-9) и родственные соединения, которые описаны в WO-A-91/08202, или 5,5-дифенил-2-изоксазолин-карбоновая кислота (S1-10) или этиловый эфир 5,5-дифенил-2-изоксазолин-3-карбоновой кислоты (S1-11) ("изоксадифен-этил") или н-пропиловый эфир (S1-12) или этиловый эфир 5-(4-фторфенил)-5-фенил-2-изоксазолин-3-карбоновой кислоты (S1-13), как описано в патентной заявке WO-A-95/07897.
- S2) Соединения из группы производных 8-хинолинокси (S2):
- S2<sup>a</sup>) Соединения типа 8-хинолиноксиуксусной кислоты (S2<sup>a</sup>), предпочтительно (5-хлор-8-хинолинокси)уксусная кислота-(1-метилгексил)-сложный эфир ("клоквинтосет-мексил") (S2-1), (5-хлор-8-хинолинокси)уксусная кислота-(1,3-диметил-бут-1-ил)-сложный эфир (S2-2), 4-аллил-окси-бутиловый эфир (5-хлор-8-хинолинокси)уксусной кислоты (S2-3), 1-аллил-окси-проп-2-иловый эфир (5-хлор-8-хинолинокси)уксусной

кислоты (S2-4), этиловый эфир (5-хлор-8-хинолинокси)уксусной кислоты (S2-5),

метиловый эфир (5-хлор-8-хинолинокси)уксусной кислоты (S2-6), аллиловый эфир (5-хлор-8-хинолинокси)уксусной кислоты (S2-7), 2-(2-пропилиден-иминокси)-1-этиловый эфир (5-хлор-8-хинолинокси)-уксусной кислоты (S2-8), 2-оксо-проп-1-иловый эфир (5-хлор-8-хинолинокси)уксусной кислоты (S2-9) и родственные соединения, которые описаны в EP-A-86750, EP-A-94349 и EP-A-191736 или EP-A-0 492 366, а также (5-хлор-8-хинолинокси)уксусная кислота (S2-10), их гидраты и соли, например, их соли лития, натрия, калия, кальция, магния, алюминия, железа, четвертичного аммония, сульфония, или фосфония, которые описаны в WO-A-2002/34048;

- S2<sup>b</sup>) Соединения типа (5-хлор-8-хинолинокси)малоновой кислоты (S2<sup>b</sup>), предпочтительно такие соединения, как диэтиловый эфир (5-хлор-8-хинолинокси)малоновой кислоты, диаллиловый эфир (5-хлор-8-хинолинокси)малоновой кислоты, метил-этиловый эфир (5-хлор-8-хинолинокси)малоновой кислоты и родственные соединения, которые описаны в EP-A-0 582 198.
- S3) Действующие вещества типа дихлорацетамидов (S3), которые часто используют в качестве защитных средств в предвсходовой обработке (эффективных средств для защиты почвы), как, например, "дихлормид" (N,N-диаллил-2,2-дихлорацетамид) (S3-1), "R-29148" (3-дихлорацетил-2,2,5-триметил-1,3-оксазолидин) компании Stauffer (S3-2), "R-28725" (3-дихлорацетил-2,2,-диметил-1,3-оксазолидин) компании Stauffer (S3-3), "беноксакор" (4-дихлорацетил-3,4-дигидро-3-метил-2H-1,4-бензоксазин) (S3-4), "PPG-1292" (N-аллил-N-[(1,3-диоксолан-2-ил)-метил]-дихлорацетамид) компании PPG Industries (S3-5), "DKA-24" (N-аллил-N-[(аллиламинокарбонил)метил]-дихлорацетамид) компании Sagro-Chem (S3-6),

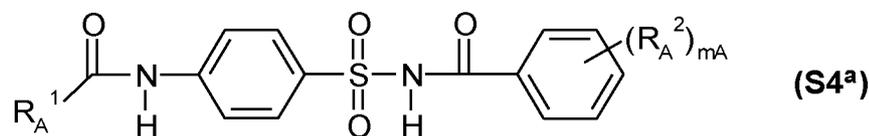
"AD-67" или "MON 4660" (3-дихлорацетил-1-окса-3-аза-спиро[4,5]декан) компании Nitrokemia или Monsanto (S3-7),

"TI-35" (1-дихлорацетил-азепан) компании TRI-Chemical RT (S3-8),  
 "диклонон" (дициклонон) или "BAS145138" или "LAB145138" (S3-9)  
 ((RS)-1-дихлорацетил-3,3,8a-триметилпергидропирроло[1,2-a]пиримидин-6-он) компании BASF,

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

S4) Соединения из класса ацилсульфонамидов (S4):

S4<sup>a</sup>) N-ацилсульфонамиды формулы (S4<sup>a</sup>) и их соли, которые описаны в WO-A-97/45016,



где

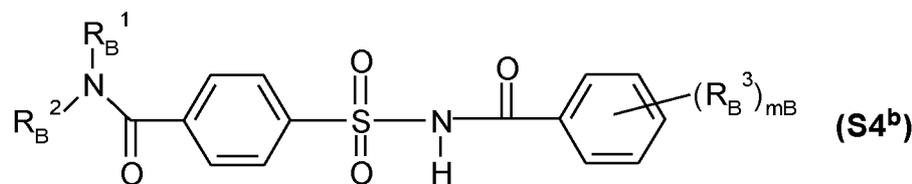
R<sub>A</sub><sup>1</sup> означает (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)алкил, (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)циклоалкил, причем 2 названных последними остатка замещены ν<sub>A</sub> заместителями из группы галогена, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)алкокси, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)галоалкокси и (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)алкилтио и, в случае циклического остатка, также (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)алкилом и (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)галоалкилом;

R<sub>A</sub><sup>2</sup> означает галоген, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)алкил, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)алкокси, CF<sub>3</sub>;

m<sub>A</sub> означает 1 или 2;

ν<sub>A</sub> означает 0, 1, 2 или 3;

S4<sup>b</sup>) Соединения типа 4-(бензоилсульфамойл)бензамидов формулы (S4<sup>b</sup>) и их соли, которые описаны в WO-A-99/16744,



где

$R_B^1$ ,  $R_B^2$  означают независимо друг от друга водород,  $(C_1-C_6)$ алкил,  $(C_3-C_6)$ циклоалкил,  $(C_3-C_6)$ алкенил,  $(C_3-C_6)$ алкинил,

$R_B^3$  означает галоген,  $(C_1-C_4)$ алкил,  $(C_1-C_4)$ галоалкил или  $(C_1-C_4)$ алкокси, и

$m_B$  означает 1 или 2,

например, такие, в которых

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

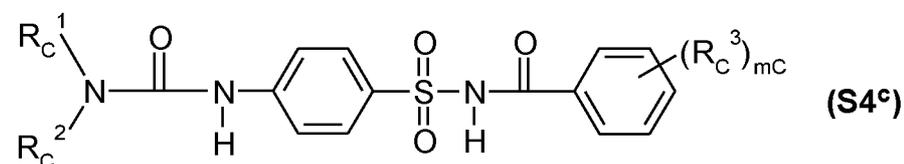
$R_B^1 =$  циклопропил,  $R_B^2 =$  водород, и  $(R_B^3) = 5-Cl-2-O\text{Me}$  (S4-2),

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

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

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

S4<sup>c</sup>) Соединения из класса бензоилсульфамойлфенилмочевин формулы (S4<sup>c</sup>), которые описаны в EP-A-365484,



где

$R_C^1$ ,  $R_C^2$  означают независимо друг от друга водород,  $(C_1-C_8)$ алкил,  $(C_3-C_8)$ циклоалкил,  $(C_3-C_6)$ алкенил,  $(C_3-C_6)$ алкинил,

$R_C^3$  означает галоген,  $(C_1-C_4)$ алкил,  $(C_1-C_4)$ алкокси,  $CF_3$  и

$m_C$  означает 1 или 2;

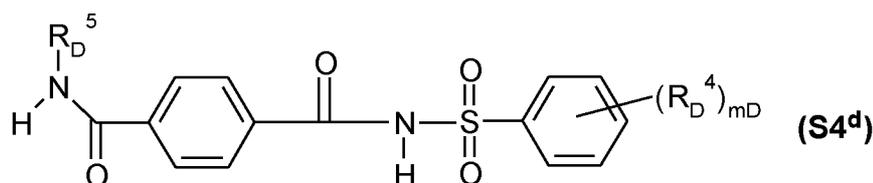
например,

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

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

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

S4<sup>d</sup>) Соединения типа N-фенилсульфонилтерeftаламидов формулы (S4<sup>d</sup>) и их соли, которые, например, известны из CN 101838227,



где

$R_D^4$  означает галоген, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)алкил, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)алкокси, CF<sub>3</sub>;

$m_D$  означает 1 или 2;

$R_D^5$  означает водород, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)алкил, (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)циклоалкил, (C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)алкенил, (C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)алкинил, (C<sub>5</sub>-C<sub>6</sub>)циклоалкенил.

S5) Действующие вещества из класса гидроксиароматических веществ и ароматическо-алифатических производных карбоновой кислоты (S5), например,

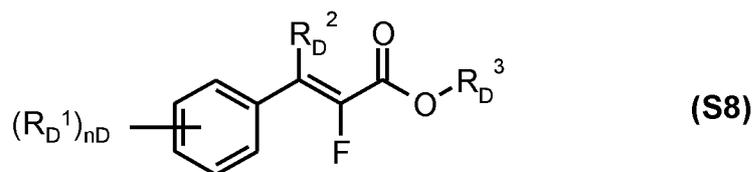
этиловый эфир 3,4,5-триацетоксибензойной кислоты, 3,5-диметокси-4-гидрокси бензойная кислота, 3,5-дигидрокси бензойная кислота, 4-гидроксисалициловая кислота, 4-фторсалициловая кислота, 2-гидроксикоричная кислота, 2,4-дихлоркоричная кислота, которые описаны в WO-A-2004/084631, WO-A-2005/015994, WO-A-2005/016001.

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

1-метил-3-(2-тиенил)-1,2-дигидрохиноксалин-2-он, 1-метил-3-(2-тиенил)-1,2-дигидрохиноксалин-2-тион, 1-(2-аминоэтил)-3-(2-тиенил)-1,2-дигидрохиноксалин-2-он-гидрохлорид, 1-(2-метилсульфониламиноэтил)-3-(2-тиенил)-1,2-дигидрохиноксалин-2-он, которые описаны в WO-A-2005/112630.

S7) Соединения из класса производных дифенилметоксиуксусной кислоты (S7), например, метиловый эфир дифенилметоксиуксусной кислоты (Reg. № CAS 41858-19-9) (S7-1), этиловый эфир дифенилметоксиуксусной кислоты или дифенилметоксиуксусная кислота, которые описаны в WO-A-98/38856.

S8) Соединения формулы (S8), которые описаны в WO-A-98/27049,



где символы и индексы имеют следующие значения:

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

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

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

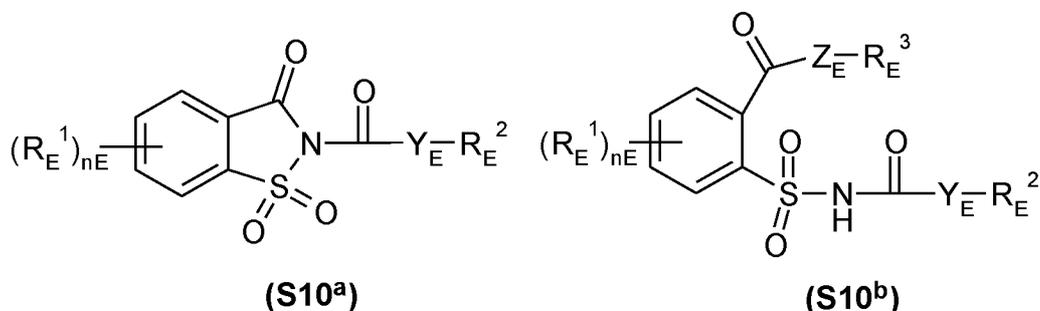
$n_D$  означает целое число 0 - 2.

S9) Действующие вещества из класса 3-(5-тетразолилкарбонил)-2-хинолонов (S9), например,

1,2-дигидро-4-гидрокси-1-этил-3-(5-тетразолилкарбонил)-2-хинолон (Рег. № CAS: 219479-18-2), 1,2-дигидро-4-гидрокси-1-метил-3-(5-тетразолилкарбонил)-2-хинолон (Рег. № CAS 95855-00-8), которые описаны в WO-A-1999/000020.

S10) Соединения формул (S10<sup>a</sup>) или (S10<sup>b</sup>),

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



где

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

$Y_E, Z_E$  означают независимо друг от друга O или S,

$n_E$  означает целое число 0 - 4,

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

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

S11) Действующие вещества типа оксиимино-соединений (S11), которые известны как протравителя для семян, как, например, "оксабетринил" ((Z)-1,3-диоксолан-2-илметоксиимино(фенил)ацетонитрил) (S11-1), который известен как защитное средство – ядохимикат-протравитель для проса от повреждения метолахлором,

"флуксофеним" (1-(4-хлорфенил)-2,2,2-трифтор-1-этанон-O-(1,3-диоксолан-2-илметил)-оксим) (S11-2), который известен как защитное средство – ядохимикат-протравитель для проса от повреждения метолахлором, и

"циометринил" или "CGA-43089" ((Z)-цианометоксиимино(фенил)-ацетонитрил) (S11-3), который известен как защитное средство – ядохимикат-протравитель для проса от повреждения метолахлором.

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

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

"Нафталевый ангидрид" (ангидрид 1,8-нафталиндикарбоновой кислоты) (S13-1), который известен как защитное средство – ядохимикат-протравитель для кукурузы от повреждения тиокарбаматербициденом, "фенклорим" (4,6-дихлор-2-фенилпиримидин) (S13-2), который известен как защитное средство для претилахлора в посеянном рисе,

"флуразол" (бензил-2-хлор-4-трифторметил-1,3-тиазол-5-карбоксилат) (S13-3), который известен как защитное средство – ядохимикат-протравитель для проса от повреждения алахлором и метолахлором,

"CL 304415" (Reg. № CAS 31541-57-8) (4-карбокси-3,4-дигидро-2H-1-бензопиран-4-уксусная кислота) (S13-4)

компании American Cyanamid, который известен как защитное средство для кукурузы от повреждения имидазолином,

"MG 191" (Рег. № CAS 96420-72-3) (2-дихлорметил-2-метил-1,3-диоксолан) (S13-5) компании Nitrokemia, который известен как защитное средство для кукурузы,

"MG 838" (Рег. № CAS 133993-74-5) (2-пропенил 1-окса-4-азаспиро[4.5]декан-4-карбодитионат) (S13-6) компании Nitrokemia

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

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

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

S14) Действующие вещества, которые, помимо гербицидного действия против вредных растений, также оказывают защитное действие на культурные растения, такие как рис, как, например,

"димепиперат" или "MY-93" (S-1-метил-1-фенилэтил-пиперидин-1-карботионат), который известен как защитное средство для риса от повреждения гербицидом молинатом,

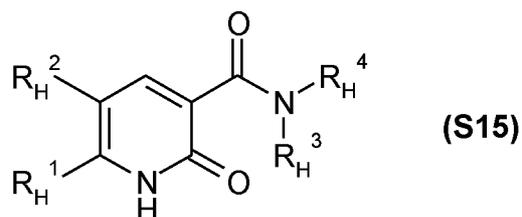
"даймурон" или "SK 23" (1-(1-метил-1-фенилэтил)-3-р-толил-мочевина), который известен как защитное средство для риса от повреждения гербицидом имазосульфуроном,

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

"метоксифенон" или "NK 049" (3,3'-диметил-4-метокси-бензофенон), который известен как защитное средство для риса от повреждения некоторыми гербицидами,

"CSB" (1-бром-4-(хлорметилсульфонил)бензол) компании Kumiai, (Рег. № CAS 54091-06-4), который известен как защитное средство от повреждения некоторыми гербицидами в рисе.

S15) Соединения формулы (S15) или из таутомеры,



которые описаны в WO-A-2008/131861 и WO-A-2008/131860,

где

$R_H^1$  означает  $(C_1-C_6)$ галоалкильный остаток, и

$R_H^2$  означает водород или галоген, и

$R_H^3$ ,  $R_H^4$  означают независимо друг от друга водород,  $(C_1-C_{16})$ алкил,  $(C_2-C_{16})$ алкенил или  $(C_2-C_{16})$ алкинил,

причем каждый из 3 указанных последними остатков является незамещенным или может быть замещен одним или более остатками из группы галогена, гидроксид, циано,  $(C_1-C_4)$ алкокси,  $(C_1-C_4)$ галоалкокси,  $(C_1-C_4)$ алкилтио,  $(C_1-C_4)$ алкиламино, ди $[(C_1-C_4)$ алкил]-амино,  $[(C_1-C_4)$ алкокси]-карбонила,  $[(C_1-C_4)$ галоалкокси]-карбонила,  $(C_3-C_6)$ циклоалкила, который является незамещенным или замещенным, фенила, который является незамещенным или замещенным, и гетероциклила, который является незамещенным или замещенным,

или  $(C_3-C_6)$ циклоалкил,  $(C_4-C_6)$ циклоалкенил,  $(C_3-C_6)$ циклоалкил, который на стороне кольца конденсируется одним 4 - 6-членным насыщенным или ненасыщенным карбоциклическим кольцом, или  $(C_4-C_6)$ циклоалкенил, который на стороне кольца конденсируется одним 4-6-членным насыщенным или ненасыщенным карбоциклическим кольцом,

причем каждый из 4 названных последними остатков является незамещенным или может быть замещен одним или более остатками из группы галогена, гидроксид, циано,  $(C_1-C_4)$ алкил,  $(C_1-C_4)$ галоалкила,

(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)алкокси, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)галоалкокси, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)алкилтио,  
 (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)алкиламино, ди[(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)алкил]-амино, [(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)алкокси]-  
 карбонила, [(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)галоалкокси]-карбонила, (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)циклоалкила,  
 который является незамещенным или замещенным, фенила, который  
 является незамещенным или замещенным, и гетероциклила, который  
 является незамещенным или замещенным,

или

R<sub>H</sub><sup>3</sup> означает (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-алкокси, (C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>)алкенилокси, (C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)алкинилокси  
 или (C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>)галоалкокси, и

R<sub>H</sub><sup>4</sup> означает водород или (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-алкил, или

R<sub>H</sub><sup>3</sup> и R<sub>H</sub><sup>4</sup> вместе с напрямую соединенным N-атомом означает 4-8-членное  
 гетероциклическое кольцо, которое наряду с N-атомом также может  
 содержать другие кольцевые гетероатомы, предпочтительно до 2  
 других кольцевых гетероатомов из группы N, O и S и которое является  
 незамещенным или замещено одним или более остатками из группы  
 галогена, циано, нитро, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)алкил, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)галоалкила, (C<sub>1</sub>-  
 C<sub>4</sub>)алкокси и (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)алкилтио.

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

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

(4-хлорфенокси)уксусная кислота,

(R,S)-2-(4-хлор-о-толилокси)пропионовая кислота (мекопроп),

4-(2,4-дихлорфенокси)масляная кислота (2,4-DB),

(4-хлор-о-толилокси)уксусная кислота (MCPA),

4-(4-хлор-о-толилокси)масляная кислота,

4-(4-хлорфенокси)масляная кислота,

3,6-дихлор-2-метокси бензойной кислоты (дикамба),

1-(этоксикарбонил)этил-3,6-дихлор-2-метоксибензоат (лактидихлор-этил).

Предпочтительными защитными средствами в комбинации с соединениями  
 согласно изобретению общей формулы (I) и/или их солями, в частности, с  
 соединениями формул (I.1) - (I.34) и/или их солями являются: клоквиносет-

мексил, ципросульфамид, фенхлоразол-этиловый эфир, изоксадифен-этил, мефенпир-диэтил, фенхлорим, цимилурон, S4-1 и S4-5, а особенно предпочтительными защитными средствами являются: клоквинтоцет-мексил, ципросульфамид, изоксадифен-этил и мефенпир-диэтил.

Биологические примеры:

А. Гербицидное действие и совместимость с культурными растениями в послевсходовый период

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

В представленных ниже Таблицах A1 - A14 представлены действия выбранных соединений общей формулы (I) в соответствии с Таблицами I.1 - I.34 на различные вредные растения и нормы расхода соответственно 20 г/га и менее, которые были получены согласно предыдущих инструкций для проведения испытания.

Таблица А1

Соединение Пример №	<i>Alopecurus myosuroides</i> (Действие в %)	Норма расхода [г/га]
I.1-1	90	20
I.1-2	100	20
I.1-23	90	20
I.1-115	100	20
I.1-115	80	5
I.1-176	100	20
I.1-176	90	5
I.1-286	100	20
I.1-286	100	5
I.1-447	90	20
I.1-447	80	5
I.1-457	80	20
I.1-457	80	5
I.1-471	100	20
I.1-471	80	5
I.1-481	100	20
I.1-481	100	5
I.6-441	80	20
I.14-442	90	20
I.31-1	80	20
I.31-23	100	20
I.31-442	90	20
I.31-442	80	5

Таблица А2

Соединение Пример №	<i>Digitaria sanguinalis</i> (Действие в %)	Норма расхода [г/га]
I.1-1	100	20
I.1-1	100	5
I.1-2	100	20
I.1-2	100	5
I.1-23	100	20
I.1-23	100	5
I.1-441	100	20
I.1-441	90	5
I.1-442	100	20
I.1-447	100	20
I.1-447	100	5
I.1-448	100	20
I.1-457	100	20
I.1-457	100	5
I.2-442	100	20
I.6-441	100	20
I.6-441	80	5
I.14-442	100	20

Таблица А3

Соединение Пример №	<i>Echinochloa crus-galli</i> (Действие в %)	Норма расхода [г/га]
I.1-1	100	20
I.1-1	90	5
I.1-2	100	20
I.1-2	90	5
I.1-23	100	20
I.1-23	80	5

Соединение Пример №	<i>Echinochloa crus-galli</i> (Действие в %)	Норма расхода [г/га]
I.1-115	100	20
I.1-115	90	5
I.1-176	100	20
I.1-176	90	5
I.1-286	100	20
I.1-286	90	20
I.1-441	100	20
I.1-441	80	5
I.1-442	100	20
I.1-442	100	5
I.1-447	100	20
I.1-447	100	5
I.1-457	100	20
I.1-457	80	5
I.1-471	100	20
I.1-471	90	5
I.1-481	100	20
I.1-481	90	5
I.1-441	100	20
I.1-442	100	20
I.2-442	100	20
I.5-457	80	20
I.6-441	90	20
I.6-441	80	5
I.14-442	100	20
I.31-1	90	20
I.31-23	100	20
I.31-23	80	5
I.31-442	90	20
I.31-442	90	5

Таблица А4

Соединение Пример №	<i>Lolium rigidum</i> (Действие в %)	Норма расхода [г/га]
I.1-2	80	20
I.1-23	80	20
I.1-441	80	20
I.1-471	80	20
I.1-481	80	20

Таблица А5

Соединение Пример №	<i>Setaria viridis</i> (Действие в %)	Норма расхода [г/га]
I.1-1	100	20
I.1-1	100	5
I.1-2	100	20
I.1-2	100	5
I.1-23	100	20
I.1-23	100	5
I.1-441	100	20
I.1-441	100	5
I.1-442	100	20
I.1-442	100	5
I.1-447	100	20
I.1-447	100	5
I.1-448	100	20
I.1-448	80	5
I.1-457	100	20
I.1-457	100	5
I.2-442	100	20
I.2-442	100	5
I.5-442	90	5
I.5-457	100	20

Соединение Пример №	<i>Setaria viridis</i> (Действие в %)	Норма расхода [г/га]
I.5-457	100	5
I.6-441	100	20
I.6-441	90	5
I.14-442	100	20
I.14-442	100	5

Таблица А6

Соединение Пример №	<i>Abutilon theophrasti</i> (Действие в %)	Норма расхода [г/га]
I.1-1	100	20
I.1-1	100	5
I.1-2	100	20
I.1-2	100	5
I.1-23	100	20
I.1-23	100	5
I.1-115	100	20
I.1-115	90	5
I.1-176	100	20
I.1-176	100	5
I.1-286	100	20
I.1-286	100	5
I.1-441	100	20
I.1-441	100	5
I.1-442	100	20
I.1-442	100	5
I.1-447	100	20
I.1-447	100	5
I.1-448	80	20
I.1-448	80	5
I.1-457	100	20

Соединение Пример №	<i>Abutilon theophrasti</i> (Действие в %)	Норма расхода [г/га]
I.1-457	100	5
I.1-471	100	20
I.1-471	100	5
I.1-481	100	20
I.1-481	100	5
I.2-442	100	20
I.2-442	100	5
I.5-442	100	5
I.5-457	80	20
I.6-441	100	20
I.6-441	100	5
I.31-1	100	20
I.31-1	100	5
I.14-442	100	20
I.14-442	100	5
I.31-23	100	20
I.31-23	100	5
I.31-442	100	20
I.31-442	100	5

Таблица А7

Соединение Пример №	<i>Amaranthus retroflexus</i> (Действие в %)	Норма расхода [г/га]
I.1-1	100	20
I.1-1	100	5
I.1-2	100	20
I.1-2	100	5
I.1-23	100	20
I.1-23	100	5
I.1-115	100	20

Соединение Пример №	<i>Amaranthus retroflexus</i> (Действие в %)	Норма расхода [г/га]
I.1-115	100	5
I.1-176	100	20
I.1-176	100	5
I.1-286	100	20
I.1-286	100	5
I.1-441	100	20
I.1-441	100	5
I.1-442	100	20
I.1-442	100	5
I.1-447	100	20
I.1-447	100	5
I.1-448	100	20
I.1-448	100	5
I.1-457	100	20
I.1-457	100	5
I.1-471	100	20
I.1-471	100	5
I.1-481	100	20
I.1-481	100	5
I.2-442	100	20
I.2-442	100	5
I.5-442	100	5
I.5-457	100	20
I.5-457	100	5
I.6-441	100	20
I.6-441	100	5
I.14-442	100	20
I.14-442	100	5
I.31-1	100	20
I.31-1	100	5

Соединение Пример №	<i>Amaranthus retroflexus</i> (Действие в %)	Норма расхода [г/га]
I.31-23	100	20
I.31-23	100	5
I.31-442	100	20
I.31-442	100	5

Таблица А8

Соединение Пример №	<i>Matricaria inodora</i> (Действие в %)	Норма расхода [г/га]
I.1-1	100	20
I.1-1	90	5
I.1-2	100	20
I.1-2	100	5
I.1-23	100	20
I.1-23	80	5
I.1-115	100	20
I.1-115	100	5
I.1-176	100	20
I.1-176	100	5
I.1-286	100	20
I.1-286	100	5
I.1-441	100	20
I.1-441	100	5
I.1-442	100	20
I.1-442	90	5
I.1-447	100	20
I.1-447	100	5
I.1-457	90	20
I.1-471	100	20
I.1-471	100	5
I.1-481	100	0

Соединение Пример №	<i>Matricaria inodora</i> (Действие в %)	Норма расхода [г/га]
I.1-481	90	5
I.2-442	90	20
I.5-442	80	5
I.6-441	80	20
I.14-442	100	20
I.14-442	100	5
I.31-1	100	20
I.31-1	80	5
I.31-23	100	20
I.31-23	100	5
I.31-442	100	20

Таблица А9

Соединение Пример №	<i>Pharbitis purpurea</i> (Действие в %)	Норма расхода [г/га]
I.1-1	100	20
I.1-1	100	5
I.1-2	100	20
I.1-2	100	5
I.1-23	100	20
I.1-23	80	5
I.1-115	100	20
I.1-115	100	5
I.1-176	100	20
I.1-176	100	5
I.1-286	100	5
I.1-441	100	20
I.1-441	100	5
I.1-442	100	5
I.1-448	100	20

Соединение Пример №	<i>Pharbitis purpurea</i> (Действие в %)	Норма расхода [г/га]
I.5-442	100	5
I.1-447	100	20
I.1-447	100	5
I.1-457	100	20
I.1-457	100	5
I.1-471	100	20
I.1-471	100	5
I.1-481	100	20
I.1-481	80	5
I.5-457	90	20
I.5-457	90	5
I.6-441	90	20
I.6-441	80	5
I.14-442	100	20
I.14-442	90	5
I.31-1	100	20
I.31-1	100	5
I.31-23	100	20
I.31-23	100	5
I.31-442	100	20

Таблица А10

Соединение Пример №	<i>Polygonum convolvulus</i> (Действие в %)	Норма расхода [г/га]
I.1-1	100	20
I.1-1	80	5
I.1-2	100	20
I.1-2	100	5
I.1-23	100	20
I.1-23	100	5

Соединение Пример №	<i>Polygonum convolvulus</i> (Действие в %)	Норма расхода [г/га]
I.1-441	100	20
I.1-441	80	5
I.1-442	100	20
I.1-448	100	20
I.1-447	100	20
I.1-447	100	5
I.1-457	100	20
I.1-457	100	5
I.2-442	100	20
I.2-442	100	5
I.5-442	100	5
I.5-457	100	20
I.5-457	90	5
I.6-441	100	20
I.6-441	100	5
I.14-442	100	20

Таблица А11

Соединение Пример №	<i>Stellaria media</i> (Действие в %)	Норма расхода [г/га]
I.1-441	100	5
I.1-442	100	20
I.2-442	100	20
I.2-442	80	5
I.5-457	100	20
I.5-457	80	5
I.6-441	100	20
I.6-441	100	5

Таблица А12

Соединение Пример №	<i>Viola tricolor</i> (Действие в %)	Норма расхода [г/га]
I.1-1	100	20
I.1-1	100	5
I.1-2	100	20
I.1-2	100	5
I.1-23	100	20
I.1-23	100	5
I.1-115	100	20
I.1-115	100	5
I.1-176	100	20
I.1-176	100	5
I.1-286	100	20
I.1-286	100	5
I.1-441	100	20
I.1-441	100	5
I.1-442	100	20
I.1-442	100	5
I.1-447	100	20
I.1-447	100	5
I.1-448	100	20
I.1-448	100	5
I.1-457	100	20
I.1-457	100	5
I.1-471	100	20
I.1-471	100	5
I.1-481	100	20
I.1-481	100	5
I.2-442	100	20
I.2-442	100	5
I.5-442	100	5

Соединение Пример №	<i>Viola tricolor</i> (Действие в %)	Норма расхода [г/га]
I.5-457	100	20
I.5-457	100	5
I.6-441	100	20
I.6-441	100	5
I.14-442	100	20
I.14-442	100	5
I.31-1	100	20
I.31-1	100	5
I.31-23	100	20
I.31-23	100	5
I.31-442	100	20
I.31-442	100	5

Таблица А13

Соединение Пример №	<i>Veronica persica</i> (Действие в %)	Норма расхода [г/га]
I.1-1	100	20
I.1-1	100	5
I.1-2	100	20
I.1-2	100	5
I.1-23	100	20
I.1-23	100	5
I.1-115	100	20
I.1-115	100	5
I.1-176	100	20
I.1-176	100	5
I.1-286	100	20
I.1-286	100	5
I.1-441	100	20
I.1-441	100	5
I.1-442	100	20

Соединение Пример №	<i>Veronica persica</i> (Действие в %)	Норма расхода [г/га]
I.1-442	100	5
I.1-447	100	20
I.1-447	100	5
I.1-448	80	20
I.1-448	80	5
I.1-457	100	20
I.1-457	100	5
I.1-471	100	20
I.1-471	100	5
I.1-481	100	20
I.1-481	100	5
I.2-442	100	20
I.2-442	100	5
I.5-442	100	5
I.5-457	100	20
I.5-457	100	5
I.6-441	100	20
I.6-441	100	5
I.14-442	100	20
I.14-442	100	5
I.31-1	100	20
I.31-1	100	5
I.31-23	100	20
I.31-23	100	5
I.31-442	100	20
I.31-442	100	5

Таблица А14

Соединение Пример №	<i>Hordeum murinum</i> (Действие в %)	Норма расхода [г/га]
I.1-441	100	20
I.1-441	80	5

Таблица А15

Соединение Пример №	<i>Avena fatua</i> (Действие в %)	Норма расхода [г/га]
I.1-1	80	20
I.1-2	80	20
I.1-23	100	20
I.1-176	80	20
I.1-286	80	20
I.1-457	80	20
I.1-471	80	20
I.14-442	80	20
I.31-23	80	20

В нижеследующих Таблицах А16 - А20 представлены данные по совместимости выбранных соединений общей формулы (I) с культурными растениями в соответствии с Таблицами I.1 - I.34 при норме расхода, соответствующей 5 г/га или менее, которая наблюдалась в ходе испытаний, проводившихся по указанной выше методике. В них представлены наблюдаемые эффекты на выбранные культурные растения по сравнению с необработанной контрольной группой (значение в %).

Таблица А16

Соединение Пример №	<i>Oryza sativa</i> (Действие в %)	Норма расхода [г/га]
I.1-1	10	1,25
I.1-2	10	5
I.1-2	0	1,25
I.1-23	20	1,25
I.1-286	0	1,25
I.1-447	10	5
I.1-447	0	1,25
I.1-448	0	5
I.1-457	0	1,25
I.1-481	20	5
I.1-481	10	1,25
I.2-442	0	5
I.31-1	10	5
I.31-1	0	1,25
I.31-23	20	5
I.1-441	20	5
I.1-441	10	1,25
I.1-442	20	5
I.1-442	10	1,25
I.1-471	0	1,25
I.2-442	0	5
I.5-442	20	5
I.5-457	10	5
I.5-457	0	1,25
I.6-441	20	5
I.14-442	20	5
I.14-442	10	1,25
I.31-442	10	5
I.31-442	0	1,25

Таблица А17

Соединение Пример №	<i>Zea mays</i> (Действие в %)	Норма расхода [г/га]
I.1-23	20	1,25
I.1-441	20	1,25
I.1-442	20	1,25
I.1-448	20	5
I.1-457	20	1,25
I.1-471	20	5
I.2-442	20	5
I.2-442	10	1,25
I.5-457	20	5
I.6-441	20	5
I.6-441	10	1,25
I.14-442	20	1,25

Таблица А18

Соединение Пример №	<i>Brassica napus</i> (Действие в %)	Норма расхода [г/га]
I.1-442	10	1,25
I.5-442	20	5
I.5-442	0	1,55
I.5-457	10	5
I.5-457	0	1,25
I.6-441	20	1,25

Таблица А19

Соединение Пример №	<i>Glycine max</i> (Действие в %)	Норма расхода [г/га]
I.1-441	20	5
I.1-442	20	5

Соединение Пример №	<i>Glycine max</i> (Действие в %)	Норма расхода [г/га]
I.1-442	10	1,25
I.2-442	10	1,25
I.5-457	10	5
I.5-457	0	1,25
I.14-442	20	1,25

Таблица А20

Соединение Пример №	<i>Triticum aestivum</i> (Действие в %)	Норма расхода [г/га]
I.1-1	0	1,25
I.1-2	0	1,25
I.1-23	20	1,25
I.1-115	20	1,25
I.1-176	20	1,25
I.1-286	20	1,25
I.1-441	20	1,25
I.1-448	10	5
I.1-448	0	1,25
I.1-457	20	1,25
I.2-442	20	5
I.31-1	10	5
I.31-23	20	5
I.31-23	10	5
I.1-447	10	1,25
I.1-471	20	5
I.1-471	10	1,25
I.1-481	20	1,25
I.2-442	20	5
I.5-442	20	5

Соединение Пример №	<i>Triticum aestivum</i> (Действие в %)	Норма расхода [г/га]
I.5-442	10	1,25
I.5-457	20	5
I.6-441	20	5
I.14-442	20	1,25
I.31-442	20	5
I.31-442	10	1,25

Как показывают результаты, соединения общей формулы (I) согласно изобретению при обработке в послевсходовый период оказывают хорошее гербицидное действие на вредные растения как, например, *Abutilon theophrasti*, *Alopecurus myosuroides*, *Amaranthus retroflexus*, *Avena fatua*, *Digitaria sanguinalis*, *Echinochloa crus-galli*, *Hordeum murinum*, *Lolium rigidum*, *Matricaria inodora*, *Pharbitis purpurea*, *Polygonum convolvulus*, *Setaria viridis*, *Stellaria media*, *Veronica persica* и *Viola tricolor* при норме расхода от 0,005 до 0,02 кг активного вещества или менее на гектар, а также имеют хорошую совместимость с культурными растениями в случае организмов, таких как *Oryza sativa*, *Zea mays*, *Brassica napus*, *Glycine max* и *Triticum aestivum* при норме расхода von 0.005 кг и менее на гектар.

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

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

В нижеследующих Таблицах В1 - В11 представлено действие выбранных соединений общей формулы (I) в соответствии с Таблицами I.1 - I.34 на различные вредные растения и норма расхода, соответствующая 80 г/га и менее, которые были получены в соответствии с указанной выше методикой.

Таблица В1

Соединение Пример №	<i>Alopecurus myosuroides</i> (Действие в %)	Норма расхода [г/га]
I.1-442	90	80
I.5-442	80	80

Таблица В2

Соединение Пример №	<i>Digitaria sanguinalis</i> (Действие в %)	Норма расхода [г/га]
I.1-442	100	80
I.1-442	100	20
I.5-442	80	80

Таблица В3

Соединение Пример №	<i>Echinochloa crus-galli</i> (Действие в %)	Норма расхода [г/га]
I.1-442	100	80
I.5-442	80	80

Таблица В4

Соединение Пример №	<i>Setaria viridis</i> (Действие в %)	Норма расхода [г/га]
I.1-442	100	80
I.1-442	90	20
I.5-442	100	80

Таблица В5

Соединение Пример №	<i>Abutilon theophrasti</i> (Действие в %)	Норма расхода [г/га]
I.1-442	100	80
I.5-442	100	80

Таблица В6

Соединение Пример №	<i>Amaranthus retroflexus</i> (Действие в %)	Норма расхода [г/га]
I.1-442	100	80
I.1-442	100	20
I.5-442	100	80
I.5-442	100	20

Таблица В7

Соединение Пример №	<i>Matricaria inodora</i> (Действие в %)	Норма расхода [г/га]
I.1-442	100	80
I.1-442	100	20
I.5-442	90	80

Таблица В8

Соединение Пример №	<i>Pharbitis purpurea</i> (Действие в %)	Норма расхода [г/га]
I.1-442	100	80
I.5-442	100	80

Таблица В9

Соединение Пример №	<i>Polygonum convolvulus</i> (Действие в %)	Норма расхода [г/га]
I.1-442	100	80
I.1-442	90	20
I.5-442	100	80
I.5-442	100	20

Таблица В10

Соединение Пример №	<i>Viola tricolor</i> (Действие в %)	Норма расхода [г/га]
I.1-442	100	80
I.1-442	100	20
I.5-442	100	20
I.5-442	100	20

Таблица В11

Соединение Пример №	<i>Veronica persica</i> (Действие в %)	Норма расхода [г/га]
I.1-442	100	80
I.1-442	80	20
I.5-442	100	80
I.5-442	90	20

Таблица В12

Соединение Пример №	<i>Lolium rigidum</i> (Действие в %)	Норма расхода [г/га]
I.1-442	100	80

В нижеследующих Таблицах В13 - В16 представлены данные по совместимости выбранных соединений общей формулы (I) с культурными растениями в соответствии с Таблицами I.1 - I.34 при норме расхода, соответствующей 80 г/га или менее, которая наблюдалась в ходе испытаний, проводившихся по указанной выше методике. В них представлены наблюдаемые эффекты на выбранные культурные растения по сравнению с необработанной контрольной группой (значение в %).

Таблица В13

Соединение Пример №	<i>Zea mays</i> (Действие в %)	Норма расхода [г/га]
I.1-442	0	20
I.5-442	20	80
I.5-442	0	20

Таблица В14

Соединение Пример №	<i>Brassica napus</i> (Действие в %)	Норма расхода [г/га]
I.1-442	0	20
I.5-442	0	20

Таблица В15

Соединение Пример №	<i>Glycine max</i> (Действие в %)	Норма расхода [г/га]
I.5-442	0	80

Таблица В16

Соединение Пример №	<i>Triticum aestivum</i> (Действие в %)	Норма расхода [г/га]
I.1-442	10	20

Соединение Пример №	<i>Triticum aestivum</i> (Действие в %)	Норма расхода [г/га]
I.5-442	20	20

Как показывают результаты, соединения общей формулы (I) согласно изобретению при обработке в послевсходовый период оказывают хорошее гербицидное действие на вредные растения как, например, *Abutilon theophrasti*, *Alopecurus myosuroides*, *Amaranthus retroflexus*, *Digitaria sanguinalis*, *Echinochloa crus-galli*, *Lolium rigidum*, *Matricaria inodora*, *Pharbitis purpurea*, *Polygonum convolvulus*, *Setaria viridis*, *Veronica persica* и *Viola tricolor*, при этом при норме расхода 0,08 кг активного действующего вещества на гектар или менее, а также демонстрируют хорошую совместимость культурных растений в случае с такими организмами как *Zea mays*, *Brassica napus*, *Glycine max* и *Triticum aestivum* при норме расхода 0,08 кг на гектар или менее.

С. Сопоставимое гербицидное действие и переносимость культурными растениями соединения (I.14-442) согласно изобретению с известным из литературы, структурным соединением (WO2019/101551, № 16) в послевсходовый период.

Семена одно- и двудольных сорных растений высаживались в горшки (7 см в диаметре) в песчаный суглинок, проращивались при оптимальных для роста условиях и выращивались в течение 21 дня.

На зеленые части растений наносят соединения согласно изобретению, в виде порошка для смачивания (WP) или эмульсионного концентрата (EC), в виде водной суспензии или эмульсии с добавлением 1,5 л/га Мего и 2 л/га AMS с нормой расхода воды, рассчитанной как 300 л/га.

21 день испытываемые растения находились в теплице, в оптимальных условия роста, визуально оценили действие препаратов, по сравнению с необработанной группой контрольных растений.

Например, 100% действие означает, что растения погибли,  
а 0% действие – как и контрольные растения.

В приведенных ниже Таблицах С1-С3 представлены данные о действии соединения согласно изобретению

(I.14-442), а также родственного соединения из WO2019/101551 (№ 16) на различные вредные растения при норме расхода 18 г/га или меньше, которые были получены в соответствии с указанной выше методикой.

Таблица С1

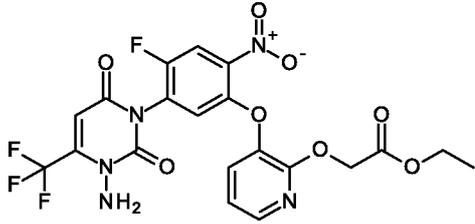
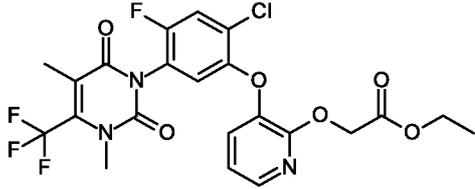
Соединение	<i>Polygonum convolvulus</i> (Действие в %)	Норма расхода [г/га]
I.14-442 (согласно изобретению) 	100	18
№ 16 (из WO2019/101551) 	75	18
I.14-442(согласно изобретению)	99	6
№ 16 (из WO2019/101551)	65	6

Таблица С2

Соединение	<i>Solanum nigrum</i> (Действие в %)	Норма расхода [г/га]
I.14-442 (согласно изобретению)	100	18
№ 16 (из WO2019/101551)	80	18
I.14-442 (согласно изобретению)	100	6
№ 16 (из WO2019/101551)	80	6

Таблица С3

Соединение	<i>Xanthium strumarium</i> (Действие в %)	Норма расхода [г/га]
I.14-442 (согласно изобретению)	100	18
№ 16 (из WO2019/101551)	85	18
I.14-442 (согласно изобретению)	96	6
№ 16 (из WO2019/101551)	50	6

Как показывают результаты, представленные в Таблицах С1 - С3, соединение I14-442 согласно изобретению, по сравнению с известным из литературы соединением (WO2019/101551, № 16), демонстрирует значительно более высокую эффективность в отношении вредных растений, таких как *poligonum convolvulus*, *Solanum nigrum* и *Xanthium strumarium*, при норме расхода 18 г и меньше на гектар.

В нижеследующих Таблицах С4 и С5 представлены значения эффектности соединения (I14-442) согласно изобретению, а также соединения из WO2019/101551 (№ 16) на различные культурные растения при норме расхода 6 г/га или менее, которые были получены в соответствии с указанными выше методиками.

Таблица С4

Соединение Пример №	<i>Zea mays</i> (Действие в %)	Норма расхода [г/га]
I.14-442 (согласно изобретению)	20	6
№ 16 (из WO2019/101551)	50	6
I.14-442 (согласно изобретению)	20	2
№ 16 (из WO2019/101551)	40	2

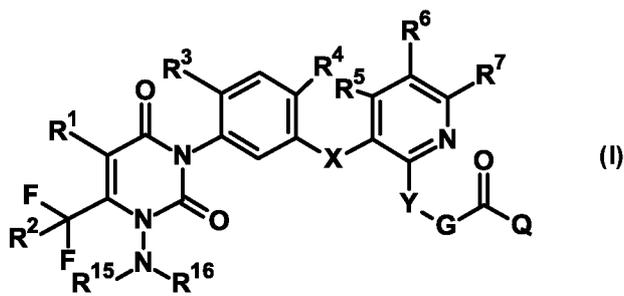
Таблица С5

Соединение Пример №	<i>Glycine max</i> (Действие в %)	Норма расхода [г/га]
I.14-442 (согласно изобретению)	20	6
№ 16 (из WO2019/101551)	50	6
I.14-442 (согласно изобретению)	10	2
№ 16 (из WO2019/101551)	40	2

Как показывают результаты, представленные в Таблицах С4 и С5, по сравнению с известным из литературы соединением (WO2019/101551, №16) соединение I14-442 согласно изобретению демонстрирует значительно более высокую переносимость культурными растениями в случае с такими организмами как *Zea mays* и *Glycine max* при норме расхода 6 г на гектар или менее.

## Формула изобретения

1. Замещенные N-фенил-N-аминоурацилы общей формулы (I) или их соли



где

R<sup>1</sup> означает водород, (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-галоалкил,

R<sup>2</sup> означает водород, фтор, хлор, бром, трифторметил, (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-алкокси,

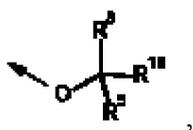
R<sup>3</sup> означает водород, галоген, (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-алкокси,

R<sup>4</sup> означает галоген, циано, NO<sub>2</sub>, C(O)NH<sub>2</sub>, C(S)NH<sub>2</sub>, (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-галоалкил, (C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>)-алкинил,

R<sup>5</sup>, R<sup>6</sup> и R<sup>7</sup> независимо друг от друга означают водород, галоген, циано, (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-алкил, (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-галоалкил, (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-алкокси, (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-галоалкокси,

G означает неразветвленный или разветвленный (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-алкилен,

Q означает гидроксильный или остаток следующей формулы



R<sup>8</sup> означает водород, (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-алкил, (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-галоалкил, арил, арил-(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-алкил, гетероарил, (C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>)-алкинил, (C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>)-алкенил, C(O)R<sup>13</sup>, C(O)OR<sup>13</sup>, (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-алкокси-(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-алкил,

R<sup>9</sup> означает водород или (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-алкил,

$R^{10}$  означает водород, галоген, циано,  $NO_2$ ,  $(C_1-C_8)$ -алкил,  $(C_1-C_8)$ -галоалкил,  $(C_3-C_8)$ -циклоалкил,  $(C_3-C_8)$ -циклоалкил- $(C_1-C_8)$ -алкил,  $(C_3-C_8)$ -галоциклоалкил,  $(C_3-C_8)$ -галоциклоалкил- $(C_1-C_8)$ -алкил,  $(C_2-C_8)$ -алкенил,  $(C_2-C_8)$ -алкинил, арил, арил- $(C_1-C_8)$ -алкил, гетероарил, гетероарил- $(C_1-C_8)$ -алкил, гетероциклил, гетероциклил- $(C_1-C_8)$ -алкил,  $R^{11}R^{12}N$ - $(C_1-C_8)$ -алкил,  $R^{13}O$ - $(C_1-C_8)$ -алкил, циано- $(C_1-C_8)$ -алкил,  $(C_1-C_8)$ -алкилкарбонилокси- $(C_1-C_8)$ -алкил,  $(C_3-C_8)$ -циклоалкилкарбонилокси- $(C_1-C_8)$ -алкил, арилкарбонилокси- $(C_1-C_8)$ -алкил, гетероарилкарбонилокси- $(C_1-C_8)$ -алкил, гетероциклилкарбонилокси- $(C_1-C_8)$ -алкил,  $OR^{13}$ ,  $NR^{11}R^{12}$ ,  $SR^{14}$ ,  $S(O)R^{14}$ ,  $SO_2R^{14}$ ,  $R^{14}S$ - $(C_1-C_8)$ -алкил,  $R^{14}(O)S$ - $(C_1-C_8)$ -алкил,  $R^{14}O_2S$ - $(C_1-C_8)$ -алкил, трис-[[ $(C_1-C_8)$ -алкил]силил- $(C_1-C_8)$ -алкил, бис-[[ $(C_1-C_8)$ -алкил](арил)силил- $(C_1-C_8)$ -алкил, [[ $(C_1-C_8)$ -алкил]-бис-(арил)силил- $(C_1-C_8)$ -алкил, трис-[[ $(C_1-C_8)$ -алкил]силил, бис-гидроксиборил- $(C_1-C_8)$ -алкил, бис-[[ $(C_1-C_8)$ -алкокси]борил- $(C_1-C_8)$ -алкил, тетраметил-1,3,2-диоксаборолан-2-ил, тетраметил-1,3,2-диоксаборолан-2-ил- $(C_1-C_8)$ -алкил, нитро- $(C_1-C_8)$ -алкил,  $C(O)OR^{13}$ ,  $C(O)R^{13}$ ,  $C(O)NR^{11}R^{12}$ ,  $R^{13}O(O)C$ - $(C_1-C_8)$ -алкил,  $R^{11}R^{12}N(O)C$ - $(C_1-C_8)$ -алкил, бис- $(C_1-C_8)$ -алкокси- $(C_1-C_8)$ -алкил, или

$R^8$  и  $R^{10}$  образуют с атомом углерода, к которому они присоединены, полностью насыщенное или частично насыщенное, при необходимости, прерываемое гетероатомами и, при необходимости, дополнительно замещенное 3-10-членное моноциклическое или бициклическое кольцо,

$R^{11}$  и  $R^{12}$  являются одинаковыми или различными и независимо друг от друга означают водород,  $(C_1-C_8)$ -алкил,  $(C_2-C_8)$ -алкенил,  $(C_2-C_8)$ -алкинил,  $(C_1-C_8)$ -цианоалкил,  $(C_1-C_{10})$ -галоалкил,  $(C_2-C_8)$ -галоалкенил,  $(C_3-C_8)$ -галоалкинил,  $(C_3-C_{10})$ -циклоалкил,  $(C_3-C_{10})$ -галоциклоалкил,  $(C_4-C_{10})$ -циклоалкенил,  $(C_4-C_{10})$ -галоциклоалкенил,  $(C_1-C_8)$ -алкокси- $(C_1-C_8)$ -алкил,  $(C_1-C_8)$ -галоалкокси- $(C_1-C_8)$ -алкил,  $(C_1-C_8)$ -алкилтио- $(C_1-C_8)$ -алкил,  $(C_1-C_8)$ -галоалкилтио- $(C_1-C_8)$ -алкил,  $(C_1-C_8)$ -алкокси- $(C_1-C_8)$ -галоалкил, арил, арил- $(C_1-C_8)$ -алкил, гетероарил, гетероарил- $(C_1-C_8)$ -алкил,  $(C_3-C_8)$ -циклоалкил- $(C_1-C_8)$ -алкил,  $(C_4-C_{10})$ -циклоалкенил- $(C_1-C_8)$ -алкил,  $COR^{13}$ ,  $SO_2R^{14}$ , гетероциклил,  $(C_1-C_8)$ -алкоксикарбонил,

бис-[(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-алкил]аминокарбонил-(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-алкил, (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-алкил-аминокарбонил-(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-алкил, арил-(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-алкил-аминокарбонил-(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-алкил, арил-(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-алкоксикарбонил, гетероарил-(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-алкоксикарбонил, (C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>)-алкенилоксикарбонил, (C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>)-алкинилоксикарбонил, гетероциклил-(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-алкил, или

R<sup>11</sup> и R<sup>12</sup> образуют с атомом азота, к которому они присоединены, полностью насыщенное или частично насыщенное, при необходимости, прерываемое гетероатомами и, при необходимости, дополнительно замещенное 3-10-членное моноциклическое или бициклическое кольцо,

R<sup>13</sup> означает водород, (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-алкил, (C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>)-алкенил, (C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>)-алкинил, (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-цианоалкил, (C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub>)-галоалкил, (C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>)-галоалкенил, (C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)-галоалкинил, (C<sub>3</sub>-C<sub>10</sub>)-циклоалкил, (C<sub>3</sub>-C<sub>10</sub>)-галоциклоалкил, (C<sub>4</sub>-C<sub>10</sub>)-циклоалкенил, (C<sub>4</sub>-C<sub>10</sub>)-галоциклоалкенил, (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-алкокси-(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-алкил, (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-галоалкокси-(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-алкил, (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-алкокси-(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-галоалкил, (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-алкокси-(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-алкокси-(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-алкил, (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-алкокси-(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-алкокси-(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-алкокси-(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-алкил, арил, арил-(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-алкил, арил-(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-алкокси-(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-алкил, гетероарил, гетероарил-(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-алкил, (C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)-циклоалкил-(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-алкил, (C<sub>4</sub>-C<sub>10</sub>)-циклоалкенил-(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-алкил, бис-[(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-алкил]аминокарбонил-(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-алкил, (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-алкил-аминокарбонил-(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-алкил, арил-(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-алкил-аминокарбонил-(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-алкил, бис-[(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-алкил]амино-(C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)-алкил, (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-алкил-амино-(C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)-алкил, арил-(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-алкил-амино-(C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)-алкил, R<sup>14</sup>S-(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-алкил, R<sup>14</sup>(O)S-(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-алкил, R<sup>14</sup>O<sub>2</sub>S-(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-алкил, гидроксикарбонил-(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-алкил, гетероциклил, гетероциклил-(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-алкил, трис-[(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-алкил]силил-(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-алкил, бис-[(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-алкил](арил)силил(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-алкил, [(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-алкил]-бис-(арил)силил-(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-алкил, (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-алкилкарбонилокси-(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-алкил, (C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)-циклоалкилкарбонилокси-(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-алкил, арилкарбонилокси-(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-алкил, гетероарилкарбонилокси-(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-алкил, гетероциклилкарбонилокси-(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-алкил, арилокси-(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-алкил, гетероарилокси-(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-алкил, (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-алкоксикарбонил,

$R^{14}$  означает водород,  $(C_1-C_8)$ -алкил,  $(C_2-C_8)$ -алкенил,  $(C_2-C_8)$ -алкинил,  $(C_1-C_8)$ -цианоалкил,  $(C_1-C_{10})$ -галоалкил,  $(C_2-C_8)$ -галоалкенил,  $(C_3-C_8)$ -галоалкинил,  $(C_3-C_{10})$ -циклоалкил,  $(C_3-C_{10})$ -галоциклоалкил,  $(C_4-C_{10})$ -циклоалкенил,  $(C_4-C_{10})$ -галоциклоалкенил,  $(C_1-C_8)$ -алкокси- $(C_1-C_8)$ -алкил,  $(C_1-C_8)$ -алкокси- $(C_1-C_8)$ -галоалкил, арил, арил- $(C_1-C_8)$ -алкил, гетероарил, гетероарил- $(C_1-C_8)$ -алкил, гетероциклил- $(C_1-C_8)$ -алкил,  $(C_3-C_8)$ -циклоалкил- $(C_1-C_8)$ -алкил,  $(C_4-C_{10})$ -циклоалкенил- $(C_1-C_8)$ -алкил, бис- $[(C_1-C_8)$ -алкил]амино,  $(C_1-C_8)$ -алкил-амино, арил- $(C_1-C_8)$ -амино, арил- $(C_1-C_6)$ -алкил-амино, арил- $[(C_1-C_8)$ -алкил]амино;  $(C_3-C_8)$ -циклоалкил-амино,  $(C_3-C_8)$ -циклоалкил- $[(C_1-C_8)$ -алкил]амино; N-азетидинил, N-пирролидинил, N-пиперидинил, N-морфолинил,

$R^{15}$  и  $R^{16}$  независимо друг от друга означают водород,  $(C_1-C_8)$ -алкил,  $(C_2-C_8)$ -алкенил,  $C(O)R^{13}$ ,  $C(O)OR^{13}$ ,  $C(O)NR^{11}R^{12}$ ,  $SO_2R^{14}$ , или

$R^{15}$  и  $R^{16}$  образуют с атомом азота, к которому они присоединены, при необходимости, дополнительно замещенную водородом,  $(C_1-C_8)$ -алкил, арил- $(C_1-C_8)$ -алкил,  $(C_3-C_8)$ -циклоалкил, арил, гетероарил, гетероциклил,  $(C_1-C_8)$ -алкоксикарбонил- $(C_1-C_8)$ -алкил, арил- $(C_1-C_8)$ -алкоксикарбонил- $(C_1-C_8)$ -алкил иминогруппу,

и

X и Y независимо друг от друга означают O (кислород) или S (серу).

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

$R^1$  означает водород,

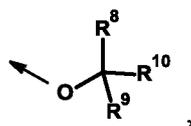
$R^2$  означает водород, фтор, хлор, бром, трифторметил,  $(C_1-C_6)$ -алкокси,

$R^3$  означает водород, галоген,  $(C_1-C_6)$ -алкокси,

$R^4$  означает галоген, циано,  $NO_2$ ,  $C(O)NH_2$ ,  $C(S)NH_2$ ,  $(C_1-C_6)$ -галоалкил,  $(C_2-C_6)$ -алкинил,

$R^5$ ,  $R^6$  и  $R^7$  независимо друг от друга означают водород, галоген, циано,  $(C_1-C_6)$ -алкил,  $(C_1-C_6)$ -галоалкил,  $(C_1-C_6)$ -алкокси,  $(C_1-C_6)$ -галоалкокси,

- G означает неразветвленный или разветвленный (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-алкилен,  
 Q означает гидроксильный или остаток следующей формулы



R<sup>8</sup> означает водород, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-алкил, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-галоалкил, арил, арил-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-алкил, гетероарил, (C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)-алкинил, (C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)-алкенил, C(O)R<sup>13</sup>, C(O)OR<sup>13</sup>, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-алкокси-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-алкил,

R<sup>9</sup> означает водород или (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-алкил,

R<sup>10</sup> означает водород, галоген, циано, NO<sub>2</sub>, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-алкил, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-галоалкил, (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)-циклоалкил, (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)-циклоалкил-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-алкил, (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)-галоциклоалкил, (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)-галоциклоалкил-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-алкил, (C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)-алкенил, (C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)-алкинил, арил, арил-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-алкил, гетероарил, гетероарил-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-алкил, гетероциклил, гетероциклил-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-алкил, R<sup>11</sup>R<sup>12</sup>N-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-алкил, R<sup>13</sup>O-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-алкил, циано-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-алкил, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-алкилкарбонилокси-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-алкил, (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)-циклоалкилкарбонилокси-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-алкил, арилкарбонилокси-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-алкил, гетероарилкарбонилокси-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-алкил, гетероциклилкарбонилокси-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-алкил, OR<sup>13</sup>, NR<sup>11</sup>R<sup>12</sup>, SR<sup>14</sup>, S(O)R<sup>14</sup>, SO<sub>2</sub>R<sup>14</sup>, R<sup>14</sup>S-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-алкил, R<sup>14</sup>(O)S-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-алкил, R<sup>14</sup>O<sub>2</sub>S-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-алкил, трис-[(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-алкил]силил-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-алкил, бис-[(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-алкил](арил)силил-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-алкил, [(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-алкил]-бис-(арил)силил-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-алкил, трис-[(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-алкил]силил, бис-гидроксидборил-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-алкил, бис-[(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-алкокси]борил-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-алкил, тетраметил-1,3,2-диоксаборолан-2-ил, тетраметил-1,3,2-диоксаборолан-2-ил-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-алкил, нитро-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-алкил, C(O)OR<sup>13</sup>, C(O)R<sup>13</sup>, C(O)NR<sup>11</sup>R<sup>12</sup>, R<sup>13</sup>O(O)C-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-алкил, R<sup>11</sup>R<sup>12</sup>N(O)C-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-алкил, бис-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-алкокси-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-алкил, или

R<sup>8</sup> и R<sup>10</sup> образуют с атомом углерода, к которому они присоединены, полностью насыщенное или частично насыщенное, при необходимости, прерываемое гетероатомами и, при необходимости, дополнительно замещенное 3-10-членное моноциклическое или бициклическое кольцо,

$R^{11}$  и  $R^{12}$  являются одинаковыми или различными и независимо друг от друга означают водород, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-алкил, (C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)-алкенил, (C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)-алкинил, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-цианоалкил, (C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub>)-галоалкил, (C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)-галоалкенил, (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)-галоалкинил, (C<sub>3</sub>-C<sub>10</sub>)-циклоалкил, (C<sub>3</sub>-C<sub>10</sub>)-галоциклоалкил, (C<sub>4</sub>-C<sub>10</sub>)-циклоалкенил, (C<sub>4</sub>-C<sub>10</sub>)-галоциклоалкенил, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-алкокси-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-алкил, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-галоалкокси-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-алкил, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-алкилтио-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-алкил, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-галоалкилтио-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-алкил, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-алкокси-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-галоалкил, арил, арил-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-алкил, гетероарил, гетероарил-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-алкил, (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)-циклоалкил-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-алкил, (C<sub>4</sub>-C<sub>10</sub>)-циклоалкенил-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-алкил, COR<sup>13</sup>, SO<sub>2</sub>R<sup>14</sup>, гетероциклил, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-алкоксикарбонил, бис-[(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-алкил]аминокарбонил-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-алкил, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-алкил-аминокарбонил-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-алкил, арил-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-алкил-аминокарбонил-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-алкил, арил-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-алкоксикарбонил, гетероарил-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-алкоксикарбонил, (C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)-алкенилоксикарбонил, (C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)-алкинилоксикарбонил, гетероциклил-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-алкил, или

$R^{11}$  и  $R^{12}$  образуют с атомом азота, к которому они присоединены, полностью насыщенное или частично насыщенное, при необходимости, прерываемое гетероатомами и, при необходимости, дополнительно замещенное 3-10-членное моноциклическое или бициклическое кольцо,

$R^{13}$  означает водород, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-алкил, (C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)-алкенил, (C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)-алкинил, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-цианоалкил, (C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub>)-галоалкил, (C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)-галоалкенил, (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)-галоалкинил, (C<sub>3</sub>-C<sub>10</sub>)-циклоалкил, (C<sub>3</sub>-C<sub>10</sub>)-галоциклоалкил, (C<sub>4</sub>-C<sub>10</sub>)-циклоалкенил, (C<sub>4</sub>-C<sub>10</sub>)-галоциклоалкенил, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-алкокси-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-алкил, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-галоалкокси-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-алкил, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-алкокси-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-галоалкил, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-алкокси-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-алкокси-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-алкил, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-алкокси-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-алкокси-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-алкокси-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-алкил, арил, арил-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-алкил, арил-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-алкокси-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-алкил, гетероарил, гетероарил-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-алкил, (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)-циклоалкил-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-алкил, (C<sub>4</sub>-C<sub>10</sub>)-циклоалкенил-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-алкил, бис-[(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-алкил]аминокарбонил-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-алкил, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-алкил-аминокарбонил-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-алкил, арил-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-алкил-аминокарбонил-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-алкил, бис-[(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-алкил]амино-

(C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>)-алкил, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-алкил-амино-(C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>)-алкил, арил-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-алкил-амино-(C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>)-алкил, R<sup>14</sup>S-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-алкил, R<sup>14</sup>(O)S-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-алкил, R<sup>14</sup>O<sub>2</sub>S-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-алкил, гидроксикарбонил-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-алкил, гетероциклил, гетероциклил-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-алкил, трис-[(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-алкил]силил-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-алкил, бис-[(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-алкил](арил)силил(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-алкил, [(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-алкил]-бис-(арил)силил-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-алкил, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-алкилкарбонилокси-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-алкил, (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)-циклоалкилкарбонилокси-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-алкил, арилкарбонилокси-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-алкил, гетероарилкарбонилокси-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-алкил, гетероциклилкарбонилокси-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-алкил, арилокси-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-алкил, гетероарилокси-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-алкил, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-алкоксикарбонил,

R<sup>14</sup> означает водород, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-алкил, (C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)-алкенил, (C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)-алкинил, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-цианоалкил, (C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub>)-галоалкил, (C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)-галоалкенил, (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)-галоалкинил, (C<sub>3</sub>-C<sub>10</sub>)-циклоалкил, (C<sub>3</sub>-C<sub>10</sub>)-галоциклоалкил, (C<sub>4</sub>-C<sub>10</sub>)-циклоалкенил, (C<sub>4</sub>-C<sub>10</sub>)-галоциклоалкенил, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-алкокси-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-алкил, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-алкокси-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-галоалкил, арил, арил-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-алкил, гетероарил, гетероарил-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-алкил, гетероциклил-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-алкил, (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)-циклоалкил-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-алкил, (C<sub>4</sub>-C<sub>10</sub>)-циклоалкенил-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-алкил, бис-[(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-алкил]амино, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-алкил-амино, арил-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-амино, арил-(C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>)-алкил-амино, арил-[(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-алкил]амино; (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)-циклоалкил-амино, (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)-циклоалкил-[(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-алкил]амино; N-азетидинил, N-пирролидинил, N-пиперидинил, N-морфолинил,

R<sup>15</sup> и R<sup>16</sup> независимо друг от друга означают водород, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-алкил, (C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)-алкенил, C(O)R<sup>13</sup>, C(O)OR<sup>13</sup>, C(O)NR<sup>11</sup>R<sup>12</sup>, SO<sub>2</sub>R<sup>14</sup>, или

R<sup>15</sup> и R<sup>16</sup> образуют с атомом азота, к которому они присоединены, при необходимости, дополнительно замещенную водородом, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-алкилом, арил-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-алкилом, (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)-циклоалкилом, арилом, гетероарилом, гетероциклилом, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-алкоксикарбонил-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-алкилом, арил-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-алкоксикарбонил-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-алкилом иминогруппу,

и

X и Y независимо друг от друга означают O (кислород) или S (серу).

3. Соединения общей формулы (I) по п. 1 и/или их соль, **отличающиеся тем, что**

$R^1$  означает водород,

$R^2$  означает водород, фтор, хлор, бром, трифторметил, метокси, этокси, проп-1-илокси, бут-1-илокси,

$R^3$  означает водород, фтор, хлор, бром, метокси, этокси, проп-1-илокси, проп-2-илокси, бут-1-илокси, бут-2-илокси, 2-метилпроп-1-илокси, 1,1-диметилэт-1-илокси,

$R^4$  означает фтор, хлор, бром, циано,  $NO_2$ ,  $C(O)NH_2$ ,  $C(S)NH_2$ , трифторметил, дифторметил, пентафторэтил, этинил, пропин-1-ил, 1-бутин-1-ил, пентин-1-ил, гексин-1-ил,

$R^5$ ,  $R^6$  и  $R^7$  независимо друг от друга означают водород, фтор, хлор, бром, йод, циано, метил, этил, проп-1-ил, 1-метилэтил, бут-1-ил, 1-метилпропил, 2-метилпропил, 1,1-диметилэтил, н-пентил, 1-метилбутил, 2-метилбутил, 3-метилбутил, 1,1-диметилпропил, 1,2-диметилпропил, 2,2-диметилпропил, 1-этилпропил, н-гексил, 1-метилпентил, 2-метилпентил, 3-метилпентил, 4-метилпентил, 1,1-диметилбутил, 1,2-диметилбутил, 1,3-ди-метилбутил, 2,2-диметилбутил, 2,3-диметилбутил, 3,3-диметилбутил, 1-этилбутил, 2-этилбутил, 1,1,2-триметилпропил, 1,2,2-триметилпропил, 1-этил-1-метилпропил, 1-этил-2-метилпропил, трифторметил, дифторметил, пентафторэтил, 2,2-дифторэтил, 2,2,2-трифторэтил, метокси, этокси, проп-1-илокси, проп-2-илокси, бут-1-илокси, бут-2-илокси, 2-метилпроп-1-илокси, 1,1-диметилэт-1-илокси, дифторметокси, трифторметокси, пентафторэтокси, 2,2-дифторэтокси, 2,2,2-трифторэтокси,

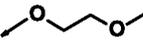
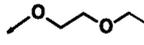
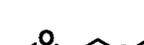
G означает метилен, (метил)метилен, (этил)метилен, (проп-1-ил)метилен, (проп-2-ил)метилен, (бут-1-ил)метилен, (бут-2-ил)метилен, (пент-1-ил)метилен, (пент-2-ил)метилен, (пент-3-ил)метилен, (диметил)метилен, (диэтил)метилен, этилен, н-пропилен, (1-метил)этил-1-ен, (2-метил)этил-1-ен, н-бутилен, 1-метилпропил-1-ен, 2-метилпропил-1-ен, 3-метилпропил-1-ен, 1,1-диметилэтил-1-ен,

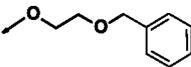
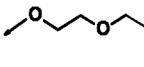
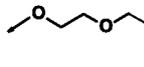
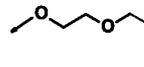
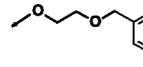
2,2-диметилэтил-1-ен, 1-этиэтил-1-ен, 2-этиэтил-1-ен, 1-(проп-1-ил)этил-1-ен, 2-(проп-1-ил)этил-1-ен, 1-(проп-2-ил)этил-1-ен, 2-(проп-2-ил)этил-1-ен, 1,1,2-триметилэтил-1-ен, 1,2,2-триметилэтил-1-ен, 1,1,2,2-тетраметилэтил-1-ен, н-пентилен, 1-метилбутил-1-ен, 2-метилбутил-1-ен, 3-метилбутил-1-ен, 4-метилбутил-1-ен, 1,1-диметилпропил-1-ен, 2,2-диметилпропил-1-ен, 3,3-диметилпропил-1-ен, 1,2-диметилпропил-1-ен, 1,3-диметилпропил-1-ен, 1-этилпропил-1-ен, н-гексилен, 1-метилпентил-1-ен, 2-метилпентил-1-ен, 3-метилпентил-1-ен, 4-метилпентил-1-ен, 1,1-диметилбутил-1-ен, 1,2-диметилбутил-1-ен, 1,3-ди-метилбутил-1-ен, 2,2-диметилбутил-1-ен, 2,3-диметилбутил-1-ен, 3,3-диметилбутил-1-ен, 1-этилбутил-1-ен, 2-этилбутил-1-ен, 1,1,2-триметилпропил-1-ен, 1,2,2-триметилпропил-1-ен, 1-этил-1-метилпропил-1-ен, 1-этил-2-метилпропил-1-ен,

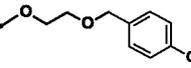
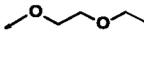
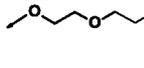
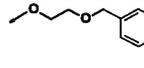
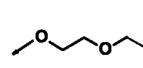
R<sup>15</sup> и R<sup>16</sup> независимо друг от друга означают водород, метил, этил, метилкарбонил, этилкарбонил, метоксикарбонил, этоксикарбонил, трет-бутилоксикарбонил,

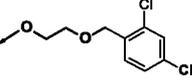
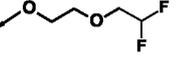
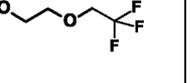
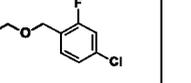
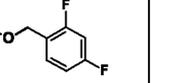
X и Y независимо друг от друга означают O (кислород) или S (серу),

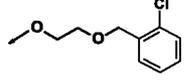
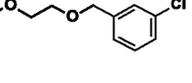
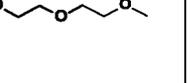
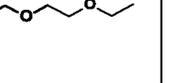
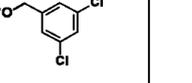
и Q означает одну из групп Q-1 - Q-486, конкретно указанных ниже:

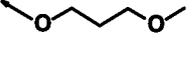
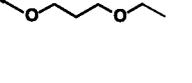
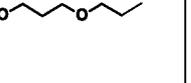
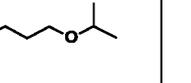
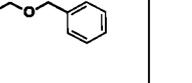
				
Q-1	Q-2	Q-3	Q-4	Q-5

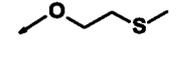
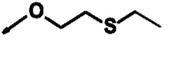
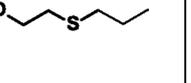
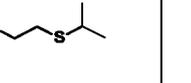
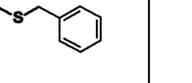
				
Q-6	Q-7	Q-8	Q-9	Q-10

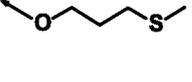
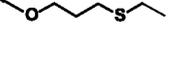
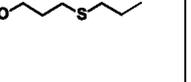
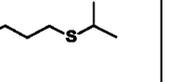
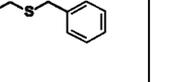
				
Q-11	Q-12	Q-13	Q-14	Q-15

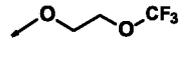
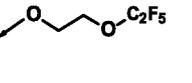
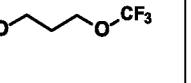
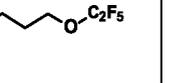
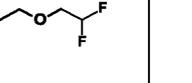
				
Q-16	Q-17	Q-18	Q-19	Q-20

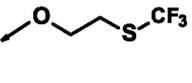
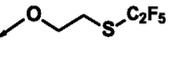
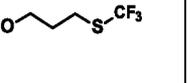
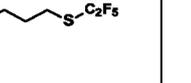
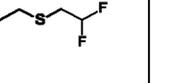
				
Q-21	Q-22	Q-23	Q-24	Q-25

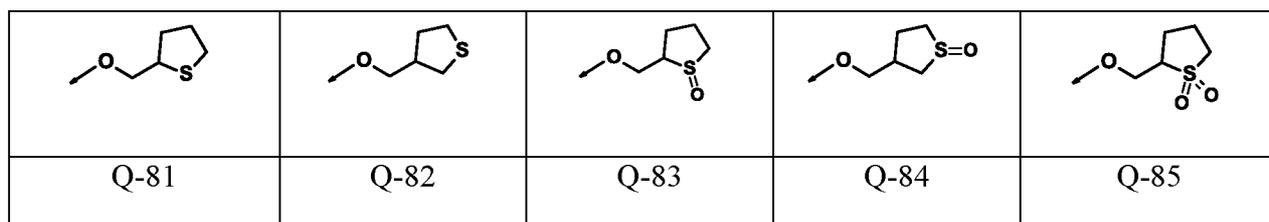
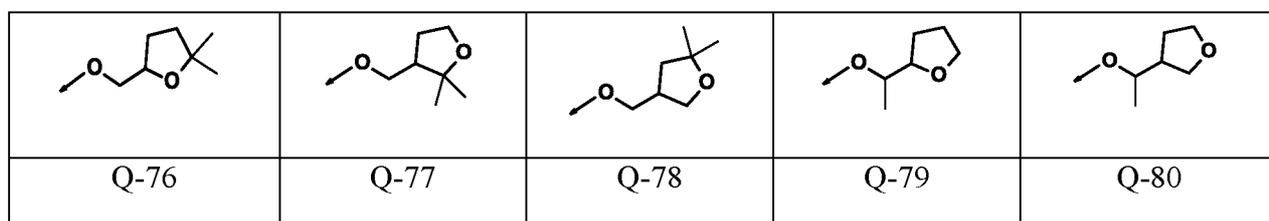
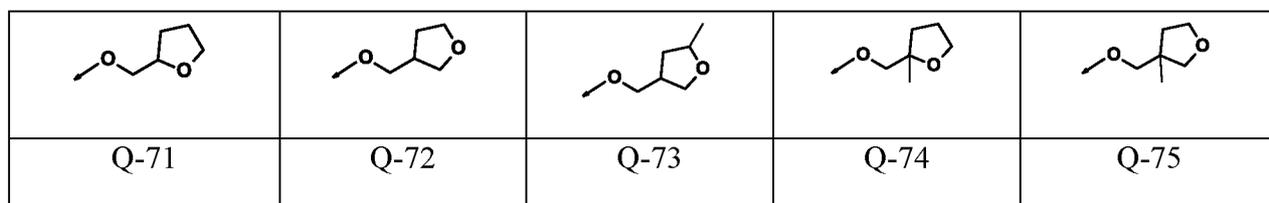
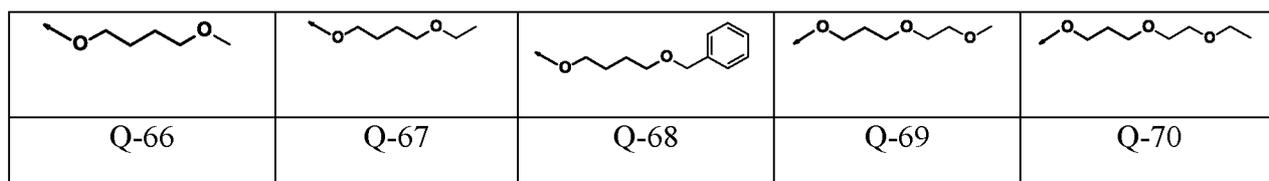
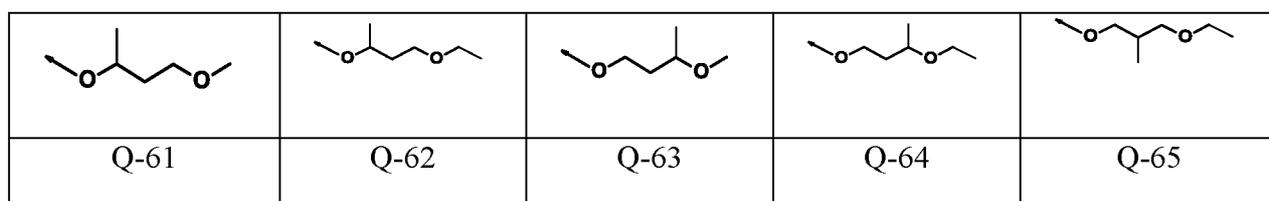
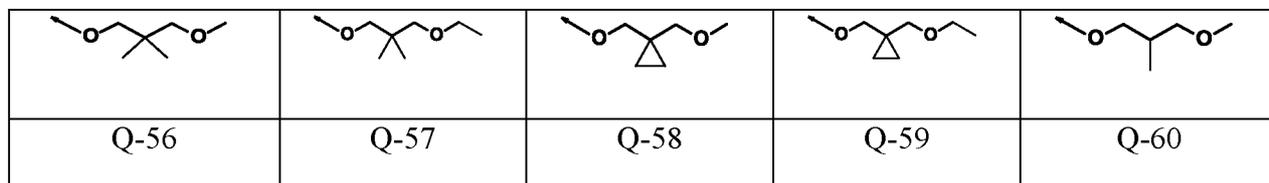
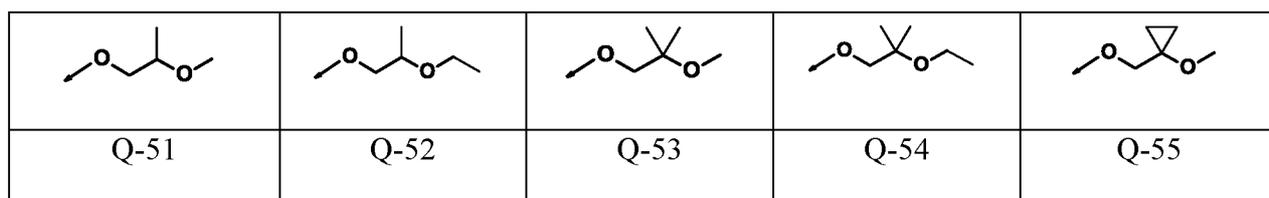
				
Q-26	Q-27	Q-28	Q-29	Q-30

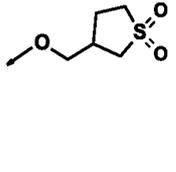
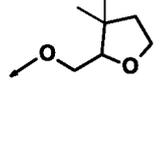
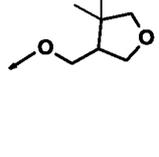
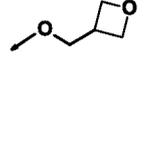
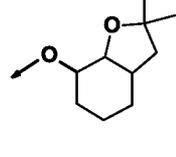
				
Q-31	Q-32	Q-33	Q-34	Q-35

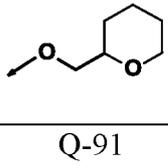
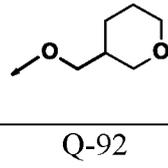
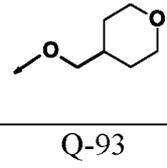
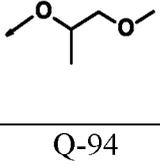
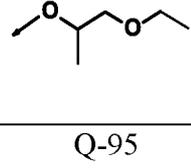
				
Q-36	Q-37	Q-38	Q-39	Q-40

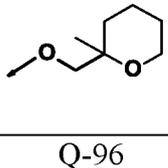
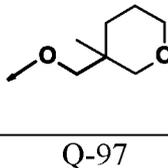
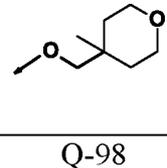
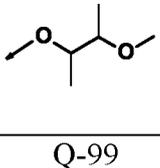
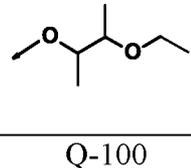
				
Q-41	Q-42	Q-43	Q-44	Q-45

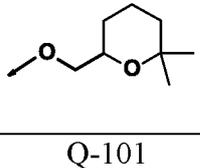
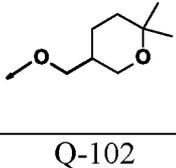
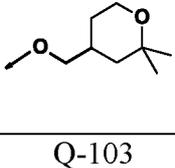
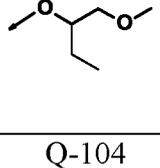
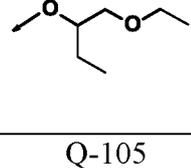
				
Q-46	Q-47	Q-48	Q-49	Q-50

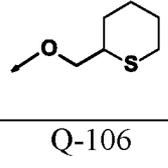
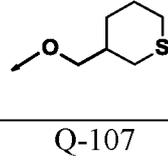
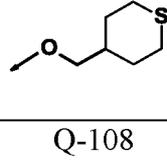
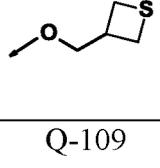
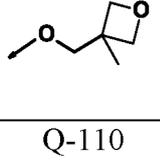


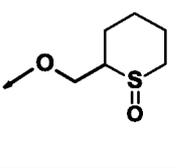
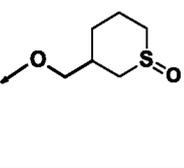
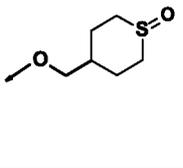
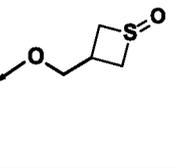
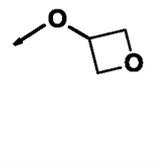
				
Q-86	Q-87	Q-88	Q-89	Q-90

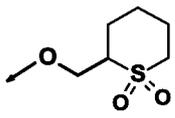
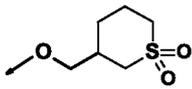
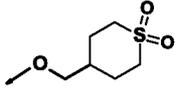
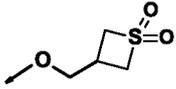
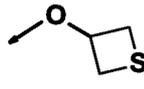
				
Q-91	Q-92	Q-93	Q-94	Q-95

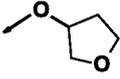
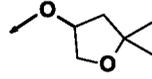
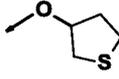
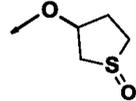
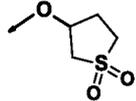
				
Q-96	Q-97	Q-98	Q-99	Q-100

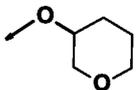
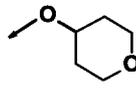
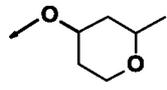
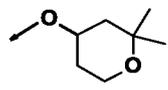
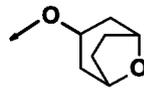
				
Q-101	Q-102	Q-103	Q-104	Q-105

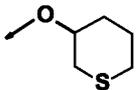
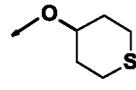
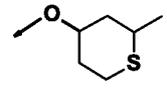
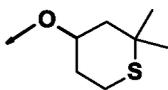
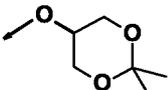
				
Q-106	Q-107	Q-108	Q-109	Q-110

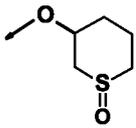
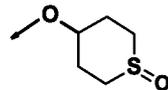
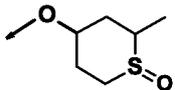
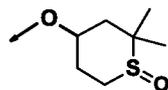
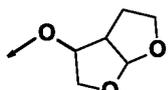
				
Q-111	Q-112	Q-113	Q-114	Q-115

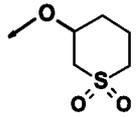
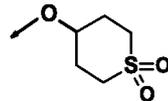
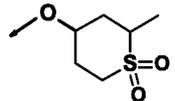
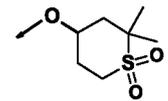
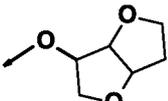
				
Q-116	Q-117	Q-118	Q-119	Q-120

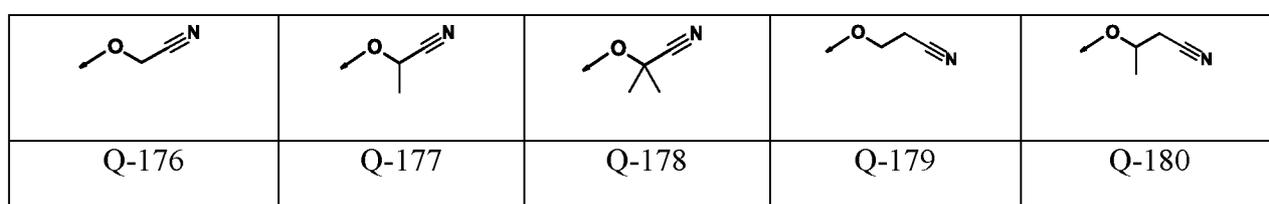
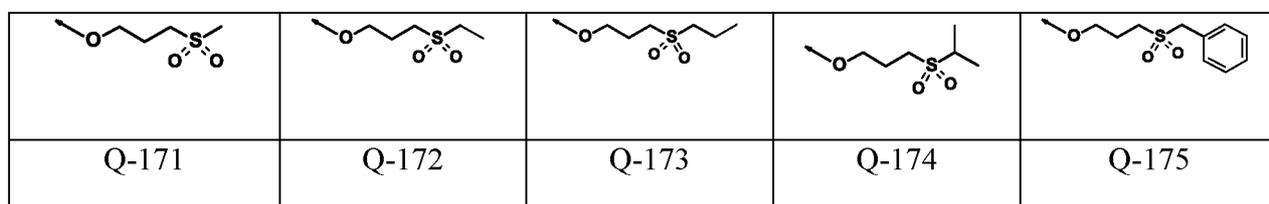
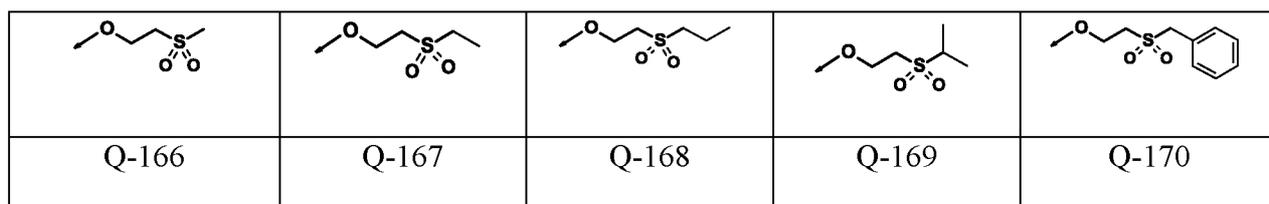
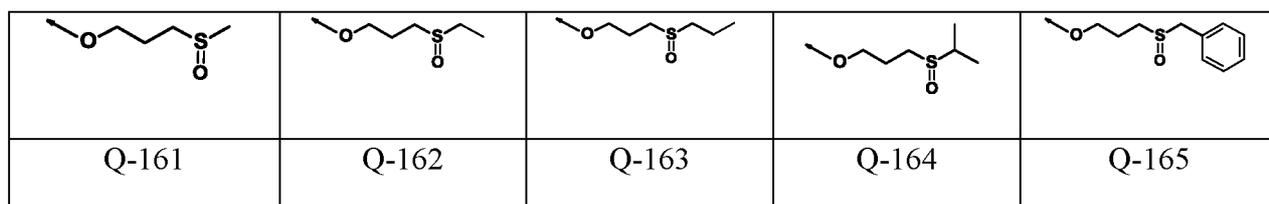
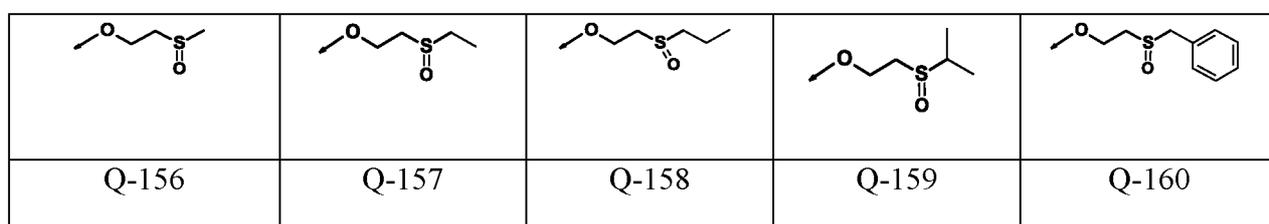
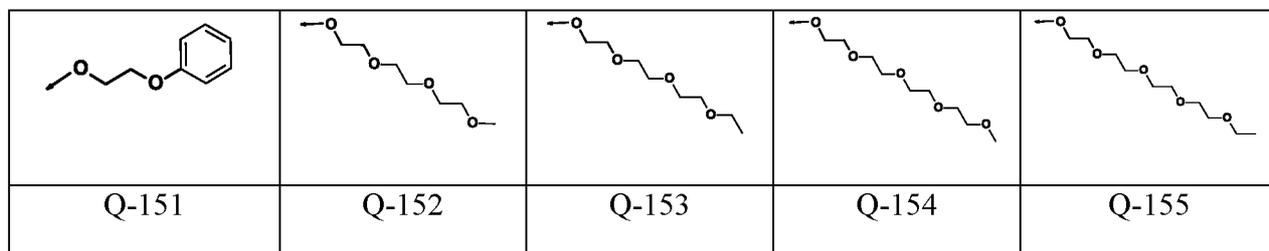
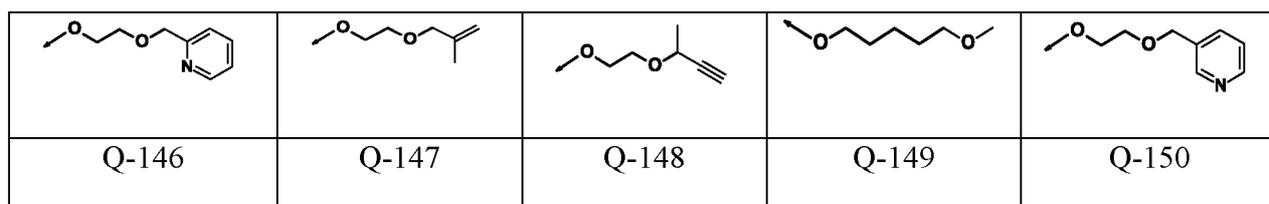
				
Q-121	Q-122	Q-123	Q-124	Q-125

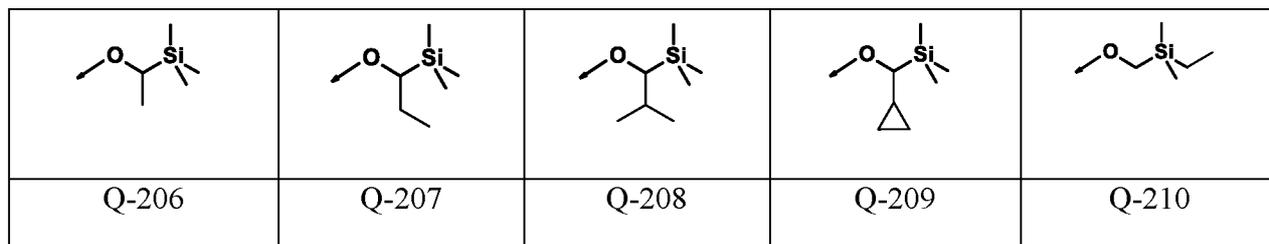
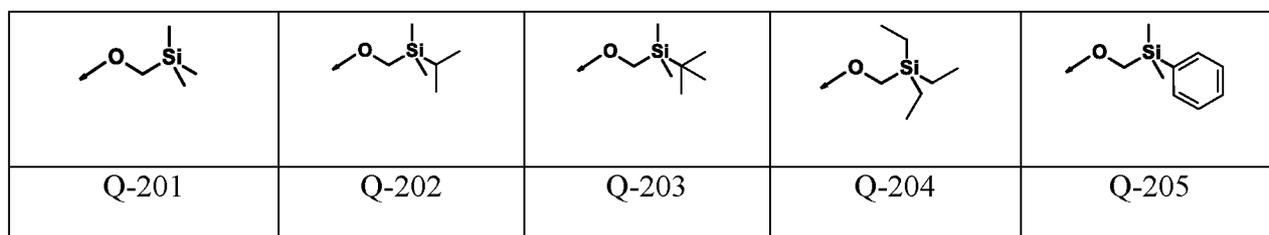
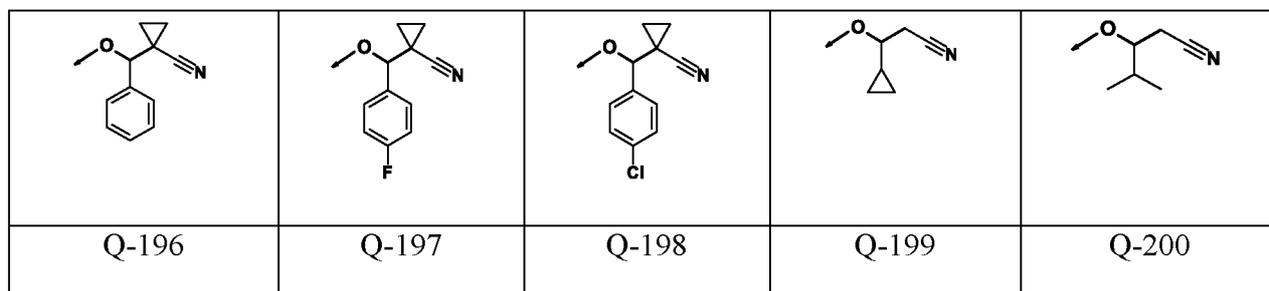
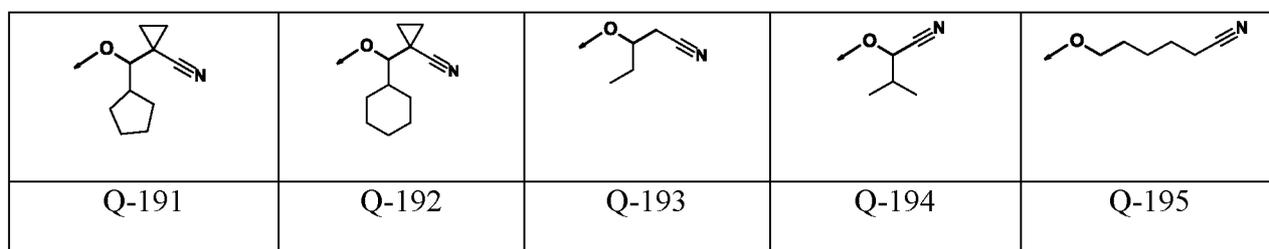
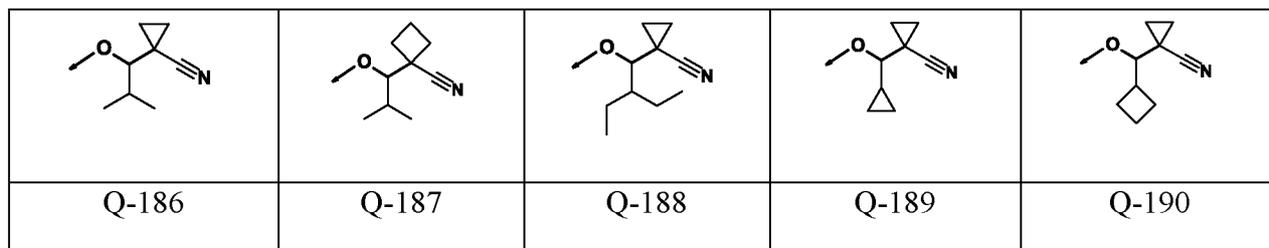
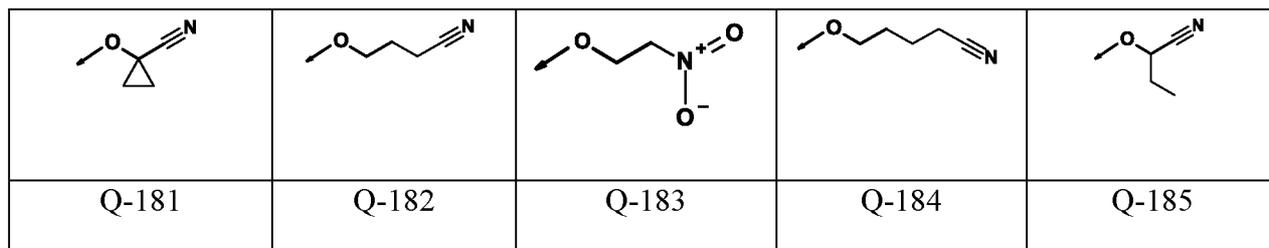
				
Q-126	Q-127	Q-128	Q-129	Q-130

				
Q-131	Q-132	Q-133	Q-134	Q-135

				
Q-136	Q-137	Q-138	Q-139	Q-140

				
Q-141	Q-142	Q-143	Q-144	Q-145





Q-211	Q-212	Q-213	Q-214	Q-215

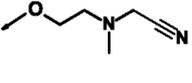
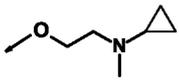
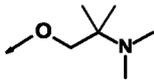
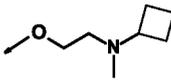
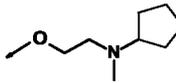
Q-216	Q-217	Q-218	Q-219	Q-220

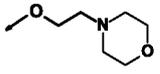
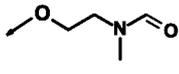
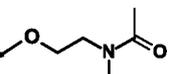
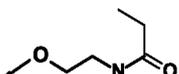
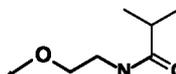
Q-221	Q-222	Q-223	Q-224	Q-225

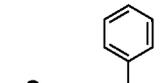
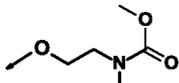
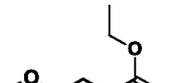
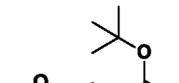
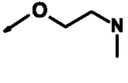
Q-226	Q-227	Q-228	Q-229	Q-230

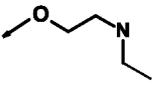
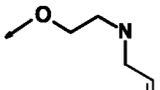
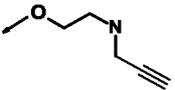
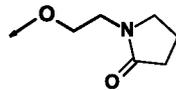
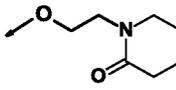
Q-231	Q-232	Q-233	Q-234	Q-235

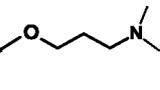
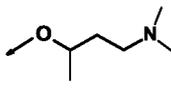
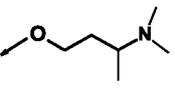
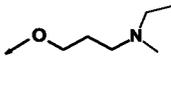
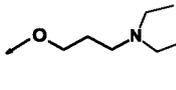
Q-236	Q-237	Q-238	Q-239	Q-240

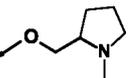
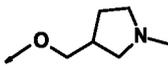
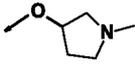
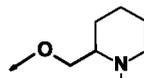
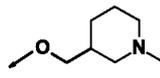
				
Q-241	Q-242	Q-243	Q-244	Q-245

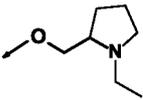
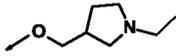
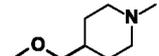
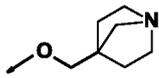
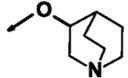
				
Q-246	Q-247	Q-248	Q-249	Q-250

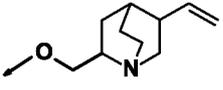
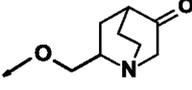
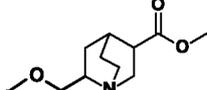
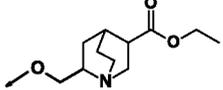
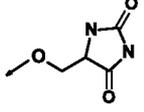
				
Q-251	Q-252	Q-253	Q-254	Q-255

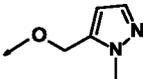
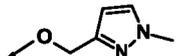
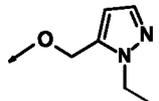
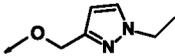
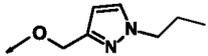
				
Q-256	Q-257	Q-258	Q-259	Q-260

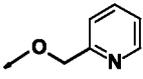
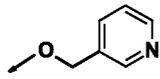
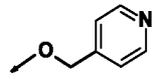
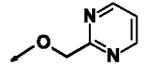
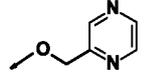
				
Q-261	Q-262	Q-263	Q-264	Q-265

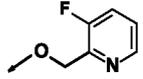
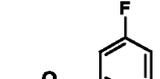
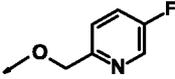
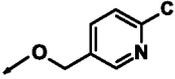
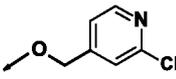
				
Q-266	Q-267	Q-268	Q-269	Q-270

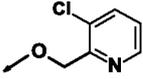
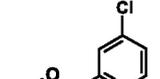
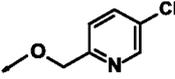
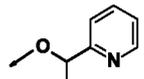
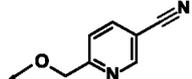
				
Q-271	Q-272	Q-273	Q-274	Q-275

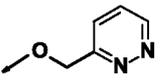
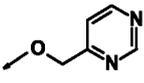
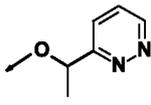
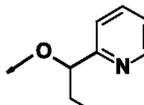
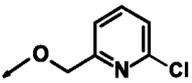
				
Q-276	Q-277	Q-278	Q-279	Q-280

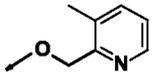
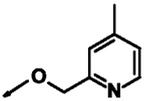
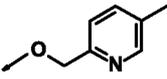
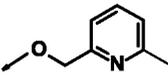
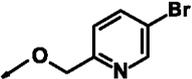
				
Q-281	Q-282	Q-283	Q-284	Q-285

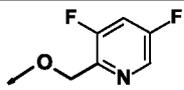
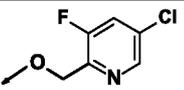
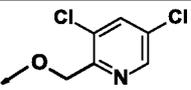
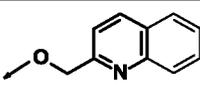
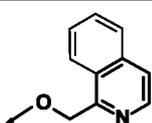
				
Q-286	Q-287	Q-288	Q-289	Q-290

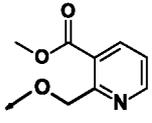
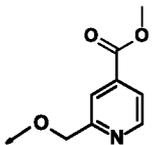
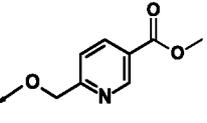
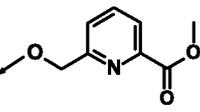
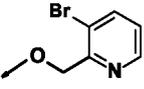
				
Q-291	Q-292	Q-293	Q-294	Q-295

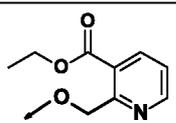
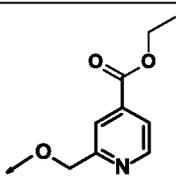
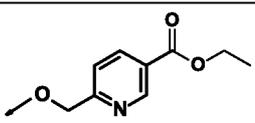
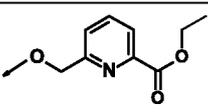
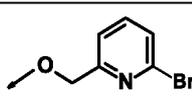
				
Q-296	Q-297	Q-298	Q-299	Q-300

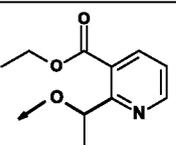
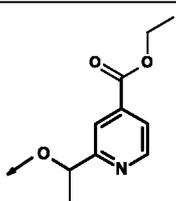
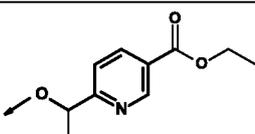
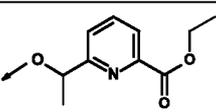
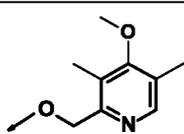
				
Q-301	Q-302	Q-303	Q-304	Q-305

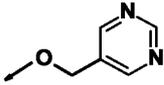
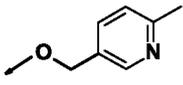
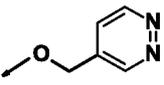
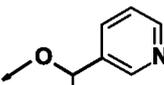
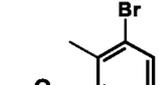
				
Q-306	Q-307	Q-308	Q-309	Q-310

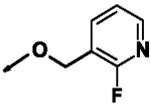
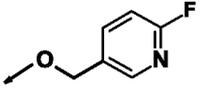
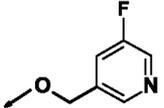
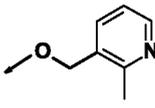
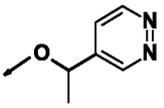
				
Q-311	Q-312	Q-313	Q-314	Q-315

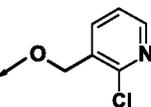
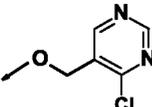
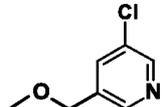
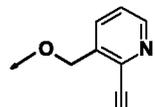
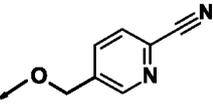
				
Q-316	Q-317	Q-318	Q-319	Q-320

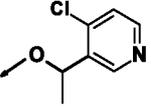
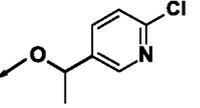
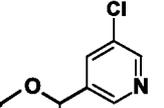
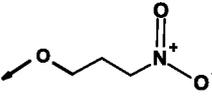
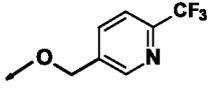
				
Q-321	Q-322	Q-323	Q-324	Q-325

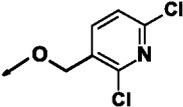
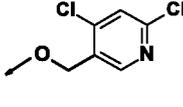
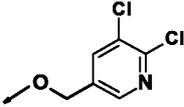
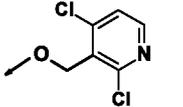
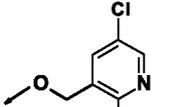
				
Q-326	Q-327	Q-328	Q-329	Q-330

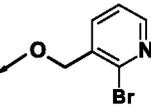
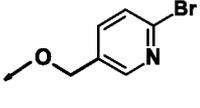
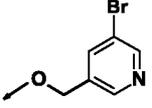
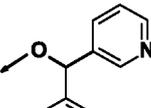
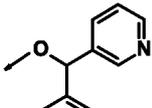
				
Q-331	Q-332	Q-333	Q-334	Q-335

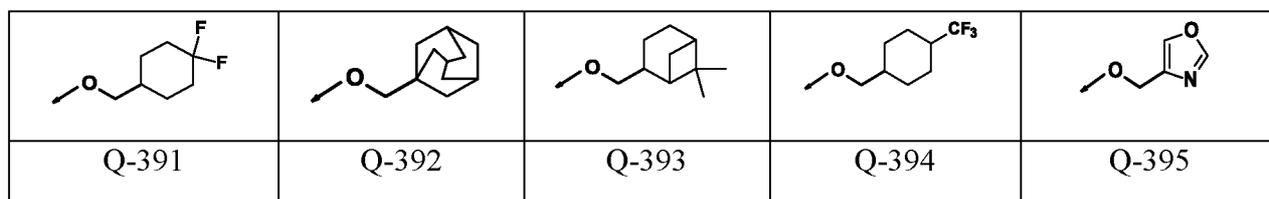
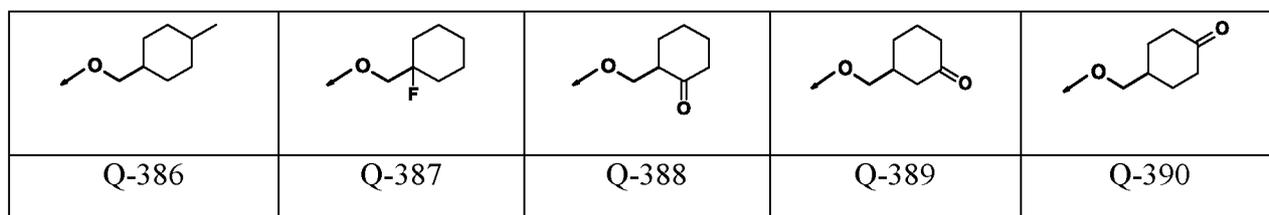
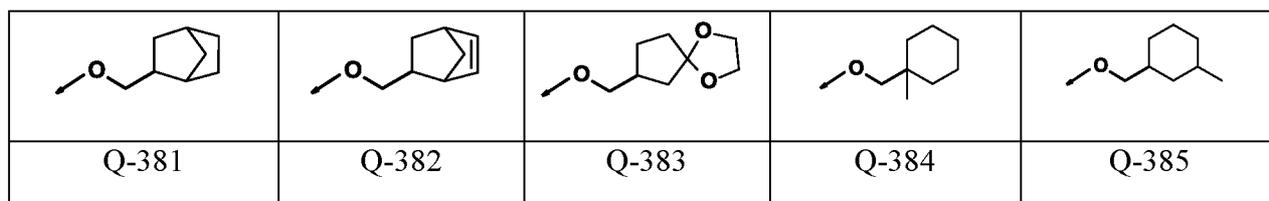
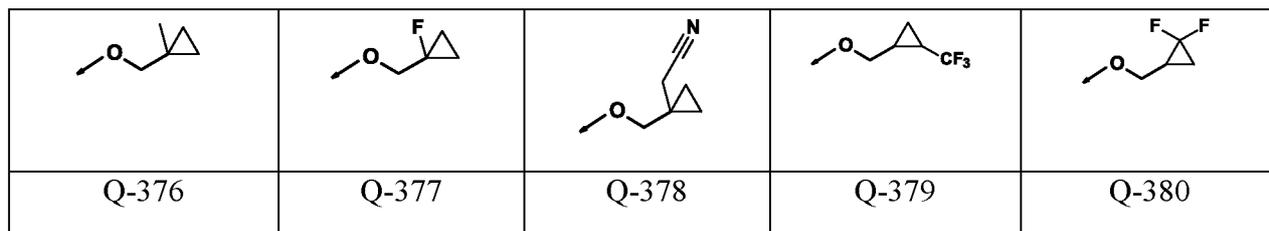
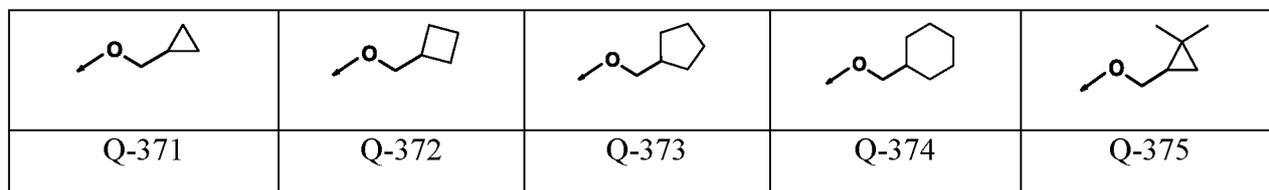
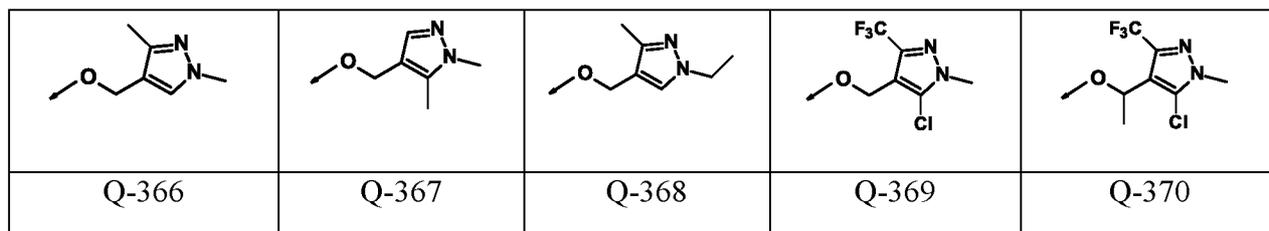
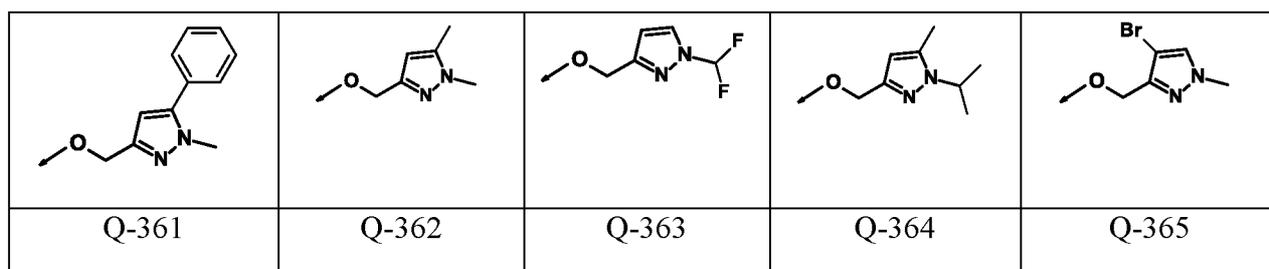
				
Q-336	Q-337	Q-338	Q-339	Q-340

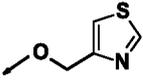
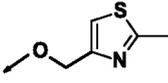
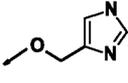
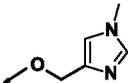
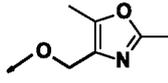
				
Q-341	Q-342	Q-343	Q-344	Q-345

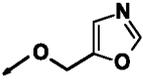
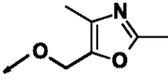
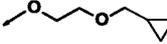
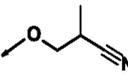
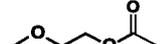
				
Q-346	Q-347	Q-348	Q-349	Q-350

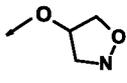
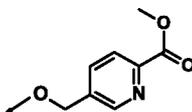
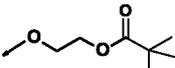
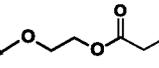
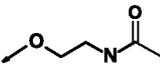
				
Q-351	Q-352	Q-353	Q-354	Q-355

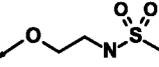
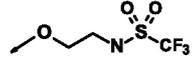
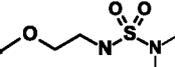
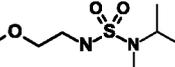
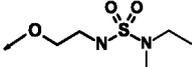
				
Q-356	Q-357	Q-358	Q-359	Q-360

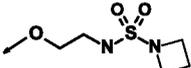
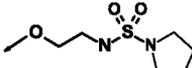
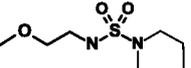
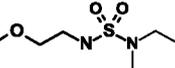
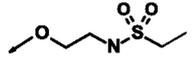


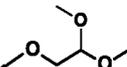
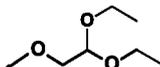
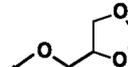
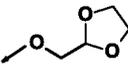
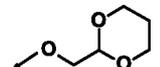
				
Q-396	Q-397	Q-398	Q-399	Q-400

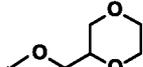
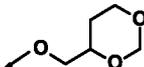
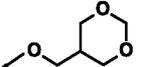
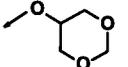
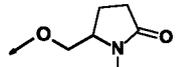
				
Q-401	Q-402	Q-403	Q-404	Q-405

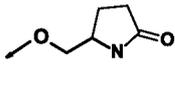
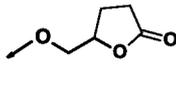
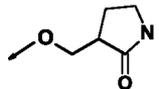
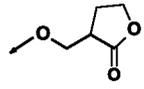
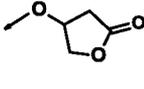
				
Q-406	Q-407	Q-408	Q-409	Q-410

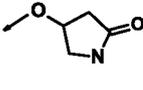
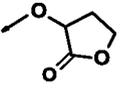
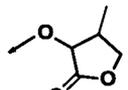
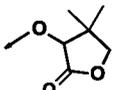
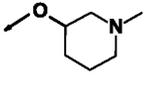
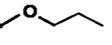
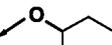
				
Q-411	Q-412	Q-413	Q-414	Q-415

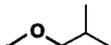
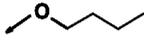
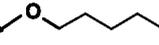
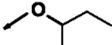
				
Q-416	Q-417	Q-418	Q-419	Q-420

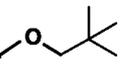
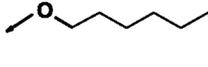
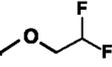
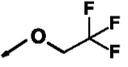
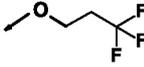
				
Q-421	Q-422	Q-423	Q-424	Q-425

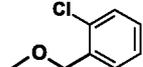
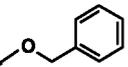
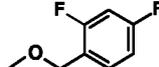
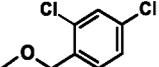
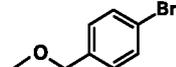
				
Q-426	Q-427	Q-428	Q-429	Q-430

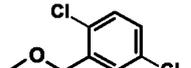
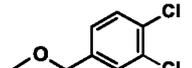
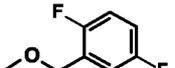
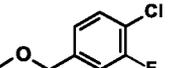
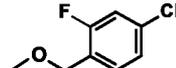
				
Q-431	Q-432	Q-433	Q-434	Q-435

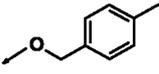
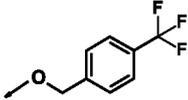
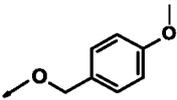
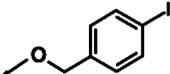
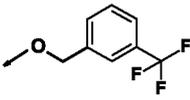
				
Q-436	Q-437	Q-438	Q-439	Q-440
				
Q-441	Q-442	Q-443	Q-444	Q-445

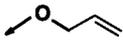
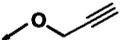
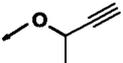
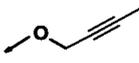
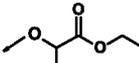
				
Q-446	Q-447	Q-448	Q-449	Q-450

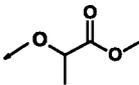
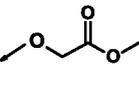
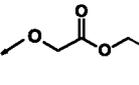
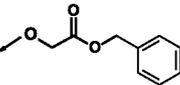
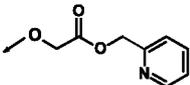
				
Q-451	Q-452	Q-453	Q-454	Q-455

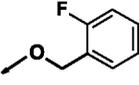
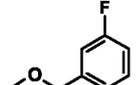
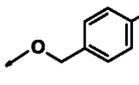
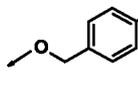
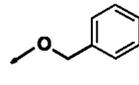
				
Q-456	Q-457	Q-458	Q-459	Q-460

				
Q-461	Q-462	Q-463	Q-464	Q-465

				
Q-466	Q-467	Q-468	Q-469	Q-470

				
Q-471	Q-472	Q-473	Q-474	Q-475

				
Q-476	Q-477	Q-478	Q-479	Q-480

				
Q-481				
				
Q-482	Q-483	Q-484	Q-485	Q-486

4. Соединения общей формулы (I) по п. 1 и/или их соль, **отличающиеся тем, что**

R<sup>1</sup> означает водород,

R<sup>2</sup> означает фтор,

R<sup>3</sup> означает фтор,

R<sup>4</sup> означает фтор, бром, циано, NO<sub>2</sub>, C(O)NH<sub>2</sub>, C(S)NH<sub>2</sub>,

R<sup>5</sup>, R<sup>6</sup> и R<sup>7</sup> независимо друг от друга означают водород, фтор, хлор, бром, циано, метил, трифторметил, метокси, трифторметокси,

G означает метилен, (метил)метилен, (этил)метилен, (диметил)метилен, этилен, н-пропилен, (1-метил)этил-1-ен, (2-метил)этил-1-ен, н-бутилен, 1-метилпропил-1-ен, 2-метилпропил-1-ен, 3-метилпропил-1-ен, н-пентилен, н-гексилен,

$R^{15}$  и  $R^{16}$  означают водород,

X и Y независимо друг от друга означают O (кислород) или S (серу),

и

Q означает одну из групп Q-1 - Q-486, конкретно указанных в п. 3.

5. Соединения общей формулы (I) по п. 1 и/или их соль, **отличающиеся тем, что**

$R^1$  означает водород,

$R^2$  означает фтор,

$R^3$  означает фтор,

$R^4$  означает фтор, бром, циано,  $NO_2$ ,  $C(O)NH_2$ ,  $C(S)NH_2$ ,

$R^5$ ,  $R^6$  и  $R^7$  независимо друг от друга означают водород, фтор, хлор, бром, циано, метил, трифторметил, метокси, трифторметокси,

G означает метилен, (метил)метилен, (этил)метилен, (диметил)метилен, этилен, н-пропилен, (1-метил)этил-1-ен, (2-метил)этил-1-ен, н-бутилен, 1-метилпропил-1-ен, 2-метилпропил-1-ен, 3-метилпропил-1-ен, н-пентилен, н-гексилен,

$R^{15}$  и  $R^{16}$  означают водород,

X и Y независимо друг от друга означают O (кислород) или S (серу),

и

Q означает одну из групп Q-1 - Q-486, конкретно указанных в п. 3.

6. Соединения общей формулы (I) по п. 1 и/или их соль, **отличающиеся тем, что**

$R^1$  означает водород,

$R^2$  означает фтор,

$R^3$  означает фтор,

$R^4$  означает фтор, бром, циано,  $NO_2$ ,

$R^5$ ,  $R^6$  и  $R^7$  независимо друг от друга означают водород, фтор, хлор, бром, метил,

G означает метилен, (метил)метилен, (этил)метилен, (диметил)метилен, этилен, н-пропилен, н-бутилен, н-пентилен, н-гексилен,

$R^{15}$  и  $R^{16}$  означают водород,

X и Y независимо друг от друга означают O (кислород) или S (серу),

и

Q означает одну из групп Q-1 - Q-486, конкретно указанных в п. 3.

7. Соединения общей формулы (I) по п. 1 и/или их соль, **отличающиеся тем, что**

$R^1$  означает водород,

$R^2$  означает фтор,

$R^3$  означает фтор,

$R^4$  означает хлор,  $NO_2$ ,

$R^5$  означает водород,

$R^6$  означает водород, фтор,

$R^7$  означает водород,

G означает метилен, (метил)метилен, этилен, н-пропилен,

$R^{15}$  и  $R^{16}$  означают водород,

X означает O (кислород) или S (серу),

Y означает O (кислород),

и

Q означает одну из групп Q-1, Q-2, Q-23, Q-115, Q-176, Q-286, Q-441, Q-442, Q-447, Q-448, Q-457, Q-471, Q-481, конкретно указанных в п. 3.

8. Применение одного или более соединений общей формулы (I), как определено в одном из пп. 1 - 7, и/или их солей в качестве гербицида или регулятора роста растений, предпочтительно в культурах полезных и/или декоративных растений.

9. Гербецидное средство или средство, регулирующее рост растений, **отличающееся тем**, что средство содержит одно или более соединений общей формулы (I), как определено в одном из пп. 1 - 7, и/или их соли, и одно или более дополнительных веществ, выбранных из групп (i) и/или (ii), и

- (i) одно или более дополнительных агрохимически действующих веществ, предпочтительно выбранных из группы, состоящей из инсектицидов, акарицидов, нематоцидов, дополнительных гербицидов, фунгицидов, защитных средств, удобрений и/или дополнительных регуляторов роста растений,
- (ii) одно или более вспомогательных средств для препаративных форм, употребительных при защите растений.

10. Способ борьбы с вредными растениями или регулирования роста растений, **отличающийся тем**, что эффективное количество

- одного или более соединений общей формулы (I), как определено в одном из пп. 1 - 7, и/или их солей, или
- средства по п. 9,

наносит на растения, семена растений, почвы, в которых или на которых произрастают растения, или на посевные площади.