

(19)



Евразийское  
патентное  
ведомство

(21) 202293133 (13) A1

## (12) ОПИСАНИЕ ИЗОБРЕТЕНИЯ К ЕВРАЗИЙСКОЙ ЗАЯВКЕ

(43) Дата публикации заявки  
2022.12.27(22) Дата подачи заявки  
2021.04.26(51) Int. Cl. C07D 401/14 (2006.01)  
A01N 43/60 (2006.01)  
C07D 403/04 (2006.01)  
C07D 403/14 (2006.01)

## (54) 1-ПИРАЗИНИЛПИРАЗОЛИЛ-3-ОКСИАЛКИЛОВЫЕ КИСЛОТЫ, А ТАКЖЕ ИХ ПРОИЗВОДНЫЕ И ИХ ПРИМЕНЕНИЕ ДЛЯ БОРЬБЫ С НЕЖЕЛАТЕЛЬНЫМ РОСТОМ РАСТЕНИЙ

(31) 20172043.0

(32) 2020.04.29

(33) EP

(86) PCT/EP2021/060784

(87) WO 2021/219527 2021.11.04

(71) Заявитель:

БАЙЕР АКЦИЕНГЕЗЕЛЬШАФТ  
(DE)

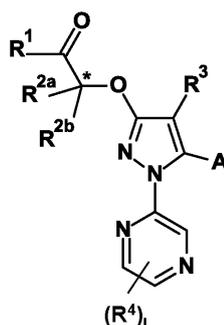
(72) Изобретатель:

Якоби Харальд, Хоффманн Михаэль  
Герхард, Мюллер Томас (DE), Бускато  
Арзеквель Эстелла (ES), Шмутцлер  
Дирк, Махеттира Ану Бхеемайах,  
Асмус Элизабет, Гатцвайлер Эльмар,  
Розингер Кристофер, Хью, Болленбах-  
Валь Биргит, Диттген Ян (DE)

(74) Представитель:

Квашнин В.П. (RU)

(57) Изобретение относится к новым гербицидно-активным, замещенным 1-пиразинилпиразолил-3-оксиалкиловым кислотам, а также их производным общей формулы (I) и их агрохимически совместимым солям, N-оксидам, гидратам и гидратам солей и N-оксидов, способу их получения, а также их применению для борьбы с сорняками и сорными травами в сельскохозяйственных культурах и для общей борьбы с сорняками и сорными травами в экологических зонах, в которых нарушается рост растений.



A1

202293133

202293133

A1

**1-ПИРАЗИНИЛПИРАЗОЛИЛ-3-ОКСИАЛКИЛОВЫЕ КИСЛОТЫ, А ТАКЖЕ  
ИХ ПРОИЗВОДНЫЕ И ИХ ПРИМЕНЕНИЕ ДЛЯ БОРЬБЫ С  
НЕЖЕЛАТЕЛЬНЫМ РОСТОМ РАСТЕНИЙ**

Описание

Настоящее изобретение относится к новым гербицидно-активным, замещенным 1-пиразинилпиразолил-3-оксиалкиловым кислотам, а также их производным общей формулы (I) и их агрохимически совместимым/приемлемым солям, N-оксидам, гидратам и гидратам солей и N-оксидов, способу их получения, а также их применению для борьбы с сорняками и сорными травами в сельскохозяйственных культурах и для общей борьбы с сорняками и сорными травами в экологических зонах, в которых нарушается рост растений.

Производные 1-пиразинилпиразолил-3-оксиалкиловых кислот включают, в частности, их сложные эфиры, соли и амиды.

Из уровня техники известны биологическое воздействие замещенных 1,5-дифенилпиразолил-3-оксиуксусных кислот и замещенных 1-фенил-5-тиенилпиразолил-3-оксиалкиловых кислот, а также способы получения данных соединений. В патенте ФРГ DE 2828529 A1 описано получение и гипополидевическое действие 1,5-дифенилпиразолил-3-оксиуксусной кислоты. В китайском патенте CN 101284815 раскрыты производные 1,5-

дифенилпиразолил-3-оксиуксусной кислоты в качестве бактерицидно-активных агрохимикатов. В международной заявке WO 2008/083233 A2 описывается 1,5-дифенилпиразолил-3-оксиалкиловые кислоты и их производные в качестве веществ, пригодных для разрушения клеточных агрегатов. В Journal of Heterocyclic Chemistry (2012), 49(6), 1370-1375 описаны дальнейшие синтезы и фунгицидное действие 1,5-дифенилпиразолил-3-оксиуксусной кислоты. Синтез замещенных 1-фенил-5-тиенилпиразолил-3-оксиалкиловых кислот и их фармацевтическое действие в качестве FXR и LXR модуляторов описаны в международной заявке WO 2008/073825 A1 .

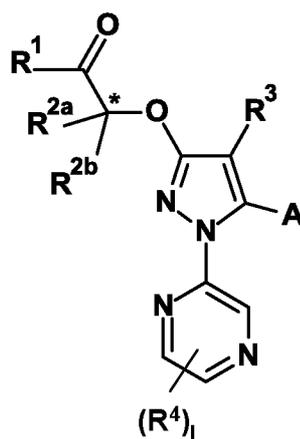
1-Пиразинилпиразолил-3-оксиалкиловые кислоты согласно изобретению, а также их производные отличаются от уже известных 1,5-дифенилпиразолил-3-оксоуксусных кислот и 1-фенил-5-тиенилпиразолил-3-оксиалкиловых кислот пиразинильным остатком в 1-положении пиразольного кольца и, таким образом, до сих пор являются неизвестными.

Задачей настоящего изобретения является предоставление новых пиразольных производных, которые могут использоваться в качестве гербицидов или регуляторов роста растений, с удовлетворительной гербицидной активностью и широким спектром действия против вредных растений и/или с высокой селективностью в отношении сельскохозяйственных культур.

Данная задача была решена с помощью замещенных пиразолил-3-оксиалкиловых кислот, отличающихся пиразинильным заместителем в 1-положении пиразольного кольца, т.е. производных 1-пиразинилпиразолил-3-оксиалкиловых кислот, обладающих очень хорошим гербицидным действием, а также очень хорошей селективностью.

Удивительно, но данные соединения обладают высокой эффективностью против широкого круга экономически важных сорняков и сорных трав. В то же время соединения обладают хорошей совместимостью в отношении культурных растений. Таким образом, обладая хорошей эффективностью в отношении вредных растений, они могут быть селективно использованы в культурных растениях.

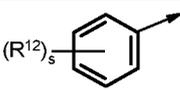
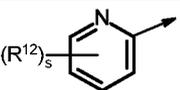
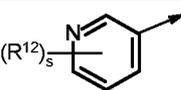
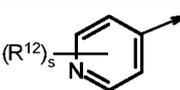
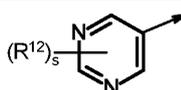
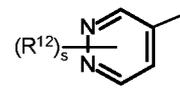
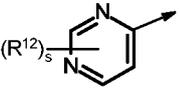
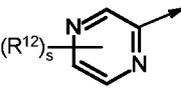
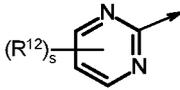
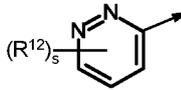
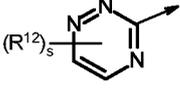
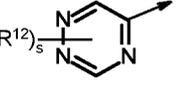
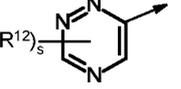
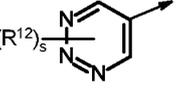
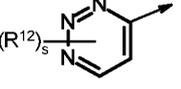
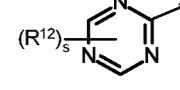
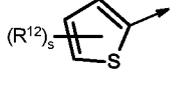
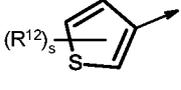
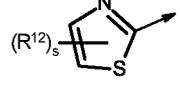
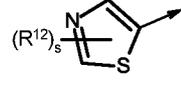
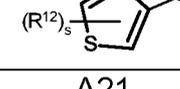
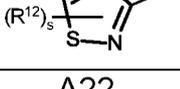
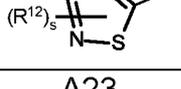
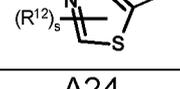
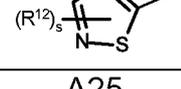
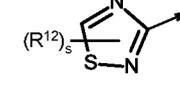
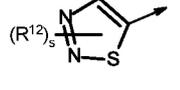
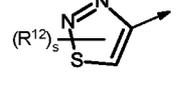
Объектом настоящего изобретения являются 1-пиразинилпиразолил-3-оксиалкиловые кислоты общей формулы (I)



(I)

а также их агрохимически совместимые соли, N-оксиды, гидраты и гидраты солей и N-оксидов, причем остатки имеют следующие определения:

A представляет собой A1-A28:

				
A1	A2	A3	A4	A5
				
A6	A7	A8	A9	A10
				
A11	A12	A13	A14	A15
				
A16	A17	A18	A19	A20
				
A21	A22	A23	A24	A25
				
A26	A27	A28		

R<sup>1</sup> представляет собой

- OR<sup>1a</sup> или
- NR<sup>9</sup>R<sup>10</sup>; в которой

R<sup>1a</sup>

- означает водород;
- означает (C<sub>1</sub>-C<sub>12</sub>)-алкил, который является незамещенным или замещен одним или несколькими заместителями, выбранными из группы, состоящей из галогена, (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)-циклоалкила, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-триалкилсилила, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-алкокси, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-алкокси-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-алкокси, циано и нитро;
- означает (C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)-алкенил, (C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)-галогеналкенил;
- означает (C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)-алкинил;
- означает (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)-циклоалкил, который является незамещенным или замещен одним или несколькими заместителями, выбранными из группы, состоящей из галогена, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-алкила, (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)-циклоалкила;
- означает (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-алкил-SO-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-алкил, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-алкил-SO<sub>2</sub>-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-алкил;
- означает гетероциклил, гетероарил и арил, который является незамещенным или замещен одним или несколькими заместителями, выбранными из группы, состоящей из галогена, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-алкила, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-галогеналкила;
- означает гетероциклил-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-алкил-, гетероарил-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-алкил- и арил-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-алкил-, причем гетероциклил, гетероарил и арил является незамещенным или замещен одним или несколькими заместителями, выбранными из группы, состоящей из галогена, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-алкила, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-галогеналкила;
- означает (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-алкилиденамино:

$R^9$  обозначает водород и (C<sub>1</sub>-C<sub>12</sub>)-алкил;

$R^{10}$

- означает водород;
- означает арил, гетероарил, гетероциклил, который является незамещенным или замещен одним или несколькими заместителями, выбранными из группы, состоящей из галогена, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-алкила, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-галогеналкила;
- означает (C<sub>3</sub>-C<sub>7</sub>)-циклоалкил-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-алкил-, гетероциклил-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-алкил-, гетероарил-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-алкил-, арил-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-алкил-, арил-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-алкокси;  
 причем циклоалкил, гетероциклил, гетероарил и арил является незамещенным или замещен одним или несколькими заместителями, выбранными из группы, состоящей из галогена, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-алкила, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-галогеналкила;
- означает (C<sub>1</sub>-C<sub>12</sub>)-алкил; (C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)-циклоалкил, (C<sub>2</sub>-C<sub>12</sub>)-алкенил, (C<sub>5</sub>-C<sub>8</sub>) циклоалкенил, (C<sub>2</sub>-C<sub>12</sub>)-алкинил;  
 причем указанные выше алкильный, циклоалкильный, алкенильный, циклоалкенильный и алкинильный остатки являются незамещенными или в каждом случае независимо друг от друга замещены *m* остатками, выбранными из группы, состоящей из циано, нитро, OR<sup>5</sup>, S(O)<sub>*n*</sub>R<sup>5</sup>, SO<sub>2</sub>NR<sup>6</sup>R<sup>7</sup>, C(O)OR<sup>8</sup>, CONR<sup>6</sup>R<sup>8</sup>, COR<sup>6</sup>, NR<sup>6</sup>R<sup>8</sup>, NR<sup>6</sup>COR<sup>8</sup>, NR<sup>6</sup>CONR<sup>8</sup>R<sup>8</sup>, NR<sup>6</sup>CO<sub>2</sub>R<sup>8</sup>, NR<sup>6</sup>SO<sub>2</sub>R<sup>8</sup>, NR<sup>6</sup>SO<sub>2</sub>NR<sup>6</sup>R<sup>8</sup>, C(R<sup>6</sup>)=NOR<sup>8</sup>;
- означает (C<sub>1</sub>-C<sub>12</sub>)-галогеналкил;

- означает  $S(O)_2R^5$ , циано, нитро,  $OR^5$ ,  $SO_2NR^6R^7$ ,  $CO_2R^8$ ,  $COR^8$ ,  $NR^6R^8$ ,  $NR^6COR^8$ ,  $NR^6CO_2R^8$ ,  $NR^6SO_2R^8$ ;

или

$R^9$  и  $R^{10}$  вместе с атомом азота, к которому они присоединены, образуют при необходимости замещенное от одного до шести раз остатком из группы, состоящей из галогена,  $(C_1-C_6)$ -алкила, галоген- $(C_1-C_6)$ -алкила,  $OR^5$ ,  $S(O)_nR^5$ ,  $CO_2R^8$ ,  $CONR^6R^8$ ,  $COR^6$  и  $C(R^6)=NOR^8$ , насыщенное, частично или полностью ненасыщенное пяти-, шести- или семичленное кольцо, которое помимо данного атома азота содержит  $g$  атомов углерода,  $o$  атомов кислорода,  $p$  атомов серы и  $q$  элементов из группы, состоящей из  $NR^7$ ,  $CO$  и  $NCOR^7$ , в качестве кольцевых атомов;

$R^5$  представляет собой  $(C_1-C_6)$ -алкил;  $(C_3-C_6)$ -циклоалкил,  $(C_1-C_6)$ -галогеналкил,  $(C_2-C_4)$ -алкенил или арил.

$R^6$  представляет собой водород или  $R^5$ ;

$R^7$  представляет собой водород,  $(C_1-C_6)$ -алкил,  $(C_3-C_6)$ -циклоалкил,  $(C_2-C_4)$ -алкенил или  $(C_3-C_4)$ -алкинил;

$R^8$  представляет собой водород,  $(C_1-C_6)$ -алкил,  $(C_3-C_6)$ -циклоалкил,  $(C_3-C_4)$ -алкенил или  $(C_3-C_4)$ -алкинил;

$R^{2a}$  представляет собой

- водород, галоген, циано;
- $(C_1-C_6)$ -алкил,  $(C_1-C_4)$ -алкокси- $(C_1-C_4)$ -алкил,  $(C_1-C_6)$ -галогеналкил,

(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-алкокси;

- (C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)-алкенил, (C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)-галогеналкенил;
- (C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)-алкинил, (C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)-галогеналкинил;
- (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)-циклоалкил;

R<sup>2b</sup> представляет собой

- водород и (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-алкил;

R<sup>3</sup> представляет собой

- галоген, циано, изоциано, NO<sub>2</sub>;
- (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>)-галогеналкил, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-алкилкарбонил, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-галогеналкилкарбонил, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-алкилоксикарбонил;
- (C<sub>2</sub>-C<sub>3</sub>)-алкенил, (C<sub>2</sub>-C<sub>3</sub>)-галогеналкенил;
- (C<sub>2</sub>-C<sub>3</sub>)-алкинил, (C<sub>2</sub>-C<sub>3</sub>)-галогеналкинил;
- (C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>)-алкил-S(O)<sub>n</sub> и (C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>)-галогеналкил-S(O)<sub>n</sub>;
- CHO, C(O)NH<sub>2</sub>;
- NH<sub>2</sub>;

R<sup>4</sup> представляет собой

- галоген, циано, изоциано, нитро;
- (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>)-галогеналкил, (C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)-галогеналкокси;
- (C<sub>2</sub>-C<sub>3</sub>)-алкенил, (C<sub>2</sub>-C<sub>3</sub>)-галогеналкенил;
- (C<sub>2</sub>-C<sub>3</sub>)-алкинил, (C<sub>2</sub>-C<sub>3</sub>)-галогеналкинил;
- (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-алкил-S(O)<sub>n</sub>, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-галогеналкил-S(O)<sub>n</sub>;
- CHO, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-алкилкарбонил, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-галогеналкилкарбонил, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-алкилоксикарбонил;

- NH<sub>2</sub>;

R<sup>12</sup> представляет собой

- галоген, циано, изоциано, NO<sub>2</sub>;
- (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-алкил, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-галогеналкил, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-алкилкарбонил, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-галогеналкилкарбонил; (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-алкилоксикарбонил, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-алкокси, (C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)-галогеналкокси, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-алкил-S(O)<sub>n</sub>;
- (C<sub>2</sub>-C<sub>3</sub>)-алкенил, (C<sub>2</sub>-C<sub>3</sub>)-галогеналкенил;
- (C<sub>2</sub>-C<sub>3</sub>)-алкинил, (C<sub>2</sub>-C<sub>3</sub>)-галогеналкинил;
- NH<sub>2</sub>;

и в которой коэффициенты означают

l 0, 1, 2 или 3.

m 0, 1 или 2;

n 0, 1 или 2;

o 0, 1 или 2;

p 0 или 1;

q 0 или 1;

r 3, 4, 5 или 6; и

s 0, 1, 2, 3, 4 или 5.

## Определения

В определениях символов, используемых в приведенных выше формулах, использовались обобщенные понятия, которые обычно обозначают следующие заместители:

**Галоген:** фтор, хлор, бром или йод, предпочтительно фтор, хлор или бром и особенно предпочтительно фтор или хлор.

**Алкил:** насыщенный, углеводородный остаток с прямой или разветвленной цепью, содержащий от 1 до 12, предпочтительно от 1 до 6 и особенно предпочтительно от 1 до 4 атомов углерода, например, (но не ограничиваясь ими) C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-алкил, такой как метил, этил, пропил (н-пропил), 1-метилэтил (изопропил), бутил (н-бутил), 1-метилпропил (втор-бутил), 2-метилпропил (изобутил), 1,1-диметилэтил (трет-бутил), пентил, 1-метилбутил, 2-метилбутил, 3-метилбутил, 2,2-диметилпропил, 1-этилпропил, 1,1-диметилпропил, 1,2-диметилпропил, гексил, 1-метилпентил, 2-метилпентил, 3-метилпентил, 4-метилпентил, 1,1-диметилбутил, 1,2-диметилбутил, 1,3-диметилбутил, 2,2-диметилбутил, 2,3-диметилбутил, 3,3-диметилбутил, 1-этилбутил, 2-этилбутил, 1,1,2-триметилпропил, 1,2,2-триметилпропил, 1-этил-1-метилпропил и 1-этил-2-метилпропил. В частности данная группа представляет собой C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-алкильную группу, например, метильную, этильную, пропильную, 1-метилэтильную(изопропильную), бутильную, 1-метилпропильную(втор-бутильную), 2-метилпропильную(изобутильную) или 1,1-диметилэтил-трет-бутильную группу. Это определение применимо, если не указано иное,

например, в случае алкилсульфанила, алкилсульфинила, алкилсульфонила, галогеналкила или галогеналкилсульфанила, а также к алкилу, как части составного заместителя, например циклоалкилалкилу или гидроксилалкилу.

**Алкенил:** ненасыщенные углеводородные группы с прямой или разветвленной цепью, содержащие от 2 до 8, предпочтительно от 2 до 6 и более предпочтительно от 2 до 4 атомов углерода и двойную связь в любом положении, например (но не ограничиваясь ими) C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-алкенил, такой как винил, аллил, (E)-2-метилвинил, (Z)-2-метилвинил, изопропенил, гомоаллил, (E)-бут-2-енил, (Z)-бут-2-енил, (E)-бут-1-енил, (Z)-бут-1-енил, 2-метилпроп-2-енил, 1-метилпроп-2-енил, 2-метилпроп-1-енил, (E)-1-метилпроп-1-енил, (Z)-1-метилпроп-1-енил, пент-4-енил, (E)-пент-3-енил, (Z)-пент-3-енил, (E)-пент-2-енил, (Z)-пент-2-енил, (E)-пент-1-енил, (Z)-пент-1-енил, 3-метилбут-3-енил, 2-метилбут-3-енил, 1-метилбут-3-енил, 3-метилбут-2-енил, (E)-2-метилбут-2-енил, (Z)-2-метилбут-2-енил, (E)-1-метилбут-2-енил, (Z)-1-метилбут-2-енил, (E)-3-метилбут-1-енил, (Z)-3-метилбут-1-енил, (E)-2-метилбут-1-енил, (Z)-2-метилбут-1-енил, (E)-1-метилбут-1-енил, (Z)-1-метилбут-1-енил, 1,1-диметилпроп-2-енил, 1-этилпроп-1-енил, 1-пропилвинил, 1-изопропилвинил, (E)-3,3-диметилпроп-1-енил, (Z)-3,3-диметилпроп-1-енил, гекс-5-енил, (E)-гекс-4-енил, (Z)-гекс-4-енил, (E)-гекс-3-енил, (Z)-гекс-3-енил, (E)-гекс-2-енил, (Z)-гекс-2-енил, (E)-гекс-1-енил, (Z)-гекс-1-енил, 4-метилпент-4-енил, 3-метилпент-4-енил, 2-метилпент-4-енил, 1-метилпент-4-енил, 4-метилпент-3-енил, (E)-3-метилпент-3-енил, (Z)-3-метилпент-3-енил, (E)-2-метилпент-3-енил, (Z)-2-

метилпент-3-енил, (E)-1-метилпент-3-енил, (Z)-1-метилпент-3-енил, (E)-4-метилпент-2-енил, (Z)-4-метилпент-2-енил, (E)-3-метилпент-2-енил, (Z)-3-метилпент-2-енил, (E)-2-метилпент-2-енил, (Z)-2-метилпент-2-енил, (E)-1-метилпент-2-енил, (Z)-1-метилпент-2-енил, (E)-4-метилпент-1-енил, (Z)-4-метилпент-1-енил, (E)-3-метилпент-1-енил, (Z)-3-метилпент-1-енил, (E)-2-метилпент-1-енил, (Z)-2-метилпент-1-енил, (E)-1-метилпент-1-енил, (Z)-1-метилпент-1-енил, 3-этилбут-3-енил, 2-этилбут-3-енил, 1-этилбут-3-енил, (E)-3-этилбут-2-енил, (Z)-3-этилбут-2-енил, (E)-2-этилбут-2-енил, (Z)-2-этилбут-2-енил, (E)-1-этилбут-2-енил, (Z)-1-этилбут-2-енил, (E)-3-этилбут-1-енил, (Z)-3-этилбут-1-енил, 2-этилбут-1-енил, (E)-1-этилбут-1-енил, (Z)-1-этилбут-1-енил, 2-пропилпроп-2-енил, 1-пропилпроп-2-енил, 2-изопропилпроп-2-енил, 1-изопропилпроп-2-енил, (E)-2-пропилпроп-1-енил, (Z)-2-пропилпроп-1-енил, (E)-1-пропилпроп-1-енил, (Z)-1-пропилпроп-1-енил, (E)-2-изопропилпроп-1-енил, (Z)-2-изопропилпроп-1-енил, (E)-1-изопропилпроп-1-енил, (Z)-1-изопропилпроп-1-енил, 1-(1,1-диметилэтил)этенил, бута-1,3-диенил, пента-1,4-диенил, гекса-1,5-диенил или метилгексадиенил. В частности, группа представляет собой винил или аллил. Это определение применимо также, если не указано иное, к алкенилу, как части составного заместителя, например галогеналкенилу.

**Алкинил:** углеводородные группы с прямой или разветвленной цепью, содержащие от 2 до 8, предпочтительно от 2 до 6 и более предпочтительно от 2 до 4 атомов углерода и тройную связь в любом положении, например (но не ограничиваясь ими) C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-алкинил, такой как этинил, проп-1-инил, проп-2-инил, бут-1-инил, бут-2-инил, бут-3-инил, 1-

метилпроп-2-инил, пент-1-инил, пент-2-инил, пент-3-инил, пент-4-инил, 2-метилбут-3-инил, 1-метилбут-3-инил, 1-метилбут-2-инил, 3-метилбут-1-инил, 1-этилпроп-2-инил, гекс-1-инил, гекс-2-инил, гекс-3-инил, гекс-4-инил, гекс-5-инил, 3-метилпент-4-инил, 2-метилпент-4-инил, 1-метилпент-4-инил, 2-метилпент-3-инил, 1-метилпент-3-инил, 4-метилпент-2-инил, 1-метилпент-2-инил, 4-метилпент-1-инил, 3-метилпент-1-инил, 2-этилбут-3-инил, 1-этилбут-3-инил, 1-этилбут-2-инил, 1-пропилпроп-2-инил, 1-изопропилпроп-2-инил, 2,2-диметилбут-3-инил, 1,1-диметилбут-3-инил, 1,1-диметилбут-2-инил или 3,3-диметилбут-1-инил. В частности, алкинильная группа представляет собой этинил, проп-2-инил или проп-2-инил. Это определение применимо также, если не указано иное, к алкинилу как части составного заместителя, например галогеналкинилу.

**Алкокси:** насыщенный алкоксильный остаток с прямой или разветвленной цепью, содержащие от 2 до 8, предпочтительно от 2 до 6 и более предпочтительно от 2 до 4 атомов углерода, например, (но не ограничиваясь ими) (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-алкокси, такой как метокси, этокси, н-пропокси, 1-метилэтокси, бутокси, 1-метилпропокси, 2-метилпропокси, 1,1-диметилэтокси, н-пентокси, 1-метилбутокси, 2-метилбутокси, 3-метилбутокси, 2,2-диметилпропокси, 1-этилпропокси, 1,1-диметилпропокси, 1,2-диметилпропокси, 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. Это определение применимо также, если не указано иное, к алкокси, как части составного заместителя, например галогеналкокси, алкилалкокси.

**Алкоксикарбонил:** алкоксигруппа, имеющая от 1 до 8, предпочтительно от 1 до 6 и более предпочтительно от 1 до 4 атомов углерода (как описано выше), присоединенная к основной цепи через карбонильную группу (-C(=O)-). Это определение применимо также, если не указано иное, к алкоксикарбонилу, как части составного заместителя, например, циклоалкилалкоксикарбонилу.

**Циклоалкил:** моноциклические насыщенные углеводородные группы, содержащие от 3 до 10, предпочтительно от 3 до 8 и более предпочтительно от 3 до 6 атомов углерода в кольце, например (но не ограничиваясь ими) циклопропил, циклопентил и циклогексил. Это определение применимо также, если не указано иное, к циклоалкилу, как части составного заместителя, например, циклоалкилалкилу.

**Циклоалкенил:** моноциклические частично ненасыщенные углеводородные группы, содержащие от 3 до 10, предпочтительно от 3 до 8 и более предпочтительно от 3 до 6 атомов углерода в кольце, например (но не ограничиваясь ими) циклопропенил, циклопентенил и циклогексенил. Это определение применимо также, если не указано иное, к циклоалкенилу как части составного заместителя, например, циклоалкенилалкилу.

**Циклоалкокси:** моноциклические насыщенные циклоалкоксильные остатки, содержащие от 3 до 10, предпочтительно от 3 до 8 и более предпочтительно от 3 до 6 атомов углерода в кольце, например (но не ограничиваясь ими) циклопропилокси, циклопентилокси и циклогексилокси. Это определение применимо также, если не указано иное, к циклоалкокси, как части составного заместителя, например, циклоалкоксиалкилу.

**Галогеналкил:** алкильные группы с прямой или разветвленной цепью, содержащие от 1 до 6, предпочтительно от 1 до 4 атомов углерода (как описано выше), причем некоторые или все атомы водорода в этих группах замещены атомами галогена, как описано выше, например (но не ограничиваясь ими) C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>-галогеналкил, такой как хлорметил, бромметил, дихлорметил, трихлорметил, фторметил, дифторметил, трифторметил, хлорфторметил, дихлорфторметил, хлордифторметил, 1-хлорэтил, 1-бромэтил, 1-фторэтил, 2-фторэтил, 2,2-дифторэтил, 2,2,2-трифторэтил, 2-хлор-2-фторэтил, 2-хлор-2,2-дифторэтил, 2,2-дихлор-2-фторэтил, 2,2,2-трихлорэтил, пентафторэтил и 1,1,1-трифторпроп-2-ил. Это определение применимо также, если не указано иное, к галогеналкилу, как части составного заместителя, например, галогеналкиламиноалкилу.

Галоалкенил и галоалкинил имеют аналогичные с галогеналкилом определения, но вместо алкильных групп присутствуют алкенильные или соответственно алкинильные группы в качестве части заместителя.

**Галогеналкокси:** алкоксигруппы с прямой или разветвленной цепью, содержащие от 1 до 6, предпочтительно от 1 до 3 атомов углерода (как

описано выше), причем некоторые или все атомы водорода в этих группах замещены атомами галогена, как описано выше, например (но не ограничиваясь ими) C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>-галогеналкокси, такой как хлорметокси, бромметокси, дихлорметокси, трихлорметокси, фторметокси, дифторметокси, трифторметокси, хлорфторметокси, дихлорфторметокси, хлордифторметокси, 1-хлорэтоксид, 1-бромэтоксид, 1-фторэтоксид, 2-фторэтоксид, 2,2-дифторэтоксид, 2,2,2-трифторэтоксид, 2-хлор-2-фторэтоксид, 2-хлор-2,2-дифторэтоксид, 2,2-дихлор-2-фторэтоксид, 2,2,2-трихлорэтоксид, пентафторэтоксид и 1,1,1-трифторпропан-2-ол. Это определение применимо также, если не указано иное, к галогеналкокси, как части составного заместителя, например, галогеналкоксиалкилу.

**Арил:** моно-, би- или трициклическая ароматическая или частично ароматическая группа, содержащая от 6 до 14 атомов углерода, например (но не ограничиваясь ими) фенил, нафтил, тетрагидронафтил, инденил и инданил. Присоединение к основной общей структуре может осуществляться через любой подходящий кольцевой атом арильного остатка. Арил предпочтительно выбирают из фенила, 1-нафтила и 2-нафтила. Фенил является особенно предпочтительным.

**Гетероарил:** 5- или 6-членная циклическая ароматическая группа, содержащая по меньшей мере 1, при необходимости также 2, 3, 4 или 5 гетероатомов, причем каждый гетероатом независимо выбран из группы S, N и O, и причем группа также может являться частью би- или трициклической системы с числом кольцевых атомов до 14, причем кольцевая система может быть образована одним или двумя

дополнительными циклоалкильными, циклоалкенильными, гетероциклическими, арильными и/или гетероарильными остатками и причем предпочтительными являются бензоконденсированные 5- или 6-членные гетероарильные группы. Присоединение к основной общей структуре может осуществляться через любой подходящий кольцевой атом гетероарильного остатка. Примерами **5-членных гетероарильных групп, присоединенных к основной цепи через один из углеродных атомов кольца**, являются фур-2-ил, фур-3-ил, тиен-2-ил, тиен-3-ил, пиррол-2-ил, пиррол-3-ил, изоксазол-3-ил, изоксазол-4-ил, изоксазол-5-ил, изотиазол-3-ил, изотиазол-4-ил, изотиазол-5-ил, пиразол-3-ил, пиразол-4-ил, пиразол-5-ил, оксазол-2-ил, оксазол-4-ил, оксазол-5-ил, тиазол-2-ил, тиазол-4-ил, тиазол-5-ил, имидазол-2-ил, имидазол-4-ил, 1,2,4-оксадиазол-3-ил, 1,2,4-оксадиазол-5-ил, 1,2,4-тиадиазол-3-ил, 1,2,4-тиадиазол-5-ил, 1,2,4-триазол-3-ил, 1,3,4-оксадиазол-2-ил, 1,3,4-тиадиазол-2-ил и 1,3,4-триазол-2-ил. Примерами **5-членных гетероарильных групп, присоединенных к основной цепи через кольцевой атом азота**, являются пиррол-1-ил, пиразол-1-ил, 1,2,4-триазол-1-ил, имидазол-1-ил, 1,2,3-триазол-1-ил и 1,3,4-триазол-1-ил. Примерами **6-членных гетероарильных групп** являются пиридин-2-ил, пиридин-3-ил, пиридин-4-ил, пиридазин-3-ил, пиридазин-4-ил, пиримидин-2-ил, пиримидин-4-ил, пиримидин-5-ил, пиразин-2-ил, 1,3,5-триазин-2-ил, 1,2,4-триазин-3-ил и 1,2,4,5-тетразин-3-ил. Примерами **бензоконденсированных 5-членных гетероарильных групп** являются индол-1-ил, индол-2-ил, индол-3-ил, индол-4-ил, индол-5-ил, индол-6-ил, индол-7-ил, бензимидазол-1-ил, бензимидазол-2-ил, бензимидазол-4-ил, бензимидазол-5-ил, индазол-1-ил,

индазол-3-ил, индазол-4-ил, индазол-5-ил, индазол-6-ил, индазол-7-ил, индазол-2-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, 1,3-бензотиазол-2-ил, 1,3-бензотиазол-4-ил, 1,3-бензотиазол-5-ил, 1,3-бензотиазол-6-ил, 1,3-бензотиазол-7-ил, 1,3-бензоксазол-2-ил, 1,3-бензоксазол-4-ил, 1,3-бензоксазол-5-ил, 1,3-бензоксазол-6-ил и 1,3-бензоксазол-7-ил. Примерами **бензоконденсированных 6-членных гетероарильных групп** являются хинолин-2-ил, хинолин-3-ил, хинолин-4-ил, хинолин-5-ил, хинолин-6-ил, хинолин-7-ил, хинолин-8-ил, изохинолин-1-ил, изохинолин-3-ил, изохинолин-4-ил, изохинолин-5-ил, изохинолин-6-ил, изохинолин-7-ил и изохинолин-8-ил. Другими примерами 5- или 6-членных гетероарильных остатков, которые являются частью бициклической кольцевой системы, являются 1,2,3,4-тетрагидрохинолин-1-ил, 1,2,3,4-тетрагидрохинолин-2-ил, 2,3,4-тетрагидрохинолин-7-ил, 1,2,3,4-тетрагидрохинолин-8-ил, 1,2,3,4-тетрагидроизохинолин-1-ил, 1,2,3,4-тетрагидроизохинолин-2-ил, 1,2,3,4-тетрагидроизохинолин-5-ил, 1,2,3,4-тетрагидроизохинолин-6-ил и 1,2,3,4-тетрагидроизохинолин-7-ил. Это определение применимо также, если не указано иное, к гетероарилу, как части составного заместителя, например, гетероарилалкилу.

**Гетероциклил:** от трех- до семи-членная, насыщенная или частично ненасыщенная гетероциклическая группа, содержащая по меньшей мере один (одну), при необходимости до четырех, гетероатом(ов) и/или

гетерогруппу(-), независимо друг от друга выбранных из группы, состоящей из N, O, S, S(=O), S(=O)<sub>2</sub> и ди-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-алкилсилил, причем группа может быть бензоконденсирована. Присоединение к основной общей структуре может осуществляться через кольцевой атом углерода или, если это возможно, через кольцевой атом азота гетероциклической группы. **Насыщенными гетероциклическими группами** в данном случае являются, например, (но не ограничиваясь ими) оксиранил, азиридирил, тетрагидрофуран-2-ил, тетрагидрофуран-3-ил, тетрагидротиен-2-ил, тетрагидротиен-3-ил, пирролидин-2-ил, пирролидин-3-ил, изоксазолидин-3-ил, изоксазолидин-4-ил, изоксазолидин-5-ил, изотиазолидин-3-ил, изотиазолидин-4-ил, изотиазолидин-5-ил, пиразолидин-3-ил, пиразолидин-4-ил, пиразолидин-5-ил, оксазолидин-2-ил, оксазолидин-4-ил, оксазолидин-5-ил, тиазолидин-2-ил, тиазолидин-4-ил, тиазолидин-5-ил, имидазолидин-2-ил, имидазолидин-4-ил, 1,2,4-оксадиазолидин-3-ил, 1,2,4-оксадиазолидин-5-ил, 1,3,4-оксадиазолидин-2-ил, 1,2,4-тиадиазолидин-3-ил, 1,2,4-тиадиазолидин-5-ил, 1,3,4-тиадиазолидин-2-ил, 1,2,4-триазолидин-3-ил, 1,3,4-триазолидин-2-ил, пиперидин-2-ил, пиперидин-3-ил, пиперидин-4-ил, 1,3-диоксан-5-ил, тетрагидропиран-2-ил, тетрагидропиран-4-ил, тетрагидротиен-2-ил, гексагидропиридазин-3-ил, гексагидропиридазин-4-ил, гексагидропиримидин-2-ил, гексагидропиримидин-4-ил, гексагидропиримидин-5-ил, пиперазин-2-ил, 1,3,5-гексагидротриазин-2-ил и 1,2,4-гексагидротриазин-3-ил. **Частично ненасыщенные гетероциклические группы** в данном случае представляют собой, например (но не ограничиваясь ими) 2,3-дигидрофуран-2-ил, 2,3-дигидрофуран-3-ил, 2,4-дигидрофуран-2-ил, 2,4-дигидрофуран-3-ил, 2,3-

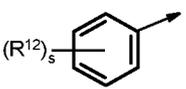
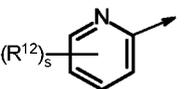
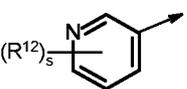
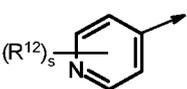
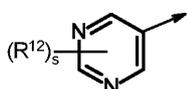
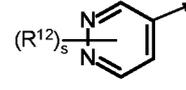
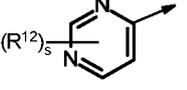
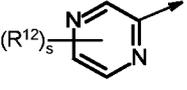
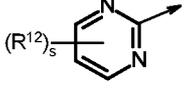
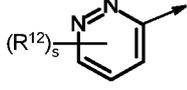
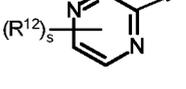
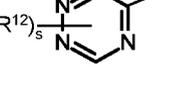
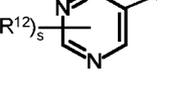
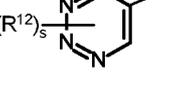
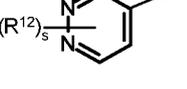
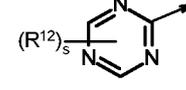
дигидротиен-2-ил, 2,3-дигидротиен-3-ил, 2,4-дигидротиен-2-ил, 2,4-дигидротиен-3-ил, 2-пирролин-2-ил, 2-пирролин-3-ил, 3-пирролин-2-ил, 3-пирролин-3-ил, 2-изоксазолин-3-ил, 3-изоксазолин-3-ил, 4-изоксазолин-3-ил, 2-изоксазолин-4-ил, 3-изоксазолин-4-ил, 4-изоксазолин-4-ил, 2-изоксазолин-5-ил, 3-изоксазолин-5-ил, 4-изоксазолин-5-ил, 2-изотиазолин-3-ил, 3-изотиазолин-3-ил, 4-изотиазолин-3-ил, 2-изотиазолин-4-ил, 3-изотиазолин-4-ил, 4-изотиазолин-4-ил, 2-изотиазолин-5-ил, 3-изотиазолин-5-ил, 4-изотиазолин-5-ил, 2,3-дигидропиразол-1-ил, 2,3-дигидропиразол-2-ил, 2,3-дигидропиразол-3-ил, 2,3-дигидропиразол-4-ил, 2,3-дигидропиразол-5-ил, 3,4-дигидропиразол-1-ил, 3,4-дигидропиразол-3-ил, 3,4-дигидропиразол-4-ил, 3,4-дигидропиразол-5-ил, 4,5-дигидропиразол-1-ил, 4,5-дигидропиразол-3-ил, 4,5-дигидропиразол-4-ил, 4,5-дигидропиразол-5-ил, 2,3-дигидрооксазол-2-ил, 2,3-дигидрооксазол-3-ил, 2,3-дигидрооксазол-4-ил, 2,3-дигидрооксазол-5-ил, 3,4-дигидрооксазол-2-ил, 3,4-дигидрооксазол-3-ил, 3,4-дигидрооксазол-4-ил, 3,4-дигидрооксазол-5-ил, 3,4-дигидрооксазол-2-ил, 3,4-дигидрооксазол-3-ил, 3,4-дигидрооксазол-4-ил. Примерами **бензоконденсированных гетероциклических групп** являются индолин-1-ил, индолин-2-ил, индолин-3-ил, изоиндолин-1-ил, изоиндолин-2-ил, 2,3-дигидробензофуран-2-ил и 2,3-дигидробензофуран-3-ил. Это определение применимо также, если не указано иное, к гетероциклилу, как части составного заместителя, например, гетероциклилалкилу.

Не включены комбинации, которые нарушают законы природы и которые, следовательно, специалист в данной области исключил бы на основании

своих профессиональных знаний. Например, исключаются кольцевые структуры с тремя и более соседними атомами кислорода.

Предпочтительными являются соединения общей формулы (I), а также их агрохимически совместимые соли, N-оксиды, гидраты и гидраты солей и N-оксидов, причем остатки имеют следующие определения:

A представляет собой A1-A16:

				
A1	A2	A3	A4	A5
				
A6	A7	A8	A9	A10
				
A11	A12	A13	A14	A15
				
A16				

R<sup>1</sup> представляет собой

- OR<sup>1a</sup> или
- NR<sup>9</sup>R<sup>10</sup>; в которой

R<sup>1a</sup>

- означает водород;
- означает (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-алкил, который является незамещенным или

замещен одним или несколькими заместителями, выбранными из группы, состоящей из галогена, (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)-циклоалкила, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-алкокси, (C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>)-алкокси-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-алкокси, циано и нитро;

- означает (C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)-алкенил, (C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)-галогеналкенил;
- означает арил-(C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>)-алкил, гетероарил-(C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>)-алкил, причем арил и гетероарил является незамещенным или замещен одним или несколькими заместителями, выбранными из группы, состоящей из галогена, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-алкила, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-галогеналкила;
- означает (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-алкилиденамино;

R<sup>9</sup> обозначает водород и (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-алкил;

R<sup>10</sup>

- означает водород;
- означает (C<sub>3</sub>-C<sub>7</sub>)-циклоалкил-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-алкил, арил-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-алкил, арил-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-алкокси;  
 причем циклоалкил и арил является незамещенным или замещен одним или несколькими заместителями, выбранными из группы, состоящей из галогена, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-алкила, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-галогеналкила;
- означает (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>3</sub>-C<sub>8</sub>) циклоалкил,  
 причем вышеуказанные алкильный, алкенильный, алкинильный и циклоалкильный остатки являются незамещенными или каждый независимо друг от друга

замещен  $m$  остатками, выбранными из группы, состоящей из  
циано,  $C(O)OR^8$ ;

- означает  $(C_1-C_6)$ -галогеналкил;
- означает  $S(O)_2R^5$ ,  $SO_2NR^6R^7$ ,  $NR^6SO_2R^8$ ;

$R^5$  означает  $(C_1-C_4)$ -алкил,  $(C_1-C_4)$ -галогеналкил,  $(C_3-C_6)$ -  
циклоалкил,  $(C_2-C_4)$ -алкенил или арил;

$R^6$  означает водород,  $(C_1-C_4)$ -алкил или  $(C_3-C_6)$ -циклоалкил;

$R^7$  означает водород,  $(C_1-C_4)$ -алкил или  $(C_3-C_6)$ -циклоалкил;

$R^8$  означает водород,  $(C_1-C_6)$ -алкил или  $(C_3-C_6)$ -циклоалкил;

$R^{2a}$  представляет собой

- водород, циано;
- $(C_1-C_6)$ -алкил;
- $(C_3-C_6)$ -циклоалкил;

$R^{2b}$  представляет собой водород,

$R^3$  представляет собой

- фтор, хлор, бром, иод, циано, изоциано,  $NO_2$ ;
- $(C_1-C_6)$ -алкил,  $(C_3-C_6)$ -циклоалкил,  $(C_1-C_6)$ -галогеналкил;

$R^4$  представляет собой

- фтор, хлор, бром, циано;
- метил, этил;
- метокси, этокси;

$R^{12}$  представляет собой

- галоген, циано, нитро;
- метил, этил, (C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>)- галогеналкил;
- метокси, этокси;

и в которой коэффициенты означают

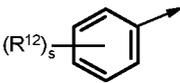
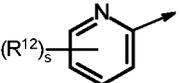
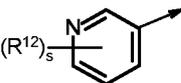
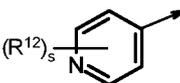
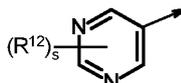
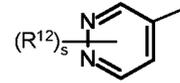
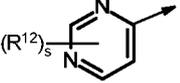
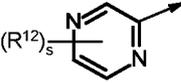
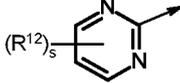
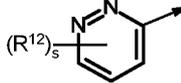
l 0, 1 или 2.

m 0, 1 или 2;

s 0, 1, 2, 3.

Особенно предпочтительными являются соединения общей формулы (I), а также их агрохимически совместимые соли, N-оксиды, гидраты и гидраты солей и N-оксидов, причем остатки имеют следующие определения:

A представляет собой A1-A10:

				
A1	A2	A3	A4	A5
				
A6	A7	A8	A9	A10

$R^1$  представляет собой

- $OR^{1a}$  или

-  $NR^9R^{10}$ ; в которой

$R^{1a}$

- означает водород;
- означает метил, этил, пропил, 1-метилэтил, бутил, 1-метилпропил, 2-метилпропил, 1,1-диметилэтил, пентил, 1-метилбутил, 2-метилбутил, 3-метилбутил, 2,2-диметилпропил, цианометил, 2-метоксиэтил, 2-(2-метоксиэтокси)этил;
- означает 1-пропенил, 2-пропенил;
- бензил, пиридилметил, причем фенильный и пиридильный остаток соответственно является незамещенным или замещен галогеном;
- означает изопропилиденамино;

$R^9$  представляет собой водород;

$R^{10}$

- означает водород;
- означает циклопропилметил;
- бензил, 1-фенилэтил, 2-фенилэтил, бензилокси, причем фенильный остаток в каждой из четырех указанных групп соответственно является незамещенным или замещен галогеном;
- метил, этил, пропил, 1-метилэтил, бутил, 1-метилпропил, 2-метилпропил, 1,1-диметилэтил, пентил, 1-метилбутил, 2-метилбутил, 3-метилбутил, 2,2-диметилпропил, 1-этилпропил, гексил, причем вышеуказанные остатки являются

незамещенными или однократно замещены остатком  $C(O)OR^8$ ;

- циклопропил, циклобутил, циклопентил, причем три указанных остатка являются незамещенными или однократно замещены остатком  $C(O)OR^8$ ;
- означают 1-пропенил, 2-пропенил, 2-метил-2-пропенил, проп-2-ин-1-ил, бут-2-ин-1-ил;
- означает  $S(O)_2R^5$ ,  $SO_2NR^6R^7$ ;

$R^5$  означает метил, этил, пропил, 1-метилэтил, трифторметил, 1,1-дифторэтил, 2,2,2-трифторэтил, циклопропил или винил;

$R^6$  означает водород, метил, этил, пропил, 1-метилэтил или циклопропил,

$R^7$  означает водород или метил,

$R^8$  означает водород, метил, этил;

$R^{2a}$  представляет собой

- водород;
- метил;

$R^{2b}$  представляет собой водород,

$R^3$  представляет собой

- фтор, хлор, бром, иод, циано,  $NO_2$ ;
- циклопропил, трифторметил;

$R^4$  представляет собой

- фтор, хлор, бром;
- метил;

$R^{12}$  представляет собой

- фтор, хлор, бром;

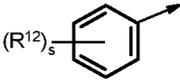
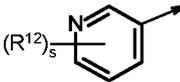
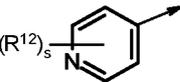
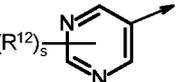
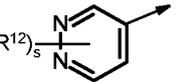
и в которой коэффициенты означают

$l$  0 или 1.

$s$  0, 1 или 2.

Более предпочтительными являются соединения общей формулы (I), а также их агрохимически совместимые соли, N-оксиды, гидраты и гидраты солей и N-оксидов, причем остатки имеют следующие определения:

A представляет собой A1, A3, A4, A5 или A6:

				
A1	A3	A4	A5	A6

$R^1$  представляет собой

- $OR^{1a}$  или
- $NR^9R^{10}$ ; в которой

$R^{1a}$

- означает водород;

- означает метил, этил;
- означает цианометил, 2-метоксиэтил, 2-(2-метоксиэтокси)этил;
- означает пиридин-2-ил-метил;
- означает изопропилиденамино;

$R^9$  представляет собой водород;

$R^{10}$

- означает циклопентил, который однократно замещен  $C(O)OR^8$ ;
- означает циклопропилметил;
- означает  $CH_2C(O)OR^8$ ,  $CH_2CH_2C(O)OR^8$ ;
- означает 2-пропенил;
- означает  $S(O)_2R^5$ ,  $SO_2NR^6R^7$ ;

$R^5$  означает метил, этил, трифторметил, 1,1-дифторэтил, циклопропил или винил;

$R^6$  означает метил, этил, пропил или 1-метилэтил;

$R^7$  означает водород или метил,

$R^8$  означает водород, метил, этил;

$R^{2a}$  представляет собой

- водород;
- метил;

$R^{2b}$  представляет собой водород,

$R^3$  выбирают из группы, состоящей из

- хлора, брома, иода, циано,  $NO_2$ ;
- трифторметила, циклопропила;

$R^4$  представляет собой

- фтор, хлор;

$R^{12}$  представляет собой фтор,

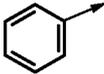
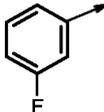
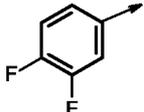
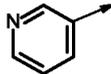
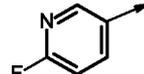
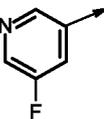
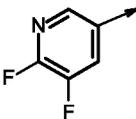
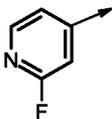
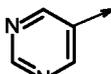
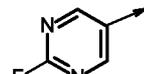
и в которой коэффициенты означают

$l$  0 или 1,

$s$  0, 1 или 2.

Наиболее предпочтительными являются соединения общей формулы (I), а также их агрохимически совместимые соли, N-оксиды, гидраты и гидраты солей и N-оксидов, причем остатки имеют следующие определения:

A представляет собой A1-1, A1-2, A1-3, A3-1, A3-2, A3-3, A3-4, A4-1, A5-1 или A5-2:

				
A1-1	A1-2	A1-3	A3-1	A3-2
				
A3-3	A3-4	A4-1	A5-1	A5-2

$R^1$  представляет собой

- $OR^{1a}$  или
- $NR^9R^{10}$ ; в которой

$R^{1a}$

- означает водород;
- означает метил, этил;
- означает цианометил, 2-метоксиэтил, 2-(2-метоксиэтокси)этил;
- означает пиридин-2-ил-метил;
- означает изопропилиденамино;

$R^9$  представляет собой водород;

$R^{10}$

- означает циклопентил, который однократно замещен  $C(O)OR^8$ ;
- означает циклопропилметил;
- означает  $CH_2C(O)OR^8$ ,  $CH_2CH_2C(O)OR^8$ ;
- означает 2-пропенил;
- означает  $S(O)_2R^5$ ,  $SO_2NR^6R^7$ ;

$R^5$  означает метил, этил, трифторметил, циклопропил или винил;

$R^6$  означает метил, этил или 1-метилэтил;

$R^7$  означает метил;

$R^8$  означает водород, метил, этил;

$R^{2a}$  представляет собой

- водород;

- метил;

$R^{2b}$  представляет собой водород,

$R^3$  представляет собой

- хлор, бром, циано, циклопропил;

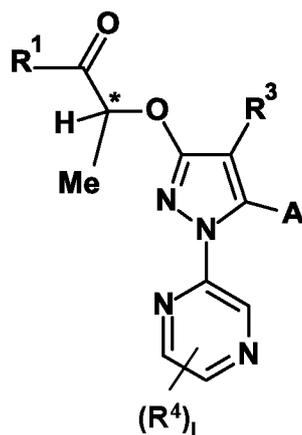
$R^4$  представляет собой

- 3-фтор, 3-хлор;

в которой коэффициент означает

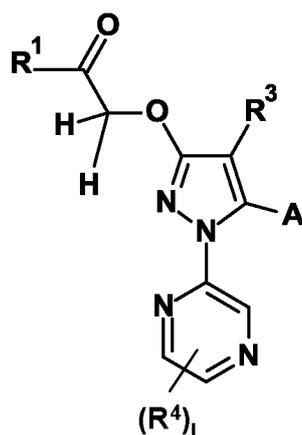
$l$  0 или 1.

Еще одним предпочтительным объектом настоящего изобретения являются соединения общей формулы (Iх) и их агрохимически совместимые соли, N-оксиды, гидраты и гидраты солей и N-оксидов, где остатки  $R^1$ ,  $R^3$ ,  $R^4$ , А и  $l$  соответствуют указанным выше предпочтительным, особенно предпочтительным, более предпочтительным и наиболее предпочтительным определениям:



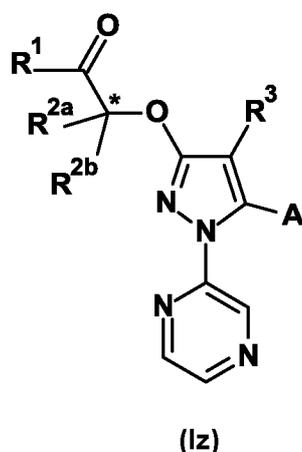
(Ix)

Еще одним предпочтительным объектом настоящего изобретения являются соединения общей формулы (Iy) и их агрохимически совместимые соли, N-оксиды, гидраты и гидраты солей и N-оксидов, где остатки R<sup>1</sup>, R<sup>3</sup>, R<sup>4</sup>, A и I соответствуют указанным выше предпочтительным, особенно предпочтительным, более предпочтительным и наиболее предпочтительным определениям:



(Iy)

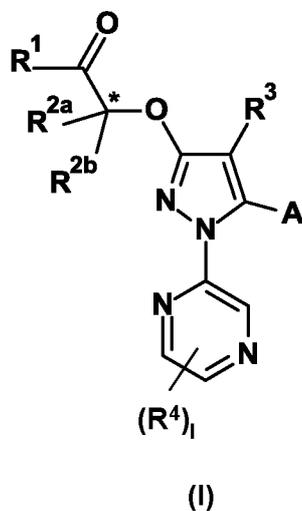
Еще одним предпочтительным объектом настоящего изобретения являются соединения общей формулы (Iz) и их агрохимически совместимые соли, N-оксиды, гидраты и гидраты солей и N-оксидов, где остатки  $R^1$ ,  $R^{2a}$ ,  $R^{2b}$ ,  $R^4$  и A соответствуют указанным выше предпочтительным, особенно предпочтительным, более предпочтительным и наиболее предпочтительным определениям:



Если соединения за счет перегруппировки водорода могут образовывать таутомеры, которые формально со структурной точки зрения не были бы охвачены общей формулой (I), то эти таутомеры тем не менее включены в определение соединений общей формулы (I) согласно изобретению, если только конкретный таутомер не является объектом рассмотрения. Например, многие карбонильные соединения могут существовать как в кето-форме, так и в енольной форме, причем обе формы охватываются определением соединения общей формулы (I).

Соединения согласно настоящему изобретению общей формулы (I) имеют при втором атоме углерода алкилкислотной структуры хиральный атом

углерода, который в приведенной далее структуре отмечен (\*):



Согласно правилам правила Кана-Инголда-Прелога (CIP-правила), этот атом углерода может иметь либо (R)-конфигурацию, либо (S)-конфигурацию.

Настоящее изобретение охватывает соединения общей формулы (I) как с (S)-, так и с (R)-конфигурацией.

Кроме того, в рамках настоящего изобретения также охватываются любые смеси соединений общей формулы (I), имеющих (R)-конфигурацию (соединения общей формулы (I-(R))) с соединениями общей формулы (I), имеющими (S)-конфигурацию (соединения общей формулы (I-S)), причем рацемическая смесь соединений общей формулы (I), имеющих (R)- и (S)-конфигурацию, также входит в объем настоящего изобретения.

Однако в контексте настоящего изобретения предпочтительным является

применение соединений общей формулы (I) с (R)-конфигурацией с селективностью от 60 до 100%, предпочтительно от 80 до 100%, особенно предпочтительно от 90 до 100%, наиболее особенно предпочтительно от 95 до 100%, причем конкретное (R)-соединение присутствует при энантиоселективности в каждом случае более 50% ее, предпочтительно от 60 до 100% ее, особенно предпочтительно от 80 до 100% ее, более особенно предпочтительно от 90 до 100% ее, наиболее предпочтительно от 95 до 100% ее, в пересчете на общее содержание рассматриваемого (R)-соединения.

Соответственно настоящее изобретение в частности относится к соединениям общей формулы (I\*), в которых стереохимическая конфигурация атома углерода, помеченного (\*), имеет стереохимическую чистоту от 60 до 100 % (R), предпочтительно от 80 до 100 % (R), особенно от 90 до 100 % (R), более предпочтительно от 95 до 100 % (R).

Кроме того, в зависимости от соответствующих выбранных остатков, дополнительные стереоэлементы могут присутствовать в соединениях общей формулы (I) согласно настоящему изобретению.

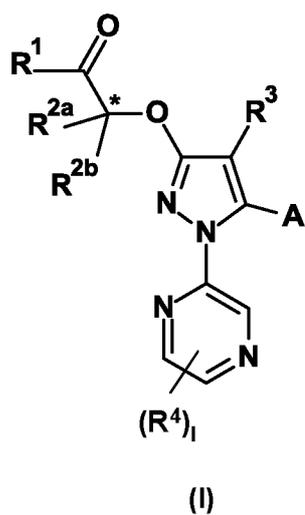
Соединения, указанные в следующих таблицах, являются предпочтительными. Соединения общей формулы (I) с (R)-конфигурацией отмечены соответствующим образом в колонке, в которой указан остаток R<sup>2a</sup>. Например, если R<sup>2a</sup> = алкил, предпочтительной стереохимической конфигурацией атома углерода, отмеченного знаком (\*) общей формулы (I), является (R)-конфигурация.

Принимая во внимание правила Кана-Инголда-Прелога, при атоме углерода, помеченном (\*), также может быть ситуация, когда, благодаря приоритету рассматриваемого заместителя, (S)-конфигурация является предпочтительной при атоме углерода, помеченном (\*). Это может быть случай, например, когда остаток R<sup>2a</sup> соответствует (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-алкоксильному остатку.

Соответственно в контексте настоящего изобретения особенно предпочтительными являются соединения общей формулы (I) предпочтительно, в которых расположение в пространстве соответствует расположению в пространстве соединений общей формулы (I), в которых R<sup>2a</sup> = метил с (R)-конфигурацией, с селективностью от 60 до 100 %, предпочтительно от 80 до 100 %, особенно от 90 до 100 %, более предпочтительно от 95 до 100 %, предпочтительно, причем соответствующее (R)-аналогичное соединение присутствует при энантиоселективности в каждом случае более 50 % ее, предпочтительно от 60 до 100 % ее, особенно от 80 до 100 % ее, более предпочтительно от 90 до 100 % ее, наиболее предпочтительно от 95 до 100 % ее, в пересчете на общее содержание рассматриваемого (R)-аналогичного соединения. Соответственно настоящее изобретение в частности относится к соединениям общей формулы (I), в которых стереохимическая конфигурация при атоме углерода, помеченном (\*), присутствует при стереохимической чистоте от 60 до 100 % (R, или R аналог), предпочтительно от 80 до 100 % (R, или R аналог), особенно от 90 до 100

% (R, или R аналог), более предпочтительно от 95 до 100 % (R, или R аналог).

Таблица 1: Сложный эфир



Пример №	R <sup>1</sup>	R <sup>2a</sup>	R <sup>2b</sup>	R <sup>3</sup>	A	(R <sup>4</sup> ) <sub>i</sub>
I-01	EtO	H	H	Br	Фенил	H
I-02	EtO	H	H	Br	3-Фторфенил	H
I-03	OH	H	H	Br	Фенил	H
I-04	OH	H	H	Br	3-Фторфенил	H
I-05	MeO	Me	H	Cl	2-Фторпиридин-4-ил	H
I-06	MeO	H	H	Cl	2-Фторпиридин-4-ил	H
I-07	MeO	H	H	Br	5-Фторпиридин-3-ил	H
I-08	MeO	Me	H	Br	5-Фторпиридин-3-ил	H
I-09	MeO	H	H	Br	2-Фторпиридин-4-ил	H
I-10	MeO	Me	H	Br	2-Фторпиридин-4-ил	H
I-11	MeO	H	H	Br	6-Фторпиридин-3-ил	H
I-12	MeO	Me	H	Br	6-Фторпиридин-3-ил	H
I-13	CH <sub>2</sub> =CHCH <sub>2</sub> O	Me	H	Br	6-Фторпиридин-3-ил	H

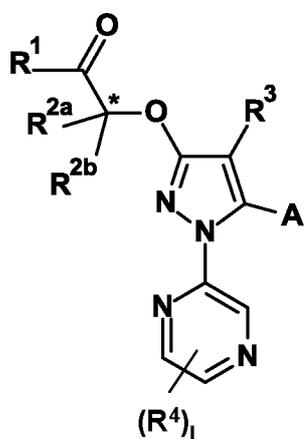
Пример №	R <sup>1</sup>	R <sup>2a</sup>	R <sup>2b</sup>	R <sup>3</sup>	A	(R <sup>4</sup> ) <sub>1</sub>
					ил	
I-14	CH <sub>3</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> O	(R)-Me	H	Br	6-Фторпиридин-3-ил	H
I-15	MeO	H	H	Br	3,4-Дифторфенил	H
I-16	MeO	Me	H	Br	3,4-Дифторфенил	H
I-17	MeO	(R)-Me	H	Br	6-Фторпиридин-3-ил	H
I-18	MeO	(S)-Me	H	Br	6-Фторпиридин-3-ил	H
I-19	MeO	Me	H	Br	Фенил	H
I-20	MeO	(R)-Me	H	Br	3-Фторфенил	H
I-21	MeO	(S)-Me	H	Br	3-Фторфенил	H
I-22	MeO	Me	H	CN	3,4-Дифторфенил	H
I-23	MeO	H	H	CN	3,4-Дифторфенил	H
I-24	OH	Me	H	Br	6-Фторпиридин-3-ил	H
I-25	MeO	(R)-Me	H	CN	6-Фторпиридин-3-ил	H
I-26	MeO	(S)-Me	H	CN	6-Фторпиридин-3-ил	H
I-27	MeO	(R)-Me	H	Br	Пиримидин-2-ил	H
I-28	MeO	(R)-Me	H	CN	Пиримидин-5-ил	H
I-29	MeO	(R)-Me	H	CN	Пиримидин-2-ил	H
I-30	MeO	(R)-Me	H	Br	Пиримидин-5-ил	H
I-31	MeO	(R)-Me	H	Br	Пиридазин-4-ил	H
I-32	MeO	(R)-Me	H	CN	Пиридазин-4-ил	H
I-33	OH	(R)-Me	H	C(O)NH <sub>2</sub>	Пиридазин-4-ил	H
I-34	MeO	(R)-Me	H	Br	2-Фторпиридин-4-ил	H
I-35	MeO	(R)-Me	H	CN	2-Фторпиридин-4-ил	H
I-36	MeO	(R)-Me	H	Cl	6-Фторпиридин-3-ил	H
I-37	OH	(S)-Me	H	Br	5-Фторпиридин-3-ил	H
I-38	MeO	(R)-Me	H	Br	Пиридин-3-ил	H
I-39	MeO	(R)-Me	H	Br	5-Фторпиридин-3-ил	H
I-40	MeO	(R)-Me	H	CN	5-Фторпиридин-3-ил	H
I-41	OH	H	H	Br	3,4-Дифторфенил	H
I-42	MeO	H	H	Br	5,6-Дифторпиридин-3-ил	H
I-43	MeO	(R)-Me	H	Br	5,6-	H

Пример №	R <sup>1</sup>	R <sup>2a</sup>	R <sup>2b</sup>	R <sup>3</sup>	A	(R <sup>4</sup> ) <sub>1</sub>
					Дифторпиридин-3-ил	
I-44	MeO	(R)-Me	H	Br	2-Фторпиримидин-5-ил	H
I-45	MeO	(R)-Me	H	Br	3,4-Дифторфенил	H
I-46	MeO	(R)-Me	H	CN	3,4-Дифторфенил	H
I-47	OH	Me	H	Br	3,4-Дифторфенил	H
I-48	OH	(R)-Me	H	Br	3-Фторфенил	H
I-49	OH	H	H	Br	6-Фторпиридин-3-ил	H
I-50	EtO	H	H	NO <sub>2</sub>	6-Фторпиридин-3-ил	H
I-51	EtO	H	H	I	6-Фторпиридин-3-ил	H
I-52	EtO	H	H	Br	6-Фторпиридин-3-ил	H
I-53	EtO	H	H	Cl	6-Фторпиридин-3-ил	H
I-54	OH	(R)-Me	H	Br	Пиримидин-2-ил	H
I-55	OH	(R)-Me	H	CN	Пиримидин-2-ил	H
I-56	OH	(R)-Me	H	Br	пиридазин-4-ил	H
I-57	OH	(R)-Me	H	Br	Фенил	H
I-58	OH	(S)-Me	H	Br	3-Фторфенил	H
I-59	OH	(R)-Me	H	CN	6-Фторпиридин-3-ил	H
I-60	OH	(R)-Me	H	CN	2-Фторпиридин-4-ил	H
I-61	OH	(S)-Me	H	CN	6-Фторпиридин-3-ил	H
I-62	OH	Me	H	Cl	2-Фторпиридин-4-ил	H
I-63	OH	(R)-Me	H	Br	6-Фторпиридин-3-ил	H
I-64	OH	H	H	CN	3,4-Дифторфенил	H
I-65	NCCH <sub>2</sub> O	H	H	Br	6-Фторпиридин-3-ил	H
I-66	EtO	H	H	CF <sub>3</sub>	6-Фторпиридин-3-ил	H
I-67	MeOC <sub>2</sub> H <sub>4</sub> OC <sub>2</sub> H <sub>4</sub> O	H	H	Br	6-Фторпиридин-3-ил	H
I-68	MeOC <sub>2</sub> H <sub>4</sub> O	H	H	Br	6-Фторпиридин-3-ил	H
I-69	Me <sub>2</sub> C=NO	H	H	Br	6-Фторпиридин-3-ил	H
I-70	Пиридин-2-	H	H	Br	6-Фторпиридин-3-	H

Пример №	R <sup>1</sup>	R <sup>2a</sup>	R <sup>2b</sup>	R <sup>3</sup>	A	(R <sup>4</sup> ) <sub>1</sub>
	илметокси				ил	
I-71	EtO	H	H	Br	6-Фторпиридин-3-ил	3-Cl
I-72	MeO	(R)-Me	H	Br	6-Фторпиридин-3-ил	3-Cl
I-73	OH	H	H	Br	6-Фторпиридин-3-ил	3-Cl
I-74	EtO	H	H	Br	3,4-Дифторфенил	3-F
I-75	OH	(R)-Me	H	Br	6-Фторпиридин-3-ил	3-Cl
I-76	EtO	H	H	Br	6-Фторпиридин-3-ил	3-F
I-77	MeO	H	H	Br	6-Фторпиридин-3-ил	3-F
I-78	MeO	Me	H	Br	6-Фторпиридин-3-ил	3-F
I-79	OH	H	H	Br	6-Фторпиридин-3-ил	3-F
I-80	MeO	(R)-Me	H	Br	6-Фторпиридин-3-ил	3-F
I-81	EtO	(R)-Me	H	Br	6-Фторпиридин-3-ил	3-F
I-82	OH	(R)-Me	H	Br	6-Фторпиридин-3-ил	3-F
I-83	OH	H	H	c-Pr	6-Фторпиридин-3-ил	H
I-84	MeO	H	H	c-Pr	6-Фторпиридин-3-ил	H
I-85	EtO	H	H	c-Pr	6-Фторпиридин-3-ил	H
I-86	OH	(R)-Me	H	c-Pr	6-Фторпиридин-3-ил	H
I-87	MeO	(R)-Me	H	c-Pr	6-Фторпиридин-3-ил	H
I-88	EtO	(R)-Me	H	c-Pr	6-Фторпиридин-3-ил	H
I-89	MeO	(R)-Me	H	I	6-Фторпиридин-3-ил	H
I-90	EtO	H	H	Br	5-Фторпиридин-3-ил	H
I-91	EtO	H	H	Cl	5-Фторпиридин-3-ил	H
I-92	OH	H	H	Cl	5-Фторпиридин-3-ил	H
I-93	OH	H	H	Br	5-Фторпиридин-3-ил	H
I-94	EtO	H	H	F	5-Фторпиридин-3-	H

Пример №	R <sup>1</sup>	R <sup>2a</sup>	R <sup>2b</sup>	R <sup>3</sup>	A	(R <sup>4</sup> ) <sub>1</sub>
					ил	
I-95	MeO	(R)-Me	H	Cl	5-Фторпиридин-3-ил	H
I-96	OH	(R)-Me	H	Br	5-Фторпиридин-3-ил	H
I-97	OH	(R)-Me	H	Cl	5-Фторпиридин-3-ил	H
I-98	EtO	(R)-Me	H	Cl	5-Фторпиридин-3-ил	H
I-99	EtO	(R)-Me	H	Br	5-Фторпиридин-3-ил	H
I-100	EtO	(R)-Me	H	Br	6-Фторпиридин-3-ил	H
I-101	OH	H	H	c-Pr	5-Фторпиридин-3-ил	H
I-102	MeO	H	H	c-Pr	5-Фторпиридин-3-ил	H
I-103	EtO	H	H	c-Pr	5-Фторпиридин-3-ил	H
I-104	OH	(R)-Me	H	c-Pr	5-Фторпиридин-3-ил	H
I-105	MeO	(R)-Me	H	c-Pr	5-Фторпиридин-3-ил	H
I-106	EtO	(R)-Me	H	c-Pr	5-Фторпиридин-3-ил	H

Таблица 2: Амиды



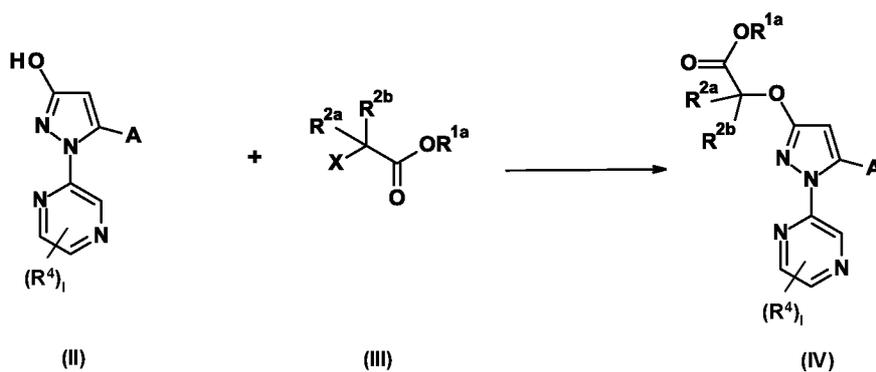
(I)

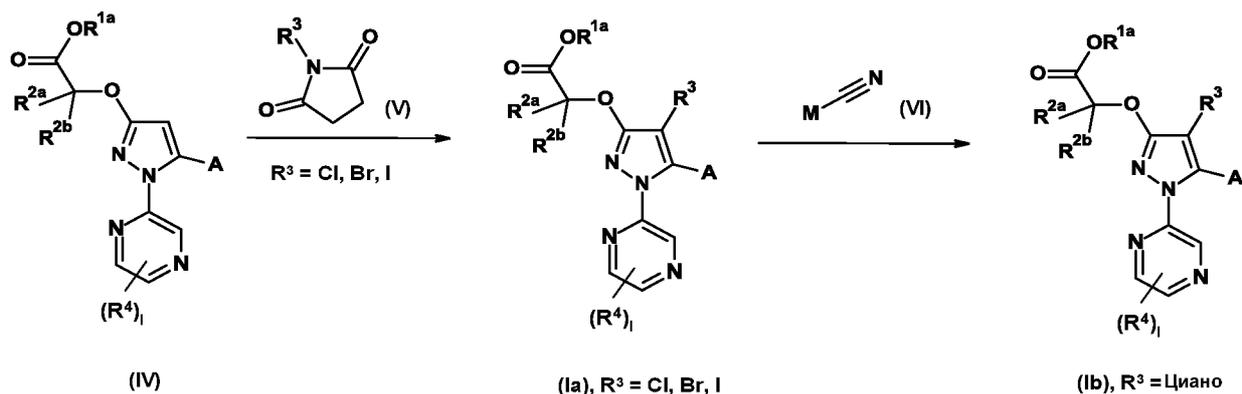
При мер №	R <sup>1</sup>	R <sup>2a</sup>	R <sup>2b</sup>	R <sup>3</sup>	A	(R <sup>4</sup> ) <sub>n</sub>
II-01	2-пропениламино	H	H	Br	3-Фторфенил	H
II-02	(3-Метокси-3-оксопропил)амино	(R)- Me	H	Br	6-Фторпиридин- 3-ил	H
II-03	(2-Метокси-2-оксоэтил)амино	(R)- Me	H	Br	6-Фторпиридин- 3-ил	H
II-04	(3-этокси-3-оксопропил)амино	(R)- Me	H	Br	6-Фторпиридин- 3-ил	H
II-05	[3- (Метоксикарбонил)циклопентил] амино	(R)- Me	H	Br	6-Фторпиридин- 3-ил	H
II-06	Циклопропилметиламино	(R)- Me	H	Br	6-Фторпиридин- 3-ил	H
II-07	(3-Метокси-3-оксопропил)амино	H	H	Br	6-Фторпиридин- 3-ил	H
II-08	(2-Метокси-2-оксоэтил)амино	H	H	Br	6-Фторпиридин- 3-ил	H
II-09	(3-этокси-3-оксопропил)амино	H	H	Br	6-Фторпиридин- 3-ил	H
II-10	Циклопропилметиламино	H	H	Br	6-Фторпиридин- 3-ил	H
II-11	[3- (Метоксикарбонил)циклопентил] амино	H	H	Br	6-Фторпиридин- 3-ил	H
II-12	(Диметилсульфамоил)амино	H	H	Br	6-Фторпиридин- 3-ил	H
II-13	[Изопропил(метил)сульфамоил] амино	H	H	Br	6-Фторпиридин- 3-ил	H
II-14	(Метилсульфонил)амино	H	H	Br	6-Фторпиридин- 3-ил	H
II-15	(Трифторметилсульфонил)амин о	H	H	Br	6-Фторпиридин- 3-ил	H
II-16	(Этилсульфонил)амино	H	H	Br	6-Фторпиридин- 3-ил	H
II-17	(Винилсульфонил)амино	H	H	Br	6-Фторпиридин- 3-ил	H
II-18	(Циклопропилсульфонил)амино	H	H	Br	6-Фторпиридин- 3-ил	H
II-19	[Этил(метил)сульфамоил]амино	H	H	Br	6-Фторпиридин- 3-ил	H
II-20	(Метилсульфамоил)амино	H	H	Br	6-Фторпиридин- 3-ил	H
II-21	(Этилсульфамоил)амино	H	H	Br	6-Фторпиридин- 3-ил	H
II-22	(Диметилсульфамоил)амино	(R)- Me	H	Br	6-Фторпиридин- 3-ил	H
II-23	[Изопропил(метил)сульфамоил]	(R)-	H	Br	6-Фторпиридин-	H

	амино	Me			3-ил	
II-24	(Метилсульфонил)амино	(R)- Me	H	Br	6-Фторпиридин- 3-ил	H

Еще один аспект настоящего изобретения относится к получению соединений общей формулы **(I)** согласно изобретению. Соединения согласно изобретению могут быть получены различными способами.

Соединения согласно изобретению могут быть получены, например, в соответствии со способом синтеза, показанным ниже на схеме 1 из замещенных 1-пиразинил-1H-пиразол-3-олов **(II)**.





### Схема 1

На схеме 1 показан синтез соединения общей формулы ((Ia),  $R^3 = Cl, Br, I$ ) посредством реакции замещенного пиразола общей формулы (IV) с электрофильным галогенирующим реагентом общей формулы (V), таким как, например, N-хлорсукцинимид ((V),  $R^3 = Cl$ ), N-бромсукцинимид ((V),  $R^3 = Br$ ) или N-йодсукцинимид ((V),  $R^3 = I$ ). Аналогичным образом можно использовать другие электрофильные реагенты, например, электрофильные нитрующие реагенты, такие как нитрующая кислота, тетрафторборат нитрония или нитрат аммония/трифторуксусная кислота (для  $R^3 = NO_2$ ), или электрофильные фторирующие реагенты, такие как DAST, Selectfluor или N-фторбензолсульфонимид (для  $R^3 = F$ ). Реакцию предпочтительно проводят в диапазоне температур от  $0^\circ C$  до  $120^\circ C$  в подходящем растворителе, таком как N,N-диметилформамид, 1,2-дихлорэтан или ацетонитрил.

Соединение общей формулы (Ib;  $R^3 = CN$ ) можно получить, например, посредством реакции соединения формулы (Ia;  $R^3 = Cl, Br, I$ ,

предпочтительно  $R^3 = Br, I$ ) в подходящем растворителе с металлцианидом  $M-CN$  (VI) с добавлением достаточного количества катализатора на основе переходного металла, в частности палладиевых катализаторов, таких как тетраakis(трифенилфосфин)палладий(0) или диацетат палладия, или дихлорид бис(трифенилфосфин)палладия(II), или никелевых катализаторов, таких как ацетилацетонат никеля(II) или хлорид бис(трифенилфосфин)никеля(II), предпочтительно при повышенной температуре в органическом растворителе, таком как 1,2-диметоксиэтан или N,N-диметилформамид. Остаток «M» означает, например, магний, цинк, литий или натрий. В целом, пригодными являются методы кросс-сочетания, описанные в R.D.Larsen, *Organometallics in Process Chemistry*, 2004 Springer Verlag, в I.Tsuji, *Palladium Reagents and Catalysts*, 2004 Wiley, в M.Beller, C. Bolm, *Transition Metals for Organic Synthesis*, 2004 VCH-Wiley. Другие подходящие методы синтеза описаны в *Chem. Rev.* 2006, 106, 2651; *Platinum Metals Review*, 2009, 53, 183; *Platinum Metals Review* 2008, 52, 172 и *Acc. Chem. Res.* 2008, 41, 1486.

Соединение общей формулы (IV) может быть синтезировано посредством алкилирования 3-гидроксипиразолов общей формулы (II) галогенидом общей формулы (III) в присутствии основания в соответствии или по аналогии со способами, известными специалисту. Предпочтительным в качестве основания является карбонатная соль щелочного металла, выбранного из группы, состоящей из лития, натрия, калия и цезия. Реакцию предпочтительно проводят в диапазоне температур между комнатной температурой и 150°C в подходящем растворителе, таком как

дихлорметан, ацетонитрил, N,N-диметилформаид или этилацетат. см. *J. Med. Chem.* 2011, 54(16), 5820-5835 и международную заявку WO2010/010154. Остаток « X » означает, например, хлор, бром или йод.

3-Гидроксипиразолы общей формулы (II) могут быть получены, например, по аналогии с известным из литературы методами в две стадии из замещенных производных пропиновой кислоты общей формулы (VII) (Схема 2; см., например: *Adv. Synth. Catal.* 2014, 356, 3135-3147).

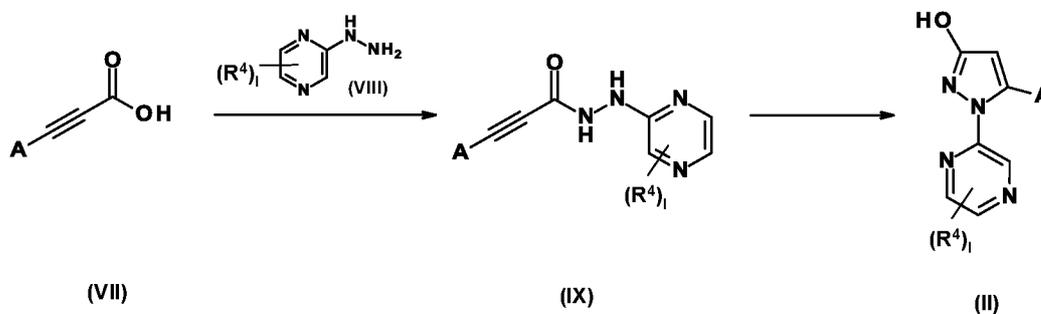


Схема 2

На первой стадии (схема 2) осуществляют синтез соединения общей формулы (IX) посредством амидного сочетания замещенной пропиновой кислоты общей формулы (VII) с гидразинопипразином общей формулы (VIII) в присутствии реагента амидного сочетания, такого как, например, ангидрид пропанфосфоновой кислоты (ТЗР), дициклогексилкарбодиимид, N-(3-диметиламинопропил)-N'-этилкарбодиимид, N,N'-кабонилдиимидазол, хлорид 2-хлор-1,3-диметилимидазолия или йодид 2-хлор-1-метилпипидиния (см. *Chemistry of Peptide Synthesis*, под ред. N. Leo Benoiton, Taylor&Francis, 2006, ISBN-10: 1-57444-454-9).

Полимерсвязанные реагенты, такие как полимерсвязанный дициклогексилкарбодиимид, также подходят для данной реакции сочетания. Реакцию предпочтительно проводят в диапазоне температур от 0°C до 80°C в подходящем растворителе, таком как дихлорметан, тетрагидрофуран, ацетонитрил, *N,N*-диметилформамид или этилацетат, и в присутствии основания, такого как триэтиламин, *N,N*-диизопропилэтиламин или 1,8-диазабицикло[5.4.0]ундец-7-цен (см. схему 2). Условия пептидного сочетания ТЗР см. в *Organic Process Research & Development* 2009, 13, 900-906. Соединения общих формул (VII) и (VIII) имеются в продаже или могут быть получены согласно способам или аналогично способам, известным специалисту в данной области техники.

На второй стадии (схема 2) соединения общей формулы (IX) циклизуют в присутствии галогенида меди, такого как йодид меди (I), бромид меди (I), или основания, такого как метилат натрия, или кислоты, такой как метансульфокислота, в 3-гидроксипиразолы общей формулы (II). Реакцию предпочтительно проводят в диапазоне температур от 0°C до 120°C в подходящем растворителе, таком как 1,2-дихлорэтан, ацетонитрил, *N,N*-диметилформамид, *n*-пропанол, *n*-бутанол или этилацетат.

В качестве альтернативы 3-гидроксипиразолы общей формулы (II) также могут быть получены, например, из защищенных 3-гидроксипиразолов общей формулы (X) (схема 3). Защитная группа R предпочтительно представляет собой бензильную или триалкилсилильную группу.

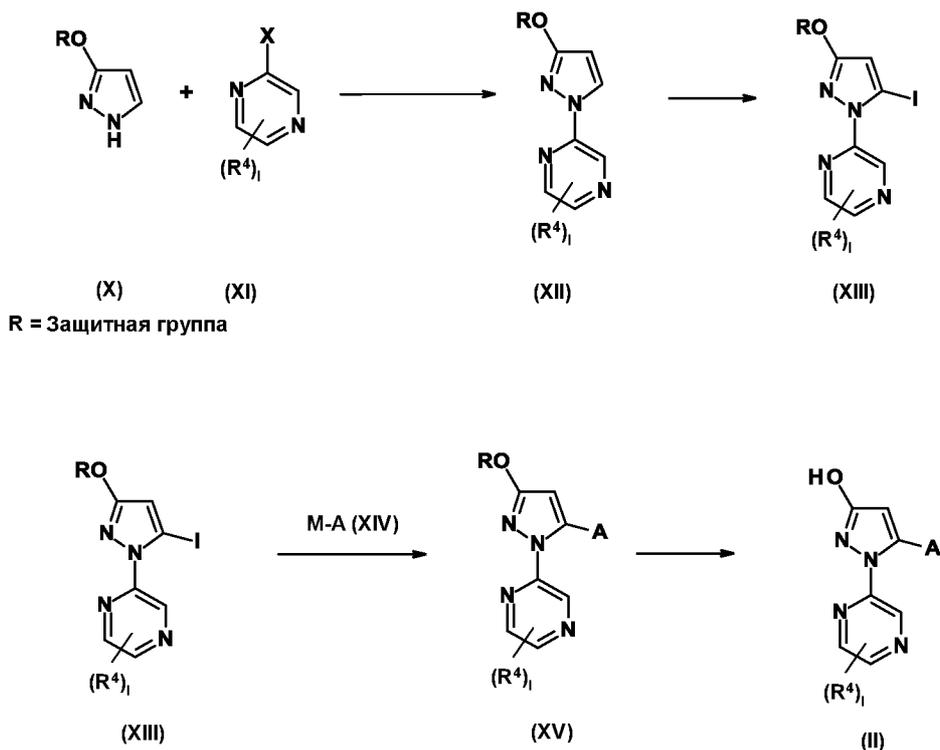


Схема 3

На первой стадии схемы 3 соединения общей формулы (XII) получают посредством N-арилирования защищенных 3-гидроксиимидазолов общей формулы (X) с помощью пиразинилгалогенида общей формулы (XI) в присутствии галогенида меди, например, йодида меди(I). Реакцию предпочтительно проводят в диапазоне температур от 0°C до 120°C в подходящем растворителе, таком как ацетонитрил или N,N-диметилформамид, и в присутствии основания, такого как, например, триэтиламин или карбонат цезия. Соединения общей формулы (XII) могут быть получены в соответствии или по аналогии со способами, известными специалисту в данной области техники (например, *Chem. Med. Chem.* 2015, 10, 1184-1199). Остаток «X» в соединениях общей формулы (XI) означает, предпочтительно, хлор, бром или йод.

На второй стадии из соединений общей формулы (XII) получают 5-йодпиразолы общей формулы (XIII). Реакция протекает в присутствии сильного основания, например *n*-бутиллития или диизопропиламида лития, и йода. Реакция предпочтительно протекает в диапазоне температур от  $-78^{\circ}\text{C}$  до  $-60^{\circ}\text{C}$  в подходящем растворителе, таком как диэтиловый эфир или тетрагидрофуран.

Соединение общей формулы (XV) можно получить, например, посредством реакции соединения формулы (XIII) в подходящем растворителе с соединением M-A (XIV) с добавлением достаточного количества катализатора на основе переходного металла, в частности палладиевого катализатора, такого как диацетат палладия или дихлорид бис(трифенилфосфин)палладия(II), или никелевого катализатора, такого как ацетилацетонат никеля(II) или хлорид бис(трифенилфосфин)никеля(II), предпочтительно при повышенной температуре в органическом растворителе, таком как 1,2-диметоксиэтан. Остаток «M» представляет собой, например,  $\text{B}(\text{OR}^{\text{b}})(\text{OR}^{\text{c}})$ , где остатки  $\text{R}^{\text{b}}$  и  $\text{R}^{\text{c}}$  независимо друг от друга представляют собой водород,  $(\text{C}_1\text{-C}_4)$ -алкил, или, если остатки  $\text{R}^{\text{b}}$  и  $\text{R}^{\text{c}}$  соединены между собой, означают вместе этилен или пропилен. Наконец, снятие защиты с соединения формулы (XV) в соответствии со стандартными методами, хорошо известными специалисту в данной области техники, дает 3-гидроксипиразолы общей формулы (II), которые далее можно подвергнуть взаимодействию, например, как описано на схеме 1, с получением соединения согласно изобретению.

Соединения согласно изобретению также могут быть получены, например, в соответствии со способом синтеза, показанным ниже на схеме 4, из замещенных 5-амино-1-пиазинил-1Н-пиазол-3-олов общей формулы (XVI).

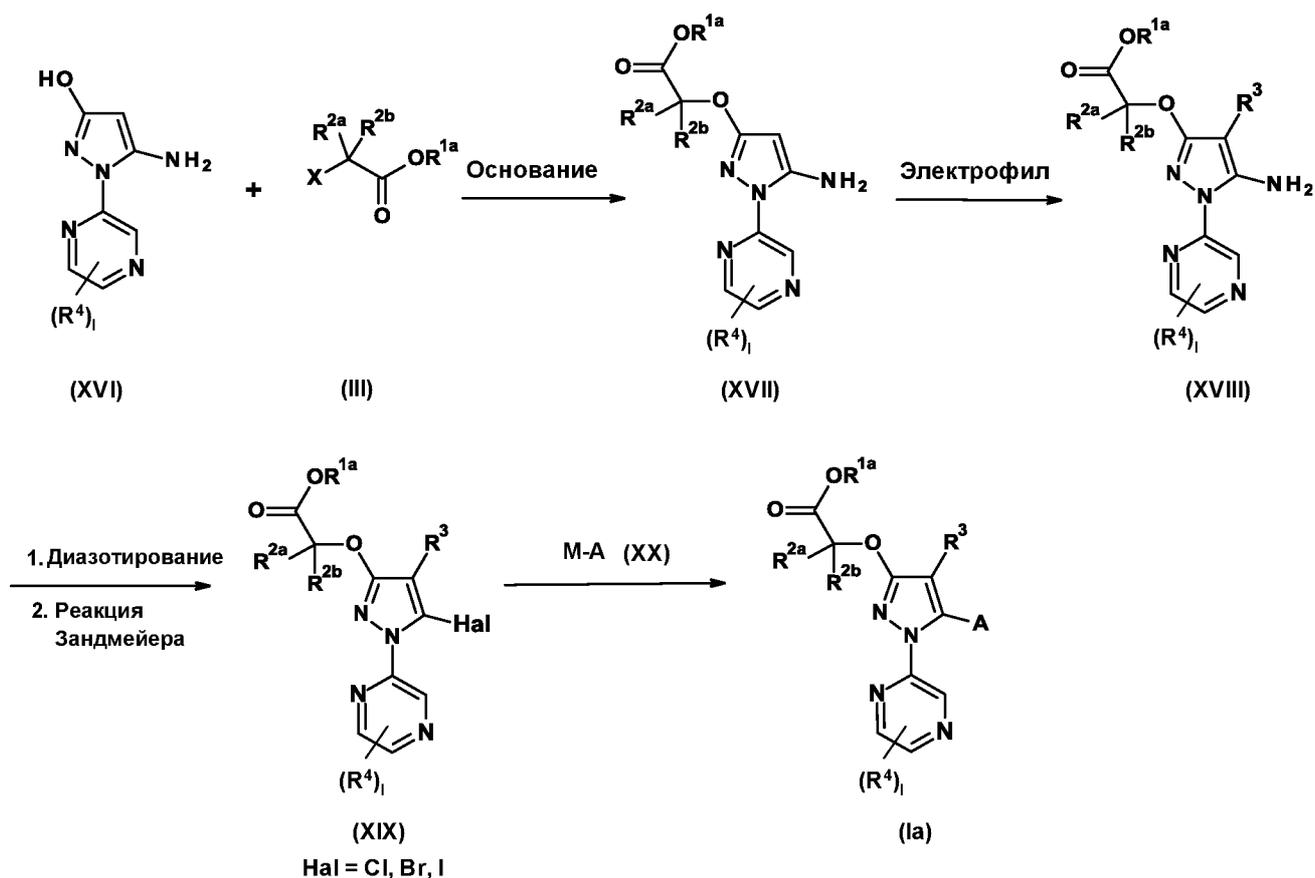


Схема 4

На Схеме 4 показан синтез соединений формулы (Ia) в соответствии или по аналогии со способами, известными специалисту в данной области, посредством взаимодействия соединения общей формулы (XIX), в которой Hal предпочтительно представляет собой бром или йод, особенно предпочтительно йод, с соединением M-A (XX) с добавлением

достаточного количества катализатора на основе переходного металла, в частности палладиевого катализатора, такого как диацетат палладия или дихлорид бис(трифенилфосфин)палладия(II), или никелевого катализатора, такого как ацетилацетонат никеля(II) или хлорида бис(трифенилфосфин)никеля(II), предпочтительно при повышенной температуре в органическом растворителе, таком как 1,2-диметоксиэтан или диоксан. Остаток «M» означает, например, Mg-Hal, Zn-Hal, Sn((C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)алкил)<sub>3</sub>, литий, медь или B(OR<sup>b</sup>)(OR<sup>c</sup>), где остатки R<sup>b</sup> и R<sup>c</sup> независимо друг от друга представляют собой водород, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-алкил, или, если остатки R<sup>b</sup> и R<sup>c</sup> соединены между собой, означают вместе этилен или пропилен.

Соединения общей формулы (XIX) могут быть получены диазотированием и последующей реакцией Зандмейера из 5-аминопиразолов общей формулы (XVIII) с обычными органическими и неорганическими нитритами, такими как, например, 1,1-диметилэтилнитрит, трет-бутилнитрит или изоамилнитрит, в присутствии пригодных реагентов, таких как, например, смеси из бромида/хлорида меди(I) и меди(II), йод или диодметан (схема 4). Реакцию предпочтительно проводят в диапазоне температур между 0°C и 120°C в подходящем растворителе, таком как дихлорметан, ацетонитрил или N,N-диметилформаид.

Синтез соединения общей формулы (XVIII) осуществляют в соответствии или по аналогии со способами, известными специалисту в данной области, посредством взаимодействия замещенного пиразола общей формулы (XVII) с электрофильным реагентом, например, электрофильным

галогенирующим реагентом, таким как N-хлорсукцинимид (для  $R^3 = Cl$ ), N-бромсукцинимид (для  $R^3 = Br$ ), N-йодсукцинимид (для  $R^3 = I$ ) или электрофильным нитрующим реагентом, таким как нитрующая кислота, тетрафторборат нитрония, нитрат аммония/трифторуксусная кислота (для  $R^3 = NO_2$ ) или электрофильным фторирующим реагентом, таким как DAST, Selectfluor, N-фторбензолсульфонимид (для  $R^3 = F$ ). Реакцию предпочтительно проводят в диапазоне температур от 0°C до 120°C в подходящем растворителе, таком как N,N-диметилформамид, 1,2-дихлорэтан или ацетонитрил. Соединение общей формулы (XVIII; с  $R^3 = CN$ ) можно получить, например, посредством реакции соединения формулы (XVIII; с  $R^3 =$  галоген, предпочтительно  $R^3 = Br, I$ ) в подходящем растворителе с металлцианидом M-CN (VI) с добавлением достаточного количества катализатора на основе переходного металла, в частности палладиевых катализаторов, таких как тетракис(трифенилфосфин)палладий(0) или диацетат палладия, или дихлорид бис(трифенилфосфин)палладия(II), или никелевых катализаторов, таких как ацетилацетонат никеля(II) или хлорид бис(трифенилфосфин)никеля(II), предпочтительно при повышенной температуре в органическом растворителе, таком как 1,2-диметоксиэтан или N,N-диметилформамид. В целом, пригодными являются методы кросс-сочетания, описанные в R.D.Larsen, *Organometallics in Process Chemistry*, 2004 Springer Verlag, в I.Tsuji, *Palladium Reagents and Catalysts*, 2004 Wiley, в M.Beller, C. Bolm, *Transition Metals for Organic Synthesis*, 2004 VCH-Wiley. Другие подходящие методы синтеза описаны в *Chem. Rev.*

2006, 106, 2651; *Platinum Metals Review*, 2009, 53, 183; *Platinum Metals Review* 2008, 52, 172 и *Acc. Chem. Res.* 2008, 41, 1486.

Соединение общей формулы (XVII) может быть синтезировано посредством алкилирования замещенных 5-амино-1-пиразинил-1H-пиразол-3-олов общей формулы (XVI) галогенидом общей формулы (III) в присутствии основания в соответствии или по аналогии со способами, известными специалисту (см. Схему 4). Основание может представлять собой карбонатную соль щелочного металла (такого как, например, литий, натрий, калий или цезий). Реакцию предпочтительно проводят в диапазоне температур между комнатной температурой и 150°C в подходящем растворителе, таком как дихлорметан, ацетонитрил, N,N-диметилформаид или этилацетат. Остаток «X» в соединении общей формулы (III) означает, предпочтительно, хлор, бром или йод. Соединения общей формулы (XVI) имеются в продаже или могут быть получены в соответствии или по аналогии со способами, известными специалисту в данной области, например, посредством взаимодействия гидразинопиразина общей формулы (VIII) с этилцианоацетатом (см., например, *Synthetic Communications* (2012), 42(10), 1401-1410).

Из соединений общей формулы (Ia), описанных выше, могут быть получены стандартными способами, хорошо известными специалисту в данной области, соединения общей формулы (Ic) с  $R^{1a}=H$  и (Id) с  $R^1=NR^9R^{10}$  согласно изобретению.

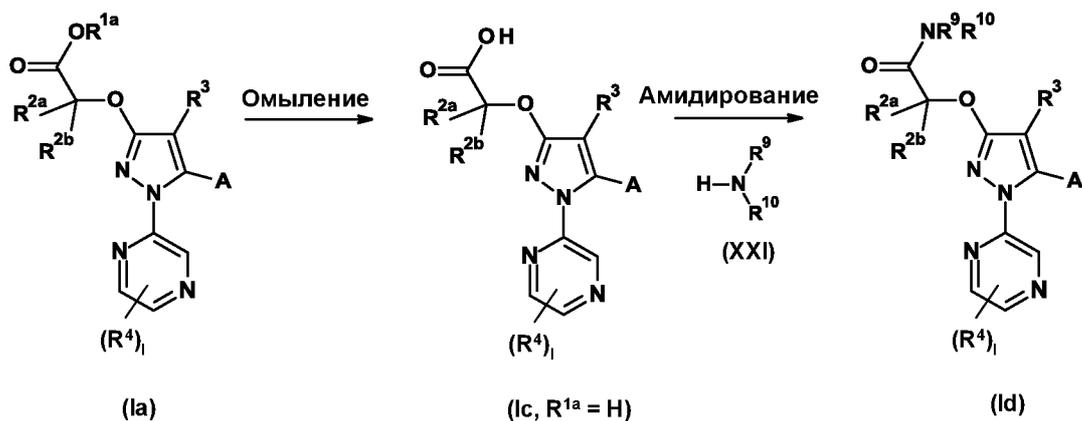


Схема 5

Как представлено на схеме 5 кислоту общей формулы (Ic) можно получить омылением сложным эфиром общей формулы (Ia) в соответствии или по аналогии со способами, известными специалисту в данной области. Омыление можно проводить в присутствии основания или кислоты Льюиса. Основанием может быть гидроксидная соль щелочного металла (такого как литий, натрий или калий), и реакция омыления предпочтительно протекает в диапазоне температур от комнатной температуры до  $120^{\circ}C$ .

Синтез соединения общей формулы (Id) согласно настоящему изобретению осуществляют посредством амидного сочетания кислоты общей формулы (Ic) с амином общей формулы (XXI) в присутствии реагента амидного сочетания, такого как, например, ангидрид пропанфосфоновой кислоты (ТЗР), дициклогексилкарбодиимид, N-(3-диметиламинопропил)-N'-этилкарбодиимид, N,N'-кабонилдиимидазол, 2-хлор-1,3-диметилимидазолия хлорид или 2-хлор-1-метилпиридиния йодид

(см. *Chemistry of Peptide Synthesis*, под ред. N. Leo Benoiton, Taylor & Francis, 2006, ISBN-10: 1-57444-454-9). Полимерсвязанные реагенты, такие как полимерсвязанный дициклогексилкарбодиимид, также подходят для данной реакции сочетания. Реакцию предпочтительно проводят в диапазоне температур от 0°C до 80°C в подходящем растворителе, таком как дихлорметан, ацетонитрил, *N,N*-диметилформамид или этилацетат, и в присутствии основания, такого как триэтиламин, *N,N*-диизопропилэтиламин или 1,8-диазабицикло[5.4.0]ундец-7-цен. Условия пептидного сочетания ТЗР см. в *Organic Process Research & Development* **2009**, 13, 900-906.

Соединения формулы (I) согласно изобретению (и/или их соли), которые в последующем описании упоминаются вместе как «соединения согласно изобретению», обладают отличной гербицидной активностью по отношению к широкому спектру экономически важных однодольных и двудольных однолетних вредных растений.

Таким образом, настоящее изобретение также относится к способу борьбы с нежелательными растениями или регуляции роста растений, предпочтительно культурных растений, в соответствии с которым одно или более соединений согласно настоящему изобретению наносят на растения (например, вредные растения, такие как однодольные или двудольные сорные растения или нежелательные культурные растения), семенной материал (например, зерна, семена или органы вегетативного размножения, такие как клубни или части побегов с почками) или на поверхность почвы, в которой растут растения (например, на посевную

площадь). При этом соединения согласно изобретению можно наносить, например, методом предпосевной обработки (при необходимости также путем введения в почву), а также методом довсходовой или после всходовой обработки. Ниже в качестве примеров приведены отдельные представители однодольных и двудольных сорных растений, рост которых можно контролировать посредством предлагаемых в изобретении соединений, без ограничения возможных сорных растений указанными перечнями.

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

Двудольные сорные растения следующих родов: *Abutilon*, *Amaranthus*, *Ambrosia*, *Anoda*, *Anthemis*, *Aphanes*, *Artemisia*, *Atriplex*, *Bellis*, *Bidens*, *Capsella*, *Carduus*, *Cassia*, *Centaurea*, *Chenopodium*, *Cirsium*, *Convolvulus*, *Datura*, *Desmodium*, *Emex*, *Erysimum*, *Euphorbia*, *Galeopsis*, *Galinsoga*, *Galium*, *Hibiscus*, *Ipomoea*, *Kochia*, *Lamium*, *Lepidium*, *Lindernia*, *Matricaria*, *Mentha*, *Mercurialis*, *Mullugo*, *Myosotis*, *Papaver*, *Pharbitis*, *Plantago*, *Polygonum*, *Portulaca*, *Ranunculus*, *Raphanus*, *Rorippa*, *Rotala*, *Rumex*, *Salsola*, *Senecio*, *Sesbania*, *Sida*, *Sinapis*, *Solanum*, *Sonchus*, *Sphenoclea*, *Stellaria*, *Taraxacum*, *Thlaspi*, *trifolium*, *Urtica*, *Veronica*, *Viola*, *Xanthium*.

Если соединения согласно настоящему изобретению наносятся на поверхность почвы перед прорастанием, прорастание сорной травы либо полностью предотвращается, либо она растет до стадии образования семядольных листьев, но затем ее рост прекращается.

При нанесении активного вещества после всхода на зеленые части растений, рост резко останавливается после обработки, и вредные растения остаются на стадии роста момента нанесения, или они полностью погибают после определенного времени, таким образом, конкуренция с сорными травами, которые являются вредными для культурных растений, исключается на очень ранней стадии и окончательным образом.

Соединения согласно изобретению могут проявлять селективность в отношении полезных культур, а также могут применяться в качестве неселективных гербицидов.

Благодаря их гербицидным свойствам и свойствам регулировать рост растений активные соединения могут также применяться для уничтожения сорных растений в культурах растений, которые уже известны или еще разрабатываются. Трансгенные растения, как правило, характеризуются особенно благоприятными свойствами, например, стойкостью к воздействию определенных используемых в аграрной индустрии активных веществ, прежде всего определенных гербицидов, а также резистентностью к болезням растений или их возбудителям, в частности, определенным насекомым или микроорганизмам, таким как грибки,

бактерии или вирусы. Другие особые свойства трансгенных растений касаются, например, собираемого урожая с точки зрения количества, качества, пригодности к хранению, состава и присутствия особых ингредиентов. Так, например, известны трансгенные растения с повышенным содержанием крахмала или измененным качеством крахмала, а также трансгенные растения с другим составом жирных кислот в собранном урожае. Другими особыми свойствами являются устойчивость к абиотическому стрессу, например высокой температуре, низкой температуре, засухе, повышенному содержанию соли или ультрафиолетовому излучению.

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

Соединения формулы (I) можно применять в качестве гербицидов в культурах сельскохозяйственных растений, которые резистентны к фитотоксическому действию гербицидов или соответственно сделаны резистентными методом геной инженерии.

Подходящие способы выращивания новых растений, которые обладают модифицированными свойствами по сравнению с существующими растениями, состоят, например, в классических способах селекции и выращивании мутантов. Альтернативно новые растения с измененными свойствами можно создавать с помощью рекомбинантных способов (смотрите, например, EP 0221044, EP 0131624). Например были описаны

во многих случаях изменения культурных растений с помощью генных технологий с целью модификации крахмала, синтезируемого в растениях (например, WO 92/11376, WO 92/14827, WO 91/19806), трансгенные культурные растения, которые посредством «пирамидирования генов» устойчивы к определенным гербицидам типа глюфозинатов (смотрите, например, EP 0242236, EP 0242246) или глифозатов (WO 92/000377) или сульфонилмочевин (EP 0257993, US 5013659) или против комбинаций или смесей данных гербицидов, такие как трансгенные культурные растения, например, кукуруза или соя с торговым наименованием или обозначением Optimum™ GAT™ (Glyphosate ALS Tolerant).

- трансгенные культурные растения, например хлопок, обладающие способностью производить *Bacillus thuringiensis*-токсины (Bt-токсины), которые придают растениям устойчивость к определенным вредителям (EP 0142924 A, EP 0193259 A).

- трансгенные культурные растения с модифицированным составом жирных кислот (WO 91/013972 A).

- измененные методами генной технологии культурные растения с новыми ингредиентами или вторичными веществами, например, новые фитоалексины, которые обуславливают повышенную устойчивость к болезням (EP 0309862 A, EP 0464461 A)

- измененные методами генной технологии растения с менее интенсивным фотодыханием, которые отличаются повышенной

урожайностью и повышенной стрессовой толерантностью (EP 0305398 A)

- трансгенные культурные растения, которые продуцируют фармацевтически или диагностически важные протеины (так называемый молекулярный фарминг),
- трансгенные культурные растения, которые отличаются повышенной урожайностью или более высоким качеством,
- трансгенные культурные растения, которые обладают, например, комбинацией указанных выше новых свойств («пирамидирование генов»).

Многочисленные молекулярно-биологические технологии, с помощью которых получают новые трансгенные растения с измененными свойствами, в принципе известны; см., например, В. I. Potrykus и G. Spangenberg (ред.) Gene Transfer to Plants, Springer Lab Manual (1995), Springer Verlag Berlin, Heidelberg. или Christou, "Trends in Plant Science" 1 (1996) 423-431).

При такого рода гентехнологических манипуляциях молекулы нуклеиновых кислот могут вноситься в плазмиды, что вызывает мутагенез или вызывает изменение последовательности в результате рекомбинации ДНК-последовательностей. С помощью названных выше стандартных способов, можно, например, вызвать обмен основаниями, удалить часть последовательностей или добавить природные или искусственные последовательности. Для соединения ДНК-фрагментов между собой к

фрагментам могут быть присоединены адаптеры или линкеры, смотрите, например, Sambrook и др., 1989, *Molecular Cloning, A Laboratory Manual*, 2. Aufl. Cold Spring Harbor Laboratory Press, Cold Spring Harbor, NY; или Winnacker "Gene und Klone", VCH Weinheim 2. Auflage 1996

Получение растительной клетки с ограниченной активностью одного из генных продуктов может быть достигнуто, например, при экспрессии как минимум одной соответствующей антисенс-РНК, одной сенс-РНК для достижения косупрессионного эффекта или экспрессии как минимум одной соответствующим образом построенной рибосомы, которая расщепляет специфически транскрипции генного продукта, указанного выше. Для этого можно использовать ДНК-молекулы, которые охватывают всю кодирующую последовательность генного продукта, включая охват возможных существующих боковых последовательностей, а также молекулы ДНК, которые охватывают только части кодируемой последовательности, причем эти части должны быть достаточно длинными, для того чтобы вызвать в клетках антисенсный эффект. Также возможно применение ДНК-последовательностей, которые обнаруживают высокую степень гомологии к кодируемым последовательностям генного продукта, однако не полностью идентичны.

При экспрессии молекул нуклеиновой кислоты в растениях синтетический протеин может локализоваться в любой ячейке растительной клетки. Однако для достижения локализации в определенной ячейке клетки можно, например, кодируемую область связать с ДНК-последовательностями, которые гарантируют локализацию в

определенной ячейке клетки. Такого рода последовательности известны специалистам (см., например, Braun et al., EMBO J. 11 (1992), 3219-3227; Wolter и др, Proc. Natl. Acad. Sci. USA 85 (1988), 846-850; Sonnewald и др., Plant J. 1 (1991), 95-106). Молекулы нуклеиновых кислот также могут быть экспрессированы в органеллах растительных клеток.

Трансгенные клетки растений можно по известным технологиям регенерировать в целые растения. В случае трансгенных растений в принципе имеют в виду растения любого вида, то есть как однодольные, так и двудольные растения. Так можно получить трансгенные растения, которые обладают измененными свойствами в связи со сверхэкспрессией, супрессией или ингибированием гомологических (= природных) генов или последовательностей генов или экспрессией гетерологических (= чужих) генов или последовательностей генов.

Соединения (I) согласно настоящему изобретению предпочтительно можно использовать в трансгенных культурах, которые обладают устойчивостью по отношению к регуляторам роста, например, таким как 2,4-D, дикамба, или по отношению к гербицидам, которые подавляют эссенциальные ферменты растений, например, ацетолактатсинтазы (ALS), EPSP синтазы, глутамин-синтазы (GS) или гидроксифенилпируватдиоксигеназы (HPPD), соответственное по отношению к гербицидам из группы сульфонилкарбамидов, глифосатов, глюфосинатов или бензоилизоксазолов и аналогичных действующих веществ или любых комбинаций данных действующих веществ.

Особенно предпочтительно соединения согласно изобретению могут быть использованы в трансгенных культурных растениях, устойчивых к комбинации глифосатов и глюфосинатов, глифосатов и сульфонилмочевин или имидазолинонов. Особенно предпочтительно соединения согласно изобретению можно использовать в трансгенных культурах, таких как, кукуруза или соя с торговым наименованием или обозначением Optimum™ GAT™ (Glyphosate ALS Tolerant).

В случае применения активных соединений согласно настоящему изобретению в трансгенных культурах помимо наблюдаемых в других культурах воздействий на сорные растения часто обнаруживают воздействия, специфичные для применения в соответствующей трансгенной культуре, например, изменение или особое расширение спектра сорных растений, которые могут быть уничтожены, изменение вносимых количеств активных соединений, особенно высокая сочетаемость действующих веществ с гербицидами, по отношению к которым устойчива трансгенная культура, а также влияние на рост и урожайность трансгенных культурных растений.

Таким образом, объектом настоящего изобретения является также применение соединений формулы (I) согласно настоящему изобретению в качестве гербицидов для уничтожения сорных растений в трансгенных культурных растениях.

Соединения согласно изобретению могут применяться в форме смачиваемых порошков, эмульгируемых концентратов, распыляемых

растворов, пылевидных средств или гранулятов в обычных препаратах. Поэтому объектом настоящего изобретения также является гербицидное или регулирующее рост растений средство, которое содержит соединения согласно изобретению.

Из соединений согласно изобретению можно изготовить различные препаративные формы в зависимости от того, какие биологические и/или химико-физические параметры заданы. В качестве препаративных форм, например, подходят порошки для разбрызгивания (WP), водорастворимые порошки (SP), водорастворимые концентраты, эмульгируемые концентраты (EC), эмульсии (EW), такие как масловодяные и водно-масляные эмульсии, растворы для опрыскивания, суспензионные концентраты (SC), дисперсии на масляной или водной основе, растворы, смешиваемые с маслом, капсульные суспензии (CS), распыляемые средства (DP), средства для протравливания семян, грануляты для рассыпания и для применения на почве, грануляты (GR) в форме микрогранулятов и гранулятов, образованных при распылении, при пропитывании и при адсорбции, вододиспергируемые грануляты (WG), водорастворимые грануляты (SG), композиции в ультрамалых объемах, микрокапсулы и воски. Эти виды отдельных препаративных форм в принципе известны и описаны, например, в: Winnacker-Küchler, "Chemische Technologie", том 7, С. Hauser Verlag München, 4 изд. 1986; Wade van Valkenburg, "Pesticide Formulations", Marcel Dekker, N.Y., 1973; K.Martens, "Spray Drying" Handbook, 3 изд. 1979, G. Goodwin Ltd. London.

Необходимые вспомогательные вещества для препаративных форм, такие

как инертные материалы, поверхностно-активные вещества, растворители и другие добавки также известны и описаны, например, в: Watkins, "Handbook of Insecticide Dust Diluents and Carriers", 2 изд., Darland Books, Caldwell N.J.; H.v. Olphen, "Introduction to Clay Colloid Chemistry", 2 изд., J. Wiley&Sons, N.Y. C.Marsden, "Solvents Guide"; 2 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. Verlagsgesell., Stuttgart 1976; Winnacker-Küchler, "Chemische Technologie", том 7, C.Hauser Verlag München, 4 изд. 1986.

На основе данных композиций можно также изготавливать комбинации с другими действующими веществами, например, инсектицидами, акарицидами, гербицидами, фунгицидами, а также с защитными средствами, удобрениями и/или регуляторами роста, например в форме готовой композиции или баковой смеси.

В качестве партнера для комбинации для соединений согласно настоящему изобретению в составах смесей или в баковой смеси, например, могут использоваться активные вещества, основанные на ингибировании, например, ацетолактатсинтаза, ацетил-КоА-карбоксилаза, целлюлозсинтаза, енолпирувилшिकимат-3-фосфатсинтаза, глутаминсинтететаза, п-гидроксифенилпируватдиоксигеназа, фитоендесатураза, фотосистема I, фотосистема II на основе протопорфириногенаоксидазы, известные, например, из Weed Research 26 (1986) 441-445 или «The Pesticide Manual», 16-е издание, The British Crop

Protection Council и the Royal Soc. of Chemistry, 2006 и цитируемой там литературе. Далее в качестве примера указаны известные гербициды или регуляторы роста растений, которые могут быть скомбинированы с соединениями согласно изобретению, причем указанные активными вещества обозначены либо их «общим названием» в англоязычном варианте согласно Международной организации по стандартизации (ISO), либо химическим названием или кодовым номером. При этом все формы применения, такие как кислоты, соли, сложные эфиры, а также все изомерные формы, такие как стереоизомеры и оптические изомеры, всегда включены, даже если они явным образом не упомянуты.

Примерами таких гербицидных партнеров для смешивания являются:

Ацетохлор, ацифлуорфен, ацифлуорфен-метил, ацифлуорфен-натрий, аклонифен, алахлор, аллидохлор, аллоксидим, аллоксидим-натрий, аметрин, амикарбазон, амидохлор, амидосульфурон, 4-амино-3-хлор-6-(4-хлор-2-фтор-3-метилфенил)-5-фторпиридин-2-карбоновая кислота, аминоклопирахлор, аминоклопирахлор-калий, аминоклопирахлор-метил, аминоклопирахлор-диметиламмоний, аминоклопирахлор-трипромин, амитрол, сульфамат аммония, анилофос, асулам, асулам-калий, асулам-натрий, атразин, азафенидин, азимсульфурон, бифлутамид, (S)-(-)-бифлутамид, бифлутамид-M, беназолин, беназолин-этил, беназолин-диметиламмоний, беназолин-калий, бенфлуралин, бенфуресат, бенсульфурон, бенсульфурон-метил, бенсулид, бентазон, бентазон-натрий, бензобиклон, бензофенап, бициклопирон, бифенокс, биланафос, биланафос-натрий, бипиразон, биспирибак, биспирибак-

натрий, бикслозон, бромацил, бромацил-литий, бромацил-натрий, бромбутид, бромфеноксим, бромоксинил, бромоксинил-бутират, -калий, -гептаноат и -октаноат, бутоксинон, бутаклор, бутафенацил, бутамифос, бутенахлор, бутралин, бутрооксидим, бутилат, кафенстрол, камбендихлор, карбетамид, карфентразон, карфентразон-этил, хлорамбен, хлорамбен-аммоний, хлорамбен-диоламин, хлорамбен-метил, хлорамбен-метиламмоний, хлорамбен-натрий, хлорбромурон, хлорфенак, хлорфенак-аммоний, хлорфенак-натрий, хлорфенпроп, хлорфенпроп-метил, хлорфлуренол, хлорфлуренол-метил, хлоридазон, хлоримурон, хлоримурон-этил, хлорофталим, хлортолурун, хлорсульфурон, хлортал, хлортал-диметил, хлортал-монометил, цинидон, цинидон-этил, цинметилин, экзо-(+)-цинметилин, т.е. (1R,2S,4S)-4-изопропил-1-метил-2-[(2-метилбензил)окси]-7-оксабицикло[2.2.1]гептан, экзо-(-)-цинметилин, т.е. (1R,2S,4S)-4-изопропил-1-метил-2-[(2-метилбензил)окси]-7-оксабицикло[2.2.1]гептан, циносульфурон, клацифос, клетодим, клодинафоп, клодинафоп-этил, клодинафоп-пропаргил, кломазон, клемерпроп, клопиралид, клопиралид-метил, клопиралид-оламин, клопиралид-калий, клопиралид-трипомин, клорансулам, клорансулам-метил, кумилурон, цианамид, цианазин, циклоат, циклопиранил, циклопириморат, циклосульфамурон, циклоксидим, цигалофоп, цигалофоп-бутил, ципразин, 2,4-D (включая аммоний, бутотил, бутил, холин, диэтиламмоний, диметиламмоний, диоламин, добоксил, додециламмоний, этексил, этил, 2-этилгексил, гептиламмоний, изобутил, изооктил, изопропил, изопропиламмоний, литий, мептил, метил, калий, тетрадециламмоний, триэтиламмоний, триизопропаноламмоний,

трипромин и его троламиновая соль), 2,4-DB, 2,4-DB-бутил, -диметиламмоний, изооктил, -калий и -натрий, даймурон (димрон), далапон, далапон-кальций, далапон-магний, далапон-натрий, дазомет, дазомет-натрий, н-деканол, 7-дезоксид-седогептулоза, десмедифам, детозилпиразолат (DTP), дикамба и его соли, например дикамба-бипроамин, дикамба-N,N-бис(3-аминопропил)метиламин, дикамба-бутотил, дикамба-холин, дикамба-дигликольамин, дикамба-диметиламмоний, дикамба-диэтаноламинаммоний, дикамба-диэтиламмоний, дикамба-изопропиламмоний, дикамба-метил, дикамба-моноэтаноламин, дикамба-оламин, дикамба-калий, дикамба-натрий, дикамба-триэтаноламин, дихлобенил, 2-(2,4-дихлорбензил)-4,4-диметил-1,2-оксазолидин-3-он, 2-(2,5-дихлорбензил)-4,4-диметил-1,2-оксазолидин-3-он, дихлорпроп, дихлорпроп-бутотил, дихлорпроп-диметиламмоний, дихлорпроп-этексил, дихлорпроп-этиламмоний, дихлорпроп-изооктил, дихлорпроп-метил, дихлорпроп-калий, дихлорпроп-натрий, дихлорпроп-п, дихлорпроп-п-диметиламмоний, дихлорпроп-п-этексил, дихлорпроп-п-калий, дихлорпроп-натрий, диклофоп, диклофоп-метил, диклофоп-P, диклофоп-P-метил, диклосулам, дифензокват, дифензокват-метилсульфат, дифлуфеникан, дифлуфензопир, дифлуфензопир-натрий, димефурон, димепиперат, димесульфазет, диметахлор, диметаметрин, диметенамид, диметенамид-P, диметрасульфурон, динитрамин, динотерб, динотерб-ацетат, дифенамид, дикват, дикват-дибромид, дикват-дихлорид, дитиопир, диурон, ДНОК, ДНОК-аммоний, ДНОК-калий, ДНОК-натрий, эндотал, эндотал-диаммоний, эндотал-дикалий, эндотал-динатрий, эпирифенацил (S-3100), EPTC, эспрокарб, эталфлуралин,

этаметсульфурон, этаметсульфурон-метил, этиозин, этофумезат, этоксифен, этоксифен-этил, этокисульфурон, этобензанид, F-5231, т.е. N-[2-хлор-4-фтор-5-[4-(3-фторпропил)-4,5-дигидро-5-оксо-1H-тетразол-1-ил]-фенил]-этансульфон амид, F-7967, т.е. N-[2-хлор-4-фтор-5-[4-(3-фторпропил)-4,5-дигидро-5-оксо-1H-тетразол-1-ил]-фенил]этансульфонамид, F-7967, т.е. 3-[7-хлор-5-фтор-2-(трифторметил)-1H-бензимидазол-4-ил]-1-метил-6-(трифторметил)пиримидин-2,4(1H,3H)-дион, феноксапроп, феноксапроп-P, феноксапроп-этил, феноксапроп-P-этил, феноксасульфон, фенпиразон, фенхинотрион, фентразамид, флампроп, флампроп-изопропил, флампроп-метил, флампроп-M-изопропил, флампроп-M-метил, флазасульфурон, флорасулам, флорпираоксифен, флорпираоксифен-бензил, флуазифоп, флуазифоп-бутил, флуазифоп-метил, флуазифоп-П, флуазифоп-п-бутил, флукарбазон, флукарбазон-натрий, флуцетосульфурон, флухлоралин, флуфенацет, флуфенпир, флуфенпир-этил, флуметсулам, флумиклорак, флумиклорак-пентил, флумиоксазин, флуометурон, флуренол, флуренол-бутил, -диметиламмоний и -метил, фторгликофен, фторгликофен-этил, флупропанат, флупропанат-натрий, флупирсульфурон, флупирсульфурон-метил, флупирсульфурон-метил-натрий, флуридон, флюрохлоридон, флуорокспир, флуорокспир-бутометил, флуорокспир-метил, флуртамон, флутиацет, флутиацет-метил, фомесафен, фомесафен-натрий, форамсульфурон, форамсульфурон-натриевая соль, фозамин, фозамин-аммоний, глюфосинат, глюфосинат-аммоний, глюфосинат-натрий, L-глюфосинат-аммоний, L-глюфоцианат-натрий, глюфосинат-P-натрий, глюфосинат-P-аммоний, глифосат, глифосат-аммоний, -

изопропиламмоний, -диаммоний, -диметиламмоний, -калий, -натрий, -сесквинатрий и -тримезий, 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, галоксифоп-натрий, гексазинон, HNPC-A8169, т.е. проп-2-ин-1-ил (2S)-2-{3-[(5-трет-бутилпиридин-2-ил)окси]фенокси}пропаноат, HW-02, т.е. 1-(диметоксифосфорил)этил-(2,4-дихлорфенокси)ацетат, гидантоцидин, имазаметабенз, имазаметабенз-метил, имазамокс, имазамокс-аммоний, имазапик, имазапик-аммоний, имазапир, имазапир-изопропиламмоний, имазахин, имазахин-аммоний, имазахин-метил, имазетапир, имазетапир-иммоний, имазосульфурон, инданофан, индазифлам, йодосульфурон, йодосульфурон-метил, йодосульфурон-метил-натрий, иоксинил, иоксинил-литий, -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, кетоспирадокс-калий, лактофен, ленацил, линурон, МСРА, МСРА-бутотил, -бутил, -диметиламмоний, -диоламин, -2-этилгексил, -этил, -изобутил, изоктил, -изопропил, -изопропиламмоний, -метил, оламин, -калий, -натрий и -троламин, МСРВ, МСРВ-метил, -этил и -натрий, мекопроп, мекопроп-бутотил, мекопроп-диметиламмоний, мекопроп-диоламин, мекопроп-этексил, мекопроп-этадил, мекопроп-изоктил, мекопроп-метил, мекопроп-калий, мекопроп-натрий и мекопроп-троламин, мекопроп-П, мекопроп-п-бутотил, -

диметиламмоний, -2-этилгексил и -калий, мефенацет, мефлюидид, мефлюидид-диоламин, мефлюидид-калий, мезосульфурон, мезосульфурон-метил, мезосульфурон натриевая соль, мезотрион, метабензтиазурон, метам, метамифоп, метамитрон, метазахлор, метазосульфурон, метабензтиазурон, метиопирсульфурон, метиозолин, метилизотиоцианат, метобромурон, метолахлор, S-метолахлор, метосулам, метоксурон, метрибузин, метсульфурон, метсульфурон-метил, молинат, монолинурон, моноссульфурон, моноссульфурон-метил, 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, NC-656, т.е. 3-[(изопропилсульфонил)метил]-N-(5-метил-1,3,4-оксадиазол-2-ил)-5-(трифторметил)[1,2,4]триазоло[4,3-а]пиридин-8-карбоксамид, небурон, никосульфурон, нонановая кислота (пеларгоновая кислота), норфлуразон, олеиновая кислота (жирные кислоты), орбенкарб, ортосульфамурон, оризалин, оксадиаргил, оксадиазон, оксасульфурон, оксацикломефон, оксифлуорфен, паракват, паракват-дихлорид, паракват-диметилсульфат, пебулат, пендиметалин, пеноксулам, пентахлорфенол, пентоксазон, петоксамид, нефтяные масла, фенмедифам, фенмедифам-этил, пиклорам, пиклорам-диметиламмоний, пиклорам-этексил, пиклорам-изооктил, пиклорам-метил, пиклорам-оламин, пиклорам-калий, пиклорам-триэтиламмоний, пиклорам-трипромин, пиклорам-троламин, пиколинафен, пиноксаден, пиперофос, претилахлор, примисульфурон, примисульфурон-метил, продиамин, профоксидим, прометон, прометрин, пропахлор, пропанил, пропаквизафоп, пропазин, профам, пропохлор, пропоксикарбазон,

пропоксикарбазон-натрий, пропириссульфурон, пропизамид, просульфокарб, просульфурон, пираклонил, пирафлуфен, пирафлуфен-этил, пирасульфотол, пиразолинат (пиразолат), пиразосульфурон, пиразосульфурон-этил, пиразоксифен, пирибамбенз, пирибамбенз-изопропил, пирибамбенз-пропил, пирибензоксим, пирибутикарб, пиридафол, пиридат, пирифталид, пириминобак, пириминобак-метил, пиримисульфан, пиритиобак, пиритиобак-натрий, пироксасульфон, пирокссулам, хинклорак, хинклорак-диметиламмоний, хинклорак-метил, хинмерак, хинокламин, квизалофоп, квизалофоп-этил, квизалофоп-Р, квизалофоп-Р-этил, квизалофоп-Р-тефурил, QYM201, т.е. 1-{2-хлор-3-[(3-циклопропил-5-гидрокси-1-метил-1Н-пиразол-4-ил)карбонил]-6-(трифторметил)фенил}пиперидин-2-он, римсульфурон, сафлуфенацил, сетоксидим, сидурон, симазин, симетрин, SL-261, сулкотрион, сульфентразон, сульфометурон, сульфометурон-метил, сульфосульфурон, SYP-249, т.е. 1-этоксид-3-метил-1-оксобут-3-ен-2-ил-5-[2-хлор-4-(трифторметил)феноксид]-2-нитробензоат, SYP-300, т.е. 1-[7-фтор-3-оксо-4-(проп-2-ин-1-ил)-3,4-дигидро-2Н-1,4-бензоксазин-6-ил]-3-пропил-2-тиоксоимидазолидин-4,5-дион, 2,3,6-ТВА, ТХУ (трихлоруксусная кислота) и ее соли, например ТХУ-аммоний, ТХУ-кальций, ТХУ-этил, ТХУ-магний, ТХУ-натрий, тебутиурон, тефурилтрион, темботрион, тепралоксидим, тербацил, тербукарб, тербуметон, тербутилазин, тербутрин, тетфлу-пиролимет, такстомин, тенилхлор, тиазопир, тиенкарбазон, тиенкарбазон-метил, тифенсульфурон, тифенсульфурон-метил, тиобенкарб, тиафенацил, толпиралат, топрамезон, тралкоксидим, триафамон, триаллат, триасульфурон, триа-зифлам, трибенурон, трибенурон-метил,

триклопир, триклопир-бутотил, триклопир-холин, триклопир-этил, триклопир-триэтиламмоний, триэтазин, трифлорисульфурон, трифлорисульфурон-натрий, трифлудимоксазин, трифлуралин, трифлусульфурон, трифлусульфурон-метил, тритосульфурон, сульфат мочевины, вернолат, XDE-848, ZJ-0862, т.е. 3,4-дихлор-N-{2-[(4,6-диметоксипиримидин-2-ил)окси]бензил}анилин, этиловый эфир 3-(2-хлор-4-фтор-5-(3-метил-2,6-диоксо-4-трифторметил-3,6-дигидропиримидин-1(2H)-ил)фенил)-5-метил-4,5-дигидроизоксазол-5-карбоновой кислоты, 3-хлор-2-[3-(дифторметил)изоксазол-5-ил]фенил-5-хлорпиримидин-2-иловый эфир, 2-(3,4-диметоксифенил)-4-[(2-гидрокси-6-оксоциклогекс-1-ен-1-ил)карбонил]-6-метилпиридазин-3(2H)-он, 2-({2-[(2-метоксиэтокси)метил]-6-метилпиридин-3-ил}карбонил)циклогексан-1,3-дион, (5-гидрокси-1-метил-1H-пиразол-4-ил)(3,3,4-триметил-1,1-диоксидо-2,3-дигидро-1-бензотиофен-5-ил)метанон, 1-метил-4-[(3,3,4-триметил-1,1-диоксидо-2,3-дигидро-1-бензотиофен-5-ил)карбонил]-1H-пиразол-5-илпропан-1-сульфонат, 4-{2-хлор-3-[(3,5-диметил-1H-пиразол-1-ил)метил]-4-(метилсульфонил)бензоил}-1-метил-1H-пиразол-5-ил-1,3-диметил-1H-пиразол-4-карбоксилат; цианометил 4-амино-3-хлор-5-фтор-6-(7-фтор-1H-индол-6-ил)пиридин-2-карбоксилат, проп-2-ин-1-ил 4-амино-3-хлор-5-фтор-6-(7-фтор-1H-индол-6-ил)пиридин-2-карбоксилат, метил 4-амино-3-хлор-5-фтор-6-(7-фтор-1H-индол-6-ил)пиридин-2-карбоксилат, 4-амино-3-хлор-5-фтор-6-(7-фтор-1H-индол-6-ил)пиридин-2-карбоновая кислота, бензил 4-амино-3-хлор-5-фтор-6-(7-фтор-1H-индол-6-ил)пиридин-2-карбоксилат, этил 4-амино-3-хлор-5-фтор-6-(7-фтор-1H-индол-6-ил)пиридин-2-карбоксилат, метил-4-амино-3-хлор-5-фтор-6-(7-фтор-1-изобутирил-1H-

индол-6-ил)пиридин-2-карбоксилат, метил 6-(1-ацетил-7-фтор-1Н-индол-6-ил)-4-амино-3-хлор-5-фторпиридин-2-карбоксилат, метил 4-амино-3-хлор-6-[1-(2,2-диметилпропаноил)-7-фтор-1Н-индол-6-ил]-5-фторпиридин-2-карбоксилат, метил 4-амино-3-хлор-5-фтор-6-[7-фтор-1-(метоксиацетил)-1Н-индол-6-ил]пиридин-2-карбоксилат, калия 4-амино-3-хлор-5-фтор-6-(7-фтор-1Н-индол-6-ил)пиридин-2-карбоксилат, натрия 4-амино-3-хлор-5-фтор-6-(7-фтор-1Н-индол-6-ил)пиридин-2-карбоксилат, бутил 4-амино-3-хлор-5-фтор-6-(7-фтор-1Н-индол-6-ил)пиридин-2-карбоксилат, 4-гидрокси-1-метил-3-[4-(трифторметил)пиридин-2-ил]имидазолидин-2-он, 3-(5-трет-бутил-1,2-оксазол-3-ил)-4-гидрокси-1-метилимидазолидин-2-он.

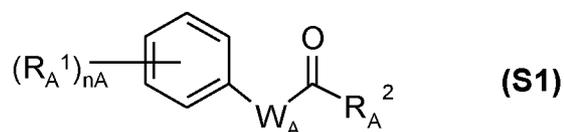
Примерами регуляторов роста растений в качестве партнеров для смешивания являются:

абсцизовая кислота, ацибензолар, ацибензолар-S-метил, 1-аминоциклопро-1-илкарбоновая кислота и их производные, 5-аминолевулиновая кислота, анцимидол, 6-бензиламинопурин, брассинолид, брассинолид-этил, катехин, хитоолигосахариды (CO; CO отличаются от LCO тем, что в них отсутствует боковая цепь жирных кислот, характерная для LCO. CO, иногда называемые N-ацетилхитоолигосахаридами, также состоят из остатков GlcNAc, но имеют характерные элементы боковых цепей, которые отличают их от молекул хитина  $[(C_8H_{13}NO_5)_n]$ , CAS № 1398-61-4] и молекул хитозана  $[(C_5H_{11}NO_4)_n]$ , CAS № 9012-76-4]), хитиновые соединения, хлорид хлормеквата, клопроп, цикланилид, 3-(циклопроп-1-енил)пропионовая кислота, даминозид, дазомет, дазомет-натрий, н-деканол, дикегулак, дикегулак-натрий,

эндотал, эндотал-дикалий, динатрий и моно(N,N-диметилалкиламмоний), этефон, флуметралин, флуренол, флуренол-бутил, флуренол-метил, флурпримидол, форхлорфенурон, гибберелловая кислота, инабенфид, индол-3-уксусная кислота (IAA), 4-индол-3-илмасляная кислота, изопротиолан, пробеназол, жасмоновая кислота, жасмоновая кислота или ее производные (например, метиловый эфир жасмоновой кислоты), липохитоолигосахариды (LCO, иногда называемые сигналами симбиотического образования клубеньков (Nod) (или факторами Nod) или факторами Мус, состоящими из олигосахаридного скелета из  $\beta$ -1,4-связанных остатков N-ацетил-D-глюкозамина («GlcNAc») с N-связанной жирной ацильной цепью, конденсированной на невозстанавливаемом конце. Как известно специалистам, LCO различаются по количеству остатков GlcNAc в основной цепи, по длине и степени насыщения жирной ацильной цепи, а также по заместителям остатков восстанавливающих и невозстанавливающих сахаров, линолевая кислота или ее производные, линоленовая кислота или ее производные, малеиновый гидразид, мепикват хлорид, мепикват пентаборат, 1-метилциклопропен, 3'-метилабсцизовая кислота, 2-(1-нафтил)ацетамид, 1-нафтилуксусная кислота, 2-нафтилоксиуксусная кислота, смесь нитрофенолятов, 4-оксо-4[(2-фенилэтил)амино]масляная кислота, паклобутразол, 4-фенилмасляная кислота, N-фенилфталамовая кислота, прогексадион, прогексадион-кальций, прогидрожасмон, салициловая кислота, метиловый эфир салициловой кислоты, стриголактон, текназен, тидиазурон, триаконтанол, тринексапак, тринексапак-этил, цитодеф, униканазол, униканазол-Р, 2-фтор-N-(3-метоксифенил)-9H-пурин-6-амин.

Защитные средства, которые можно использовать в комбинации с соединениями формулы (I) согласно изобретению и, при необходимости, в комбинациях с другими активными веществами, такими как инсектициды, акарициды, гербициды, фунгициды, перечисленные выше, предпочтительно выбирают из группы, состоящей из:

S1) Соединения формулы (S1)

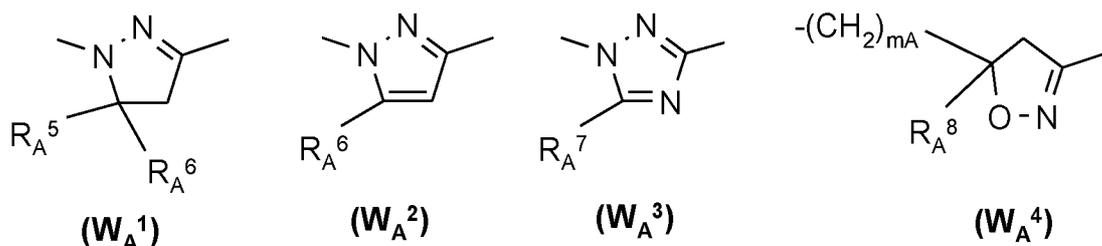


в которой символы и индексы определяются следующим образом:

$n_A$  равно натуральному числу от 0 до 5, предпочтительно равно 0 - 3;

$R_A^1$  представляет собой галоген, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>) алкил, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-алкокси, нитро или (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-галогеналкил;

$W_A$  представляет собой незамещенный или замещенный двухвалентный гетероциклический радикал из группы частично ненасыщенных или ароматических пяти-членных гетероциклов с 1 - 3 кольцевыми гетероатомами из группы N и O, где по меньшей мере один атом азота и самое большее один O-атом присутствует в кольце, предпочтительно радикал из группы ( $W_A^1$ ) - ( $W_A^4$ ),



$m_A$  равно 0 или 1,

$R_A^2$  представляет собой  $OR_A^3$ ,  $SR_A^3$  или  $NR_A^3R_A^4$  или насыщенный или ненасыщенный 3-7-членный гетероцикл с по меньшей мере одним атомом N и до 3 гетероатомов, предпочтительно из группы O и S, который соединен с карбонильной группой в (S1) через атом азота и является незамещенным или замещен остатком из группы, включающей (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-алкил, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-алкокси или при необходимости замещенный фенил, предпочтительно остаток формулы  $OR_A^3$ ,  $NHR_A^4$  или  $N(CH_3)_2$ , в частности формулы  $OR_A^3$ ;

$R_A^3$  представляет собой водород или незамещенный или замещенный алифатический углеводородный остаток, предпочтительно имеющий суммарно от 1 до 18 атомов углерода;

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

$R_A^5$  представляет собой H, (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-алкил, (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-галогеналкил, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-алкокси-(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-алкил, циано или  $COOR_A^9$ , где  $R_A^9$  представляет собой водород, (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-алкил, (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-галогеналкил, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-алкокси-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-

алкил, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-гидроксиалкил, (C<sub>3</sub>-C<sub>12</sub>)-циклоалкил или три(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-алкилсилил;

R<sub>A</sub><sup>6</sup>, R<sub>A</sub><sup>7</sup>, R<sub>A</sub><sup>8</sup> являются одинаковыми или различными, и каждый представляет собой водород, (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-алкил, (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-галоалкил, (C<sub>3</sub>-C<sub>12</sub>)-циклоалкил или замещенный или незамещенный фенил;

предпочтительно:

а) Соединения, относящиеся к типу дихлорфенилпиразолин-3-карбоновой кислоты (S1<sup>a</sup>), предпочтительно соединения, такие как 1-(2,4-дихлорфенил)5-(этоксикарбонил)5-метил2-пиразолин-3-карбоновая кислота, этиловый эфир 1-(2,4-дихлорфенил)5-(этоксикарбонил)5-метил2-пиразолин-3-карбоновой кислоты (S1-1) ("мефенпир-диэтил"), и родственные соединения, такие как описаны в международной заявке WO-A-91/07874;

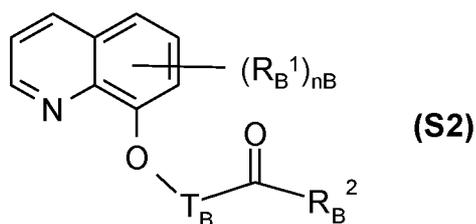
б) Производные дихлорфенилпиразолкарбоновой кислоты (S1<sup>b</sup>), предпочтительно соединения, такие как этиловый эфир 1-(2,4-дихлорфенил)-5-метил-пиразол-3-карбоновой кислоты (S1-2), этиловый эфир 1-(2,4-дихлорфенил)-5-изопропил-пиразол-3-карбоновой кислоты (S1-3), этиловый эфир 1-(2,4-дихлорфенил)-5-(1,1-диметил-этил)пиразол-3-карбоновой кислоты (S1-4) и родственные соединения, такие как описаны в европейских заявках на патент EP-A-333 131 и EP-A-269 806;

с) Производные 1,5-дифенилпиразол-3-карбоновой кислоты (S1<sup>c</sup>), предпочтительно соединения, такие 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, такие как описаны, например, в европейской заявке на патент EP-A-268554;

d) Соединения вида триазолкарбоновой кислоты (S1<sup>d</sup>), предпочтительно соединения, такие как фенхлоразол(-этиловый сложный эфир), т.е. этиловый эфир 1-(4-дихлорфенил)5-трихлорметил-(1H)-1,2,4-триазол-3-карбоновой кислоты (S1-7), и родственные соединения, такие как описаны в европейских заявках на патент EP-A-174 562 и EP-A-346 620;

e) Соединения вида 5-бензил- или 5-фенил-2-изоксазолин-3-карбоновой кислоты или 5,5-дифенил-2-изоксазолин-3-карбоновой кислоты (S1<sup>e</sup>), предпочтительно соединения, такие 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), и родственные соединения, такие как описаны в WO-A-91/08202, или 5,5-дифенил-2-изоксазолин-3-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 международной патентной заявке WO-A-95/07897.

S2) Хинолиновые производные формулы (S2),



в которой символы и индексы определяются следующим образом:

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

$n_B$  равно натуральному числу от 0 до 5, предпочтительно от 0 до 3;

$R_B^2$  представляет собой  $OR_B^3$ ,  $SR_B^3$  или  $NR_B^3R_B^4$  или насыщенный или ненасыщенный 3-7-членный гетероцикл с по меньшей мере одним атомом N и до 3 гетероатомов, предпочтительно из группы O и S, который соединен с карбонильной группой в (S2) через атом азота и является незамещенным или замещен остатком из группы, включающей (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-алкил, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-алкокси или при необходимости замещенный фенил, предпочтительно остаток формулы  $OR_B^3$ ,  $NHR_B^4$  или  $N(CH_3)_2$ , в частности формулы  $OR_B^3$ ;

$R_B^3$  представляет собой водород или незамещенный или замещенный алифатический углеводородный остаток, предпочтительно имеющий суммарно от 1 до 18 атомов углерода;

$R_B^4$  представляет собой водород, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-алкил, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-алкокси или

замещенный или незамещенный фенил;

T<sub>B</sub> представляет собой (C<sub>1</sub> или C<sub>2</sub>)-алкандиильную цепь, незамещенную или замещенную одним или двумя (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-алкильными остатками или [(C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)-алкокси]-карбонилем;

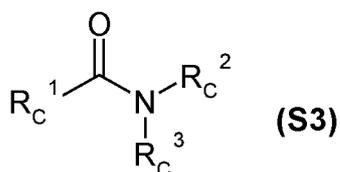
предпочтительно:

- а) Соединения, относящиеся к типу 8-хинолиноксиуксусной кислоты (S2<sup>a</sup>), предпочтительно 1-метилгексильный эфир (5-хлор-8-хинолинокси)уксусной кислоты ("клоквинтоцет-мексил") (S2-1), 1,3-диметил-бут-1-иловый эфир (5-хлор-8-хинолинокси)уксусной кислоты (S2-2), 4-аллилокси-бутиловый эфир (5-хлор-8-хинолинокси)уксусной кислоты (S2-3), 1-аллилокси-проп-2-иловый эфир (5-хлор-8-хинолинокси)уксусной кислоты (S2-4), этиловый эфир (5-хлор-8-хинолинокси)уксусной кислоты (S2-5), 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, такие как описаны в европейских заявках на патент EP-A-86 750, EP-A-94 349 и EP-A-191 736 или EP-A-0 492 366, а также (5-хлор-8-хинолинокси)уксусная кислота (S2-10), ее гидраты и соли,

например, ее соли лития-, натрия- калия-, кальция-, магния-, алюминия-, железа-, аммония-, четвертичного аммония-, сульфония-, или фосфония, такие как описаны в международной заявке WO-A-2002/34048;

b) Соединения, относящиеся к типу (5-хлор-8-хинолинокси)малоновой кислоты (S2<sup>b</sup>), предпочтительно соединения, такие 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, такие как описаны в европейской заявке на патент EP-A-0 582 198.

S3) Соединения формулы (S3)



в которой символы и индексы определяются следующим образом:

R<sub>C</sub><sup>1</sup> представляет собой (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-алкил, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-галогеналкил, (C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>)-алкенил, (C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>)-галогеналкенил, (C<sub>3</sub>-C<sub>7</sub>)-циклоалкил, предпочтительно дихлорметил;

R<sub>C</sub><sup>2</sup>, R<sub>C</sub><sup>3</sup> представляют собой одинаково или по разному водород, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-алкил, (C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>)-алкенил, (C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>)-алкинил, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-галогеналкил, (C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>)-галогеналкенил, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-алкилкарбамоил-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-алкил, (C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>)-

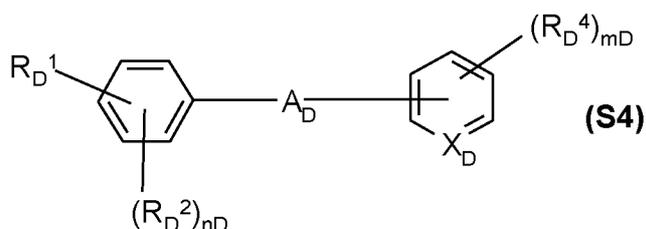
алкенилкарбамоил-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-алкил, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-алкокси-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-алкил, диоксоланил-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-алкил, тиазолил, фурил, фуриралкил, тиенил, пиперидил, замещенный или незамещенный фенил, или R<sub>C</sub><sup>2</sup> и R<sub>C</sub><sup>3</sup> вместе образуют замещенное или незамещенное гетероциклическое кольцо, предпочтительно оксазолидиновое, тиазолидиновое, пиперидиновое, морфолиновое, гексагидропиримидиновое или бензоксазиновое кольцо;

предпочтительно:

Активные вещества, относящиеся к типу дихлорацетамида (S3), которые часто применяются в качестве предвсходовых защитных веществ (воздействующих на почву защитных веществ), как например "Дихлормид" (N,N-диаллил-2,2-дихлорацетамид) (S3-1), "R-29148" (3-дихлорацетил-2,2,5-триметил-1,3-оксазолидин) от компании Stauffer (S3-2), "R-28725" (3-дихлорацетил-2,2,-диметил-1,3-оксазолидин) от 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) от компании PPG Industries (S3-5), "DKA-24" (N-Аллил-N-[(аллиламинокарбонил)метил]-дихлорацетамид) от компании Sagro-Chem (S3-6), "AD-67" или "MON 4660" (3-дихлорацетил-1-окса-3-аза-спиро[4,5]декан) от компании Nitrokemia или Monsanto (S3-7), «TI-35" (1-дихлорацетил-азепан) от компании Tri-Chemical RT (S3-8), "Диклонон" (дициклонон) или "BAS145138" или "LAB145138" (S3-9) ((RS)-1-дихлорацетил-3,3,8a-триметилреггидропирролол[1,2-a]пиримидин-6-он) от компании BASF,

"Фурилазол" или "MON 13900" ((RS)-3-дихлорацетил-5-(2-фурил)-2,2-диметил-токсазолидин) (S3-10); а также его (R)-изомер (S3-11).

S4) N-Ацилсульфонамиды формулы (S4) и их соли,



в которых символы и индексы имеют следующие значения:

$A_D$  представляет собой  $SO_2-NR_D^3-CO$  или  $CO-NR_D^3-SO_2$

$X_D$  представляет собой  $CH$  или  $N$ ;

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

$R_D^2$  представляет собой галоген,  $(C_1-C_4)$ -галогеналкил,  $(C_1-C_4)$ -галогеналкокси, нитро,  $(C_1-C_4)$ -алкил,  $(C_1-C_4)$ -алкокси,  $(C_1-C_4)$ -алкилсульфонил,  $(C_1-C_4)$ -алкоксикарбонил или  $(C_1-C_4)$ -алкилкарбонил;

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

$R_D^4$  представляет собой галоген, нитро,  $(C_1-C_4)$ -алкил,  $(C_1-C_4)$ -галогеналкил,  $(C_1-C_4)$ -галогеналкокси,  $(C_3-C_6)$ -циклоалкил, фенил,  $(C_1-C_4)$ -

алкокси, циано, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-алкилтио, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-алкилсульфинил, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-алкилсульфонил, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-алкоксикарбонил или (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-алкилкарбонил;

R<sub>D</sub><sup>5</sup> представляет собой 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, фенил или 3-6-членный гетероциклил, содержащий  $\nu_D$  гетероатомов из группы азота, кислорода и серы, причем последние семь остатков замещены  $\nu_D$  заместителями из группы галогена, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-алкокси, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-галогеналкокси, (C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>)-алкилсульфинил, (C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>)-алкилсульфонил, (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)-циклоалкил, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-алкоксикарбонил, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-алкилкарбонил и фенил и, в случае циклических радикалов, также (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-алкил и (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-галогеналкил;

R<sub>D</sub><sup>6</sup> представляет собой водород, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-алкил, (C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)-алкенил или (C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)-алкинил, причем три последних упомянутых остатка замещены  $\nu_D$  заместителями из группы, включающей галоген, гидроксильную, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-алкил, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-алкокси и (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-алкилтио, или

R<sub>D</sub><sup>5</sup> и R<sub>D</sub><sup>6</sup> вместе с несущим их атомом азота образуют пирролидинильный или пиперидинильный остаток;

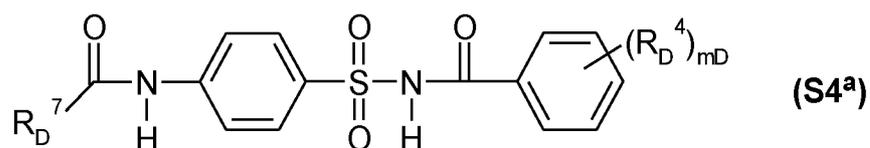
R<sub>D</sub><sup>7</sup> представляет собой водород, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-алкиламино, ди-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-алкиламино, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-алкил, (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)-циклоалкил, причем 2 последних упомянутых остатка замещены  $\nu_D$  заместителями из группы, включающей галоген, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-алкокси, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-галогеналкокси и (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-алкилтио, а в случае циклического остатка также (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-алкил и (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-галогеналкил;

$n_D$  равно 0, 1 или 2;

$m_D$  равно 1 или 2,

$v_D$  равно 0, 1, 2 или 3;

среди указанного предпочтение отдается соединениям, относящимся к типу N-ацилсульфонамида, например, соединениям согласно приведенной далее формуле (S4<sup>a</sup>), которые, например, известны из международной заявки WO-A-97/45016



в которой

$R_D^7$  представляет собой (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-алкил, (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)-циклоалкил, причем 2 последних упомянутых остатка замещены  $v_D$  заместителями из группы, включающей галоген, (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, а в случае циклического остатка также (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-алкил и (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>) галогеналкил;

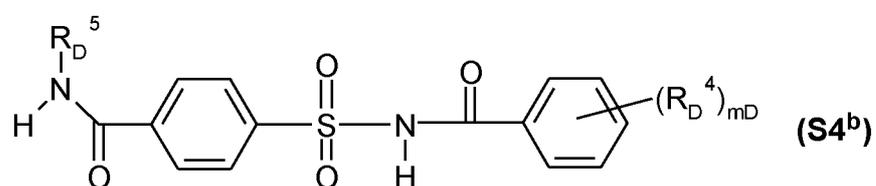
$R_D^4$  представляет собой галоген, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>) алкил, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>) алкокси, CF<sub>3</sub>;

$m_D$  равно 1 или 2,

$v_D$  равно 0, 1, 2 или 3;

а также

ацилсульфамоилбензамидам, например, согласно приведенной далее формуле (S4<sup>b</sup>), которые, например, известны из международной заявке WO-A-99/16744,



например такие, в которых

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

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

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

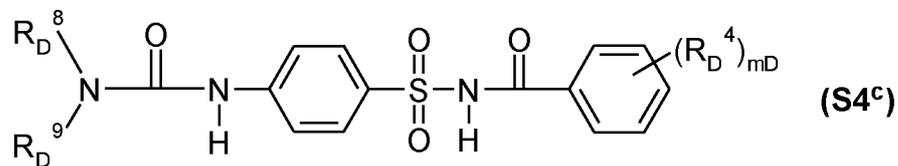
$R_D^5$  = изопропил и  $(R_D^4) = 5\text{-Cl-2-OMe}$  (S4-4) и

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

а также

соединениям, относящимся к типу N-ацилсульфамоилфенилмочевин

формулы (S4<sup>c</sup>), которые, например, известны из европейского патента EP-A-365484,



в которой

$R_D^8$  и  $R_D^9$  независимо друг от друга означают водород, (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-алкил, (C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)-циклоалкил, (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)-алкенил, (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)-алкинил,

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

$m_D$  равно 1 или 2;

например,

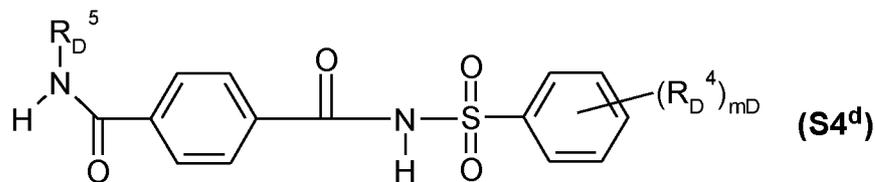
1-[4-(N-2-метоксибензоилсульфамоил)фенил]-3-метилмочевина,

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

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

а также

N-фенилсульфонилтерефталамидам формулы (S4<sup>d</sup>), которые, например, известны из китайского патента CN 101838227,



например такие, в которых

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

$m_D$  равно 1 или 2,

$R_D^5$  означает водород,  $(C_1-C_6)$ -алкил,  $(C_3-C_6)$ -циклоалкил,  $(C_2-C_6)$ -алкенил,  $(C_2-C_6)$ -алкинил,  $(C_5-C_6)$ -циклоалкенил.

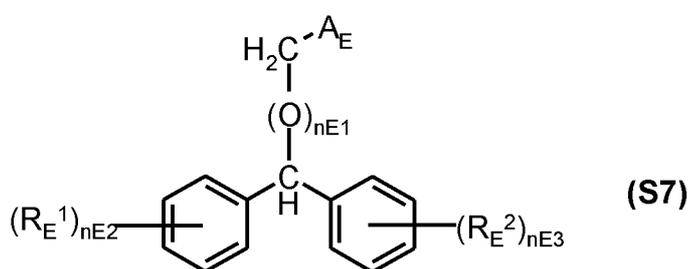
S5) Активные вещества из класса производных гидроксисамоароматических и ароматических-алифатических карбоновых кислот (S5), например, этиловый сложный эфир 3,4,5-триацетоксибензойной кислоты, 3,5-диметокси-4-гидроксисамоароматическая кислота, 3,5-дигидроксисамоароматическая кислота, 4-гидроксисалициловая кислота, 4-фторсалициловая кислота, 2-гидроксисалициловая кислота, 2,4-дихлорсалициловая кислота, такие как описано в международных заявках WO-A-2004/084631, WO-A-2005/015994, WO-A-2005/016001.

S6) Активные вещества из класса 1,2-дигидрохиноксалин-2-она (S6), например,

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

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

S7) Соединения формулы (S7), как описано в международной заявке WO-A-1998/38856



в которых символы и индексы имеют следующие значения:

$R_E^1$ ,  $R_E^2$  независимо друг от друга представляют собой галоген, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-алкил, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-алкокси, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-галоалкил, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-алкиламино, ди-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-алкиламино, нитро;

$A_E$  представляет собой COOR<sub>E</sub><sup>3</sup> или COSR<sub>E</sub><sup>4</sup>

$R_E^3$ ,  $R_E^4$  независимо друг от друга представляют собой водород, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-алкил, (C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)-алкенил, (C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>)-алкинил, цианоалкил, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-галоалкил, фенил, нитрофенил, бензил, галобензил, пиридинилалкил и алкиламмоний,

$n_E^1$  представляет собой 0 или 1

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

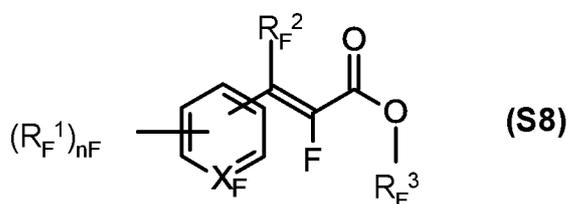
предпочтительно:

дифенилметоксиуксусная кислота,

этиловый эфир дифенилметоксиуксусной кислоты ,

метилвый эфир дифенилметоксиуксусной кислоты (Регистрационный номер CAS 41858-19-9) (S7-1).

S8) Соединения формулы (S8), такие как описаны в международной заявке WO-A-1998/27049



в которой

$X_F$  представляет собой CH или N;

$n_F$  в случае если  $X_F=N$ , представляет собой целое число от 0 до 4 и

в случае если  $X_F=CH$ , представляет собой целое число от 0 до 5,

$R_F^1$  представляет собой галоген, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-алкил, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-галогеналкил, (C<sub>1</sub>-

C<sub>4</sub>)-алкокси, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-галогеналкокси, нитро, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-алкилтио, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-алкилсульфонил, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-алкоксикарбонил, при необходимости замещенный фенил, при необходимости замещенный фенокси,

R<sub>F</sub><sup>2</sup> означает водород или (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-алкил

R<sub>F</sub><sup>3</sup> 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 указанных выше C-содержащих остатков является незамещенным или замещен одним или более, предпочтительно максимум тремя одинаковыми или различными остатками из группы, состоящей из галогена и алкокси, или их соли.

предпочтительно соединения, в которых

X<sub>F</sub> представляет собой СН;

n<sub>F</sub> означает целое число от 0 до 2,

R<sub>F</sub> представляет собой галоген, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-алкил, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-галогеналкил, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-алкокси, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-галогеналкокси,

R<sub>F</sub><sup>2</sup> представляет собой водород или (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-алкил,

R<sub>F</sub><sup>3</sup> 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 указанных выше C-содержащих остатков является незамещенным или замещен одним или более, предпочтительно

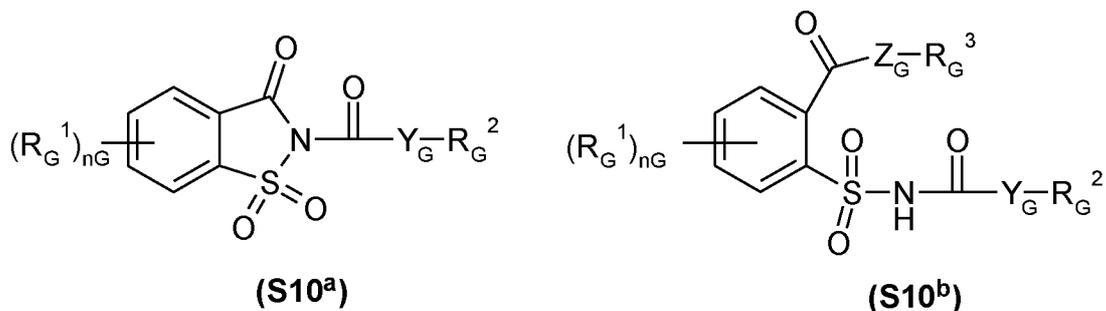
максимум тремя одинаковыми или различными остатками из группы, состоящей из галогена и алкокси, или их соли.

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

1,2-дигидро-4-гидрокси-1-этил-3-(5-тетразолилкарбонил)-2-хинолон (номер CAS 219479-18-2), 1,2-дигидро-4-гидрокси-1-метил-3-(5-тетразолилкарбонил)-2-хинолон (номер CAS 95855-00-8), такие как описаны в международной заявке WO-A-1999/000020.

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

такие как описаны в международной заявке WO-A-2007/023719 и WO-A-2007/023764



в которой

R<sub>G</sub><sup>1</sup> означает галоген, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-алкил, метокси, нитро, циано, CF<sub>3</sub>, OCF<sub>3</sub>

Y<sub>G</sub>, Z<sub>G</sub> независимо друг от друга означают O или S,

$n_G$  означает целое число от 0 до 4,

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

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

S11) Активные вещества типа оксиимино-соединений (S11), которые известны в качестве протравителей для семян, как например, "Оксабетринил" ((Z)-1,3-диоксолан-2-илметоксиимино(фенил)ацетонитрил) (S11-1), который известен в качестве протравителя для семян и защитного средства для проса против повреждения метолахлором,

"Флуксофеним" (1-(4-хлорфенил)-2,2,2-трифтор-1-этанон-O-(1,3-диоксолан-2-илметил)-оксим) (S11-2), который известен в качестве протравителя для семян и защитного средства для проса против повреждения метолахлором, и

"Циометринил" или "CGA-43089" ((Z)-цианометоксиимино(фенил)ацетонитрил) (S11-3), который известен в качестве протравителя для семян и защитного средства для проса против повреждения метолахлором.

S12) Активные вещества класса изотиохроманонов (S12), такие как, например, метил-[(3-оксо-1H-2-бензотиопиран-4(3H)-илиден)метокси]ацетат (CAS-номер 205121-04-6) (S12-1) и родственные

соединения, известные из международной заявки WO-A-1998/13361.

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

«Нафталевый ангидрид» (ангидрид 1,8-нафталиндикарбоновой кислоты) (S13-1), который известен в качестве протравливателя семян для защиты кукурузы от тиокарбаматных гербицидов,

"Фенклорим" (4,6-дихлор-2-фенилпиримидин) (S13-2), который известен в качестве защитного средства для риса от претилахлора,

"Флуразол" (бензил-2-хлор-4-трифторметил-1,3-тиазол-5-карбоксилат) (S13-3), который известен в качестве протравливателя семян и защитного средства для проса против повреждения алахлором и метолахлором,

"CL 304415" (CAS-номер 31541-57-8)

(4-карбокси-3,4-дигидро-2H-1-бензопиран-4-уксусная кислота) (S13-4) фирмы American Cyanamid, который известен в качестве защитного средства для кукурузы против повреждения имидазолином,

"MG 191" (CAS-номер 96420-72-3) (2-дихлорметил-2-метил-1,3-диоксолан) (S13-5) фирмы Nitrokemia, который известен в качестве защитного средства для кукурузы,

"MG 838" (CAS-номер 133993-74-5)

(2-пропенил 1-окса-4-азаспиро[4.5]декан-4-карботиоат) (S13-6) фирмы

Nitrokemia,

"Дисульфотон" (О,О-диэтил S-2-этилтиозетил фосфордитиоат) (S13-7),

"Диэтолат" (О,О-диэтил-О-фенилфосфортиоат) (S13-8),

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

S14) Активные вещества которые в дополнение к гербицидному действию против вредных растений, также оказывают защитное действие на культурные растения, такие как рис, например, "Димепиперат" или "MY 93" (S-1-метил-1-фенилэтил-пиперидин-1-карботиоат), который известен в качестве защитного средства для риса против повреждения гербицидом молинатом,

"Даимурон" или "SK 23" (1-(1-метил-1-фенилэтил)-3-р-толил-мочевина), который известен в качестве защитного средства для риса против повреждения гербицидом имазосулфуроном,

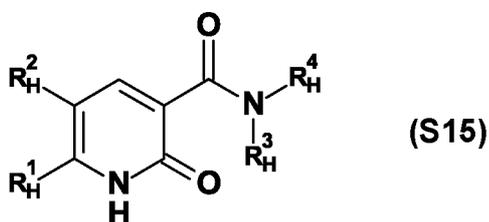
"Кумилурон" = "JC 940" (3-(2-хлорфенилметил)-1-(1-метил-1-фенил-этил)мочевина, смотрите JP-A-60087254), который известен в качестве защитного средства для риса для защиты от повреждения некоторыми гербицидами,

"Метоксифенон" или "NK 049" (3,3'-диметил-4-метокси-бензофенон), который известен в качестве защитного средства для риса для защиты от

повреждения некоторыми гербицидами,

"CSB" (1-Бром-4-(хлорметилсульфонил)бензол) от Kumiai, (CAS-номер 54091-06-4), который известен в качестве защитного средства для риса против повреждения некоторыми гербицидами.

S15) Соединения формулы (S15) или их таутомеры



такие как описаны в международной заявке WO-A-2008/131861 и WO-A-2008/131860, в которых

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

$R_H^2$  означает водород или галоген, и

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

причем каждый из последних 3 упомянутых остатков является незамещенным или замещен одним или более остатками из группы, включающей галоген, гидроксильный, циано, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-алкокси, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-галогеналкокси, (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]-карбонил, [(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-галогеналкокси]-карбонил, (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)-циклоалкил, который является незамещенным или замещенным, фенил, который является незамещенным или замещенным, и гетероциклил, который является незамещенным или замещенным,

или (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)-циклоалкил, (C<sub>4</sub>-C<sub>6</sub>)-циклоалкенил, (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)-циклоалкил, сконденсированный на одной стороне кольца с 4 - 6-членным насыщенным или ненасыщенным карбоциклическим кольцом, или (C<sub>4</sub>-C<sub>6</sub>)-циклоалкенил, сконденсированный на одной стороне кольца с 4 - 6-членным насыщенным или ненасыщенным карбоциклическим кольцом,

причем каждый из последних 4 упомянутых остатков является незамещенным или замещен одним или более остатками из группы, включающей галоген, гидроксильную, циано-, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-алкил-, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-галогеналкил-, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-алкокси-, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-галогеналкокси-, (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]-карбонил-, [(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-галогеналкокси]-карбонил-, (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)-циклоалкил, который является незамещенным или замещенным, фенил, который является незамещенным или замещенным, и гетероциклил, 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>)-галогеналкокси-, и

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

$R_H^3$  и  $R_H^4$  вместе с непосредственно связанным атомом азота означают четырех-восьми-членное гетероциклическое кольцо, которое помимо атома азота может также содержать другие гетероатомы, предпочтительно до двух других гетероатомов из группы N, O и S, и является незамещенным или замещено одним или более остатками из группы, включающей галоген, циано, нитро, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-алкил, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-галогеналкил, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-алкокси, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-галогеналкокси и (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-алкилтио.

S16) Активные вещества, которые применяются преимущественно в качестве гербицидов, но также оказывают защитное действие в отношении культурных растений, например,

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

(4-хлорфенокси)уксусная кислота,

(R,S)-2-(4-хлор-о-толилокси)поролонвая кислота (Месоргор),

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

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

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

4-(4-хлорфенокси)масляная кислота,

3,6-дихлор-2-метоксибензойная кислота (дикамба),

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

Особенно предпочтительными защитными средствами являются мефенпир-диэтил, ципросульфамид, изоксадифен-этил, клоквинтоцет-

мексил, дихлормид и меткамифен.

Смачивающиеся порошки представляют собой препараты, однородно диспергируемые в воде, которые содержат, наряду с активным веществом, кроме разбавителя или инертного вещества, еще поверхностно-активные вещества ионной или неионной природы (смачивающие средства, диспергирующие средства), например полиоксиэтилированные алкилфенолы, полиоксиэтилированные жирные спирты, полиоксиэтилированные жирные амины, сульфаты полигликолевых эфиров жирных спиртов, алкансульфонаты, алкилбензолсульфонаты, лигнинсульфонокислый натрий, 2,2'-динафтилметан-6,6'-дисульфонокислый натрий, дибутил-нафталин-сульфонокислый натрий или также олеилметил-тауринокислый натрий. Для изготовления смачивающихся порошков гербицидные активные вещества тонко перемалывают, например, на молотковых мельницах, на мельницах с поддувом воздуха и на струйных мельницах и одновременно или в заключение перемешивают со вспомогательными веществами композиций.

Эмульгируемые концентраты получают при растворении активного вещества в органическом растворителе, например бутанол, циклогексанон, диметилформамид, ксилол или высококипящие ароматические соединения или углеводороды, или смеси органических растворителей при добавлении одного или нескольких поверхностно-активных соединений ионной и/или неионной природы (эмульгаторы). В качестве эмульгаторов можно использовать, например,

алкиларилсульфонокислые кальциевые соли, такие как Са-додецилбензолсульфонат или неионные эмульгаторы, такие как полигликолевый эфир жирной кислоты, алкиларилполигликолевый эфир, полигликолевый эфир жирного спирта, продукт конденсации пропиленоксида с этиленоксидом, алкилполиэфир, сложный эфир сорбита, такой как, например, эфир сорбита с жирной кислотой или полиоксиэтиленсорбитовый эфир, такой как, например, полиоксиэтиленсорбитовый эфир жирной кислоты.

Распыляемые средства получают при перемалывании активного вещества с тонко измельченными твердыми веществами, такими как тальк, природные глины, например каолин, бентонит и пирофиллит или диатомовая земля.

Суспензионные концентраты бывают на водной или масляной основе. Их можно приготовить, например, при мокром перемалывании на обычной коммерческой шаровой мельнице при необходимости с добавлением поверхностно-активных соединений, таких как описаны выше для других типов препаративных форм.

Эмульсии, например эмульсии масло-в-воде (EW), можно получить, например, при перемешивании с помощью мешалок, коллоидных мельниц и/или статических мешалок с применением содержащих воду органических растворителей и при необходимости поверхностно-активных веществ, например, описанных выше для других типов препаративных форм.

Грануляты можно получать или при распылении активного вещества с помощью форсунок на способный к адсорбции гранулированный инертный материал, или при нанесении концентратов активного вещества с помощью клеящих средств, например поливинилового спирта, полиакрилкислого натрия или минеральных масел, на поверхность веществ носителей, таких как песок, каолиниты или гранулированный инертный материал. Подходящие активные вещества можно также гранулировать способами, обычными для получения гранулятов минеральных удобрений, при желании в смеси с минеральными удобрениями.

Диспергируемые в воде грануляты, как правило, получают обычными способами, такими как распылительная сушка, гранулирование в кипящем слое, тарелочное гранулирование, перемешивание в высокоскоростных смесителях и экструзия без твердого инертного материала.

Относительно получения гранулятов при тарелочном гранулировании, гранулировании в кипящем слое, при экструзии и при распылительной сушке смотрите, например, способы в "Spray-Drying Handbook" 3е изд. 1979, G. Goodwin Ltd., London, J.E. Browning, "Agglomeration", Chemical and Engineering 1967, страницы 147 и далее, "Perry's Chemical Engineer's Handbook", 5е Изд., McGrawHill, New York 1973, с. 8-57.

Относительно других подробностей приготовления препаративных форм средств защиты растений смотрите, например, G.C. Klingman, "Weed Control as a Science", John Wiley and Sons, Inc., New York, 1961, страницы

81-96 и J.D. Freyer, S.A.Evans, "Weed Control Handbook", 5 изд., Blackwell Scientific Publications, Oxford, 1968, стр.101-103.

Агрехимические композиции содержат, как правило, от 0,1 до 99 % масс., в частности от 0,1 до 95 % масс. соединений согласно изобретению. Концентрация активного вещества в смачивающихся порошках составляет, например, около 10 до 90 % масс., остаток до 100 % масс. состоит из обычных для препаративных форм компонентов. В случае эмульгируемых концентратов концентрация активного вещества может составлять около 1 до 90 % масс., предпочтительно от 5 до 80 % масс. Пылевидные препаративные формы содержат от 1 до 30 % масс. активного вещества, предпочтительно, в большинстве случаев от 5 до 20 % масс. активного вещества, растворы для опрыскивания содержат около 0,05 до 80, предпочтительно от 2 до 50 % масс. активного вещества. В случае вододиспергируемых гранулятов содержание активного вещества зависит отчасти от того, является ли активное вещество жидким или твердым, и от того, какие применяются гранулирующие вспомогательные вещества, наполнители и т.д. В случае вододиспергируемых гранулятов содержание активного вещества составляет, например, от 1 до 95 % масс., предпочтительно от 10 до 80 % масс.

Кроме того, указанные композиции активных соединений при необходимости содержат соответствующие аппреты, смачивающие вещества, диспергаторы, эмульгаторы, средства для улучшения проникания, консерванты, антифризы и растворители, наполнители, носители и красители, антивспениватели, средства для уменьшения

испарения, а также регуляторы рН и вязкости.

На основе данных композиций можно также изготавливать комбинации с другими веществами, обладающими пестицидным действием, например, инсектицидами, акарицидами, гербицидами, фунгицидами, а также с защитными средствами, удобрениями и/или регуляторами роста, например в форме готовой композиции или баковой смеси.

Для применения составы, которые доступны в коммерческой форме, необязательно разбавляют водой обычным способом, например, в случае смачивающихся порошков, эмульгируемых концентратов, дисперсий и вододиспергируемых гранулятов. Пылевидные составы, грануляты для нанесения на почву или грануляты для рассеивания, а также распыляемые растворы, как правило, далее не разбавляются другими инертными веществами перед применением.

Необходимая норма нанесения соединений формулы (I) и их солей варьируется в зависимости от внешних условий, таких как, среди прочего, температура, влажность и вид применяемого гербицида. Она может варьироваться в широких диапазонах, например, от 0,001 до 10,0 кг/га одного или более активного вещества, предпочтительно в диапазоне от 0,005 до 5 кг/га, более предпочтительно в диапазоне от 0,01 до 1,5 кг/га, в частности предпочтительно в диапазоне от 0,05 до 1 кг/га. Это относится как к предвсходовому, так и к послевсходовому применению.

Носитель означает натуральное или синтетическое, органическое или

неорганическое вещество, с которым смешивают или комбинируют активные вещества для лучшей пригодности к применению, особенно для нанесения на растения или части растений или семена. Носитель, который может быть твердым или жидким, обычно является инертным и должен быть пригоден для применения в сельском хозяйстве.

В качестве твердых или жидких носителей пригодны, например, аммониевые соли и помолы природных горных пород, таких как каолины, глиноземы, тальк, мел, кварц, аттапульгит, монтмориллонит или диатомовая земля и помолы синтетических минералов, такие как высокодисперсная кремниевая кислота, оксид алюминия, природные или синтетические силикаты, смолы, воски, твердые удобрения, вода, спирты, особенно бутанол, органические растворители, минеральные и растительные масла и их производные. Также могут быть использованы смеси таких носителей. В качестве твердых носителей для гранулятов подходят, например, раздробленные и фракционированные природные горные породы, такие как кальцит, мрамор, пемза, сепиолит, доломит, а также синтетические грануляты из неорганической и органической муки, а также грануляты из такого органического материала, такие как древесные опилки, скорлупа кокосовых орехов, кукурузные початки и стебли табака.

В качестве сжижаемых газообразных разбавителей или носителей пригодны такие жидкости, которые при нормальной температуре и нормальном давлении являются газообразными, например несущие газы аэрозолей, такие как галогенуглеводороды, а также бутан, пропан, азот и диоксид углерода.

В композициях могут быть использованы средства, повышающие адгезию, такие как, карбоксиметилцеллюлоза и природные и синтетические полимеры в форме порошка, гранул или латексной форме, как например, гуммиарабик, поливиниловый спирт, поливинилацетат, или еще природные фосфолипиды, как например, цефалины и лецитины, и синтетические фосфолипиды. Другими добавками могут быть минеральные и растительные масла.

В случае использования воды в качестве разбавителя могут также применяться, например, органические растворители в качестве вспомогательных растворителей. В качестве жидких растворителей пригодными являются в основном: ароматические соединения, такие как ксилол, толуол или алкилнафталины, хлорированные ароматические соединения или хлорированные алифатические углеводороды, такие как хлорбензолы, хлорэтилены или дихлорметан, алифатические углеводороды, такие как циклогексан или парафины, например фракции минерального масла, минеральные и растительные масла, спирты, такие как бутанол или гликоль, а также их простые эфиры и сложные эфиры, кетоны, такие как ацетон, метилэтилкетон, метилизобутилкетон или циклогексанон, сильнополярные растворители, такие как диметилформамид и диметилсульфоксид, а также воду.

Средства согласно изобретению могут также содержать другие компоненты, такие как поверхностно-активные вещества. Подходящими поверхностно-активными веществами являются эмульгирующие и пенообразующие средства, диспергирующие или смачивающие средства с

ионными или не ионными свойствами или смеси данных поверхностно-активных веществ. Примерами таковых являются соли полиакриловой кислоты, соли лигносульфоновой кислоты, соли фенолсульфоновой кислоты или нафталинсульфоновой кислоты, поликонденсаты этиленоксида с жирными спиртами или жирными кислотами или с жирными аминами, с замещенными фенолами (предпочтительно алкилфенолами или арилфенолами), соли эфиров сульфоянтарной кислоты, производные тауриновой кислоты (предпочтительно алкилтаураты), эфиры фосфорной кислоты с полиэтоксилированными спиртами или фенолами, эфиры жирных кислот с полиолами и производные соединений, содержащих сульфаты, сульфонаты и фосфаты, например простые алкиларилполигликолевые эфиры, алкилсульфонаты, алкилсульфаты, арилсульфонаты, гидролизаты яичного белка, лигнинсульфитовые щелоки и метилцеллюлоза. Присутствие поверхностно-активного вещества является необходимым, если одно из действующих веществ и/или один из инертных носителей не растворим в воде и применение осуществляют в воде. Доля поверхностно-активных веществ составляет от 5 до 40 % масс. средства согласно изобретению. Могут быть использованы красители, такие как неорганические пигменты, например оксид железа, оксид титана, ферроциан синий, и органические красители, такие как ализариновые, азо- и металлфталоцианиновые красители и питательные микроэлементы, таких как соли железа, марганца, бора, меди, кобальта, молибдена и цинка.

При необходимости также могут содержаться другие дополнительные компоненты, например, защитные коллоиды, связующие вещества, клеящие вещества, загустители, тиксотропные вещества, пенетранты, стабилизаторы, секвестрирующие агенты, комплексообразователи. Как правило, действующие вещества можно комбинировать с каждой твердой или жидкой добавкой, которая обычно применяется для приготовления композиций. В основном средства и композиции согласно изобретению содержат от 0,05 до 99 % масс., от 0,01 до 98 % масс., предпочтительно от 0,1 до 95 % масс., особенно предпочтительно от 0,5 до 90 % активного вещества, наиболее предпочтительно между 10 и 70 % масс. Активные вещества или соответственно средства согласно изобретению можно использовать как таковые или в зависимости от их соответствующих физических и/или химических свойств в форме их композиций или приготовленных из них форм применения, таких как аэрозоли, капсульные суспензии, концентраты холодного тумана, концентраты горячего тумана, закапсулованные грануляты, мелкие грануляты, текучие концентраты для обработки семенного материала, готовые для применения растворы, распыляемые порошки, эмульгируемые концентраты, эмульсии масло-в-воде, эмульсии вода-в-масле, макрогрануляты, микрогрануляты, диспергируемые в масле порошки, смешиваемые с маслом текучие концентраты, смешиваемые с маслом жидкости, пены, пасты, обернутый пестицидами семенной материал, суспензионные концентраты, суспензионно-эмульсионные концентраты, растворимые концентраты, суспензии, порошки для опрыскивания, растворимые порошки, распыляемые средства и грануляты, растворимые в воде грануляты или

таблетки, растворимые в воде порошки для обработки семенного материала, смачиваемые порошки, пропитанные активным веществом природные или синтетические вещества, а также мельчайшие капсулы в полимерных веществах и покровные массы для семенного материала, а также композиции в ультра малых объемах для образования холодного или теплого тумана.

Указанные композиции могут быть приготовлены известным образом, например смешиванием активных веществ по меньшей мере с одним обычным наполнителем, растворителем или соответственно разбавителем, эмульгатором, диспергирующим и/или связывающим или фиксирующим средством, смачивающим средством, водоотталкивающим средством, при необходимости сиккативами и УФ-стабилизаторами и при необходимости красителями и пигментами, противовспенивателями, консервирующими средствами, вторичными загустителями, клеящими веществами, гиббереллинами, а также другими вспомогательными для переработки веществами.

Средства согласно изобретению охватывают не только композиции, которые уже готовы к применению и могут быть нанесены с помощью подходящей аппаратуры на растения или на семенной материал, но и имеющиеся в продаже концентраты, которые перед применением необходимо разбавить водой.

Соединения согласно изобретению могут присутствовать в своих обычных композициях, а также в формах применения, полученных из этих

композиций, в смесях с другими (известными) активными веществами, такими как инсектициды, аттрактанты, стерилизаторы, бактерициды, акарициды, нематициды, фунгициды, регуляторы роста растений, гербициды, удобрения, защитные вещества или соответственно полухимикаты.

Обработку растений и частей растений согласно изобретению активными веществами или соответственно средствами проводят непосредственно или воздействием на их окружающую среду, среду обитания или складские помещения обычными методами обработки, например, окуриванием, опрыскиванием, распылением, орошением, обработкой паром, разбрызгиванием, опыливанием, рассыпанием, вспениванием, обмазыванием, размазыванием, поливанием (промакиванием), капельным орошением и в случае материала для размножения, в частности семян, также сухим протравливанием, мокрым протравливанием, протравливанием в шламе, инкрустированием, покрыванием однослойной или многослойной оболочкой и т.д. Кроме того, существует возможность нанесения активного вещества способом ультрамалых объемов или инъектирования в почву препарата активного вещества или самого активного вещества.

Как также описано далее, особое значение имеет также обработка трансгенного семенного материала активным веществом или соответственно средством согласно изобретению. Это касается семенного материала растений, которые содержат, по меньшей мере, один гетерологический ген, который регулирует экспрессию полипептида или

белка с инсектицидными свойствами. Гетерологический ген в трансгенном семенном материале может иметь происхождение, например, из микроорганизмов родов *Bacillus*, *Rhizobium*, *Pseudomonas*, *Serratia*, *Trichoderma*, *Clavibacter*, *Glomus* или *Gliocladium*. Предпочтительно данный гетерологический ген происходит из *Bacillus* sp., причем генный продукт оказывает действие против кукурузной огневки (европейского точильщика корней) и/или западного кукурузного корневого червя. Более предпочтительно гетерологический ген происходит из *Bacillus thuringiensis*.

В рамках данного изобретения средство согласно изобретению наносят на семена отдельно или в подходящей композиции. Предпочтительно семена обрабатывают в том состоянии, в котором они являются настолько стабильным, что при обработке не причиняется вреда. В основном, обработку семенного материала можно осуществлять в любой момент времени между сбором урожая и посевом. Обычно можно использовать семенной материал, который был отделен от растения и освобожден от початков, скорлупы, стеблей, внешних оболочек, шерсти или мякоти плода. Например, возможно использовать семенной материал, который был собран, очищен и высушен до содержания влаги ниже 15 % масс. Альтернативно может быть использован также семенной материал, который после сушки был обработан водой и затем по-новой высушен.

В общем, при обработке семенного материала необходимо обратить внимание на то, что количество средства согласно изобретению, нанесенного на семенной материал, и/или других добавок выбирают таким образом, чтобы оно не вредило прорастанию семенного материала или

соответственно полученным из него растениям. Это необходимо соблюдать прежде всего, в случае активных веществ, которые могут проявлять фитотоксические эффекты при определенных нормах нанесения.

Средства согласно изобретению могут быть нанесены непосредственно, то есть без содержания других компонентов и без разбавления. Как правило предпочтительно наносить средство на семенной материал в форме подходящей композиции. Подходящие композиции и способы обработки семенного материала известны специалисту в данной области и описаны например в следующих документах: US 4,272,417 A, US 4,245,432 A, US 4,808,430 A, US 5,876,739 A, US 2003/0176428 A1, WO 2002/080675 A1, WO 2002/028186 A2.

Активные вещества согласно изобретению могут быть превращены в стандартные композиции для протравливания семян, такие как растворы, эмульсии, суспензии, порошки, пены, взвеси или другие покрывающие композиции для семенного материала, а также ULV-композиции.

Данные композиции получают известным образом, посредством смешивания активных веществ со стандартными добавками, такими как, например, обычные разжижители, а также растворители или разбавители, красители, смачивающие агенты, диспергирующие средства, эмульгаторы, противовспениватели, консерванты, вторичные загустители, клеящие вещества, гиббереллины, а также вода.

В качестве красителей, которые могут присутствовать в применяемых согласно настоящему изобретению композициях для протравливания семян, пригодными являются все стандартные для таких целей красители. При этом можно применять либо пигменты, которые мало растворимы в воде, либо красители, которые растворимы в воде. В качестве примеров следует назвать красители, известные под наименованиями Родамин В или наименованиями в международной системе обозначения красителей C.I. Pigment Red 112 и C.I. Solvent Red 1.

В качестве смачивающих средств, которые могут содержаться в применяемых согласно изобретению протравочных композициях, рассматривают все вещества, способствующие смачиванию, обычные для приготовления композиций агрохимических активных веществ. Предпочтительно могут быть использованы алкилнафталинсульфонаты, такие как диизопропил- или диизобутилнафталинсульфонаты.

В качестве диспергаторов и/или эмульгаторов, которые могут содержаться в протравочных композициях, применяемых согласно изобретению, принимают во внимание все неионогенные, анионные и катионные диспергирующие средства, обычные для приготовления композиций агрохимических активных веществ. Предпочтительным является применение неионных или анионных диспергирующих средств или смесей неионных или анионных диспергирующих средств. Подходящие неионные диспергирующие средства включают в частности этиленоксид/пропиленоксид блочные полимеры, алкилфенолполигликолевые простые эфиры и

тристирилфенолполигликолевые простые эфиры, и их фосфатированные или сульфатированные производные. Подходящие анионные диспергирующие средства включают в частности лигносульфонаты, соли полиакриловой кислоты и арилсульфонат/формальдегид конденсаты.

В качестве противовспенивающих средств в протравочных композициях, применяемых согласно изобретению, могут содержаться все вещества, препятствующие пенообразованию, обычные для приготовления композиций агрохимических активных веществ. Предпочтительно используемыми являются силиконовые противовспенивающие средства и стеарат магния.

В качестве консервантов в протравочных композициях, применяемых согласно изобретению, могут содержаться все вещества, применимые для подобных целей в агрохимических средствах. Примеры включают дихлорофен и полуформаль бензилового спирта.

В качестве вторичных загустителей, которые могут содержаться в протравочных композициях, применяемых согласно изобретению, пригодными являются все вещества, применимые для подобных целей в агрохимических средствах. Предпочтительными являются производные целлюлозы, производные акриловой кислоты, ксантан, модифицированные глины и тонко измельченная кремниевая кислота.

В качестве клеящих веществ, которые могут содержаться в протравочных композициях, применяемых согласно изобретению, рассматривают все

связующие средства, которые обычно могут быть использованы в протравочных средствах. В качестве предпочтительных могут быть упомянуты поливинилпирролидон, поливинилацетат, поливиниловый спирт и тилоза.

Применимые согласно изобретению протравочные композиции можно использовать непосредственно, либо после предварительного разбавления водой, для обработки семенного материала различных видов, также семенного материала трансгенных растений. При этом при взаимодействии с веществами, образованными экспрессией, могут также возникать дополнительные синергитические эффекты.

Для обработки семенного материала применяемыми согласно изобретению протравочными композициями или полученными из них при добавлении воды составами используют все обычные применяемые для протравливания смесители. В частности, методика протравливания семян состоит в помещении семенного материала в смеситель, добавлении в каждом случае желаемого количества композиции для протравливания, либо как таковой, либо после предварительного разбавления водой, и смешивании всех компонентов до достижения равномерного распределения композиции на семенном материале. При необходимости это сопровождается операцией сушки.

Активные соединения согласно изобретению подходят для защиты растений и органов растений, для повышения урожайности и улучшения качества сельскохозяйственных культур, при этом они хорошо

переносятся растениями, обладают благоприятной токсичностью для теплокровных животных и хорошей совместимостью с окружающей средой. Преимущественно они могут применяться как средства защиты растений. Они действуют против нормально чувствительных и резистентных видов, а также против всех или отдельных стадий их развития.

В качестве растений, которые можно обрабатывать согласно изобретению, необходимо назвать следующие основные культуры: кукуруза, соя, хлопок, семена масличных культур Brassica, такие как Brassica napus (например, рапс), Brassica rapa, B. juncea (например, (полевая) горчица) и Brassica carinata, рис, пшеница, сахарная свекла, сахарный тростник, овес, рожь, ячмень, просо, тритикале, лен, виноград и различные фрукты и овощи различных ботанических таксонов, таких как Rosaceae sp. (например, семечковые плоды, как яблоко и груша, а также косточковые плоды, как абрикосы, вишни, миндаль и персики и садоваягодные культуры, такие как земляника), Ribesioideae sp., Juglandaceae sp., Betulaceae sp., Anacardiaceae sp., Fagaceae sp., Moraceae sp., Oleaceae sp., Actinidaceae sp., Lauraceae sp., Musaceae sp. (например, банановые деревья и плантации), Rubiaceae sp. (например, кофе), Theaceae sp., Sterculiaceae sp., Rutaceae sp. (например, лимоны, апельсины и грейпфруты); Solanaceae sp. (например, томаты, картофель, перец, баклажаны), Liliaceae sp., Compositae sp. (например, салат, артишок и цикорий, включая корневой цикорий, эндивий или цикорий обыкновенный), Umbelliferae sp. (например, морковь, петрушка, черешковый сельдерей и сельдерей корневой),

Cucurbitaceae sp. (например, огурцы, включая корнишоны, кабачки, арбузы, тыквы и дыни), Alliaceae sp. (например, лук-порей и лук репчатый), Cruciferae sp. (например, капуста белокочанная, капуста краснокочанная, брокколи, капуста цветная, капуста брюссельская, Пак-чой, кольраби, редис, хрен, кресс-салат и пекинская капуста), Leguminosae sp. (например, арахис, горох и бобы, такие как стручковая фасоль и кормовые бобы), Chenopodiaceae sp. (например, листовая свекла, кормовая свекла, шпинат, свекла красная), Malvaceae (например, бамя), Asparagaceae (например, спаржа); полезные растения и декоративные растения в саду и лесу; а также в каждом случае генетически модифицированные виды данных растений.

Как отмечено выше, согласно изобретению можно обрабатывать все растения и их части. В одном из предпочтительных вариантов осуществления изобретения обрабатывают дикорастущие или полученные такими традиционные биологическими методами, как скрещивание или синтез протопластов, виды и сорта растений, а также их части. В другом предпочтительном варианте осуществления обрабатывают трансгенные растения и сорта растений, полученные с помощью способов генной инженерии, при необходимости в комбинации с обычными способами (генномодифицированные организмы), и их части. Термины "растения", "части растений" и "растительные части" пояснены выше. Более предпочтительно согласно изобретению обрабатывают растения и сорта растений, которые в каждом случае являются коммерчески доступными или находящимися в обиходе. Под сортами растений понимают растения с

новыми качествами ("Traits"), которые были получены путем традиционного разведения, мутагенеза или рекомбинационной ДНК-технологии. Это могут быть сорта, расы, био- и генотипы.

Способ обработки согласно изобретению может применяться для обработки генетически модифицированных организмов (GMO), например, растений или семян. Генетически модифицированные растения (или трансгенные растения) представляют собой растения, в которых гетерологический ген устойчиво интегрирован в геном. Понятие "гетерологический ген" обозначает в основном ген, который вырабатывается или соединяется вне растения и при внедрении в клеточный геном, геном хлоропласта или митохондрический геном трансформируемых растений придает новые улучшенные агрономические или прочие свойства, чтобы заинтересованный протеин или полипептид экспримировались, или чтобы другой ген, который имеется в растении, или остальные гены, имеющиеся в растении, регулировались или отключались (например, при помощи антинаправленной технологии, Cosuppression-технологии или RNAi-технологии [RNA Interference]). Гетерологический ген, который имеется в геноме, также называют трансген. Трансген, который определяют его особенным наличием в геноме растения, называют преобразованный или трансгенный результат (Event).

В зависимости от видов или сортов растений, места их произрастания и условий роста (почвы, климата, периода вегетации, питания) обработка согласно изобретению может приводить также к сверхаддитивным ("синергическим") эффектам. Так, например,

возможны следующие эффекты, которые существенно превышают ожидаемые: сниженные нормы потребления и/или увеличенный спектр действия и/или усиленное действие применяемых согласно изобретению веществ и средств, лучший рост растений, повышенная толерантность к высоким или низким температурам, повышенная толерантность к сухости или к содержанию солей в воде и почве, повышенная продуктивность цветения, облегчение уборки урожая, ускорение созревания, увеличение размеров урожая, фрукты большего размера, более высокие растения, более интенсивный зеленый цвет листа, раннее цветение, улучшенное качество и/или повышенная пищевая ценность продукта урожая, повышенная концентрация сахара во фруктах, повышенная устойчивость при хранении и/или обрабатываемость продуктов урожая.

Растения и сорта растений, которые предпочтительно обрабатывают согласно изобретению, включают все растения, которые получены посредством генетического материала, который придает этим растениям особенно выгодные, полезные признаки (независимо от того, было ли это достигнуто посредством селекции и/или биотехнологии).

Примеры устойчивых к нематодам растений описаны в следующих патентных заявках США: 11/765,491, 11/765,494, 10/926,819, 10/782,020, 12/032,479, 10/783,417, 10/782,096, 11/657,964, 12/192,904, 11/396,808, 12/166,253, 12/166,239, 12/166,124, 12/166,209, 11/762,886, 12/364,335, 11/763,947, 12/252,453, 12/209,354, 12/491,396 и 12/497,221.

Растения, которые обрабатывают согласно изобретению, являются

гибридными растениями, которые несут в себе свойства гетерозиса или соответственно гибридного эффекта, что приводит в основном к высокому урожаю, улучшенному росту, улучшенному здоровью и лучшей сопротивляемости к биотическим или абиотическим стрессовым факторам. Такие растения обычно получают благодаря тому, что выведенная путем инбридинга родительская линия со стерильной пыльцой (женский гибридный продукт) перекрещивается с другой выведенной путем инбридинга родительской линией со стерильной пыльцой (мужской гибридный продукт). Гибридные семена обычно собирают с растений со стерильной пыльцой и продают предприятию, занимающемуся размножением. Растения со стерильной пыльцой (например, кукурузу) можно иногда получать при механическом удалении мужских половых органов или мужских цветков; однако обычно считают, что стерильность пыльцы основывается на генетических детерминантах в растительном геноме. В этом случае, особенно тогда, когда желательный продукт, который хотят получить от гибридного растения, представляет собой семена, обычно является благоприятным убедиться, что полностью восстановлена фертильность пыльцы в гибридных растениях, которые содержат ответственные за стерильность пыльцы генетические детерминанты. Это может быть достигнуто посредством гарантирования, что мужские партнеры при скрещивании содержат соответствующие гены, восстанавливающие фертильность, которые способны восстановить фертильность пыльцы гибридных растений, которые содержат ответственные за стерильность пыльцы генетические детерминанты. Генетические детерминанты для стерильности пыльцы могут

локализоваться в цитоплазме. Примеры цитоплазматической стерильности пыльцы (CMS), описаны, например, для видов Brassica. Также генетические детерминанты для стерильности пыльцы могут локализоваться в геноме клеточного ядра. Растения со стерильной пыльцой могут также быть получены методами растительной биотехнологии, такой как генная инженерия. Особенно благоприятное средство для получения растений со стерильной пыльцой описано в международной заявке WO 89/10396, при этом, например, одна рибонуклеаза, такая как барназа, селективно экспримируется в покровных клетках тычинок. Фертильность может быть восстановлена посредством экспрессии ингибитора рибонуклеазы, такого как барстар, в покровных клетках.

Растения или сорта растений (которые получены методами растительной биотехнологии, такими как генная инженерия), которые могут обрабатываться согласно изобретению, являются толерантными к гербицидам, т.е. растения, которым была придана толерантность по отношению к одному или нескольким заданным гербицидам. Такие растения могут быть получены или генетической трансформацией или селекцией растений, которые содержат мутацию, придающую такую толерантность к гербицидам.

Растениями, толерантными к гербицидам, являются, например, растения, толерантные к гербициду глифосату, т.е. растения, которым была придана толерантность по отношению к гербициду глифосату или его солям. Толерантность к глифосату растениям может быть придана различными

способами. Так, например, растения, толерантные к глифосату, получают трансформацией растений геном, который кодирует энзим 5-энолпирувилшикимат-3-фосфатсинтазы (EPSPS). Примером таких EPSPS-генов являются AroA-ген (мутант CT7) бактерии *Salmonella typhimurium* (Comai и др., 1983, *Science* 221, 370-371), CP4-ген бактерии *Agrobacterium* sp., (Barry и др., 1992, *Curr. Topics Plant Physiol.* 7, 139-145), гены, которые кодируют одну EPSPS из петунии (Shah и др., 1986, *Science* 233, 478-481), одну EPSPS из томата (Gasser и др., 1988, *J. Biol. Chem.* 263, 4280-4289) или одну EPSPS из элеусина (международная заявка WO 01/66704). Также речь может идти о мутированном EPSPS. Растения, толерантные к глифосату, могут быть также получены в следствие того, что экспримируют ген, который кодирует энзим глифосат-оксидоредуктазы. Растения, толерантные к глифосату, могут быть также получены в следствие того, что экспримируют ген, который кодирует энзим глифосат-ацетилтрансферазы. Растения, толерантные к глифосату, могут также быть получены при селекции растений, которые содержат природные существующие мутации вышеназванных генов. Растения, экспрессирующие гены EPSPS, обеспечивающие толерантность к глифосату, описаны. Растения, экспрессирующие другие гены, обеспечивающие толерантность к глифосату, например, гены декарбоксилазы, описаны.

Другими резистентными к гербицидам растениями являются, например, растения, которым придали толерантность к гербицидам, которые ингибируют энзим глютаминсинтазы, как, например, биалафос,

фосфинотрицин или глуфосинат. Такие растения могут быть получены при экспримировании энзима, который дезактивирует гербицид или мутант энзима глутаминсинтазы, резистентного к ингибированию. Таким действующим дезактивирующим энзимом является, например, энзим, кодирующий фосфинотрицин-ацетилтрансферазу (как, например, бар- или пат-белок из рода стрептомицетов). Растения, которые экспримируют экзогенную фосфинотрицин-ацетилтрансферазу, описаны.

Другими толерантными к гербицидам растениями являются также растения, которым придали толерантность к гербицидам, ингибирующим энзим гидроксифенилпируватдиоксигеназы (HPPD). Гидроксифенилпируватдиоксигеназы означают энзимы, которые катализируют реакцию, превращающую пара-гидроксифенилпируват (HPP) в гомогентизат. Растения, толерантные, по отношению к HPPD-блокаторам, можно трансформировать геном, который кодирует природный резистентный HPPD-энзим, или геном, который кодирует мутированный и химерный HPPD-энзим, как описано в международных заявках WO 96/38567, WO 99/24585, WO 99/24586, WO 2009/144079, WO 2002/046387 или патенте США US 6,768,044. Толерантность к HPPD-блокаторам также может быть достигнута посредством трансформации растений генами, кодирующими определенные энзимы, которые обеспечивают образование гомогентизата, несмотря на ингибирование природного HPPD-энзима HPPD-блокатором. Такие растения описаны в международных заявках WO 99/34008 и WO 02/36787. Толерантность растений по отношению к HPPD-блокаторам можно также улучшить в

результате того, что растения дополнительно к гену, который кодирует энзим, толерантный к HPPD, трансформируют геном, который кодирует энзим префенатдегидрогеназы, как описано в международной заявке WO 2004/024928. Кроме того, растения можно сделать еще более устойчивыми к HPPD-блокаторам посредством введения в их геном гена, который кодирует энзим, который метаболизирует или разрушает HPPD-блокаторы, такой как энзим CYP450 (см. международные заявки WO 2007/103567 и WO 2008/150473).

Другие устойчивые к гербицидам растения представляют собой растения, которым придали толерантность по отношению к блокаторам ацетолактатсинтазы (ALS). К известным ALS-блокаторам относят, например, сульфонилмочевину, имидазолинон, триазолопиримидин, пиримидинилокси(тио)бензоат и/или сульфониламинокарбонилтриазиноновые гербициды. Известно, что различные мутации в энзиме ALS (известном также как синтаза ацетогидроксикислоты, AHAS) придают толерантность к различным гербицидам или группам гербицидов, как например описано в Tranel и Wright (Weed Science 2002, 50, 700-712). Получение растений, толерантных к сульфонилмочевине и растений, толерантных к имидазолинону, описано. Другие толерантные к сульфонилмочевине и имидазолинону растения также описаны.

Другие растения, которые являются толерантными к сульфонилмочевине и/или к имидазолинону, могут быть получены индуцированным мутагенезом, селекцией клеточных культур в присутствии гербицида или

мутационным разведением (см., например, для сои US 5,084,082, для риса WO 97/41218, для сахарной свеклы US 5,773,702 и WO 99/057965, для салата US 5,198,599 или для подсолнечника WO 01/065922).

Растения или виды растений (которые были получены методами растительной биотехнологии, такими как генная инженерия), которые, при необходимости, согласно изобретению могут подвергаться обработке, являются толерантными к абиотическим стрессовым факторам. Такие растения могут быть получены генетической трансформацией или селекцией растений, которые содержат мутацию, придающую такую резистентность к стрессам. К особенно полезным растениям с устойчивостью к стрессам относят следующие:

- a. растения, которые содержат один трансген, который может снизить экспрессию и/или активность гена для поли(ADP-рибоза)полимераза (PARP) в клетках растений или растениях.
- b. растения, которые содержат один трансген, способствующий толерантности к стрессам, который может ограничить экспрессию и/или активность PARG кодирующего гена растений или растительных клеток;
- c. растения, которые содержат один трансген способствующий толерантности к стрессам, который кодирует в растениях функциональный фермент способный к синтезу никотинамидадениндинуклеотид-селвидж-биосинтеза, в том числе, никотинамидаза,

никотинатфосфорибосилтрансфераза, ниацинмононуклеотидаденил-трансфераза, никотионамидадениндинуклеотидсинтетаза или никотионамидфосфорибосилтрансфераза.

Растения или сорта растений (которые были получены методами растительной биотехнологии, такими как генная инженерия), которые, при необходимости, можно обрабатывать согласно изобретению, обнаруживают измененное количество, качество и/или стабильность при хранении продукции урожая и/или измененные свойства определенных составных частей продукции урожая, как, например:

1) Трансгенные растения, синтезирующие модифицированный крахмал, который изменен по своим химико-физическим качествам, особенно относительно содержания амилозы или соотношения амилоза/амилопектин, степени разветвления, средней длины цепи, размещения боковой цепи, свойств вязкости, прочности геля, величины размера зерен и/или морфологии размера зерен в сравнении с синтезированным крахмалом в клетках дикорастущих растений или в дикорастущих растениях таким образом, что он лучше подходит для известного применения.

2) Трансгенные растения, синтезирующие некрахмально-углеводные полимеры, или некрахмально-углеводные полимеры, которые изменяют свойства по сравнению с дикорастущими растениями без генетических модификаций. Примерами являются растения, которые производят полифруктозу, особенно, типа инулинов и леванов, растения, которые

производят альфа-1,4-глюкан, растения, которые производят альфа-1,6-разветвленный альфа-1,4-глюкан, и растения, которые производят альтернан.

3) Трансгенные растения, которые производят гиалуронан.

4) Трансгенные растения или гибридные растения, такие как лук, с определенными свойствами, такими как «высокое содержание растворимых твердых веществ» (,high soluble solids content'), низкая острота (,low pungency', LP) и/или длительное хранение (,long storage', LS).

Растения или сорта растений (которые были получены методами растительной биотехнологии, такими как генная инженерия), которые также могут быть обработаны согласно изобретению, являются растениями, как растения хлопчатника с измененными свойствами волокна. Такие растения могут быть получены генетической трансформацией или селекцией растений, которые содержат мутацию, придающую такие измененные свойства волокна; к ним относятся:

a) Растения, такие как растения хлопчатника, которые содержат измененную форму генов целлюлозосинтазы,

b) Растения, такие как растения хлопчатника, которые содержат измененную форму *gsu2*- или *gsu3*-гомологических нуклеиновых кислот, такие как растения хлопчатника с повышенной экспрессией сахарозофосфатсинтазы;

- c) Растения, такие как растения хлопчатника, с повышенной экспрессией сахарозосинтазы;
- d) Растения, такие как растения хлопчатника, у которых время регулируемого прохода плазмодесм изменяется в основании клеток волокна, например, при регулируемом снижении волоконселективной  $\beta$ -1,3-глюканазы;
- e) Растения, такие как растения хлопчатника с волокнами с измененной реакционной способностью, например, с помощью экспрессии гена N-ацетилглюкозаминтрансферазы, в том числе, также podC, и генов хитинсинтазы.

Растения или сорта растений (которые были получены методами растительной биотехнологии, такими как генная инженерия), которые также могут быть обработаны согласно изобретению, являются растениями, такие как рапс или растения, родственные растениям рода Brassica с измененными свойствами состава масла. Такие растения могут быть получены генетической трансформацией или селекцией растений, которые содержат мутацию, придающую такие измененные свойства масла; к ним относятся:

- a) Растения, такие как рапсовые растения, которые вырабатывают масло с высоким содержанием олеиновой кислоты;
- b) Растения, такие как рапсовые растения, которые вырабатывают

масло с низким содержанием линоленовой кислоты.

- с) Растения, такие как рапсовые растения, которые вырабатывают масло с низким содержанием насыщенной жирной кислоты.

Растения или сорта растений (которые могут быть получены методами биотехнологии растений, такими как генная инженерия), которые также могут быть обработаны согласно изобретению, представляют собой растения, такие как картофель, которые являются устойчивыми к вирусам, например, к картофельному вирусу Y (трансформант SY230 и SY233 от Tesporlant, Аргентина), или которые устойчивы к таким болезням, как фитофтороз и альтернариоз (potato late blight) (например, ген RB), или которые демонстрируют пониженную сладость, индуцированную холодом (несущие гены Nt-Inh, II-INV), или которые проявляют карликовый фенотип (ген оксидазы A-20).

Растения или сорта растений (которые были получены методами растительной биотехнологии, такими как генная инженерия), которые также могут быть обработаны согласно изобретению, являются растениями, такими как рапс или растения, родственные растениям рода Brassica с измененными свойствами осыпания семян (seed shattering). Такие растения могут быть получены генетической трансформацией или селекцией растений, которые содержат мутацию, придающую такие измененные свойства, и охватывают растения, такие как рапс с замедленным или уменьшенным осыпанием семян.

Особенно полезными трансгенными растениями, которые могут быть обработаны согласно изобретению, являются растения с трансформантом или комбинациями трансформантов, которые в США в Службе инспекции здоровья животных и растений (APHIS) Министерства сельского хозяйства США (USDA) являются объектом выданных или находящихся на рассмотрении ходатайств о нерегулируемом статусе. Информацию об этом можно в любое время получить в APHIS (4700 River Road Riverdale, MD 20737, США), например, через веб-сайт [http://www.aphis.usda.gov/brs/not\\_reg.html](http://www.aphis.usda.gov/brs/not_reg.html). На дату подачи данной заявки ходатайства со следующей информацией были либо выданы, либо находились на рассмотрении в APHIS:

- Ходатайство: Идентификационный номер ходатайства. Техническое описание трансформанта можно найти в отдельном документе ходатайства, доступном в APHIS на веб-сайте по номеру ходатайства. Данные описания раскрыты здесь посредством ссылки.
- Расширение ходатайства: Ссылка на более раннее ходатайство с просьбой о расширении или продлении.
- Учреждение: Имя лица, подающего ходатайство.
- Регулируемый товар: соответствующие виды растений.
- Трансгенный фенотип: свойство („Trait“), придаваемое растению в результате трансформации.

– Трансформант или линия трансформации: название трансформанта или трансформантов (иногда называемых линией(ями)), для которых испрашивается нерегулируемый статус.

– Документы APHIS: различные документы, опубликованные APHIS в отношении ходатайства или которые могут быть получены из APHIS по запросу.

Особенно полезные трансгенные растения, которые можно обрабатывать согласно изобретению, являются растениями с одним или несколькими генами, которые кодируют один или несколько токсинов, являются трансгенными растениями, которые предлагаются под следующими торговыми названиями: YIELD GARD® (например, кукуруза, хлопчатник, соя-бобы), KnockOut® (например, кукуруза), BiteGard® (например, кукуруза), BT-Xtra® (например, кукуруза), StarLink® (например, кукуруза), Bollgard® (хлопчатник), Nucotn® (хлопчатник), Nucotn 33B® (хлопчатник), NatureGard® (например, кукуруза), Protecta® и NewLeaf® (картофель). Толерантными к гербицидам растениями, которые следует упомянуть, являются, например, сорта кукурузы, хлопка и сои, которые предлагаются под следующими торговыми названиями: Roundup Ready® (толерантность к глифосату, например, кукуруза, хлопчатник, соя-бобы), Liberty Link® (толерантность к фосфинотрицину, например, рапс), IMI® (толерантность к имидазолинону) и SCS® (толерантность к сульфонилмочевине), например, кукуруза. К устойчивым к гербицидам растениям (традиционно выращиваемым на толерантность к гербицидам растениям), которые следует упомянуть, относятся продаваемые под названием Clearfield®

сорта (например, кукуруза).

Далее следующие примеры подробнее раскрывают настоящее изобретение.

## ПРИМЕРЫ

Настоящее изобретение далее более подробно проиллюстрировано с помощью следующих примеров, которые никоим образом не ограничивают объем настоящего изобретения.

### А. Примеры синтеза

Метил-[[4-бром-5-(3,4-дифторфенил)-1-(пиразин-2-ил)-1H-пиразол-3-ил]окси]ацетат (**I-15**): К раствору 0,20 г (0,54 ммоль) 4-бром-5-(3,4-дифторфенил)-1-(пиразин-2-ил)-1H-пиразол-3-ола в 8 мл диметилформамида прибавляли 0,27 г (0,81 ммоль) карбоната цезия, перемешивали при комнатной температуре 10 мин, добавляли 0,10 г (0,65 ммоль) метилбромацетата и перемешивали при комнатной температуре в течение одного часа. Фильтровали, фильтрат концентрировали в вакууме, остаток растворяли в воде и несколько раз экстрагировали дихлорметаном, объединенные органические фазы сушили над сульфатом натрия и удаляли растворитель в вакууме. После очистки колоночной хроматографией на силикагеле с гептаном/этилацетатом получали 0,23 г (93% от теории) продукта с  $m/z=427$  (50)  $[M^+]$ , 425 (50)  $[M^+]$ .  $^1H$ -ЯМР (400 МГц,  $CDCl_3$ ,  $\delta$ , м.д.): 8.95 (м, 1H), 8.38 (м, 1H), 8.06 (м, 1H), 7.22-7.17 (м, 2H), 7.10-7.05 (м, 1H), 4.97 (с, 2H), 3.84 (с, 3H).

*Синтез исходных соединений:*

- а) *4-бром-5-(3,4-дифторфенил)-1-(пиразин-2-ил)-1H-пиразол-3-ол*: В атмосфере аргона к 0,50 г (1,07 ммоль) 2-[3-(бензилокси)-4-бром-5-(3,4-дифторфенил)-1H-пиразол-1-ил]пиразина добавляли 18,50 г (162,25 ммоль) трифторуксусной кислоты и перемешивали при кипячении с возвратом флегмы в течение одного часа. Избыток трифторуксусной кислоты удаляли в вакууме, остаток растворяли в дихлорметане и растворитель удаляли в вакууме. Получали 0,45 г (95% от теории) бесцветного твердого вещества  $m/z=355$  (50) [ $M^+$ ], 353 (50) [ $M^+$ ].
- б) *2-[3-(бензилокси)-4-бром-5-(3,4-дифторфенил)-1H-пиразол-1-ил]пиразин*: К раствору 0,56 г (1,50 ммоль) 2-[3-(бензилокси)-5-(3,4-дифторфенил)-1H-пиразол-1-ил]пиразина в 8 мл ДМФА добавляли 0,27 г (1,50 ммоль) N-бромсукцинимиды и перемешивали при комнатной температуре в течение одного часа. Удаляли растворитель в вакууме, остаток растворяли в воде и несколько раз экстрагировали дихлорметаном, объединенные органические фазы сушили над сульфатом натрия и удаляли растворитель в вакууме. После очистки колоночной хроматографией на силикагеле с гептаном/этилацетатом получали 0,50 г (71% от теории) продукта с  $m/z$  (%) = 445 (50) [ $M^+$ ], 443 (50) [ $M^+$ ].  $^1H$ -ЯМР (400 МГц,  $CDCl_3$ ,  $\delta$ , м.д.): 9.00 (м, 1H), 8.38 (м, 1H), 8.07 (м, 1H), 7.56-7.52 (м, 2H), 7.44-7.36 (м, 3H), 7.22-7.16 (м, 2H), 7.08-7.05 (м, 1H), 5.44 (с, 2H).
- с) *2-[3-(бензилокси)-5-(3,4-дифторфенил)-1H-пиразол-1-ил]пиразин*: В атмосфере аргона к раствору 1,50 г (3,97 ммоль) 2-[3-(бензилокси)-

5-йод-1H-пиразол-1-ил]пиразина в 45 мл диоксана последовательно добавляли 1,14 г (4,76 ммоль) 2-(3,4-дифторфенил)-4,4,5,5-тетраметил-1,3,2-диоксаборолана, 0,038 г (0,20 ммоль) йодида меди(I), 2,58 г (7,93 ммоль) карбоната цезия, 4,5 мл воды и 0,23 г (0,20 ммоль) тетраakis(трифенилфосфин)палладия, и реакционную смесь перемешивали при 70°C в течение 3 часов. Растворитель удаляли в вакууме, остаток растворяли в воде/этилацетате, водную фазу несколько раз экстрагировали этилацетатом, объединенные органические фазы сушили над сульфатом натрия и растворитель удаляли в вакууме. После очистки колоночной хроматографией на силикагеле с гептаном/этилацетатом получали 0,58 г (38%) желтоватого твердого вещества с  $m/z$  (%) = 365 [ $M^+$ ].  $^1H$ -ЯМР (400 МГц,  $CDCl_3$ ,  $\delta$ , м.д.): 9.03 (м, 1H), 8.39 (м, 1H), 8.12 (м, 1H), 7.52-7.49 (м, 2H), 7.43-7.34 (м, 3H), 7.18-7.11 (м, 2H), 7.06-7.02 (м, 1H), 6.03 (с, 1H), 5.36 (с, 2H).

- d) *2-[3-(бензилокси)-5-йод-1H-пиразол-1-ил]пиразин*: В атмосфере аргона к раствору 5,00 г (15,86 ммоль) 2-[3-(бензилокси)-1H-пиразол-1-ил]пиразина в 150 мл сухого тетрагидрофурана при -78 °C по каплям добавляли раствор 2,21 г (20,61 ммоль) диизопропиламида лития (2-молярный раствор в тетрагидрофуране) в 50 мл тетрагидрофурана и перемешивали в течение 0,5 часа при -78°C. Добавляли по каплям раствор 5,23 г (20,61 ммоль) йода в 50 мл тетрагидрофурана и перемешивали при -78°C еще в течение часа. Смеси давали нагреться до комнатной температуры, добавляли

воду и несколько раз экстрагировали этилацетатом. Объединенные органические фазы сушили над сульфатом натрия и растворитель удаляли в вакууме. После очистки колоночной хроматографией на силикагеле с гептаном/этилацетатом получали 1,84 г (31%) бесцветного твердого вещества с  $m/z$  (%) = 379 [ $M^+$ ].  $^1H$ -ЯМР (400 МГц,  $CDCl_3$ ,  $\delta$ , м.д.): 9.13 (м, 1H), 8.50 (м, 1H), 8.42 (м, 1H), 7.48-7.45 (м, 2H), 7.42-7.32 (м, 3H), 6.26 (с, 1H), 5.30 (с, 2H).

- е) *2-[3-(бензилокси)-1H-пиразол-1-ил]пиразин*: В атмосфере аргона к раствору 6,87 г (59,99 ммоль) 2-хлорпиразина в 60 мл ДМФА, последовательно добавляли 24,88 г (76,35 ммоль) карбоната цезия, 10,00 г (54,54 ммоль) 3-(бензилокси)-1H-пиразола растворенного в 40 мл ДМФА, 1,45 г (7,62 ммоль) йодида меди(I) и реакционную смесь перемешивали при 120°C в течение 5 часов. Фильтровали, промывали дихлорметаном и растворитель удаляли в вакууме. Остаток растворяли в водном растворе хлорида аммония и несколько раз экстрагировали дихлорметаном, объединенные органические фазы сушили над сульфатом натрия и удаляли растворитель в вакууме. Получали 17,00 г (98%) зеленоватого твердого вещества  $m/z=253$  [ $M^+$ ].  $^1H$ -ЯМР (400 МГц,  $CDCl_3$ ,  $\delta$ , м.д.): 9.17 (м, 1H), 8.38 (м, 1H), 8.31 (д, 1H), 8.28 (м, 1H), 7.52-7.50 (м, 2H), 7.42-7.34 (м, 3H), 6.02 (д, 1H), 5.35 (с, 2H).

*Пиридин-2-илметил-{{4-бром-5-(6-фторпиридин-3-ил)-1-(пиразин-2-ил)-1H-пиразол-3-ил}окси}ацетат (I-70)*: К 0,04 г (0,36 ммоль) (пиридин-2-ил)метанола в 3,0 мл дихлорметана последовательно добавляли 0,10 г

(0,25 ммоль) {[4-бром-5-(6-фторпиридин-3-ил)-1-(пиразин-2-ил)-1H-пиразол-3-ил]окси}уксусной кислоты (I-49), 0,05 г (0,33 ммоль) 1H-бензотриазол-1-ола, 0,06 г (0,33 ммоль) N-(3-диметиламинопропил)-N'-этилкарбодиимид гидрохлорида и на кончике шпателя N,N-диметилпиридин-4-амин и перемешивали в течение часа при комнатной температуре. В реакционную смесь добавляли воду и дихлорметан, несколько раз экстрагировали водную фазу дихлорметаном, сушили объединенные органические фазы над сульфатом натрия и удаляли растворитель в вакууме. Посредством очистки выделенного неочищенного продукта колоночной хроматографией на силикагеле с градиентом гептан/этилацетат получали 0,08 г (65% от теории) продукта с  $m/z$  (%) = 487 (50)  $[M^+]$ , 485 (50)  $[M^+]$ .  $^1H$ -ЯМР (600 МГц,  $CDCl_3$ ,  $\delta$ , м.д.): 9.01 (м, 1H), 8.61 (м, 1H), 8.39 (м, 1H), 8.22 (м, 1H), 7.99 (м, 1H), 7.85-7.81 (м, 1H), 7.69-7.65 (м, 1H), 7.39 (м, 1H), 7.26-7.22 (м, 1H), 7.03-7.00 (м, 1H), 5.39 (с, 2H), 5.09 (с, 2H).

*{[4-бром-5-(6-фторпиридин-3-ил)-1-(пиразин-2-ил)-1H-пиразол-3-ил]окси}уксусная кислота (I-49):* К 0,77 г (1,82 ммоль) этил-{[4-бром-5-(6-фторпиридин-3-ил)-1-(пиразин-2-ил)-1H-пиразол-3-ил]окси}ацетата (I-52) в 7 мл тетрагидрофурана добавляли раствор 0,13 г (5,47 ммоль) гидроксида лития в 10 мл воды и перемешивали 2 ч при температуре 65°C. Удаляли растворитель в вакууме, остаток растворяли водой и дважды экстрагировали дихлорметаном, доводили водную фазу до pH = 2-3 с помощью 2 М соляной кислоты и дважды экстрагировали дихлорметаном. Объединенные органические фазы сушили над сульфатом натрия и

растворитель удаляли в вакууме. Получали бесцветное твердое вещество (0,58 г, 76% от теории).  $^1\text{H}$ -ЯМР (600 МГц,  $\text{DMSO-d}_6$ ,  $\delta$ , м.д.): 13.17 (уш.с, 1H), 9.00 (м, 1H), 8.52 (м, 1H), 8.34 (м, 1H), 8.20 (м, 1H), 8.11-8.08 (м, 1H), 7.33-7.31 (м, 1H), 4.97 (с, 2H).

*Этил-[[4-бром-5-(6-фторпиридин-3-ил)-1-(пиразин-2-ил)-1H-пиразол-3-ил]окси]ацетат (I-52)*: К раствору 0,81 г (2,36 ммоль) этил-[[5-(6-фторпиридин-3-ил)-1-(пиразин-2-ил)-1H-пиразол-3-ил]окси]ацетата в 5 мл ДМФА добавляли 0,50 г (2,83 ммоль) N-бромсукцинимиды и перемешивали при комнатной температуре в течение десяти часов. Удаляли растворитель в вакууме, остаток растворяли в воде и несколько раз экстрагировали дихлорметаном, объединенные органические фазы сушили над сульфатом натрия и удаляли растворитель в вакууме. После очистки колоночной хроматографией на силикагеле с градиентом гептан/этилацетат получали 0,92 г (87% от теории) продукта с  $m/z$  (%) = 424 (50) [ $\text{M}^+$ ], 422 (50) [ $\text{M}^+$ ].  $^1\text{H}$ -ЯМР (600 МГц,  $\text{CDCl}_3$ ,  $\delta$ , м.д.): 9.05 (м, 1H), 8.37 (м, 1H), 8.23 (м, 1H), 7.99 (м, 1H), 7.86-7.82 (м, 1H), 7.03-7.00 (м, 1H), 4.96 (с, 2H), 4.31 (к, 2H), 1.34 (т, 3H).

*Синтез исходных соединений:*

- а) *Этил-[[5-(6-фторпиридин-3-ил)-1-(пиразин-2-ил)-1H-пиразол-3-ил]окси]ацетат*: К раствору 1,58 г (5,84 ммоль) 5-(6-фторпиридин-3-ил)-1-(пиразин-2-ил)-1H-пиразол-3-ола в 10 мл диметилформамида прибавляли 2,85 г (8,75 ммоль) карбоната цезия, перемешивали при комнатной температуре в течение 10 минут, добавляли 1,17 г (7,00

ммоль) этилбромацетата и перемешивали при 65 °С в течение еще двух часов. Фильтровали, фильтрат концентрировали в вакууме, остаток растворяли в воде и несколько раз экстрагировали дихлорметаном, объединенные органические фазы сушили над сульфатом натрия и удаляли растворитель в вакууме. После очистки колоночной хроматографией на силикагеле с гептаном/этилацетатом получали 1,53 г (73% от теории) продукта с  $m/z = 344 [M^+]$ .  $^1H$ -ЯМР (600 МГц,  $CDCl_3$ ,  $\delta$ , м.д.): 9.08 (м, 1H), 8.37 (м, 1H), 8.23 (м, 1H), 8.02 (м, 1H), 7.81-7.78 (м, 1H), 6.96-6.94 (м, 1H), 6.13 (с, 1H), 4.91 (с, 2H), 4.31 (к, 2H), 1.33 (т, 3H).

b) *5-(6-фторпиридин-3-ил)-1-(пиразин-2-ил)-1H-пиразол-3-ол*: К раствору 3,55 г (8,28 ммоль) 3-(6-фторпиридин-3-ил)-N'-(пиразин-2-ил)проп-2-ингидазида в 7 мл ацетонитрила добавляли 0,08 г (0,66 ммоль) йодида меди (I) и перемешивали при температуре 80 °С в течение двух часов. После очистки колоночной хроматографией на силикагеле с гептаном/этилацетатом получали 1,59 г (75% от теории) продукта с  $m/z = 258 [M^+]$ .  $^1H$ -ЯМР (400 МГц,  $DMCO-d_6$ ,  $\delta$ , м.д.): 10.82 (с, 1H), 9.00 (м, 1H), 8.46 (м, 1H), 8.29 (м, 1H), 8.17 (м, 1H), 8.02-7.97 (м, 1H), 7.32-7.28 (м, 1H), 6.18 (с, 1H).

c) *3-(6-фторпиридин-3-ил)-N'-(пиразин-2-ил)проп-2-ингидазид*: К раствору 3,00 г (16,35 ммоль) 3-(6-фторпиридин-3-ил)проп-2-иновой кислоты в 20 мл тетрагидрофурана последовательно добавляли 2,07 г (18,80 ммоль) 2-гидразинопиразина и 8,27 г (81,76 ммоль) триэтиламина. Добавляли по каплям 15,61 г (24,53 ммоль)

ангидрида пропан-фосфоновой кислоты (ТЗР, 50%-ный раствор в тетрагидрофуране) и перемешивали при комнатной температуре в течение часа. Реакционную смесь выливали в воду, несколько раз экстрагировали этилацетатом, сушили объединенные органические фазы над сульфатом натрия, удаляли растворитель в вакууме и получали 3,55 г (51% от теории) маслянистого продукта (чистота ВЭЖХ / МС = 60%,  $m/z = 258 [M^+]$ ), который без очистки подвергали дальнейшему взаимодействию.

d) *3-(6-фторпиридинпирозин-2-ил)проп-2-иновая кислота*: В атмосфере аргона к 9,20 г (41,26 ммоль) 2-фтор-5-иодпиридина в 105 мл сухого тетрагидрофурана последовательно добавляли 2,89 г (41,26 ммоль) пропиоловой кислоты, 0,58 г (0,83 ммоль) дихлорида бис(трифенилфосфин)палладия(II), 0,31 г (1,65 ммоль) йодида меди(I) и 14,61 г (144,41 ммоль) диизопропиламина. Смесь перемешивали при комнатной температуре в течение 2 часов, реакционную смесь выливали в воду, добавляли 30 мл 2 н. соляной кислоты и несколько раз экстрагировали этилацетатом. Объединенные органические фазы сушили над сульфатом магния и концентрировали в вакууме. К остатку добавляли диэтиловый эфир, перемешивали на ультразвуковой бане в течение 10 мин, фильтровали и растворитель удаляли в вакууме. Получали 6,25 г (78% от теории) продукта с  $m/z = 166 [M^+]$ .  $^1\text{H}$ -ЯМР (600 МГц,  $\text{DMSO-d}_6$ ,  $\delta$ , м.д.): 14.00 (уш.с, 1H), 8.57 (м, 1H), 8.32-8.28 (м, 1H), 7.35-7.32 (м, 1H).

*Метил-(2R)-2-[[4-бром-1-(пиразин-2-ил)-5-(пиридазин-4-ил)-1H-пиразол-3-ил]окси]пропаноат (I-31)*: К раствору 0,71 г (1,75 ммоль) метил-(2R)-2-(1-(пиразин-2-ил)-5-(пиридазин-4-ил)-1H-пиразол-3-ил]окси]пропаноата в 8 мл ДМФА добавляли 0,37 г (2,10 ммоль) N-бромсукцинимиды и перемешивали при комнатной температуре в течение трех часов. Удаляли растворитель в вакууме, остаток растворяли в воде и несколько раз экстрагировали дихлорметаном, объединенные органические фазы сушили над сульфатом натрия и удаляли растворитель в вакууме. После очистки колоночной хроматографией на силикагеле с градиентом гептан/этилацетат получали 0,14 г (20% от теории) продукта с  $m/z$  (%) = 405 (50) [ $M^+$ ], 407 (50) [ $M^+$ ] и удельным углом вращения  $[\alpha] = +56^\circ$ .  $^1H$ -ЯМР (400 МГц,  $CDCl_3$ ,  $\delta$ , м.д.): 9.32 (м, 1H), 9.14 (м, 1H), 9.08 (м, 1H), 8.40 (м, 1H), 7.94 (м, 1H), 7.55 (м, 1H), 5.26 (к, 1H), 3.83 (с, 3H), 1.74 (д, 3H).

*Метил-(2R)-2-[[4-циан-1-(пиразин-2-ил)-5-(пиридазин-4-ил)-1H-пиразол-3-ил]окси]пропаноат (I-32)*: Смесь, состоящую из 0,40 г (0,79 ммоль) метил-(2R)-2-[[4-бром-1-(пиразин-2-ил)-5-(пиридазин-4-ил)-1H-пиразол-3-ил]окси]пропаноата (I-31), 0,09 г (0,75 ммоль) цианида цинка и 0,09 г (0,08 ммоль) тетраakis(трифенилфосфин)палладия в 10 мл диметилацетамида нагревали в микроволновой печи при  $180^\circ C$  в течение 40 минут в атмосфере аргона. Удаляли растворитель в вакууме, остаток растворяли в воде/дихлорметане, водную фазу несколько раз экстрагировали дихлорметаном, объединенные органические фазы сушили над сульфатом натрия и удаляли растворитель в вакууме. После очистки колоночной хроматографией на силикагеле с градиентом

гептан/этилацетат получали 0,21 г (70% от теории) продукта с  $m/z$  (%) = 352 [ $M^+$ ] и удельным углом вращения  $[\alpha] = +54^\circ$ .  $^1H$ -ЯМР (400 МГц,  $CDCl_3$ ,  $\delta$ , м.д.): 9.39 (м, 1H), 9.15 (м, 1H), 9.12 (м, 1H), 8.54 (м, 1H), 8.05 (м, 1H), 7.64 (м, 1H), 5.29 (к, 1H), 3.83 (с, 3H), 1.74 (д, 3H).

*N*-Аллил-2{[4-бром-5-(3-дифторфенил)-1-(пиразин-2-ил)-1H-пиразол-3-ил]окси} ацетамид (II-01): В атмосфере аргона к раствору 0,09 г (0,23 ммоль) {[4-бром-5-(3-фторфенил)-1-(пиразин-2-ил)-1H-пиразол-3-ил]окси}уксусной кислоты в 5 мл тетрагидрофурана последовательно добавляли 0,01 г (0,25 ммоль) проп-2-ен-1-амина и 0,05 г (0,28 ммоль) гидрохлорида *N*-(3-диметиламинопропил)-*N'*-этилкарбодиимида в 5 мл дихлорметана и перемешивали при комнатной температуре в течение четырех часов. Удаляли растворитель в вакууме, остаток растворяли в дихлорметане, добавляли 2 н. соляную кислоту и несколько раз экстрагировали дихлорметаном, объединенные органические фазы сушили над сульфатом натрия и удаляли растворитель в вакууме. После очистки колоночной хроматографией на силикагеле с гептаном/этилацетатом получали 0,03 г (27% от теории) бесцветного масла с  $m/z$  (%) = 434 (50) [ $M^+$ ], 432 (50) [ $M^+$ ].  $^1H$ -ЯМР (400 МГц,  $CDCl_3$ ,  $\delta$ , м.д.): 8.94 (м, 1H), 8.41 (м, 1H), 8.10 (м, 1H), 7.41-7.36 (м, 1H), 7.16-7.05 (м, 2H), 6.62 (уш.с, 1H), 5.94-5.87 (м, 1H), 5.30-5.25 (м, 1H), 5.20-5.17 (м, 1H), 4.93 (с, 2H), 4.05-4.01 (м, 1H).

ЯМР-данные выбранных примеров:

Данные  $^1\text{H}$ -ЯМР выбранных примеров соединений общей формулы (I) представлены двумя различными способами, а именно (а) классическая оценка и интерпретация ЯМР или (b) в виде списков  $^1\text{H}$ -ЯМР-пигов в соответствии с методом, описанным ниже.

а) Классическая интерпретация ЯМР

Пример I-08:

$^1\text{H}$ -ЯМР (400 МГц,  $\text{CDCl}_3$ ,  $\delta$ , м.д.): 9.03 (м, 1H), 8.52 (м, 1H), 8.39-8.37 (м, 2H), 7.98 (м, 1H), 7.51-7.48 (м, 1H), 5.27 (к, 1H), 3.82 (с, 3H), 1.73 (д, 3H).

Пример I-15:

$^1\text{H}$ -ЯМР (400 МГц,  $\text{CDCl}_3$ ,  $\delta$ , м.д.): 8.95 (м, 1H), 8.38 (м, 1H), 8.06 (м, 1H), 7.22-7.17 (м, 2H), 7.10-7.05 (м, 1H), 4.97 (с, 2H), 3.84 (с, 3H).

Пример I-27:

$^1\text{H}$ -ЯМР (400 МГц,  $\text{CDCl}_3$ ,  $\delta$ , м.д.): 9.01 (м, 1H), 8.82 (д, 2H), 8.33 (м, 1H), 7.90 (м, 1H), 7.32 (т, 1H), 5.29 (к, 1H), 3.80 (с, 3H), 1.72 (д, 3H).

Пример I-31:

$^1\text{H}$ -ЯМР (400 МГц,  $\text{CDCl}_3$ ,  $\delta$ , м.д.): 9.32 (м, 1H), 9.14 (м, 1H), 9.08 (м, 1H), 8.40 (м, 1H), 7.94 (м, 1H), 7.55 (м, 1H), 5.26 (к, 1H), 3.83 (с, 3H), 1.74 (д, 3H).

Пример I-32:

$^1\text{H}$ -ЯМР (400 МГц,  $\text{CDCl}_3$ ,  $\delta$ , м.д.): 9.39 (м, 1H), 9.15 (м, 1H), 9.12 (м, 1H), 8.54 (м, 1H), 8.05 (м, 1H), 7.64 (м, 1H), 5.29 (к, 1H), 3.83 (с, 3H), 1.74 (д, 3H).

Пример I-36:

$^1\text{H}$ -ЯМР (400 МГц,  $\text{CDCl}_3$ ,  $\delta$ , м.д.): 9.03 (м, 1H), 8.37 (м, 1H), 8.24 (м, 1H), 7.99 (м, 1H), 7.86-7.82 (м, 1H), 7.03-7.00 (м, 1H), 5.27 (к, 1H), 3.82 (с, 3H), 1.73 (д, 3H).

Пример I-49:

$^1\text{H}$ -ЯМР (600 МГц,  $\text{DMSO-d}_6$ ,  $\delta$ , м.д.): 13.17 (уш.с, 1H), 9.00 (м, 1H), 8.52 (м, 1H), 8.34 (м, 1H), 8.20 (м, 1H), 8.11-8.08 (м, 1H), 7.33-7.31 (м, 1H), 4.97 (с, 2H).

Пример I-52:

$^1\text{H}$ -ЯМР (600 МГц,  $\text{CDCl}_3$ ,  $\delta$ , м.д.): 9.05 (м, 1H), 8.37 (м, 1H), 8.23 (м, 1H), 7.99 (м, 1H), 7.86-7.82 (м, 1H), 7.03-7.00 (м, 1H), 4.96 (с, 2H), 4.31 (к, 2H), 1.34 (т, 3H).

Пример I-54:

$^1\text{H}$ -ЯМР (400 МГц,  $\text{CDCl}_3$ ,  $\delta$ , м.д.): 9.1 (с, 1H), 8.9 (д, 2H), 8.4 (с, 1H), 7.9 (с, 1H), 7.4 (м, 1H), 5.2 (к, 1H), 1.7 (д, 3H).

Пример I-55:

$^1\text{H}$ -ЯМР (400 МГц,  $\text{CDCl}_3$ ,  $\delta$ , м.д.): 9.1 (с, 1H), 8.7 (д, 2H), 8.5 (с, 1H), 8.1 (с, 1H), 7.4 (м, 1H), 5.4 (к, 1H), 1.8 (д, 3H).

Пример I-70:

$^1\text{H}$ -ЯМР (600 МГц,  $\text{CDCl}_3$ ,  $\delta$ , м.д.): 9.01 (м, 1H), 8.61 (м, 1H), 8.39 (м, 1H), 8.22 (м, 1H), 7.99 (м, 1H), 7.85-7.81 (м, 1H), 7.69-7.65 (м, 1H), 7.39 (м, 1H), 7.26-7.22 (м, 1H), 7.03-7.00 (м, 1H), 5.39 (с, 2H), 5.09 (с, 2H).

Пример I-78:

$^1\text{H}$ -ЯМР (400 МГц,  $\text{CDCl}_3$ ,  $\delta$ , м.д.): 8.18-8.14 (м, 3H), 7.86-7.82 (м, 1H), 7.00-6.97 (м, 1H), 5.23 (к, 1H), 3.79 (с, 3H), 1.70 (д, 3H).

Пример I-80:

$^1\text{H}$ -ЯМР (400 МГц,  $\text{CDCl}_3$ ,  $\delta$ , м.д.): 8.18-8.14 (м, 3H), 7.86-7.82 (м, 1H), 7.00-6.97 (м, 1H), 5.23 (к, 1H), 3.79 (с, 3H), 1.70 (д, 3H).

Пример I-83:

<sup>1</sup>H-ЯМР (400 МГц, ДМСО-d<sub>6</sub>, δ, м.д.): 13.01 (уш.с, 1H), 8.94 (с, 1H), 8.42 (м, 1H), 8.30 (м, 1H), 8.12 (м, 1H), 8.06-8.02 (м, 1H), 7.28-7.25 (м, 1H), 4.88 (с, 2H), 1.56-1.49 (м, 1H), 0.73-0.63 (м, 4H).

Пример I-84:

<sup>1</sup>H-ЯМР (400 МГц, CDCl<sub>3</sub>, δ, м.д.): 9.00 (с, 1H), 8.27 (м, 1H), 8.23 (м, 1H), 7.93 (м, 1H), 7.83-7.78 (м, 1H), 7.00-6.97 (м, 1H), 4.92 (с, 2H), 3.83 (с, 3H), 1.49-1.43 (м, 1H), 0.83-0.79 (м, 2H), 0.76-0.71 (м, 2H).

Пример I-85:

<sup>1</sup>H-ЯМР (400 МГц, CDCl<sub>3</sub>, δ, м.д.): 9.00 (с, 1H), 8.27 (м, 1H), 8.23 (м, 1H), 7.93 (м, 1H), 7.83-7.78 (м, 1H), 7.00-6.97 (м, 1H), 4.90 (с, 2H), 4.29 (к, 2H), 1.48-1.43 (м, 1H), 1.33 (т, 3H), 0.84-0.80 (м, 2H), 0.76-0.71 (м, 2H).

Пример I-86:

<sup>1</sup>H-ЯМР (400 МГц, CDCl<sub>3</sub>, δ, м.д.): 9.04 (с, 1H), 8.22 (м, 2H), 7.95 (с, 1H), 7.81-7.76 (м, 1H), 7.00-6.96 (м, 1H), 5.20 (к, 1H), 1.72 (д, 3H), 1.47-1.40 (м, 1H), 0.90-0.80 (м, 2H), 0.77-0.72 (м, 2H).

Пример I-87:

<sup>1</sup>H-ЯМР (400 МГц, CDCl<sub>3</sub>, δ, м.д.): 8.98 (с, 1H), 8.26 (м, 1H), 8.23 (м, 1H), 7.91 (м, 1H), 7.82-7.78 (м, 1H), 6.99-6.96 (м, 1H), 5.23 (к, 1H), 3.80 (с, 3H), 1.66 (д, 3H), 1.48-1.43 (м, 1H), 0.87-0.82 (м, 2H), 0.74-0.72 (м, 2H).

Пример I-88:

<sup>1</sup>H-ЯМР (400 МГц, CDCl<sub>3</sub>, δ, м.д.): 8.99 (с, 1H), 8.25 (м, 1H), 8.23 (м, 1H), 7.91 (м, 1H), 7.82-7.78 (м, 1H), 6.99-6.96 (м, 1H), 5.20 (к, 1H), 4.30-4.22 (м, 2H), 1.66 (д, 3H), 1.48-1.41 (м, 1H), 1.31 (т, 3H), 0.87-0.84 (м, 2H), 0.75-0.71 (м, 2H).

Пример I-89:

<sup>1</sup>H-ЯМР (400 МГц, CDCl<sub>3</sub>, δ, м.д.): 9.03 (м, 1H), 8.34 (м, 1H), 8.20 (м, 1H), 7.96 (м, 1H), 7.83-7.78 (м, 1H), 7.03-7.00 (м, 1H), 5.25 (к, 1H), 3.82 (с, 3H), 1.72 (д, 3H).

Пример II-01:

<sup>1</sup>H-ЯМР (400 МГц, CDCl<sub>3</sub>, δ, м.д.): 8.94 (м, 1H), 8.41 (м, 1H), 8.10 (м, 1H), 7.41-7.36 (м, 1H), 7.16-7.05 (м, 2H), 6.62 (уш.с, 1H), 5.94-5.87 (м, 1H), 5.30-5.25 (м, 1H), 5.20-5.17 (м, 1H), 4.93 (с, 2H), 4.05-4.01 (м, 1H).

Пример II-02:

$^1\text{H}$ -ЯМР (400 МГц,  $\text{CDCl}_3$ ,  $\delta$ , м.д.): 9.09 (м, 1H), 8.40 (м, 1H), 8.24 (м, 1H), 8.00 (м, 1H), 7.86-7.81 (м, 1H), 7.04-7.01 (м, 2H), 5.31 (к, 1H), 3.68-3.55 (м, 2H), 3.66 (с, 3H), 2.60-2.57 (м, 2H), 1.72 (д, 3H).

Пример II-03:

$^1\text{H}$ -ЯМР (400 МГц,  $\text{CDCl}_3$ ,  $\delta$ , м.д.): 9.10 (м, 1H), 8.41 (м, 1H), 8.24 (м, 1H), 8.01 (м, 1H), 7.86-7.81 (м, 1H), 7.04-7.01 (м, 2H), 5.40 (к, 1H), 4.17-4.10 (м, 2H), 3.78 (с, 3H), 1.75 (д, 3H).

Beispiel II-04:

$^1\text{H}$ -ЯМР (400 МГц,  $\text{CDCl}_3$ ,  $\delta$ , м.д.): 9.09 (м, 1H), 8.40 (м, 1H), 8.24 (м, 1H), 8.00 (м, 1H), 7.86-7.81 (м, 1H), 7.04-7.01 (м, 2H), 5.32 (к, 1H), 4.16-4.08 (м, 2H), 3.67-3.58 (м, 2H), 2.58-2.55 (м, 2H), 1.72 (д, 3H), 1.23 (т, 3H).

Пример II-05:

$^1\text{H}$ -ЯМР (400 МГц,  $\text{CDCl}_3$ ,  $\delta$ , м.д.): 9.09 (м, 1H), 8.39 (м, 1H), 8.24-8.21 (м, 1H), 8.00 (м, 1H), 7.86-7.81 (м, 1H), 7.10-7.00 (м, 2H), 5.33-5.24 (м, 1H), 4.47-4.38 (м, 1H), 3.68/3.66 (2с, 3H), 2.93-2.85 (м, 1H), 2.28-2.19 (м, 1H), 2.04-1.93 (м, 3H), 1.90-1.68 (м, 5H).

Пример II-06:

<sup>1</sup>H-ЯМР (400 МГц, CDCl<sub>3</sub>, δ, м.д.): 9.10 (м, 1H), 8.41 (м, 1H), 8.24 (м, 1H), 8.01 (м, 1H), 7.86-7.81 (м, 1H), 7.04-7.00 (м, 1H), 6.62 (уш.м, 1H), 5.34 (к, 1H), 3.25-3.18 (м, 2H), 1.74 (д, 3H), 1.05-0.95 (м, 1H), 0.54-0.50 (м, 2H), 0.25-0.22 (м, 2H).

Пример II-07:

<sup>1</sup>H-ЯМР (400 МГц, CDCl<sub>3</sub>, δ, м.д.): 9.10 (м, 1H), 8.42 (м, 1H), 8.24 (м, 1H), 8.01 (м, 1H), 7.86-7.81 (м, 1H), 7.08 (уш.т, 1H), 7.04-7.01 (м, 1H), 4.90 (с, 2H), 3.69 (с, 3H), 3.67 (к, 2H), 2.62 (т, 2H).

Пример II-08:

<sup>1</sup>H-ЯМР (400 МГц, CDCl<sub>3</sub>, δ, м.д.): 9.11 (м, 1H), 8.42 (м, 1H), 8.24 (м, 1H), 8.02 (м, 1H), 7.86-7.82 (м, 1H), 7.04-7.00 (м, 2H), 4.96 (с, 2H), 4.18 (д, 2H), 3.80 (с, 3H).

Пример II-09:

<sup>1</sup>H-ЯМР (400 МГц, CDCl<sub>3</sub>, δ, м.д.): 9.10 (м, 1H), 8.41 (м, 1H), 8.23 (м, 1H), 8.01 (м, 1H), 7.86-7.81 (м, 1H), 7.09 (уш.т, 1H), 7.04-7.01 (м, 1H), 4.90 (с, 2H), 4.17 (к, 2H), 3.67 (к, 2H), 2.61 (т, 2H), 1.26 (т, 3H).

Пример II-10:

$^1\text{H}$ -ЯМР (400 МГц,  $\text{CDCl}_3$ ,  $\delta$ , м.д.): 9.11 (м, 1H), 8.41 (м, 1H), 8.24 (м, 1H), 8.02 (м, 1H), 7.86-7.81 (м, 1H), 7.04-7.01 (м, 1H), 6.62 (уш.с, 1H), 4.91 (с, 2H), 3.27 (м, 2H), 1.06-1.02 (м, 1H), 0.58-0.53 (м, 2H), 0.29-0.26 (м, 2H).

Пример II-11:

$^1\text{H}$ -ЯМР (400 МГц,  $\text{CDCl}_3$ ,  $\delta$ , м.д.): 9.10 (м, 1H), 8.40 (м, 1H), 8.23 (м, 1H), 8.01 (м, 1H), 7.86-7.82 (м, 1H), 7.17 (уш.д, 1H), 7.04-7.01 (м, 1H), 4.89 (с, 2H), 4.55-4.48 (м, 1H), 3.68 (с, 3H), 2.98-2.95 (м, 1H), 2.28-2.20 (м, 1H), 2.08-1.82 (м, 4H), 1.81-1.73 (м, 1H).

Пример II-12:

$^1\text{H}$ -ЯМР (400 МГц,  $\text{CDCl}_3$ ,  $\delta$ , м.д.): 9.08 (с, 1H), 8.58 (уш.с, 1H), 8.44 (м, 1H), 8.24 (м, 1H), 8.04 (м, 1H), 7.88-7.83 (м, 1H), 7.07-7.03 (м, 1H), 4.96 (с, 2H), 3.02 (с, 6H).

Пример II-13:

$^1\text{H}$ -ЯМР (400 МГц,  $\text{CDCl}_3$ ,  $\delta$ , м.д.): 9.07 (с, 1H), 8.75 (уш.с, 1H), 8.44 (м, 1H), 8.24 (м, 1H), 8.04 (м, 1H), 7.87-7.82 (м, 1H), 7.05-7.02 (м, 1H), 4.93 (с, 2H), 4.25 (к, 1H), 2.93 (с, 3H), 1.17 (д, 6H).

Пример II-14:

$^1\text{H}$ -ЯМР (400 МГц,  $\text{CDCl}_3$ ,  $\delta$ , м.д.): 9.07 (с, 1H), 8.71 (уш.с, 1H), 8.44 (м, 1H), 8.24 (м, 1H), 8.05 (м, 1H), 7.87-7.82 (м, 1H), 7.06-7.03 (м, 1H), 5.01 (с, 2H), 3.40 (с, 3H).

#### b) Характеристики списков ЯМР-пигов

$^1\text{H}$ -ЯМР-Данные выбранных примеров представляют в виде списков  $^1\text{H}$ -ЯМР-пигов. Для каждого сигнального пика приводится значение химического сдвига  $\delta$  в м.д. и интенсивность сигнала в круглых скобках. Между парами значение  $\delta$  – интенсивность сигнала ставятся точки с запятыми в качестве разделителей.

Поэтому список пиков примера имеет следующую форму:

$$\delta_1(\text{интенсивность}_1); \delta_2(\text{интенсивность}_2); \dots; \delta_i(\text{интенсивность}_i); \dots; \delta_n(\text{интенсивность}_n).$$

Интенсивность четких сигналов коррелирует с высотой сигналов в печатном примере спектра ЯМР в см и показывает реальное соотношение интенсивности сигнала. В случае широких сигналов могут быть показаны несколько пиков или середина сигнала и ее относительная интенсивность в сравнении с самым интенсивным сигналом в спектре.

Для калибровки химического сдвига для  $^1\text{H}$ -ЯМР-спектра, применяли тетраметилсилан и/или химический сдвиг применяемого растворителя,

особенно в случае спектра, измеренного в ДМСО. Поэтому в списках ЯМР-пигов может, однако не должен, встречаться пик тетраметилсилана.

Списки  $^1\text{H}$ -ЯМР-пигов схожи с классическими печатными  $^1\text{H}$ -ЯМР-спектрами и при этом обычно содержат все пики, которые приводятся при классической ЯМР-интерпретации.

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

В данных о сигналах соединений в дельта-области растворителей и/или воды в наших списках  $^1\text{H}$ -ЯМР-пигов продемонстрированы обычные пики растворителей, например, пики ДМСО в ДМСО- $\text{D}_6$  и пик воды, которые обычно имеют высокую интенсивность.

Пики стереоизомеров целевых соединений и/или пики примесей обычно имеют более низкую интенсивность, чем пики целевых соединений (например, с чистотой  $>90\%$ ).

Такие стереоизомеры и/или примеси могут быть типичными для соответствующих способов получения. Таким образом их пики могут помогать при распознавании воспроизведения нашего способа получения при помощи "отпечатков пальцев побочных продуктов".

Эксперт, который оценивает пики целевых соединений с помощью известных способов (MestreC, ACD-моделирование, а также, с помощью полученных опытным путем, анализируемых ожидаемых значений), по мере необходимости может изолировать пики целевых соединений, причем, при необходимости, применяют дополнительный фильтр интенсивности. Такое выделение было бы похоже на соответствующее выявление пиков в классической  $^1\text{H}$ -ЯМР-интерпретации.

Более подробное описание ЯМР-данных со списками пиков можно найти в базе данных Research Disclosure под номером 564025.

<p>I-01: <math>^1\text{H}</math>-ЯМР (400.0 МГц, <math>\text{CDCl}_3</math>):  <math>\delta</math>= 8.8165 (3.5); 8.8132 (3.6); 8.3518 (3.6); 8.3454 (3.6); 8.0976 (2.7); 8.0940 (2.9); 8.0913 (2.8); 8.0876 (2.5); 7.4276 (0.6); 7.4236 (0.9); 7.4219 (1.0); 7.4159 (5.6); 7.4115 (5.4); 7.4046 (2.4); 7.4026 (2.1); 7.3981 (3.5); 7.3963 (3.0); 7.3895 (1.0); 7.3858 (1.2); 7.3745 (0.6); 7.3465 (0.6); 7.3392 (3.8); 7.3348 (4.2); 7.3307 (1.2); 7.3274 (1.5); 7.3258 (1.4); 7.3232 (1.6); 7.3207 (1.7); 7.3147 (2.3); 7.2594 (15.4); 4.9613 (15.0); 4.9109 (0.8); 4.3231 (2.0); 4.3053 (6.3); 4.2874 (6.4); 4.2696 (2.1); 2.0424 (0.7); 1.5454 (3.1); 1.3379 (7.8); 1.3200 (16.0); 1.3097 (0.7); 1.3022 (7.9); 1.2918 (0.8); 1.2741 (1.0); 1.2649 (1.7); 1.2581 (1.3); 0.8986 (0.8); 0.8817 (2.9); 0.8640 (1.1); 0.0080 (0.5); -0.0002 (17.4); -0.0085 (0.6)</p>
<p>I-02: <math>^1\text{H}</math>-ЯМР (400.0 МГц, <math>\text{CDCl}_3</math>):  <math>\delta</math>= 8.9079 (3.9); 8.9044 (3.8); 8.3699 (3.7); 8.3635 (3.8); 8.0703 (2.9); 8.0667 (3.0); 8.0639 (2.9); 8.0603 (2.7); 7.3994 (0.8); 7.3847 (0.9); 7.3791 (1.4); 7.3647 (1.4); 7.3594 (1.2); 7.3447 (1.1); 7.2589 (40.6); 7.1506 (0.7); 7.1481 (0.9); 7.1442 (0.8); 7.1417 (0.9); 7.1294 (1.1); 7.1269 (1.5); 7.1230 (1.4); 7.1205 (1.8); 7.1165 (1.9); 7.1127 (2.4); 7.1102 (1.7); 7.1057 (0.9); 7.0975 (1.6); 7.0937 (2.2); 7.0911 (1.5); 7.0831 (1.5); 7.0773 (1.2); 7.0734 (0.8); 7.0599 (1.3); 7.0559 (1.2); 7.0500 (0.9); 4.9545 (15.9); 4.3261 (2.0); 4.3083 (6.4); 4.2904 (6.4); 4.2726 (2.1); 1.5303 (9.2); 1.3414 (7.8); 1.3236 (16.0); 1.3057 (7.7); 1.2640 (0.7); 0.8818 (0.7); 0.0079 (1.8); -0.0002 (50.7); -0.0085 (1.8)</p>
<p>I-03: <math>^1\text{H}</math>-ЯМР (400.0 МГц, <math>\text{CDCl}_3</math>):  <math>\delta</math>= 8.7968 (3.8); 8.3727 (3.4); 8.3668 (3.8); 8.1438 (2.7); 8.1402 (2.8); 7.5175 (4.6); 7.4221 (5.4); 7.4071 (3.5); 7.3400 (3.7); 7.3362 (4.3); 7.3160 (2.6); 7.2587 (846.2); 6.9947 (4.5); 5.0488 (16.0); 3.7462 (4.0); 1.8524 (5.2); 1.8356 (2.2); 1.5445 (2.0); 0.1460 (3.2); 0.0079 (30.5); -0.0002 (1013.4); -0.0085 (36.3); -0.1496 (3.3)</p>
<p>I-05: <math>^1\text{H}</math>-ЯМР (400.0 МГц, <math>\text{CDCl}_3</math>):  <math>\delta</math>= 9.0264 (2.8); 8.3995 (2.5); 8.3933 (2.5); 8.2805 (2.1); 8.2677 (2.2); 8.0068 (1.8); 8.0023 (2.2); 7.9984 (1.7); 7.2645 (9.4); 7.2638 (9.3); 7.1427 (1.6); 7.1298 (1.6); 6.9534 (2.5); 5.3007 (2.1); 5.2930 (0.7); 5.2754 (1.9); 5.2580 (1.9); 5.2406 (0.6);</p>

3.8197 (16.0); 1.7355 (7.5); 1.7180 (7.5); 1.2562 (0.7); 0.0007 (5.9); -0.0002 (5.9)
I-06: $^1\text{H}$ -ЯМР (599,7 МГц, $\text{CDCl}_3$ ): $\delta$ = 9.0495 (3.8); 9.0474 (3.7); 8.4133 (3.5); 8.4091 (3.5); 8.2827 (2.8); 8.2741 (2.8); 8.0208 (2.4); 8.0184 (2.7); 8.0166 (2.6); 8.0142 (2.3); 7.2810 (0.3); 7.2736 (0.3); 7.2602 (47.8); 7.1444 (1.2); 7.1419 (2.0); 7.1395 (1.2); 7.1358 (1.2); 7.1333 (1.9); 7.1309 (1.1); 6.9568 (3.0); 5.2994 (0.4); 4.9827 (14.0); 3.8456 (24.2); 1.5402 (29.1); 1.2550 (0.6); 0.0692 (0.9); 0.0208 (0.3); 0.0133 (0.3); 0.0053 (1.8); -0.0001 (50.0); -0.0056 (1.6)
I-07: $^1\text{H}$ -ЯМР (599,6 МГц, $\text{CDCl}_3$ ): $\delta$ = 9.0599 (8.9); 9.0580 (9.6); 8.5326 (8.0); 8.5280 (8.1); 8.3901 (9.0); 8.3874 (12.7); 8.3830 (8.8); 7.9956 (5.3); 7.9932 (6.4); 7.9916 (6.3); 7.9892 (5.4); 7.5126 (2.5); 7.5095 (3.1); 7.5083 (3.1); 7.5052 (2.6); 7.4979 (2.5); 7.4948 (3.1); 7.4936 (3.1); 7.4905 (2.4); 7.2671 (6.2); 4.9879 (30.4); 3.8473 (50.0); 3.8078 (0.3); 3.7215 (0.3); 2.7677 (9.5); 1.6668 (1.6); 1.3346 (0.5); 1.2853 (0.7); 1.2553 (2.0); 0.8795 (0.4); 0.0052 (0.3); -0.0001 (7.9); -0.0054 (0.3)
I-09: $^1\text{H}$ -ЯМР (400,2 МГц, $d_6$ -ДМСО): $\delta$ = 9.0108 (2.9); 9.0075 (2.9); 8.5511 (2.7); 8.5447 (2.8); 8.3492 (2.0); 8.3363 (2.0); 8.2088 (1.8); 8.2052 (1.9); 8.2024 (1.9); 8.1989 (1.7); 7.4259 (1.3); 7.4224 (0.9); 7.4169 (0.8); 7.4132 (1.2); 7.4095 (0.8); 7.3636 (2.3); 5.7550 (1.1); 5.0950 (7.8); 3.7455 (16.0); 3.3345 (139.7); 3.1755 (0.6); 3.1624 (0.5); 2.6718 (0.3); 2.5252 (1.0); 2.5118 (21.7); 2.5074 (43.2); 2.5029 (55.8); 2.4983 (39.9); 2.4939 (19.2); 2.3297 (0.3); -0.0002 (0.9)
I-10: $^1\text{H}$ -ЯМР (400,0 МГц, $\text{CDCl}_3$ ): $\delta$ = 9.0305 (1.9); 9.0270 (2.0); 8.3930 (1.9); 8.3866 (1.9); 8.2798 (1.5); 8.2669 (1.5); 7.9922 (1.5); 7.9886 (1.6); 7.9859 (1.5); 7.9822 (1.4); 7.2621 (7.8); 7.1422 (0.7); 7.1385 (1.1); 7.1344 (0.8); 7.1293 (0.8); 7.1257 (1.0); 7.1215 (0.7); 6.9518 (1.1); 6.9485 (1.6); 6.9467 (1.2); 6.9451 (1.1); 5.2692 (1.6); 5.2517 (1.6); 3.8182 (16.0); 1.7341 (6.3); 1.7167 (6.2); 1.5654 (3.6); -0.0002 (10.1)
I-11: $^1\text{H}$ -ЯМР (599,7 МГц, $d_6$ -ДМСО): $\delta$ = 8.9948 (1.8); 8.9926 (1.8); 8.5268 (1.7); 8.5226 (1.8); 8.3421 (1.1); 8.3380 (1.1); 8.1967 (1.2); 8.1944 (1.3); 8.1925 (1.2); 8.1901 (1.1); 8.1081 (0.4); 8.1039 (0.4); 8.0942 (0.6); 8.0903 (0.6); 8.0810 (0.4); 8.0768 (0.4); 7.3247 (0.6); 7.3207 (0.6); 7.3105 (0.6); 7.3065 (0.6); 5.0913 (5.1); 3.7477 (10.0); 3.3265 (50.0); 2.5174 (0.3); 2.5087 (5.4); 2.5057 (11.1); 2.5026 (15.2); 2.4996 (11.2); 2.4966 (5.4); -0.0001 (0.3)
I-12: $^1\text{H}$ -ЯМР (400,2 МГц, $d_6$ -ДМСО): $\delta$ = 8.9454 (2.9); 8.9421 (3.0); 8.5221 (2.8); 8.5157 (2.9); 8.3370 (1.8); 8.3310 (1.8); 8.1907 (1.8); 8.1871 (1.9); 8.1844 (1.9); 8.1808 (1.7); 8.1107 (0.6); 8.1047 (0.6); 8.0901 (1.1); 8.0840 (1.0); 8.0701 (0.7); 8.0639 (0.7); 7.3270 (1.2); 7.3204 (1.1); 7.3057 (1.1); 7.2990 (1.1); 5.7551 (1.7); 5.3303 (0.5); 5.3131 (1.9); 5.2958 (2.0); 5.2785 (0.5); 3.7434 (16.0); 3.3280 (73.8); 2.6715 (0.4); 2.5247 (1.2); 2.5113 (23.3); 2.5070 (46.6); 2.5025 (60.7); 2.4980 (43.6); 2.4936 (21.2); 2.3291 (0.4); 1.6266 (6.4); 1.6093 (6.4); -0.0002 (5.5)
I-16: $^1\text{H}$ -ЯМР (400,0 МГц, $\text{CDCl}_3$ ): $\delta$ = 8.9473 (1.6); 8.9440 (1.6); 8.3675 (1.6); 8.3611 (1.6); 8.0366 (1.2); 8.0330 (1.3); 8.0303 (1.3); 8.0266 (1.2); 7.2627 (6.6); 7.2166 (0.5); 7.2088 (0.9); 7.2044 (0.5); 7.1979 (0.5); 7.1925 (0.6); 7.1888 (0.9); 7.1842 (1.2); 7.1655 (0.6); 7.1632 (0.7); 5.2998 (2.7); 5.2681 (1.6); 5.2506 (1.6); 3.8109 (16.0); 1.7242 (6.3); 1.7067 (6.2); -0.0002 (4.6)
I-17: $^1\text{H}$ -ЯМР (400,0 МГц, $\text{CDCl}_3$ ): $\delta$ = 9.0282 (1.9); 9.0249 (1.9); 8.3644 (1.8); 8.3580 (1.9); 8.2297 (1.2); 8.2236 (1.2);

7.9842 (1.4); 7.9806 (1.4); 7.9779 (1.4); 7.9742 (1.3); 7.8549 (0.6); 7.8487 (0.6); 7.8361 (0.7); 7.8338 (0.8); 7.8299 (0.7); 7.8276 (0.7); 7.8150 (0.6); 7.8088 (0.6); 7.2629 (13.1); 7.0246 (0.8); 7.0184 (0.8); 7.0173 (0.8); 7.0034 (0.8); 6.9973 (0.8); 6.9961 (0.8); 5.2732 (1.6); 5.2557 (1.6); 3.8205 (16.0); 1.7354 (6.3); 1.7179 (6.3); -0.0002 (8.0)
I-18: $^1\text{H}$ -ЯМР (400,0 МГц, $\text{CDCl}_3$ ): $\delta$ = 9.0287 (1.7); 9.0257 (1.6); 9.0252 (1.6); 8.3659 (1.7); 8.3654 (1.7); 8.3591 (1.7); 8.2325 (0.7); 8.2306 (1.0); 8.2285 (0.8); 8.2265 (0.8); 8.2243 (1.0); 8.2224 (0.7); 7.9865 (1.5); 7.9829 (1.5); 7.9801 (1.5); 7.9764 (1.4); 7.8576 (0.6); 7.8514 (0.6); 7.8388 (0.7); 7.8365 (0.8); 7.8326 (0.7); 7.8303 (0.7); 7.8177 (0.7); 7.8115 (0.7); 7.2709 (3.9); 7.0281 (0.8); 7.0266 (0.8); 7.0207 (0.8); 7.0191 (0.8); 7.0070 (0.8); 7.0054 (0.8); 6.9995 (0.8); 6.9980 (0.8); 5.3019 (4.9); 5.2751 (1.6); 5.2577 (1.6); 3.8209 (16.0); 1.7355 (6.3); 1.7180 (6.3); -0.0002 (2.4)
I-19: $^1\text{H}$ -ЯМР (400,0 МГц, $\text{CDCl}_3$ ): $\delta$ = 8.8278 (1.8); 8.8244 (1.8); 8.3398 (1.7); 8.3335 (1.7); 8.0695 (1.2); 8.0658 (1.2); 8.0631 (1.2); 8.0595 (1.1); 7.4127 (3.0); 7.4082 (2.8); 7.4012 (1.2); 7.3995 (1.0); 7.3949 (1.7); 7.3932 (1.5); 7.3828 (0.6); 7.3352 (2.0); 7.3308 (2.2); 7.3267 (0.5); 7.3232 (0.7); 7.3219 (0.7); 7.3193 (0.8); 7.3169 (0.8); 7.3126 (0.5); 7.3107 (1.2); 7.2613 (10.9); 5.2985 (2.2); 5.2813 (1.6); 3.8066 (16.0); 3.8036 (1.6); 1.7237 (6.3); 1.7062 (6.3); -0.0002 (6.6)
I-20: $^1\text{H}$ -ЯМР (400,0 МГц, $\text{CDCl}_3$ ): $\delta$ = 8.9047 (2.2); 8.9012 (2.2); 8.3583 (2.2); 8.3519 (2.2); 8.0484 (1.4); 8.0447 (1.5); 8.0420 (1.5); 8.0384 (1.3); 7.3818 (0.5); 7.3763 (0.8); 7.3618 (0.8); 7.3565 (0.6); 7.3417 (0.6); 7.2611 (14.9); 7.1259 (0.6); 7.1237 (0.7); 7.1196 (0.7); 7.1173 (0.9); 7.1125 (0.9); 7.1090 (1.2); 7.1063 (0.9); 7.0936 (0.7); 7.0899 (1.1); 7.0874 (0.7); 7.0786 (0.8); 7.0726 (0.6); 7.0552 (0.7); 7.0511 (0.7); 5.2811 (1.6); 5.2636 (1.6); 3.8099 (16.0); 1.7252 (6.6); 1.7078 (6.5); 1.5687 (0.8); 1.2643 (0.6); 0.8818 (1.1); -0.0002 (8.7)
I-22: $^1\text{H}$ -ЯМР (400,0 МГц, $\text{CDCl}_3$ ): $\delta$ = 8.9710 (0.8); 8.9676 (0.8); 8.5137 (0.7); 8.5077 (0.7); 8.1490 (0.5); 8.1453 (0.6); 8.1427 (0.5); 7.5191 (0.5); 7.2602 (91.5); 5.2646 (0.7); 5.2471 (0.7); 3.8093 (7.5); 1.7244 (2.9); 1.7069 (2.9); 1.5376 (16.0); 0.0080 (1.9); -0.0002 (55.0); -0.0085 (1.5)
I-23: $^1\text{H}$ -ЯМР (400,0 МГц, $\text{CDCl}_3$ ): $\delta$ = 8.9863 (1.3); 8.9829 (1.3); 8.5294 (1.2); 8.5232 (1.3); 8.1691 (0.9); 8.1655 (1.0); 8.1628 (0.9); 8.1593 (0.8); 7.2604 (71.0); 7.2509 (0.5); 7.2420 (0.6); 7.2378 (0.8); 7.2325 (0.5); 4.9751 (5.5); 3.8384 (10.1); 1.5396 (16.0); 0.0080 (1.4); -0.0002 (42.7); -0.0085 (1.1)
I-24: $^1\text{H}$ -ЯМР (400,0 МГц, $\text{CDCl}_3$ ): $\delta$ = 9.0984 (5.6); 8.3399 (4.8); 8.2296 (5.4); 8.0132 (5.0); 7.8235 (3.1); 7.2618 (102.0); 7.0201 (3.2); 6.9999 (3.2); 5.3011 (2.9); 5.2837 (3.2); 5.2672 (3.0); 2.0404 (1.2); 1.8015 (11.5); 1.7843 (11.9); 1.6790 (1.9); 1.2563 (16.0); 0.8808 (3.2); -0.0002 (60.1)
I-25: $^1\text{H}$ -ЯМР (400,0 МГц, $\text{CDCl}_3$ ): $\delta$ = 9.0521 (1.6); 9.0489 (1.6); 8.5094 (1.6); 8.5032 (1.6); 8.2920 (1.1); 8.2901 (0.9); 8.2878 (0.9); 8.2857 (1.1); 8.0970 (1.4); 8.0934 (1.4); 8.0907 (1.4); 8.0871 (1.3); 7.9551 (0.7); 7.9487 (0.6); 7.9368 (0.7); 7.9339 (0.8); 7.9305 (0.7); 7.9275 (0.7); 7.9156 (0.7); 7.9092 (0.7); 7.2631 (13.5); 7.0763 (0.8); 7.0748 (0.9); 7.0688 (0.8); 7.0673 (0.9); 7.0551 (0.8); 7.0536 (0.8); 7.0476 (0.8); 7.0461 (0.8); 5.3007 (0.8); 5.2788 (1.6); 5.2613 (1.6); 3.8202 (16.0); 1.7377 (6.4); 1.7203 (6.4); -0.0002 (9.2)
I-26: $^1\text{H}$ -ЯМР (400,6 МГц, $\text{CDCl}_3$ ): $\delta$ = 9.0528 (1.9); 9.0523 (1.9); 9.0494 (2.0); 8.5115 (1.9); 8.5111 (1.9); 8.5052 (2.0);

8.2937 (1.1); 8.2917 (0.9); 8.2894 (0.9); 8.2874 (1.2); 8.1002 (1.5); 8.0966 (1.6); 8.0939 (1.6); 8.0903 (1.5); 7.9572 (0.6); 7.9509 (0.6); 7.9389 (0.7); 7.9360 (0.8); 7.9326 (0.7); 7.9297 (0.7); 7.9177 (0.7); 7.9114 (0.6); 7.2702 (2.1); 7.0787 (0.8); 7.0773 (0.8); 7.0713 (0.8); 7.0698 (0.8); 7.0575 (0.8); 7.0560 (0.8); 7.0500 (0.8); 7.0486 (0.8); 5.3029 (9.0); 5.2992 (0.7); 5.2813 (1.6); 5.2639 (1.6); 3.8211 (16.0); 1.7381 (6.2); 1.7207 (6.1); -0.0002 (1.9)
I-28: $^1\text{H}$ -ЯМР (400,0 МГц, $\text{CDCl}_3$ ): $\delta$ = 9.3202 (3.7); 9.1070 (1.9); 9.1038 (1.8); 8.8734 (5.9); 8.5225 (1.8); 8.5163 (1.8); 8.0755 (1.4); 8.0718 (1.5); 8.0692 (1.5); 8.0656 (1.4); 7.2655 (12.6); 5.3037 (0.8); 5.2927 (1.6); 5.2753 (1.6); 3.8311 (16.0); 3.8267 (0.9); 1.7521 (6.2); 1.7346 (6.1); -0.0002 (8.9)
I-29: $^1\text{H}$ -ЯМР (400,6 МГц, $\text{CDCl}_3$ ): $\delta$ = 8.9456 (1.7); 8.9425 (1.7); 8.7689 (5.3); 8.7566 (5.4); 8.5367 (1.7); 8.5304 (1.8); 8.1457 (1.4); 8.1421 (1.4); 8.1393 (1.4); 8.1358 (1.3); 7.3396 (1.5); 7.3274 (2.9); 7.3151 (1.5); 7.2615 (20.6); 5.3006 (0.6); 5.2933 (1.5); 5.2758 (1.5); 3.7919 (16.0); 1.7272 (6.2); 1.7098 (6.1); 1.5602 (2.3); 0.0080 (0.6); -0.0002 (18.6); -0.0085 (0.5)
I-30: $^1\text{H}$ -ЯМР (400,0 МГц, $\text{CDCl}_3$ ): $\delta$ = 9.2600 (2.3); 9.0794 (1.4); 9.0763 (1.4); 8.7975 (2.4); 8.3821 (1.4); 8.3757 (1.4); 7.9706 (1.2); 7.9669 (1.3); 7.9642 (1.3); 7.9606 (1.1); 7.2669 (9.9); 5.2811 (1.5); 5.2636 (1.6); 3.8297 (16.0); 2.7777 (1.6); 2.0484 (2.0); 1.7470 (6.0); 1.7296 (6.0); 1.2789 (0.6); 1.2610 (1.2); 1.2431 (0.5); -0.0002 (7.1)
I-33: $^1\text{H}$ -ЯМР(400,0 МГц, $d_6$ -ДМСО): $\delta$ = 13.2459 (0.5); 9.2662 (2.1); 9.2631 (2.7); 9.2530 (2.2); 9.2499 (2.8); 9.2346 (2.4); 9.2315 (2.5); 9.2289 (3.0); 9.2258 (2.2); 9.0122 (3.5); 9.0094 (3.8); 8.5536 (3.4); 8.5476 (3.5); 8.1475 (2.5); 8.1439 (2.7); 8.1411 (2.7); 8.1375 (2.5); 7.7303 (2.3); 7.7245 (2.3); 7.7171 (2.3); 7.7113 (2.3); 7.5943 (1.4); 6.9956 (1.4); 5.3275 (0.6); 5.3103 (2.5); 5.2930 (2.6); 5.2756 (0.6); 3.3408 (1.0); 3.3229 (16.0); 3.2967 (0.5); 2.6707 (0.6); 2.5240 (1.8); 2.5194 (2.7); 2.5105 (30.2); 2.5061 (64.8); 2.5015 (90.0); 2.4970 (65.9); 2.4926 (31.1); 2.3283 (0.6); 2.1169 (0.9); 2.0854 (2.0); 1.6767 (7.5); 1.6594 (7.4); 1.5463 (1.9); 1.1404 (2.0); 0.0080 (1.5); -0.0002 (45.8); -0.0085 (1.5)
I-34: $^1\text{H}$ -ЯМР (400,0 МГц, $\text{CDCl}_3$ ): $\delta$ = 9.0305 (2.6); 8.3936 (2.2); 8.3874 (2.2); 8.2808 (2.0); 8.2679 (2.1); 7.9930 (1.7); 7.9893 (2.0); 7.2638 (9.8); 7.1393 (1.5); 7.1264 (1.5); 6.9500 (2.3); 5.2874 (0.6); 5.2699 (1.8); 5.2525 (1.8); 5.2352 (0.6); 3.8187 (16.0); 2.0454 (0.8); 1.7346 (7.2); 1.7172 (7.2); 1.2771 (0.6); 1.2606 (1.2); 0.8986 (0.5); 0.8819 (1.3); 0.8645 (0.6); -0.0002 (6.0)
I-35: $^1\text{H}$ -ЯМР (400,0 МГц, $\text{CDCl}_3$ ): $\delta$ = 9.0560 (3.3); 8.5389 (2.8); 8.5328 (2.7); 8.3425 (2.2); 8.3298 (2.2); 8.1037 (2.1); 8.1000 (2.4); 7.2624 (13.2); 7.2025 (1.7); 7.1897 (1.7); 6.9756 (2.5); 5.2967 (0.6); 5.2791 (1.8); 5.2616 (1.8); 5.2444 (0.6); 3.8196 (16.0); 2.0453 (1.4); 1.7393 (7.3); 1.7218 (7.3); 1.2775 (0.7); 1.2606 (1.4); 0.8823 (0.9); -0.0002 (8.8)
I-37: $^1\text{H}$ -ЯМР(400,0 МГц, $d_6$ -ДМСО): $\delta$ = 13.1410 (1.4); 8.9751 (5.9); 8.9718 (6.0); 8.6937 (5.1); 8.6866 (5.3); 8.5212 (5.6); 8.5148 (6.3); 8.5071 (5.5); 8.1800 (3.7); 8.1764 (4.0); 8.1737 (3.9); 8.1700 (3.6); 7.9732 (1.6); 7.9688 (1.9); 7.9620 (1.5); 7.9491 (1.7); 7.9447 (2.0); 7.9380 (1.6); 5.7563 (2.7); 5.2248 (0.9); 5.2074 (3.8); 5.1901 (3.9); 5.1728 (0.9); 3.6009 (0.6); 3.3191 (16.0); 2.6707 (0.8); 2.5236 (3.8); 2.5101 (48.7); 2.5057 (100.0); 2.5012 (135.1); 2.4967 (96.6); 2.4924 (44.6); 2.3285 (0.8); 1.7598 (0.7); 1.6165 (11.8); 1.5991 (11.7); 1.2346 (0.5); 0.0079 (2.9); -0.0002 (72.3); -0.0085 (2.3)
I-38: $^1\text{H}$ -ЯМР(400,2 МГц, $d_6$ -ДМСО):

$\delta$ = 8.9331 (2.8); 8.9297 (2.9); 8.6481 (1.2); 8.6441 (1.4); 8.6359 (1.3); 8.6320 (1.3); 8.5953 (1.8); 8.5912 (1.8); 8.5250 (2.6); 8.5186 (2.7); 8.1787 (1.7); 8.1752 (1.9); 8.1724 (1.9); 8.1688 (1.7); 7.8643 (0.8); 7.8594 (1.1); 7.8547 (0.8); 7.8446 (0.9); 7.8396 (1.2); 7.8349 (0.8); 7.5043 (1.0); 7.4921 (1.0); 7.4860 (0.9); 7.4845 (0.9); 7.4739 (0.8); 7.4723 (0.9); 5.7558 (2.3); 5.3261 (0.5); 5.3090 (1.9); 5.2917 (1.9); 5.2744 (0.5); 3.7424 (16.0); 3.3265 (40.5); 2.6712 (0.4); 2.5247 (1.0); 2.5112 (22.9); 2.5068 (46.8); 2.5022 (61.5); 2.4977 (44.4); 2.4932 (21.8); 2.3291 (0.4); 1.6255 (6.3); 1.6082 (6.2); -0.0002 (6.4)
I-39: $^1\text{H}$ -ЯМР(400,2 МГц, $d_6$ -ДМСО): $\delta$ = 8.9575 (2.9); 8.9542 (2.9); 8.6949 (2.4); 8.6880 (2.4); 8.5270 (2.7); 8.5205 (2.9); 8.5088 (1.5); 8.5048 (2.6); 8.5011 (1.4); 8.1775 (1.7); 8.1740 (1.9); 8.1712 (1.9); 8.1676 (1.7); 7.9709 (0.8); 7.9665 (0.9); 7.9642 (0.9); 7.9598 (0.8); 7.9468 (0.8); 7.9425 (0.9); 7.9402 (0.9); 7.9357 (0.7); 5.7560 (2.0); 5.3378 (0.5); 5.3206 (1.9); 5.3033 (1.9); 5.2859 (0.5); 3.7458 (16.0); 3.3259 (46.9); 2.6712 (0.4); 2.5244 (1.3); 2.5111 (25.9); 2.5068 (51.0); 2.5023 (65.6); 2.4977 (46.8); 2.4933 (22.4); 2.3291 (0.4); 1.6295 (6.4); 1.6122 (6.3); -0.0002 (6.1)
I-40: $^1\text{H}$ -ЯМР(400,2 МГц, $d_6$ -ДМСО): $\delta$ = 9.0179 (3.0); 9.0150 (2.9); 8.7754 (2.5); 8.7685 (2.5); 8.6651 (2.7); 8.6588 (2.8); 8.6453 (1.6); 8.6416 (2.7); 8.2938 (1.9); 8.2902 (2.1); 8.2875 (2.0); 8.2840 (1.8); 8.1133 (0.8); 8.1089 (0.9); 8.1067 (0.9); 8.1023 (0.8); 8.0895 (0.8); 8.0851 (1.0); 8.0830 (0.9); 8.0785 (0.7); 5.7555 (1.7); 5.4233 (0.5); 5.4060 (1.9); 5.3887 (1.9); 5.3714 (0.5); 3.7568 (16.0); 3.3268 (51.2); 2.6714 (0.4); 2.5111 (24.4); 2.5069 (47.0); 2.5024 (59.7); 2.4979 (43.0); 2.4936 (21.1); 2.3292 (0.4); 1.6551 (6.5); 1.6378 (6.4); -0.0002 (6.1)
I-41: $^1\text{H}$ -ЯМР (599,6 МГц, $\text{CDCl}_3$ ): $\delta$ = 8.9739 (2.7); 8.3799 (1.9); 8.3761 (2.2); 8.0840 (1.9); 7.2597 (34.2); 7.2253 (0.4); 7.2097 (1.4); 7.1954 (1.7); 7.1802 (0.9); 7.0816 (0.8); 5.2993 (0.4); 5.0238 (6.8); 2.1085 (0.5); 1.4321 (0.7); 1.2555 (2.0); 0.8802 (0.4); 0.8677 (0.3); 0.8395 (0.3); -0.0001 (50.0)
I-42: $^1\text{H}$ -ЯМР (400,6 МГц, $\text{CDCl}_3$ ): $\delta$ = 9.0754 (1.6); 9.0723 (1.6); 8.4034 (1.5); 8.3971 (1.6); 8.0143 (1.2); 8.0107 (1.3); 8.0080 (1.3); 8.0043 (1.2); 7.9829 (1.2); 7.9783 (1.9); 7.9739 (1.3); 7.6793 (0.6); 7.6742 (0.6); 7.6563 (0.9); 7.6514 (0.9); 7.6341 (0.6); 7.6291 (0.6); 7.2608 (30.1); 4.9835 (8.5); 3.8467 (16.0); 1.5443 (7.4); 0.0080 (0.9); -0.0002 (32.3); -0.0085 (1.0)
I-43: $^1\text{H}$ -ЯМР (400,6 МГц, $\text{CDCl}_3$ ): $\delta$ = 9.0489 (1.8); 9.0482 (1.7); 9.0453 (1.9); 9.0447 (1.7); 8.3875 (1.8); 8.3868 (1.7); 8.3811 (1.9); 7.9988 (1.4); 7.9952 (1.5); 7.9924 (1.5); 7.9888 (1.4); 7.9777 (1.1); 7.9732 (1.6); 7.9686 (1.1); 7.6718 (0.6); 7.6668 (0.5); 7.6497 (0.8); 7.6487 (0.7); 7.6447 (0.8); 7.6437 (0.7); 7.6266 (0.6); 7.6215 (0.5); 7.2619 (11.2); 5.2695 (1.5); 5.2520 (1.5); 3.8209 (16.0); 1.7366 (6.1); 1.7192 (6.0); 1.5580 (2.4); 1.2646 (0.5); 1.2599 (0.5); 0.8819 (1.0); -0.0002 (11.3)
I-44: $^1\text{H}$ -ЯМР (400,0 МГц, $\text{CDCl}_3$ ): $\delta$ = 9.0859 (1.9); 9.0828 (1.9); 8.7086 (4.8); 8.7046 (4.8); 8.3984 (1.9); 8.3921 (1.9); 7.9921 (1.4); 7.9884 (1.5); 7.9857 (1.5); 7.9821 (1.4); 7.2613 (13.6); 5.2786 (1.6); 5.2612 (1.6); 3.8262 (16.0); 1.7451 (6.2); 1.7276 (6.2); 1.5497 (4.2); -0.0002 (17.3)
I-45: $^1\text{H}$ -ЯМР (599,6 МГц, $\text{CDCl}_3$ ): $\delta$ = 8.9460 (8.2); 8.9439 (8.3); 8.3656 (7.6); 8.3614 (7.7); 8.0338 (5.0); 8.0313 (5.8); 8.0296 (5.5); 8.0272 (4.7); 7.2611 (17.1); 7.2171 (1.5); 7.2075 (2.0); 7.2036 (4.7); 7.1950 (2.2); 7.1896 (4.4); 7.1864 (5.0); 7.1772 (1.9); 7.1732 (3.2); 7.0810 (1.4); 7.0784 (1.9); 7.0745 (2.0); 7.0716 (2.0); 7.0681 (1.8); 7.0641 (1.6); 7.0609 (1.6);

7.0574 (1.5); 5.2769 (1.7); 5.2652 (5.5); 5.2536 (5.5); 5.2420 (1.6); 3.8105 (50.0); 3.7971 (0.4); 3.7884 (0.4); 3.6849 (0.3); 2.9568 (1.2); 2.8846 (1.1); 2.0444 (0.5); 1.7210 (21.6); 1.7094 (21.4); 1.5598 (10.0); 1.2897 (0.3); 1.2800 (0.4); 1.2710 (0.5); 1.2650 (0.8); 1.2591 (1.0); 1.2561 (0.9); 1.2473 (0.4); 0.8935 (0.7); 0.8820 (1.6); 0.8700 (0.8); 0.0053 (1.0); -0.0001 (23.6); -0.0056 (0.8)
I-46: $^1\text{H}$ -ЯМР (599,6 МГц, $\text{CDCl}_3$ ): $\delta$ = 8.9713 (8.7); 8.9692 (8.9); 8.5138 (8.0); 8.5097 (8.2); 8.1487 (5.4); 8.1462 (6.2); 8.1446 (6.0); 8.1422 (5.1); 7.2656 (7.1); 7.2525 (3.2); 7.2478 (2.4); 7.2441 (2.3); 7.2389 (3.0); 7.2359 (4.6); 7.2315 (3.0); 7.2267 (2.3); 7.2229 (2.4); 7.2181 (1.8); 7.2146 (2.0); 7.1842 (1.7); 7.1819 (2.1); 7.1779 (2.4); 7.1752 (2.2); 7.1715 (1.8); 7.1677 (1.5); 7.1639 (1.6); 7.1610 (1.4); 5.2763 (1.8); 5.2646 (5.8); 5.2530 (5.8); 5.2414 (1.8); 4.1343 (0.4); 3.8458 (0.5); 3.8096 (50.0); 3.7944 (0.4); 3.0148 (4.0); 2.9410 (3.1); 2.4778 (0.3); 2.4288 (0.4); 2.1029 (0.3); 2.0824 (3.3); 1.7216 (22.2); 1.7100 (22.1); 1.2565 (0.3); 0.0053 (0.4); -0.0001 (8.8)
I-47: $^1\text{H}$ -ЯМР (400,0 МГц, $\text{CDCl}_3$ ): $\delta$ = 9.0078 (7.0); 9.0043 (7.0); 8.3413 (6.7); 8.3348 (7.0); 8.0668 (4.5); 8.0632 (4.7); 8.0603 (4.6); 8.0567 (4.2); 7.2604 (69.1); 7.2303 (1.4); 7.2091 (3.1); 7.1936 (1.9); 7.1886 (3.6); 7.1851 (3.9); 7.1805 (2.0); 7.1667 (1.8); 7.1636 (2.3); 7.0846 (1.2); 7.0808 (1.5); 7.0742 (1.6); 7.0703 (1.6); 7.0652 (1.3); 7.0597 (1.1); 7.0532 (1.2); 7.0488 (1.1); 7.0440 (0.8); 5.2976 (1.3); 5.2800 (5.0); 5.2625 (5.1); 5.2450 (1.2); 1.7868 (16.0); 1.7692 (15.8); 1.2626 (0.6); 0.8818 (0.8); 0.0079 (1.3); -0.0002 (41.9); -0.0085 (1.2)
I-48: $^1\text{H}$ -ЯМР (400,0 МГц, $\text{CDCl}_3$ ): $\delta$ = 8.9693 (7.2); 8.9658 (7.1); 8.3291 (6.9); 8.3225 (7.1); 8.0811 (4.5); 8.0776 (4.7); 8.0747 (4.5); 8.0711 (4.1); 7.4001 (1.3); 7.3857 (1.5); 7.3800 (2.4); 7.3657 (2.4); 7.3602 (1.8); 7.3457 (1.8); 7.2599 (47.9); 7.1521 (1.3); 7.1455 (1.3); 7.1307 (2.2); 7.1244 (2.4); 7.1120 (3.4); 7.1089 (4.4); 7.1059 (3.4); 7.0895 (3.3); 7.0771 (2.2); 7.0729 (2.0); 7.0672 (1.4); 7.0539 (2.1); 7.0496 (2.1); 7.0437 (1.5); 5.3085 (1.2); 5.2910 (4.8); 5.2735 (5.0); 5.2561 (1.2); 1.7940 (16.0); 1.7765 (16.0); 1.2635 (1.6); 1.2428 (0.7); 0.8986 (0.8); 0.8820 (2.5); 0.8643 (1.0); 0.0079 (1.8); -0.0002 (61.9); -0.0084 (2.0)
I-50: $^1\text{H}$ -ЯМР (400,2 МГц, $d_6$ -DMCO): $\delta$ = 9.0200 (5.6); 9.0173 (5.5); 8.6671 (4.9); 8.6609 (5.0); 8.4392 (3.6); 8.4334 (3.7); 8.3099 (3.4); 8.3064 (3.9); 8.3038 (3.7); 8.3004 (3.1); 8.2622 (1.2); 8.2562 (1.2); 8.2420 (2.0); 8.2363 (1.9); 8.2216 (1.3); 8.2156 (1.2); 7.3436 (2.1); 7.3375 (2.2); 7.3223 (2.1); 7.3162 (2.0); 5.7556 (2.5); 5.1833 (14.3); 4.2540 (2.2); 4.2363 (7.0); 4.2185 (7.0); 4.2008 (2.3); 3.3271 (79.8); 3.1753 (1.0); 3.1621 (1.0); 2.6759 (0.5); 2.6716 (0.6); 2.6671 (0.5); 2.5069 (81.6); 2.5025 (102.6); 2.4981 (74.4); 2.3337 (0.5); 2.3292 (0.6); 2.3248 (0.4); 1.2512 (7.8); 1.2334 (16.0); 1.2157 (7.5); -0.0002 (8.7); -0.0084 (0.4)
I-51: $^1\text{H}$ -ЯМР (599,6 МГц, $\text{CDCl}_3$ ): $\delta$ = 9.0519 (17.3); 8.3595 (13.2); 8.3555 (14.2); 8.2077 (10.4); 8.2044 (11.3); 7.9803 (8.5); 7.9780 (11.4); 7.9767 (11.8); 7.9743 (10.0); 7.8265 (3.4); 7.8225 (3.7); 7.8127 (5.9); 7.8091 (6.0); 7.8000 (3.6); 7.7960 (3.6); 7.2627 (22.1); 7.0247 (6.3); 7.0202 (6.6); 7.0106 (6.1); 7.0061 (6.2); 4.9533 (50.0); 4.9107 (0.4); 4.3238 (6.6); 4.3119 (19.6); 4.3000 (19.7); 4.2881 (6.6); 2.0444 (0.7); 1.5766 (31.7); 1.3464 (21.4); 1.3345 (42.2); 1.3227 (20.8); 1.2709 (0.3); 1.2592 (0.7); 1.2474 (0.3); 0.8818 (0.6); -0.0001 (32.6)
I-53: $^1\text{H}$ -ЯМР (599,6 МГц, $\text{CDCl}_3$ ): $\delta$ = 9.0493 (16.4); 8.3767 (13.1); 8.3727 (13.8); 8.2389 (11.1); 8.0000 (11.7); 7.8597

(3.4); 7.8558 (3.6); 7.8459 (6.0); 7.8430 (6.1); 7.8332 (3.7); 7.8292 (3.6); 7.2616 (33.4); 7.0261 (6.3); 7.0216 (6.6); 7.0121 (6.2); 7.0075 (6.3); 4.9628 (49.3); 4.3291 (6.4); 4.3172 (19.1); 4.3053 (19.3); 4.2935 (6.6); 1.5612 (47.3); 1.3481 (20.5); 1.3362 (40.5); 1.3244 (20.4); 1.2561 (0.6); -0.0001 (50.0)
I-56: <sup>1</sup> H-ЯМР(400,2 МГц, d <sub>6</sub> -ДМСО): $\delta$ = 9.3944 (7.0); 9.3920 (6.9); 9.3812 (7.2); 9.3788 (6.9); 9.3221 (7.8); 9.3192 (9.0); 9.3172 (9.0); 9.0142 (9.8); 8.5329 (10.3); 8.5266 (10.6); 8.3148 (0.5); 8.1442 (8.1); 8.1408 (8.1); 7.8633 (5.8); 7.8576 (6.0); 7.8501 (5.9); 7.8444 (5.6); 5.7554 (8.3); 5.2382 (1.4); 5.2210 (4.3); 5.2038 (4.3); 5.1867 (1.4); 4.0967 (0.8); 3.7493 (0.4); 3.3336 (65.0); 3.1691 (9.4); 2.6761 (1.4); 2.6716 (1.8); 2.6672 (1.4); 2.5731 (0.4); 2.5071 (247.0); 2.5027 (307.8); 2.4983 (222.9); 2.3339 (1.3); 2.3295 (1.7); 2.3250 (1.3); 1.6203 (16.0); 1.6031 (15.5); 0.0078 (0.8); -0.0002 (18.2)
I-57: <sup>1</sup> H-ЯМР (400,0 МГц, CDCl <sub>3</sub> ): $\delta$ = 9.3511 (1.0); 8.8337 (4.8); 8.3295 (3.9); 8.3234 (4.0); 8.1274 (3.6); 7.5190 (0.9); 7.4320 (2.2); 7.4227 (9.6); 7.4193 (10.6); 7.4046 (7.1); 7.3954 (1.7); 7.3912 (2.0); 7.3815 (1.3); 7.3349 (8.0); 7.3308 (8.4); 7.3259 (3.4); 7.3162 (4.0); 7.3108 (5.0); 7.2601 (153.5); 6.9960 (0.8); 5.3488 (1.4); 5.3320 (3.7); 5.3143 (3.8); 5.2972 (1.0); 2.0080 (1.1); 1.7927 (16.0); 1.7752 (16.0); 0.0080 (5.3); -0.0002 (205.9); -0.0085 (6.0)
I-58: <sup>1</sup> H-ЯМР (400,0 МГц, CDCl <sub>3</sub> ): $\delta$ = 9.3517 (0.5); 8.9574 (4.6); 8.9303 (0.8); 8.3520 (0.8); 8.3351 (3.9); 8.3287 (3.9); 8.0812 (4.0); 7.4009 (1.4); 7.3861 (1.8); 7.3808 (2.8); 7.3660 (2.9); 7.3606 (2.2); 7.3461 (2.0); 7.2606 (82.4); 7.1528 (1.5); 7.1464 (1.6); 7.1315 (2.7); 7.1251 (2.8); 7.1078 (4.7); 7.0887 (3.8); 7.0863 (3.0); 7.0773 (2.5); 7.0716 (2.3); 7.0540 (2.4); 7.0497 (2.4); 5.3110 (1.2); 5.2937 (4.2); 5.2762 (4.2); 5.2588 (1.2); 2.0082 (0.8); 1.7907 (16.0); 1.7825 (3.7); 1.7732 (15.9); 1.7650 (3.0); 0.0080 (3.5); -0.0002 (110.9); -0.0085 (3.3)
I-59: <sup>1</sup> H-ЯМР (400,0 МГц, CDCl <sub>3</sub> ): $\delta$ = 9.1037 (4.0); 8.4860 (3.3); 8.4799 (3.3); 8.3072 (4.4); 8.3007 (4.6); 8.1276 (3.5); 7.9562 (1.9); 7.9498 (1.8); 7.9379 (2.3); 7.9349 (2.4); 7.9317 (2.2); 7.9286 (2.0); 7.9168 (2.0); 7.9104 (1.8); 7.2610 (70.3); 7.0829 (2.9); 7.0757 (3.0); 7.0607 (2.7); 7.0543 (2.8); 5.3203 (1.2); 5.3027 (4.6); 5.2852 (4.7); 5.2676 (1.2); 3.9928 (1.3); 2.0094 (10.0); 1.8014 (16.0); 1.7839 (15.9); 0.0080 (2.5); -0.0002 (92.1); -0.0085 (2.8)
I-60: <sup>1</sup> H-ЯМР(400,0 МГц, d <sub>6</sub> -ДМСО): $\delta$ = 9.0269 (2.6); 9.0235 (2.5); 8.9748 (0.7); 8.7064 (0.6); 8.7000 (0.7); 8.6793 (2.4); 8.6729 (2.5); 8.4117 (1.8); 8.3989 (1.8); 8.3206 (1.6); 8.3171 (1.6); 8.3143 (1.6); 8.3107 (1.4); 7.5469 (1.2); 7.5341 (1.1); 7.5091 (1.9); 6.5316 (0.5); 5.2814 (1.8); 5.2641 (1.8); 5.2474 (0.5); 4.2028 (0.8); 2.6708 (1.0); 2.6664 (0.7); 2.5245 (2.5); 2.5198 (3.4); 2.5109 (54.9); 2.5064 (121.0); 2.5018 (170.4); 2.4973 (120.9); 2.4928 (54.7); 2.3286 (1.1); 1.9088 (16.0); 1.6388 (5.1); 1.6213 (5.7); 1.6022 (1.4); 1.2350 (0.7); 0.0081 (2.6); -0.0002 (102.0); -0.0085 (3.2)
I-61: <sup>1</sup> H-ЯМР (400,0 МГц, CDCl <sub>3</sub> ): $\delta$ = 9.1013 (3.9); 8.4901 (3.5); 8.2990 (5.5); 8.1226 (4.8); 7.9563 (1.7); 7.9498 (1.8); 7.9347 (3.0); 7.9167 (1.9); 7.9104 (1.6); 7.2613 (65.4); 7.0816 (3.6); 7.0743 (3.7); 7.0604 (3.5); 7.0531 (3.2); 5.3207 (1.9); 5.3045 (4.8); 5.2870 (4.5); 5.2693 (1.4); 3.9909 (0.7); 2.8309 (1.3); 2.0091 (8.4); 1.7981 (15.9); 1.7806 (16.0); -0.0002 (85.8)
I-62: <sup>1</sup> H-ЯМР (400,0 МГц, CDCl <sub>3</sub> ): $\delta$ = 9.0841 (4.3); 9.0809 (4.4); 8.3653 (4.2); 8.3589 (4.5); 8.2889 (4.1); 8.2759 (4.2); 8.0389 (3.1); 8.0352 (3.3); 8.0324 (3.3); 8.0289 (3.1); 7.2615 (58.9); 7.1526 (1.6); 7.1487 (2.8); 7.1451 (1.8); 7.1397 (1.8); 7.1359 (2.8); 7.1321 (1.7); 6.9566 (4.4); 5.2990 (1.0); 5.2816 (4.1); 5.2641 (4.2); 5.2465 (1.0); 2.6568 (0.6); 2.0088 (16.0);

1.8008 (13.3); 1.7832 (13.3); 0.0079 (2.0); -0.0002 (77.1); -0.0085 (2.3)
I-63: $^1\text{H}$ -ЯМР (400,0 МГц, $\text{CDCl}_3$ ): $\delta$ = 9.3518 (0.6); 9.0961 (2.1); 8.3374 (2.0); 8.2310 (4.1); 8.2250 (4.2); 8.0144 (2.7); 7.8452 (1.9); 7.8391 (1.7); 7.8242 (2.3); 7.8180 (2.2); 7.8054 (1.8); 7.7992 (1.9); 7.5198 (0.6); 7.2607 (118.4); 7.0280 (2.6); 7.0208 (2.6); 7.0059 (2.4); 6.9998 (2.6); 5.3036 (1.0); 5.2861 (4.6); 5.2686 (4.6); 5.2512 (1.2); 2.0086 (12.1); 1.8012 (16.0); 1.7837 (15.8); 0.1460 (0.6); 0.0080 (3.8); -0.0002 (156.2); -0.0085 (5.1); -0.1496 (0.7)
I-64: $^1\text{H}$ -ЯМР (400,0 МГц, $\text{CDCl}_3$ ): $\delta$ = 9.0087 (2.9); 8.5297 (2.2); 8.1886 (2.7); 7.5191 (1.4); 7.2861 (1.3); 7.2602 (233.6); 7.2423 (3.2); 7.2214 (2.2); 7.1818 (1.7); 6.9962 (1.2); 5.0352 (16.0); 2.0083 (3.6); 0.0079 (7.9); -0.0002 (309.2); -0.0085 (9.2)
I-65: $^1\text{H}$ -ЯМР(400,2 МГц, $d_6$ -ДМСО): $\delta$ = 9.0325 (4.8); 9.0291 (4.7); 8.5273 (4.5); 8.5209 (4.6); 8.3477 (2.8); 8.3416 (2.9); 8.1891 (2.9); 8.1855 (3.2); 8.1827 (3.0); 8.1792 (2.7); 8.1199 (1.0); 8.1137 (1.0); 8.0993 (1.7); 8.0936 (1.6); 8.0792 (1.1); 8.0730 (1.0); 7.3300 (1.8); 7.3235 (1.8); 7.3088 (1.7); 7.3023 (1.7); 5.7550 (6.2); 5.2077 (12.1); 5.1549 (16.0); 3.3246 (50.5); 2.6757 (0.4); 2.6711 (0.6); 2.6665 (0.4); 2.5245 (1.6); 2.5111 (38.4); 2.5067 (76.0); 2.5022 (97.5); 2.4976 (69.2); 2.4932 (33.3); 2.3334 (0.4); 2.3289 (0.6); 2.3243 (0.4); 0.0078 (0.4); -0.0002 (10.8); -0.0084 (0.4)
I-66: $^1\text{H}$ -ЯМР (400,0 МГц, $\text{CDCl}_3$ ): $\delta$ = 9.0388 (2.2); 8.4295 (1.9); 8.4236 (1.9); 8.1949 (2.2); 8.1889 (2.3); 8.0107 (1.7); 8.0071 (2.0); 8.0013 (1.7); 7.8460 (0.9); 7.8397 (0.8); 7.8253 (1.2); 7.8209 (1.1); 7.8062 (0.9); 7.8001 (0.9); 7.2622 (25.3); 7.0195 (1.6); 7.0121 (1.6); 6.9983 (1.7); 6.9919 (1.5); 4.9721 (16.0); 4.3310 (2.1); 4.3131 (6.5); 4.2953 (6.6); 4.2774 (2.2); 1.5961 (0.9); 1.3488 (7.7); 1.3309 (15.7); 1.3131 (7.5); 0.0080 (0.6); -0.0002 (20.9); - 0.0085 (0.6)
I-67: $^1\text{H}$ -ЯМР(400,2 МГц, $d_6$ -ДМСО): $\delta$ = 9.0040 (2.6); 9.0008 (2.6); 8.5251 (2.4); 8.5186 (2.4); 8.3390 (1.6); 8.3333 (1.7); 8.1928 (1.5); 8.1893 (1.8); 8.1865 (1.7); 8.1830 (1.5); 8.1125 (0.5); 8.1061 (0.5); 8.0916 (1.0); 8.0855 (0.9); 8.0717 (0.6); 8.0655 (0.6); 7.3321 (1.0); 7.3260 (1.0); 7.3108 (1.0); 7.3043 (0.9); 5.7559 (1.5); 5.0966 (6.4); 4.2977 (1.6); 4.2864 (2.0); 4.2822 (1.5); 4.2748 (1.8); 3.6530 (1.8); 3.6456 (1.5); 3.6414 (2.0); 3.6300 (1.7); 3.5365 (1.7); 3.5256 (2.6); 3.5208 (1.7); 3.5129 (2.7); 3.4216 (2.7); 3.4138 (1.7); 3.4089 (2.5); 3.3979 (1.7); 3.3258 (55.4); 3.2167 (16.0); 2.6710 (0.4); 2.5065 (51.6); 2.5020 (66.2); 2.4976 (48.0); 2.3288 (0.4); -0.0002 (5.9)
I-68: $^1\text{H}$ -ЯМР (400,0 МГц, $\text{CDCl}_3$ ): $\delta$ = 9.0637 (1.9); 9.0603 (2.0); 8.3755 (1.9); 8.3691 (1.9); 8.2318 (1.2); 8.2257 (1.2); 7.9927 (1.3); 7.9891 (1.4); 7.9864 (1.4); 7.9827 (1.3); 7.8577 (0.5); 7.8516 (0.5); 7.8389 (0.6); 7.8367 (0.7); 7.8328 (0.6); 7.8305 (0.7); 7.8178 (0.6); 7.8116 (0.6); 7.2618 (8.8); 7.0278 (0.8); 7.0205 (0.8); 7.0067 (0.8); 6.9993 (0.8); 5.0170 (7.5); 4.4140 (1.8); 4.4061 (1.0); 4.4024 (1.9); 4.3985 (1.0); 4.3907 (2.0); 3.6668 (2.1); 3.6591 (1.0); 3.6552 (2.0); 3.6516 (1.1); 3.6436 (2.0); 3.4034 (16.0); 1.5613 (2.4); 1.2559 (0.6); -0.0002 (11.4)
I-69: $^1\text{H}$ -ЯМР (400,0 МГц, $\text{CDCl}_3$ ): $\delta$ = 9.0639 (1.9); 9.0608 (1.9); 8.3795 (1.8); 8.3733 (1.9); 8.2312 (1.1); 8.2250 (1.1); 7.9998 (1.4); 7.9961 (1.5); 7.9934 (1.4); 7.9897 (1.3); 7.8588 (0.6); 7.8526 (0.6); 7.8400 (0.7); 7.8377 (0.7); 7.8338 (0.6); 7.8315 (0.7); 7.8190 (0.6); 7.8127 (0.6); 7.2616 (12.2); 7.0311 (0.8); 7.0249 (0.8); 7.0099 (0.7); 7.0039 (0.7); 5.1471 (8.4); 2.0748 (14.5); 2.0452 (1.1); 2.0393 (16.0); 1.5555 (4.0); 1.2596 (0.5); -0.0002 (16.3)
I-71: $^1\text{H}$ -ЯМР(400,2 МГц, $d_6$ -ДМСО):

$\delta = 8.6595 (5.5); 8.6534 (6.3); 8.5824 (6.4); 8.5763 (5.5); 8.2516 (3.1); 8.2454 (3.2); 7.9742 (1.1); 7.9678 (1.1); 7.9531 (1.7); 7.9484 (1.6); 7.9337 (1.2); 7.9273 (1.2); 7.2903 (2.0); 7.2840 (2.0); 7.2688 (1.9); 7.2625 (1.8); 5.7558 (3.2); 4.9664 (13.3); 4.1944 (2.1); 4.1766 (6.8); 4.1589 (6.8); 4.1411 (2.2); 3.3251 (63.1); 2.6762 (0.5); 2.6716 (0.6); 2.6670 (0.5); 2.5248 (2.2); 2.5113 (41.9); 2.5071 (81.8); 2.5026 (104.7); 2.4981 (74.2); 2.4937 (35.5); 2.3338 (0.5); 2.3294 (0.6); 2.3249 (0.5); 1.2113 (7.6); 1.1936 (16.0); 1.1758 (7.4); 0.0079 (0.4); -0.0002 (9.6); -0.0085 (0.3)$
I-72: $^1\text{H}$ -ЯМР(400,2 МГц, $d_6$ -ДМСО): $\delta = 8.6533 (3.1); 8.6472 (3.5); 8.5633 (3.5); 8.5573 (3.1); 8.2491 (1.8); 8.2428 (1.9); 7.9691 (0.7); 7.9627 (0.6); 7.9481 (1.0); 7.9427 (1.0); 7.9286 (0.7); 7.9223 (0.7); 7.2860 (1.2); 7.2795 (1.2); 7.2647 (1.1); 7.2581 (1.1); 5.7557 (4.6); 5.1845 (0.5); 5.1674 (1.9); 5.1500 (1.9); 5.1328 (0.5); 3.6893 (16.0); 3.3245 (36.3); 2.6715 (0.4); 2.5246 (1.4); 2.5112 (26.3); 2.5070 (52.4); 2.5025 (68.1); 2.4980 (49.4); 2.4937 (24.4); 2.3295 (0.4); 1.5992 (6.4); 1.5819 (6.4); -0.0002 (7.1)$
I-74: $^1\text{H}$ -ЯМР(400,2 МГц, $d_6$ -ДМСО): $\delta = 8.3972 (2.0); 8.3910 (12.7); 8.3865 (4.9); 8.3798 (1.4); 7.6420 (1.0); 7.6369 (1.0); 7.6229 (1.1); 7.6173 (1.2); 7.6141 (1.3); 7.6084 (1.1); 7.5945 (1.0); 7.5894 (1.0); 7.5434 (0.9); 7.5219 (1.9); 7.5170 (1.1); 7.5005 (1.3); 7.4955 (1.8); 7.4742 (1.0); 7.2781 (1.2); 7.2724 (1.2); 7.2681 (1.2); 7.2625 (1.1); 7.2567 (1.0); 7.2517 (1.0); 7.2467 (0.9); 5.7560 (5.3); 4.9646 (13.9); 4.2064 (2.2); 4.1886 (7.0); 4.1708 (7.1); 4.1531 (2.3); 3.3250 (65.2); 2.6756 (0.6); 2.6713 (0.7); 2.6670 (0.5); 2.5069 (94.5); 2.5024 (119.5); 2.4980 (85.2); 2.3337 (0.5); 2.3292 (0.7); 2.3249 (0.5); 1.2209 (7.7); 1.2032 (16.0); 1.1854 (7.5); 0.0079 (0.6); -0.0001 (13.2); -0.0083 (0.5)$
I-75: $^1\text{H}$ -ЯМР(400,2 МГц, $d_6$ -ДМСО): $\delta = 13.0565 (0.6); 8.6612 (0.4); 8.6540 (7.9); 8.6480 (9.3); 8.5767 (8.6); 8.5707 (7.7); 8.5631 (1.1); 8.5571 (0.9); 8.3149 (0.5); 8.2392 (4.2); 8.2329 (4.2); 7.9645 (1.5); 7.9582 (1.5); 7.9434 (2.5); 7.9388 (2.2); 7.9372 (2.2); 7.9241 (1.7); 7.9177 (1.6); 7.2870 (2.7); 7.2806 (2.8); 7.2655 (2.6); 7.2592 (2.5); 5.7551 (16.0); 5.1672 (0.4); 5.1498 (0.4); 5.0748 (1.0); 5.0574 (4.1); 5.0400 (4.3); 5.0224 (1.2); 4.1009 (0.9); 4.0885 (0.9); 3.8523 (0.7); 3.6893 (3.7); 3.3269 (54.0); 3.1746 (5.6); 3.1633 (5.4); 2.6804 (0.4); 2.6761 (0.8); 2.6715 (1.2); 2.6670 (0.9); 2.5249 (3.4); 2.5200 (5.6); 2.5115 (73.7); 2.5071 (148.8); 2.5025 (194.0); 2.4980 (138.2); 2.4935 (66.3); 2.3382 (0.4); 2.3339 (0.8); 2.3293 (1.2); 2.3248 (0.8); 1.5992 (1.8); 1.5869 (12.8); 1.5695 (12.7); 1.5465 (0.8); 1.5341 (0.4); 1.5164 (0.3); 1.3554 (1.0); 1.2360 (0.4); 0.0080 (0.8); -0.0001 (24.4); -0.0084 (0.8)$
I-76: $^1\text{H}$ -ЯМР(400,2 МГц, $d_6$ -ДМСО): $\delta = 8.3797 (2.6); 8.3737 (4.1); 8.3695 (3.7); 8.3628 (3.7); 8.3569 (3.6); 8.3463 (3.2); 8.3382 (3.7); 8.3315 (2.2); 8.1247 (1.2); 8.1186 (1.1); 8.1040 (1.9); 8.0986 (1.8); 8.0841 (1.2); 8.0779 (1.1); 7.3030 (2.1); 7.2966 (2.1); 7.2817 (2.0); 7.2753 (2.0); 5.7548 (1.7); 4.9789 (14.1); 4.2136 (2.2); 4.1958 (7.1); 4.1781 (7.1); 4.1603 (2.3); 3.3394 (320.5); 3.1756 (0.6); 3.1625 (0.6); 2.6764 (0.6); 2.6721 (0.7); 2.6677 (0.6); 2.5253 (2.2); 2.5076 (99.1); 2.5032 (124.0); 2.4987 (89.3); 2.3344 (0.6); 2.3300 (0.8); 2.3254 (0.6); 1.2289 (7.7); 1.2111 (16.0); 1.1934 (7.5); -0.0002 (1.5)$
I-77: $^1\text{H}$ -ЯМР(400,2 МГц, $d_6$ -ДМСО): $\delta = 8.3851 (1.4); 8.3790 (2.1); 8.3749 (1.9); 8.3628 (2.0); 8.3541 (2.5); 8.3457 (2.1); 8.3385 (1.2); 8.1251 (0.7); 8.1189 (0.6); 8.1048 (1.1); 8.0989 (1.0); 8.0846 (0.7); 8.0782 (0.7); 7.3040 (1.2); 7.2974 (1.2); 7.2828 (1.2); 7.2760 (1.1); 5.7559 (3.7); 5.0030 (8.0); 3.7172 (16.0); 3.3252 (37.1); 2.6714 (0.4); 2.5112 (27.7); 2.5069 (52.1); 2.5025 (66.1); 2.4981 (47.3); 2.4940 (23.2); 2.3293 (0.4); 0.0078 (0.4); -0.0002 (7.0)$
I-90: $^1\text{H}$ -ЯМР (400,6 МГц, $\text{CDCl}_3$ ):

$\delta$ = 9.0636 (3.8); 9.0601 (3.8); 8.5326 (2.8); 8.5257 (2.8); 8.3920 (1.8); 8.3883 (3.1); 8.3838 (4.7); 8.3767 (3.8); 7.9931 (2.6); 7.9895 (2.8); 7.9867 (2.8); 7.9831 (2.6); 7.5159 (1.2); 7.5115 (1.3); 7.5090 (1.4); 7.5047 (1.2); 7.4938 (1.3); 7.4895 (1.4); 7.4869 (1.4); 7.4826 (1.2); 7.2613 (38.7); 4.9648 (15.4); 4.9574 (1.2); 4.3381 (2.0); 4.3202 (6.2); 4.3024 (6.2); 4.2846 (2.0); 1.5635 (9.6); 1.3544 (7.8); 1.3366 (16.0); 1.3188 (7.5); 0.0080 (1.2); 0.0048 (0.6); -0.0002 (37.1); -0.0057 (0.5); -0.0084 (1.0)
I-91: $^1\text{H}$ -ЯМР (400,6 МГц, $\text{CDCl}_3$ ): $\delta$ = 9.0643 (3.3); 9.0612 (3.4); 8.5340 (2.2); 8.5272 (2.3); 8.3965 (2.6); 8.3915 (4.3); 8.3848 (3.4); 8.0073 (2.6); 8.0037 (2.8); 8.0009 (2.8); 7.9973 (2.6); 7.5254 (1.2); 7.5211 (1.4); 7.5185 (1.4); 7.5142 (1.2); 7.5033 (1.3); 7.4990 (1.4); 7.4964 (1.3); 7.4921 (1.2); 7.2634 (27.2); 4.9693 (15.1); 4.3412 (1.9); 4.3233 (6.1); 4.3055 (6.2); 4.2877 (2.0); 2.9283 (1.3); 1.5761 (2.8); 1.3571 (7.7); 1.3393 (16.0); 1.3215 (7.5); 0.0080 (1.0); -0.0002 (39.8); -0.0085 (1.1)
I-92: $^1\text{H}$ -ЯМР (400,6 МГц, $d_6$ -ДМСО): $\delta$ = 13.1958 (1.1); 9.0176 (5.7); 9.0167 (5.8); 9.0140 (5.7); 9.0131 (5.8); 8.7010 (5.2); 8.6940 (5.2); 8.5368 (6.0); 8.5359 (6.3); 8.5304 (10.8); 8.5295 (11.1); 8.5261 (2.6); 8.1973 (4.9); 8.1938 (5.0); 8.1909 (4.9); 8.1873 (4.7); 7.9956 (2.0); 7.9914 (2.0); 7.9886 (2.0); 7.9844 (1.8); 7.9715 (2.1); 7.9673 (2.2); 7.9646 (1.9); 7.9603 (1.8); 5.7569 (3.5); 4.9917 (16.0); 3.3214 (15.8); 2.6704 (0.7); 2.5649 (0.6); 2.5242 (1.6); 2.5195 (2.3); 2.5107 (35.7); 2.5061 (78.2); 2.5015 (109.9); 2.4969 (75.2); 2.4924 (32.7); 2.4797 (0.5); 2.3286 (0.6); 1.3552 (1.0); 0.0080 (1.0); -0.0002 (32.0); -0.0085 (0.9)
I-93: $^1\text{H}$ -ЯМР (400,6 МГц, $d_6$ -ДМСО): $\delta$ = 9.0142 (6.0); 9.0133 (6.1); 9.0107 (6.0); 9.0097 (6.2); 8.6961 (5.5); 8.6891 (5.5); 8.5291 (6.0); 8.5282 (6.2); 8.5226 (6.5); 8.5217 (6.4); 8.5162 (3.0); 8.5127 (5.1); 8.5121 (5.4); 8.5085 (2.6); 8.1868 (5.2); 8.1832 (5.3); 8.1803 (5.2); 8.1767 (5.0); 7.9775 (2.0); 7.9733 (2.1); 7.9705 (2.1); 7.9663 (1.8); 7.9535 (2.2); 7.9492 (2.3); 7.9465 (2.0); 7.9422 (1.9); 5.7567 (0.6); 4.9803 (16.0); 3.6011 (0.7); 3.3269 (11.1); 2.5249 (1.0); 2.5203 (1.3); 2.5115 (19.2); 2.5069 (42.5); 2.5023 (59.7); 2.4977 (40.6); 2.4931 (17.7); 1.7595 (0.9); 0.0080 (1.9); -0.0002 (72.2); -0.0085 (1.9)
I-94: $^1\text{H}$ -ЯМР (400,6 МГц, $\text{CDCl}_3$ ): $\delta$ = 9.0685 (2.5); 9.0652 (2.5); 8.5224 (1.2); 8.5159 (1.3); 8.4348 (1.5); 8.3895 (2.5); 8.3832 (2.6); 8.0302 (2.1); 8.0265 (2.2); 8.0237 (2.2); 8.0201 (2.0); 7.5281 (0.7); 7.5233 (0.8); 7.5187 (1.0); 7.5059 (0.6); 7.5009 (0.9); 7.4958 (0.6); 7.2604 (96.5); 7.2570 (1.4); 7.2554 (0.8); 7.2546 (0.7); 4.9556 (14.2); 4.3417 (1.8); 4.3239 (5.6); 4.3061 (5.7); 4.2883 (1.8); 1.7764 (0.6); 1.3557 (7.6); 1.3379 (16.0); 1.3200 (7.4); 0.0080 (3.9); 0.0064 (0.6); 0.0055 (0.7); 0.0047 (1.0); 0.0039 (1.4); 0.0022 (5.6); -0.0002 (142.5); -0.0051 (1.5); -0.0059 (1.3); -0.0067 (1.1); -0.0084 (4.0)
I-95: $^1\text{H}$ -ЯМР (400,6 МГц, $\text{CDCl}_3$ ): $\delta$ = 9.0353 (1.8); 9.0318 (1.8); 8.5270 (1.3); 8.5201 (1.3); 8.3972 (0.8); 8.3936 (1.4); 8.3901 (0.9); 8.3757 (1.8); 8.3693 (1.8); 7.9903 (1.4); 7.9866 (1.5); 7.9839 (1.4); 7.9803 (1.4); 7.5160 (0.6); 7.5117 (0.7); 7.5091 (0.7); 7.5047 (0.6); 7.4938 (0.7); 7.4895 (0.7); 7.4869 (0.7); 7.4826 (0.6); 7.2634 (5.2); 5.2817 (1.5); 5.2642 (1.5); 3.8234 (16.0); 1.7391 (6.1); 1.7217 (6.1); 1.5994 (2.1); 0.8817 (0.6); -0.0002 (7.5)
I-96: $^1\text{H}$ -ЯМР (400,6 МГц, $\text{CDCl}_3$ ): $\delta$ = 9.0967 (3.3); 8.5409 (1.8); 8.3984 (1.9); 8.3369 (2.9); 8.3308 (3.0); 8.0012 (2.8); 7.9978 (3.3); 7.9951 (3.4); 7.9916 (2.9); 7.5184 (0.6); 7.5130 (1.5); 7.5089 (1.9); 7.5065 (2.0); 7.5023 (1.7); 7.4912 (1.7); 7.4870 (2.0); 7.4845 (1.9); 7.4804 (1.6); 7.2600 (74.5); 5.3000 (12.8); 5.2827 (5.1); 5.2652 (5.2); 5.2477 (1.2); 1.8013 (16.0); 1.7928 (1.7); 1.7838 (15.9); 1.2546 (0.9); 0.0080 (3.3); -0.0002 (112.6); -0.0084 (3.6)

<p>I-97: <math>^1\text{H}</math>-ЯМР (400,6 МГц, <math>\text{CDCl}_3</math>):  <math>\delta</math>= 9.0941 (5.0); 9.0913 (5.1); 8.5472 (3.3); 8.5407 (3.4); 8.4130 (4.0); 8.3333 (4.9); 8.3268 (5.2); 8.0103 (3.9); 8.0068 (4.3); 8.0039 (4.2); 8.0003 (3.8); 7.5276 (2.0); 7.5233 (2.2); 7.5208 (2.3); 7.5165 (2.0); 7.5057 (2.1); 7.5014 (2.4); 7.4989 (2.2); 7.4946 (1.9); 7.2608 (30.7); 5.3000 (4.9); 5.2804 (5.2); 5.2630 (5.3); 5.2455 (1.2); 1.7998 (16.0); 1.7823 (15.9); 1.7714 (0.9); 0.0080 (1.5); -0.0002 (46.9); -0.0084 (1.3)</p>
<p>I-98: <math>^1\text{H}</math>-ЯМР (400,6 МГц, <math>\text{CDCl}_3</math>):  <math>\delta</math>= 9.0415 (2.1); 9.0389 (2.1); 8.5255 (0.7); 8.3960 (0.8); 8.3709 (2.1); 8.3646 (2.1); 7.9860 (1.8); 7.9824 (2.0); 7.9797 (2.0); 7.9761 (1.8); 7.5156 (0.8); 7.5114 (1.0); 7.5089 (1.0); 7.5047 (0.8); 7.4935 (0.9); 7.4892 (1.0); 7.4867 (1.0); 7.4825 (0.8); 7.2613 (28.0); 5.2665 (0.8); 5.2490 (3.0); 5.2316 (3.0); 5.2142 (0.8); 4.3139 (0.9); 4.3058 (1.1); 4.2961 (3.0); 4.2883 (3.0); 4.2783 (3.1); 4.2705 (3.0); 4.2607 (1.2); 4.2528 (1.0); 1.7348 (11.3); 1.7174 (11.2); 1.5681 (3.4); 1.3353 (7.6); 1.3175 (16.0); 1.2997 (7.3); 0.0080 (1.2); -0.0002 (43.5); -0.0085 (1.3)</p>
<p>I-99: <math>^1\text{H}</math>-ЯМР (400,6 МГц, <math>\text{CDCl}_3</math>):  <math>\delta</math>= 9.0441 (2.8); 9.0409 (2.8); 8.5278 (1.1); 8.5228 (1.1); 8.3858 (1.4); 8.3663 (2.8); 8.3600 (2.9); 7.9750 (2.3); 7.9714 (2.5); 7.9686 (2.4); 7.9650 (2.2); 7.5090 (1.1); 7.5047 (1.2); 7.5021 (1.2); 7.4978 (1.0); 7.4868 (1.1); 7.4825 (1.2); 7.4800 (1.1); 7.4757 (1.0); 7.2619 (19.0); 5.2625 (0.8); 5.2451 (3.0); 5.2277 (3.0); 5.2103 (0.8); 4.3127 (0.9); 4.3048 (1.1); 4.2948 (3.0); 4.2872 (3.1); 4.2770 (3.2); 4.2695 (3.0); 4.2593 (1.2); 4.2518 (0.9); 1.7340 (11.4); 1.7166 (11.2); 1.5813 (2.0); 1.3350 (7.7); 1.3172 (16.0); 1.2994 (7.3); 0.8819 (0.6); 0.0079 (0.7); -0.0002 (29.1); -0.0028 (1.2); -0.0085 (0.9)</p>
<p>I-100: <math>^1\text{H}</math>-ЯМР (400,6 МГц, <math>\text{CDCl}_3</math>):  <math>\delta</math>= 8.1032 (1.3); 8.0989 (1.0); 8.0969 (1.3); 7.7843 (0.6); 7.7780 (0.6); 7.7657 (0.7); 7.7632 (0.7); 7.7594 (0.7); 7.7569 (0.7); 7.7446 (0.6); 7.7383 (0.6); 7.2614 (7.7); 7.1845 (0.5); 7.1803 (0.6); 7.1674 (0.8); 7.1614 (0.9); 7.1489 (1.5); 7.1447 (1.7); 7.1419 (1.5); 7.1380 (1.2); 7.1344 (1.6); 7.1284 (1.0); 6.9809 (0.9); 6.9795 (0.9); 6.9734 (0.9); 6.9721 (0.9); 6.9598 (0.8); 6.9584 (0.9); 6.9523 (0.8); 6.9509 (0.8); 4.9150 (0.5); 4.9076 (8.6); 3.8047 (16.0); 2.0448 (0.9); 1.5524 (4.3); 1.2592 (0.6); -0.0002 (11.4)</p>

## В. Примеры композиций

а) Пылевидный препарат получают посредством смешивания 10 массовых частей соединения формулы (I) и/или его солей и 90 массовых частей талька в качестве инертного вещества и измельчения в бильной мельнице.

б) Смачиваемый порошок, легко диспергируемый в воде, получают

посредством смешивания 25 масс. частей соединения формулы (I) и/или его солей, 64 масс. частей каолин-содержащего кварца в качестве инертного вещества, 10 масс. частей лигносульфоната калия и 1 масс. части олеилметилтаурата натрия в качестве смачивающего средства и диспергента, и измельчают смесь в ударно-дисковой мельнице.

с) Легко диспергируемый в воде дисперсионный концентрат получают посредством смешивания 20 масс. частей соединения формулы (I) и/или его солей с 6 масс. частями алкилфенолполигликолевого простого эфира (®Triton X 207), 3 масс. частями изотридеканолполигликолевого простого эфира (8 EO) и 71 масс. частями парафинового минерального масла (диапазон кипения, например, от около 255 до около 277 C), и измельчают смесь в шаровой мельнице до размера менее 5 микрон.

d) Эмульгируемый концентрат получают посредством смешивания 15 масс. частей соединения формулы (I) и/или его солей, 75 масс. частей циклогексанона в качестве растворителя и 10 масс. частей оксиэтилированного нонилфенола в качестве эмульгатора.

e) Диспергируемые в воде гранулы получают посредством смешивания

75 масс. частей соединения формулы (I) и/или его солей,

10 масс. частей лигносульфоната кальция,

5 масс. частей лаурилсульфата натрия,

3 масс. частей поливинилового спирта и

7 масс. частей каолина,

измельчения смеси в ударно-дисковой мельнице, и гранулирования порошка в псевдооживленном слое посредством распыления воды в качестве гранулирующей среды.

f) Диспергируемый в воде гранулят также получают посредством гомогенизирования и измельчения в коллоидной мельнице

25 масс. частей	соединения формулы (I) и/или его солей,
5 масс. частей	2,2'-динафтилметан-6,6'-дисульфокислого натрия,
2 масс. частей	олеилметилтаурата натрия,
1 масс. части	поливинилового спирта,
17 масс. частей	карбонат кальция и
50 масс. частей	каолина,

затем измельчения смеси в бисерной мельнице и атомизирования и высушивания полученной суспензии в распылительной башне при помощи однофазной форсунки.

### C. Биологические примеры

В приведенных далее таблицах A1 - A21 и B1 - B21 применяются следующие аббревиатуры:

ABUTH:	Канатник Теофраста ( <i>Abutilon theophrasti</i> )	ALOMY:	Лисохвост мышехвостниковидный ( <i>Alopecurus myosuroides</i> )
AMARE:	Амарант запрокинутый ( <i>Amaranthus retroflexus</i> )	AVEFA:	Овёс пустой ( <i>Avena fatua</i> )
DIGSA:	Росичка кроваво-красная ( <i>Digitaria sanguinalis</i> )	ECHCG:	Ежовник обыкновенный ( <i>Echinochloa crus-galli</i> )

HORMU:	Ячмень мышиный ( <i>Hordeum murinum</i> )	LOLRI:	Плевел жёсткий ( <i>Lolium rigidum</i> )
MATIN:	Матрикария непахучая ( <i>Matricaria inodora</i> )	PHBPU:	Ипомея пурпурная ( <i>Pharbitis purpurea</i> )
POAAN:	Мятлик однолетний ( <i>Poa annua</i> )	POLCO:	Горец вьюнковый ( <i>Polygonum convolvulus</i> )
SETVI:	Щетинник зелёный ( <i>Setaria viridis</i> )	STEME:	Звездчатка средняя ( <i>Stellaria media</i> )
VERPE:	Вероника персидская ( <i>Veronica persica</i> )	VIOTR:	Фиалка трёхцветная ( <i>Viola tricolor</i> )

## 1. Гербицидное действие при послевсходовой обработке

- а) Семена однодольных или двудольных сорных или культурных растений высевают в пластиковые или органические горшочки с суглинистой почвой, присыпают землей и помещают в теплицу с контролируемыми условиями роста. По истечении периода, составляющего от двух до трех недель, испытываемые растения на стадии формирования листочков подвергают обработке. Смешанные композиции соединений согласно настоящему изобретению в форме смачивающихся порошков (WP) или в форме эмульгируемых концентратов (EC) распыляют на зеленые части растений в виде водных суспензий или эмульсий с добавлением 0,5 % добавок при водной норме нанесения в пересчете 600 л/га. Примерно через три недели выдержки испытываемых растений в теплице в оптимальных для роста условиях оценивают эффективность препаратов посредством визуальной оценки при сравнении с неподвергнутыми обработке контрольными растениями. Например, 100%-ая эффективность означает гибель всех растений, 0%-ая эффективность означает полное сходство с контрольными растениями.

В далее следующих таблицах с А1 по А15 показаны эффективности выбранных соединений общей формулы (I) в соответствии с таблицами 1 и 2 на различных вредных растениях и при наносимом количестве, соответствующем 320 г/га или 80 г/га, которые были получены в соответствии с вышеупомянутыми исследовательскими методиками.

Таблица А1: Эффективность при послевсходовой обработке против  
ALOMY в %

Номер опыта	Дозировка [г/га]	ALOMY: (%)
I-01	320	90
I-02	320	80
I-04	320	90
I-05	320	100
I-07	320	100
I-08	320	100
I-09	320	90
I-10	320	90
I-11	320	100
I-12	320	90
I-15	320	80
I-16	320	100
I-17	320	100
I-20	320	90
I-21	320	90
I-22	320	100
I-25	320	80
I-34	320	100
I-36	320	100
I-37	320	100
I-39	320	100
I-40	320	90
I-45	320	90
I-46	320	90
I-52	320	90
I-05	80	100
I-07	80	90
I-08	80	100
I-09	80	80
I-10	80	90
I-12	80	90
I-13	80	90
I-15	80	80
I-16	80	90
I-17	80	100
I-20	80	80

I-22	80	90
I-34	80	80
I-37	80	90
I-39	80	90
I-40	80	80
I-45	80	90
I-46	80	90
I-47	80	90
I-48	80	90
I-52	80	80
I-65	80	80
I-67	80	90
I-68	80	80
I-72	80	90
I-89	320	100
I-88	320	100
I-83	320	80
II-03	320	90
I-92	320	80
I-90	320	100
I-93	320	100
I-94	320	80
I-97	320	90
I-96	320	100
I-95	320	100
I-99	320	100
I-98	320	80
I-89	80	80
I-87	80	100
I-88	80	80
I-86	80	90
I-83	80	80
II-03	80	80
I-90	80	80
I-95	80	100
I-99	80	80
I-98	80	80

Таблица A2: Эффективность при послевсходовой обработке против AVEFA в %

Номер опыта	Дозировка [г/га]	AVEFA: (%)
I-05	320	100
I-07	320	100
I-08	320	100
I-09	320	90
I-10	320	90
I-12	320	100
I-15	320	90
I-16	320	100
I-17	320	100
I-20	320	90
I-21	320	80
I-22	320	100
I-34	320	90
I-36	320	90
I-37	320	90
I-39	320	90
I-40	320	80
I-45	320	80
I-46	320	80
I-05	80	90
I-07	80	100
I-08	80	100
I-09	80	90
I-10	80	80
I-12	80	100
I-13	80	100
I-15	80	90
I-16	80	90
I-17	80	90
I-20	80	90
I-22	80	100
I-36	80	90
I-37	80	90
I-39	80	80
I-46	80	80
I-48	80	80
I-72	80	90
I-89	320	100
I-88	320	100
II-03	320	90
I-92	320	90
I-90	320	100

I-91	320	90
I-93	320	100
I-94	320	80
I-97	320	100
I-96	320	90
I-95	320	90
I-99	320	100
I-98	320	80
I-89	80	90
I-87	80	90
I-86	80	90
I-92	80	90
I-93	80	100
I-95	80	80
I-99	80	80
I-98	80	80

Таблица А3: Эффективность при послевсходовой обработке против DIGSA

в %

Номер опыта	Дозировка [г/га]	DIGSA: (%)
I-01	320	80
I-05	320	90
I-07	320	90
I-08	320	80
I-10	320	80
I-12	320	80
I-13	320	90
I-15	320	90
I-16	320	90
I-17	320	90
I-20	320	90
I-22	320	80
I-34	320	80
I-36	320	90
I-37	320	90
I-39	320	90
I-40	320	80
I-05	80	80

I-07	80	80
I-13	80	80
I-17	80	80
I-20	80	80
I-36	80	80
I-39	80	80
I-47	80	80
I-53	80	90

Таблица А4: Эффективность при послевсходовой обработке против ЕСНCG в %

Номер опыта	Дозировка [г/га]	ЕСНCG: (%)
I-01	320	90
I-02	320	80
I-07	320	90
I-08	320	90
I-09	320	80
I-11	320	80
I-12	320	80
I-13	320	90
I-15	320	90
I-16	320	90
I-17	320	90
I-20	320	80
I-37	320	90
I-39	320	90
I-45	320	80
I-52	320	80
I-07	80	80
I-08	80	80
I-09	80	80
I-13	80	80
I-39	80	80
I-48	80	90
I-53	80	80
I-68	80	80
I-89	320	80

II-03	320	80
I-92	320	90
I-90	320	90
I-91	320	90
I-93	320	90
I-94	320	90
I-97	320	90
I-96	320	90
I-95	320	90
I-99	320	90
I-98	320	80
I-92	80	90
I-97	80	90
I-96	80	80
I-95	80	90
I-99	80	90
I-98	80	80

Таблица А5: Эффективность при послевсходовой обработке против LOLRI

в %

Номер опыта	Дозировка [г/га]	LOLRI (%)
I-01	320	90
I-04	320	80
I-05	320	90
I-07	320	90
I-08	320	90
I-09	320	90
I-10	320	90
I-12	320	90
I-15	320	90
I-16	320	90
I-17	320	90
I-20	320	100
I-21	320	90
I-22	320	100
I-34	320	80
I-36	320	90
I-37	320	90

I-39	320	90
I-40	320	80
I-45	320	90
I-46	320	90
I-07	80	80
I-13	80	80
I-15	80	90
I-17	80	90
I-20	80	90
I-22	80	80
I-39	80	90
I-45	80	90
I-46	80	90
I-89	320	100
I-88	320	100
I-92	320	90
I-90	320	80
I-91	320	90
I-93	320	90
I-94	320	90
I-97	320	100
I-96	320	100
I-95	320	90
I-99	320	100
I-98	320	90
I-97	80	90
I-96	80	100
I-95	80	90
I-99	80	100

Таблица А6: Эффективность при послевсходовой обработке против SETVI

в %

Номер опыта	Дозировка [г/га]	SETVI (%)
I-05	320	80
I-07	320	80
I-08	320	80
I-10	320	80
I-11	320	90

I-12	320	80
I-15	320	90
I-16	320	90
I-17	320	80
I-20	320	90
I-22	320	80
I-34	320	90
I-36	320	100
I-37	320	90
I-39	320	80
I-40	320	90
I-45	320	80
I-07	80	80
I-08	80	80
I-15	80	90
I-16	80	80
I-20	80	80
I-22	80	80
I-34	80	80
I-37	80	90
I-39	80	80
I-48	80	80
I-53	80	80
I-89	320	90
I-78	320	100
II-03	320	90
I-92	320	80
I-90	320	90
I-91	320	90
I-93	320	90
I-94	320	90
I-97	320	90
I-96	320	90
I-95	320	90
I-99	320	90
I-98	320	80
I-78	80	80
II-03	80	90
I-92	80	80
I-90	80	80
I-91	80	80
I-93	80	90
I-97	80	90
I-96	80	90
I-95	80	90

I-99	80	90
I-98	80	80

Таблица А7: Эффективность при послевсходовой обработке против АВУТН в %

Номер опыта	Дозировка [г/га]	АВУТН (%)
I-01	320	80
I-05	320	80
I-07	320	90
I-08	320	90
I-11	320	80
I-12	320	80
I-13	320	80
I-15	320	80
I-16	320	80
I-17	320	80
I-20	320	90
I-36	320	80
I-37	320	80
I-39	320	80
I-40	320	80
I-45	320	80
I-52	320	80
I-07	80	80
I-08	80	80
I-15	80	80
I-17	80	80
I-20	80	80
I-37	80	80
I-39	80	80
I-40	80	80
I-53	80	80
I-89	320	90
I-92	320	90
I-90	320	90
I-91	320	80
I-93	320	80

I-94	320	90
I-97	320	90
I-95	320	90
I-98	320	80
I-89	80	90
II-09	80	90
I-90	80	90
I-91	80	80
I-93	80	80
I-97	80	90
I-95	80	90
I-98	80	80

Таблица А8: Эффективность при послевсходовой обработке против AMARE в %

Номер опыта	Дозировка [г/га]	AMARE (%)
I-01	320	90
I-02	320	80
I-04	320	90
I-05	320	80
I-07	320	80
I-08	320	80
I-10	320	80
I-11	320	90
I-12	320	80
I-15	320	80
I-16	320	90
I-17	320	80
I-20	320	100
I-21	320	90
I-22	320	90
I-25	320	80
I-34	320	80
I-36	320	90
I-37	320	90
I-39	320	80
I-40	320	90

I-45	320	90
I-46	320	80
I-52	320	80
I-01	80	80
I-04	80	90
I-11	80	90
I-12	80	80
I-13	80	80
I-15	80	80
I-17	80	80
I-20	80	90
I-21	80	80
I-22	80	90
I-36	80	90
I-40	80	80
I-46	80	80
I-47	80	80
I-52	80	90
I-53	80	80
I-72	80	80
I-89	320	90
I-84	320	90
I-88	320	80
I-80	320	80
II-03	320	90
I-92	320	90
I-90	320	90
I-91	320	90
I-93	320	90
I-94	320	80
I-97	320	90
I-95	320	90
I-99	320	90
I-98	320	80
I-89	80	90
II-10	80	80
II-09	80	90
II-08	80	80
I-87	80	80
II-13	80	80
I-84	80	90
I-80	80	80
I-92	80	80
I-91	80	80
I-93	80	90

I-97	80	90
I-95	80	90
I-99	80	90

Таблица А9: Эффективность при послевсходовой обработке против MATIN

в %

Номер опыта	Дозировка [г/га]	MATIN (%)
I-01	320	90
I-02	320	80
I-04	320	90
I-07	320	90
I-08	320	90
I-11	320	80
I-12	320	80
I-13	320	80
I-15	320	80
I-16	320	80
I-22	320	80
I-34	320	90
I-36	320	80
I-37	320	80
I-39	320	90
I-45	320	80
I-46	320	80
I-01	80	80
I-04	80	80
I-07	80	90
I-08	80	80
I-39	80	80
I-53	80	80
I-89	320	80
I-83	320	80
I-94	320	80
I-97	320	90
I-96	320	90
I-95	320	90
I-99	320	90

I-97	80	90
I-96	80	80
I-95	80	80
I-99	80	80

Таблица А10: Эффективность при послевсходовой обработке против  
РНВРУ в %

Номер опыта	Дозировка [г/га]	РНВРУ (%)
I-01	320	80
I-02	320	90
I-04	320	80
I-07	320	90
I-08	320	90
I-11	320	80
I-12	320	90
I-15	320	90
I-16	320	90
I-20	320	90
I-21	320	80
I-22	320	90
I-34	320	80
I-36	320	90
I-37	320	80
I-39	320	90
I-40	320	90
I-45	320	90
I-01	80	80
I-04	80	80
I-07	80	90
I-08	80	80
I-11	80	80
I-12	80	80
I-13	80	80
I-15	80	90
I-22	80	80
I-36	80	90
I-39	80	80

I-47	80	80
I-52	80	80
I-53	80	80
I-68	80	80
I-92	320	90
I-91	320	90
I-93	320	90
I-94	320	100
I-97	320	100
I-96	320	90
I-95	320	90
I-99	320	90
I-98	320	90
II-10	80	80
I-92	80	80
I-93	80	90
I-97	80	90
I-96	80	90
I-95	80	90
I-99	80	80
I-98	80	90

Таблица А11: Эффективность при послевсходовой обработке против POLCO в %

Номер опыта	Дозировка [г/га]	POLCO (%)
I-01	320	80
I-04	320	90
I-07	320	90
I-08	320	100
I-09	320	100
I-11	320	90
I-12	320	90
I-16	320	90
I-17	320	90
I-20	320	80
I-22	320	80
I-34	320	100

I-36	320	100
I-37	320	100
I-39	320	90
I-40	320	80
I-45	320	100
I-46	320	100
I-48	320	100
I-52	320	80
I-53	320	90
I-01	80	80
I-04	80	80
I-05	80	80
I-07	80	80
I-13	80	80
I-36	80	90
I-40	80	80
I-53	80	90
I-89	320	90
I-84	320	80
I-88	320	80
I-80	320	80
II-03	320	80
I-90	320	80
I-91	320	80
I-94	320	80
I-97	320	90
I-96	320	80
I-95	320	90
I-99	320	80
I-98	320	80
I-89	80	90
II-09	80	80
I-90	80	80
I-91	80	80
I-97	80	90
I-96	80	80
I-95	80	90
I-99	80	80

Таблица A12: Эффективность при послевсходовой обработке против  
STEME в %

Номер опыта	Дозировка [г/га]	STEME (%)
I-01	320	90
I-02	320	80
I-04	320	80
I-05	320	80
I-07	320	90
I-08	320	90
I-09	320	80
I-10	320	90
I-12	320	90
I-07	80	90
I-08	80	90
I-12	80	80
I-13	80	90

Таблица А13: Эффективность при послевсходовой обработке против VIOTR в %

Номер опыта	Дозировка [г/га]	VIOTR (%)
I-01	320	90
I-02	320	80
I-04	320	80
I-05	320	90
I-07	320	90
I-08	320	90
I-09	320	90
I-10	320	100
I-11	320	100
I-12	320	100
I-15	320	90
I-16	320	90
I-17	320	90
I-20	320	90
I-21	320	90
I-22	320	90
I-25	320	90
I-34	320	90

I-36	320	90
I-37	320	90
I-39	320	90
I-40	320	80
I-45	320	90
I-52	320	80
I-01	80	90
I-05	80	90
I-07	80	80
I-08	80	90
I-09	80	90
I-10	80	90
I-11	80	90
I-12	80	90
I-13	80	90
I-15	80	90
I-16	80	80
I-17	80	90
I-20	80	80
I-21	80	80
I-22	80	80
I-34	80	90
I-36	80	90
I-37	80	80
I-39	80	80
I-45	80	80
I-53	80	90
I-65	80	80

Таблица А14: Эффективность при послевсходовой обработке против

VERPE в %

Номер опыта	Дозировка [г/га]	VERPE (%)
I-01	320	90
I-02	320	80
I-04	320	80
I-05	320	90
I-07	320	90
I-08	320	90

I-10	320	90
I-11	320	90
I-12	320	90
I-15	320	90
I-16	320	80
I-17	320	90
I-20	320	90
I-21	320	80
I-22	320	90
I-34	320	80
I-36	320	90
I-37	320	90
I-39	320	90
I-40	320	80
I-45	320	80
I-46	320	80
I-52	320	90
I-01	80	80
I-05	80	80
I-07	80	90
I-08	80	90
I-09	80	90
I-10	80	80
I-11	80	90
I-12	80	80
I-13	80	90
I-15	80	90
I-20	80	80
I-22	80	80
I-37	80	80
I-39	80	80
I-53	80	80
I-65	80	80
I-89	320	90
I-78	320	80
I-84	320	80
I-88	320	80
I-92	320	90
I-90	320	90
I-91	320	80
I-93	320	80
I-94	320	90
I-97	320	90
I-96	320	90
I-95	320	90

I-99	320	90
I-98	320	80
I-89	80	80
II-09	80	90
I-92	80	80
I-90	80	90
I-91	80	80
I-93	80	80
I-94	80	90
I-97	80	90
I-96	80	90
I-95	80	90
I-99	80	90
I-98	80	80

Таблица А15: Эффективность при послевсходовой обработке против  
HORMU в %

Номер опыта	Дозировка [г/га]	HORMU (%)
I-05	320	90
I-07	320	90
I-08	320	90
I-09	320	90
I-10	320	80
I-12	320	90
I-13	320	90
I-07	80	80
I-08	80	80
I-09	80	80
I-10	80	80
I-12	80	90
I-13	80	90

Как показывают результаты, соединения согласно изобретению, такие как соединения № I-01, I-05, I-07, I-08, I-10, I-11, I-12, I-15, I-16, I-17, I-20, I-22, I-

34, I-36, I-37, I-39, I-40, I-45 и I-53 и другие соединения из таблиц А1 - А15 при послевсходовой обработке обладают хорошей гербицидной активностью в отношении вредных растений. При этом, например, соединения № I-05, I-07, I-08, I-10, I-12, I-16, I-17, I-22, I-36, I-37, I-39 и I-40 в способе послевсходовой обработки имеют очень хорошую эффективность (от 80% до 100% гербицидной эффективности) против вредных растений, таких как *Alopecurus myosuroides*, *Amaranthus retroflexus*, *Avena fatua*, *Lolium hardum*, *Polygonum convolvulus*, *Setaria viridis*, *Veronica persica* и *Viola tricolor* при норме нанесения 0,32 кг активного вещества на гектар.

b) Семена однодольных или двудольных сорных растений высевают в пластиковые горшочки с суглинистой почвой (двукратный посев одним видом однодольных или двудольных сорных растений на горшок), присыпают землей и помещают в теплицу с контролируемыми условиями роста. По истечении периода, составляющего от двух до трех недель, испытываемые растения на стадии формирования листочков подвергают обработке. Смешанные композиции соединений согласно настоящему изобретению в форме смачивающихся порошков (WP) или в форме эмульгируемых концентратов (EC) наносят на зеленые части растений в виде водных суспензий или эмульсий, с добавлением 0,5% добавок, при водной норме нанесения в пересчете 600 литров на гектар. Примерно через три недели выдержки испытываемых растений в теплице в оптимальных для роста условиях оценивают эффективность препаратов посредством визуальной оценки при сравнении с неподвергнутыми обработке контрольными растениями. Например,

100%-ая эффективность означает гибель всех растений, 0%-ая эффективность означает полное сходство с контрольными растениями.

В далее следующих таблицах с А16 по А21 показаны эффективности выбранных соединений общей формулы (I) в соответствии с таблицами 1 и 2 на различных вредных растениях и при наносимом количестве, соответствующем 1280 г/га, которые были получены в соответствии с вышеупомянутыми исследовательскими методиками.

Таблица А16: Эффективность при послевсходовой обработке 1280 г/га против РОААН в %

Номер опыта	Дозировка [г/га]	РОААН (%)
I-02	1280	90
I-04	1280	90
I-05	1280	100
I-10	1280	100
I-11	1280	100
I-12	1280	100
I-16	1280	100
I-18	1280	100
I-19	1280	100
I-20	1280	100
I-21	1280	100
I-22	1280	100
I-24	1280	100
I-25	1280	90
I-26	1280	100
I-30	1280	100
I-34	1280	100
I-35	1280	100
I-36	1280	100
I-37	1280	100
I-38	1280	100
I-39	1280	100

I-40	1280	100
I-41	1280	100
I-42	1280	100
I-43	1280	100
I-45	1280	100
I-46	1280	100
I-47	1280	100
I-48	1280	100
I-49	1280	100
I-50	1280	90
I-53	1280	100
I-65	1280	100
I-66	1280	90
I-67	1280	100
I-68	1280	100
I-69	1280	90
I-71	1280	100
I-72	1280	100
I-73	1280	100
I-74	1280	90

Таблица А17: Эффективность при послевсходовой обработке 1280 г/га против DIGSA в %

Номер опыта	Дозировка [г/га]	DIGSA: (%)
I-11	1280	100
I-18	1280	100
I-30	1280	100
I-34	1280	100
I-35	1280	90
I-36	1280	100
I-37	1280	100
I-38	1280	90
I-39	1280	100
I-40	1280	90
I-42	1280	90
I-45	1280	100
I-46	1280	100
I-47	1280	100
I-49	1280	90

I-53	1280	100
I-65	1280	100
I-67	1280	100
I-68	1280	100
I-69	1280	90
I-70	1280	100
I-71	1280	90
I-72	1280	100
I-74	1280	90

Таблица А18: Эффективность при послевсходовой обработке 1280 г/га против ECHCG в %

Номер опыта	Дозировка [г/га]	ECHCG: (%)
I-02	1280	90
I-06	1280	100
I-11	1280	90
I-12	1280	90
I-16	1280	100
I-20	1280	100
I-26	1280	100
I-30	1280	90
I-34	1280	100
I-36	1280	100
I-37	1280	100
I-38	1280	100
I-39	1280	100
I-45	1280	100
I-46	1280	100
I-47	1280	100
I-48	1280	100
I-49	1280	100
I-53	1280	100
I-65	1280	90
I-67	1280	90
I-68	1280	100
I-69	1280	90
I-70	1280	90
I-71	1280	100
I-72	1280	100

I-73	1280	100
------	------	-----

Таблица А19: Эффективность при послевсходовой обработке 1280 г/га против АВУТН в %

Номер опыта	Дозировка [г/га]	АВУТН (%)
I-05	1280	90
I-11	1280	90
I-16	1280	90
I-18	1280	90
I-20	1280	90
I-24	1280	90
I-30	1280	90
I-36	1280	90
I-37	1280	90
I-45	1280	90
I-46	1280	90
I-47	1280	90
I-48	1280	90
I-49	1280	100
I-53	1280	90
I-65	1280	90
I-66	1280	90
I-67	1280	90
I-68	1280	100
I-70	1280	100
I-73	1280	90

Таблица А20: Эффективность при послевсходовой обработке 1280 г/га против МАТИН в %

Номер опыта	Дозировка [г/га]	МАТИН (%)
I-01	1280	90

I-02	1280	90
I-04	1280	90
I-06	1280	90
I-12	1280	90
I-16	1280	90
I-18	1280	90
I-20	1280	100
I-21	1280	90
I-22	1280	90
I-26	1280	100
I-34	1280	90
I-36	1280	90
I-37	1280	90
I-38	1280	90
I-39	1280	90
I-40	1280	100
I-41	1280	90
I-42	1280	100
I-43	1280	100
I-46	1280	90
I-47	1280	90
I-48	1280	100
I-49	1280	100
I-50	1280	90
I-52	1280	90
I-53	1280	100
I-65	1280	100
I-66	1280	90
I-67	1280	100
I-68	1280	90
I-69	1280	90
I-70	1280	100
I-71	1280	100
I-72	1280	100
I-73	1280	100
I-74	1280	90

Таблица А21: Эффективность при послевсходовой обработке 1280 г/га против STEME в %

Номер опыта	Дозировка [г/га]	STEME (%)
I-01	1280	100
I-02	1280	90
I-04	1280	100
I-05	1280	90
I-10	1280	90
I-11	1280	90
I-12	1280	100
I-16	1280	100
I-18	1280	100
I-20	1280	100
I-21	1280	100
I-22	1280	100
I-25	1280	90
I-30	1280	90
I-34	1280	100
I-36	1280	100
I-37	1280	100
I-38	1280	100
I-39	1280	100
I-40	1280	100
I-43	1280	90
I-45	1280	100
I-46	1280	90
I-47	1280	100
I-48	1280	100
I-49	1280	90
I-50	1280	90
I-53	1280	100
I-65	1280	90
I-67	1280	90
I-68	1280	100
I-69	1280	90
I-70	1280	100
I-72	1280	90

Как показывают результаты, соединения общей формулы (I) согласно изобретению при послевсходовой обработке обладают очень хорошей гербицидной активностью (от 90% до 100% гербицидной эффективности) против вредных растений, таких как, например, *Abutilon theophrasti*,

*Digitaria sanguinalis*, *Echinochloa crus-galli*, *Matricaria inodora*, *Poa annua*, *Stellaria media* при норме нанесения 1,28 кг действующего вещества на гектар.

Таким образом, соединения согласно изобретению, проявляют хорошее гербицидное действие против широкого спектра сорняков и сорных трав и поэтому подходят для послевсходовой борьбы с нежелательным ростом растений.

## 2. Гербицидное действие при довсходовой обработке

- a) Семена однодольных или двудольных сорных и культурных растений высеивают в пластиковые или органические горшочки и присыпают землей. Смешанные композиции соединений согласно настоящему изобретению в форме смачивающихся порошков (WP) или в форме эмульгируемых концентратов (EC) наносят на поверхность покрывающей земли в виде водных суспензий или эмульсий с добавлением 0,5% добавок при водной норме нанесения в пересчете 600 л/га. После указанной обработки горшочки с испытуемыми растениями помещают в теплицу и выдерживают в оптимальных для роста условиях. Через три недели оценивают в процентах эффективность препаратов посредством визуальной оценки при сравнении с неподвергнутыми обработке контрольными растениями. Например, 100%-ая эффективность означает гибель всех растений, 0%-ая эффективность означает полное сходство с контрольными растениями.

В далее следующих таблицах с В1 по В15 показаны эффективности выбранных соединений общей формулы (I) в соответствии с таблицами 1 и 2 на различных вредных растениях и при наносимом количестве, соответствующем 320 г/га или 80 г/га, которые были получены в соответствии с вышеупомянутыми исследовательскими методиками.

Таблица В1: Эффективность при довсходовой обработке против ALOMY в %

Номер опыта	Дозировка [г/га]	ALOMY: (%)
I-01	320	80
I-04	320	80
I-05	320	100
I-07	320	100
I-08	320	100
I-09	320	90
I-10	320	100
I-11	320	100
I-12	320	100
I-13	320	100
I-15	320	90
I-16	320	90
I-17	320	100
I-20	320	90
I-21	320	80
I-22	320	100
I-25	320	80
I-34	320	100
I-36	320	100
I-37	320	100
I-39	320	100
I-40	320	100
I-45	320	100
I-46	320	100
I-48	320	100
I-52	320	90

I-53	320	100
I-65	320	90
I-67	320	100
I-68	320	100
I-72	320	90
I-75	320	100
I-89	320	100
I-87	320	100
I-88	320	100
I-86	320	100
I-80	320	100
II-03	320	100
II-02	320	80
I-92	320	90
I-90	320	90
I-91	320	80
I-93	320	90
I-97	320	100
I-96	320	100
I-95	320	100
I-99	320	100
I-98	320	90

Таблица В2: Эффективность при довсходовой обработке против AVEFA в %

Номер опыта	Дозировка [г/га]	AVEFA: (%)
I-05	320	80
I-07	320	90
I-08	320	90
I-09	320	90
I-10	320	90
I-12	320	90
I-13	320	90
I-15	320	80
I-16	320	90
I-17	320	100
I-20	320	80

I-22	320	90
I-34	320	90
I-36	320	100
I-37	320	90
I-39	320	90
I-45	320	80
I-46	320	90
I-48	320	90
I-53	320	90
I-67	320	80
I-68	320	90
I-72	320	80
I-75	320	90
I-87	320	90
I-88	320	90
II-03	320	100
I-92	320	100
I-90	320	100
I-91	320	90
I-93	320	100
I-97	320	90
I-96	320	90
I-95	320	90
I-99	320	90
I-98	320	80

Таблица В3: Эффективность при довсходовой обработке против DIGSA в %

Номер опыта	Дозировка [г/га]	DIGSA: (%)
I-01	320	90
I-02	320	90
I-04	320	90
I-05	320	100
I-07	320	100
I-08	320	100
I-09	320	100
I-10	320	100
I-11	320	100

I-12	320	100
I-13	320	100
I-15	320	100
I-16	320	100
I-17	320	100
I-20	320	100
I-21	320	90
I-22	320	100
I-34	320	100
I-36	320	100
I-37	320	100
I-39	320	100
I-40	320	100
I-45	320	100
I-46	320	100
I-47	80	100
I-48	320	100
I-52	320	100
I-53	320	100

Таблица В4: Эффективность при дождевой обработке против ЕСНCG в %

Номер опыта	Дозировка [г/га]	ЕСНCG: (%)
I-01	320	80
I-05	320	90
I-07	320	100
I-08	320	100
I-09	320	100
I-13	320	100
I-15	320	100
I-17	320	100
I-20	320	90
I-34	320	80
I-36	320	100
I-37	320	90
I-39	320	100
I-46	320	100

I-48	320	100
I-53	320	100
I-67	320	90
I-68	320	90
I-92	320	90
I-90	320	100
I-91	320	100
I-93	320	100
I-94	320	100
I-97	320	100
I-96	320	100
I-95	320	100
I-99	320	100
I-98	320	100

Таблица В5: Эффективность при довсходовой обработке против LOLRI в %

Номер опыта	Дозировка [г/га]	LOLRI (%)
I-01	320	80
I-04	320	90
I-05	320	100
I-07	320	100
I-08	320	100
I-09	320	90
I-10	320	100
I-11	320	100
I-12	320	100
I-15	320	100
I-16	320	100
I-17	320	100
I-20	320	100
I-21	320	90
I-22	320	100
I-34	320	100
I-36	320	100
I-37	320	100
I-39	320	100
I-40	320	90

I-45	320	90
I-46	320	100
I-48	320	100
I-52	320	100
I-53	320	80
I-65	320	80
I-68	320	80
I-72	320	100
I-75	320	100
I-89	320	100
I-87	320	100
I-88	320	100
I-86	320	100
I-80	320	80
II-03	320	100
I-92	320	100
I-90	320	100
I-91	320	100
I-93	320	100
I-94	320	90
I-97	320	100
I-96	320	100
I-95	320	100
I-99	320	100
I-98	320	90

Таблица В6: Эффективность при дождевой обработке против SETVI в %

Номер опыта	Дозировка [г/га]	SETVI (%)
I-05	320	90
I-07	320	100
I-08	320	100
I-09	320	90
I-10	320	100
I-11	320	100
I-12	320	100
I-13	320	100
I-15	320	100

I-16	320	100
I-17	320	100
I-20	320	100
I-21	320	90
I-22	320	100
I-34	320	100
I-36	320	100
I-37	320	100
I-39	320	100
I-40	320	100
I-45	320	100
I-46	320	100
I-48	320	100
I-52	320	90
I-53	320	100
I-65	320	100
I-67	320	90
I-68	320	100
I-89	320	100
I-78	320	90
II-12	320	100
I-87	320	100
I-88	320	80
II-03	320	100
I-92	320	100
I-90	320	100
I-91	320	100
I-93	320	100
I-97	320	100
I-96	320	100
I-95	320	100
I-99	320	100
I-98	320	100

Таблица В7: Эффективность при довсходовой обработке против АВУТН в

%

Номер опыта	Дозировка [г/га]	АВУТН (%)
-------------	------------------	-----------

I-08	320	80
I-39	320	90
I-46	320	80
I-48	320	100
I-92	320	90
I-91	320	90
I-97	320	90
I-96	320	90
I-95	320	90
I-99	320	90
I-98	320	90

Таблица В8: Эффективность при довсходовой обработке против AMARE в  
%

Номер опыта	Дозировка [г/га]	AMARE (%)
I-01	320	100
I-02	320	100
I-04	320	100
I-05	320	100
I-07	320	100
I-08	320	100
I-09	320	100
I-10	320	90
I-11	320	90
I-12	320	100
I-13	320	100
I-15	320	100
I-16	320	100
I-17	320	100
I-20	320	100
I-21	320	100
I-22	320	90
I-34	320	90
I-36	320	100
I-37	320	90
I-39	320	100
I-40	320	90

I-45	320	100
I-46	320	100
I-47	80	90
I-48	320	100
I-52	320	100
I-53	320	100
I-65	320	100
I-67	320	100
I-68	320	100
I-72	320	100
I-75	320	90
I-76	320	90
I-77	320	80
I-89	320	100
I-78	320	80
II-08	320	90
II-12	320	80
II-14	320	80
II-13	320	90
I-84	320	90
I-86	320	80
I-80	320	100
II-03	320	100
I-92	320	100
I-90	320	100
I-91	320	100
I-93	320	100
I-97	320	100
I-96	320	100
I-95	320	100
I-99	320	100
I-98	320	100

Таблица В9: Эффективность при довсходовой обработке против MATIN в %

Номер опыта	Дозировка [г/га]	MATIN (%)
I-01	320	90

I-02	320	90
I-04	320	90
I-07	320	90
I-08	320	90
I-11	320	90
I-15	320	100
I-16	320	90
I-20	320	90
I-21	320	80
I-36	320	80
I-37	320	90
I-39	320	90
I-45	320	100
I-46	320	100
I-48	320	100
I-52	320	90
I-53	320	100
I-65	320	90
I-67	320	80
I-68	320	90
I-76	320	90
I-77	320	80
I-92	320	100
I-90	320	100
I-91	320	100
I-93	320	100
I-94	320	90
I-97	320	100
I-96	320	100
I-95	320	100
I-99	320	100
I-98	320	90

Таблица В10: Эффективность при довсходовой обработке против РНВРУ

в %

Номер опыта	Дозировка [г/га]	РНВРУ (%)
I-05	320	80

I-07	320	90
I-08	320	90
I-11	320	90
I-15	320	90
I-48	320	90
I-52	320	100
I-67	320	80
I-68	320	80
I-92	320	90
I-91	320	90
I-93	320	100
I-97	320	100
I-96	320	90
I-95	320	90
I-99	320	90
I-98	320	80

Таблица В11: Эффективность при дождевой обработке против POLCO

в %

Номер опыта	Дозировка [г/га]	POLCO (%)
I-01	320	80
I-04	320	90
I-07	320	90
I-08	320	100
I-09	320	100
I-11	320	90
I-12	320	90
I-13	320	90
I-16	320	90
I-17	320	90
I-20	320	80
I-22	320	80
I-34	320	100
I-36	320	100
I-37	320	100
I-39	320	90
I-40	320	80

I-45	320	100
I-46	320	100
I-48	320	100
I-52	320	80
I-53	320	90
I-67	320	90
I-72	320	90
I-75	320	80
I-88	320	80
I-86	320	80
II-03	320	90
I-92	320	90
I-90	320	100
I-91	320	90
I-93	320	100
I-97	320	90
I-96	320	100
I-95	320	100
I-99	320	90
I-98	320	90

Таблица В12: Эффективность при довсходовой обработке против STEME  
в %

Номер опыта	Дозировка [г/га]	STEME (%)
I-01	320	80
I-04	320	90
I-05	320	100
I-07	320	100
I-08	320	100
I-12	320	90
I-13	320	90

Таблица В13: Эффективность при довсходовой обработке против VIOTR в  
%

Номер опыта	Дозировка [г/га]	VIOTR (%)
I-05	320	100
I-07	320	100
I-08	320	100
I-09	320	90
I-10	320	80
I-11	320	100
I-12	320	100
I-13	320	100
I-15	320	100
I-16	320	100
I-17	320	100
I-20	320	90
I-21	320	100
I-22	320	90
I-25	320	90
I-34	320	100
I-36	320	100
I-37	320	100
I-39	320	100
I-40	320	90
I-45	320	100
I-46	320	100
I-48	320	100
I-52	320	90
I-53	320	100
I-65	320	90
I-67	320	90
I-68	320	90
I-72	320	90
I-75	320	80
I-77	320	80

Таблица В14: Эффективность при довсходовой обработке против VERPE в

%

Номер опыта	Дозировка [г/га]	VERPE (%)
-------------	------------------	-----------

I-01	320	90
I-02	320	100
I-04	320	90
I-05	320	100
I-07	320	100
I-08	320	100
I-11	320	90
I-12	320	80
I-13	320	100
I-15	320	100
I-16	320	100
I-17	320	100
I-20	320	100
I-21	320	90
I-25	320	90
I-32	320	90
I-36	320	100
I-37	320	100
I-39	320	100
I-45	320	80
I-46	320	100
I-48	320	100
I-52	320	90
I-53	320	90
I-65	320	90
I-67	320	90
I-68	320	90
I-72	320	80
I-89	320	100
I-87	320	80
I-88	320	90
I-80	320	80
II-03	320	100
II-06	320	100
I-92	320	100
I-90	320	100
I-91	320	90
I-93	320	100
I-97	320	100
I-96	320	100
I-95	320	100
I-99	320	100
I-98	320	100

Таблица В15: Эффективность при довсходовой обработке против НОРМУ  
в %

Номер опыта	Дозировка [г/га]	НОРМУ (%)
I-05	320	90
I-07	320	90
I-08	320	100
I-10	320	80
I-12	320	90
I-13	320	100

Как показывают результаты, соединения согласно изобретению, такие как соединения № I-01, I-05, I-07, I-08, I-11, I-12, I-13, I-15, I-16, I-17, I-20, I-22, I-34, I-36, I-37, I-39, I-45, I-46, I-48, I-52 и I-53 и другие соединения из таблиц В1 - В15 при довсходовой обработке обладают хорошей гербицидной активностью в отношении вредных растений. При этом, например, соединения № I-07, I-08, I-11, I-12, I-13, I-16, I-17, I-20, I-36, I-37, I-39, I-45, I-46, I-48, I-52 и I-53 в способе довсходовой обработки имеют очень хорошую эффективность (от 80% до 100% гербицидной эффективности) против вредных растений, таких как *Alopecurus myosuroides*, *Amaranthus retroflexus*, *Digitaria sanguinalis*, *Lolium hardum*, *Polygonum convolvulus*, *Setaria viridis*, *Veronica persica* и *Viola tricolor* при норме нанесения 0,32 кг активного вещества на гектар.

- b) Семена однодольных и двудольных сорных растений высевают в пластиковые горшочки с суглинистой почвой (двукратный посев одним видом однодольных или двудольных сорных растений на горшок) и

присыпают землей. Смешанные композиции соединений согласно настоящему изобретению в форме смачивающихся порошков (WP) или в форме эмульгируемых концентратов (EC) наносят на поверхность покрывающей земли в виде водных суспензий или эмульсий, с добавлением 0,5% добавок, при водной норме нанесения в пересчете 600 литров на гектар. После указанной обработки горшочки с испытуемыми растениями помещают в теплицу и выдерживают в оптимальных для роста условиях. Через три недели оценивают в процентах эффективность препаратов посредством визуальной оценки при сравнении с неподвергнутыми обработке контрольными растениями. Например, 100%-ая эффективность означает гибель всех растений, 0%-ая эффективность означает полное сходство с контрольными растениями.

В далее следующих таблицах с B16 по B21 показаны эффективности выбранных соединений общей формулы (I) в соответствии с таблицами 1 и 2 на различных вредных растениях и при наносимом количестве, соответствующем 1280 г/га, которые были получены в соответствии с вышеупомянутыми исследовательскими методиками.

Таблица B16: Эффективность при довсходовой обработке 1280 г/га против POAAN в %

Номер опыта	Дозировка [г/га]	POAAN (%)
I-01	1280	100
I-02	1280	100

I-04	1280	100
I-05	1280	100
I-06	1280	100
I-09	1280	100
I-10	1280	100
I-11	1280	100
I-12	1280	100
I-16	1280	100
I-18	1280	100
I-19	1280	100
I-20	1280	100
I-21	1280	100
I-22	1280	100
I-24	1280	100
I-25	1280	100
I-26	1280	100
I-30	1280	100
I-34	1280	100
I-35	1280	100
I-36	1280	100
I-37	1280	100
I-38	1280	100
I-39	1280	100
I-40	1280	100
I-41	1280	100
I-42	1280	100
I-43	1280	100
I-45	1280	100
I-46	1280	100
I-47	1280	100
I-48	1280	100
I-49	1280	100
I-50	1280	100
I-52	1280	100
I-53	1280	100
I-65	1280	100
I-66	1280	100
I-67	1280	100
I-68	1280	100
I-69	1280	100
I-70	1280	100
I-71	1280	100
I-72	1280	100
I-73	1280	100
I-74	1280	100
II-01	1280	100

Таблица В17: Эффективность при довсходовой обработке 1280 г/га против DIGSA в %

Номер опыта	Дозировка [г/га]	DIGSA: (%)
I-11	1280	90
I-18	1280	100
I-24	1280	100
I-25	1280	100
I-26	1280	100
I-30	1280	100
I-34	1280	100
I-35	1280	90
I-36	1280	100
I-37	1280	100
I-38	1280	100
I-39	1280	100
I-40	1280	100
I-41	1280	100
I-42	1280	100
I-43	1280	100
I-45	1280	100
I-46	1280	100
I-47	1280	100
I-48	1280	100
I-49	1280	100
I-50	1280	100
I-52	1280	100
I-53	1280	100
I-65	1280	100
I-66	1280	100
I-67	1280	100
I-68	1280	100
I-69	1280	100
I-70	1280	100
I-71	1280	100
I-72	1280	100
I-74	1280	100

Таблица В18: Эффективность при довсходовой обработке 1280 г/га против  
ЕСНCG в %

Номер опыта	Дозировка [г/га]	ЕСНCG: (%)
I-01	1280	100
I-02	1280	100
I-04	1280	100
I-05	1280	100
I-06	1280	100
I-09	1280	100
I-11	1280	90
I-12	1280	100
I-16	1280	100
I-18	1280	100
I-20	1280	100
I-21	1280	100
I-22	1280	100
I-23	1280	100
I-25	1280	90
I-26	1280	100
I-30	1280	100
I-34	1280	90
I-36	1280	90
I-37	1280	100
I-38	1280	100
I-39	1280	100
I-40	1280	100
I-41	1280	100
I-45	1280	100
I-46	1280	100
I-47	1280	100
I-48	1280	100
I-49	1280	100
I-53	1280	100
I-65	1280	100
I-66	1280	90
I-67	1280	100
I-68	1280	100
I-69	1280	100
I-70	1280	100
I-71	1280	100
I-72	1280	100

I-73	1280	100
II-01	1280	90

Таблица В19: Эффективность при довсходовой обработке 1280 г/га против AMARE в %

Номер опыта	Дозировка [г/га]	AMARE (%)
I-01	1280	100
I-02	1280	100
I-04	1280	100
I-05	1280	100
I-06	1280	90
I-09	1280	90
I-10	1280	100
I-11	1280	100
I-12	1280	100
I-16	1280	100
I-18	1280	100
I-19	1280	100
I-20	1280	100
I-21	1280	100
I-22	1280	100
I-23	1280	100
I-24	1280	90
I-25	1280	100
I-26	1280	90
I-30	1280	100
I-34	1280	100
I-35	1280	90
I-36	1280	100
I-37	1280	100
I-38	1280	100
I-39	1280	100
I-40	1280	100
I-41	1280	100
I-42	1280	90
I-43	1280	100
I-45	1280	100
I-46	1280	100

I-47	1280	100
I-48	1280	100
I-49	1280	100
I-50	1280	100
I-52	1280	90
I-53	1280	100
I-65	1280	100
I-66	1280	100
I-67	1280	100
I-68	1280	100
I-69	1280	100
I-70	1280	100
I-71	1280	100
I-72	1280	100
I-73	1280	100
I-74	1280	100
II-01	1280	100

Таблица В20: Эффективность при довсходовой обработке 1280 г/га против

MATIN в %

Номер опыта	Дозировка [г/га]	MATIN (%)
I-01	1280	100
I-02	1280	100
I-04	1280	100
I-05	1280	90
I-06	1280	90
I-09	1280	100
I-10	1280	90
I-11	1280	90
I-12	1280	90
I-16	1280	100
I-18	1280	90
I-20	1280	100
I-21	1280	100
I-22	1280	90
I-25	1280	90
I-30	1280	90
I-34	1280	100
I-36	1280	90

I-37	1280	100
I-38	1280	100
I-39	1280	100
I-40	1280	100
I-41	1280	100
I-42	1280	90
I-43	1280	90
I-45	1280	100
I-46	1280	100
I-47	1280	100
I-48	1280	100
I-49	1280	100
I-50	1280	90
I-52	1280	90
I-53	1280	100
I-65	1280	100
I-66	1280	100
I-67	1280	100
I-68	1280	100
I-69	1280	100
I-70	1280	100
I-71	1280	100
I-72	1280	100
I-73	1280	100
I-74	1280	100
II-01	1280	100

Таблица В21: Эффективность при дождевой обработке 1280 г/га против  
STEME в %

Номер опыта	Дозировка [г/га]	STEME (%)
I-01	1280	100
I-02	1280	100
I-04	1280	100
I-05	1280	100
I-06	1280	100
I-09	1280	100
I-10	1280	100
I-11	1280	100
I-12	1280	100

I-16	1280	100
I-18	1280	100
I-19	1280	100
I-20	1280	100
I-21	1280	100
I-22	1280	100
I-24	1280	90
I-26	1280	100
I-30	1280	100
I-34	1280	100
I-35	1280	100
I-36	1280	100
I-37	1280	100
I-38	1280	100
I-39	1280	100
I-40	1280	100
I-41	1280	100
I-42	1280	90
I-43	1280	100
I-45	1280	100
I-46	1280	100
I-47	1280	100
I-48	1280	100
I-49	1280	100
I-50	1280	90
I-52	1280	100
I-53	1280	100
I-65	1280	100
I-66	1280	100
I-67	1280	100
I-68	1280	100
I-69	1280	100
I-70	1280	100
I-71	1280	100
I-72	1280	100
I-73	1280	100
I-74	1280	100
II-01	1280	100

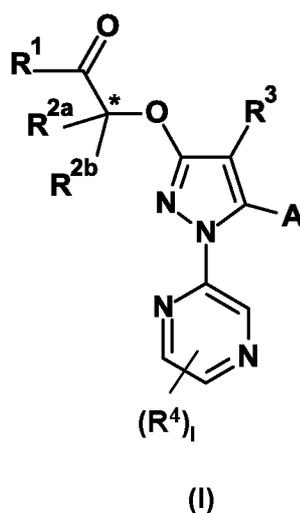
Как показывают результаты, соединения общей формулы (I) согласно изобретению при довсходовой обработке обладают очень хорошей гербицидной активностью (от 90% до 100% гербицидной эффективности)

против вредных растений, таких как, например, *Amaranthus retroflexus*, *Digitaria sanguinalis*, *Echinochloa crus-galli*, *Matricaria inodora*, *Poa annua*, *Stellaria media* при норме нанесения 1,28 кг действующего вещества на гектар.

Таким образом, соединения согласно изобретению, проявляют хорошее гербицидное действие против широкого спектра сорняков и сорных трав и поэтому подходят для довсходовой борьбы с нежелательным ростом растений.

### ФОРМУЛА ИЗОБРЕТЕНИЯ

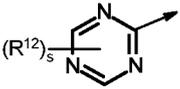
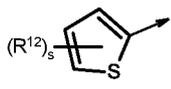
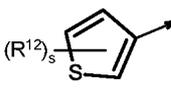
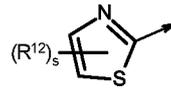
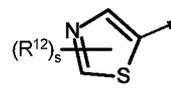
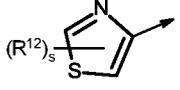
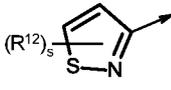
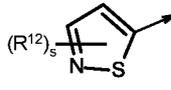
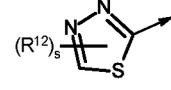
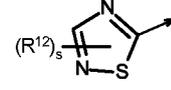
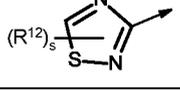
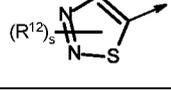
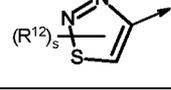
1. Замещенные 1-пиразинилпиразолил-3-оксиалкиловые кислоты общей формулы (I), а также их агрохимически приемлемые соли, N-оксиды, гидраты и гидраты солей и N-оксидов,



причем

A представляет собой A1-A28:

A1	A2	A3	A4	A5
A6	A7	A8	A9	A10
A11	A12	A13	A14	A15

				
A16	A17	A18	A19	A20
				
A21	A22	A23	A24	A25
				
A26	A27	A28		

$R^1$  представляет собой

- $OR^{1a}$  или
- $NR^9R^{10}$ ; в которой

$R^{1a}$

- означает водород;
- означает  $(C_1-C_{12})$ -алкил, который является незамещенным или замещен одним или несколькими заместителями, выбранными из группы, состоящей из галогена,  $(C_3-C_6)$ -циклоалкила,  $(C_1-C_4)$ -триалкилсилила,  $(C_1-C_6)$ -алкокси,  $(C_1-C_4)$ -алкокси- $(C_1-C_4)$ -алкокси, циано и нитро;
- означает  $(C_2-C_6)$ -алкенил,  $(C_2-C_6)$ -галогеналкенил;
- означает  $(C_2-C_6)$ -алкинил;
- означает  $(C_3-C_6)$ -циклоалкил, который является незамещенным или замещен одним или несколькими заместителями, выбранными из группы, состоящей из галогена,  $(C_1-C_6)$ -алкила,  $(C_3-C_6)$ -циклоалкила;
- означает  $(C_1-C_4)$ -алкил-SO- $(C_1-C_4)$ -алкил,  $(C_1-C_4)$ -алкил-SO<sub>2</sub>- $(C_1-$

$C_4$ )-алкил;

- означает гетероциклил, гетероарил и арил, который является незамещенным или замещен одним или несколькими заместителями, выбранными из группы, состоящей из галогена,  $(C_1-C_6)$ -алкила,  $(C_1-C_6)$ -галогеналкила;
- означает гетероциклил- $(C_1-C_4)$ -алкил-, гетероарил- $(C_1-C_4)$ -алкил- и арил- $(C_1-C_4)$ -алкил-, причем гетероциклил, гетероарил и арил является незамещенным или замещен одним или несколькими заместителями, выбранными из группы, состоящей из галогена,  $(C_1-C_6)$ -алкила,  $(C_1-C_6)$ -галогеналкила;
- означает  $(C_1-C_6)$ -алкилиденамино:

$R^9$  означает водород и  $(C_1-C_{12})$ -алкил;

$R^{10}$

- означает водород;
  - означает арил, гетероарил, гетероциклил, который является незамещенным или замещен одним или несколькими заместителями, выбранными из группы, состоящей из галогена,  $(C_1-C_6)$ -алкила,  $(C_1-C_6)$ -галогеналкила;
  - означает  $(C_3-C_7)$ -циклоалкил- $(C_1-C_4)$ -алкил-, гетероциклил- $(C_1-C_4)$ -алкил-, гетероарил- $(C_1-C_4)$ -алкил-, арил- $(C_1-C_4)$ -алкил-, арил- $(C_1-C_4)$ -алкокси;
- причем циклоалкил, гетероциклил, гетероарил, и арил является незамещенным или замещен одним или несколькими заместителями, выбранными из группы, состоящей из галогена,  $(C_1-C_6)$ -алкила,  $(C_1-C_6)$ -галогеналкила;

- означает (C<sub>1</sub>-C<sub>12</sub>)-алкил; (C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)-циклоалкил, (C<sub>2</sub>-C<sub>12</sub>)-алкенил, (C<sub>5</sub>-C<sub>8</sub>) циклоалкенил, (C<sub>2</sub>-C<sub>12</sub>)-алкинил;
- причем указанные выше алкильный, циклоалкильный, алкенильный, циклоалкенильный и алкинильный остатки являются незамещенными или в каждом случае независимо друг от друга замещены m остатками, выбранными из группы, состоящей из циано, нитро, OR<sup>5</sup>, S(O)<sub>n</sub>R<sup>5</sup>, SO<sub>2</sub>NR<sup>6</sup>R<sup>7</sup>, C(O)OR<sup>8</sup>, CONR<sup>6</sup>R<sup>8</sup>, COR<sup>6</sup>, NR<sup>6</sup>R<sup>8</sup>, NR<sup>6</sup>COR<sup>8</sup>, NR<sup>6</sup>CONR<sup>8</sup>R<sup>8</sup>, NR<sup>6</sup>CO<sub>2</sub>R<sup>8</sup>, NR<sup>6</sup>SO<sub>2</sub>R<sup>8</sup>, NR<sup>6</sup>SO<sub>2</sub>NR<sup>6</sup>R<sup>8</sup>, C(R<sup>6</sup>)=NOR<sup>8</sup>;
- означает (C<sub>1</sub>-C<sub>12</sub>)-галогеналкил;
  - означает S(O)<sub>2</sub>R<sup>5</sup>, циано, нитро, OR<sup>5</sup>, SO<sub>2</sub>NR<sup>6</sup>R<sup>7</sup>, CO<sub>2</sub>R<sup>8</sup>, COR<sup>8</sup>, NR<sup>6</sup>R<sup>8</sup>, NR<sup>6</sup>COR<sup>8</sup>, NR<sup>6</sup>CO<sub>2</sub>R<sup>8</sup>, NR<sup>6</sup>SO<sub>2</sub>R<sup>8</sup>;

или

- R<sup>9</sup> и R<sup>10</sup> вместе с атомом азота, к которому они присоединены, образуют при необходимости замещенный от одного до шести раз остатком из группы, состоящей из галогена, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-алкила, галоген-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-алкила, OR<sup>5</sup>, S(O)<sub>n</sub>R<sup>5</sup>, CO<sub>2</sub>R<sup>8</sup>, CONR<sup>6</sup>R<sup>8</sup>, COR<sup>6</sup> и C(R<sup>6</sup>)=NOR<sup>8</sup>, насыщенное, частично или полностью ненасыщенное пяти-, шести- или семичленное кольцо, которое помимо данного атома азота содержит g атомов углерода, o атомов кислорода, p атомов серы и q элементов из группы, состоящей из NR<sup>7</sup>, CO и NCOR<sup>7</sup>, в качестве кольцевых атомов;
- R<sup>5</sup> представляет собой (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>)-галогеналкил, (C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>)-алкенил или арил.

- $R^6$  представляет собой водород или  $R^5$ ;
- $R^7$  представляет собой водород,  $(C_1-C_6)$ -алкил,  $(C_3-C_6)$ -циклоалкил,  $(C_2-C_4)$ -алкенил или  $(C_3-C_4)$ -алкинил;
- $R^8$  представляет собой водород,  $(C_1-C_6)$ -алкил,  $(C_3-C_6)$ -циклоалкил,  $(C_3-C_4)$ -алкенил или  $(C_3-C_4)$ -алкинил;

$R^{2a}$  представляет собой

- водород, галоген, циано;
- $(C_1-C_6)$ -алкил,  $(C_1-C_4)$ -алкокси- $(C_1-C_4)$ -алкил,  $(C_1-C_6)$ -галогеналкил,  $(C_1-C_6)$ -алкокси;
- $(C_2-C_6)$ -алкенил,  $(C_2-C_6)$ -галогеналкенил;
- $(C_2-C_6)$ -алкинил,  $(C_2-C_6)$ -галогеналкинил;
- $(C_3-C_6)$ -циклоалкил;

$R^{2b}$  представляет собой

- водород и  $(C_1-C_4)$ -алкил;

$R^3$  представляет собой

- галоген, циано, изоциано,  $NO_2$ ;
- $(C_1-C_6)$ -алкил,  $(C_3-C_6)$ -циклоалкил,  $(C_1-C_6)$ -галогеналкил,  $(C_1-C_6)$ -алкилкарбонил,  $(C_1-C_6)$ -галогеналкилкарбонил,  $(C_1-C_4)$ -алкилоксикарбонил;
- $(C_2-C_3)$ -алкенил,  $(C_2-C_3)$ -галогеналкенил;
- $(C_2-C_3)$ -алкинил,  $(C_2-C_3)$ -галогеналкинил;
- $(C_1-C_2)$ -алкил- $S(O)_n$  и  $(C_1-C_2)$ -галогеналкил- $S(O)_n$ ;
- $CHO$ ,  $C(O)NH_2$ ;

- NH<sub>2</sub>;

R<sup>4</sup> представляет собой

- галоген, циано, изоциано, нитро;
- (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>)-галогеналкил, (C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)-галогеналкокси;
- (C<sub>2</sub>-C<sub>3</sub>)-алкенил, (C<sub>2</sub>-C<sub>3</sub>)-галогеналкенил;
- (C<sub>2</sub>-C<sub>3</sub>)-алкинил, (C<sub>2</sub>-C<sub>3</sub>)-галогеналкинил;
- (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-алкил-S(O)<sub>n</sub>, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-галогеналкил-S(O)<sub>n</sub>;
- CHO, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-алкилкарбонил, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-галогеналкилкарбонил, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-алкилоксикарбонил;
- NH<sub>2</sub>;

R<sup>12</sup> представляет собой

- галоген, циано, изоциано, NO<sub>2</sub>;
- (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-алкил, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-галогеналкил, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-алкилкарбонил, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-галогеналкилкарбонил; (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-алкилоксикарбонил, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-алкокси, (C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)-галогеналкокси, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-алкил-S(O)<sub>n</sub>;
- (C<sub>2</sub>-C<sub>3</sub>)-алкенил, (C<sub>2</sub>-C<sub>3</sub>)-галогеналкенил;
- (C<sub>2</sub>-C<sub>3</sub>)-алкинил, (C<sub>2</sub>-C<sub>3</sub>)-галогеналкинил;
- NH<sub>2</sub>;

и в которой коэффициенты означают

l 0, 1, 2 или 3.

m 0, 1 или 2;

n 0, 1 или 2;

- o 0, 1 или 2;
- p 0 или 1;
- q 0 или 1;
- r 3, 4, 5 или 6; и
- s 0, 1, 2, 3, 4 или 5.

2. Соединения формулы (I) по п. 1, а также их агрохимически приемлемые соли, N-оксиды, гидраты и гидраты солей и N-оксидов, причем

A представляет собой A1-A16:

A1	A2	A3	A4	A5
A6	A7	A8	A9	A10
A11	A12	A13	A14	A15
A16				

R<sup>1</sup> представляет собой

- OR<sup>1a</sup> или
- NR<sup>9</sup>R<sup>10</sup>; в которой

R<sup>1a</sup>

- означает водород;
- означает (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-алкил, который является незамещенным или замещен одним или несколькими заместителями, выбранными из группы, состоящей из галогена, (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)-циклоалкила, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-алкокси, (C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>)-алкокси-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-алкокси, циано и нитро;
- означает (C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)-алкенил, (C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)-галогеналкенил;
- означает арил-(C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>)-алкил, гетероарил-(C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>)-алкил, причем арил и гетероарил является незамещенным или замещен одним или несколькими заместителями, выбранными из группы, состоящей из галогена, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-алкила, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-галогеналкила;
- означает (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-алкилиденамино;

R<sup>9</sup> обозначает водород и (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-алкил;R<sup>10</sup>

- означает водород;
- означает (C<sub>3</sub>-C<sub>7</sub>)-циклоалкил-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-алкил, арил-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-алкил-, арил-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-алкокси, причем циклоалкил и арил является незамещенным или замещен одним или несколькими заместителями, выбранными из группы, состоящей из галогена, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-алкила, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-галогеналкила;
- означает (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>3</sub>-C<sub>8</sub>)-циклоалкил, причем вышеуказанные алкильный, алкенильный, алкинильный и циклоалкильный остатки являются незамещенными или каждый независимо друг от

друга замещен  $m$  остатками, выбранными из группы, состоящей из циано,  $C(O)OR^8$ ;

- означает  $(C_1-C_6)$ -галогеналкил;
- означает  $S(O)_2R^5$ ,  $SO_2NR^6R^7$ ,  $NR^6SO_2R^8$ ;

$R^5$  означает  $(C_1-C_4)$ -алкил,  $(C_1-C_4)$ -галогеналкил,  $(C_3-C_6)$ -циклоалкил,  $(C_2-C_4)$ -алкенил или арил;

$R^6$  обозначает водород,  $(C_1-C_4)$ -алкил или  $(C_3-C_6)$ -циклоалкил;

$R^7$  обозначает водород,  $(C_1-C_4)$ -алкил или  $(C_3-C_6)$ -циклоалкил;

$R^8$  обозначает водород,  $(C_1-C_6)$ -алкил или  $(C_3-C_6)$ -циклоалкил;

$R^{2a}$  представляет собой

- водород, циано;
- $(C_1-C_6)$ -алкил;
- $(C_3-C_6)$ -циклоалкил;

$R^{2b}$  представляет собой водород,

$R^3$  представляет собой

- фтор, хлор, бром, иод, циано, изоциано,  $NO_2$ ;
- $(C_1-C_6)$ -алкил,  $(C_3-C_6)$ -циклоалкил,  $(C_1-C_6)$ -галогеналкил;

$R^4$  представляет собой

- фтор, хлор, бром, циано;
- метил, этил;
- метокси, этокси;

$R^{12}$  представляет собой

- галоген, циано, нитро;
- метил, этил, (C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>)-галогеналкил;
- метокси, этокси;

и в которой коэффициенты означают

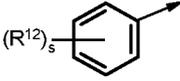
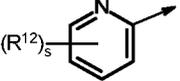
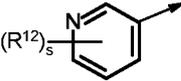
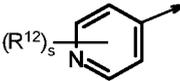
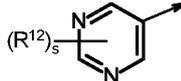
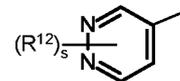
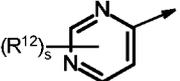
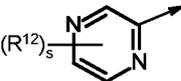
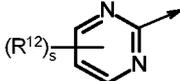
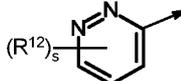
l 0, 1 или 2.

m 0, 1 или 2;

s 0, 1, 2, 3.

3. Соединения формулы (I) по п. 1 или 2, а также их агрохимически приемлемые соли, N-оксиды, гидраты и гидраты солей и N-оксидов, причем:

A представляет собой A1-A10:

				
A1	A2	A3	A4	A5
				
A6	A7	A8	A9	A10

$R^1$  представляет собой

- $OR^{1a}$  или
- $NR^9R^{10}$ ; в которой

$R^{1a}$ 

- означает водород;
- означает метил, этил, пропил, 1-метилэтил, бутил, 1-метилпропил, 2-метилпропил, 1,1-диметилэтил, пентил, 1-метилбутил, 2-метилбутил, 3-метилбутил, 2,2-диметилпропил, цианометил, 2-метоксиэтил, 2-(2-метоксиэтокси)этил;
- означает 1-пропенил, 2-пропенил;
- бензил, пиридилметил, причем фенильный и пиридильный остаток соответственно является незамещенным или замещен галогеном;
- означает изопропилиденамино;

 $R^9$  представляет собой водород; $R^{10}$ 

- означает водород;
- означает циклопропилметил;
- бензил, 1-фенилэтил, 2-фенилэтил, бензилокси, причем фенильный остаток в каждой из четырех указанных групп соответственно является незамещенным или замещен галогеном;
- метил, этил, пропил, 1-метилэтил, бутил, 1-метилпропил, 2-метилпропил, 1,1-диметилэтил, пентил, 1-метилбутил, 2-метилбутил, 3-метилбутил, 2,2-диметилпропил, 1-этилпропил, гексил, причем вышеуказанные остатки являются незамещенными или однократно замещены остатком  $C(O)OR^8$ ;

- циклопропил, циклобутил, циклопентил, причем три указанных остатка являются незамещенными или однократно замещены остатком  $C(O)OR^8$ ;
- означает 1-пропенил, 2-пропенил, 2-метил-2-пропенил, проп-2-ин-1-ил, бут-2-ин-1-ил;
- означает  $S(O)_2R^5$ ,  $SO_2NR^6R^7$ ;

$R^5$  означает метил, этил, пропил, 1-метилэтил, трифторметил, 1,1-дифторэтил, 2,2,2-трифторэтил, циклопропил или винил;

$R^6$  означает водород, метил, этил, пропил, 1-метилэтил или циклопропил,

$R^7$  означает водород или метил,

$R^8$  представляет собой водород, метил, этил;

$R^{2a}$  представляет собой

- водород;
- метил;

$R^{2b}$  представляет собой водород,

$R^3$  представляет собой

- фтор, хлор, бром, иод, циано,  $NO_2$ ;
- циклопропил, трифторметил;

$R^4$  представляет собой

- фтор, хлор, бром;
- метил;

$R^{12}$  представляет собой

- фтор, хлор, бром;

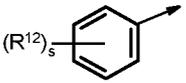
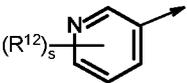
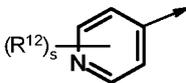
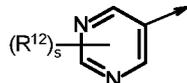
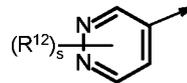
и в которой коэффициенты означают

$l$  0 или 1.

$s$  0, 1 или 2.

4. Соединения формулы (I) по одному из пп. 1 - 3, а также их агрохимически приемлемые соли, N-оксиды, гидраты и гидраты солей и N-оксидов, причем:

A представляет собой A1, A3, A4, A5 или A6:

				
A1	A3	A4	A5	A6

$R^1$  представляет собой

- $OR^{1a}$  или
- $NR^9R^{10}$ ; в которой

$R^{1a}$

- означает водород;
- означает метил, этил;
- означает цианометил, 2-метоксиэтил, 2-(2-метоксиэтокси)этил;
- означает пиридин-2-ил-метил;

- означает изопропилиденамино;

$R^9$  представляет собой водород;

$R^{10}$

- означает циклопентил, который однократно замещен

$C(O)OR^8$ ;

- означает циклопропилметил;

- означает  $CH_2C(O)OR^8$ ,  $CH_2CH_2C(O)OR^8$ ;

- означает 2-пропенил;

- означает  $S(O)_2R^5$ ,  $SO_2NR^6R^7$ ;

$R^5$  означает метил, этил, трифторметил, 1,1-дифторэтил, циклопропил или винил;

$R^6$  означает метил, этил, пропил или 1-метилэтил;

$R^7$  означает водород или метил,

$R^8$  означает водород, метил, этил;

$R^{2a}$  представляет собой

- водород;
- метил;

$R^{2b}$  представляет собой водород,

$R^3$  выбирают из группы, состоящей из

- хлор, бром, иод, циано,  $NO_2$ ;
- трифторметил, циклопропил;

$R^4$  представляет собой

- фтор, хлор;

$R^{12}$  представляет собой фтор,

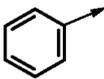
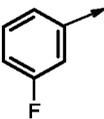
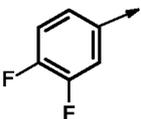
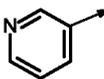
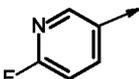
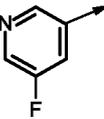
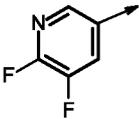
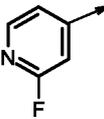
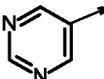
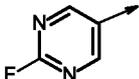
и в которой коэффициенты означают

$l$  0 или 1.

$s$  0, 1 или 2.

5. Соединения формулы (I) по одному из пп. 1 - 4, а также их агрохимически приемлемые соли, N-оксиды, гидраты и гидраты солей и N-оксидов, причем

A представляет собой A1-1, A1-2, A1-3, A3-1, A3-2, A3-3, A3-4, A4-1, A5-1 или A5-2 :

				
A1-1	A1-2	A1-3	A3-1	A3-2
				
A3-3	A3-4	A4-1	A5-1	A5-2

$R^1$  представляет собой

-  $OR^{1a}$  или

-  $NR^9R^{10}$ ; в которой

$R^{1a}$

- означает водород;
- означает метил, этил;
- означает цианометил, 2-метоксиэтил, 2-(2-метоксиэтокси)этил;
- означает пиридин-2-ил-метил;
- означает изопропилиденамино;

$R^9$  представляет собой водород;

$R^{10}$

- означает циклопентил, который однократно замещен  $C(O)OR^8$ ;
- означает циклопропилметил;
- означает  $CH_2C(O)OR^8$ ,  $CH_2CH_2C(O)OR^8$ ;
- означает 2-пропенил;
- означает  $S(O)_2R^5$ ,  $SO_2NR^6R^7$ ;

$R^5$  означает метил, этил, трифторметил, циклопропил или винил;

$R^6$  означает метил, этил или 1-метилэтил;

$R^7$  означает метил;

$R^8$  означает водород, метил, этил;

$R^{2a}$  представляет собой

- водород;
- метил;

$R^{2b}$  представляет собой водород,

$R^3$  представляет собой

- хлор, бром, циано, циклопропил;

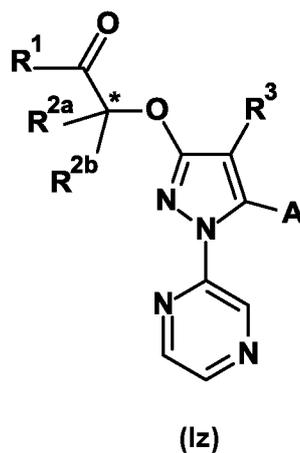
$R^4$  представляет собой

- 3-фтор, 3-хлор;

в которой коэффициент означает

l 0 или 1.

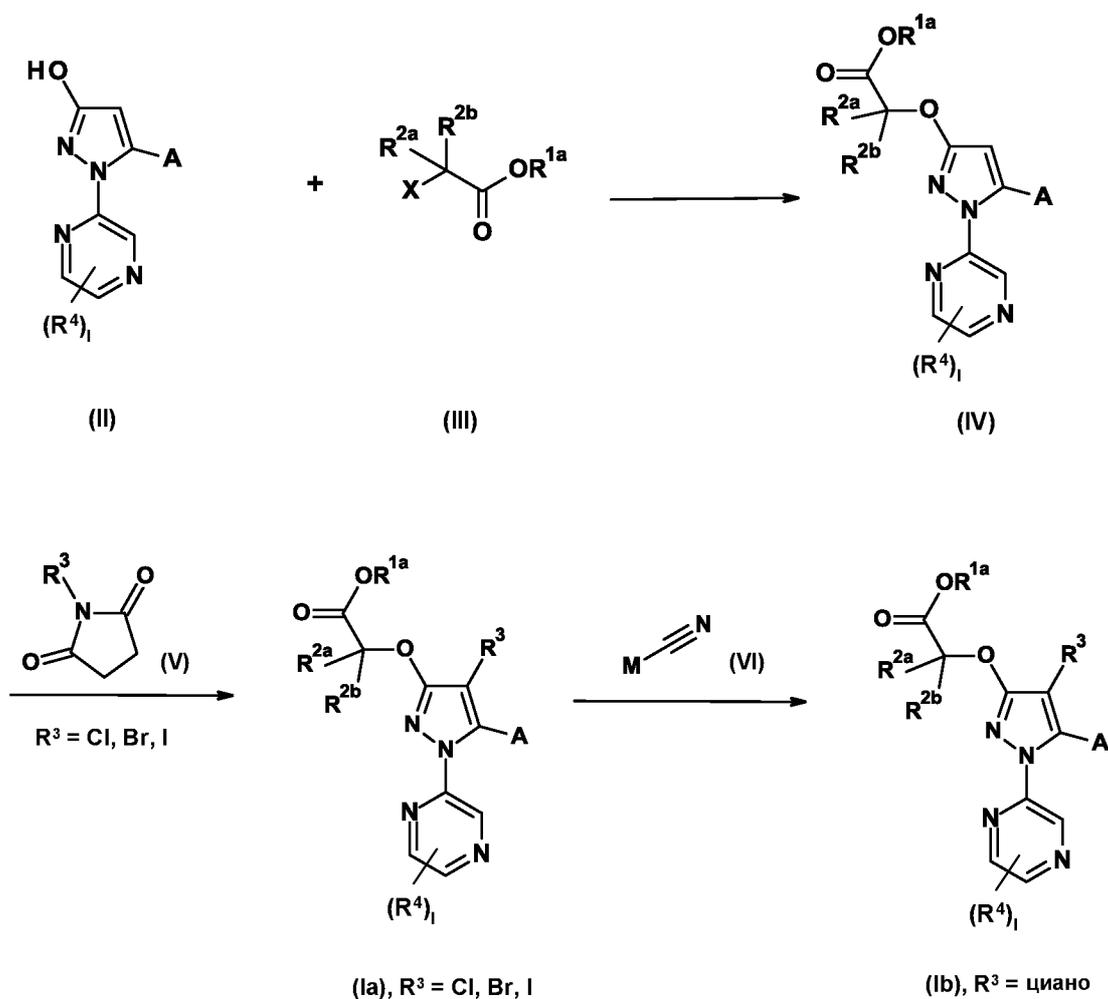
6. Соединения формулы (Iz), а также их агрохимически приемлемые соли, N-оксиды, гидраты и гидраты солей и N-оксидов



причем остатки  $R^1$ ,  $R^{2a}$ ,  $R^{2b}$ ,  $R^3$  и A имеют значения, как указано в п.п. 2 - 5.

7. Способ получения соединений общей формулы (Ia) и (Ib), а также их агрохимически приемлемых солей, N-оксидов, гидратов и гидратов солей и N-оксидов по одному из пп. 1-5, посредством взаимодействия соединений общей формулы (II) с соединениями

общей формулы (III) с образованием соединений общей формулы (IV) и затем далее с использованием соединений общей формулы (V) и (VI),



в которых  $R^{2a}$ ,  $R^{2b}$ ,  $R^{1a}$ ,  $R^3$ ,  $R^4$ , I и A имеют указанные выше значения, и M означает металл, причем превращение (Ia) в (Ib) происходит в присутствии катализатора на основе переходного металла.

## 8. Агрехимическое средство, содержащее

а) по меньшей мере одно соединение общей формулы (I) или его агрохимически приемлемую соль, N-оксид, гидрат, гидрат соли/N-оксида, как определено в одном или нескольких пп. 1-6, и

б) обычные для защиты растений вспомогательные вещества и добавки.

9. Агрохимическое средство, содержащее

а) по меньшей мере одно соединение общей формулы (I) или его агрохимически приемлемую соль, N-оксид, гидрат, гидрат соли/N-оксида, как определено в одном или нескольких пп. 1-6,

б) одно или несколько агрохимически активных веществ, отличных от компонента а), и при необходимости

с) обычные для защиты растений вспомогательные вещества и добавки.

10. Способ борьбы с нежелательными растениями или регулирования роста растений, отличающийся тем, что на растения, семена или поверхность, на которой растут растения, наносят эффективное количество по меньшей мере одного соединения общей формулы (I) или его агрохимически приемлемой соли, N-оксида, гидрата, гидрата соли/N-оксида, как определено в одном или нескольких из пп. 1-6.

11. Применение соединений общей формулы (I) или их агрохимически приемлемой соли, N-оксида, гидрата, гидрата соли/N-оксида, как определено в одном или нескольких пп. 1-6, в качестве гербицида или регулятора роста растений.
12. Применение по п. 11, отличающееся тем, что соединения общей формулы (I) или их агрохимически приемлемую соль, N-оксид, гидрат, гидрат соли/N-оксида используют для борьбы с вредными растениями или для регулирования роста растительных культур.
13. Применение по п. 12, отличающиеся тем, что культурными растениями являются трансгенные культурные растения.
14. Семенной материал, отличающийся тем, что он покрыт соединениями общей формулы (I) или их агрохимически приемлемой солью, N-оксидом, гидратом, гидратом соли/N-оксида, как определено в одном или нескольких пп. 1-6, или агрохимическим средством по одному из пп.8 или 9.