

(19)



Евразийское  
патентное  
ведомство

(21) 202391253 (13) A1

(12) ОПИСАНИЕ ИЗОБРЕТЕНИЯ К ЕВРАЗИЙСКОЙ ЗАЯВКЕ

(43) Дата публикации заявки  
2023.08.21

(51) Int. Cl. C07D 401/04 (2006.01)  
A01N 43/653 (2006.01)  
A01N 53/00 (2006.01)

(22) Дата подачи заявки  
2021.11.02

(54) ПРОИЗВОДНЫЕ [(5-ФЕНИЛ-1-(ГЕТЕРОАРИЛ)-1Н-ТРИАЗОЛ-3-ИЛ)ОКСИ]УКСУСНОЙ КИСЛОТЫ В КАЧЕСТВЕ АНТИДОТОВ ДЛЯ ЗАЩИТЫ ТЕХНИЧЕСКИХ РАСТЕНИЙ И СЕЛЬСКОХОЗЯЙСТВЕННЫХ КУЛЬТУР

(31) 20206041.4

(32) 2020.11.05

(33) EP

(86) PCT/EP2021/080352

(87) WO 2022/096442 2022.05.12

(71) Заявитель:

БАЙЕР АКЦИЕНГЕЗЕЛЬШАФТ  
(DE)

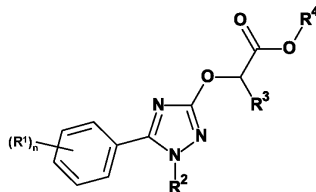
(72) Изобретатель:

Мюллер Томас, Райнгрубер Анна  
Мария, Фракенполь Йенс, Хельмке  
Хендрик, Диттген Ян (DE)

(74) Представитель:

Беляева Е.Н. (BY)

(57) Настоящее изобретение касается соединений для защиты сельскохозяйственных культур и средств, содержащих специальные соединения в качестве антидотов для снижения фитотоксического воздействия агрохимикатов, в частности гербицидов. В частности, изобретение касается определенных производных [(5-фенил-1-(гетероарил)-1Н-1,2,4-триазол-3-ил)окси]уксусной кислоты общей формулы (I)



и их солей, способов их производства, а также их применения в качестве соединений для защиты сельскохозяйственных культур (антидотов).

A1

202391253

202391253

A1

## **Производные [(5-фенил-1-(гетероарил)-1Н-триазол-3-ил)окси]уксусной кислоты в качестве антидотов для защиты технических растений и сельскохозяйственных культур**

### **Описание**

Настоящее изобретение касается соединений для защиты сельскохозяйственных культур и средств, содержащих специальные соединения в качестве антидотов для снижения фитотоксического воздействия агрохимикатов, в частности, гербицидов. В частности, изобретение касается определенных производных [(5-фенил-1-(гетероарил)-1Н-1,2,4-триазол-3-ил)окси]уксусной кислоты, а также их солей в качестве антидотов и способов их производства.

В процессе применения пестицидов для борьбы с нежелательными организмами в сельскохозяйственных и лесных культурах зачастую, в большей или меньшей степени, посевы повреждаются используемыми пестицидами, такими как гербициды, инсектициды, фунгициды и др. Указанный нежелательный фитотоксический побочный эффект проявляется в определенной степени при использовании многочисленных гербицидов – прежде всего при их применении после появления всходов – в случае с полезными растениями, такими как, например, кукуруза, рис или злаки. В некоторых случаях использование так называемых "гербицидных антидотов" или "антидотов" позволяет защитить полезные растения от фитотоксических свойств пестицидов без снижения или существенного ослабления пестицидного действия на вредные организмы. В некоторых случаях в присутствии антидотов наблюдается улучшенный пестицидный эффект в отношении вредных организмов, таких как сорняки.

Соединения, известные на сегодняшний день как антидоты, по своему химическому строению относятся к большому количеству различных структурных классов, а возможность их использования в качестве антидотов, как правило, также зависит от химической структуры пестицидов и культур полезных растений.

Защитное действие соединений из группы производных фенокси- или гетероарилоксиалкановых кислот известно давно в случаях, когда указанные соединения используют в сочетании с гербицидами. Примерами таких соединений являются 2-метил-4-хлорфеноксиуксусная кислота и подобные соединения,

которые также проявляют гербицидную активность в отношении вредных растений, а также клохинтоцет-мексил.

Также известны антидоты из группы производных сложных эфиров N-фенилзамещенных гетероарилкарбоновых кислот с множеством гетероатомов в гетероароматических соединениях. Примерами таких антидотов являются используемые в коммерческих продуктах антидоты мефенпир-диэтил и изоксадифен-этил.

Из WO 2004/084631 известно об использовании производных гидроксизамещенных ароматических карбоновых кислот. В WO 2005/015994 специальные производные салициловой кислоты описаны в качестве антидотов. Они особенно подходят для использования в качестве антидотов в культурах кукурузы и соевых бобов.

Кроме того, из WO 2005/112630 в качестве антидота известны производные 1,2-дигидрохиноксалин-2-она, а из

WO 2008/131860 - пиридонкарбоксамиды.

Активные вещества из химического класса производных [(5-фенил-1-(гетероарил)-1H-1,2,4-триазол-3-ил)окси]уксусной кислоты, обладающие полезными для растений свойствами, из литературы неизвестны.

Различные издания описывают [(1,5-дифенил-1H-1,2,4-триазол-3-ил)окси]уксусной кислоты производные, обладающие лечебными свойствами. Из Polish J. Chem. 2006, 80, 889-897 и Bioorganic & Medicinal Chemistry 2018, 26, 3321-3344 известны производные [(1,5-дифенил-1H-1,2,4-триазол-3-ил)окси]уксусной кислоты.

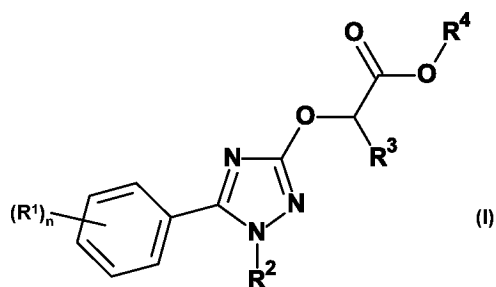
При использовании антидотов для защиты полезных растений от повреждения пестицидами было продемонстрировано, что известные антидоты в ряде случаев обладают недостатками. Они включают в себя:

- недостаточные защитные свойства растений,
- в сочетании с определенным гербицидом спектр полезных культур, на которых происходит применение антидота/гербицида, недостаточно велик,
- определенный антидот можно сочетать только с несколькими гербицидами,

- использование антидотов приводит к увеличению нормы расхода и количества вспомогательных веществ в составе рецептуры, и, соответственно, может приводить к техническим сложностям с нанесением.

По указанным причинам возросла потребность в предоставлении альтернативных соединений, обладающих действием антидотов.

Предметом изобретения являются новые соединения для защиты сельскохозяйственных культур общей формулы (I) или их соли,



для снижения фитотоксического воздействия пестицидов, в частности, гербицидов, на технические растения или сельскохозяйственные культуры,

в которой

$R^1$  означает водород, галоген, циано, нитро,  $(C_1-C_6)$ алкил,  $(C_2-C_6)$ алкенил,  $(C_2-C_6)$ алкинил,  $(C_3-C_8)$ циклоалкил,  $(C_3-C_8)$ циклоалкенил,  $(C_1-C_6)$ алкокси и  $(C_1-C_6)$ алкилS(O)<sub>p</sub>, причем семь названных последними остатков являются незамещенными, или замещены одним или более остатками из группы галогена, циано,  $(C_1-C_6)$ алкокси и  $(C_1-C_6)$ алкилаS(O)<sub>p</sub>,

$R^2$  означает гетероарил, причем гетероарильный остаток является незамещенным или замещен галогеном, циано, нитро,  $(C_1-C_6)$ алкилом,  $(C_2-C_6)$ алкенилом,  $(C_2-C_6)$ алкинилом,  $(C_3-C_8)$ циклоалкилом,  $(C_3-C_8)$ циклоалкенилом,  $(C_1-C_6)$ алкокси и  $(C_1-C_6)$ алкиломS(O)<sub>p</sub>, причем семь названных последними остатков являются незамещенными, или замещены одним или более остатками из группы галогена, циано,  $(C_1-C_6)$ алкокси и  $(C_1-C_6)$ алкилаS(O)<sub>p</sub>,

$R^3$  означает водород и  $(C_1-C_6)$ алкил,

$R^4$  означает водород,  $(C_1-C_{18})$ алкил,  $(C_1-C_{18})$ галоалкил,  $(C_1-C_{18})$ цианоалкил,  $(C_2-C_{18})$ алкенил,  $(C_2-C_{18})$ алкинил,  $(C_3-C_{12})$ циклоалкил,  $(C_3-C_{12})$ циклоалкенил, арил, гетероарил,  $(C_1-C_{18})$ алкокси- $(C_1-C_{18})$ алкил,  $(C_1-C_{18})$ галоалкокси- $(C_1-C_{18})$ алкил,  $(C_1-C_{18})$ алкокси- $(C_1-C_{18})$ галоалкил,  $(C_1-C_{18})$ алкилтио- $(C_1-C_{18})$ алкил,  $(C_1-C_{18})$ галоалкилтио- $(C_1-C_{18})$ алкил,  $(C_2-C_{18})$ галоалкенил,  $(C_2-C_{18})$ галоалкинил, гетероциклил- $(C_1-C_{18})$ алкил, арил- $(C_1-C_{18})$ алкил,  $(C_3-C_{12})$ циклоалкил- $(C_1-C_{18})$ алкил,  $(C_1-C_{18})$ алкоксикарбонил- $(C_1-C_{18})$ алкил, и  $(C_1-C_{18})$ алкоксикарбонил- $(C_3-C_{12})$ циклоалкил- $(C_1-C_{18})$ алкил, или

остаток формулы  $-NR^aR^b$  или  $-N=CR^cR^d$ ,

причем в вышеупомянутых 2 остатках каждый из остатков  $R^a$ ,  $R^b$ ,  $R^c$  и  $R^d$  независимо друг от друга означает водород,  $(C_1-C_4)$ алкил,  $(C_2-C_4)$ алкенил,  $(C_2-C_4)$ алкинил, бензил, замещенный бензил, фенил или замещенный фенил, или  $R^a$  и  $R^b$  вместе с атомом N могут образовывать 3-8-членный гетероцикл, который может содержать один или два дополнительных гетероциклических атома из группы N, O и S, однако не в том случае 3- или 4-членного гетероцикла, и который является незамещенным или замещен одним или более остатками из группы  $(C_1-C_4)$ алкила и  $(C_1-C_4)$ галоалкила, или  $R^c$  и  $R^d$  вместе с атомом C означают 3-8-членный карбоциклический или гетероциклический остаток, который может содержать 1 - 3 гетероциклических атома из группы N, O и S, причем карбоциклический или гетероциклический остаток является незамещенным или замещен одним или более остатками из группы  $(C_1-C_4)$ алкила и  $(C_1-C_4)$ галоалкила,

n означает число от 0 до 5,

и

p означает 0, 1 или 2.

Соединения общей формулы (I) образуют соли путем добавления подходящей неорганической или органической кислоты, например, минеральных кислот, как, например, HCl, HBr,  $H_2SO_4$ ,  $H_3PO_4$  или  $HNO_3$ , или органических кислот, например, карбоновых кислот, таких как муравьиная кислота, уксусная

кислота, пропионовая кислота, щавелевая кислота, молочная кислота, салициловая кислота, или сульфоновых кислот, таких как *p*-толуолсульфонокислота к группе оснований, таких как пиперидино, морфолин или пиридино. Эти соли в качестве аниона содержат сопряженное основание кислоты. Соответствующие заместители, которые представлены в депротонированной форме, такие как сульфонокислоты, некоторые амиды сульфонокислот или карбоновые кислоты, могут образовывать внутренние соли с группами, которые сами могут быть протонированы, как, например, аминогруппы. Образование солей также может происходить под действием основания соединения общей формулы (I). Подходящими основаниями являются, например, органические амины, такие как триалкиламин, морфолин, пиперидин и пиридин, а также гидроксиды, карбонаты и гидрокарбонаты аммония, щелочных или щелочноземельных металлов, в частности, гидроксид натрия и калия, натрий- и карбонат калия, а также бикарбонат натрия и калия. Указанные соли представляют собой соединения, в которых кислый водород заменен катионом, подходящим для применения в сельскохозяйственных целях, например, соли металлов, в частности, соли щелочных металлов или соли щелочноземельных металлов, в частности, соли натрия и калия, или также соли аммония, соли с органическими аминами или соли четвертичного аммония, например, с катионами формулы  $[NR^iR^{ii}R^{iii}R^{iv}]^+$ , причем каждый из  $R^i - R^{iv}$  независимо друг от друга представляет собой органический остаток, в частности, алкил, арил, арилалкил или алкиларил. Также сюда относятся соли алкилсульфония и алкилсульфония, такие как соли (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-триалкилсульфония и (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-триалкилсульфония.

В дальнейшем соединения формулы (I), используемые в соответствии с изобретением, и их соли называются «соединениями общей формы (I)».

Предпочтительным предметом изобретения являются соединения общей формулы (I), в которой

$R^i$  означает водород, галоген, циано, нитро, (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>3</sub>-C<sub>6</sub>)циклоалкил, (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)циклоалкенил, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)алкокси и (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)алкилS(O)<sub>p</sub>, где упомянутые последними семь остатков являются незамещенными или замещены одним или более остатками из группы галогена, циано, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)алкокси и (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)алкилаS(O)<sub>p</sub>,

$R^2$  означает гетероарил, причем гетероарильный остаток является незамещенным или замещен галогеном, циано, нитро,  $(C_1-C_6)$ алкилом,  $(C_2-C_6)$ алкенилом,  $(C_2-C_4)$ алкинилом,  $(C_3-C_6)$ циклоалкилом,  $(C_3-C_6)$ циклоалкенилом,  $(C_1-C_4)$ алкокси и  $(C_1-C_4)$ алкилом $S(O)_p$ , где упомянутые последними семь остатков являются незамещенными или замещены одним или более остатками из группы галогена, циано,  $(C_1-C_4)$ алкокси и  $(C_1-C_4)$ алкила $S(O)_p$ ,

$R^3$  означает водород и  $(C_1-C_4)$ алкил,

$R^4$  означает водород,  $(C_1-C_{16})$ алкил,  $(C_1-C_{16})$ галоалкил,  $(C_1-C_{16})$ цианоалкил,  $(C_2-C_{16})$ алкенил,  $(C_2-C_{16})$ алкинил,  $(C_3-C_{12})$ циклоалкил,  $(C_3-C_{12})$ циклоалкенил, арил, гетероарил,  $(C_1-C_{16})$ алкокси- $(C_1-C_{16})$ алкил,  $(C_1-C_{16})$ галоалкокси- $(C_1-C_{16})$ алкил,  $(C_1-C_{16})$ алкокси- $(C_1-C_{16})$ галоалкил,  $(C_1-C_{16})$ алкилтио- $(C_1-C_{16})$ алкил,  $(C_1-C_{16})$ галоалкилтио- $(C_1-C_{16})$ алкил,  $(C_2-C_{16})$ галоалкенил,  $(C_2-C_{16})$ галоалкинил, гетероциклил- $(C_1-C_{16})$ алкил, арил- $(C_1-C_{16})$ алкил,  $(C_3-C_{12})$ циклоалкил- $(C_1-C_{16})$ алкил,  $(C_1-C_{16})$ алкоксикарбонил- $(C_1-C_{16})$ алкил, и  $(C_1-C_{16})$ алкоксикарбонил- $(C_3-C_{12})$ циклоалкил- $(C_1-C_{16})$ алкил,

$n$  означает число от 0 до 4,

и

$p$  означает 0, 1 или 2.

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

$R^1$  означает водород, галоген, циано, метил, этил,  $CF_3$ ,  $CF_2Cl$ ,  $CH_2F$ ,  $CHF_2$ ,  $OCH_3$ ,  $OCF_3$ ,  $SCH_3$ ,  $SOCH_3$ ,  $SO_2CH_3$  и  $SCF_3$ ,

$R^2$  означает гетероарил, причем гетероарильный остаток является незамещенным или замещен один или более раз галогеном, циано, метилом, этилом,  $CF_3$ ,  $CF_2Cl$ ,  $CH_2F$ ,  $CHF_2$ ,  $OCH_3$ ,  $OCF_3$ ,  $SCH_3$ ,  $SOCH_3$ ,  $SO_2CH_3$  и  $SCF_3$ ,

$R^3$  означает водород,  $CH_2CH_3$  и  $CH_3$ ,

$R^4$  означает водород,  $(C_1-C_{12})$ алкил,  $(C_1-C_{12})$ галоалкил,  $(C_1-C_{12})$ цианоалкил,  $(C_2-C_{12})$ алкенил,  $(C_2-C_{12})$ алкинил,  $(C_3-C_{12})$ циклоалкил,

(C<sub>3</sub>-C<sub>12</sub>)циклоалкенил, арил, гетероарил, (C<sub>1</sub>-C<sub>12</sub>)алкокси-(C<sub>1</sub>-C<sub>12</sub>)алкил, (C<sub>1</sub>-C<sub>12</sub>)галоалкокси-(C<sub>1</sub>-C<sub>12</sub>)алкил, (C<sub>1</sub>-C<sub>12</sub>)алкокси-(C<sub>1</sub>-C<sub>12</sub>)галоалкил, (C<sub>1</sub>-C<sub>12</sub>)алкилтио-(C<sub>1</sub>-C<sub>12</sub>)алкил, (C<sub>1</sub>-C<sub>12</sub>)галоалкилтио-(C<sub>1</sub>-C<sub>12</sub>)алкил, (C<sub>2</sub>-C<sub>12</sub>)галоалкенил, (C<sub>2</sub>-C<sub>12</sub>)галоалкинил, гетероциклил-(C<sub>1</sub>-C<sub>12</sub>)алкил, арил-(C<sub>1</sub>-C<sub>12</sub>)алкил, (C<sub>3</sub>-C<sub>12</sub>)циклоалкил-(C<sub>1</sub>-C<sub>12</sub>)алкил, (C<sub>1</sub>-C<sub>12</sub>)алкокси-карбонил-(C<sub>1</sub>-C<sub>12</sub>)алкил, и (C<sub>1</sub>-C<sub>12</sub>)алкоксикарбонил-(C<sub>3</sub>-C<sub>12</sub>)циклоалкил-(C<sub>1</sub>-C<sub>12</sub>)алкил,

и

n означает 0, 1, 2 или 3.

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

R<sup>1</sup> означает водород, фтор, хлор, бром, йод, CN, метил, CF<sub>3</sub>, CF<sub>2</sub>Cl, CH<sub>2</sub>F, CHF<sub>2</sub>, OCH<sub>3</sub>, OCF<sub>3</sub>, SCH<sub>3</sub>, SOCH<sub>3</sub>, SO<sub>2</sub>CH<sub>3</sub> и SCF<sub>3</sub>,

R<sup>2</sup> означает пиридин-2-ил, пиридин-3-ил, пиридин-4-ил, пиразин-2-ил, пиразин-3-ил, пиримидин-2-ил, пиримидин-4-ил, пиримидин-5-ил, пиридазин-3-ил, пиридазин-4-ил, 1,3,5-триазин-2-ил, 1,2,4-триазин-3-ил, 1,2,4-триазин-5-ил, 1,2,4-триазин-6-ил, 1,2,3-триазин-4-ил, 1,2,3-триазин-5-ил, 1,2,4-, 1,3,2-, 1,3,6- и 1,2,6-оксазинил, изоксазол-3-ил, изоксазол-4-ил, изоксазол-5-ил, 1,3-оксазол-2-ил, 1,3-оксазол-4-ил, 1,3-оксазол-5-ил, изотиазол-3-ил, изотиазол-4-ил, изотиазол-5-ил, 1,3-тиазол-2-ил, 1,3-тиазол-4-ил, 1,3-тиазол-5-ил, 1H-пиррол-1-ил; 1H-пиррол-2-ил; 1H-пиррол-3-ил, фуран-2-ил; фуран-3-ил, тиен-2-ил, тиен-3-ил, 1H-имидазол-1-ил, 1H-имидазол-2-ил, 1H-имидазол-4-ил, 1H-имидазол-5-ил, 1H-пиразол-1-ил, 1H-пиразол-3-ил, 1H-пиразол-4-ил, 1H-пиразол-5-ил, 1H-1,2,3-триазол-1-ил, 1H-1,2,3-триазол-4-ил, 1H-1,2,3-триазол-5-ил, 2H-1,2,3-триазол-2-ил, 2H-1,2,3-триазол-4-ил, 1H-1,2,4-триазол-1-ил, 1H-1,2,4-триазол-5-ил, 4H-1,2,4-триазол-3-ил, 1,2,4-оксадиазол-3-ил, 1,2,4-оксадиазол-5-ил, 1,3,4-оксадиазол-2-ил, 1,2,3-оксадиазол-4-ил, 1,2,3-оксадиазол-5-ил, 1,2,5-оксадиазол-3-ил, 1,3,4-тиадиазол-2-ил, 1,3,4-тиадиазол-2-ил, 1,2,4-тиадиазол-5-ил, 1,2,4-тиадиазол-3-ил, 1,2,5-тиадиазол-3-ил, 1,2,5-тиадиазол-3-ил, 1,2,3-тиадиазол-4-ил, 1,2,3-тиадиазол-3-ил, который является



незамещенным или замещен один или более раз галогеном, циано, метилом,  $\text{CF}_3$ ,  $\text{CF}_2\text{Cl}$ ,  $\text{CH}_2\text{F}$ ,  $\text{CHF}_2$ ,  $\text{OCH}_3$ ,  $\text{OCF}_3$ ,  $\text{SCH}_3$ ,  $\text{SOCH}_3$ ,  $\text{SO}_2\text{CH}_3$  и  $\text{SCF}_3$ ,

$\text{R}^3$  означает водород и  $\text{CH}_3$ ,

$\text{R}^4$  означает водород,  $(\text{C}_1\text{-C}_{10})$ алкил,  $(\text{C}_1\text{-C}_{10})$ галоалкил,  $(\text{C}_1\text{-C}_{10})$ цианоалкил,  $(\text{C}_2\text{-C}_{10})$ алкенил,  $(\text{C}_2\text{-C}_{10})$ алкинил,  $(\text{C}_3\text{-C}_9)$ циклоалкил,  $(\text{C}_3\text{-C}_9)$ циклоалкенил, арил, гетероарил,  $(\text{C}_1\text{-C}_{10})$ алкокси- $(\text{C}_1\text{-C}_{10})$ алкил,  $(\text{C}_1\text{-C}_{10})$ галоалкокси- $(\text{C}_1\text{-C}_{10})$ алкил,  $(\text{C}_1\text{-C}_{10})$ алкокси- $(\text{C}_1\text{-C}_{10})$ галоалкил,  $(\text{C}_1\text{-C}_{10})$ алкилтио- $(\text{C}_1\text{-C}_{10})$ алкил,  $(\text{C}_1\text{-C}_{10})$ галоалкилтио- $(\text{C}_1\text{-C}_{10})$ алкил,  $(\text{C}_2\text{-C}_{18})$ галоалкенил,  $(\text{C}_2\text{-C}_{18})$ галоалкинил, гетероциклил- $(\text{C}_1\text{-C}_{10})$ алкил, арил- $(\text{C}_1\text{-C}_{10})$ алкил,  $(\text{C}_3\text{-C}_9)$ циклоалкил- $(\text{C}_1\text{-C}_{10})$ алкил,  $(\text{C}_1\text{-C}_{10})$ алкоксикарбонил- $(\text{C}_1\text{-C}_{10})$ алкил и  $(\text{C}_1\text{-C}_{10})$ алкоксикарбонил- $(\text{C}_3\text{-C}_9)$ циклоалкил- $(\text{C}_1\text{-C}_{10})$ алкил,

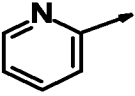
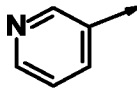
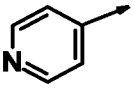
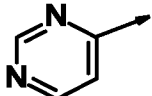
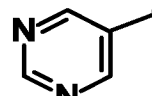
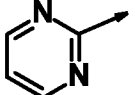
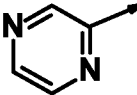
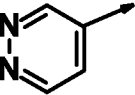
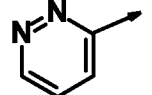
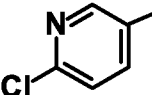
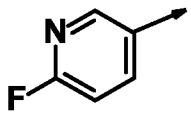
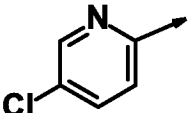
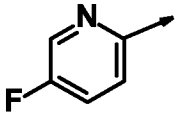
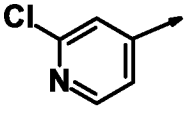
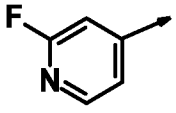
и

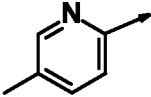
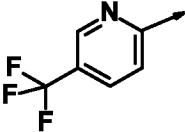
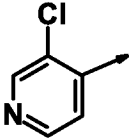
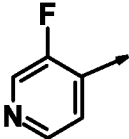
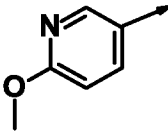





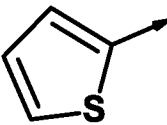
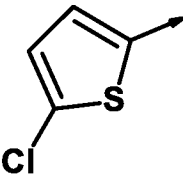
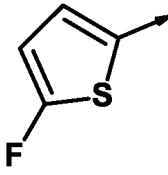
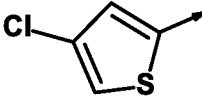
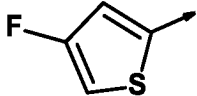
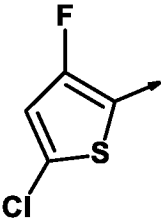
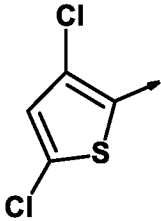
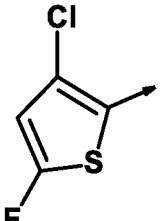
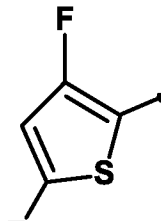
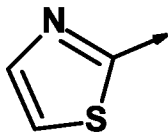
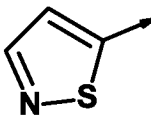
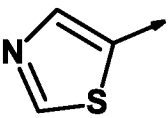
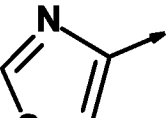
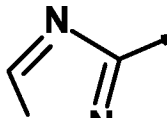
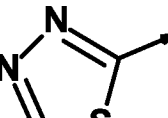
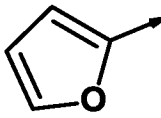
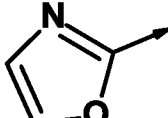
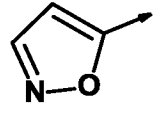
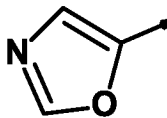
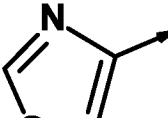
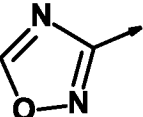
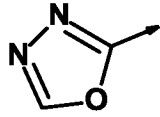
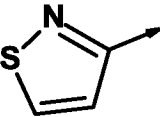
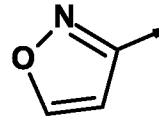
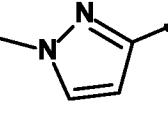
$n$  означает 0, 1, 2 или 3.

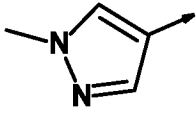
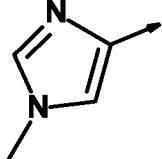
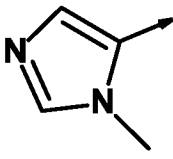
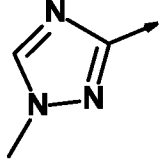
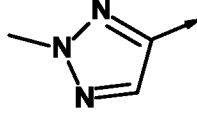
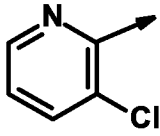
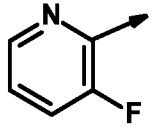
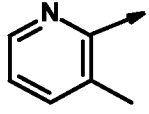
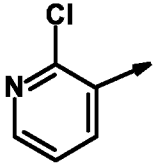
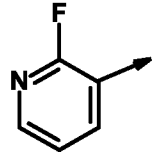
Совершенно особым предпочтительным предметом изобретения являются соединения общей формулы (I), в которой

$\text{R}^1$  означает водород, фтор, хлор, бром, йод, циано, метил,  $\text{CF}_3$ ,  $\text{CH}_2\text{F}$ ,  $\text{CHF}_2$ ,  $\text{OCH}_3$ ,  $\text{OCF}_3$ ,  $\text{SCH}_3$ ,  $\text{SOCH}_3$ ,  $\text{SO}_2\text{CH}_3$  и  $\text{SCF}_3$  steht,

$\text{R}^2$  означает группы Q-2.1 – Q-2.60

				
Q-2.1	Q-2.2	Q-2.3	Q-2.4	Q-2.5
				
Q-2.6	Q-2.7	Q-2.8	Q-2.9	Q-2.10
				

Q-2.11	Q-2.12	Q-2.13	Q-2.14	Q-2.15
				
Q-2.16	Q-2.17	Q-2.18	Q-2.19	Q-2.20
				
Q-2.21	Q-2.22	Q-2.23	Q-2.24	Q-2.25
				
Q-2.26	Q-2.27	Q-2.28	Q-2.29	Q-2.30
				
Q-2.31	Q-2.32	Q-2.33	Q-2.34	Q-2.35
				
Q-2.36	Q-2.37	Q-2.38	Q-2.39	Q-2.40
				
Q-2.41	Q-2.42	Q-2.43	Q-2.44	Q-2.45
				

Q-2.46	Q-2.47	Q-2.48	Q-2.49	Q-2.50
				
Q-2.51	Q-2.52	Q-2.53	Q-2.54	Q-2.55
				
Q-2.56	Q-2.57	Q-2.58	Q-2.59	Q-2.60

R<sup>3</sup> означает водород,

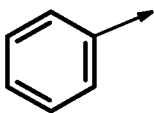
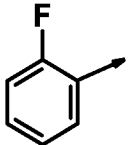
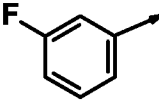
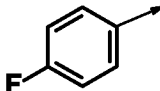
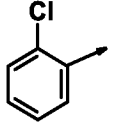
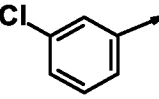
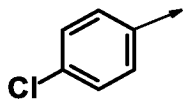
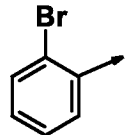
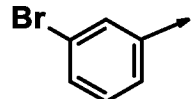
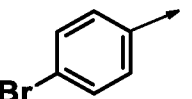
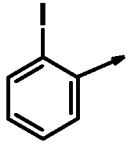
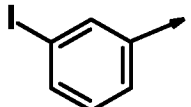
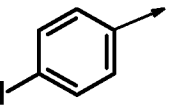
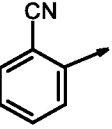
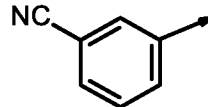
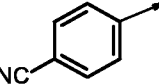
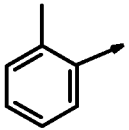
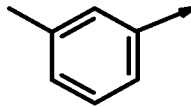
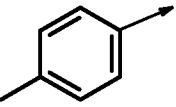
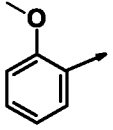
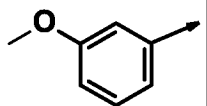
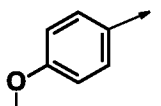
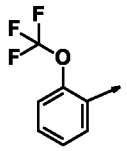
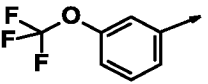
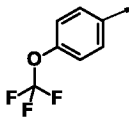
R<sup>4</sup> означает водород, метил, этил, н-пропил, изопропил, н-бутил, н-пентил, фенил, бензил, CH<sub>2</sub>(4-Cl-Ph), CH<sub>2</sub>(4-F-Ph), CH<sub>2</sub>(4-MeO-Ph), 2-метоксиэтил, тетрагидрофуран-2-ил-метил, тетрагидрофуран-3-ил-метил, тетрагидропиран-2-ил-метил, тетрагидропиран-3-ил-метил, тетрагидропиран-4-ил-метил, метилпропионат-3-ил, этилпропионат-3-ил, метилацетат-2-ил, этилацетат-2-ил, метилпивалат-2-ил, этилпивалат-3-ил, метил-2-метилпропаноат-3-ил, метил-2,2-диметилпропаноат-3-ил, этил-2-метилпропаноат-3-ил, метил-2-пропаноат-2-ил, этил-2-пропаноат-2-ил, метил-ацет-2-ил, этил-ацетат-2-ил, метил-1-метилциклопропан-карбоксилат-2-ил, этил-1-метилциклопропанкарбоксилат-2-ил, 2-(диметиламино)этил, оксетан-3-ил, (3-метилоксетан-3-ил)метил, 2,2,2-трифторэтил, 2,2-дифторэтил, 2-фторэтил, 2,2,3,3,3-пентафторпропил, циклопропилметил, 1-циклопропил-этил, (1-метил-циклопропил)-метил, (2,2-дихлорциклопропил)-метил, (2,2-диметил-циклопропил)-метил, аллил, пропаргил (проп-2-ин-1-ил), 2-хлорпроп-2-ен-1-ил, 3-фенилпроп-2-ин-1-ил, 3,3-дихлорпроп-2-ен-1-ил, 3,3-дихлор-2-фторпроп-2-ен-1-ил, метилпроп-2-ин-1-ил, 2-метилпроп-2-ен-1-ил, бут-2-ен-1-ил, бут-3-ен-1-ил, бут-2-ин-1-ил, бут-3-ин-1-ил, 4-хлор-бут-2-ин-1-ил, 3-метил-бут-2-ен-1-ил, 3-метил-бут-1-ен-1-ил, 1-(2E)-1-

метилбут-2-ен-1-ил, (E)-пент-3-ен-2-ил или (Z)-пент-3-ен-2-ил, циклобутилметил, циклопентилметил, циклогексилметил, гептан-2-ил, изобутил, 1,3-диоксолан-2-илметил или 1-этил-5-метил-1H-пиразол-4-метил,

n означает 0, 1, 2 или 3.

Чрезвычайно особенно предпочтительным предметом изобретения являются соединения общей формулы (I), в которой

(R<sup>1</sup>)<sub>n</sub>-фенил означает группы Q-1.1 – Q-1.53

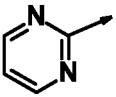
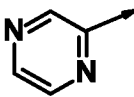
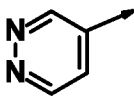
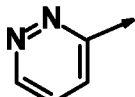
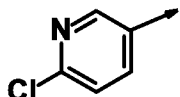
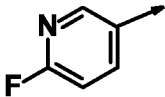
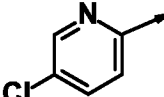
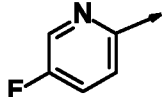
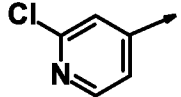
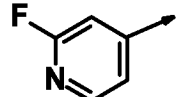
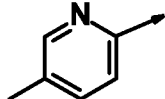
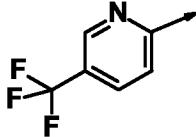
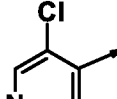
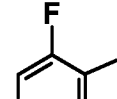
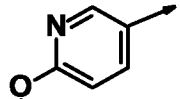





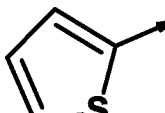
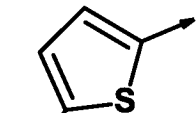
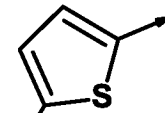
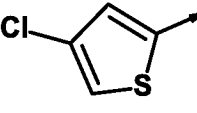
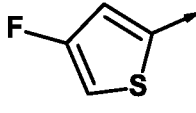
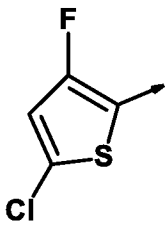
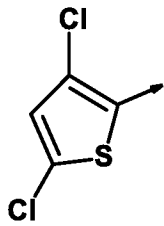
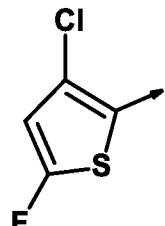
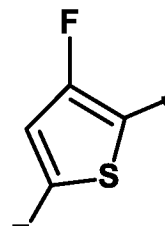
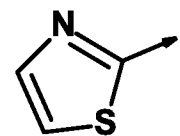
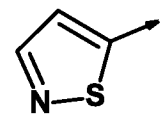
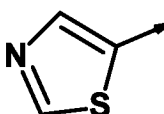
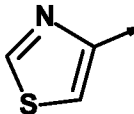
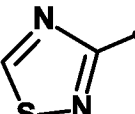
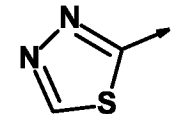
				
Q-1.1	Q-1.2	Q-1.3	Q-1.4	Q-1.5
				
Q-1.6	Q-1.7	Q-1.8	Q-1.9	Q-1.10
				
Q-1.11	Q-1.12	Q-1.13	Q-1.14	Q-1.15
				
Q-1.16	Q-1.17	Q-1.18	Q-1.19	Q-1.20
				
Q-1.21	Q-1.22	Q-1.23	Q-1.24	Q-1.25

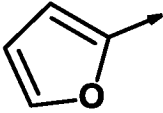
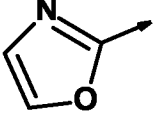
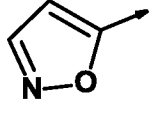
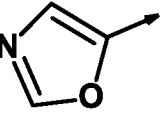
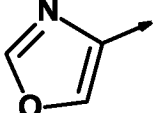
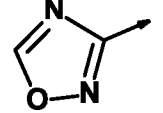
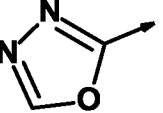
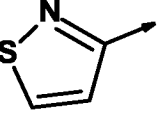
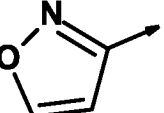
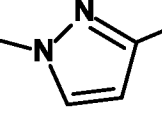
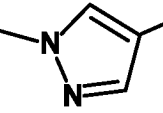
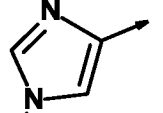
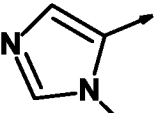
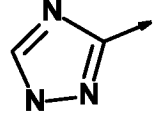
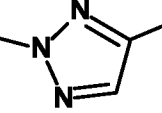
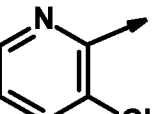
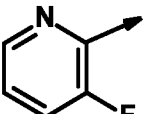
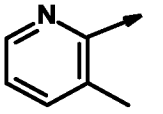
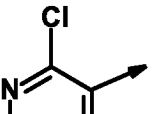
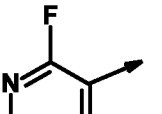
Q-1.26	Q-1.27	Q-1.28	Q-1.29	Q-1.30
Q-1.31	Q-1.32	Q-1.33	Q-1.34	Q-1.35
Q-1.36	Q-1.37	Q-1.38	Q-1.39	Q-1.40
Q-1.41	Q-1.42	Q-1.43	Q-1.44	Q-1.45
Q-1.46	Q-1.47	Q-1.48	Q-1.49	Q-1.50
Q-1.51	Q-1.52	Q-1.53		

и

R<sup>2</sup> означает группы Q-2.1 – Q-2.60

Q-2.1	Q-2.2	Q-2.3	Q-2.4	Q-2.5

				
Q-2.6	Q-2.7	Q-2.8	Q-2.9	Q-2.10
				
Q-2.11	Q-2.12	Q-2.13	Q-2.14	Q-2.15
				
Q-2.16	Q-2.17	Q-2.18	Q-2.19	Q-2.20
				
Q-2.21	Q-2.22	Q-2.23	Q-2.24	Q-2.25
				
Q-2.26	Q-2.27	Q-2.28	Q-2.29	Q-2.30
				
Q-2.31	Q-2.32	Q-2.33	Q-2.34	Q-2.35
				
Q-2.36	Q-2.37	Q-2.38	Q-2.39	Q-2.40

				
Q-2.41	Q-2.42	Q-2.43	Q-2.44	Q-2.45
				
Q-2.46	Q-2.47	Q-2.48	Q-2.49	Q-2.50
				
Q-2.51	Q-2.52	Q-2.53	Q-2.54	Q-2.55
				
Q-2.56	Q-2.57	Q-2.58	Q-2.59	Q-2.60

$R^3$  означает водород,

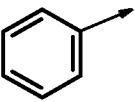
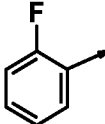
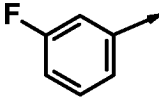
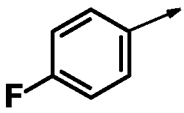
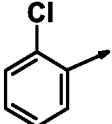
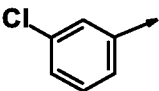
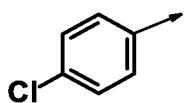
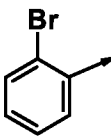
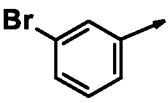
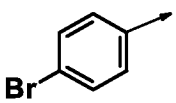
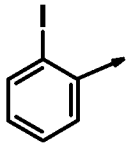
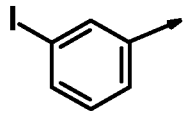
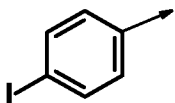
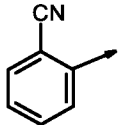
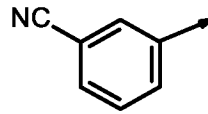
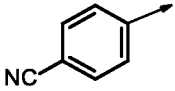
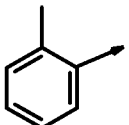
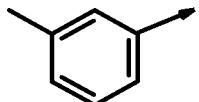
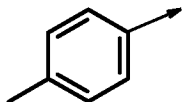
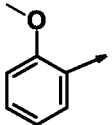
и

$R^4$  означает водород, метил, этил, н-пропил, изопропил, н-бутил, н-пентил, фенил, бензил,  $CH_2(4-Cl-Ph)$ ,  $CH_2(4-F-Ph)$ ,  $CH_2(4-MeO-Ph)$ , 2-метоксиэтил, тетрагидрофуран-2-ил-метил, тетрагидрофуран-3-ил-метил, тетрагидропиран-2-ил-метил, тетрагидропиран-3-ил-метил, тетрагидропиран-4-ил-метил, метилпропионат-3-ил, этилпропионат-3-ил, метилацетат-2-ил, этилацетат-2-ил, метилпивалат-2-ил, этилпивалат-3-ил, метил-2-метилпропаноат-3-ил, метил-2,2-диметилпропаноат-3-ил, этил-2-метилпропаноат-3-ил, метил-2-пропаноат-2-ил, этил-2-пропаноат-2-ил, метил-ацет-2-ил, этил-ацет-2-ил, метил-1-метилциклопропанкарбоксилат-2-ил, этил-1-метилциклопропанкарбоксилат-2-ил, 2-(диметиламино)этил, оксетан-3-ил, (3-метилоксетан-3-ил)метил, 2,2,2-трифторэтил, 2,2-дифторэтил, 2-

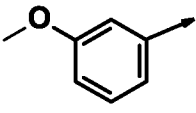
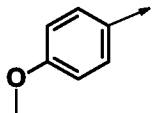
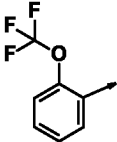
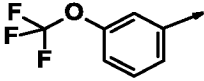
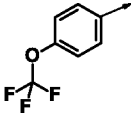
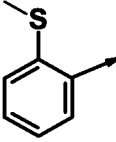
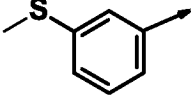
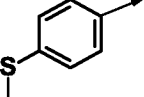
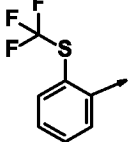
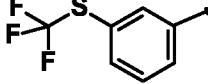

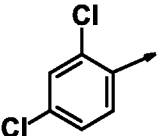
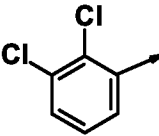
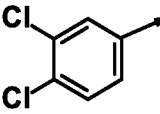
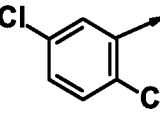
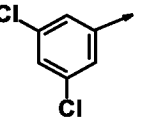
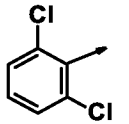
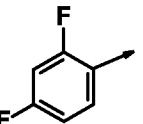
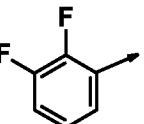
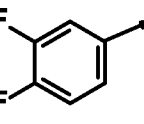
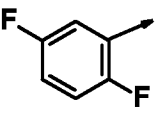
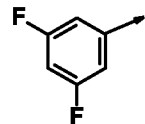
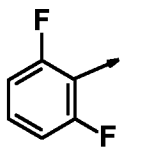
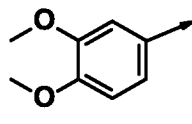
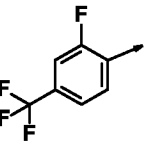
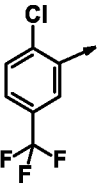
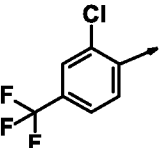
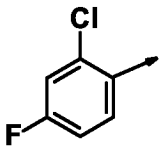
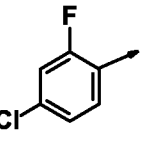
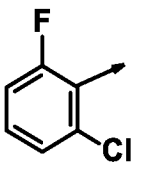
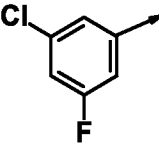
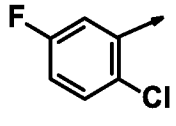
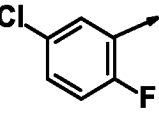
фторэтил, 2,2,3,3,3-пентафторпропил, циклопропилметил, 1-циклопропил-этил, (1-метил-циклопропил)-метил, (2,2-дихлорциклопропил)-метил, (2,2-диметил-циклопропил)-метил, аллил, пропаргил (проп-2-ин-1-ил), 2-хлорпроп-2-ен-1-ил, 3-фенилпроп-2-ин-1-ил, 3,3-дихлорпроп-2-ен-1-ил, 3,3-дихлор-2-фтор-проп-2-ен-1-ил, метилпроп-2-ин-1-ил, 2-метилпроп-2-ен-1-ил, бут-2-ен-1-ил, бут-3-ен-1-ил, бут-2-ин-1-ил, бут-3-ин-1-ил, 4-хлор-бут-2-ин-1-ил, 3-метил-бут-2-ен-1-ил, 3-метил-бут-1-ен-1-ил, 1-(2E)-1-метилбут-2-ен-1-ил, (E)-пент-3-ен-2-ил или (Z)-пент-3-ен-2-ил, циклобутилметил, циклопентилметил, циклогексилметил, гептан-2-ил, изобутил, 1,3-диоксолан-2-илметил или 1-этил-5-метил-1H-пиразол-4-метил.

В частности, чрезвычайно особенно предпочтительным предметом изобретения являются соединения общей формулы (I), в которой

(R<sup>1</sup>)<sub>n</sub>-фенил означает группы Q-1.1 – Q-1.53

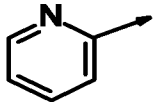
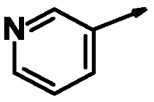
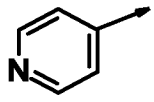
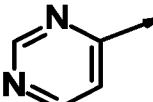
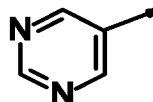
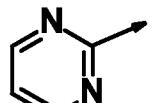
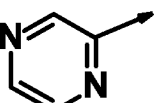
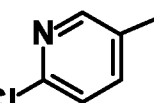
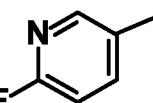
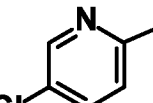
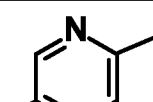
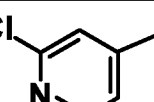
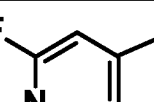
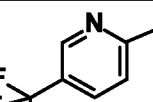
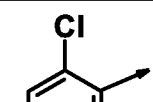
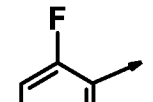
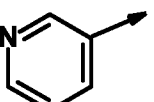
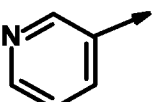
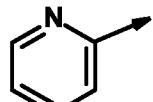
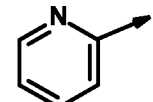
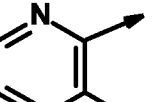
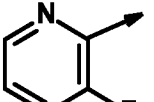
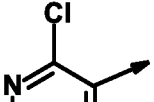
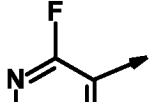
				
Q-1.1	Q-1.2	Q-1.3	Q-1.4	Q-1.5
				
Q-1.6	Q-1.7	Q-1.8	Q-1.9	Q-1.10
				
Q-1.11	Q-1.12	Q-1.13	Q-1.14	Q-1.15
				
Q-1.16	Q-1.17	Q-1.18	Q-1.19	Q-1.20



				
Q-1.21	Q-1.22	Q-1.23	Q-1.24	Q-1.25
				
Q-1.26	Q-1.27	Q-1.28	Q-1.29	Q-1.30
				
Q-1.31	Q-1.32	Q-1.33	Q-1.34	Q-1.35
				
Q-1.36	Q-1.37	Q-1.38	Q-1.39	Q-1.40
				
Q-1.41	Q-1.42	Q-1.43	Q-1.44	Q-1.45
				
Q-1.46	Q-1.47	Q-1.48	Q-1.49	Q-1.50
				
Q-1.51	Q-1.52	Q-1.53		

и

R<sup>2</sup> означает группы Q-2.1 – Q-2.60

				
Q-2.1	Q-2.2	Q-2.3	Q-2.4	Q-2.5
				
Q-2.6	Q-2.7	Q-2.10	Q-2.11	Q-2.12
				
Q-2.13	Q-2.14	Q-2.15	Q-2.17	Q-2.18
				
Q-2.19	Q-2.21	Q-2.22	Q-2.24	Q-2.25
				
Q-2.56	Q-2.57	Q-2.59	Q-2.60	

R<sup>3</sup> означает водород,

и

R<sup>4</sup> означает водород, метил, этил, н-пропил, изопропил, н-бутил, н-пентил, фенил, бензил, CH<sub>2</sub>(4-Cl-Ph), CH<sub>2</sub>(4-F-Ph), CH<sub>2</sub>(4-MeO-Ph), 2-метоксиэтил, тетрагидрофуран-2-ил-метил, тетрагидрофуран-3-ил-метил, тетрагидропиран-2-ил-метил, тетрагидропиран-3-ил-метил, тетрагидропиран-4-ил-метил, метилпропионат-3-ил, этилпропионат-3-

ил, метилацетат-2-ил, этилацетат-2-ил, метилпивалат-2-ил, этилпивалат-3-ил, метил-2-метилпропаноат-3-ил, метил-2,2-диметилпропаноат-3-ил, этил-2-метилпропаноат-3-ил, метил-2-пропаноат-2-ил, этил-2-пропаноат-2-ил, метил-ацет-2-ил, этил-ацет-2-ил, метил-1-метилциклопропанкарбоксилат-2-ил, этил-1-метилциклопропанкарбоксилат-2-ил, 2-(диметиламино)этил, оксетан-3-ил, (3-метилоксетан-3-ил)метил, 2,2,2-трифторэтил, 2,2-дифторэтил, 2-фторэтил, 2,2,3,3,3-пентафторпропил, циклопропилметил, 1-циклопропил-этил, (1-метил-циклопропил)-метил, (2,2-дихлорциклопропил)-метил, (2,2-диметил-циклопропил)-метил, аллил, пропаргил (проп-2-ин-1-ил), 2-хлорпроп-2-ен-1-ил, 3-фенилпроп-2-ин-1-ил, 3,3-дихлорпроп-2-ен-1-ил, 3,3-дихлор-2-фтор-проп-2-ен-1-ил, метилпроп-2-ин-1-ил, 2-метилпроп-2-ен-1-ил, бут-2-ен-1-ил, бут-3-ен-1-ил, бут-2-ин-1-ил, бут-3-ин-1-ил, 4-хлор-бут-2-ин-1-ил, 3-метил-бут-2-ен-1-ил, 3-метил-бут-1-ен-1-ил, 1-(2E)-1-метилбут-2-ен-1-ил, (E)-пент-3-ен-2-ил или (Z)-пент-3-ен-2-ил, циклобутилметил, циклопентилметил, циклогексилметил, гептан-2-ил, изобутил, 1,3-диоксолан-2-илметил или 1-этил-5-метил-1H-пиразол-4-метил.

Общие определения остатков, перечисленные выше или перечисленные в предпочтительных диапазонах, применяются как к конечным продуктам общей формулы (I), так и, соответственно, к исходным продуктам или промежуточным продуктам, необходимым для производства в каждом конкретном случае. Эти определения остатков могут быть произвольно объединены между собой, а значит, и между заданными предпочтительными диапазонами.

Особый интерес представляют, в частности, по причинам более высокого гербицидного действия, лучшей селективности и/или лучшей реализуемости, соединения указанной общей формулы (I) или их соли в соответствии с изобретением или их применение в соответствии с изобретением, представляющее особый интерес, где отдельные остатки имеют одно из предпочтительных значений, упомянутых ранее или указанных ниже, или, в частности, такие соединения, в которых одно или более упомянутых ранее или указанных ниже предпочтительных значений выступают в комбинации.

Применительно к соединениям в соответствии с изобретением поясняются обозначения, упомянутые выше и далее ниже. Они являются общеизвестными для специалиста и имеют, в частности, значения, пояснение которых приведено ниже:

Если не определено иначе, то, как правило, для обозначения химических групп применяется то, что связывание с каркасом или остальной частью молекулы проходит, соответственно, через названный последним структурный элемент рассматриваемой химической группы, то есть, например, в случае (C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>)-алкенилокси через атом кислорода, и в случае гетероциклил-(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-алкила или MeO(O)C-(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-алкила соответственно через атом углерода алкильной группы.

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

Согласно изобретению "алкилтио" означает - отдельно или как компонент химической группы - прямолинейный или разветвленный S-алкил, предпочтительно с 1 - 8, или с 1 - 6 атомами углерода, такой как (C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub>)-, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)- или (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-алкилтио, например, (но не ограничиваясь этим) (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-алкилтио, такой как метилтио, этилтио, пропилтио, 1-метилэтилтио, бутилтио, 1-метилпропилтио, 2-метилпропилтио, 1,1-диметилэтилтио, пентилтио, 1-метилбутилтио, 2-метилбутилтио, 3-метилбутилтио, 1,1-диметилпропилтио, 1,2-диметилпропилтио, 2,2-диметилпропилтио, 1-этилпропилтио, гексилтио, 1-метилпентилтио, 2-метилпентилтио, 3-метилпентилтио, 4-метилпентилтио, 1,1-диметилбутилтио, 1,2-

диметилбутилтио, 1,3-диметилбутилтио, 2,2-диметилбутилтио, 2,3-диметилбутилтио, 3,3-диметилбутилтио, 1-этилбутилтио, 2-этилбутилтио, 1,1,2-триметилпропилтио, 1,2,2-триметилпропилтио, 1-этил-1-метилпропилтио и 1-этил-2-метилпропилтио.

"Алкилсульфинил (алкил-S(=O)-)", в соответствии с изобретением, если иное не определено в другом месте, означает алкильные остатки, которые присоединены к каркасу через S(=O)-, такие как (C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub>)-, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)- или (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-алкилсульфинил, например, (но не ограничиваясь этим) (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-алкилсульфинил, такой как метилсульфинил, этилсульфинил, пропилсульфинил, 1-метилэтилсульфинил, бутилсульфинил, 1-метилпропилсульфинил, 2-метилпропилсульфинил, 1,1-диметилэтилсульфинил, пентилсульфинил, 1-метилбутилсульфинил, 2-метилбутилсульфинил, 3-метилбутилсульфинил, 1,1-диметилпропилсульфинил, 1,2-диметилпропилсульфинил, 2,2-диметилпропилсульфинил, 1-этилпропилсульфинил, гексилсульфинил, 1-метилпентилсульфинил, 2-метилпентилсульфинил, 3-метилпентилсульфинил, 4-метилпентилсульфинил, 1,1-диметилбутилсульфинил, 1,2-диметилбутилсульфинил, 1,3-диметилбутилсульфинил, 2,2-диметилбутилсульфинил, 2,3-диметилбутилсульфинил, 3,3-диметилбутилсульфинил, 1-этилбутилсульфинил, 2-этилбутилсульфинил, 1,1,2-триметилпропилсульфинил, 1,2,2-триметилпропилсульфинил, 1-этил-1-метилпропилсульфинил и 1-этил-2-метилпропилсульфинил.

"Алкокси" означает алкильный остаток, связанный через атом кислорода, например, (но не ограничиваясь этим) (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-алкокси, такой как метокси, этокси, пропокси, 1-метилэтокси, бутокси, 1-метилпропокси, 2-метилпропокси, 1,1-диметилэтокси, пентокси, 1-метилбутокси, 2-метилбутокси, 3-метилбутокси, 1,1-диметилпропокси, 1,2-диметилпропокси, 2,2-диметилпропокси, 1-этилпропокси, гексокси, 1-метилпентокси, 2-метилпентокси, 3-метилпентокси, 4-метилпентокси, 1,1-диметилбутокси, 1,2-диметилбутокси, 1,3-диметилбутокси, 2,2-диметилбутокси, 2,3-диметилбутокси, 3,3-диметилбутокси, 1-этилбутокси, 2-этилбутокси, 1,1,2-триметилпропокси, 1,2,2-триметилпропокси, 1-этил-1-метилпропокси и 1-этил-2-метилпропокси. Алкенилокси означает алкенильный остаток, связанный через атом кислорода, алкинилокси означает алкинильный остаток, связанный через атом кислорода, такой как (C<sub>2</sub>-C<sub>10</sub>)-, (C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)- или (C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>)-алкенокси или (C<sub>3</sub>-C<sub>10</sub>)-, (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)- или (C<sub>3</sub>-C<sub>4</sub>)-алкинокси.

"Алкилкарбонил" (алкил-C(=O)-), если иное не определено в другом месте, согласно изобретению означает алкильные остатки, которые присоединены к каркасу через -C(=O)-, такие как (C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub>)-, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)- или (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-алкилкарбонил. При этом количество атомов С относится к алкильному остатку в алкилкарбонильной группе.

"Алкоксикарбонил (алкил-O-C(=O)-)", если иное не определено в другом месте: алкильные остатки, которые присоединены к каркасу через -O-C(=O)-, такие как (C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub>)-, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)- или (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-алкоксикарбонил. Количество атомов С относится к алкильному остатку в алкоксикарбонильной группе. Аналогичным образом "алкенилоксикарбонил" и "алкинилоксикарбонил", если иное не определено в другом месте, согласно изобретению означают алкенил- или алкинильные остатки, которые присоединены к каркасу через -O-C(=O)-, такие как (C<sub>2</sub>-C<sub>10</sub>)-, (C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)- или (C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>)-алкенилоксикарбонил или (C<sub>3</sub>-C<sub>10</sub>)-, (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)- или (C<sub>3</sub>-C<sub>4</sub>)-алкинилоксикарбонил. Количество атомов С относится к алкенильным или алкинильным остаткам в алкенил- или алкинилкарбонильной группе.

Термин "алкилкарбонилокси" (алкил-C(=O)-O-) согласно изобретению означает, если иное не определено в другом месте, алкильные остатки, которые присоединены к каркасу через карбонилокси-группу (-C(=O)-O-) с кислородом, такие как (C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub>)-, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)- или (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-алкилкарбонилокси. Количество атомов С относится к алкильному остатку в алкилкарбонилокси-группе.

Термин "арил" означает, при необходимости, замещенную моно-, би- или полициклическую ароматическую систему, предпочтительно с 6 - 14, в частности, с 6 - 10 атомами С кольца, например, фенил, нафтил, антрил, фенантренил, и аналогичным образом, предпочтительно фенил.

Термин "при необходимости, замещенный арил" также включает многоциклические системы, такие как тетрагидронафтил, инденил, инданил, флуоренил, бифенил, причем место примыкания находится на ароматической системе. С точки зрения систематики, термин «арил» обычно также включает в себя термин «при необходимости, замещенный фенил». Предпочтительные арил-заместители представляют собой здесь, например, водород, галоген, алкил, циклоалкил, циклоалкилалкил, циклоалкенил, галоциклоалкил, алкенил, алкинил,

арил, арилалкил, гетероарил, гетероарилалкил, гетероцикллил, гетероциклилалкил, алкоксиалкил, алкилтио, галоалкилтио, галоалкил, алкокси, галоалкокси, циклоалкокси, циклоалкилалкокси, арилокси, гетероарилокси, алкоксиалкокси, алкинилалкокси, алкенилокси, бис-алкиламиноалкокси, трис-[алкил]силил, бис-[алкил]арилсилил, бис-[алкил]алкилсилил, трис-[алкил]силилалкинил, алкилалкинил, циклоалкилалкинил, галоалкилалкинил, гетероцикллил-N-алкокси, нитро, циано, amino, алкиламино, бис-алкиламино, алкилкарбониламино, циклоалкилкарбониламино, арилкарбониламино, алкоксикарбониламино, алкоксикарбонилалкиламино, арилалкоксикарбонилалкиламино, гидроксикарбонил, алкоксикарбонил, аминокарбонил, алкиламинокарбонил, циклоалкиламинокарбонил, бис-алкиламинокарбонил, гетероарилалкокси, арилалкокси.

Гетероциклический остаток (гетероцикллил) содержит, по крайней мере, одно гетероциклическое кольцо (=карбоциклическое кольцо, в котором, по меньшей мере, один атом углерода заменен гетероатомом, предпочтительно гетероатомом из группы N, O, S, P), которое является насыщенным, ненасыщенным, частично насыщенным или гетероароматическим, и может быть незамещенным или замещенным, при этом точка присоединения расположена на атоме кольца. Если гетероциклический остаток или гетероциклическое кольцо в отдельных случаях замещены, оно может быть конденсировано с другими карбоциклическими или гетероциклическими кольцами. В случае с необязательно замещенным гетероциклилом также включаются мультициклические системы, такие как, например, 8-аза-бицикло[3.2.1]октанил, 8-аза-бицикло[2.2.2]октанил или 1-аза-бицикло[2.2.1] гептил. В случае с необязательно замещенным гетероциклилом также включаются спироциклические системы, как, например, 1-окса-5-аза-спиро[2.3]гексил. За исключением случаев, когда указано иное, гетероциклическое кольцо предпочтительно содержит 3 - 9 кольцевых атомов, в частности, 3 - 6 кольцевых атомов, и один или более, предпочтительно 1 - 4, в частности, 1, 2 или 3 гетероатома в гетероциклическом кольце, предпочтительно из группы N, O, и S, при этом два атома кислорода не должны непосредственно соседствовать друг с другом, как, например, с одним гетероатомом из группы N, O и S 1- или 2-, или 3-пирролидинил, 3,4-дигидро-2Н-пиррол-2- или 3-ил, 2,3-дигидро-1Н-пиррол-1- или 2-, или 3-, или 4-, или 5-ил; 2,5-дигидро-1Н-пиррол-1- или 2-, или 3-ил, 1- или 2-, или 3-, или 4-пиперидинил; 2,3,4,5-тетрагидропиридин-

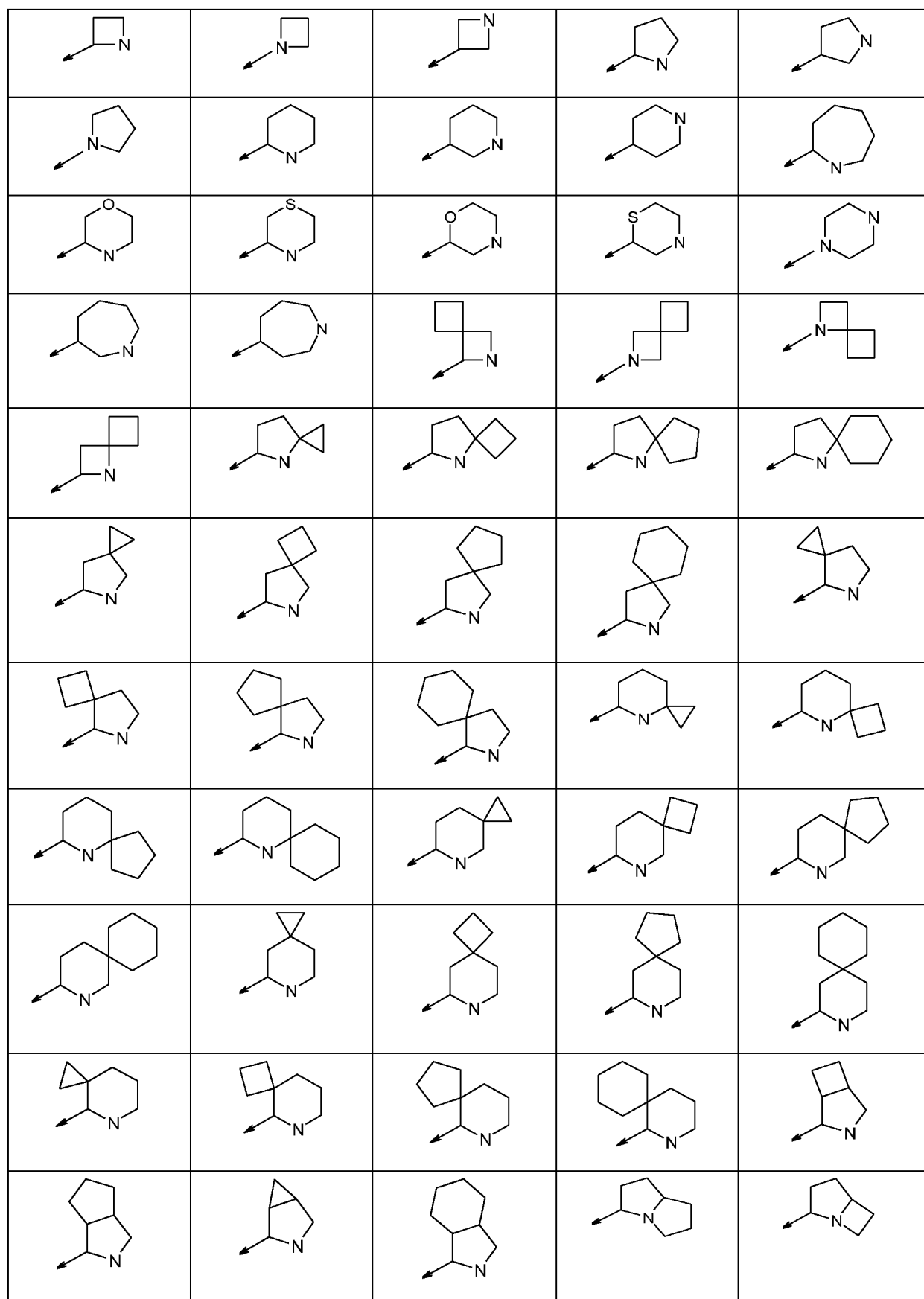
2- или 3-, или 4-, или 5-ил, или 6-ил; 1,2,3,6-тетрагидропиридин-1- или 2-, или 3-, или 4-, или 5-, или 6-ил; 1,2,3,4-тетрагидропиридин-1- или 2-, или 3-, или 4-, или 5-, или 6-ил; 1,4-дигидропиридин-1- или 2-, или 3-, или 4-ил; 2,3-дигидропиридин-2- или 3-, или 4-, или 5-, или 6-ил; 2,5-дигидропиридин-2- или 3-, или 4-, или 5-, или 6-ил, 1- или 2-, или 3-, или 4-азепанил; 2,3,4,5-тетрагидро-1Н-азепин-1- или 2-, или 3-, или 4-, или 5-, или 6-, или 7-ил; 2,3,4,7-тетрагидро-1Н-азепин-1- или 2-, или 3-, или 4-, или 5-, или 6-, или 7-ил; 2,3,6,7-тетрагидро-1Н-азепин-1- или 2-, или 3-, или 4-ил; 3,4,5,6-тетрагидро-2Н-азепин-2- или 3-, или 4-, или 5-, или 6-, или 7-ил; 4,5-дигидро-1Н-азепин-1- или 2-, или 3-, или 4-ил; 2,5-дигидро-1Н-азепин-1- или -2-, или 3-, или 4-, или 5-, или 6-, или 7-ил; 2,7-дигидро-1Н-азепин-1- или -2-, или 3-, или 4-ил; 2,3-дигидро-1Н-азепин-1- или -2-, или 3-, или 4-, или 5-, или 6-, или 7-ил; 3,4-дигидро-2Н-азепин-2- или 3-, или 4-, или 5-, или 6-, или 7-ил; 3,6-дигидро-2Н-азепин-2- или 3-, или 4-, или 5-, или 6-, или 7-ил; 5,6-дигидро-2Н-азепин-2- или 3-, или 4-, или 5-, или 6-, или 7-ил; 4,5-дигидро-3Н-азепин-2- или 3-, или 4-, или 5-, или 6-, или 7-ил; 1Н-азепин-1- или -2-, или 3-, или 4-, или 5-, или 6-, или 7-ил; 2Н-азепин-2- или 3-, или 4-, или 5-, или 6-, или 7-ил; 3Н-азепин-2- или 3-, или 4-, или 5-, или 6-, или 7-ил; 4Н-азепин-2- или 3-, или 4-, или 5-, или 6-, или 7-ил, 2- или 3-оксоланил (= 2- или 3-тетрагидрофуранил); 2,3-дигидрофуран-2- или 3-, или 4-, или 5-ил; 2,5-дигидрофуран-2- или 3-ил, 2- или 3-, или 4-оксанил (= 2- или 3-, или 4-тетрагидропиранил); 3,4-дигидро-2Н-пиран-2- или 3-, или 4-, или 5-, или 6-ил; 3,6-дигидро-2Н-пиран-2- или 3-, или 4-, или 5-, или 6-ил; 2Н-пиран-2- или 3-, или 4-, или 5-, или 6-ил; 4Н-пиран-2- или 3-, или 4-ил, 2- или 3-, или 4-оксепанил; 2,3,4,5-тетрагидрооксепин-2- или 3-, или 4-, или 5-, или 6-, или 7-ил; 2,3,4,7-тетрагидрооксепин-2- или 3-, или 4-, или 5-, или 6-, или 7-ил; 2,3,6,7-тетрагидрооксепин-2- или 3-, или 4-ил; 2,3-дигидрооксепин-2- или 3-, или 4-, или 5-, или 6-, или 7-ил; 4,5-дигидрооксепин-2- или 3-, или 4-ил; 2,5-дигидрооксепин-2- или 3-, или 4-, или 5-, или 6-, или 7-ил; оксепин-2- или 3-, или 4-, или 5-, или 6-, или 7-ил; 2- или 3-тетрагидротиофенил; 2,3-дигидротиофен-2- или 3-, или 4-, или 5-ил; 2,5-дигидротиофен-2- или 3-ил; тетрагидро-2Н-тиопиран-2- или 3-, или 4-ил; 3,4-дигидро-2Н-тиопиран-2- или 3-, или 4-, или 5-, или 6-ил; 3,6-дигидро-2Н-тиопиран-2- или 3-, или 4-, или 5-, или 6-ил; 2Н-тиопиран-2- или 3-, или 4-, или 5-, или 6-ил; 4Н-тиопиран-2- или 3-, или 4-ил. Предпочтительными 3-кольцевыми и 4-кольцевыми гетероциклами являются, например, 1- или 2-азиридирил, оксиранил, тиранил, 1- или 2-, или 3-азетидинил, 2- или 3-оксетанил, 2- или 3-тиетанил, 1,3-

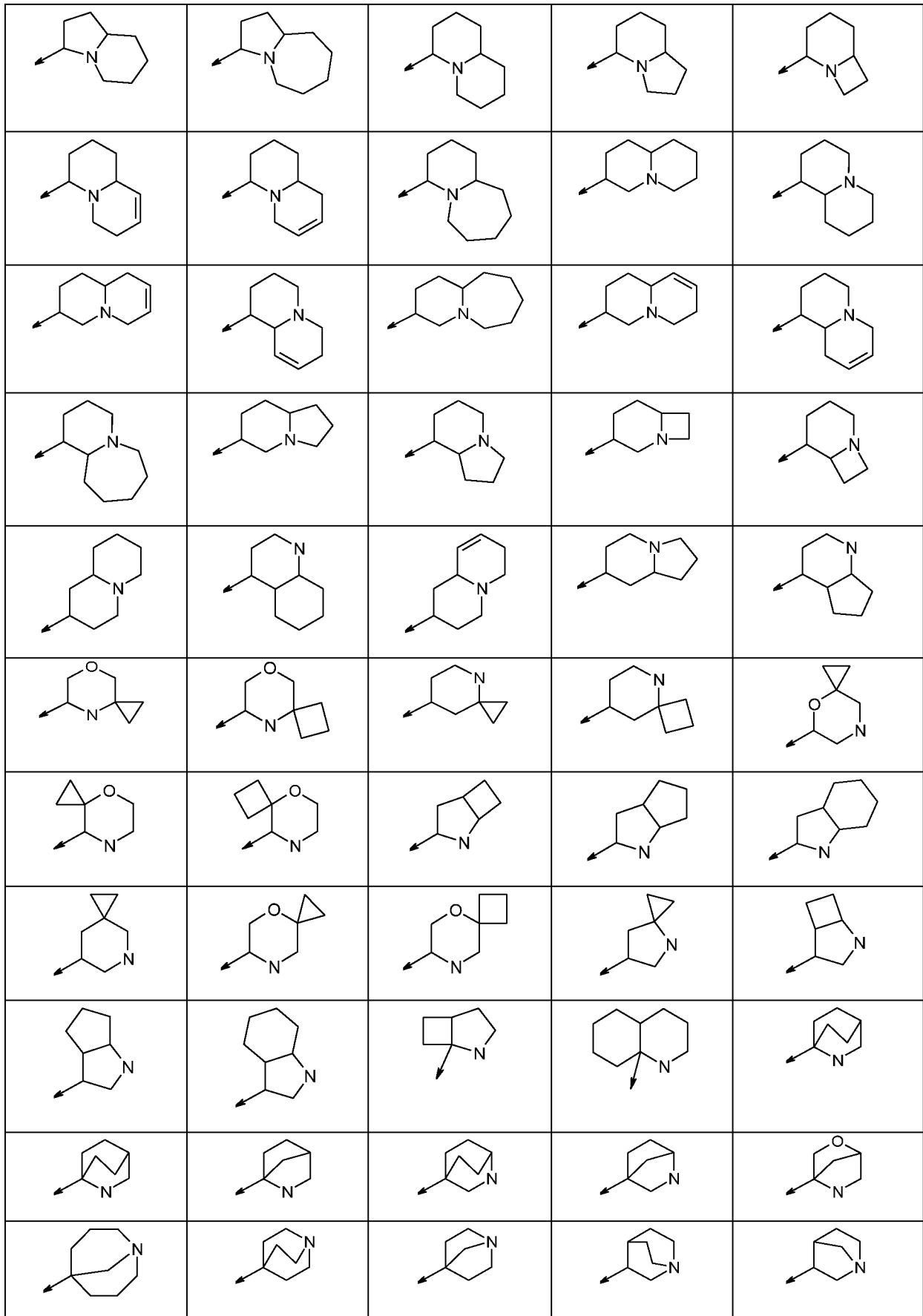


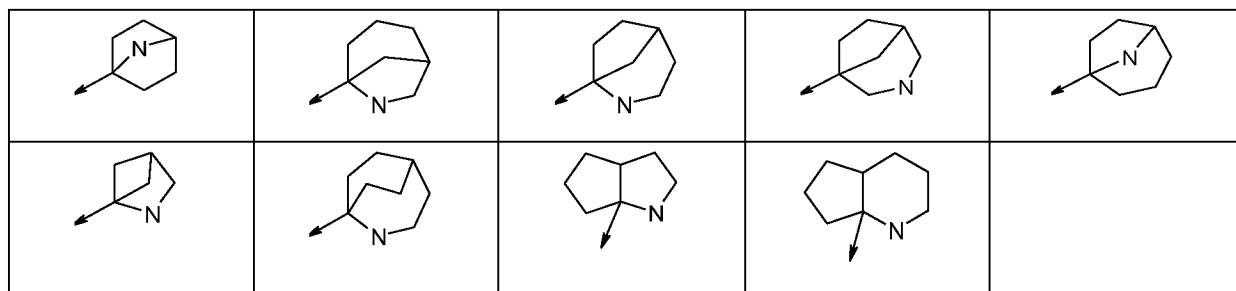
диоксетан-2-ил. Другими примерами «гетероциклила» являются частично или полностью гидрированный гетероциклический остаток с двумя гетероатомами из группы N, O и S, как, например, 1- или 2-, или 3-, или 4-пиразолидинил; 4,5-дигидро-3Н-пиразол-3- или 4-, или 5-ил; 4,5-дигидро-1Н-пиразол-1- или 3-, или 4-, или 5-ил; 2,3-дигидро-1Н-пиразол-1- или 2-, или 3-, или 4-, или 5-ил; 1- или 2-, или 3-, или 4- имидазолидинил; 2,3-дигидро-1Н-имидазол-1- или 2-, или 3-, или 4-ил; 2,5-дигидро-1Н-имидазол-1- или 2-, или 4-, или 5-ил; 4,5-дигидро-1Н-имидазол-1- или 2-, или 4-, или 5-ил; гексагидропиридазин-1- или 2-, или 3-, или 4-ил; 1,2,3,4-тетрагидропиридазин-1- или 2-, или 3-, или 4-, или 5-, или 6-ил; 1,2,3,6-тетрагидропиридазин-1- или 2-, или 3-, или 4-, или 5-, или 6-ил; 1,4,5,6-тетрагидропиридазин-1- или 3-, или 4-, или 5-, или 6-ил; 3,4,5,6-тетрагидропиридазин-3- или 4-, или 5-ил; 4,5-дигидропиридазин-3- или 4-ил; 3,4-дигидропиридазин-3- или 4-, или 5-, или 6-ил; 3,6-дигидропиридазин-3- или 4-ил; 1,6-дигидропиразин-1- или 3-, или 4-, или 5-, или 6-ил; гексагидропиримидин-1- или 2-, или 3-, или 4-ил; 1,4,5,6-тетрагидропиримидин-1- или 2-, или 4-, или 5-, или 6-ил; 1,2,5,6-тетрагидропиримидин-1- или 2-, или 4-, или 5-, или 6-ил; 1,2,3,4-тетрагидропиримидин-1- или 2-, или 3-, или 4-, или 5-, или 6-ил; 1,6-дигидропиримидин-1- или 2-, или 4-, или 5-, или 6-ил; 1,2-дигидропиримидин-1- или 2-, или 4-, или 5-, или 6-ил; 2,5-дигидропиримидин-2- или 4-, или 5-ил; 4,5-дигидропиримидин-4-, или 5-, или 6-ил; 1,4-дигидропиримидин-1- или 2-, или 4-, или 5-, или 6-ил; 1- или 2-, или 3-пиперазинил; 1,2,3,6-тетрагидропиразин-1- или 2-, или 3-, или 5-, или 6-ил; 1,2,3,4-тетрагидропиразин-1- или 2-, или 3-, или 4-, или 5-, или 6-ил; 1,2-дигидропиразин-1- или 2-, или 3-, или 5-, или 6-ил; 1,4-дигидропиразин-1- или 2-, или 3-ил; 2,3-дигидропиразин-2- или 3-, или 5-, или 6-ил; 2,5-дигидропиразин-2- или 3-ил; 1,3-диоксолан-2- или 4-, или 5-ил; 1,3-диоксол-2- или 4-ил; 1,3-диоксан-2- или 4-, или 5-ил; 4Н-1,3-диоксин-2- или 4-, или 5-, или 6-ил; 1,4-диоксан-2- или 3-, или 5-, или 6-ил; 2,3-дигидро-1,4-диоксин-2- или 3-, или 5-, или 6-ил; 1,4-диоксин-2- или 3-ил; 1,2-дитиолан-3- или 4-ил; 3Н-1,2-дитиол-3- или 4-, или 5-ил; 1,3-дитиолан-2- или 4-ил; 1,3-дитиол-2- или 4-ил; 1,2-дитиан-3- или 4-ил; 3,4-дигидро-1,2-дитиин-3- или 4-, или 5-, или 6-ил; 3,6-дигидро-1,2-дитиин-3- или 4-ил; 1,2-дитиин-3- или 4-ил; 1,3-дитиан-2- или 4-, или 5-ил; 4Н-1,3-дитиин-2- или 4-, или 5-, или 6-ил; изоксазолидин-2- или 3-, или 4-, или 5-ил; 2,3-дигидроизоксазол-2- или 3-, или 4-, или 5-ил; 2,5-дигидроизоксазол-2- или 3-, или 4-, или 5-ил; 4,5-дигидроизоксазол-3- или 4-, или 5-ил; 1,3-оксазолидин-2- или 3-,



оксазепин-2- или 4-, или 5-, или 6-, или 7-ил; 4,7-дигидро-1,3-оксазепин-2- или 4-, или 5-, или 6-, или 7-ил; 6,7-дигидро-1,3-оксазепин-2- или 4-, или 5-, или 6-, или 7-ил; 1,3-оксазепин-2- или 4-, или 5-, или 6-, или 7-ил; 1,4-оксазепан-2- или 3-, или 5-, или 6-, или 7-ил; 2,3,4,5-тетрагидро-1,4-оксазепин-2- или 3-, или 4-, или 5-, или 6-, или 7-ил; 2,3,4,7-тетрагидро-1,4-оксазепин-2- или 3-, или 4-, или 5-, или 6-, или 7-ил; 2,3,6,7-тетрагидро-1,4-оксазепин-2- или 3-, или 5-, или 6-, или 7-ил; 2,5,6,7-тетрагидро-1,4-оксазепин-2- или 3-, или 5-, или 6-, или 7-ил; 4,5,6,7-тетрагидро-1,4-оксазепин-2- или 3-, или 4-, или 5-, или 6-, или 7-ил; 2,3-дигидро-1,4-оксазепин-2- или 3-, или 5-, или 6-, или 7-ил; 2,5-дигидро-1,4-оксазепин-2- или 3-, или 5-, или 6-, или 7-ил; 2,7-дигидро-1,4-оксазепин-2- или 3-, или 5-, или 6-, или 7-ил; 4,5-дигидро-1,4-оксазепин-2- или 3-, или 4-, или 5-, или 6-, или 7-ил; 4,7-дигидро-1,4-оксазепин-2- или 3-, или 4-, или 5-, или 6-, или 7-ил; 6,7-дигидро-1,4-оксазепин-2- или 3-, или 5-, или 6-, или 7-ил; 1,4-оксазепин-2- или 3-, или 5-, или 6-, или 7-ил; изотиазолидин-2- или 3-, или 4-, или 5-ил; 2,3-дигидроизотиазол-2- или 3-, или 4-, или 5-ил; 2,5-дигидроизотиазол-2- или 3-, или 4-, или 5-ил; 4,5-дигидроизотиазол-3- или 4-, или 5-ил; 1,3-тиазолидин-2- или 3-, или 4-, или 5-ил; 2,3-дигидро-1,3-тиазол-2- или 3-, или 4-, или 5-ил; 2,5-дигидро-1,3-тиазол-2- или 4-, или 5-ил; 4,5-дигидро-1,3-тиазол-2- или 4-, или 5-ил; 1,3-тиазинан-2- или 3-, или 4-, или 5-, или 6-ил; 3,4-дигидро-2Н-1,3-тиазин-2- или 3-, или 4-, или 5-, или 6-ил; 3,6-дигидро-2Н-1,3-тиазин-2- или 3-, или 4-, или 5-, или 6-ил; 5,6-дигидро-2Н-1,3-тиазин-2- или 4-, или 5-, или 6-ил; 5,6-дигидро-4Н-1,3-тиазин-2- или 4-, или 5-, или 6-ил; 2Н-1,3-тиазин-2- или 4-, или 5-, или 6-ил; 6Н-1,3-тиазин-2- или 4-, или 5-, или 6-ил; 4Н-1,3-тиазин-2- или 4-, или 5-, или 6-ил. Другими примерами "гетероциклила" являются частично или полностью гидрированный гетероциклический остаток с 3 гетероатомами из группы N, O и S, как, например, 1,4,2-диоксазолидин-2- или 3-, или 5-ил; 1,4,2-диоксазол-3- или 5-ил; 1,4,2-диоксазинап-2- или -3-, или 5-, или 6-ил; 5,6-дигидро-1,4,2-диоксазин-3-, или 5-, или 6-ил; 1,4,2-диоксазин-3-, или 5-, или 6-ил; 1,4,2-диоксазепан-2- или 3-, или 5-, или 6-, или 7-ил; 6,7-дигидро-5Н-1,4,2-диоксазепин-3-, или 5-, или 6-, или 7-ил; 2,3-дигидро-7Н-1,4,2-диоксазепин-2- или 3-, или 5-, или 6-, или 7-ил; 2,3-дигидро-5Н-1,4,2-диоксазепин-2- или 3-, или 5-, или 6-, или 7-ил; 5Н-1,4,2-диоксазепин-3-, или 5-, или 6-, или 7-ил; 7Н-1,4,2-диоксазепин-3-, или 5-, или 6-, или 7-ил. Структурные примеры, при необходимости, дополнительно замещенных гетероциклов также приведены ниже:







Перечисленные выше гетероциклы предпочтительно замещены, например, водородом, галогеном, алкилом, галоалкилом, гидроксигруппой, алкоксигруппой, циклоалкоксигруппой, арилоксигруппой, алкоксиалкилом, алкоксиалкоксигруппой, циклоалкилом, галоциклоалкилом, арилом, арилалкилом, гетероарилем, гетероциклилом, алкенилом, алкилкарбонилем, циклоалкилкарбонилем, арилкарбонилем, гетероарилкарбонилем, алкоксикарбонилем, гидроксикарбонилем, циклоалкоксикарбонилем, циклоалкилалкоксикарбонилем, алкоксикарбонилалкилом, арилалкоксикарбонилем, арилалкоксикарбонилалкилом, алкинилем, алкинилалкилом, алкилалкинилем, трис-алкилсилалкинилем, нитрогруппой, аминогруппой, цианогруппой, галоалкоксигруппой, галоалкилтиогруппой, алкилтиогруппой, гидротиигруппой, гидроксикарбонилем, оксогруппой, гетероарилалкоксигруппой, арилалкоксигруппой, гетероциклилалкоксигруппой, гетероциклилалкилтиогруппой, гетероциклилоксигруппой, гетероциклилтиогруппой, гетероарилоксигруппой, бис-алкиламиногруппой, алкиламиногруппой, циклоалкиламиногруппой, гидроксикарбонилалкиламиногруппой, алкоксикарбонилалкиламиногруппой, арилалкоксикарбонилалкиламиногруппой, алкоксикарбонилалкил(алкил)аминогруппой, аминикарбонилем, алкиламинокарбонилем, бис-алкиламинокарбонилем, циклоалкиламинокарбонилем, гидроксикарбонилалкиламинокарбонилем, алкоксикарбонилалкиламинокарбонилем, арилалкоксикарбонилалкиламинокарбонилем.

Если основное вещество "замещено одним или более остатками" из списка остатков (= группа) или универсально определенной группы остатков, то в каждом случае это включает одновременное замещение несколькими одинаковыми и/или структурно различными остатками.

Если речь идет о частично или полностью насыщенном азотном гетероцикле, то он может быть связан с остальной частью молекулы как через углерод, так и через азот.

В качестве заместителей замещенного гетероциклического остатка рассматриваются упомянутые ниже заместители, в дополнение также оксо- и тиоксогруппы. Оксогруппа в качестве заместителя в атоме С кольца в таком случае

означает, например, карбонильную группу в гетероциклическом кольце. Таким образом, предпочтительно также включены лактоны и лактамы. Оксогруппа может также возникать на атомах гетероциклила, которые могут существовать в различных степенях окисления, например, при N и S, и затем образовывать, например, двухвалентные группы N(O), S(O) (также сокращенно SO) и S(O)<sub>2</sub> (также сокращенно SO<sub>2</sub>) в гетероциклическом кольце. В случае групп –N(O) и –S(O), соответственно, включены оба энантиомера.

Согласно изобретению термин "гетероарил" означает гетероароматические соединения, то есть полностью ненасыщенные ароматические гетероциклические соединения, предпочтительно 5-7-членное кольцо с 1 - 4, предпочтительно 1 - 2 одинаковыми или различными гетероатомами, предпочтительно O, S или N. Согласно изобретению гетероарилы представляют собой, например, 1H-пиррол-1-ил; 1H-пиррол-2-ил; 1H-пиррол-3-ил; фуран-2-ил; фуран-3-ил; тиен-2-ил; тиен-3-ил; 1H-имидазол-1-ил; 1H-имидазол-2-ил; 1H-имидазол-4-ил; 1H-имидазол-5-ил; 1H-пиразол-1-ил; 1H-пиразол-3-ил; 1H-пиразол-4-ил; 1H-пиразол-5-ил, 1H-1,2,3-триазол-1-ил, 1H-1,2,3-триазол-4-ил, 1H-1,2,3-триазол-5-ил, 2H-1,2,3-триазол-2-ил, 2H-1,2,3-триазол-4-ил, 1H-1,2,4-триазол-1-ил, 1H-1,2,4-триазол-3-ил, 4H-1,2,4-триазол-4-ил, 1,2,4-оксадиазол-3-ил, 1,2,4-оксадиазол-5-ил, 1,3,4-оксадиазол-2-ил, 1,2,3-оксадиазол-4-ил, 1,2,3-оксадиазол-5-ил, 1,2,5-оксадиазол-3-ил, азепинил, пиридин-2-ил, пиридин-3-ил, пиридин-4-ил, пирозин-2-ил, пирозин-3-ил, пиримидин-2-ил, пиримидин-4-ил, пиримидин-5-ил, пиридазин-3-ил, пиридазин-4-ил, 1,3,5-триазин-2-ил, 1,2,4-триазин-3-ил, 1,2,4-триазин-5-ил, 1,2,4-триазин-6-ил, 1,2,3-триазин-4-ил, 1,2,3-триазин-5-ил, 1,2,4-, 1,3,2-, 1,3,6- и 1,2,6-оксазинил, изоксазол-3-ил, изоксазол-4-ил, изоксазол-5-ил, 1,3-оксазол-2-ил, 1,3-оксазол-4-ил, 1,3-оксазол-5-ил, изотиазол-3-ил, изотиазол-4-ил, изотиазол-5-ил, 1,3-тиазол-2-ил, 1,3-тиазол-4-ил, 1,3-тиазол-5-ил, 1,3,4-тиадиазол-2-ил, 1,3,4-тиадиазол-5-ил, 1,2,4-тиадиазол-5-ил, 1,2,4-тиадиазол-3-ил, 1,2,5-тиадиазол-3-ил, 1,2,5-тиадиазол-3-ил, 1,2,3-тиадиазол-4-ил, 1,2,3-тиадиазол-5-ил, оксепинил, тиепинил, 1,2,4-триазолонил и 1,2,4-дiazепинил, 2H-1,2,3,4-тетразол-5-ил, 1H-1,2,3,4-тетразол-5-ил, 1,2,3,4-оксатриазол-5-ил, 1,2,3,4-тиатриазол-5-ил, 1,2,3,5-оксатриазол-4-ил, 1,2,3,5-тиатриазол-4-ил. Гетероарильные группы согласно изобретению могут быть дополнительно замещены одним или более, одинаковыми или различными остатками. Если два соседних атома углерода входят в состав другого

ароматического кольца, то они представляют собой аннелированные гетероароматические системы, такие как бензоконденсированные или многократно аннелированные гетероароматы. Предпочтительными являются, например, хинолин (например, хинолин-2-ил, хинолин-3-ил, хинолин-4-ил, хинолин-5-ил, хинолин-6-ил, хинолин-7-ил, хинолин-8-ил); изохинолин (например, изохинолин-1-ил, изохинолин-3-ил, изохинолин-4-ил, изохинолин-5-ил, изохинолин-6-ил, изохинолин-7-ил, изохинолин-8-ил); хиноксалин; хиназолин; циннолин; 1,5-нафтиридин; 1,6-нафтиридин; 1,7-нафтиридин; 1,8-нафтиридин; 2,6-нафтиридин; 2,7-нафтиридин; фиалазин; пиридопирозин; пиридопиримидин; пиридопиридазин; Pteridine; пиримидопиримидин. Примерами гетероарила также являются 5- или 6-членные бензоконденсированные кольца из группы 1Н-индол-1-ила, 1Н-индол-2-ила, 1Н-индол-3-ила, 1Н-индол-4-ила, 1Н-индол-5-ила, 1Н-индол-6-ила, 1Н-индол-7-ила, 1-бензофуран-2-ила, 1-бензофуран-3-ила, 1-бензофуран-4-ила, 1-бензофуран-5-ила, 1-бензофуран-6-ила, 1-бензофуран-7-ила, 1-бензотиофен-2-ила, 1-бензотиофен-3-ила, 1-бензотиофен-4-ила, 1-бензотиофен-5-ила, 1-бензотиофен-6-ила, 1-бензотиофен-7-ила, 1Н-индазол-1-ила, 1Н-индазол-3-ила, 1Н-индазол-4-ила, 1Н-индазол-5-ила, 1Н-индазол-6-ила, 1Н-индазол-7-ила, 2Н-индазол-2-ила, 2Н-индазол-3-ила, 2Н-индазол-4-ила, 2Н-индазол-5-ила, 2Н-индазол-6-ила, 2Н-индазол-7-ила, 2Н-изоиндол-2-ила, 2Н-изоиндол-1-ила, 2Н-изоиндол-3-ила, 2Н-изоиндол-4-ила, 2Н-изоиндол-5-ила, 2Н-изоиндол-6-ила; 2Н-изоиндол-7-ила, 1Н-бензимидазол-1-ила, 1Н-бензимидазол-2-ила, 1Н-бензимидазол-4-ила, 1Н-бензимидазол-5-ила, 1Н-бензимидазол-6-ила, 1Н-бензимидазол-7-ила, 1,3-бензоксазол-2-ила, 1,3-бензоксазол-4-ила, 1,3-бензоксазол-5-ила, 1,3-бензоксазол-6-ила, 1,3-бензоксазол-7-ила, 1,3-бензтиазол-2-ила, 1,3-бензтиазол-4-ила, 1,3-бензтиазол-5-ила, 1,3-бензтиазол-6-ила, 1,3-бензтиазол-7-ила, 1,2-бензизоксазол-3-ила, 1,2-бензизоксазол-4-ила, 1,2-бензизоксазол-5-ила, 1,2-бензизоксазол-6-ила, 1,2-бензизоксазол-7-ила, 1,2-бензизотиазол-3-ила, 1,2-бензизотиазол-4-ила, 1,2-бензизотиазол-5-ила, 1,2-бензизотиазол-6-ила, 1,2-бензизотиазол-7-ила.

Термин "галоген" означает, например, фтор, хлор, бром или йод. Если этот термин используется для обозначения остатка, то "галоген" означает, например, атом фтора, хлора, брома или йода.

В соответствии с изобретением "алкил" означает насыщенный углеводородный остаток с прямой или разветвленной открытой цепью, который,



при необходимости, замещен один или более раз, и в последнем случае называется "замещенным алкилом". Предпочтительными заместителями являются атомы галогена, алкокси-, галоалкокси-, циано-, алкилтио-, галоалкилтио-, циклоалкил-, алкоксикарбонил-, гидроксикарбонил-, гетероцикли-л, гетарил-, арил-, amino- или нитрогруппы, особенно предпочтительными являются метокси, метил, фторалкил, циано, нитро, фтор, хлор, бром или йод. Приставка «до» также включает комбинацию различных алкильных остатков, например, метил(этил) или этил(метил).

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

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

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

"Галоалкокси" представляет собой, например,  $\text{OCF}_3$ ,  $\text{OCHF}_2$ ,  $\text{OCH}_2\text{F}$ ,  $\text{OCF}_2\text{CF}_3$ ,  $\text{OCH}_2\text{CF}_3$  и  $\text{OCH}_2\text{CH}_2\text{Cl}$ ; То же самое относится к галоалкенилу и другим остаткам, замещенным галогеном.

Термин "(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-алкил", приведенный в качестве примера, означает сокращенное обозначение "прямолинейный или разветвленный алкил" с 1 - 4 атомами углерода, соответствующим диапазону для атомов C, то есть включает остатки 1-пропил, 2-пропил, 1-бутил, 2-бутил, 2-метилпропил или трет-бутил. Общие алкильные остатки с большим чем указанный диапазон атомов C, например, "(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-алкил", соответственно, также включают алкильные остатки с прямой цепью или разветвленные с большим количеством атомов C, то есть, в соответствии с примером, также алкильные остатки с 5 и 6 атомами C.

За исключением случаев, когда указано иное, в случае с углеводородными остатками, такими как алкильные, алкениловые и алкинильные остатки, а также в случае со сложными остатками, низшие углеродные структуры, например, с 1 - 6 атомами углерода или в случае с ненасыщенными группами с 2 - 6 атомами углерода, предпочтительными являются алкильные остатки, а также в случае со сложными остатками, такими как алкокси, галоалкил и т.д., например, метил, этил, н- или изопропил, н-, изо-, трет- или 2-бутил, пентил, гексил, как н-гексил, и- гексил и 1,3-диметилбутил, гептилы, такие как н-гептил, 1-метилгексил и 1,4-диметилпентил; алкенил- и алкинилоостатки обозначают возможные ненасыщенные остатки, которые соответствуют алкильным остаткам, которые отличаются тем, что они содержат, по меньшей мере, одну двойную или тройную связь.

Термин "алкенил", в частности, также включает прямолинейные или разветвленные углеводородные остатки с открытой цепью, имеющие более одной двойной связи, такие как 1,3-бутадиенил и 1,4-пентадиенил, но также алленильные или кумуленильные остатки с одной или более кумулированными двойными связями, как, например, алленил (1,2-пропадиенил), 1,2-бутадиенил и 1,2,3-пентатриенил. Алкенил означает, например, винил, который при необходимости может быть замещен другими алкильными остатками, например, (но не ограничиваясь этим) (C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)-алкенил, такой как этенил, 1-пропенил, 2-пропенил, 1-метилэтенил, 1-бутенил, 2-бутенил, 3-бутенил, 1-метил-1-пропенил, 2-метил-1-пропенил, 1-метил-2-пропенил, 2-метил-2-пропенил, 1-пентенил, 2-пентенил, 3-

пентенил, 4-пентенил, 1-метил-1-бутенил, 2-метил-1-бутенил, 3-метил-1-бутенил, 1-метил-2-бутенил, 2-метил-2-бутенил, 3-метил-2-бутенил, 1-метил-3-бутенил, 2-метил-3-бутенил, 3-метил-3-бутенил, 1,1-диметил-2-пропенил, 1,2-диметил-1-пропенил, 1,2-диметил-2-пропенил, 1-этил-1-пропенил, 1-этил-2-пропенил, 1-гексенил, 2-гексенил, 3-гексенил, 4-гексенил, 5-гексенил, 1-метил-1-пентенил, 2-метил-1-пентенил, 3-метил-1-пентенил, 4-метил-1-пентенил, 1-метил-2-пентенил, 2-метил-2-пентенил, 3-метил-2-пентенил, 4-метил-2-пентенил, 1-метил-3-пентенил, 2-метил-3-пентенил, 3-метил-3-пентенил, 4-метил-3-пентенил, 1-метил-4-пентенил, 2-метил-4-пентенил, 3-метил-4-пентенил, 4-метил-4-пентенил, 1,1-диметил-2-бутенил, 1,1-диметил-3-бутенил, 1,2-диметил-1-бутенил, 1,2-диметил-2-бутенил, 1,2-диметил-3-бутенил, 1,3-диметил-1-бутенил, 1,3-диметил-2-бутенил, 1,3-диметил-3-бутенил, 2,2-диметил-3-бутенил, 2,3-диметил-1-бутенил, 2,3-диметил-2-бутенил, 2,3-диметил-3-бутенил, 3,3-диметил-1-бутенил, 3,3-диметил-2-бутенил, 1-этил-1-бутенил, 1-этил-2-бутенил, 1-этил-3-бутенил, 2-этил-1-бутенил, 2-этил-2-бутенил, 2-этил-3-бутенил, 1,1,2-триметил-2-пропенил, 1-этил-1-метил-2-пропенил, 1-этил-2-метил-1-пропенил и 1-этил-2-метил-2-пропенил.

Термин "алкинил" также включает прямолинейные или разветвленные углеводородные остатки с открытой цепью, имеющие более одной тройной связи или также с одной или более тройными связями и одной или более двойными связями, как, например, 1,3-бутатриенил или 3-пентен-1-ин-1-ил. (C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)-Алкинил означает, например, этинил, 1-пропинил, 2-пропинил, 1-бутинил, 2-бутинил, 3-бутинил, 1-метил-2-пропинил, 1-пентинил, 2-пентинил, 3-пентинил, 4-пентинил, 1-метил-2-бутинил, 1-метил-3-бутинил, 2-метил-3-бутинил, 3-метил-1-бутинил, 1,1-диметил-2-пропинил, 1-этил-2-пропинил, 1-гексинил, 2-гексинил, 3-гексинил, 4-гексинил, 5-гексинил, 1-метил-2-пентинил, 1-метил-3-пентинил, 1-метил-4-пентинил, 2-метил-3-пентинил, 2-метил-4-пентинил, 3-метил-1-пентинил, 3-метил-4-пентинил, 4-метил-1-пентинил, 4-метил-2-пентинил, 1,1-диметил-2-бутинил, 1,1-диметил-3-бутинил, 1,2-диметил-3-бутинил, 2,2-диметил-3-бутинил, 3,3-диметил-1-бутинил, 1-этил-2-бутинил, 1-этил-3-бутинил, 2-этил-3-бутинил и 1-этил-1-метил-2-пропинил.

Термин "циклоалкил" означает карбоциклическую насыщенную кольцевую систему предпочтительно с 3 - 8 кольцевыми С атомами, например, циклопропилом, циклобутилом, циклопентилом или циклогексиллом,

дополнительно замещенными, при необходимости, предпочтительно водородом, алкилом, алкокси, циано, нитро, алкилтио, галоалкилтио, галогеном, алкенилом, алкинилом, галоалкилом, амина, алкиламино, бисалкиламино, алкоксикарбониллом, гидроксикарбониллом, арилалкоксикарбониллом, аминокарбониллом, алкиламинокарбониллом, циклоалкиламинокарбониллом. В случае, при необходимости, замещенного циклоалкила, также включены циклические системы с заместителями, причем заместители с двойной связью в циклоалкильном остатке включают, например, алкилиденовую группу, такую как метилиден. В случае, при необходимости, замещенного циклоалкила, также включены полициклические алифатические системы, как, например, бицикло[1.1.0]бутан-1-ил, бицикло[1.1.0]бутан-2-ил, бицикло[2.1.0]пентан-1-ил, бицикло[1.1.1]пентан-1-ил, бицикло[2.1.0]пентан-2-ил, бицикло[2.1.0]пентан-5-ил, бицикло[2.1.1]гексил, бицикло[2.2.1]гепт-2-ил, бицикло[2.2.2]октан-2-ил, бицикло[3.2.1]октан-2-ил, бицикло[3.2.2]нонан-2-ил, адамантан-1-ил и адамантан-2-ил, а также системы, как, например, 1,1'-би(циклопропил)-1-ил, 1,1'-би(циклопропил)-2-ил. Выражение "(C<sub>3</sub>-C<sub>7</sub>)-циклоалкил" означает сокращенное обозначение циклоалкила с 3 - 7 атомами углерода, в соответствии с диапазоном, указанным для атомов С.

В случае замещенного циклоалкила спироциклические алифатические системы также включают, как, например, спиро[2.2]пент-1-ил, спиро[2.3]гекс-1-ил, спиро[2.3]гекс-4-ил, 3-спиро[2.3]гекс-5-ил, спиро[3.3]гепт-1-ил, спиро[3.3]гепт-2-ил.

"Циклоалкенил" означает карбоциклическую, неароматическую, частично ненасыщенную кольцевую систему, предпочтительно с 4 - 8 атомами С, например, 1-циклобутенил, 2-циклобутенил, 1-циклопентенил, 2-циклопентенил, 3-циклопентенил, или 1-циклогексенил, 2-циклогексенил, 3-циклогексенил, 1,3-циклогексадиенил, или 1,4-циклогексадиенил, причем также включены заместители с двойной связью в циклоалкенильном остатке, например, алкилиденовая группа, такая как метилиден. В случае, при необходимости, замещенного циклоалкенила, соответствующим образом применяются пояснения к замещенному циклоалкилу.

Термин "алкилиден", например, также в форме (C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub>)-алкилидена, означает остаток углеводородного остатка с прямой или разветвленной открытой

цепью, связанного двойной связью. По своей природе в качестве места присоединения алкилидена возможны только положения в рассматриваемом основном веществе, в которых два атома Н могут быть заменены двойной связью; остатками являются, например,  $=\text{CH}_2$ ,  $=\text{CH}-\text{CH}_3$ ,  $=\text{C}(\text{CH}_3)-\text{CH}_3$ ,  $=\text{C}(\text{CH}_3)-\text{C}_2\text{H}_5$  или  $=\text{C}(\text{C}_2\text{H}_5)-\text{C}_2\text{H}_5$ . Циклоалкилиден означает карбоциклический остаток, связанный двойной связью.

"Алкоксиалкил" означает остаток, связанный через алкильную группу, а "алкоксиалкоси" означает алкоксиалкильный остаток, связанный через атом кислорода, например, (но не ограничиваясь этим) метоксиметокси, метоксиэтокси, этоксиэтокси, метокси-н-пропилокси.

"Арилалкил" означает "остаток, связанный с алкильной группой", "гетероарилалкил" означает гетероарильный остаток, связанный с алкильной группой, и "гетероциклиалкил" означает гетероциклический остаток, связанный с алкильной группой.

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

Согласно изобретению "галоалкилтио" означает - отдельно или как компонент химической группы - прямолинейный или разветвленный S-галогеналкил, предпочтительно с 1 - 8, или с 1 - 6 атомами углерода, такой как (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)- или (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-галоалкилтио, например, (но не ограничиваясь этим) трифторметилтио, пентафторэтилтио, дифторметил, 2,2-дифторэт-1-илтио, 2,2,2-дифторэт-1-илтио, 3,3,3-проп-1-илтио.

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

Если соединения посредством водородного сдвига могут образовывать таутомеры, которые структурно формально не были бы охвачены общей формулой (I), то эти таутомеры, тем не менее, включены в определение соединения общей формы (I) согласно изобретению, если только предметом рассмотрения не является конкретный таутомер. Так, например, многие карбонильные соединения могут присутствовать как в кетоформе, так и в енольной форме, причем обе формы охватываются определением соединения общей формулы (I).

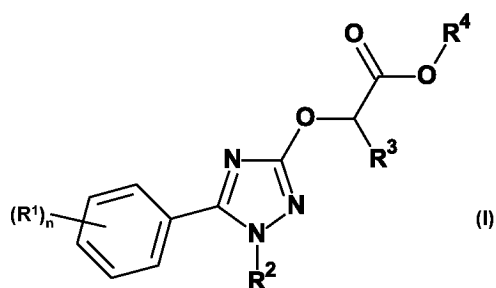
В зависимости от типа и связи заместителей соединения общей формулы (I) могут присутствовать в виде стереоизомеров. Настоящая общая формула (I) включает в себя возможные стереоизомеры, которые определяются на основании своей конкретной трехмерной формы, как, например, энантиомеры, диастереомеры, изомеры Z и E. Присутствуют, например, одна или более алкенилгрупп, соответственно, могут встречаться диастереомеры (изомеры Z и E). Присутствуют, например, один или более асимметрических атомов углерода, соответственно, могут встречаться энантиомеры и диастереомеры. Стереоизомеры получают из смесей, возникающих в процессе получения, обычными способами разделения. Хроматографическое разделение можно выполнять как в аналитическом масштабе для определения энантиомерного избытка или диастереомерного избытка, так и в препаративном масштабе для получения испытуемых образцов для биологических испытаний. Так же стереоизомеры можно получать селективно путем проведения стереоселективных реакций с использованием оптически активных исходных материалов и/или вспомогательных веществ. Таким образом, изобретение также относится ко всем стереоизомерам, предусмотренным общей формулой (I), но не указанным в их конкретной стереоформе, а также их смесям.

Если соединения получают в виде твердых веществ, их также можно очистить посредством перекристаллизации или вываривания. Если отдельные соединения (I) нельзя удовлетворительно доступными получить описанными ниже способами, их получают путем дериватизации других соединений (I).

В связи с выделением, очисткой и разделением стереоизомеров соединений общей формулы (I) рассматриваются способы, которые хорошо известны специалистам в рамках аналогичных случаев, например, физические методы, такие как кристаллизация, хроматографические методы, в особенности колоночная

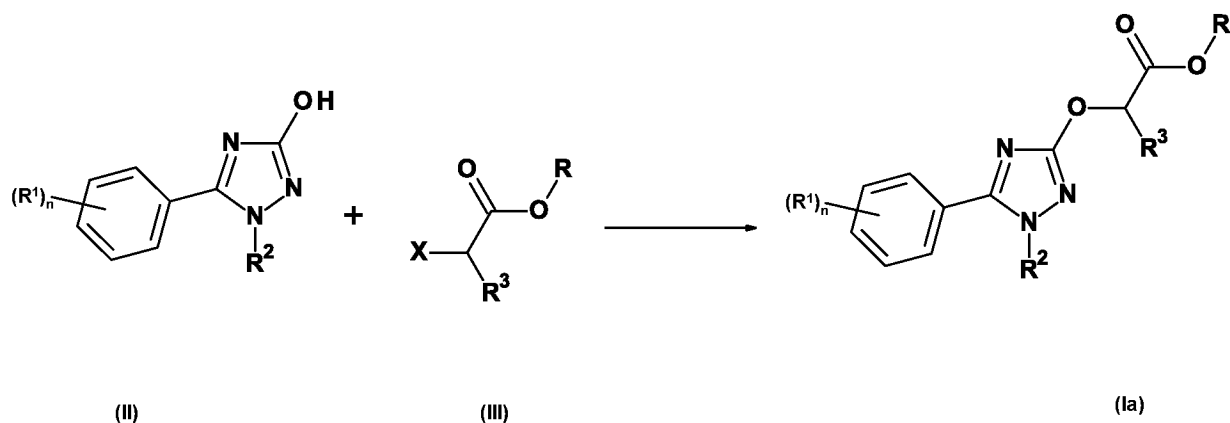
хроматография и ВЭЖХ (высокая жидкостная хроматография под давлением), дистилляция, в соответствующих случаях, при пониженном давлении, экстракция и другие методы, в соответствующих случаях оставшиеся смеси обычно можно разделить хроматографическим разделением, например, на хиральных твердых фазах. Для препаративных количеств или в промышленных масштабах подходят такие методы, как кристаллизация, например, диастереомерных солей, которые могут быть получены из диастереомерных смесей с оптически активными кислотами и, при наличии кислотных групп, с оптически активными основаниями.

Синтез производных [(5-фенил-1-(гетероарил)-1H-1,2,4-триазол-3-ил)окси]уксусной кислоты общей формулы (I)



Производные [(5-фенил-1-(гетероарил)-1H-1,2,4-триазол-3-ил)окси]-уксусной кислоты общей формулы (I) согласно изобретению можно получить с использованием известных способов. Используемые и изучаемые пути синтеза основаны на коммерчески доступных или несложных в получении замещенных бензойных кислотах, соответственно замещенных амидах бензойных кислот и коммерчески доступных химических соединениях, таких как замещенные гетероарилгидразины и дифенилкарбонаты. Группировки  $R^1$ ,  $R^2$ ,  $R^3$ ,  $R^4$ ,  $n$  и  $p$  общей формулы (I) в следующей Схеме имеют ранее определенные значения, но не ограничиваются ими.

Синтез соединения общей формулы (Ia) по изобретению осуществляется посредством реакции соединения общей формулы (II) с соединением общей формулы (III) в присутствии основания, такого как карбонат калия. Реакцию предпочтительно проводят в диапазоне температур  $0^\circ\text{C}$  -  $120^\circ\text{C}$  в соответствующем растворителе, таком как ацетонитрил (см. Схему 1).



где X = галоген и R = (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-алкил.

Схема 1.

Синтез соединения общей формулы (II) происходит путем циклизации соединения общей формулы (IV) в присутствии реагента конденсации, такого как полифосфорная кислота. Реакция предпочтительно протекает в интервале температур 0°C - 180°C в веществе (см. Схему 2).

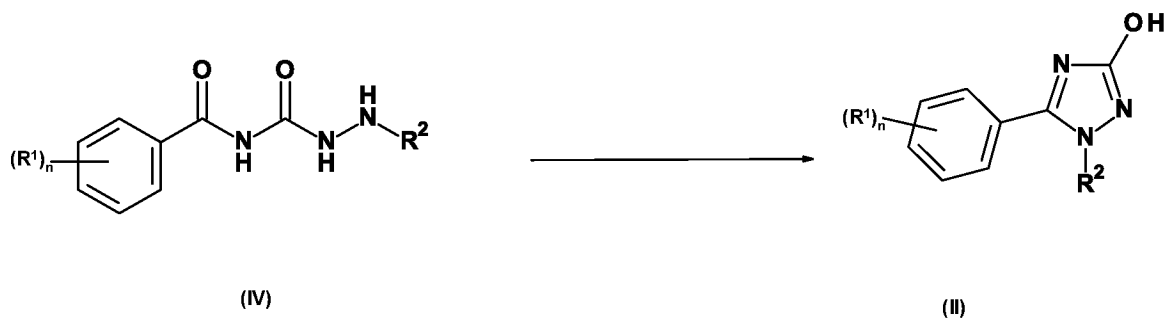
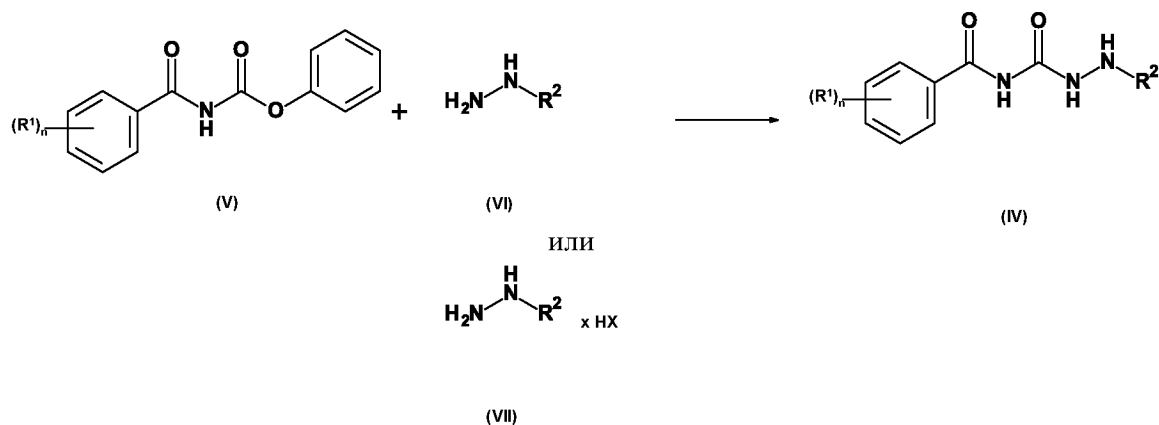


Схема 2.

Синтез соединения общей формулы (IV) происходит путем реакции соединения общей формулы (V) с фенилгидразином общей формулы (VI) в соответствующем растворителе, таком как ацетонитрил, в диапазоне температур от -20°C до 100°C, предпочтительно от -5°C до 50°C. Реакция протекает в присутствии основания, такого как триэтиламин. Вместо гетероарилгидразина общей формулы (VI) также можно использовать гетероарилгидразин гидрогалогениды общей формулы (VII) (Схема 3).

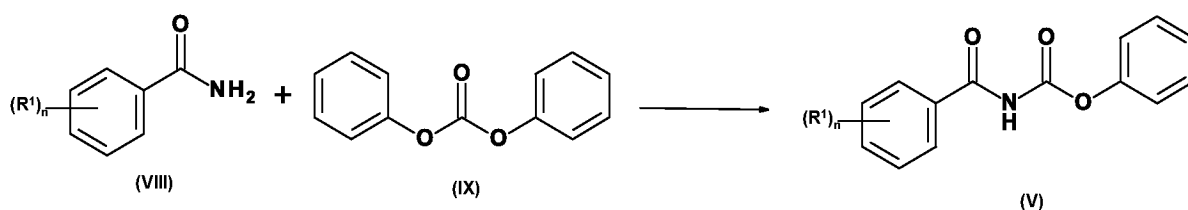




где X = галоген.

### Схема 3.

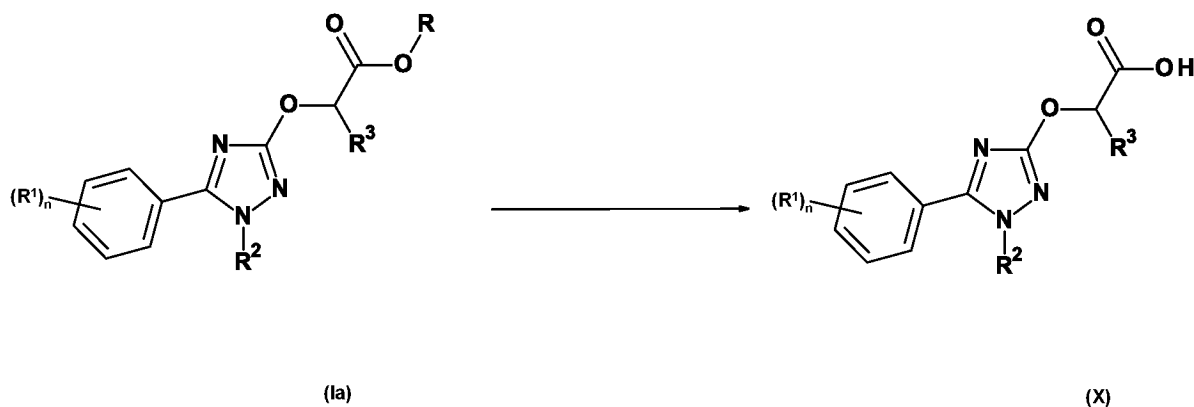
Синтез соединения общей формулы (V) может осуществляться путем взаимодействия соединения общей формулы (VIII) с дифенилкарбонатом (IX) в присутствии основания, такого как гидрид натрия (см. Схему 4). Реакция предпочтительно протекает в диапазоне температур от -20°C до 150°C в соответствующем растворителе, таком как ТГФ. Соединения общей формулы (VIII) и (IX) являются коммерчески доступными или могут быть получены способами, известными специалистам в данной области, или аналогично им.



### Схема 4.

Кислота общей формулы (X) синтезируется омылением соединения общей формулы (Ia) способами, известными специалистам в данной области, или аналогично им.

Омыление можно проводить в присутствии основания или кислоты Льюиса. Основание может быть представлено гидроксидной солью щелочного металла (как, например, литий, натрий или калий; Схема 5), и реакция гидролиза предпочтительно протекает в диапазоне температур от комнатной до 100°C. В качестве кислоты Льюиса может выступать трибромид бора, а реакция можно протекать в диапазоне температур от -20 до 100°C, предпочтительно от -5 до 50°C.



где R = (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-алкил

Схема 5.

Синтез соединения общей формулы (XI) согласно изобретению осуществляется путем этерификации кислоты общей формулы (X) спиртом общей формулы (XII) в присутствии связывающего реагента, такого как, например, ТЗР, дициклогексилкарбодиимид, *N*-(3-диметиламинопропил)-*N'*-этилкарбодиимид, *N,N'*-кабонилдиимидазол, хлорид 2-хлор-1,3-диметилимидазолия или йодид 2-хлор-1-метилпиридиния (см. *Chemistry of Peptide Synthesis*, Ed. N. Leo Benoiton, Taylor & Francis, 2006, ISBN-10: 1-57444-454-9). Полимерные связующие вещества такие как полимерное связующее вещество дициклогексилкарбодиимид, также подходят для указанной реакции сочетания. Реакция предпочтительно протекает в диапазоне температур 0°C - 80°C в соответствующем растворителе, таком как дихлорметан, ацетонитрил, *N,N*-диметил-формамид или этилацетат, а также в присутствии основания, такого как, например, триэтиламин, *N,N*-диизопропилэтиламин или 1,8-диазабицикло[5.4.0]ундец-7-енстатат (см. схему 6). Условия сочетания ТЗР описаны в работе *Organic Process Research & Development* 2009, 13, 900-906.

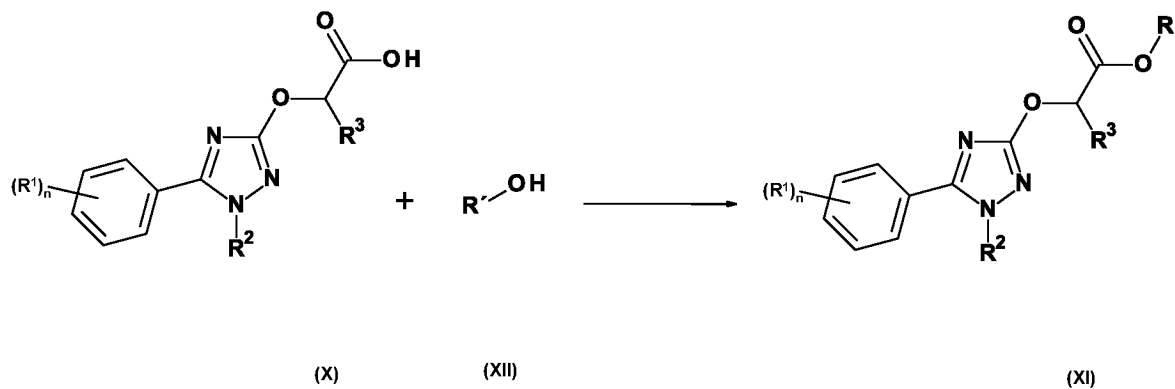


Схема 6.

На Схеме 7 показан синтез соединения общей формулы (II); синтез осуществляют путем реакции соединения общей формулы (XIII) в присутствии кислоты Бренстеда, например, 33%-ного HBr в уксусной кислоте. Реакция предпочтительно протекает в диапазоне температур от 0 °С до 180°С. См. работу *Bioorganic & Medicinal Chemistry* 2018, 26, 3321-3344.

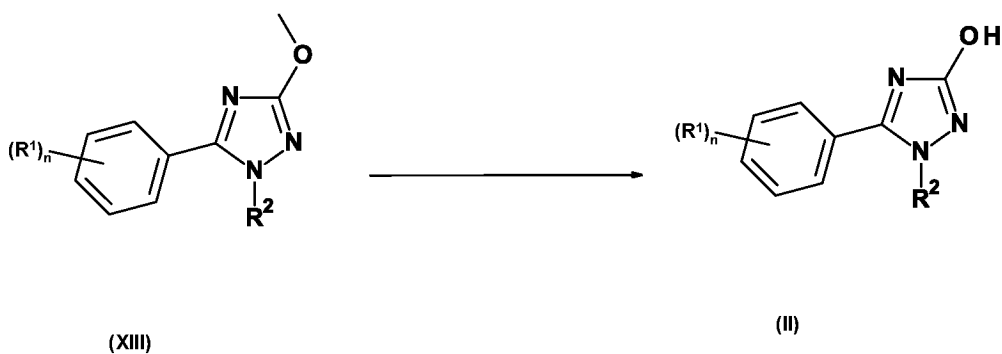


Схема 7.

Соединения общей формулы (XIII) получают посредством реакции соединения общей формулы (XIV) и фенилгидразина общей формулы (VI) в соответствующем растворителе, таком как этанол (см. схему 8). Реакция предпочтительно протекает в диапазоне температур 0 °С - 150°С.

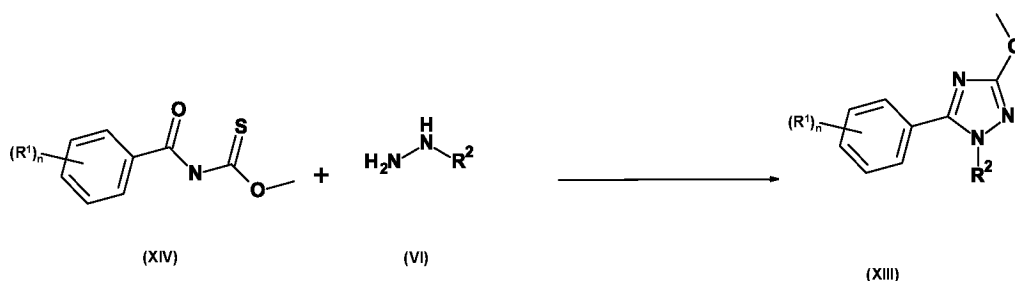
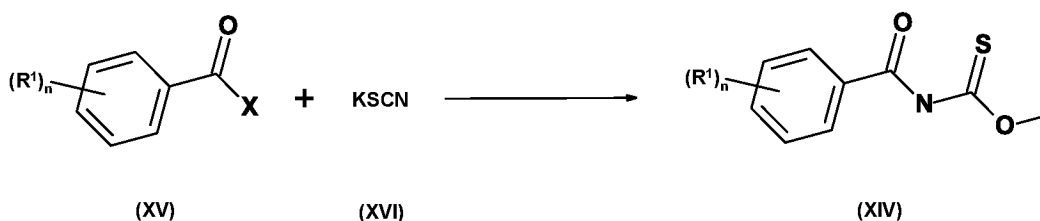


Схема 8.

Соединения общей формулы (XIV) получают посредством реакции гетероарилкарбонилсульфидокарбоната общей формулы (XV) с солью роданида общей формулы (XVI) в присутствии метанола в соответствующем растворителе, таком как ацетон (см. Схему 9). Хлорангидриды гетероарилкарбоновых кислот либо являются коммерчески доступными, либо могут быть получены способами, известными специалистам в данной области, или аналогично им. См. *Tetrahedron* 1968, 24, 5205-5214; *J. Chem. Soc.* 1957, 1091; JP81 53,664 (1981); *Justus Liebigs Ann. Chem.* 1964, 675, 180 и *J. heterocycl. Chem.* 1983, 20, 1533.



где X = фтор, хлор, бром.

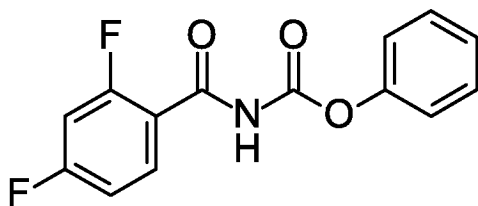
Схема 9.

Ниже приведены избранные подробные примеры синтеза соединения общей формулы (I) согласно изобретению. Приведенные номера примеров соответствуют нумерации, которая используется ниже в Таблицах I.1 - I.77. Спектроскопические данные <sup>1</sup>H-ЯМР-, <sup>13</sup>C-ЯМР- и <sup>19</sup>F-ЯМР приведены для химических примеров, описанных в приведенных ниже разделах (400 МГц при <sup>1</sup>H-ЯМР и 150 МГц при <sup>13</sup>C-ЯМР и 375 МГц при <sup>19</sup>F-ЯМР, растворитель CDCl<sub>3</sub>, CD<sub>3</sub>OD или d<sub>6</sub>-DMSO, внутренний стандарт: Тетраметилсилан δ = 0,00 частей на млн) получены на приборе Bruker, и указанные сигналы имеют следующие значения: br = широкий; s = синглет, d = дублет, t = триплет, dd = двойной дублет, ddd = дублет двойного дублета, m = мультиплет, q = кватртет, квинтет = квинтет, sext = секстет, sept = септет, dq = двойной кватртет, dt = двойной триплет. В случае со смесями диастереомеров даны либо значимые сигналы обоих диастереомеров, либо характерный сигнал основного диастереомера. Сокращения, используемые для химических групп, имеют, например, следующие значения: Me = CH<sub>3</sub>, Et = CH<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>, t-Hex = C(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, t-Bu = C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, n-Bu = неразветвленный бутил, n-Pr = неразветвленный пропил, i-Pr = разветвленный пропил, c-Pr = циклопропил, c-Hex = циклогексил.

Примеры синтеза:

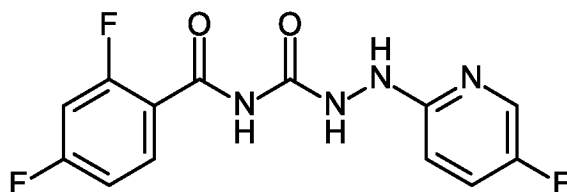
Пример синтеза №: I.42-11

Стадия синтеза 1: Фенил-(2,4-дифторбензоил)карбамат



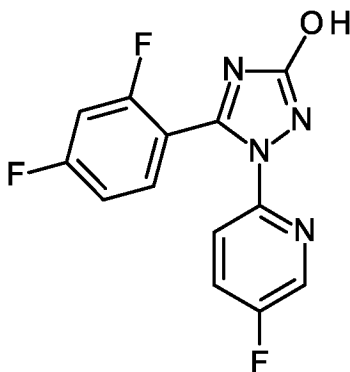
2,4-дифторбензамид (10 г, 63,65 ммоль, 1,0 эквив.) и дифенилкарбонат (20,45 г, 1,5 эквив.) растворили в ТГФ (100 мл) в атмосфере аргона и охладили до 0°C ледяной баней. К раствору порциями добавляли гидрид натрия (60% в минеральном масле, 2,55 г, 63,65 ммоль, 1,0 эквив.). Осторожно, газообразование! Затем ледяную баню убирают, а реакционную смесь перемешивают в течение 1 часа при комнатной температуре. После этого реакционную смесь концентрировали до 1/3 в вакууме с выделением белого твердого вещества. Образовавшееся твердое вещество отсосали и высушили на воздухе. Фенил-(2,4-дифторбензоил)карбамат выделили в виде белого твердого вещества (11,51 г, 61 % теор. вых.).  $^1\text{H}$ -ЯМР (400 МГц, ДМСО- $d^6$   $\delta$ , ppm) 7,76 (m, 1H), 7,36-7,28 (m, 2H), 7,18-6,99 (m, 4H), 6,77-6,74 (m, 2H).

Стадия синтеза 2: 2N-(2,4-дифторбензоил)-2-(5-фторпиридин-2-ил)гидразинкарбоксамид



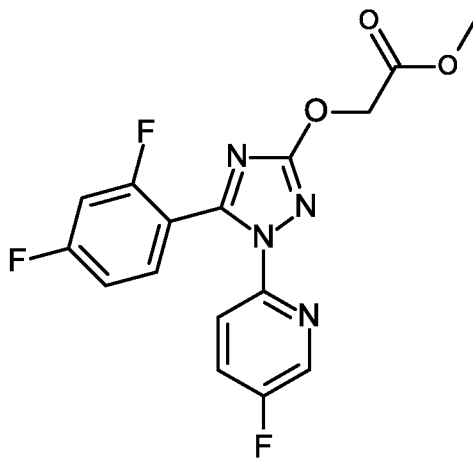
Фенил-(2,4-дифторбензоил)карбамат (2,5 г, 9,02 ммоль, 1,0 эквив.) растворили в ацетонитриле (100 мл) и затем при комнатной температуре смешали с 5-фтор-2-гидразинопиридином (1,26 г, 9,92 ммоль, 1,1 эквив.) и триэтиламином (3,77 мл, 27,05 ммоль, 3,0 эквив.). Раствор стал розовым примерно через 15-30 минут, и получилось твердое вещество бежевого цвета. Реакционную смесь перемешивают в течение 1 часа при комнатной температуре, затем отфильтровывают образовавшийся осадок и сушат его на воздухе. N-(2,4-дифторбензоил)-2-(5-фторпиридин-2-ил)гидразинкарбоксамид выделили в виде твердого вещества бежевого цвета (2,40 г, 42 % теор. вых.).  $^1\text{H}$ -ЯМР (400 МГц, ДМСО- $d^6$   $\delta$ , ppm) 11.45 (bs, 1H), 9.63 (bs, 1H), 8.09-8,00 (m, 2H), 7.78-7.61 (m, 2H), 7.09-7.02 (m, 2H), 6.85 (d, 1H).

Стадия синтеза 3: 5-(2,4-дифторфенил)-1-(5-фторпиридин-2-ил)-1Н-1,2,4-триазол-3-ол



2N-(2,4-дифторбензоил)-2-(5-фторпиридин-2-ил)гидразинкарбоксамид (0,9 г, 2,90 ммоль, 1,0 эквив.) смешивали с полифосфорной кислотой (20 г) в течение 2.5 часов при температуре 100°C, в течение которых реакционная смесь конденсировалась. После охлаждения до комнатной температуры реакционную смесь по каплям добавляли к ледяной воде и светло-бежевое твердое вещество отфильтровывали. Осадок, отфильтрованный с вакуум-фильтром, сушили при 55°C в вакуумном сушильном шкафу. 5-(2,4-дифторфенил)-1-(5-фторпиридин-2-ил)-1Н-1,2,4-триазол-3-ол выделили в виде светло-бежевого твердого вещества (180 мг, 20 % теор. вых.). <sup>1</sup>H-ЯМР (400 МГц, ДМСО-d<sup>6</sup> δ, ppm) 11,80 (bs, 1H), 8,26 (m, 1H), 7,99 (m, 1H), 7,78 (m, 1H), 7,66 (m, 1H), 7,40 (m, 1H), 7,23 (m, 1H).

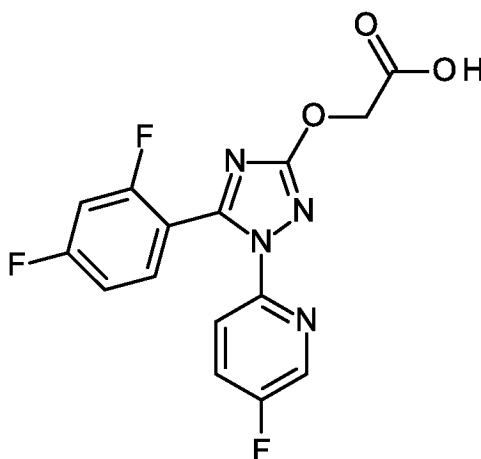
Стадия синтеза 4: Метил-{{5-(2,4-дифторфенил)-1-(5-фторпиридин-2-ил)-1Н-1,2,4-триазол-3-ил}окси}ацетат (Пример синтеза I.40-9)



5-(2,4-дифторфенил)-1-(5-фторпиридин-2-ил)-1Н-1,2,4-триазол-3-ол (161 мг, 0,55 ммоль, 1,0 эквив.) и карбонат калия (228 мг, 1,65 ммоль, 3 эквив.)

суспендировали в ацетонитриле (10 мл) и затем смешали с метиловым эфиром бромуксусной кислоты (126 мг, 0,83 ммоль, 1,5 эквив.). После этого суспензию перемешивали в течение ночи при комнатной температуре, отфильтровали от твердого вещества и поместили реакционную смесь в вакуум. Остатки очистили с помощью колоночной хроматографии (градиент эфир уксусной кислоты/гептан). Метил-{[5-(2,4-дифторфенил)-1-(5-фторпиридин-2-ил)-1H-1,2,4-триазол-3-ил]окси} выделили в виде бесцветного масла (152 мг, 71 % теор. вых.).  $^1\text{H}$ -ЯМР (400 МГц,  $\text{CDCl}_3$   $\delta$ , ppm) 8.04 (d, 1H), 7.77-7.67 (m, 2H), 7.56 (m, 1H), 7.01 (m, 1H), 6.77 (m, 1H), 4.97 (s, 2H), 3.82 (s, 3H).

Стадия синтеза 5: {[5-(2,4-дифторфенил)-1-(5-фторпиридин-2-ил)-1H-1,2,4-триазол-3-ил]окси}уксусная кислота (Пример синтеза I.42-11)



Метил-{[5-(2,4-дифторфенил)-1-(5-фторпиридин-2-ил)-1H-1,2,4-триазол-3-ил]окси}ацетат (90 мг, 0,25 ммоль, 1,0 эквив.) и гидроксид лития (12 мг, 0,49 ммоль, 2 эквив.) растворили в смеси ТГФ/вода (7:2, 13 мл) и затем перемешивали 1 ч при комнатной температуре. Реакционную смесь поместили в вакуум. Остаток растворяли в воде и доводили до рН = 2 с помощью 2 М соляной кислоты, причем в осадок выпадает светло-желтое твердое вещество. Осадок отсасывали и сушили при температуре 55 °С в вакуумном сушильном шкафу. {[5-(2,4-дифторфенил)-1-(5-фторпиридин-2-ил)-1H-1,2,4-триазол-3-ил]окси}уксусная кислота выделили в виде светло-желтого твердого вещества (85 мг, 93 % теор. вых.).  $^1\text{H}$ -ЯМР (400 МГц,  $\text{DMSO-d}^6$   $\delta$ , ppm) 13.18 (bs, 1H), 8.31 (m, 1H), 8.01 (m, 1H), 7.79 (m, 1H), 7.71 (m, 1H), 7.37 (m, 1H), 7.25 (m, 1H), 4.91 (s, 2H).

По аналогии с приведенными выше и в соответствующем месте примерами производства и с учетом общей информации о производстве [(5-фенил-1-(гетероарил)-1Н-1,2,4-триазол-3-ил)окси]уксусной кислоты производные получили следующие соединения:

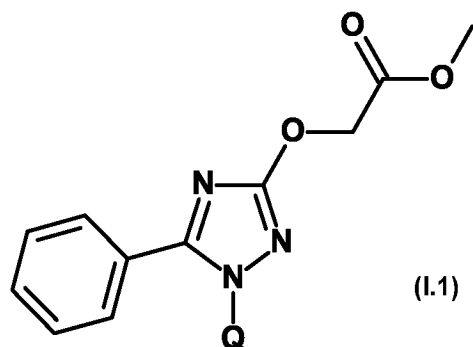


Таблица I.1: Предпочтительными соединениями формулы (I.1) являются соединения I.1-1 – I.1-24, в которых Q имеет значения, указанные в соответствующей строке Таблицы 1. Соединения I.1-1 – I.1-24 Таблицы I.1, таким образом, определяются значением соответствующих записей № 1 - 24 для Q Таблицы 1.

Таблица 1:

№	Q
1	Q-2.1
2	Q-2.2
3	Q-2.3
4	Q-2.4
5	Q-2.5
6	Q-2.6
7	Q-2.7
8	Q-2.10
9	Q-2.11
10	Q-2.12
11	Q-2.13
12	Q-2.14
13	Q-2.15



№	Q
14	Q-2.17
15	Q-2.18
16	Q-2.19
17	Q-2.21
18	Q-2.22
19	Q-2.24
20	Q-2.25
21	Q-2.56
22	Q-2.57
23	Q-2.59
24	Q-2.60

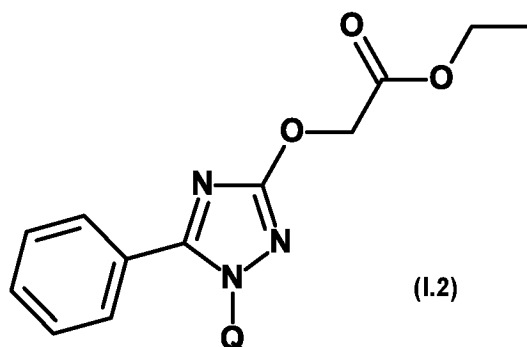


Таблица I.2: Предпочтительными соединениями формулы (I.2) являются соединения I.2-1 – I.2-24, в которых Q имеет значения, указанные в соответствующей строке Таблицы 1. Соединения I.2-1 – I.2-24 Таблицы I.2, таким образом, определяются значением соответствующих записей № 1 - 24 для Q Таблицы 1.

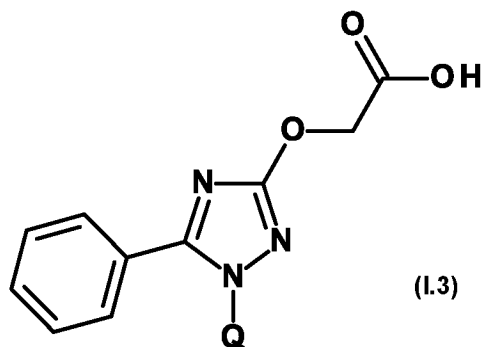


Таблица I.3: Предпочтительными соединениями формулы (I.3) являются соединения I.3-1 – I.3-24, в которых Q имеет значения, указанные в соответствующей строке Таблицы 1. Соединения I.3-1 – I.3-24 Таблицы I.3, таким образом, определяются значением соответствующих записей № 1 - 24 для Q Таблицы 1.

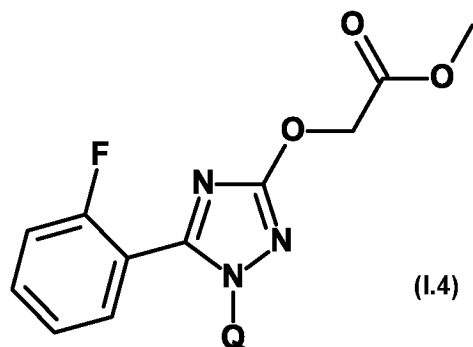


Таблица I.4: Предпочтительными соединениями формулы (I.4) являются соединения I.4-1 – I.4-24, в которых Q имеет значения, указанные в соответствующей строке Таблицы 1. Соединения I.4-1 – I.4-24 Таблицы I.4, таким образом, определяются значением соответствующих записей № 1 - 24 для Q Таблицы 1.

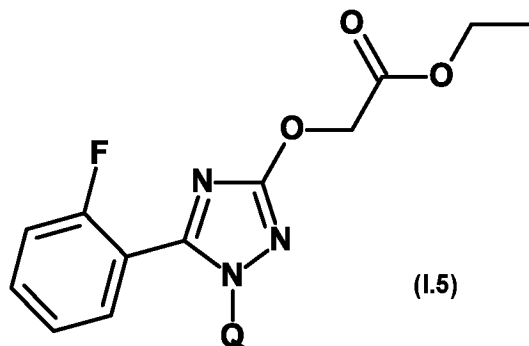


Таблица I.5: Предпочтительными соединениями формулы (I.5) являются соединения I.5-1 – I.5-24, в которых Q имеет значения, указанные в соответствующей строке Таблицы 1. Соединения I.5-1 – I.5-24 Таблицы I.5, таким образом, определяются значением соответствующих записей № 1 - 24 для Q Таблицы 1.

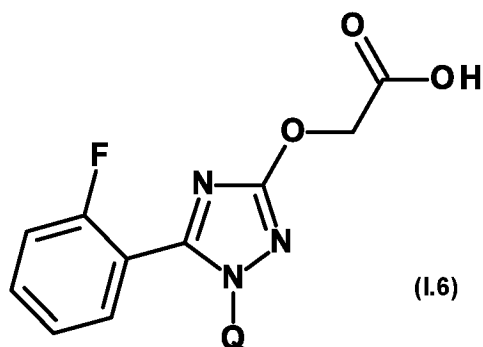


Таблица I.6: Предпочтительными соединениями формулы (I.6) являются соединения I.6-1 – I.6-24, в которых Q имеет значения, указанные в соответствующей строке Таблицы 1. Соединения I.6-1 – I.6-24 Таблицы I.6, таким образом, определяются значением соответствующих записей № 1 - 24 для Q Таблицы 1.

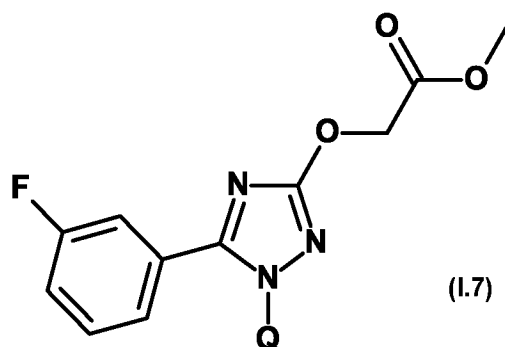


Таблица I.7: Предпочтительными соединениями формулы (I.7) являются соединения I.7-1 – I.7-24, в которых Q имеет значения, указанные в соответствующей строке Таблицы 1. Соединения I.7-1 – I.7-24 Таблицы I.7, таким образом, определяются значением соответствующих записей № 1 - 24 для Q Таблицы 1.

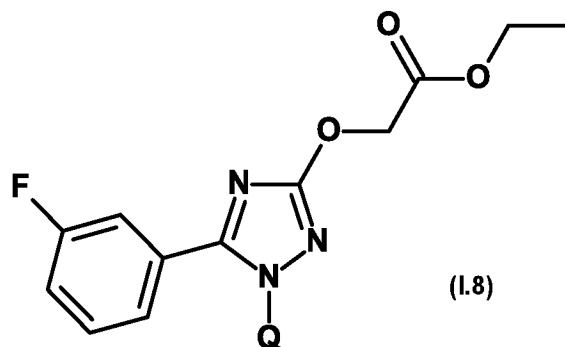


Таблица I.8: Предпочтительными соединениями формулы (I.8) являются соединения I.8-1 – I.8-24, в которых Q имеет значения, указанные в

соответствующей строке Таблицы 1. Соединения I.8-1 – I.8-24 Таблицы I.8, таким образом, определяются значением соответствующих записей № 1 - 24 для Q Таблицы 1.

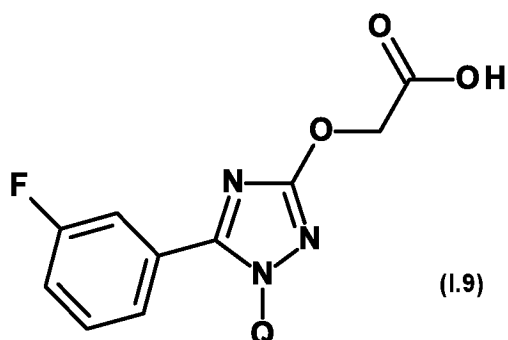


Таблица I.9: Предпочтительными соединениями формулы (I.9) являются соединения I.9-1 – I.9-24, в которых Q имеет значения, указанные в соответствующей строке Таблицы 1. Соединения I.9-1 – I.9-24 Таблицы I.9, таким образом, определяются значением соответствующих записей № 1 - 24 для Q Таблицы 1.

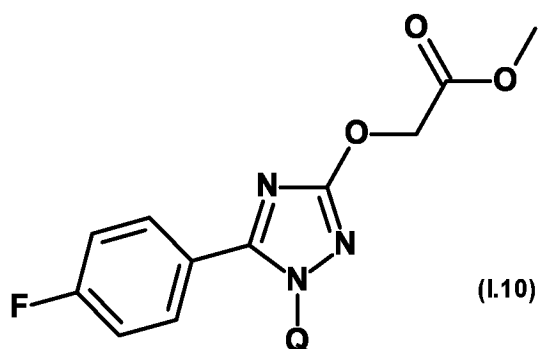


Таблица I.10: Предпочтительными соединениями формулы (I.10) являются соединения I.10-1 – I.10-24, в которых Q имеет значения, указанные в соответствующей строке Таблицы 1. Соединения I.10-1 – I.10-24 Таблицы I.10, таким образом, определяются значением соответствующих записей № 1 - 24 для Q Таблицы 1.

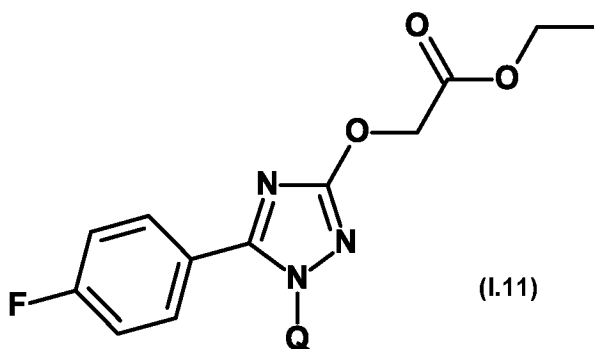


Таблица I.11: Предпочтительными соединениями формулы (I.11) являются соединения I.11-1 – I.11-24, в которых Q имеет значения, указанные в соответствующей строке Таблицы 1. Соединения I.11-1 – I.11-24 Таблицы I.11, таким образом, определяются значением соответствующих записей № 1 - 24 для Q Таблицы 1.

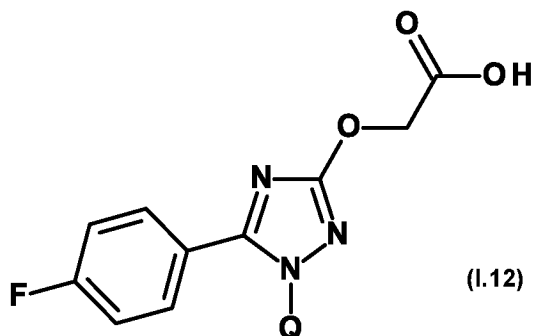


Таблица I.12: Предпочтительными соединениями формулы (I.12) являются соединения I.12-1 – I.12-24, в которых Q имеет значения, указанные в соответствующей строке Таблицы 1. Соединения I.12-1 – I.12-24 Таблицы I.12, таким образом, определяются значением соответствующих записей № 1 - 24 для Q Таблицы 1.

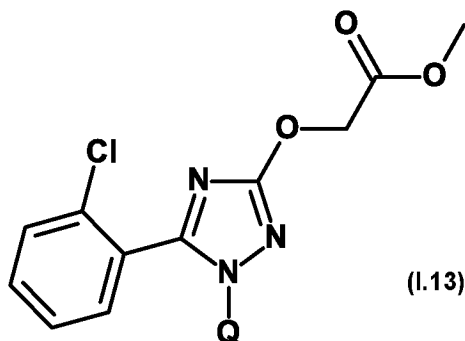


Таблица I.13: Предпочтительными соединениями формулы (I.13) являются соединения I.13-1 – I.13-24, в которых Q имеет значения, указанные в соответствующей строке Таблицы 1. Соединения I.13-1 – I.13-24 Таблицы I.13, таким образом, определяются значением соответствующих записей № 1 - 24 для Q Таблицы 1.

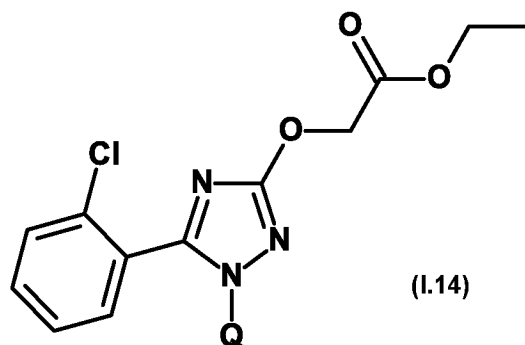


Таблица I.14: Предпочтительными соединениями формулы (I.14) являются соединения I.14-1 – I.14-24, в которых Q имеет значения, указанные в соответствующей строке Таблицы 1. Соединения I.14-1 – I.14-24 Таблицы I.14, таким образом, определяются значением соответствующих записей № 1 - 24 для Q Таблицы 1.

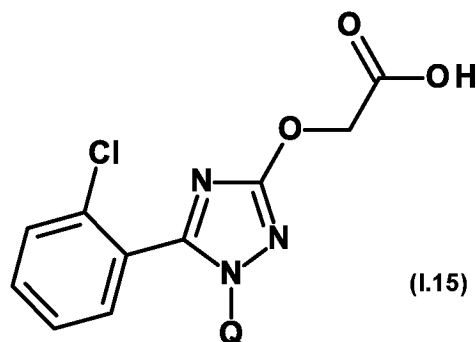


Таблица I.15: Предпочтительными соединениями формулы (I.15) являются соединения I.15-1 – I.15-24, в которых Q имеет значения, указанные в соответствующей строке Таблицы 1. Соединения I.15-1 – I.15-24 Таблицы I.15, таким образом, определяются значением соответствующих записей № 1 - 24 для Q Таблицы 1.

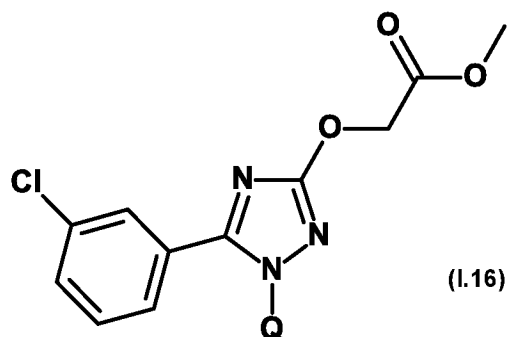


Таблица I.16: Предпочтительными соединениями формулы (I.16) являются соединения I.16-1 – I.16-24, в которых Q имеет значения, указанные в

соответствующей строке Таблицы 1. Соединения I.16-1 – I.16-24 Таблицы I.16, таким образом, определяются значением соответствующих записей № 1 - 24 для Q Таблицы 1.

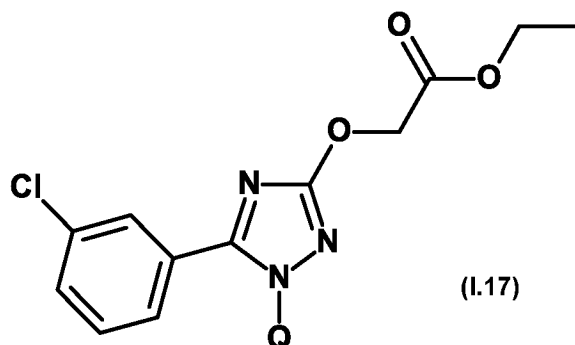


Таблица I.17: Предпочтительными соединениями формулы (I.17) являются соединения I.17-1 – I.17-24, в которых Q имеет значения, указанные в соответствующей строке Таблицы 1. Соединения I.17-1 – I.17-24 Таблицы I.17, таким образом, определяются значением соответствующих записей № 1 - 24 для Q Таблицы 1.

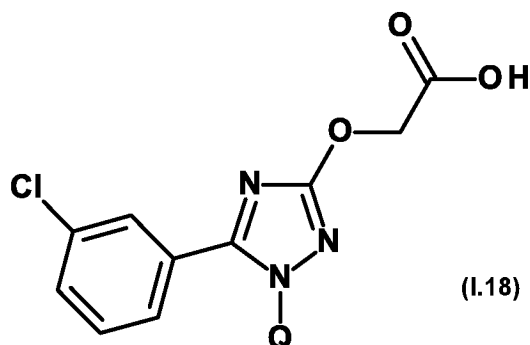


Таблица I.18: Предпочтительными соединениями формулы (I.18) являются соединения I.18-1 – I.18-24, в которых Q имеет значения, указанные в соответствующей строке Таблицы 1. Соединения I.18-1 – I.18-24 Таблицы I.18, таким образом, определяются значением соответствующих записей № 1 - 24 для Q Таблицы 1.

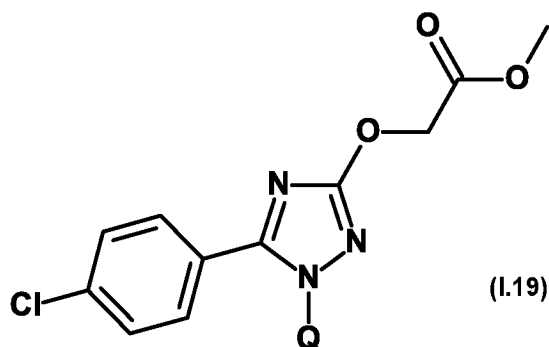


Таблица I.19: Предпочтительными соединениями формулы (I.19) являются соединения I.19-1 – I.19-24, в которых Q имеет значения, указанные в соответствующей строке Таблицы 1. Соединения I.19-1 – I.19-24 Таблицы I.19, таким образом, определяются значением соответствующих записей № 1 - 24 для Q Таблицы 1.

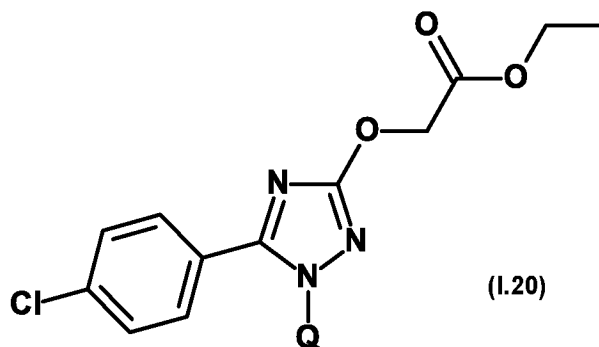


Таблица I.20: Предпочтительными соединениями формулы (I.20) являются соединения I.20-1 – I.20-24, в которых Q имеет значения, указанные в соответствующей строке Таблицы 1. Соединения I.20-1 – I.20-24 Таблицы I.20, таким образом, определяются значением соответствующих записей № 1 - 24 для Q Таблицы 1.

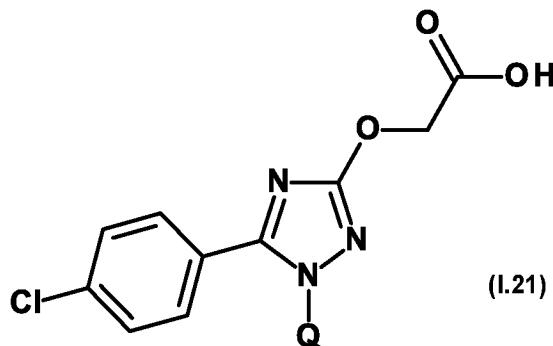


Таблица I.21: Предпочтительными соединениями формулы (I.21) являются соединения I.21-1 – I.21-24, в которых Q имеет значения, указанные в соответствующей строке Таблицы 1. Соединения I.21-1 – I.21-24 Таблицы I.21, таким образом, определяются значением соответствующих записей № 1 - 24 для Q Таблицы 1.



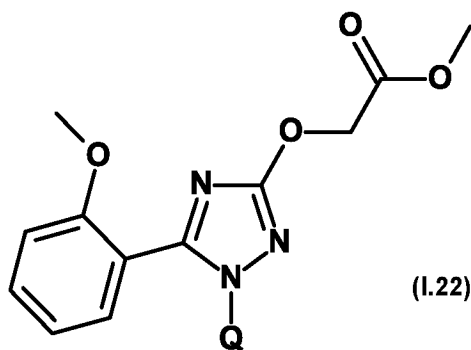


Таблица I.22: Предпочтительными соединениями формулы (I.22) являются соединения I.22-1 – I.22-24, в которых Q имеет значения, указанные в соответствующей строке Таблицы 1. Соединения I.22-1 – I.22-24 Таблицы I.22, таким образом, определяются значением соответствующих записей № 1 - 24 для Q Таблицы 1.

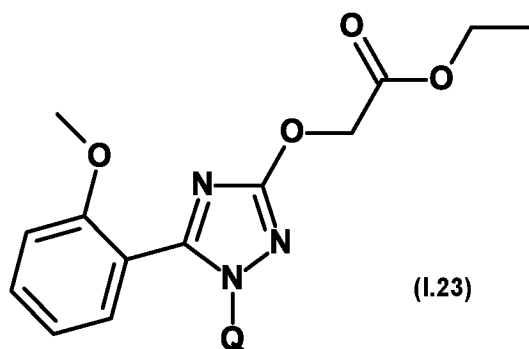


Таблица I.23: Предпочтительными соединениями формулы (I.23) являются соединения I.23-1 – I.23-24, в которых Q имеет значения, указанные в соответствующей строке Таблицы 1. Соединения I.23-1 – I.23-24 Таблицы I.23, таким образом, определяются значением соответствующих записей № 1 - 22 для Q Таблицы 1.

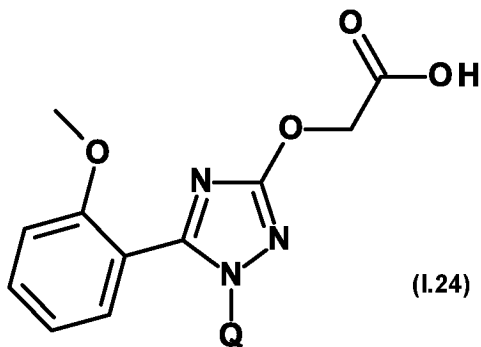


Таблица I.24: Предпочтительными соединениями формулы (I.24) являются соединения I.24-1 – I.24-24, в которых Q имеет значения, указанные в

соответствующей строке Таблицы 1. Соединения I.24-1 – I.24-24 Таблицы I.24, таким образом, определяются значением соответствующих записей № 1 - 24 для Q Таблицы 1.

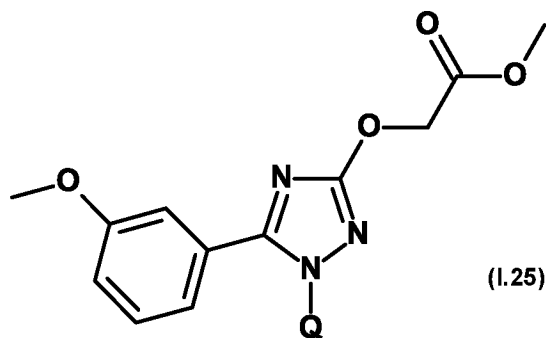


Таблица I.25: Предпочтительными соединениями формулы (I.25) являются соединения I.25-1 – I.25-24, в которых Q имеет значения, указанные в соответствующей строке Таблицы 1. Соединения I.25-1 – I.25-24 Таблицы I.25, таким образом, определяются значением соответствующих записей № 1 - 24 для Q Таблицы 1.

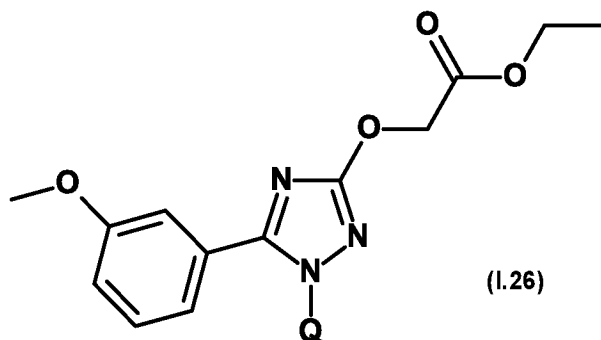


Таблица I.26: Предпочтительными соединениями формулы (I.26) являются соединения I.26-1 – I.26-24, в которых Q имеет значения, указанные в соответствующей строке Таблицы 1. Соединения I.26-1 – I.26-24 Таблицы I.26, таким образом, определяются значением соответствующих записей № 1 - 24 для Q Таблицы 1.

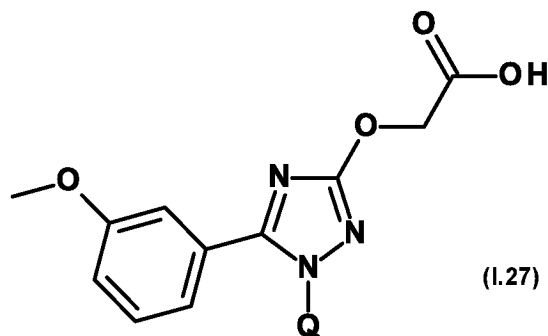


Таблица I.27: Предпочтительными соединениями формулы (I.27) являются соединения I.27-1 – I.27-24, в которых Q имеет значения, указанные в соответствующей строке Таблицы 1. Соединения I.27-1 – I.27-24 Таблицы I.27, таким образом, определяются значением соответствующих записей № 1 - 24 для Q Таблицы 1.

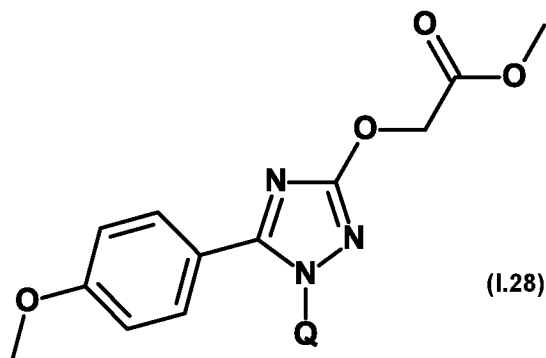


Таблица I.28: Предпочтительными соединениями формулы (I.28) являются соединения I.28-1 – I.28-24, в которых Q имеет значения, указанные в соответствующей строке Таблицы 1. Соединения I.28-1 – I.28-24 Таблицы I.28, таким образом, определяются значением соответствующих записей № 1 - 24 для Q Таблицы 1.

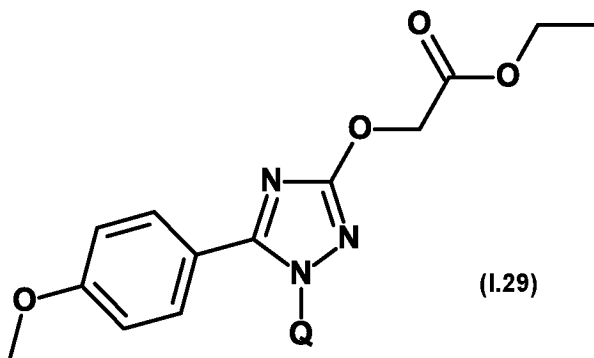


Таблица I.29: Предпочтительными соединениями формулы (I.29) являются соединения I.29-1 – I.29-24, в которых Q имеет значения, указанные в соответствующей строке Таблицы 1. Соединения I.29-1 – I.29-24 Таблицы I.29, таким образом, определяются значением соответствующих записей № 1 - 24 для Q Таблицы 1.

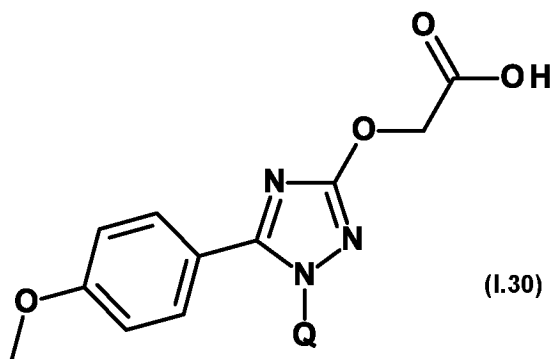


Таблица I.30: Предпочтительными соединениями формулы (I.30) являются соединения I.30-1 – I.30-24, в которых Q имеет значения, указанные в соответствующей строке Таблицы 1. Соединения I.30-1 – I.30-24 Таблицы I.30, таким образом, определяются значением соответствующих записей № 1 - 24 для Q Таблицы 1.

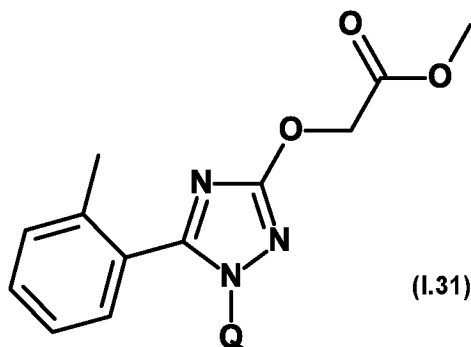


Таблица I.31: Предпочтительными соединениями формулы (I.31) являются соединения I.31-1 – I.31-24, в которых Q имеет значения, указанные в соответствующей строке Таблицы 1. Соединения I.31-1 – I.31-24 Таблицы I.31, таким образом, определяются значением соответствующих записей № 1 - 24 для Q Таблицы 1.

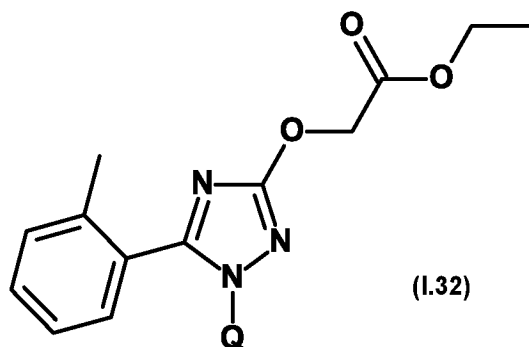


Таблица I.32: Предпочтительными соединениями формулы (I.32) являются соединения I.32-1 – I.32-24, в которых Q имеет значения, указанные в соответствующей строке Таблицы 1. Соединения I.32-1 – I.32-24 Таблицы I.32, таким образом, определяются значением соответствующих записей № 1 - 24 для Q Таблицы 1.

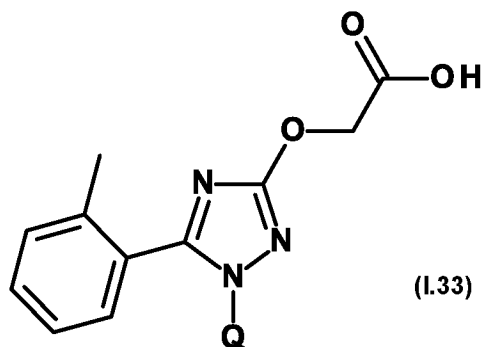


Таблица I.33: Предпочтительными соединениями формулы (I.33) являются соединения I.33-1 – I.33-24, в которых Q имеет значения, указанные в соответствующей строке Таблицы 1. Соединения I.33-1 – I.33-24 Таблицы I.33, таким образом, определяются значением соответствующих записей № 1 - 24 для Q Таблицы 1.

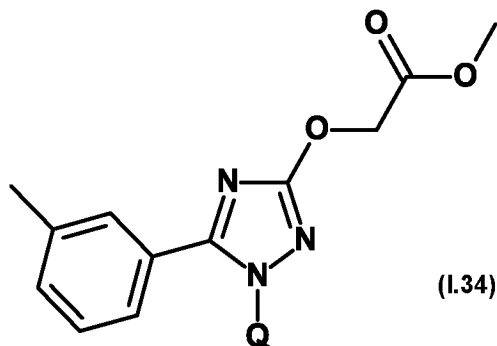


Таблица I.34: Предпочтительными соединениями формулы (I.34) являются соединения I.34-1 – I.34-24, в которых Q имеет значения, указанные в соответствующей строке Таблицы 1. Соединения I.34-1 – I.34-24 Таблицы I.34, таким образом, определяются значением соответствующих записей № 1 - 24 для Q Таблицы 1.

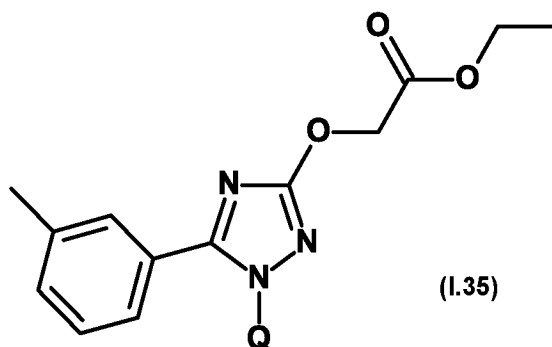


Таблица I.35: Предпочтительными соединениями формулы (I.35) являются соединения I.35-1 – I.35-24, в которых Q имеет значения, указанные в соответствующей строке Таблицы 1. Соединения I.35-1 – I.35-24 Таблицы I.35, таким образом, определяются значением соответствующих записей № 1 - 24 для Q Таблицы 1.

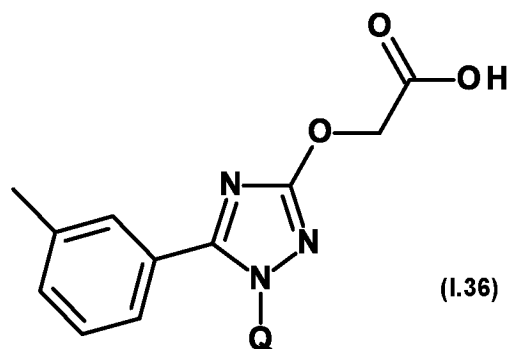


Таблица I.36: Предпочтительными соединениями формулы (I.36) являются соединения I.36-1 – I.36-24, в которых Q имеет значения, указанные в соответствующей строке Таблицы 1. Соединения I.36-1 – I.36-24 Таблицы I.36, таким образом, определяются значением соответствующих записей № 1 - 24 для Q Таблицы 1.

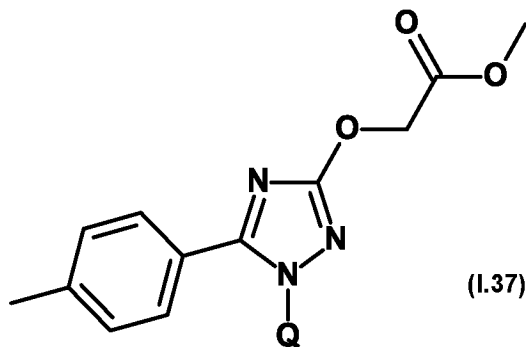


Таблица I.37: Предпочтительными соединениями формулы (I.37) являются соединения I.37-1 – I.37-24, в которых Q имеет значения, указанные в

соответствующей строке Таблицы 1. Соединения I.37-1 – I.37-24 Таблицы I.37, таким образом, определяются значением соответствующих записей № 1 - 24 для Q Таблицы 1.

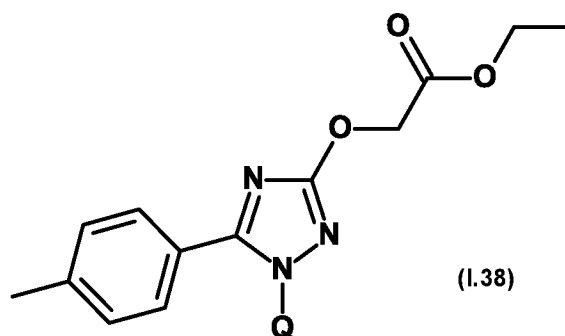


Таблица I.38: Предпочтительными соединениями формулы (I.38) являются соединения I.38-1 – I.38-24, в которых Q имеет значения, указанные в соответствующей строке Таблицы 1. Соединения I.38-1 – I.38-24 Таблицы I.38, таким образом, определяются значением соответствующих записей № 1 - 24 для Q Таблицы 1.

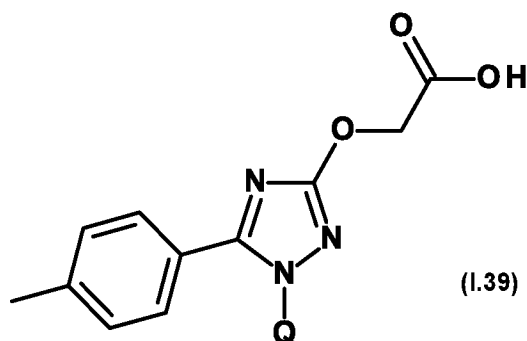


Таблица I.39: Предпочтительными соединениями формулы (I.39) являются соединения I.39-1 – I.39-24, в которых Q имеет значения, указанные в соответствующей строке Таблицы 1. Соединения I.39-1 – I.39-24 Таблицы I.39, таким образом, определяются значением соответствующих записей № 1 - 24 для Q Таблицы 1.

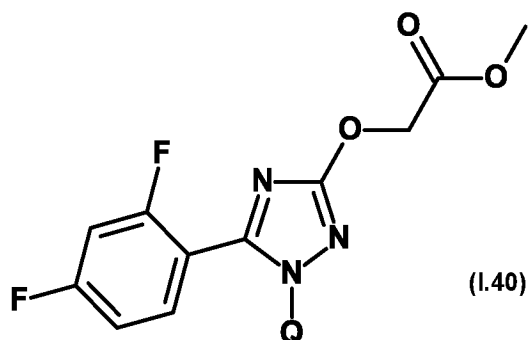


Таблица I.40: Предпочтительными соединениями формулы (I.40) являются соединения I.40-1 – I.40-24, в которых Q имеет значения, указанные в соответствующей строке Таблицы 1. Соединения I.40-1 – I.40-24 Таблицы I.40, таким образом, определяются значением соответствующих записей № 1 - 24 для Q Таблицы 1.

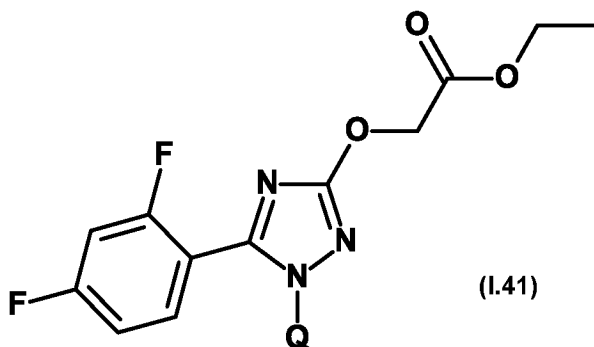


Таблица I.41: Предпочтительными соединениями формулы (I.41) являются соединения I.41-1 – I.41-24, в которых Q имеет значения, указанные в соответствующей строке Таблицы 1. Соединения I.41-1 – I.41-24 Таблицы I.41, таким образом, определяются значением соответствующих записей № 1 - 24 для Q Таблицы 1.

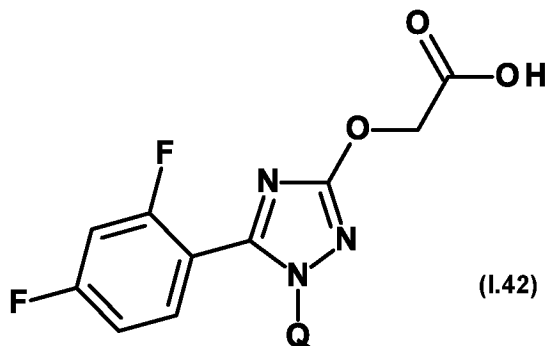


Таблица I.42: Предпочтительными соединениями формулы (I.42) являются соединения I.42-1 – I.42-24, в которых Q имеет значения, указанные в соответствующей строке Таблицы 1. Соединения I.42-1 – I.42-24 Таблицы I.42, таким образом, определяются значением соответствующих записей № 1 - 24 для Q Таблицы 1.



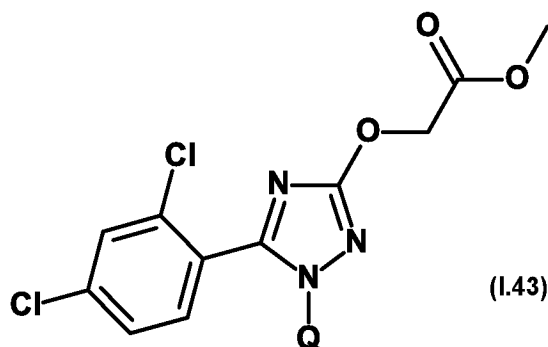


Таблица I.43: Предпочтительными соединениями формулы (I.4) являются соединения I.43-1 – I.43-24, в которых Q имеет значения, указанные в соответствующей строке Таблицы 1. Соединения I.43-1 – I.43-24 Таблицы I.43, таким образом, определяются значением соответствующих записей № 1 - 24 для Q Таблицы 1.

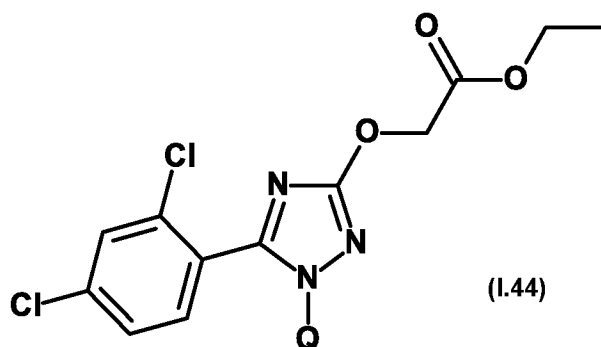


Таблица I.44: Предпочтительными соединениями формулы (I.44) являются соединения I.44-1 – I.44-24, в которых Q имеет значения, указанные в соответствующей строке Таблицы 1. Соединения I.44-1 – I.44-24 Таблицы I.44, таким образом, определяются значением соответствующих записей № 1 - 24 для Q Таблицы 1.

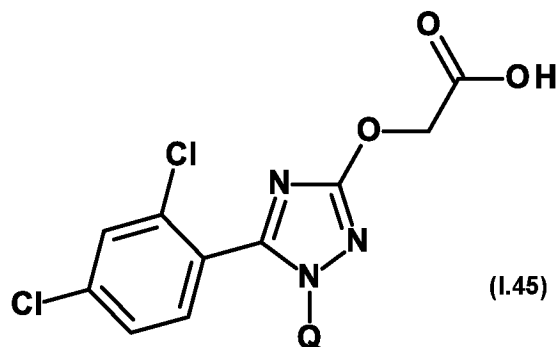


Таблица I.45: Предпочтительными соединениями формулы (I.45) являются соединения I.45-1 – I.45-24, в которых Q имеет значения, указанные в

соответствующей строке Таблицы 1. Соединения I.45-1 – I.45-24 Таблицы I.45, таким образом, определяются значением соответствующих записей № 1 - 24 для Q Таблицы 1.

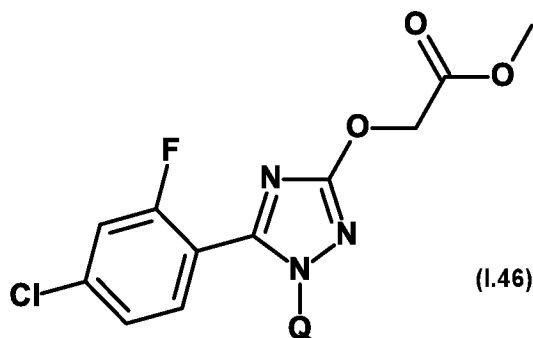


Таблица I.46: Предпочтительными соединениями формулы (I.46) являются соединения I.46-1 – I.46-24, в которых Q имеет значения, указанные в соответствующей строке Таблицы 1. Соединения I.46-1 – I.46-24 Таблицы I.46, таким образом, определяются значением соответствующих записей № 1 - 24 для Q Таблицы 1.

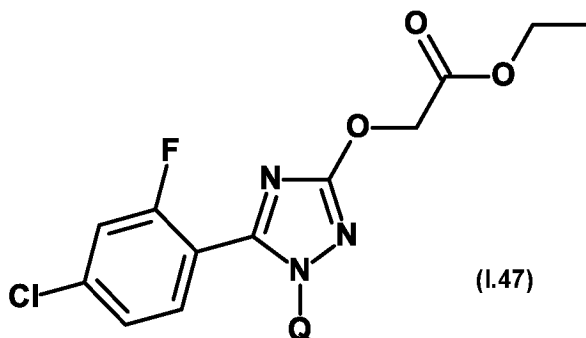


Таблица I.47: Предпочтительными соединениями формулы (I.47) являются соединения I.47-1 – I.47-24, в которых Q имеет значения, указанные в соответствующей строке Таблицы 1. Соединения I.47-1 – I.47-24 Таблицы I.47, таким образом, определяются значением соответствующих записей № 1 - 24 для Q Таблицы 1.

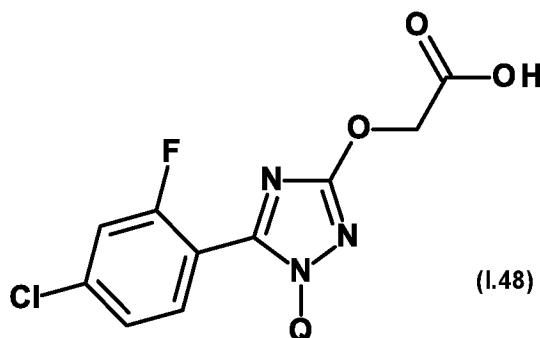


Таблица I.48: Предпочтительными соединениями формулы (I.48) являются соединения I.48-1 – I.48-24, в которых Q имеет значения, указанные в соответствующей строке Таблицы 1. Соединения I.48-1 – I.48-24 Таблицы I.48, таким образом, определяются значением соответствующих записей № 1 - 24 для Q Таблицы 1.

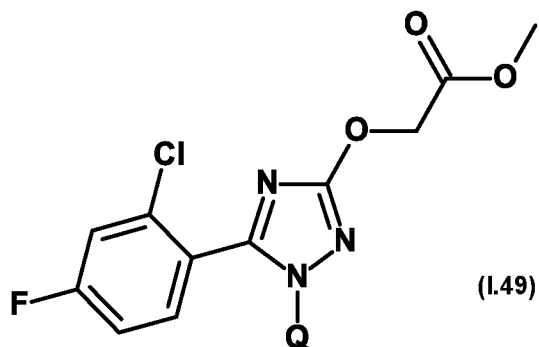


Таблица I.49: Предпочтительными соединениями формулы (I.49) являются соединения I.49-1 – I.49-24, в которых Q имеет значения, указанные в соответствующей строке Таблицы 1. Соединения I.49-1 – I.49-24 Таблицы I.49, таким образом, определяются значением соответствующих записей № 1 - 24 для Q Таблицы 1.

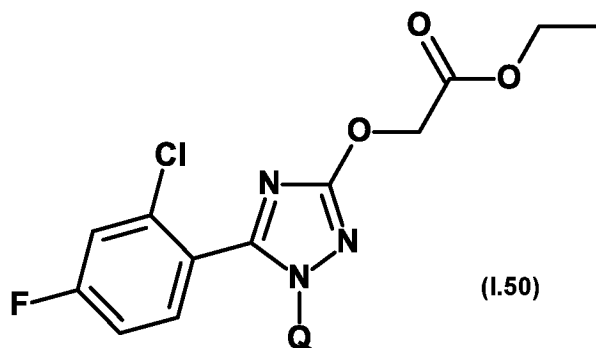


Таблица I.50: Предпочтительными соединениями формулы (I.50) являются соединения I.50-1 – I.50-24, в которых Q имеет значения, указанные в соответствующей строке Таблицы 1. Соединения I.50-1 – I.50-24 Таблицы I.50, таким образом, определяются значением соответствующих записей № 1 - 24 для Q Таблицы 1.

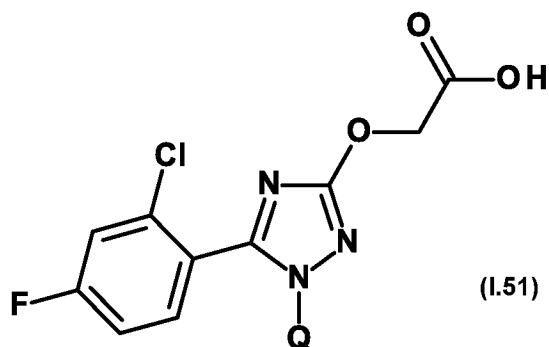


Таблица I.51: Предпочтительными соединениями формулы (I.51) являются соединения I.51-1 – I.51-24, в которых Q имеет значения, указанные в соответствующей строке Таблицы 1. Соединения I.51-1 – I.51-24 Таблицы I.51, таким образом, определяются значением соответствующих записей № 1 - 24 для Q Таблицы 1.

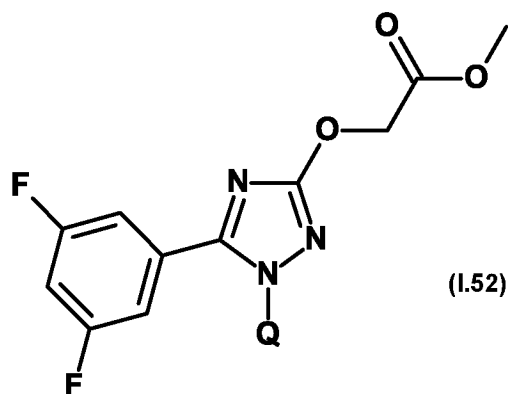


Таблица I.52: Предпочтительными соединениями формулы (I.52) являются соединения I.52-1 – I.52-24, в которых Q имеет значения, указанные в соответствующей строке Таблицы 1. Соединения I.52-1 – I.52-24 Таблицы I.52, таким образом, определяются значением соответствующих записей № 1 - 24 для Q Таблицы 1.

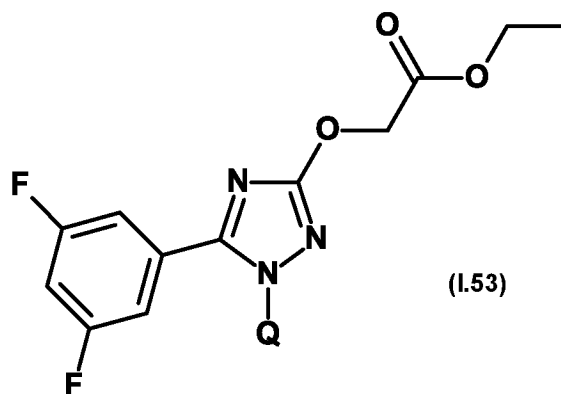


Таблица I.53: Предпочтительными соединениями формулы (I.53) являются соединения I.53-1 – I.53-24, в которых Q имеет значения, указанные в соответствующей строке Таблицы 1. Соединения I.53-1 – I.53-24 Таблицы I.53, таким образом, определяются значением соответствующих записей № 1 - 24 для Q Таблицы 1.

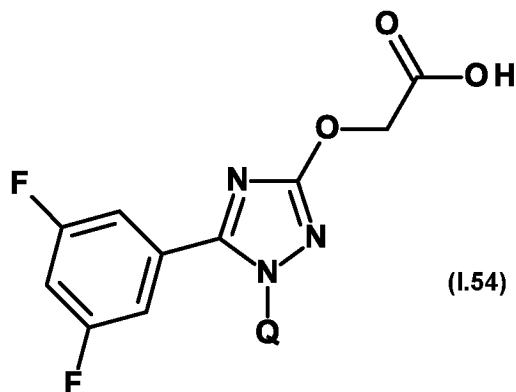


Таблица I.54: Предпочтительными соединениями формулы (I.54) являются соединения I.54-1 – I.54-24, в которых Q имеет значения, указанные в соответствующей строке Таблицы 1. Соединения I.54-1 – I.54-24 Таблицы I.54, таким образом, определяются значением соответствующих записей № 1 - 24 для Q Таблицы 1.

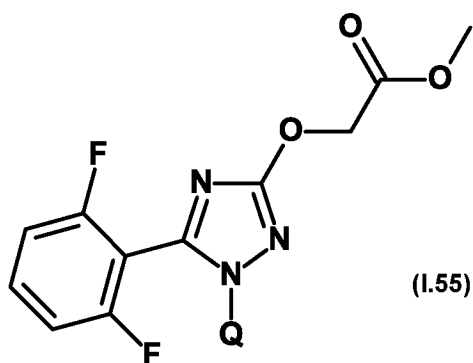


Таблица I.55: Предпочтительными соединениями формулы (I.55) являются соединения I.55-1 – I.55-24, в которых Q имеет значения, указанные в соответствующей строке Таблицы 1. Соединения I.55-1 – I.55-24 Таблицы I.55, таким образом, определяются значением соответствующих записей № 1 - 24 для Q Таблицы 1.

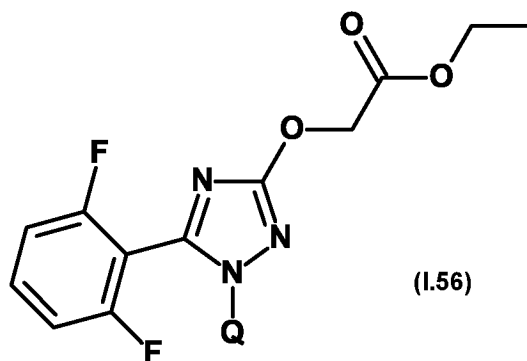


Таблица I.56: Предпочтительными соединениями формулы (I.56) являются соединения I.56-1 – I.56-24, в которых Q имеет значения, указанные в соответствующей строке Таблицы 1. Соединения I.56-1 – I.56-24 Таблицы I.56, таким образом, определяются значением соответствующих записей № 1 - 24 для Q Таблицы 1.

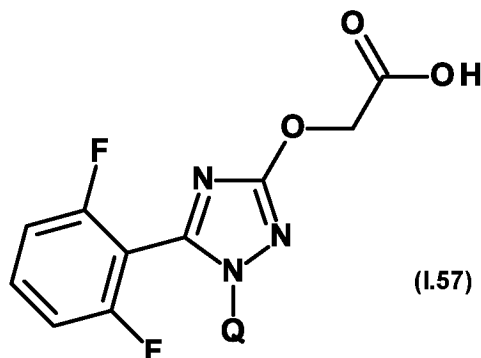


Таблица I.57: Предпочтительными соединениями формулы (I.57) являются соединения I.57-1 – I.57-24, в которых Q имеет значения, указанные в соответствующей строке Таблицы 1. Соединения I.57-1 – I.57-24 Таблицы I.57, таким образом, определяются значением соответствующих записей № 1 - 24 для Q Таблицы 1.

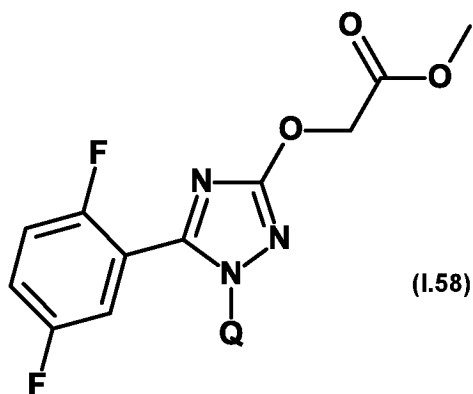


Таблица I.58: Предпочтительными соединениями формулы (I.58) являются соединения I.58-1 – I.58-24, в которых Q имеет значения, указанные в соответствующей строке Таблицы 1. Соединения I.58-1 – I.58-24 Таблицы I.58, таким образом, определяются значением соответствующих записей № 1 - 24 для Q Таблицы 1.

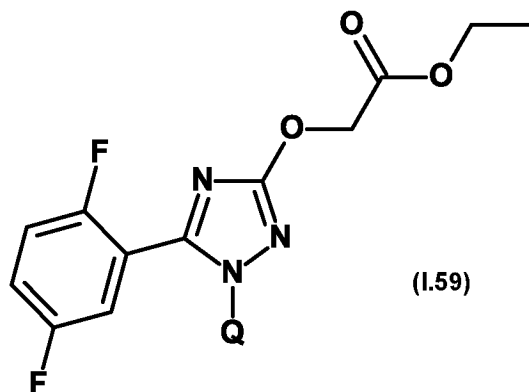


Таблица I.59: Предпочтительными соединениями формулы (I.59) являются соединения I.59-1 – I.59-24, в которых Q имеет значения, указанные в соответствующей строке Таблицы 1. Соединения I.59-1 – I.59-24 Таблицы I.59, таким образом, определяются значением соответствующих записей № 1 - 24 для Q Таблицы 1.

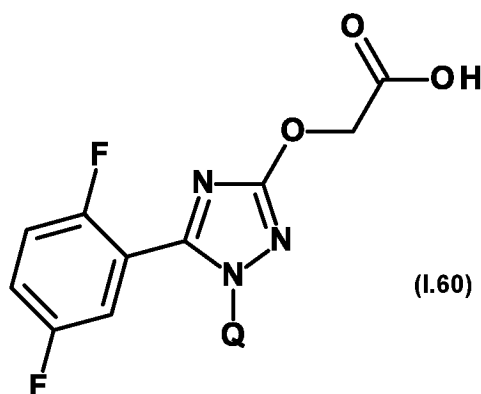


Таблица I.60: Предпочтительными соединениями формулы (I.60) являются соединения I.60-1 – I.60-24, в которых Q имеет значения, указанные в соответствующей строке Таблицы 1. Соединения I.60-1 – I.60-24 Таблицы I.60, таким образом, определяются значением соответствующих записей № 1 - 24 для Q Таблицы 1.

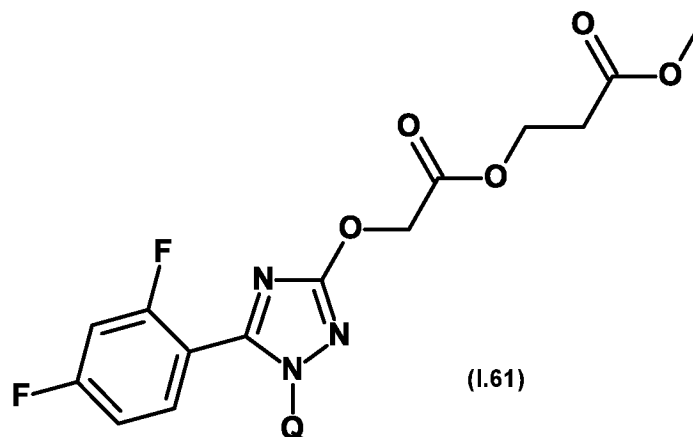


Таблица I.61: Предпочтительными соединениями формулы (I.61) являются соединения I.61-1 – I.61-24, в которых Q имеет значения, указанные в соответствующей строке Таблицы 1. Соединения I.61-1 – I.61-24 Таблицы I.61, таким образом, определяются значением соответствующих записей № 1 - 24 для Q Таблицы 1.

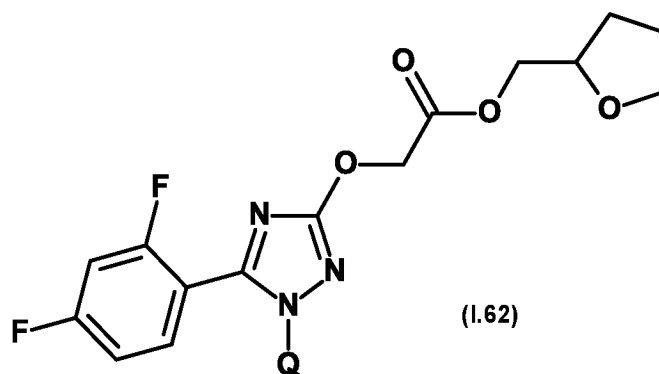


Таблица I.62: Предпочтительными соединениями формулы (I.62) являются соединения I.62-1 – I.62-24, в которых Q имеет значения, указанные в соответствующей строке Таблицы 1. Соединения I.62-1 – I.62-24 Таблицы I.62, таким образом, определяются значением соответствующих записей № 1 - 24 для Q Таблицы 1.

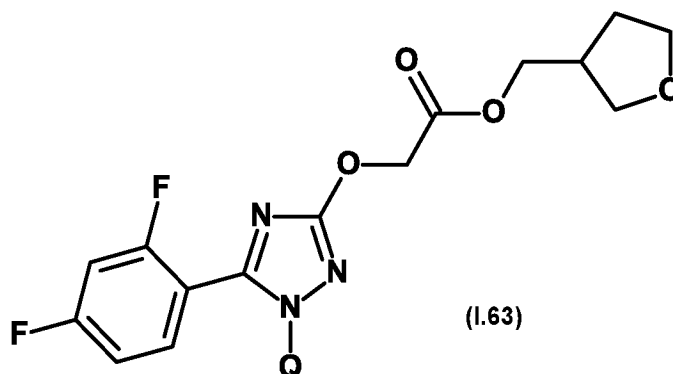




Таблица I.63: Предпочтительными соединениями формулы (I.63) являются соединения I.63-1 – I.63-24, в которых Q имеет значения, указанные в соответствующей строке Таблицы 1. Соединения I.63-1 – I.63-24 Таблицы I.63, таким образом, определяются значением соответствующих записей № 1 - 24 для Q Таблицы 1.

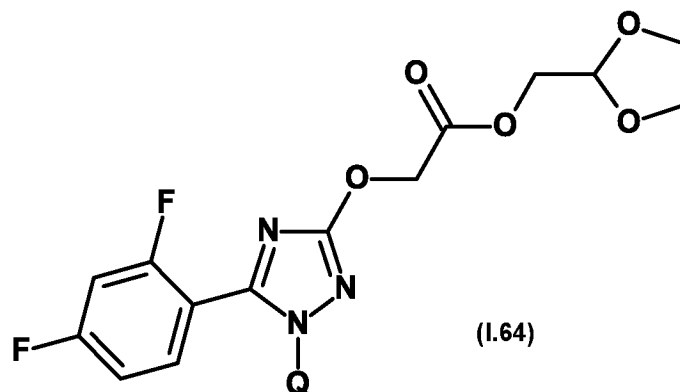


Таблица I.64: Предпочтительными соединениями формулы (I.64) являются соединения I.64-1 – I.64-24, в которых Q имеет значения, указанные в соответствующей строке Таблицы 1. Соединения I.64-1 – I.64-24 Таблицы I.64, таким образом, определяются значением соответствующих записей № 1 - 24 для Q Таблицы 1.

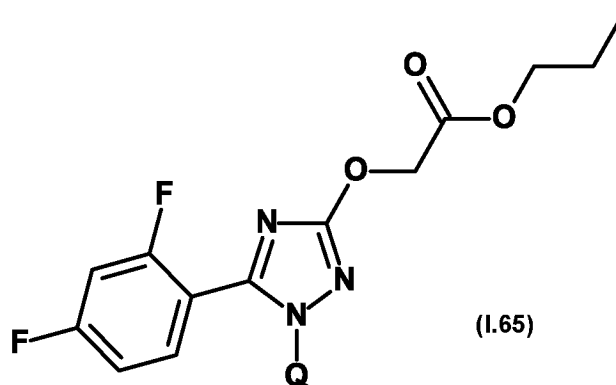


Таблица I.65: Предпочтительными соединениями формулы (I.65) являются соединения I.65-1 – I.65-24, в которых Q имеет значения, указанные в соответствующей строке Таблицы 1. Соединения I.65-1 – I.65-24 Таблицы I.65, таким образом, определяются значением соответствующих записей № 1 - 24 для Q Таблицы 1.

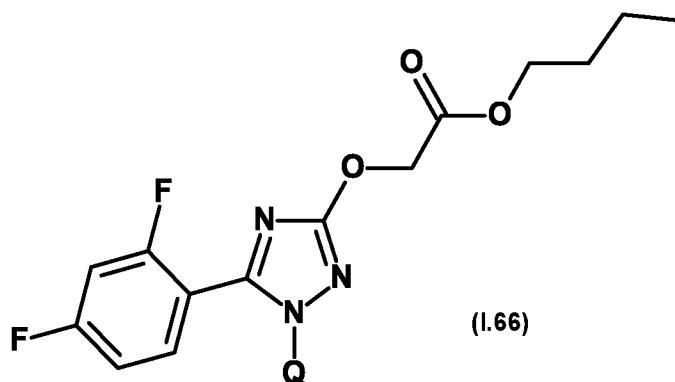


Таблица I.66: Предпочтительными соединениями формулы (I.66) являются соединения I.66-1 – I.66-24, в которых Q имеет значения, указанные в соответствующей строке Таблицы 1. Соединения I.66-1 – I.66-24 Таблицы I.66, таким образом, определяются значением соответствующих записей № 1 - 24 для Q Таблицы 1.

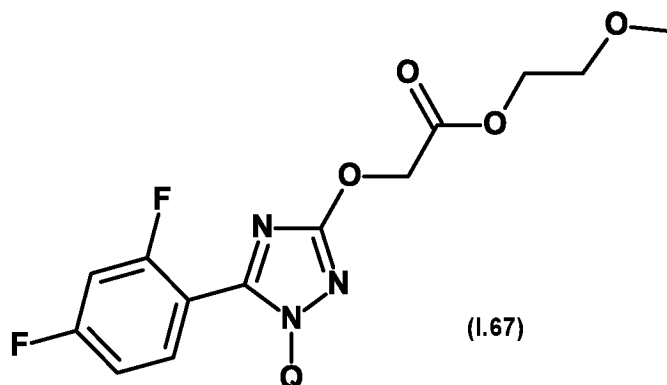


Таблица I.67: Предпочтительными соединениями формулы (I.67) являются соединения I.67-1 – I.67-24, в которых Q имеет значения, указанные в соответствующей строке Таблицы 1. Соединения I.67-1 – I.67-24 Таблицы I.67, таким образом, определяются значением соответствующих записей № 1 - 24 для Q Таблицы 1.

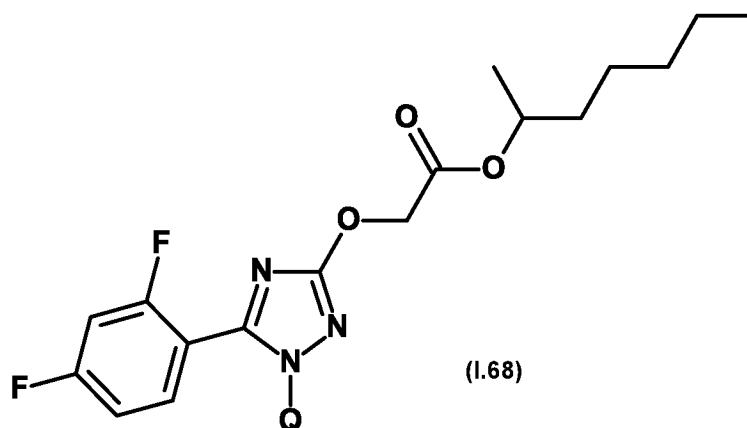


Таблица I.68: Предпочтительными соединениями формулы (I.68) являются соединения I.68-1 – I.68-24, в которых Q имеет значения, указанные в соответствующей строке Таблицы 1. Соединения I.68-1 – I.68-24 Таблицы I.68, таким образом, определяются значением соответствующих записей № 1 - 24 для Q Таблицы 1.

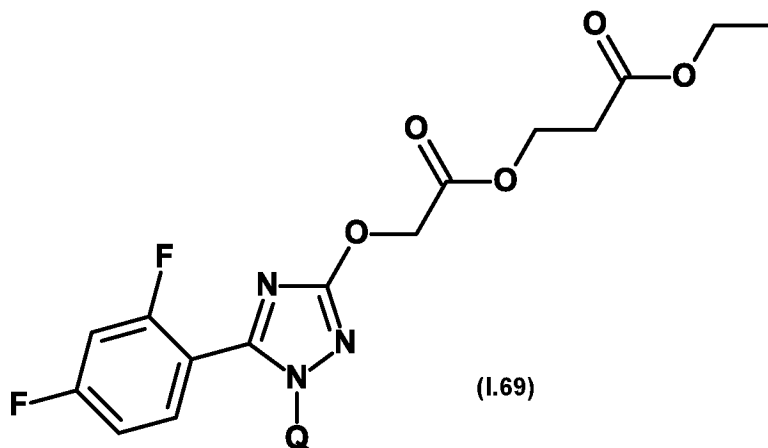


Таблица I.69: Предпочтительными соединениями формулы (I.69) являются соединения I.69-1 – I.69-24, в которых Q имеет значения, указанные в соответствующей строке Таблицы 1. Соединения I.69-1 – I.69-24 Таблицы I.69, таким образом, определяются значением соответствующих записей № 1 - 24 для Q Таблицы 1.

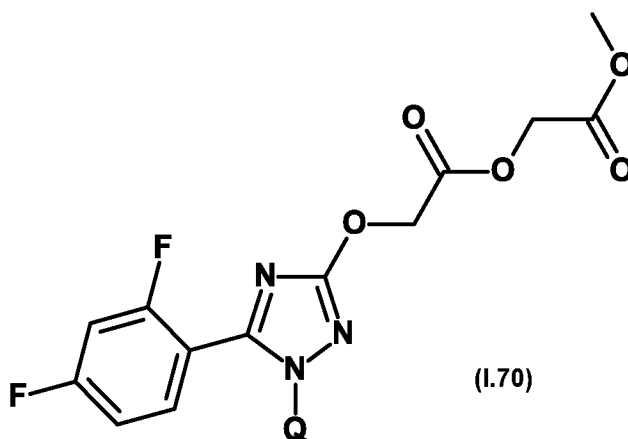


Таблица I.70: Предпочтительными соединениями формулы (I.70) являются соединения I.70-1 – I.70-24, в которых Q имеет значения, указанные в соответствующей строке Таблицы 1. Соединения I.70-1 – I.70-24 Таблицы I.70, таким образом, определяются значением соответствующих записей № 1 - 24 для Q Таблицы 1.

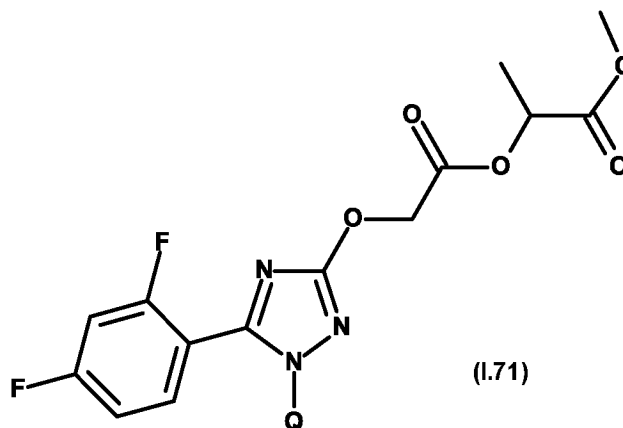


Таблица I.71: Предпочтительными соединениями формулы (I.71) являются соединения I.71-1 – I.71-24, в которых Q имеет значения, указанные в соответствующей строке Таблицы 1. Соединения I.71-1 – I.71-24 Таблицы I.71, таким образом, определяются значением соответствующих записей № 1 - 24 для Q Таблицы 1.

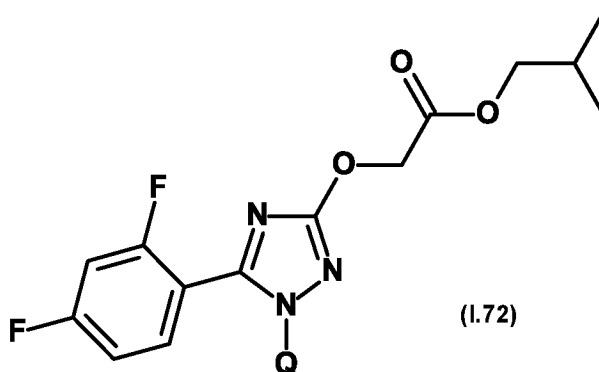


Таблица I.72: Предпочтительными соединениями формулы (I.72) являются соединения I.72-1 – I.72-24, в которых Q имеет значения, указанные в соответствующей строке Таблицы 1. Соединения I.72-1 – I.72-24 Таблицы I.72, таким образом, определяются значением соответствующих записей № 1 - 24 для Q Таблицы 1.

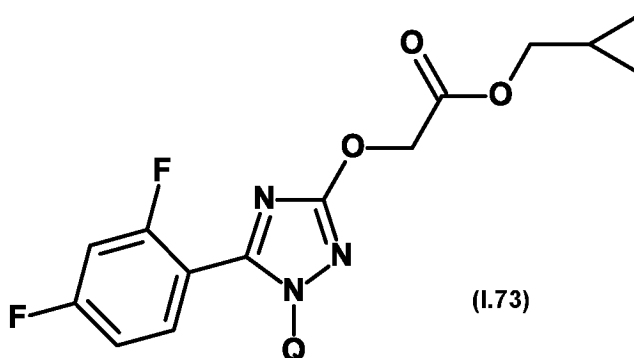


Таблица I.73: Предпочтительными соединениями формулы (I.73) являются соединения I.73-1 – I.73-24, в которых Q имеет значения, указанные в соответствующей строке Таблицы 1. Соединения I.73-1 – I.73-24 Таблицы I.73, таким образом, определяются значением соответствующих записей № 1 - 24 для Q Таблицы 1.

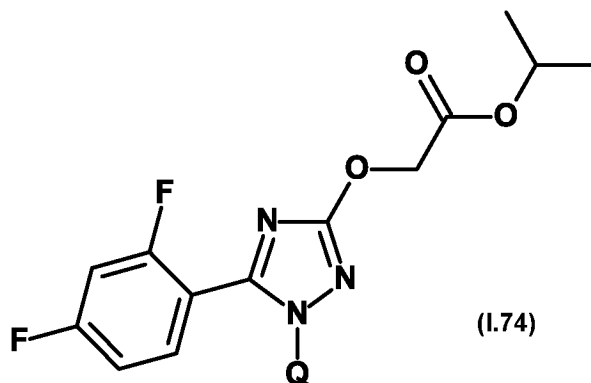


Таблица I.74: Предпочтительными соединениями формулы (I.74) являются соединения I.74-1 – I.74-24, в которых Q имеет значения, указанные в соответствующей строке Таблицы 1. Соединения I.74-1 – I.74-24 Таблицы I.74, таким образом, определяются значением соответствующих записей № 1 - 24 для Q Таблицы 1.

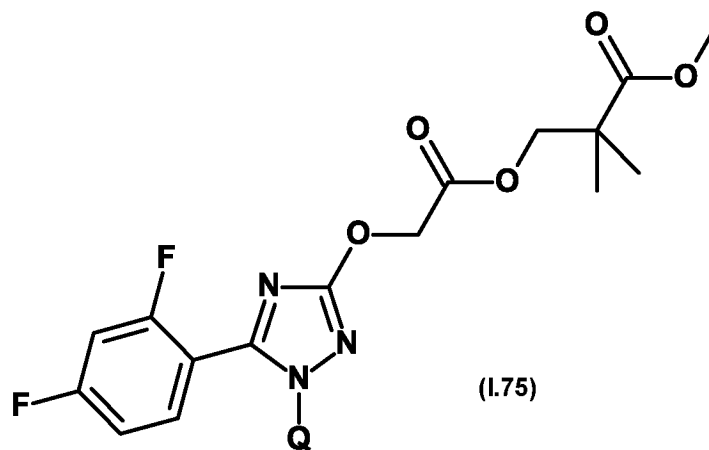


Таблица I.75: Предпочтительными соединениями формулы (I.75) являются соединения I.75-1 – I.75-24, в которых Q имеет значения, указанные в соответствующей строке Таблицы 1. Соединения I.75-1 – I.75-24 Таблицы I.75, таким образом, определяются значением соответствующих записей № 1 - 24 для Q Таблицы 1.

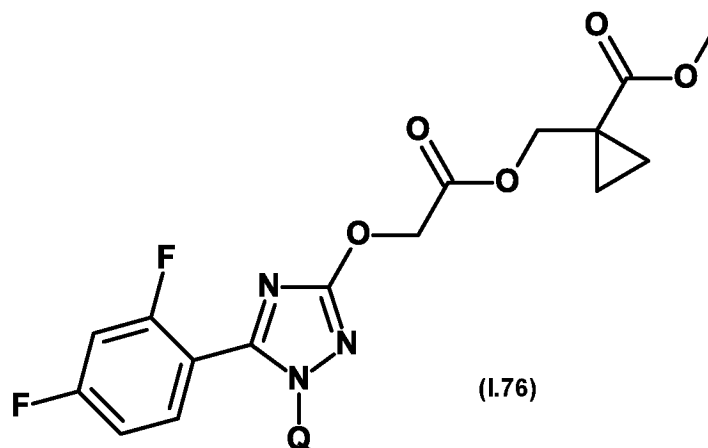


Таблица I.76: Предпочтительными соединениями формулы (I.76) являются соединения I.76-1 – I.76-24, в которых Q имеет значения, указанные в соответствующей строке Таблицы 1. Соединения I.76-1 – I.76-24 Таблицы I.76, таким образом, определяются значением соответствующих записей № 1 - 24 для Q Таблицы 1.

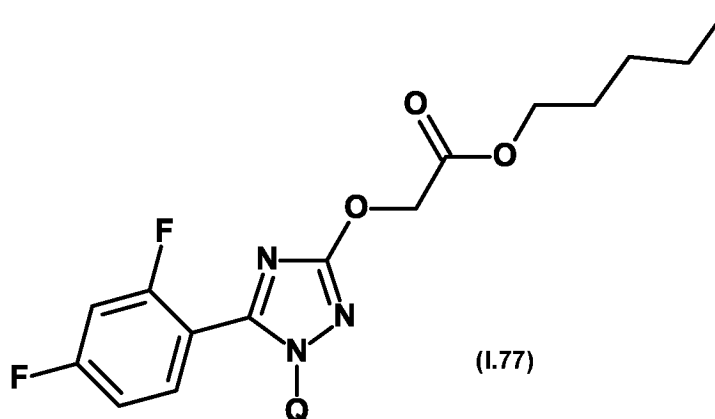


Таблица I.77: Предпочтительными соединениями формулы (I.77) являются соединения I.77-1 – I.77-24, в которых Q имеет значения, указанные в соответствующей строке Таблицы 1. Соединения I.77-1 – I.77-24 Таблицы I.77, таким образом, определяются значением соответствующих записей № 1 - 24 для Q Таблицы 1.

Спектроскопические данные по выбранным примерам из Таблиц:

Ниже приведены избранные подробные примеры синтеза соединения общей формулы (I) согласно изобретению. Спектроскопические данные  $^1\text{H}$ -ЯМР-,  $^{13}\text{C}$ -ЯМР- и  $^{19}\text{F}$ -ЯМР приведены для химических примеров, описанных в приведенных ниже разделах (400 МГц при  $^1\text{H}$ -ЯМР и 150 МГц при  $^{13}\text{C}$ -ЯМР и 375 МГц при  $^{19}\text{F}$ -ЯМР, растворитель  $\text{CDCl}_3$ ,  $\text{CD}_3\text{OD}$  или  $\text{d}_6\text{-DMSO}$ , внутренний стандарт:

тетраметилсилан  $\delta = 0,00$  ч./млн.) получены на приборе Bruker, и указанные сигналы имеют следующие значения: br = широкий; s = синглет, d = дублет, t = триплет, dd = двойной дублет, ddd = дублет двойного дублета, m = мультиплет, q = квартет, квинтет = квинтет, sext = секстет, sept = септет, dq = двойной квартет, dt = двойной триплет. В случае со смесями диастереомеров даны либо значимые сигналы обоих диастереомеров, либо характерный сигнал основного диастереомера. Сокращения, используемые для химических групп, имеют, например, следующие значения: Me = CH<sub>3</sub>, Et = CH<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>, t-Hex = C(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, t-Bu = C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, n-Bu = неразветвленный бутил, n-Pr = неразветвленный пропил, i-Pr = разветвленный пропил, c-Pr = циклопропил, c-Hex = циклогексил.

Спектроскопические данные по перечисленным ниже выбранным примерам из таблиц, были получены на основе традиционной интерпретации <sup>1</sup>H-ЯМР или оценки методом списка пиков ЯМР.

#### Традиционная интерпретация <sup>1</sup>H-ЯМР

Пример № I.48-23:

<sup>1</sup>H-ЯМР (400 MHz, DMSO-d<sup>6</sup>  $\delta$ , ppm) 13.13 (bs, 1H), 8.57 (m, 1H), 8.19 (dd, 1H), 7.64-7.54 (m, 3H), 7.43 (dd, 1H), 4.87 (s, 2H).

Пример № I.40-10:

<sup>1</sup>H-ЯМР (400 MHz, CDCl<sub>3</sub>  $\delta$ , ppm) 8.12 (d, 1H), 7.80 (dd, 1H), 7.72 (dd, 1H), 7.68 (m, 1H), 7.01 (m, 1H), 6.79 (m, 1H), 4.97 (s, 2H), 3.82 (s, 3H).

Пример № I.41-9:

<sup>1</sup>H-ЯМР (400 MHz, CDCl<sub>3</sub>  $\delta$ , ppm) 8.09 (d, 1H), 7.80 (dd, 1H), 7.66 (m, 1H), 7.07-6.98 (m, 2H), 6.83-6.78 (m, 2H), 4.93 (s, 2H), 4.28 (q, 2H), 1.30 (t, 3H).

Пример № I.48-11:

<sup>1</sup>H-ЯМР (400 MHz, CDCl<sub>3</sub>  $\delta$ , ppm) 8.29 (d, 1H), 7.69-7.60 (m, 2H), 7.39 (dd, 1H), 7.31 (m, 1H), 7.10 (m, 1H), 4.98 (s, 2H).

Пример № I.40-11:

<sup>1</sup>H-ЯМР (400 MHz, CDCl<sub>3</sub>  $\delta$ , ppm) 8.03 (d, 1H), 7.77-7.68 (m, 2H), 7.55 (m, 1H), 7.01 (m, 1H), 6.77 (m, 1H), 4.97 (s, 2H), 3.82 (s, 3H).

Пример № I.46-23:

<sup>1</sup>H-ЯМР (400 MHz, CDCl<sub>3</sub> δ, ppm) 8.48 (d, 1H), 7.83 (dd, 1H), 7.58 (m, 1H), 7.38 (m, 1H), 7.23 (m, 1H), 7.02 (dd, 1H), 4.95 (s, 2H), 3.81 (s, 3H).

Пример № I.42-9:

<sup>1</sup>H-ЯМР (400 MHz, DMSO-d<sup>6</sup> δ, ppm) 13.12 (bs, 1H), 8.27 (d, 1H), 8.04 (m, 1H), 7.72 (m, 1H), 7.43-7.27 (m, 3H), 4.88 (s, 2H).

Пример № I.48-10:

<sup>1</sup>H-ЯМР (400 MHz, DMSO-d<sup>6</sup> δ, ppm) 13.17 (bs, 1H), 8.36 (d, 1H), 8.18 (dd, 1H), 7.78 (d, 1H), 7.69 (m, 1H), 7.56 (m, 1H), 7.46 (m, 1H), 4.91 (s, 2H).

Пример № I.49-9:

<sup>1</sup>H-ЯМР (400 MHz, CDCl<sub>3</sub> δ, ppm) 8.09 (d, 1H), 7.82 (m, 1H), 7.62 (m, 1H), 7.29 (m, 1H), 7.08 (m, 1H), 7.00 (m, 1H), 4.95 (s, 2H), 3.82 (s, 3H).

Пример № I.42-23:

<sup>1</sup>H-ЯМР (400 MHz, DMSO-d<sup>6</sup> δ, ppm) 13.11 (bs, 1H), 8.56 (dd, 1H), 8.19 (dd, 1H), 7.66-7.60 (m, 2H), 7.38 (m, 1H), 7.23 (m, 1H), 4.86 (s, 2H).

Пример № I.46-10:

<sup>1</sup>H-ЯМР (400 MHz, CDCl<sub>3</sub> δ, ppm) 8.12 (d, 1H), 7.80 (dd, 1H), 7.72 (dd, 1H), 7.63 (dd, 1H), 7.28 (dd, 1H), 7.07 (dd, 1H), 4.97 (s, 2H), 3.82 (s, 3H).

Пример № I.47-9:

<sup>1</sup>H-ЯМР (400 MHz, CDCl<sub>3</sub> δ, ppm) 8.09 (d, 1H), 7.81 (m, 1H), 7.61 (m, 1H), 7.30 (m, 1H), 7.10 (dd, 1H), 7.00 (m, 1H), 4.93 (s, 2H), 4.28 (q, 2H), 1.30 (t, 3H).

Пример № I.48-9:

<sup>1</sup>H-ЯМР (400 MHz, DMSO-d<sup>6</sup> δ, ppm) 13.12 (bs, 1H), 8.28 (d, 1H), 8.06 (m, 1H), 7.66 (m, 1H), 7.59 (m, 1H), 7.49 (m, 1H), 7.34 (m, 1H), 4.86 (s, 2H).

Пример № I.40-21:

<sup>1</sup>H-ЯМР (400 MHz, CDCl<sub>3</sub> δ, ppm) 8.48 (m, 1H), 7.83 (m, 1H), 7.62 (m, 1H), 7.38 (m, 1H), 6.97 (m, 1H), 6.73 (m, 1H), 4.95 (s, 2H), 3.81 (s, 3H).

Пример № I.46-8:

<sup>1</sup>H-ЯМР (400 MHz, CDCl<sub>3</sub> δ, ppm) 8.26 (d, 1H), 7.68-7.60 (m, 2H), 7.38 (d, 1H), 7.31 (dd, 1H), 7.10 (dd, 1H), 4.95 (s, 2H), 3.82 (s, 3H).



### Метод списка пиков ЯМР

Данные  $^1\text{H}$ -ЯМР по выбранным примерам представлены в виде списков пиков  $^1\text{H}$ -ЯМР. Для каждого пика сигнала сначала указывается  $\delta$ -значение в ч. на млн., а затем (в круглых скобках) интенсивность сигнала. Пара значений  $\delta$ -величина-интенсивность сигнала различных сигнальных пиков отделяются друг от друга точкой с запятой.

Таким образом, список пиков в рамках примера имеет вид:

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

Интенсивность резких сигналов коррелирует с высотой сигнала в распечатанном примере спектра ЯМР в сантиметрах и демонстрирует истинное соотношение значений интенсивности сигналов. Для широких сигналов могут указываться несколько пиков или центр сигнала и их относительная интенсивность по сравнению с наиболее интенсивным сигналом в спектре.

Для калибровки химического сдвига  $^1\text{H}$ -ЯМР используется химический сдвиг тетраметилсилана и/или растворителя, особенно в случае спектров, измеренных в ДМСО. Таким образом, пик тетраметилсилана может появляться в списках пиков ЯМР, но при этом это не обязательно.

Списки пиков  $^1\text{H}$ -ЯМР аналогичны классическим распечаткам  $^1\text{H}$ -ЯМР и, таким образом, обычно включают в себя все пики, перечисленные в классической интерпретации ЯМР.

Кроме того, в классических распечатках  $^1\text{H}$ -ЯМР могут отображаться сигналы растворителя, сигналы от стереоизомеров целевых соединений, которые также являются предметом изобретения, и/или пики от примесей.

При указании сигналов соединений в дельта-диапазоне растворителей и/или воды в наших списках  $^1\text{H}$ -ЯМР приводятся пики обычных пиков растворителя, например, пики из ДМСО в ДМСО- $\text{D}_6$  и пик воды, для которых в среднем обычно характерна высокая интенсивность.

Пики стереоизомеров целевых соединений и/или пики примесей обычно в среднем имеют меньшую интенсивность, чем пики целевых соединений (например, с чистотой >90%).

Такие стереоизомеры и/или примеси могут быть типичными для конкретного производственного процесса. Таким образом, их пики могут помочь идентифицировать воспроизведение нашего производственного процесса с использованием "отпечатков побочных продуктов".

Специалист, который определяет пики целевых соединений известными методами (MestreC, моделирование ACD, а также с помощью эмпирически оцененных ожидаемых значений), может, при необходимости, выделить пики целевых соединений, используя, при необходимости, дополнительные фильтры интенсивности. Указанное выделение схоже с выделением пиков, используемым в классической интерпретации  $^1\text{H}$ -ЯМР.

Подробная информация о списках  $^1\text{H}$ -ЯМР приведена в Базе данных Research Disclosure (Сообщений об Исследовании) Номер 564025.

I.57-22:  $^1\text{H}$ -ЯМР(300.1 MHz,  $d_6$ -DMSO):

$\delta$ = 12.3937 (0.5); 9.2480 (5.6); 9.2263 (5.8); 8.4325 (0.7); 8.2959 (5.3); 8.2734 (5.8); 8.2539 (0.6); 7.7257 (0.5); 7.7012 (0.8); 7.6745 (1.9); 7.6510 (3.3); 7.6256 (2.6); 7.6039 (1.1); 7.4338 (0.7); 7.4088 (2.8); 7.3830 (3.7); 7.3710 (3.5); 7.3463 (4.7); 7.3331 (6.9); 7.3008 (13.9); 7.2743 (12.3); 7.2615 (6.5); 7.2363 (5.4); 7.1221 (1.4); 7.0973 (3.3); 7.0747 (4.5); 7.0606 (4.3); 6.9997 (3.1); 6.9759 (5.5); 6.9531 (11.4); 6.9243 (15.5); 6.8958 (7.8); 6.8719 (3.2); 6.8488 (3.8); 6.8250 (2.4); 6.7449 (0.5); 6.6061 (0.4); 4.5766 (0.5); 4.3590 (0.4); 4.3133 (0.5); 4.3021 (0.5); 4.2682 (0.5); 4.2449 (0.5); 4.1884 (0.9); 4.1153 (10.9); 4.0355 (1.2); 3.9754 (16.0); 3.8965 (1.3); 3.8294 (0.8); 3.7693 (0.8); 3.7405 (1.0); 3.6499 (1.2); 3.3287 (243.7); 3.2142 (2.7); 3.1688 (2.0); 3.1235 (1.6); 3.0996 (1.4); 3.0795 (1.3); 3.0277 (1.3); 2.9926 (1.2); 2.9734 (1.2); 2.9586 (1.2); 2.9448 (1.2); 2.8896 (1.4); 2.8544 (1.5); 2.7986 (1.8); 2.7262 (4.2); 2.5006 (396.1); 2.3887 (1.9); 2.3477 (1.6); 2.2709 (3.0); 2.2167 (0.9); 2.1786 (0.9); 2.1672 (0.8); 2.1355 (0.8); 2.0914 (0.6); 2.0438 (0.6); 2.0169 (0.5); 2.0011 (0.5); 1.9738 (0.6); 1.9628 (0.6); 1.9550 (0.5); 1.8867 (2.4); 1.8221 (0.6); 1.7825 (0.6); 1.7660 (0.6); 1.7548 (0.5); 1.7160 (0.4); 1.7029 (0.4); 1.6921 (0.4); 1.6808 (0.4); 1.6412 (0.4); 1.6176 (0.4); 1.5901 (0.5); 1.5781 (0.4); 1.5286 (0.4); 1.4249 (0.5); 1.3681 (0.4); 1.2931 (0.4); 1.2532 (0.5); 1.2432 (0.7); 1.2358 (1.0); 1.2249 (0.7); 1.2129 (0.5); 1.1445 (2.1); 1.0718 (0.6); 1.0553 (0.6); 1.0466 (0.6); 1.0248 (0.5); 1.0054 (0.6); 0.9782 (0.6); 0.8976 (0.4); 0.8874 (0.4); 0.7967 (0.4); 0.5598 (0.4); -0.0016 (2.3); -3.5425 (0.4); -3.5753 (0.4)

I.40-2:  $^1\text{H}$ -ЯМР(400.6 MHz,  $\text{CDCl}_3$ ):

$\delta$ = 8.6034 (0.8); 8.5998 (0.8); 8.5914 (0.8); 8.5878 (0.8); 8.5092 (1.1); 8.5033 (1.1); 7.7098 (0.7); 7.7060 (0.8); 7.7034 (0.8); 7.6995 (0.8); 7.6893 (0.9); 7.6855 (0.9); 7.6828 (1.4); 7.6789 (1.1); 7.6668 (0.7); 7.6612 (0.8); 7.6476 (0.9); 7.6448 (0.9); 7.6410 (0.6); 7.6254 (0.6); 7.3752 (0.8); 7.3734 (0.8); 7.3632 (0.8); 7.3614 (0.8); 7.3547 (0.8); 7.3529 (0.8); 7.3426 (0.7); 7.3409 (0.7); 7.2636 (27.7); 7.0318 (0.7); 7.0291 (0.5); 7.0283 (0.5); 7.0257 (0.8); 6.8196 (0.6); 6.8135 (0.5); 6.7981 (0.6); 6.7944 (0.6); 6.7922 (0.6); 6.7885 (0.6); 6.7731 (0.6); 6.7670 (0.5); 4.9602 (8.3); 3.8212 (16.0); 3.8141 (0.6); 1.6095 (2.2); 1.2845 (0.6); 1.2549 (1.2); -0.0002 (9.0)

<p>I.40-22: <math>^1\text{H}</math>-ЯМР(300.1 MHz, <math>d_6</math>-DMSO):  <math>\delta</math>= 8.3804 (2.2); 8.3572 (2.2); 7.4826 (0.7); 7.4540 (1.5); 7.4327 (1.7); 7.4097 (1.7); 7.3854 (1.6); 7.3743 (1.4); 7.3484 (1.5); 7.2151 (0.9); 7.2071 (0.9); 7.1763 (1.5); 7.1500 (1.9); 7.1360 (1.7); 7.1259 (2.0); 7.1116 (2.0); 7.1023 (1.2); 7.0875 (1.0); 7.0362 (0.8); 7.0134 (1.5); 6.9853 (0.8); 4.7327 (8.8); 3.7436 (16.0); 3.5869 (0.7); 3.3314 (9.3); 3.3078 (2.5); 2.5079 (27.4); 2.5020 (35.7); 2.4963 (25.7); 2.0763 (0.5); 1.2331 (0.5); -0.0008 (7.2)</p>
<p>I.4-22: <math>^1\text{H}</math>-ЯМР(300.1 MHz, <math>d_6</math>-DMSO):  <math>\delta</math>= 8.3870 (2.0); 8.3640 (2.2); 8.1362 (0.5); 7.4120 (0.4); 7.3875 (1.7); 7.3632 (3.0); 7.3485 (2.9); 7.3423 (3.3); 7.3250 (2.4); 7.3179 (2.1); 7.1396 (1.0); 7.1248 (1.3); 7.1156 (1.7); 7.0974 (3.2); 7.0687 (3.8); 7.0428 (1.3); 7.0366 (1.1); 4.7834 (0.4); 4.7432 (6.0); 4.6890 (0.5); 3.7489 (16.0); 3.6957 (0.5); 3.6890 (0.6); 3.5712 (0.7); 3.3364 (24.5); 2.5147 (2.4); 2.5090 (4.7); 2.5031 (6.3); 2.4973 (4.5); 2.0764 (11.3); -0.0004 (0.6)</p>
<p>I.1-22: <math>^1\text{H}</math>-ЯМР(300.1 MHz, <math>d_6</math>-DMSO):  <math>\delta</math>= 8.2143 (2.1); 8.2128 (2.1); 8.1906 (2.3); 8.1713 (2.3); 8.1669 (2.9); 8.1619 (1.3); 8.1511 (0.9); 8.1444 (3.2); 8.1390 (2.3); 7.5503 (0.5); 7.5455 (0.4); 7.5366 (0.4); 7.5262 (1.7); 7.5177 (1.6); 7.5077 (1.1); 7.5026 (1.8); 7.4947 (1.5); 7.4797 (2.8); 7.4773 (2.8); 7.4575 (2.6); 7.4529 (3.4); 7.4352 (0.5); 7.4297 (1.1); 7.4244 (0.6); 7.3891 (0.4); 6.9748 (0.8); 6.9597 (0.8); 6.9502 (1.2); 6.9353 (1.2); 6.9257 (0.7); 6.9105 (0.6); 5.3890 (7.1); 4.9956 (0.6); 3.7465 (0.3); 3.7381 (0.4); 3.7123 (1.5); 3.6764 (16.0); 3.6508 (0.4); 3.6465 (0.3); 3.6304 (0.4); 3.6212 (0.3); 3.6048 (0.8); 3.5927 (0.6); 3.5795 (0.3); 3.5685 (0.4); 3.4657 (0.3); 3.4558 (0.3); 3.3719 (457.6); 3.3123 (0.4); 2.5167 (10.1); 2.5108 (19.6); 2.5049 (26.1); 2.4989 (17.9); 2.4931 (8.1); 2.0750 (3.2); 1.2337 (0.4); -0.0002 (1.0)</p>
<p>I.55-22: <math>^1\text{H}</math>-ЯМР(300.1 MHz, <math>d_6</math>-DMSO):  <math>\delta</math>= 8.4406 (1.9); 8.4178 (2.0); 7.4413 (0.5); 7.4211 (1.8); 7.4138 (1.2); 7.3969 (2.5); 7.3909 (2.3); 7.3866 (2.2); 7.3686 (1.6); 7.3615 (2.2); 7.3413 (0.6); 7.1839 (1.0); 7.1691 (1.2); 7.1601 (1.5); 7.1455 (1.4); 7.1359 (0.9); 7.1212 (0.7); 7.0351 (1.5); 7.0062 (2.5); 6.9776 (1.3); 4.7845 (8.4); 4.7386 (0.8); 3.7663 (16.0); 3.5637 (1.6); 3.3356 (8.8); 2.5033 (5.0); 2.0768 (3.1)</p>
<p>I.46-22: <math>^1\text{H}</math>-ЯМР(400.2 MHz, <math>d_6</math>-DMSO):  <math>\delta</math>= 8.3930 (2.1); 8.3758 (2.2); 7.4213 (1.4); 7.4129 (1.4); 7.4012 (2.6); 7.3924 (2.8); 7.3865 (3.0); 7.3665 (2.9); 7.2298 (1.8); 7.2254 (1.8); 7.2090 (1.5); 7.2046 (1.4); 7.1551 (0.8); 7.1441 (1.0); 7.1371 (1.4); 7.1263 (1.5); 7.1191 (0.9); 7.1081 (0.8); 4.7367 (8.3); 3.7466 (16.0); 3.5891 (0.8); 3.3351 (41.4); 3.3114 (3.9); 2.5117 (7.8); 2.5074 (15.7); 2.5030 (21.0); 2.4985 (15.0); 2.4942 (7.1); 2.0772 (0.5); 1.7541 (0.6); 0.0001 (2.0)</p>
<p>I.6-22: <math>^1\text{H}</math>-ЯМР(300.1 MHz, <math>d_6</math>-DMSO):  <math>\delta</math>= 13.2965 (0.3); 13.2071 (0.4); 13.1912 (0.4); 13.1600 (0.4); 13.1177 (0.3); 8.4117 (6.7); 8.3888 (6.9); 8.1553 (0.4); 8.1316 (0.4); 8.0424 (0.7); 8.0223 (0.9); 7.9896 (0.4); 7.8715 (0.4); 7.8651 (0.5); 7.7451 (0.4); 7.7227 (0.7); 7.6997 (0.6); 7.6776 (0.7); 7.6545 (0.8); 7.6292 (0.6); 7.5240 (0.3); 7.4980 (0.4); 7.4734 (0.6); 7.4300 (1.3); 7.4094 (1.4); 7.3741 (6.0); 7.3496 (12.5); 7.3364 (8.4); 7.3293 (11.4); 7.3117 (7.3); 7.3044 (8.1); 7.2766 (1.0); 7.2640 (0.5); 7.2554 (0.4); 7.2384 (0.5); 7.2167 (0.4); 7.1287 (3.5); 7.1138 (4.4); 7.1047 (6.0); 7.0879 (10.9); 7.0581 (12.8); 7.0319 (4.5); 7.0270 (4.2); 6.9585 (0.3); 5.2560 (1.0); 4.6150 (16.0); 4.5420 (2.2); 3.3229 (7.7); 3.1461 (0.4); 2.7339 (0.5); 2.7280 (0.7); 2.7220 (0.5); 2.5138 (45.6); 2.5079 (87.7); 2.5020 (115.5); 2.4960 (79.8); 2.4903 (37.1); 2.2780 (0.5); 2.2716 (0.7); 2.2660 (0.5); 2.0743 (5.8); 1.2351 (0.6); 1.1470 (0.4); 0.0109 (0.4); -0.0002 (9.2)</p>

<p>I.40-11: <math>^1\text{H}</math>-ЯМР(400.6 MHz, <math>d_6</math>-DMSO):  <math>\delta</math>= 8.3202 (3.0); 8.3127 (3.1); 8.0327 (1.1); 8.0252 (1.0); 8.0123 (1.3); 8.0103 (1.5); 8.0048 (1.2); 8.0028 (1.4); 7.9900 (1.4); 7.9825 (1.2); 7.8209 (1.7); 7.8111 (1.8); 7.7986 (1.4); 7.7976 (1.4); 7.7887 (1.4); 7.7878 (1.3); 7.7499 (0.7); 7.7338 (0.8); 7.7287 (1.3); 7.7126 (1.4); 7.7076 (0.9); 7.6915 (0.8); 7.3892 (0.7); 7.3830 (0.8); 7.3659 (0.9); 7.3624 (1.0); 7.3599 (1.0); 7.3564 (0.9); 7.3393 (0.8); 7.3331 (0.8); 7.2783 (0.6); 7.2763 (0.6); 7.2704 (0.6); 7.2567 (1.1); 7.2554 (1.2); 7.2500 (1.1); 7.2358 (0.6); 7.2338 (0.6); 7.2292 (0.5); 5.7575 (16.0); 4.9056 (10.5); 2.5135 (5.3); 2.5089 (11.6); 2.5043 (16.2); 2.4998 (11.2); 2.4952 (5.0); -0.0002 (10.3)</p>
<p>I.47-5: <math>^1\text{H}</math>-ЯМР(400.6 MHz, <math>\text{CDCl}_3</math>):  <math>\delta</math>= 9.1884 (6.7); 8.7235 (16.0); 7.6796 (1.5); 7.6606 (1.7); 7.6589 (1.9); 7.6400 (1.7); 7.3488 (1.3); 7.3471 (1.2); 7.3438 (1.3); 7.3423 (1.3); 7.3279 (1.1); 7.3263 (1.1); 7.3230 (1.2); 7.3215 (1.1); 7.2630 (10.4); 7.1320 (1.6); 7.1271 (1.5); 7.1075 (1.6); 7.1027 (1.5); 5.3008 (0.8); 4.9398 (12.2); 4.3160 (1.6); 4.2982 (5.0); 4.2804 (5.0); 4.2626 (1.6); 1.5749 (2.4); 1.3281 (6.3); 1.3104 (13.2); 1.2925 (6.2); 0.0697 (1.8); -0.0002 (15.4)</p>
<p>I.46-11: <math>^1\text{H}</math>-ЯМР(400.6 MHz, <math>\text{CDCl}_3</math>):  <math>\delta</math>= 8.0396 (1.7); 8.0387 (1.6); 8.0323 (1.8); 8.0313 (1.7); 7.7751 (0.8); 7.7741 (0.8); 7.7654 (0.9); 7.7642 (0.8); 7.7528 (1.0); 7.7517 (0.9); 7.7431 (1.1); 7.7420 (0.9); 7.6672 (1.1); 7.6482 (1.3); 7.6467 (1.4); 7.6277 (1.2); 7.5878 (0.8); 7.5804 (0.8); 7.5691 (0.9); 7.5654 (0.7); 7.5618 (0.8); 7.5581 (0.7); 7.5468 (0.7); 7.5395 (0.6); 7.2864 (1.0); 7.2848 (0.9); 7.2814 (1.0); 7.2800 (0.9); 7.2654 (1.0); 7.2630 (3.8); 7.2607 (1.0); 7.2592 (0.9); 7.0668 (1.2); 7.0619 (1.2); 7.0422 (1.2); 7.0373 (1.2); 5.2997 (2.4); 4.9649 (8.5); 3.8160 (16.0); 0.0710 (3.8); -0.0002 (5.1)</p>
<p>I.47-20: <math>^1\text{H}</math>-ЯМР(400.6 MHz, <math>\text{CDCl}_3</math>):  <math>\delta</math>= 8.1450 (1.6); 8.1309 (1.6); 8.1242 (1.6); 8.1101 (1.6); 7.6508 (1.8); 7.6319 (2.1); 7.6303 (2.4); 7.6114 (2.1); 7.5353 (1.6); 7.5296 (1.7); 7.5116 (1.7); 7.5058 (1.6); 7.2862 (1.5); 7.2846 (1.5); 7.2813 (1.6); 7.2798 (1.6); 7.2654 (1.6); 7.2623 (20.4); 7.0814 (2.0); 7.0765 (1.9); 7.0570 (2.0); 7.0522 (1.9); 6.9806 (1.2); 6.9748 (1.2); 6.9665 (1.2); 6.9609 (2.3); 6.9553 (1.2); 6.9470 (1.3); 6.9412 (1.1); 5.2999 (5.4); 4.9454 (15.3); 4.3166 (1.9); 4.2988 (6.1); 4.2810 (6.2); 4.2631 (2.0); 1.3240 (7.9); 1.3199 (0.6); 1.3062 (16.0); 1.3021 (1.1); 1.2884 (7.6); 1.2842 (0.7); 0.0704 (1.5); -0.0002 (12.4)</p>
<p>I.47-11: <math>^1\text{H}</math>-ЯМР(400.6 MHz, <math>\text{CDCl}_3</math>):  <math>\delta</math>= 8.0374 (2.8); 8.0363 (2.7); 8.0300 (3.0); 8.0290 (2.7); 7.7756 (1.4); 7.7744 (1.2); 7.7658 (1.4); 7.7647 (1.3); 7.7533 (1.7); 7.7520 (1.6); 7.7435 (1.7); 7.7424 (1.5); 7.6641 (1.8); 7.6450 (2.2); 7.6435 (2.3); 7.6245 (2.0); 7.5853 (1.4); 7.5780 (1.3); 7.5666 (1.5); 7.5630 (1.2); 7.5593 (1.4); 7.5556 (1.1); 7.5444 (1.2); 7.5370 (1.1); 7.2851 (1.6); 7.2834 (1.5); 7.2801 (1.6); 7.2786 (1.5); 7.2627 (7.8); 7.2594 (1.6); 7.2579 (1.4); 7.0665 (1.9); 7.0616 (1.8); 7.0419 (1.9); 7.0371 (1.8); 5.2998 (5.8); 4.9406 (14.7); 4.3092 (1.9); 4.2913 (5.9); 4.2735 (6.0); 4.2557 (2.0); 1.5851 (1.0); 1.3163 (7.7); 1.2984 (16.0); 1.2806 (7.5); 0.0706 (3.5); -0.0002 (9.7)</p>
<p>I.46-5: <math>^1\text{H}</math>-ЯМР(400.6 MHz, <math>\text{CDCl}_3</math>):  <math>\delta</math>= 9.1908 (4.7); 8.7253 (11.4); 7.6824 (1.1); 7.6633 (1.3); 7.6617 (1.4); 7.6427 (1.3); 7.3500 (1.0); 7.3484 (0.9); 7.3451 (1.0); 7.3436 (0.9); 7.3292 (0.8); 7.3275 (0.8); 7.3242 (0.9); 7.3227 (0.8); 7.2627 (9.0); 7.1324 (1.2); 7.1276 (1.1); 7.1079 (1.2); 7.1031 (1.1); 5.3007 (2.3); 4.9638 (8.3); 3.8259 (16.0); 1.5736 (1.0); 1.2596 (0.8); 0.8819 (1.0); 0.0697 (1.2); -0.0002 (13.0); -0.0028 (0.5)</p>
<p>I.48-5: <math>^1\text{H}</math>-ЯМР(400.6 MHz, <math>d_6</math>-DMSO):  <math>\delta</math>= 9.2544 (7.2); 8.9046 (16.0); 7.7240 (1.0); 7.7034 (1.7); 7.6835 (1.3); 7.6384 (1.1); 7.6335 (1.2); 7.6128 (1.1); 7.6079 (1.2); 7.5129 (1.1); 7.5116 (1.1); 7.5073 (1.1); 7.4919 (0.9); 7.4906 (0.9); 7.4864 (0.9); 4.9102 (6.6); 3.3234 (1.3); 2.5201 (0.5); 2.5113 (7.8); 2.5068 (17.2); 2.5022 (24.2); 2.4976 (16.6); 2.4930 (7.3); 2.1834 (0.6); 1.3558 (5.8); -0.0002 (18.4); -0.0085 (0.5)</p>

I.48-11:  $^1\text{H}$ -ЯМР(400.6 MHz,  $d_6$ -DMSO):  
 $\delta$ = 8.3326 (3.0); 8.3251 (3.1); 8.0378 (1.1); 8.0303 (1.0); 8.0175 (1.3); 8.0154 (1.5); 8.0100 (1.1); 8.0079 (1.4); 7.9952 (1.4); 7.9876 (1.2); 7.8281 (1.6); 7.8272 (1.6); 7.8183 (1.8); 7.8058 (1.4); 7.8047 (1.4); 7.7959 (1.4); 7.7949 (1.3); 7.7071 (1.6); 7.6867 (2.7); 7.6669 (1.9); 7.5692 (1.7); 7.5642 (1.8); 7.5437 (1.7); 7.5387 (1.9); 7.4705 (1.7); 7.4694 (1.8); 7.4648 (1.7); 7.4498 (1.4); 7.4486 (1.5); 7.4441 (1.4); 5.7572 (16.0); 4.9061 (10.1); 3.3248 (0.8); 2.5252 (0.6); 2.5206 (0.8); 2.5118 (10.1); 2.5073 (22.2); 2.5027 (31.1); 2.4981 (21.4); 2.4935 (9.4); 0.0080 (0.6); -0.0002 (23.2); -0.0085 (0.7)

Предметом изобретения также является способ защиты технических растений или сельскохозяйственных культур от фитотоксического действия агрохимикатов, таких как пестициды или, в частности, гербициды, которые наносят ущерб посевам или полезным растениям, отличающийся тем, что соединения общей формулы (I) или их соли применяют в качестве антидота, предпочтительно путем нанесения эффективного количества соединения общей формулы (I) или их солей на растения, части растений или их семена (или семенной материал).

Соединения общей формулы (I) (= антидоты), как указано выше, подходят вместе с активными ингредиентами (пестицидами) для селективной борьбы с вредными организмами в одном ряду культур, например, экономически важных культур, таких как зерновые (пшеница, ячмень, тритикале, рожь, рис, кукуруза, сорго), сахарная свекла, сахарный тростник, рапс, хлопок, подсолнечник, горох, бобы и соевые бобы. Комбинации гербицидов и антидотов с антидотами общей формулы (I) также подходят для борьбы с вредными растениями на грядках и участках с полезными и декоративными растениями, как, например, на газонах с полезными или декоративными газонами, особенно с райграсом, мятликом или бермудской травой.

В случае с сельскохозяйственными растениями и культурами, в которых можно использовать комбинации гербицидов и антидотов с вышеупомянутыми соединениями общей формулы (I), интерес представляют мутантные культуры, полностью или частично устойчивые к некоторым пестицидам, или полностью или частично устойчивые трансгенные культуры, например, культуры кукурузы, устойчивые к глюфосинату или глифосату, или культуры сои, устойчивые к имидазолинонам, которые наносят вред растениям.

Однако особым преимуществом применяемых новых антидотов общей формулы (I) является их эффективное воздействие на сельскохозяйственные

культуры, которые, как правило, характеризуются недостаточной переносимостью к используемым пестицидам.

Соединения общей формулы (I) могут применяться вместе с пестицидами, как одновременно, так и в любой последовательности с активными ингредиентами, и при этом способны уменьшать или полностью устранять вредные побочное действие таких активных ингредиентов на сельскохозяйственные культуры, не влияя и существенно не снижая при этом на эффективность таких активных ингредиентов в отношении нежелательных вредоносных организмов.

Ущерб, обусловленный применением нескольких пестицидов, например, нескольких гербицидов или гербицидов в сочетании с инсектицидами или фунгицидами, также может быть значительно уменьшен или полностью устранен.

В результате может быть значительно расширена область применения обычных пестицидов.

Если средства согласно изобретению содержат пестициды, такие средства после соответствующего разбавления наносят либо непосредственно на обрабатываемую площадь, на уже проросшие вредные и/или полезные растения, либо на уже возшедшие вредные и/или полезные растения.

Если средства согласно изобретению не содержат пестицидов, данные средства можно использовать в так называемом процессе баковой смеси, т.е. непосредственно перед нанесением на обрабатываемый участок пользователь смешивает и разбавляет отдельно приготовленные продукты (= средство защиты растений и пестицид) или перед применением пестицида, или после применения пестицида, или для предварительной обработки семян, т.е. например, для протравливания семян сельскохозяйственных культур.

Предпочтительным является своевременное применение антидота вместе с пестицидом, особенно в случаях, когда антидот наносят на растения после гербицида.

Благоприятные эффекты от применения соединения общей формулы (I) наблюдаются в случаях, когда их используют вместе с пестицидами в предвсходовый или послевсходовый период, например, при одновременном применении в виде баковой смеси или в виде совместной рецептуры, либо параллельно или последовательно в рамках отдельного применения (сплит-

применение). Также есть возможность неоднократного нанесения соединения. Иногда имеет смысл комбинировать нанесение в предвсходовый или послевсходовый период. Обычно рекомендуется послевсходовое применение на полезных или сельскохозяйственных растениях с одновременным или более поздним нанесением пестицида. Также возможно применение соединений (I) согласно изобретению для протравливания семян, обработки (погружением) рассады (например, риса) или обработки другого материала для размножения (например, клубней картофеля).

При использовании соединений общей формулы (I) в сочетании с гербицидами, кроме антидота, часто наблюдается усиление гербицидного воздействия на вредные растения. Кроме того, во многих случаях улучшается рост полезных и культурных растений и повышается урожайность сельскохозяйственных культур.

Соединения по изобретению могут включать в себя один или более пестицидов. В качестве пестицидов выступают, например, гербициды, инсектициды, фунгициды, акарициды и нематоциды, каждый из которых может привести к фитотоксичному повреждению культурных растений, если используется отдельно или там, где есть вероятность причинения вреда.

Особый интерес представляют соответствующие пестицидные активные ингредиенты из групп гербицидов, инсектицидов, акарицидов, нематоцидов и фунгицидов, в частности, гербициды.

Массовое соотношение антидота (общей формулы (I)) и пестицида может варьироваться в широких пределах и обычно находится в диапазоне от 1:100 до 100:1, предпочтительно от 1:20 до 20:1, в частности, от 1:10 до 10:1. Оптимальное массовое соотношение антидота и пестицида обычно зависит как от конкретного используемого антидота и конкретного пестицида, так и от типа защищаемого полезного или сельскохозяйственного растения. Необходимое количество антидота может варьироваться в широких пределах в зависимости от используемого пестицида и типа защищаемого полезного растения и обычно находится в диапазоне 0,001 - 10 кг, предпочтительно 0,01 - 1 кг, в частности, 0,01 - 0,2 кг антидота на гектар. Количество и массовое соотношение, необходимое для

успешной обработки, можно определить с помощью простых предварительных тестов.

В случае протравливания семян, используется, например, 0,005 - 20 г антидота (общей формулы (I)) на килограмм семенного материала, предпочтительно 0,01 - 10 г антидота на килограмм семенного материала, в частности, 0,05 - 5 г антидота на килограмм семенного материала.

Если растворы антидота (общей формулы (I)) используют для обработки семян, семенного материала, либо ростки смачиваются растворами, подходящая концентрация обычно находится в диапазоне 1 - 10000 ч./млн., предпочтительно 100 - 1000 ч./млн. относительно массы.

Количество и массовое соотношение, необходимое для успешной обработки, можно определить с помощью простых предварительных тестов.

Антидот общей формулы (I) обычно наносят отдельно или вместе с пестицидами.

Таким образом, предметом изобретения также является урожай или соединения для защиты культурных растений.

Предпочтительным является совместное использование антидота и пестицида, в частности, использование антидота и гербицида в виде готовой к применению препаративной формы или использование метода баковой смеси.

Также предпочтительным является использование антидота общей формулы (I) при обработке семян с последующим применением пестицидов, предпочтительно гербицидов, после посева в предвсходовом или послевсходовом периоде.

Соединения общей формулы (I) или их соли могут применяться как таковые или в виде их составов (препаративных форм) в сочетании с другими пестицидно-активными веществами, такими как инсектициды, акарициды, нематоциды, гербициды, фунгициды, антидоты, удобрения и/или регуляторы роста, например, в виде готовых препаративных форм или баковых смесей. Комбинированные препаративные формы получают на основе вышеуказанных препаративных форм с учетом физических свойств и стабильности комбинируемых активных ингредиентов.



В качестве веществ, которые сочетаются с соединением общей формулы (I) в смешанных препаративных формах или баковых смесях используют, например, известные активные ингредиенты, действие которых основано на ингибировании, например, ацетолактатсинтаза, ацетил-КоА-карбоксилаза, целлюлозосинтаза, энолпирувилшкимаат-3-фосфатсинтаза, глутаминсинтетаза, р-гидроксифенилпируватдиоксигеназа, фитоендесатураза, фотосистема I, фотосистема II или протопорфириногенаоксидаза, как, например, указано в работе Weed Research 26 (1986) 441-445 или "The Pesticide Manual", 16-ое издание, The British Crop Protection Council и Royal Soc. of Chemistry, а также в указанных в них источниках литературы. Известные гербициды или регуляторы роста растений, которые можно комбинировать с соединениями по изобретению, приведены ниже в качестве примера, при этом указанные активные ингредиенты идентифицируются либо на основе "общепринятого наименования" в англоязычном варианте согласно Международной организации по стандартизации (ISO) либо на основе химического наименования, либо по коду. Во всех случаях сюда относятся любые формы применения, такие как, например, кислоты, соли, сложные эфиры, а также все изомерные формы, такие как стереоизомеры и оптические изомеры, даже если они не указаны прямо.

Примерами таких 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, аминопиралид, амитрол, сульфамат аммония, анилофос, асулам, атразин, азафенидин, азимсульфурон, бифлутамид, беназолин, беназолин-этил, бенфлуралин, бенфурезат, бенсульфурон, бенсульфурон-метил, бенсулид, бентазон, бензобициклон, бензофенап, биклопирон, бифенокс, биланафос, биланафос-натрий, биспирибак, биспирибак-натрий, бромацил, бромбутид, бромфеноксим, бромксинил, бромксинилбутират, калия, -гептаноат и -октаноат, бутоксинон, бутахлор, бутафенацил, бутамифос, бутенахлор, бутралин, бутрооксидим, бутилат, кафенстрол, карбетамид, карфентразон, карфентразон-этил, хлорамбен, хлорбромурон, хлорфенак, хлорфенак-натрий, хлорфенпроп, хлорфлуренол,

хлорфлуренол-метил, хлоридазон, хлоримурон, хлоримурон-этил, хлорофталим, хлортолурун, хлортал-диметил, хлорсульфурон, цинидон, с инидон -этил, цинметилин, циноссульфурон, клацифос, клетодим, клодинафоп, клодинафоп-пропаргил, кломазон, кломепроп, клопиралид, клорансулам, клорансулам-метил, кумилурон, цианамид, цианазин, циклоат, циклопириморат, циклосульфамурон, циклоксидим, цигалофоп, цигалофоп-бутил, ципразин, 2,4-D, 2,4-D-бутил, -бутил, -диметиламмоний, -диоламин, -этил, 2-этилгексил, -изобутил, -изооктил, -изопропиламмоний, -калий, -триизопропаноламмоний и -троламин, 2,4-DB, 2,4-DB-бутил, -диметиламмоний, изооктил, -калий и -натрий, даймурон (димрон), далапон, дазамет, н-деканол, десмедифам, детозил-пиразолат (ДТП), дикамба, дихлобенил, 2-(2,4-дихлорбензил)-4,4-диметил-1,2-оксазолидин-3-он, 2-(2,5-дихлорбензил)-4,4-диметил-1,2-оксазолидин-3- один, дихлорпроп, дихлорпроп-Р, диклофоп, диклофоп-метил, диклофоп-Р-метил, диклосулам, дифензокват, дифлуфеникан, дифлуфензопир, дифлуфензопир-натрий, димефурон, димепиперат, диметахлор, диметаметрин, диметенамид, диметенамид-Р, диметрасульфурон, динитрамин, динотерб, дифенамид, дикват, дикват-дибромид, дитиопир, диурон, динитро-о-крезол, эндотал, этил-N, N-ди-н-пропилтиокарбамат, эспрокарб, эталфлуралин, этаметсульфурон, этаметсульфурон-метил, этиозин, этофумезат, этоксифен, этоксифен-этил, этоксисульфурон, этобензанид, F-9600, F-5231, т.е. N-[2-хлор-4-фтор-5-[4-(3-фторпропил)-4,5-дигидро-5-оксо-1Н-тетразол-1-ил]-фенил]этансульфонамид, F-7967, т.е. 3-[7-хлор-5-фтор-2-(трифторметил)-1Н-бензимидазол-4-ил]-1-метил-6-(трифторметил)пиримидин-2,4(1Н,3Н)-дион, феноксапроп, феноксапроп-Р, феноксапроп-этил, феноксапроп-Р-этил, феноксасульфон, фенхинотрион, фентразамид, флампроп, флампроп-М-изопропил, флампроп-М-метил, флазасульфурон, флорасулам, флуазифоп, флуазифоп-Р, флуазифоп-бутил, флуазифоп- Р-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, флупирсульфурон, флупирсульфурон-метил-натрий, флуридон, флуорохлоридон, флуорокспир, флуорокспир-метил, флуртамон, флутиацет, флутиацет-метил, фомесафен, фомесафен-натрий, форамсульфурон, фозамин, глюфосинат, глюфосинат-аммоний, глюфосинат-Р-натрий, глюфосинат-Р-аммоний, глюфосинат-Р-натрий,

глифосат, глифосат-аммоний, -изопропиламмоний, -диаммоний, -диметил-аммоний, -калий, -натрий и -тримезий, Н- 9201, т.е. О-(2,4-диметил-6-нитрофенил)-О-этилизопропилфосфорамидотиоат, галауоксифен, галоксифен-метил, галосафен, галосульфурон, галосульфурон-метил, галоксифоп, галоксифоп-Р, галоксифоп-этоксиэтил, галоксифоп-Р-этоксиэтил, галоксифоп-метил, галоксифоп-Р-метил, гексазинос, НW-02, т.е. 1-(диметоксофосфорил)-этил-(2,4-дихлорфеноксид)ацетат, мазаметабенз, имазаметабенз-метил, имазамокс, имазамокс-аммоний, имазапик, имазапик-аммоний, имазапир, имазапир-изопропиламмоний, имазахин, имазахин-аммоний, имазетапир, имазетапир-иммоний, имазосульфурон, инданофан, индазифлам, йодосульфурон, йодосульфурон-метил-натрий, иоксинил, иоксинил-октаноат, -калия и натрия, ипфенкарбазон, изопротурон, изоурон, изоксабен, изоксафлутол, карбутилат, КУН-043, т.е. 3-([5-(дифторметил)-1-метил-3-(трифторметил)-1Н-пиразол-4-ил]метил)сульфонил)-5,5-диметил-4,5-дигидро-1,2-оксазол, кетоспирадокс, лактофен, ленацил, линурон, МЦПА, МЦПА-бутотил, -диметиламмоний, -2-этилгексил, -изопропиламмоний, -калий и -натрий, МЦПБ, МЦПБ-метил, -этил и -натрий, мекопроп, мекопроп-натрий, и -бутотил, мекопроп-Р, мекопроп-Р-бутотил, -диметиламмоний, -2-этилгексил и -калий, мефенацет, мефлюидид, мезосульфурон, мезосульфурон-метил, мезотрион, метабензтиазурон, метам, метамифоп, метамитрон, метазахлор, метазосульфурон, метабензтиазурон, метиопирсульфурон, метиозолин, метил изотиоцианат, метобромурон, метолахлор, S-метолахлор, метосулам, метоксурон, метрибузин, метсульфурон, метсульфурон-метил, молинат, монолинурон, моноссульфурон, моноссульфуриновый эфир, МТ-5950, т.е. N-[3-хлор-4-(1-метилэтил)фенил]-2-метилпентанамид, NGGC-011, напропамид, NC-310, т.е. 4-(2,4-дихлорбензоил)-1-метил-5-бензилоксипиразол, небурон, никосульфурон, нонановая кислота (пеларгоновая кислота), норфлуразон, олеиновая кислота (жирные кислоты), орбенкарб, ортосульфамурон, оризалин, оксадиаргил, оксадиазон, оксасульфурон, оксацикломефон, оксифлуорфен, паракват, дихлорид параквата, пебулят, пендиметалин, пенокосулам, пентахлорфенол, пентоксазон, петоксамид, нефтяные масла, фенмедифам, пиклорам, пиколинафен, пиноксаден, пиперофос, претилахлор, примисульфурон, примисульфурон-метил, продиамин, профоксидим, прометон, прометрин, пропахлор, пропанил, пропаквизафоп, пропазин, профам, проихлор, пропоксикарбазон, пропоксикарбазон-натрий, пропирисульфурон, пропизамид, просульфокарб, просульфурон, пираклонил, пирафлуфен, пирафлуфен-этил,



Примерами возможных партнеров для смешивания для регуляторов роста растений являются:

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

В случае использования в качестве препаративных форм активных ингредиентов или совместных препаративных форм они, как правило, содержат клеящие вещества, смачивающие, диспергирующие, эмульгирующие, проникающие, консервирующие вещества, средства против замерзания и растворители, наполнители, носители и красители, пеногасители, ингибиторы испарения, а также агенты, влияющие на показатель pH и вязкость.

Соединения общей формулы (I) и их комбинации с одним или более указанными пестицидами могут быть составлены по-разному в зависимости от заданных химико-физических и биологических параметров. В качестве типов препаративных форм могут использоваться:

- Эмульгируемые концентраты, которые получают растворением активных ингредиентов в органическом растворителе, например, бутаноле, циклогексаноне, диметилформамиде, ксилоле или более высококипящих углеводородах, либо смесях органических растворителей с добавлением одного или более поверхностно-активных веществ ионогенного и/или неионогенного типа (эмульгаторы).

Подходящими эмульгаторами являются, например, соли кальция и алкиларилсульфоновой кислоты, полигликолевые эфиры жирных кислот, алкиларилполигликолевый эфир, полигликолевый эфир жирных спиртов, продукты конденсации пропиленоксид-этиленоксида, алкилполиэфир, сорбитановые сложные эфиры и полиоксиэтиленсорбитановые сложные эфиры жирных кислот:

- пылевидные препараты, полученные путем размола активных ингредиентов с тонкоизмельченными твердыми неорганическими или органическими веществами, например, тальком, природными глинами, такими как каолин, бентонит и пиррофиллит, диатомовая земля или мука.
- суспензионные концентраты на основе воды или масла, которые могут быть получены, например, мокрым помолом с использованием бисерных мельниц;
- водорастворимый порошок;
- водорастворимые концентраты;
- грануляты, такие как водорастворимые грануляты, диспергируемые в воде грануляты и грануляты для посыпания и внесения в почву;
- смачивающиеся порошки, которые помимо активного вещества также содержат разбавители или инертные вещества и ПАВ;
- капсульные суспензии и микрокапсулы;
- препаративные формы, наносимые в сверхмалых количествах.

Вышеупомянутые типы препаративных форм известны специалисту в данной области и описаны, например, в: K. Martens, "Spray Drying Handbook", 3-е Изд., G. Goodwin Ltd., Лондон. 1979; W. van Valkenburg, "Pesticide Formulations", Marcel Dekker, Нью-Йорк 1973; Winacker-Küchler, "Chemische Technologie", том 7, C. Hanser Verlag Мюнхен, 4. издание 1986; "Perry's Chemical Engineer's Handbook", 5-ое Изд., McGraw-Hill, Нью-Йорк 1973, стр. 8-57.

Необходимые вспомогательные средства для препаративных форм, такие как инертные материалы, поверхностно-активные вещества, растворители и другие добавки, также известны и описаны, например, в: McCutcheon's "Detergents and Emulsifiers Annual", MC Publ. Corp., Ridgewood N.J.; C. Marsden, "Solvents Guide", 2-ое Изд., Interscience, Нью-Йорк 1963; H. von Olphen, "Introduction to Clay Colloid Chemistry", 2-ое Изд., J. Wiley & Sons, N.Y.; Schönfeldt, "Grenzflächenaktive

Äthylenoxidaddukte", Wiss. Verlagsgesellschaft, Штуттгарт 1976; Sisley and Wood, "Encyclopedia of Surface Active Agents", Chem. Publ. Co. Inc., Нью-Йорк 1964; Watkins, "Handbook of Insecticide Dust Diluents and Carriers", 2ое Изд., Darland Books, Caldwell N.J.; Winnacker-Küchler, "Chemische Technologie", том 7, C. Hanser Verlag Мюнхен, 4. издание 1986.

Помимо указанных выше вспомогательных средств для препаративных форм, средства для защиты сельскохозяйственных культур могут, при необходимости, содержать обычные адгезионные, смачивающие, диспергирующие, проникающие, эмульгирующие, консервирующие, незамерзающие средства, наполнители, носители и красители, противовспенивающие средства, ингибиторы испарения, а также средства, влияющие на pH или вязкость.

В зависимости от типа препаративной формы средства защиты сельскохозяйственных культур обычно содержат 0,1 - 99 мас.%, в частности, 0,2 - 95 мас.% одного или более антидотов общей формулы (I) или комбинацию антидота и пестицида. Кроме того, они содержат 1 - 99,9, в частности, 4 - 99,5 мас.% одной или более твердых или жидких добавок и 0 - 25, в частности, 0,1 - 25 мас.% поверхностно-активного вещества. В эмульгируемых концентратах концентрация активного ингредиента, т.е. концентрация антидота и/или пестицида, как правило, составляет 1 - 90, в частности, 5 - 80 мас.%. Пылеулавливающие агенты, как правило, содержат 1 - 30, предпочтительно 5 - 20 мас.% активного ингредиента. В смачивающихся порошках концентрация активного ингредиента, как правило, составляет 10 - 90 мас.%. В гранулах, диспергируемых в воде, содержание активного ингредиента составляет, например, 1 - 95 мас.%, предпочтительно 10 - 80 мас.%.

Для применения имеющиеся в продаже препаративные формы, при необходимости, разбавляют обычными способами, например, смачивающимися порошками, эмульгируемыми концентратами, дисперсиями и диспергируемыми в воде гранулами с помощью воды. Пылевидные препараты, гранулы, а также распыляемые растворы, как правило, больше не разбавляются с другими инертными веществами перед применением. В зависимости от внешних условий, таких как температура, влажность, тип используемого гербицида и т.д., варьируется требуемая норма расхода антидота общей формулы (I).

В приведенных ниже примерах, которые объясняют изобретение, но не ограничивают его, количественные характеристики относятся к массе, если не определено более подробно.

## ПРИМЕРЫ

### 1. Примеры препаративных форм

#### 1.1 Пылевидные препараты

Пылевидные препараты получают путем смешивания 10 массовых частей соединения общей формулы (I) (антидот) или смеси активных ингредиентов пестицида (например, гербицида) и антидота общей формулы (I) и 90 массовых частей талька в качестве инертного вещества и измельчения в бичевой мельнице.

#### 1.2 Вододиспергируемый порошок

Вододиспергируемый смачивающийся порошок получают добавлением 25 массовых частей соединения общей формулы (I) или смеси действующих веществ пестицида (например, гербицида) и антидота общей формулы (I), 64 массовых части каолинсодержащего кварца в качестве инертного вещества, 10 массовых частей лигносульфоната калия и 1 массовой части олеилметилтауриновой кислоты смешивают в качестве смачивающего и диспергирующего агента и измельчают в штифтовой мельнице.

#### 1.3 Вододиспергируемый концентрат

Диспергируемый концентрат, который легко диспергируется в воде, получают посредством смешивания 20 массовых частей соединения общей формулы (I) или смеси действующих веществ пестицида (например, гербицида) и антидота формулы (I) с 6 массовыми частями алкилфенолполигликолевого эфира (®Triton X 207), 3 массовыми частями изотридеканолполигликолевого эфира и 71 массовой частью парафинового минерального масла и измельчают в шаровой мельнице до крупности менее 5 микрон.

#### 1.4 Эмульгируемый концентрат

Эмульгируемый концентрат получают из 15 массовых частей соединения общей формулы (I) или смеси действующих веществ пестицида (например, гербицида) и антидота общей формулы (I), 75 массовых частей циклогексанона в качестве растворителя и 10 массовых частей оксиэтилированного нонилфенола в качестве эмульгатора.



### 1.5 Вододиспергируемый гранулят

Вододиспергируемый гранулят получают смешивания 75 массовых частей антидота общей формулы (I) или смеси пестицида и антидота общей формулы (I),

10	"	лигносульфоната кальция,
5	"	лаурилсульфата натрия,
3	"	поливинилового спирта и
7	"	поливинилового спирта и
7	"	каолина,

измельчения в штифтовой мельнице и гранулирования порошка в псевдооживленном слое путем распыления воды в качестве гранулирующей жидкости.

Вододиспергируемый гранулят также получают путем гомогенизации и измельчения 25 массовых частей антидота общей формулы (I) или смеси пестицида и антидота общей формулы (I),

5	"	2,2'-динафтилметан-6,6'-дисульфат-кислого натрия,
2	"	олеоилметилтаурин-кислого натрия,
17	"	карбоната кальция,
50	"	воды и
1		массовой части поливинилового спирта

в коллоидной мельнице, последующего измельчения в бисерной мельнице и распыления и высушивания полученной суспензии в башне для распылительной сушки с помощью однокомпонентной форсунки.

## 2. Биологические примеры:

2.1 Относительное действие выбранных соединений по изобретению на примере снижения вредного воздействия мезосульфурон-метила в случае с яровым ячменем (HORVS)

Семена обрабатываемых культур помещали в супесчаную почву в пластиковых горшках (диаметр ~4 см), засыпали почвой и выращивали в теплице при хороших условиях для прорастания и роста. Тестовые растения обрабатывали на стадии раннего листа (ВВСН10 – ВВСН12). При этом соединения общей формулы (I) согласно изобретению, приготовленные в виде смачивающихся порошков (СП), использовали в виде водной суспензии с нормой расхода воды на уровне 800 л/га с добавлением смачивающих агентов (например, 0,2% Genapol-

LRO или 0,2% Мего) и распылением в указанной дозировке на надземные части растений.

После этого выполняли нанесение гербицида. Для этого мезосульфурон-метил в виде композиции вододиспергируемого гранулята (ВГ) использовали в качестве водной дисперсии с нормой расхода воды на уровне 800 л/га с добавлением смачивающего агента (например, 0,2% Genapol-LRO или 1 л/га Вiорower) с нанесением на надземные части растений в дозировке 40 - 60 г/га. Дозировку гербицида подбирали таким образом, чтобы на момент оценки он обеспечивал умеренное, визуально четко различимое повреждение (минимум 30%, максимум 75%) контрольной группы культур без обработки антидотом по сравнению с необработанными культурами.

После применения растения выращивали в теплице при хороших условиях роста. Через 9-13 дней после нанесения визуально оценивали эффективность испытуемых соединений. Для этой цели внешний вид растений, обработанных тестируемым соединением и гербицидом, сравнивали с соответствующими контрольными гербицидами (без антидота; с четко распознаваемыми повреждениями) и необработанными контрольными растениями (без повреждений). Эффект снижения вредного воздействия испытываемых соединений оценивали в графе "коды эффективности" в соответствии с градацией по следующей схеме:

0: снижение вредного воздействия отсутствует (внешний вид соответствует контрольному растению, обработанному гербицидом)

1: незначительное снижение вредного воздействия

2: заметное снижение вредного воздействия

3: значительное снижение вредного воздействия

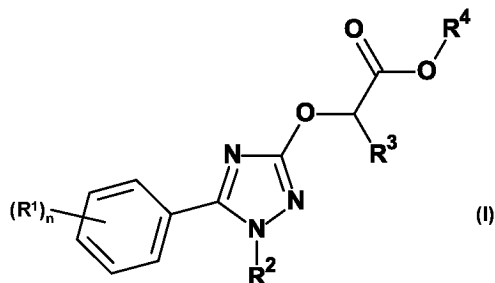
4: полное снижение вредного воздействия (внешний вид соответствует необработанному контрольному растению)

Испытания показывают явную эффективность соединений по изобретению, выбранных в качестве примера, в части снижения вредного воздействия на посеvy ярового ячменя (HORVS; сорт Montoya), обусловленного гербицидом мезосульфурон-метилом:

Пример №	Дозировка антидота формулы (I) (г/га)	Культурное растение	Эффективность антидота (Код эффективности)
I.40-11	500	HORVS	2
I.40-10	500	HORVS	2-3
I.40-10	100	HORVS	2
I.46-10	500	HORVS	2
I.46-10	100	HORVS	2
I.48-10	500	HORVS	2-3
I.48-10	100	HORVS	2

## Формула изобретения

1. Соединения общей формулы (I) или их соли



в которой

- $R^1$  означает водород, галоген, циано, нитро,  $(C_1-C_6)$ алкил,  $(C_2-C_6)$ алкенил,  $(C_2-C_6)$ алкинил,  $(C_3-C_8)$ циклоалкил,  $(C_3-C_8)$ циклоалкенил,  $(C_1-C_6)$ алкокси и  $(C_1-C_6)$ алкилS(O)<sub>p</sub>, причем семь названных последними остатков являются незамещенными или замещены одним или более остатками из группы галогена, циано,  $(C_1-C_6)$ алкокси и  $(C_1-C_6)$ алкилаS(O)<sub>p</sub>,
- $R^2$  означает гетероарил, причем гетероарильный остаток является незамещенным или замещен галогеном, циано, нитро,  $(C_1-C_6)$ алкилом,  $(C_2-C_6)$ алкенилом,  $(C_2-C_6)$ алкинилом,  $(C_3-C_8)$ циклоалкилом,  $(C_3-C_8)$ циклоалкенилом,  $(C_1-C_6)$ алкокси и  $(C_1-C_6)$ алкиломS(O)<sub>p</sub>, причем семь названных последними остатков являются незамещенными или замещены одним или более остатками из группы галогена, циано,  $(C_1-C_6)$ алкокси и  $(C_1-C_6)$ алкилаS(O)<sub>p</sub>,
- $R^3$  означает водород и  $(C_1-C_6)$ алкил,
- $R^4$  означает водород,  $(C_1-C_{18})$ алкил,  $(C_1-C_{18})$ галоалкил,  $(C_1-C_{18})$ цианоалкил,  $(C_2-C_{18})$ алкенил,  $(C_2-C_{18})$ алкинил,  $(C_3-C_{12})$ циклоалкил,  $(C_3-C_{12})$ циклоалкенил, арил, гетероарил,  $(C_1-C_{18})$ алкокси- $(C_1-C_{18})$ алкил,  $(C_1-C_{18})$ галоалкокси- $(C_1-C_{18})$ алкил,  $(C_1-C_{18})$ алкокси- $(C_1-C_{18})$ галоалкил,  $(C_1-C_{18})$ алкилтио- $(C_1-C_{18})$ алкил,  $(C_1-C_{18})$ галоалкилтио- $(C_1-C_{18})$ алкил,  $(C_2-C_{18})$ галоалкенил,  $(C_2-C_{18})$ галоалкинил, гетероциклил- $(C_1-C_{18})$ алкил, арил- $(C_1-C_{18})$ алкил,  $(C_3-C_{12})$ циклоалкил- $(C_1-C_{18})$ алкил,  $(C_1-C_{18})$ алкокси-

карбонил-(C<sub>1</sub>-C<sub>18</sub>)алкил, и (C<sub>1</sub>-C<sub>18</sub>)алкоксикарбонил-(C<sub>3</sub>-C<sub>12</sub>)цикло-  
алкил-(C<sub>1</sub>-C<sub>18</sub>)алкил, или

остаток формулы -NR<sup>a</sup>R<sup>b</sup> или -N=CR<sup>c</sup>R<sup>d</sup>,

причем в вышеупомянутых 2 остатках каждый из остатков R<sup>a</sup>, R<sup>b</sup>, R<sup>c</sup> и R<sup>d</sup> независимо друг от друга означает 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, бензил, замещенный бензил, фенил или замещенный фенил, или R<sup>a</sup> и R<sup>b</sup> вместе с атомом N могут образовывать 3-8-членный гетероцикл, который может содержать один или два дополнительных гетероциклических атома из группы N, O и S, однако не в случае 3-4-членного гетероцикла, и который является незамещенным или замещен одним или более остатками из группы (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)алкила и (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)галоалкила,

или R<sup>c</sup> и R<sup>d</sup> вместе с атомом C означают 3-8-членный карбоциклический или гетероциклический остаток, который может содержать 1 - 3 гетероциклических атома из группы N, O и S, причем карбоциклический или гетероциклический остаток является незамещенным или замещен одним или более остатками из группы (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)алкила и (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)галоалкила,

n означает число от 0 до 5,

и

p означает 0, 1 или 2.

2. Соединения общей формулы (I) по п. 1 или их соли,

в которой

R<sup>1</sup> означает водород, галоген, циано, нитро, (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>3</sub>-C<sub>6</sub>)циклоалкил, (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)циклоалкенил, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)алкокси и (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)алкилS(O)<sub>p</sub>, причем упомянутые последними семь остатков являются незамещенными или замещены одним или более остатками из группы галогена, циано, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)алкокси и (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)алкилаS(O)<sub>p</sub>,

R<sup>2</sup> означает гетероарил, причем гетероарильный остаток является незамещенным или замещен галогеном, циано, нитро, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)алкилом,

(C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)алкенилом, (C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>)алкинилом, (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)циклоалкилом, (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)циклоалкенилом, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)алкокси и (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)алкиломS(O)<sub>p</sub>, причем упомянутые последними семь остатков являются незамещенными или замещены одним или более остатками из группы галогена, циано, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)алкокси и (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)алкилаS(O)<sub>p</sub>,

R<sup>3</sup> означает водород и (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)алкил,

R<sup>4</sup> означает водород, (C<sub>1</sub>-C<sub>16</sub>)алкил, (C<sub>1</sub>-C<sub>16</sub>)галоалкил, (C<sub>1</sub>-C<sub>16</sub>)цианоалкил, (C<sub>2</sub>-C<sub>16</sub>)алкенил, (C<sub>2</sub>-C<sub>16</sub>)алкинил, (C<sub>3</sub>-C<sub>12</sub>)циклоалкил, (C<sub>3</sub>-C<sub>12</sub>)циклоалкенил, арил, гетероарил, (C<sub>1</sub>-C<sub>16</sub>)алкокси-(C<sub>1</sub>-C<sub>16</sub>)алкил, (C<sub>1</sub>-C<sub>16</sub>)галоалкокси-(C<sub>1</sub>-C<sub>16</sub>)алкил, (C<sub>1</sub>-C<sub>16</sub>)алкокси-(C<sub>1</sub>-C<sub>16</sub>)галоалкил, (C<sub>1</sub>-C<sub>16</sub>)алкилтио-(C<sub>1</sub>-C<sub>16</sub>)алкил, (C<sub>1</sub>-C<sub>16</sub>)галоалкилтио-(C<sub>1</sub>-C<sub>16</sub>)алкил, (C<sub>2</sub>-C<sub>16</sub>)галоалкенил, (C<sub>2</sub>-C<sub>16</sub>)галоалкинил, гетероцикл-ил-(C<sub>1</sub>-C<sub>16</sub>)алкил, арил-(C<sub>1</sub>-C<sub>16</sub>)алкил, (C<sub>3</sub>-C<sub>12</sub>)циклоалкил-(C<sub>1</sub>-C<sub>16</sub>)алкил, (C<sub>1</sub>-C<sub>16</sub>)алкоксикарбонил-(C<sub>1</sub>-C<sub>16</sub>)алкил, и (C<sub>1</sub>-C<sub>16</sub>)алкоксикарбонил-(C<sub>3</sub>-C<sub>12</sub>)циклоалкил-(C<sub>1</sub>-C<sub>16</sub>)алкил,

n означает число от 0 до 4,

и

p означает 0, 1 или 2.

3. Соединения общей формулы (I) по п. 1 или их соли,

в которой

R<sup>1</sup> означает водород, галоген, циано, метил, этил, CF<sub>3</sub>, CF<sub>2</sub>Cl, CH<sub>2</sub>F, CHF<sub>2</sub>, OCH<sub>3</sub>, OCF<sub>3</sub>, SCH<sub>3</sub>, SOCH<sub>3</sub>, SO<sub>2</sub>CH<sub>3</sub> и SCF<sub>3</sub>,

R<sup>2</sup> означает гетероарил, причем гетероарильный остаток является незамещенным или замещен один или несколько раз галогеном, циано, метилом, этилом, CF<sub>3</sub>, CF<sub>2</sub>Cl, CH<sub>2</sub>F, CHF<sub>2</sub>, OCH<sub>3</sub>, OCF<sub>3</sub>, SCH<sub>3</sub>, SOCH<sub>3</sub>, SO<sub>2</sub>CH<sub>3</sub> и SCF<sub>3</sub>,

R<sup>3</sup> означает водород, CH<sub>2</sub>CH<sub>3</sub> и CH<sub>3</sub>,

R<sup>4</sup> означает водород, (C<sub>1</sub>-C<sub>12</sub>)алкил, (C<sub>1</sub>-C<sub>12</sub>)галоалкил, (C<sub>1</sub>-C<sub>12</sub>)цианоалкил, (C<sub>2</sub>-C<sub>12</sub>)алкенил, (C<sub>2</sub>-C<sub>12</sub>)алкинил, (C<sub>3</sub>-C<sub>12</sub>)циклоалкил, (C<sub>3</sub>-C<sub>12</sub>)циклоалкенил, арил, гетероарил, (C<sub>1</sub>-C<sub>12</sub>)алкокси-(C<sub>1</sub>-C<sub>12</sub>)алкил,

(C<sub>1</sub>-C<sub>12</sub>)галоалкокси-(C<sub>1</sub>-C<sub>12</sub>)алкил, (C<sub>1</sub>-C<sub>12</sub>)алкокси-(C<sub>1</sub>-C<sub>12</sub>)галоалкил, (C<sub>1</sub>-C<sub>12</sub>)алкилтио-(C<sub>1</sub>-C<sub>12</sub>)алкил, (C<sub>1</sub>-C<sub>12</sub>)галоалкилтио-(C<sub>1</sub>-C<sub>12</sub>)алкил, (C<sub>2</sub>-C<sub>12</sub>)галоалкенил, (C<sub>2</sub>-C<sub>12</sub>)галоалкинил, гетероциклил-(C<sub>1</sub>-C<sub>12</sub>)алкил, арил-(C<sub>1</sub>-C<sub>12</sub>)алкил, (C<sub>3</sub>-C<sub>12</sub>)циклоалкил-(C<sub>1</sub>-C<sub>12</sub>)алкил, (C<sub>1</sub>-C<sub>12</sub>)алкоксикарбонил-(C<sub>1</sub>-C<sub>12</sub>)алкил, и (C<sub>1</sub>-C<sub>12</sub>)алкоксикарбонил-(C<sub>3</sub>-C<sub>12</sub>)циклоалкил-(C<sub>1</sub>-C<sub>12</sub>)алкил,

и

n означает 0, 1, 2 или 3.

4. Соединения общей формулы (I) по п. 1 или их соли,

в которой

R<sup>1</sup> означает водород, фтор, хлор, бром, йод, CN, метил, CF<sub>3</sub>, CF<sub>2</sub>Cl, CH<sub>2</sub>F, CHF<sub>2</sub>, OCH<sub>3</sub>, OCF<sub>3</sub>, SCH<sub>3</sub>, SOCH<sub>3</sub>, SO<sub>2</sub>CH<sub>3</sub> и SCF<sub>3</sub>,

R<sup>2</sup> означает пиридин-2-ил, пиридин-3-ил, пиридин-4-ил, пиазин-2-ил, пиазин-3-ил, пиримидин-2-ил, пиримидин-4-ил, пиримидин-5-ил, пиридазин-3-ил, пиридазин-4-ил, 1,3,5-триазин-2-ил, 1,2,4-триазин-3-ил, 1,2,4-триазин-5-ил, 1,2,4-триазин-6-ил, 1,2,3-триазин-4-ил, 1,2,3-триазин-5-ил, 1,2,4-, 1,3,2-, 1,3,6- и 1,2,6-оксазинил, изоксазол-3-ил, изоксазол-4-ил, изоксазол-5-ил, 1,3-оксазол-2-ил, 1,3-оксазол-4-ил, 1,3-оксазол-5-ил, изотиазол-3-ил, изотиазол-4-ил, изотиазол-5-ил, 1,3-тиазол-2-ил, 1,3-тиазол-4-ил, 1,3-тиазол-5-ил, 1Н-пиррол-1-ил; 1Н-пиррол-2-ил; 1Н-пиррол-3-ил, фуран-2-ил; фуран-3-ил, тиен-2-ил, тиен-3-ил, 1Н-имидазол-1-ил, 1Н-имидазол-2-ил, 1Н-имидазол-4-ил, 1Н-имидазол-5-ил, 1Н-пиразол-1-ил, 1Н-пиразол-3-ил, 1Н-пиразол-4-ил, 1Н-пиразол-5-ил, 1Н-1,2,3-триазол-1-ил, 1Н-1,2,3-триазол-4-ил, 1Н-1,2,3-триазол-5-ил, 2Н-1,2,3-триазол-2-ил, 2Н-1,2,3-триазол-4-ил, 1Н-1,2,4-триазол-1-ил, 1Н-1,2,4-триазол-5-ил, 4Н-1,2,4-триазол-3-ил, 1,2,4-оксадиазол-3-ил, 1,2,4-оксадиазол-5-ил, 1,3,4-оксадиазол-2-ил, 1,2,3-оксадиазол-4-ил, 1,2,3-оксадиазол-5-ил, 1,2,5-оксадиазол-3-ил, 1,3,4-тиадиазол-2-ил, 1,3,4-тиадиазол-2-ил, 1,2,4-тиадиазол-5-ил, 1,2,4-тиадиазол-3-ил, 1,2,5-тиадиазол-3-ил, 1,2,5-тиадиазол-3-ил, 1,2,3-тиадиазол-4-ил, 1,2,3-тиадиазол-3-ил, который является незамещенным или замещен один или более раз галогеном, циано,

метилом,  $\text{CF}_3$ ,  $\text{CF}_2\text{Cl}$ ,  $\text{CH}_2\text{F}$ ,  $\text{CHF}_2$ ,  $\text{OCH}_3$ ,  $\text{OCF}_3$ ,  $\text{SCH}_3$ ,  $\text{SOCH}_3$ ,  $\text{SO}_2\text{CH}_3$  и  $\text{SCF}_3$ ,

$\text{R}^3$  означает водород и  $\text{CH}_3$ ,

$\text{R}^4$  означает водород,  $(\text{C}_1\text{-C}_{10})$ алкил,  $(\text{C}_1\text{-C}_{10})$ галоалкил,  $(\text{C}_1\text{-C}_{10})$ цианоалкил,  $(\text{C}_2\text{-C}_{10})$ алкенил,  $(\text{C}_2\text{-C}_{10})$ алкинил,  $(\text{C}_3\text{-C}_9)$ циклоалкил,  $(\text{C}_3\text{-C}_9)$ циклоалкенил, арил, гетероарил,  $(\text{C}_1\text{-C}_{10})$ алкокси- $(\text{C}_1\text{-C}_{10})$ алкил,  $(\text{C}_1\text{-C}_{10})$ галоалкокси- $(\text{C}_1\text{-C}_{10})$ алкил,  $(\text{C}_1\text{-C}_{10})$ алкокси- $(\text{C}_1\text{-C}_{10})$ галоалкил,  $(\text{C}_1\text{-C}_{10})$ алкилтио- $(\text{C}_1\text{-C}_{10})$ алкил,  $(\text{C}_1\text{-C}_{10})$ галоалкилтио- $(\text{C}_1\text{-C}_{10})$ алкил,  $(\text{C}_2\text{-C}_{18})$ галоалкенил,  $(\text{C}_2\text{-C}_{18})$ галоалкинил, гетероцикл- $(\text{C}_1\text{-C}_{10})$ алкил, арил- $(\text{C}_1\text{-C}_{10})$ алкил,  $(\text{C}_3\text{-C}_9)$ циклоалкил- $(\text{C}_1\text{-C}_{10})$ алкил,  $(\text{C}_1\text{-C}_{10})$ алкоксикарбонил- $(\text{C}_1\text{-C}_{10})$ алкил и  $(\text{C}_1\text{-C}_{10})$ алкоксикарбонил- $(\text{C}_3\text{-C}_9)$ циклоалкил- $(\text{C}_1\text{-C}_{10})$ алкил,

и

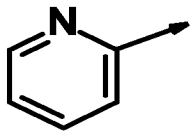
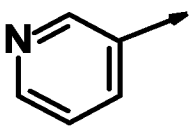
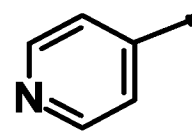
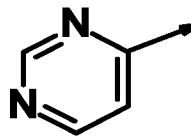
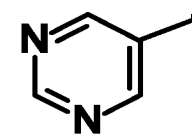
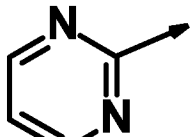
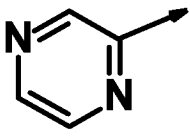
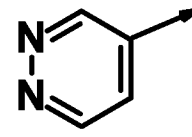
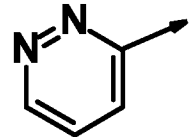
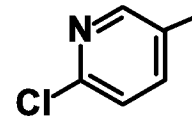
$n$  означает 0, 1, 2 или 3.

5. Соединения общей формулы (I) по п. 1 или их соли,

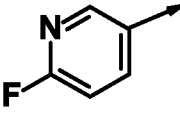
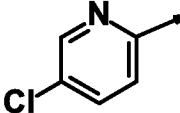
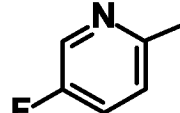
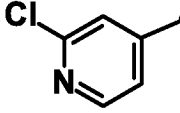
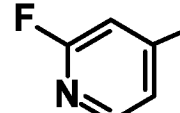
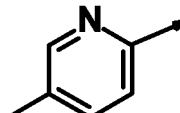
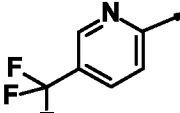
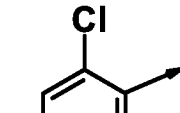
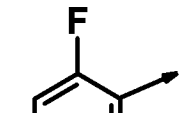
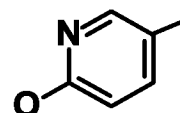
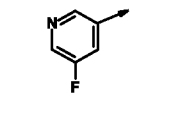
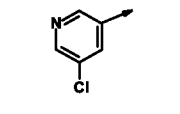
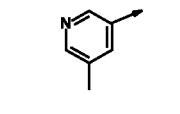
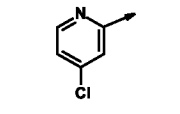
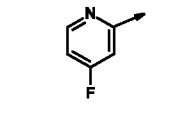
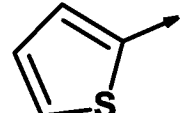
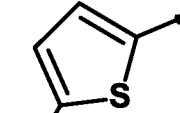
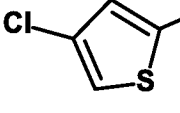
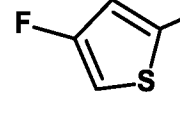
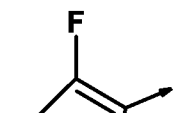
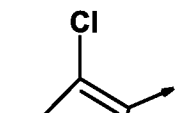
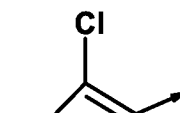
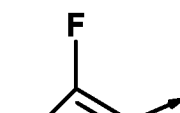
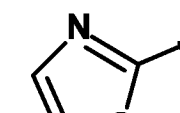
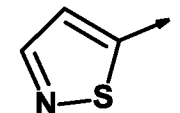
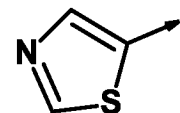
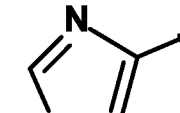
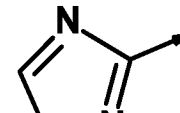
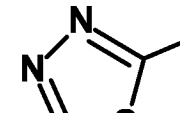
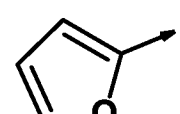
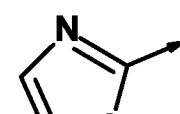
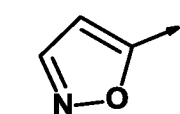
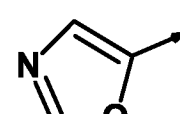
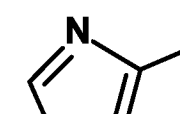
в которой

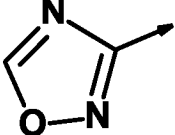
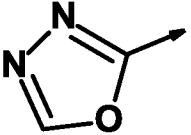
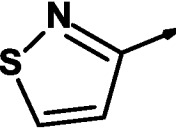
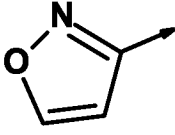
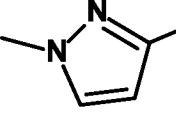
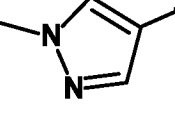
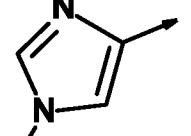
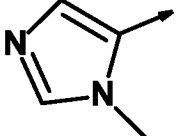
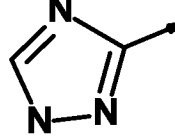
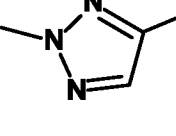
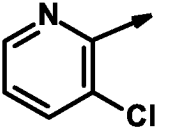
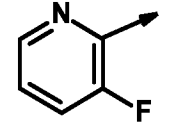
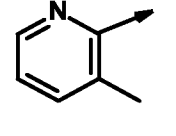
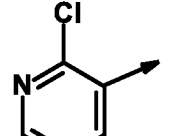
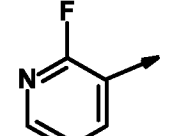
$\text{R}^1$  означает водород, фтор, хлор, бром, йод, циано, метил,  $\text{CF}_3$ ,  $\text{CH}_2\text{F}$ ,  $\text{CHF}_2$ ,  $\text{OCH}_3$ ,  $\text{OCF}_3$ ,  $\text{SCH}_3$ ,  $\text{SOCH}_3$ ,  $\text{SO}_2\text{CH}_3$  и  $\text{SCF}_3$ ,

$\text{R}^2$  означает группы Q-2.1 – Q-2.60

				
Q-2.1	Q-2.2	Q-2.3	Q-2.4	Q-2.5
				
Q-2.6	Q-2.7	Q-2.8	Q-2.9	Q-2.10



				
Q-2.11	Q-2.12	Q-2.13	Q-2.14	Q-2.15
				
Q-2.16	Q-2.17	Q-2.18	Q-2.19	Q-2.20
				
Q-2.21	Q-2.22	Q-2.23	Q-2.24	Q-2.25
				
Q-2.26	Q-2.27	Q-2.28	Q-2.29	Q-2.30
				
Q-2.31	Q-2.32	Q-2.33	Q-2.34	Q-2.35
				
Q-2.36	Q-2.37	Q-2.38	Q-2.39	Q-2.40
				
Q-2.41	Q-2.42	Q-2.43	Q-2.44	Q-2.45

				
Q-2.46	Q-2.47	Q-2.48	Q-2.49	Q-2.50
				
Q-2.51	Q-2.52	Q-2.53	Q-2.54	Q-2.55
				
Q-2.56	Q-2.57	Q-2.58	Q-2.59	Q-2.60

R<sup>3</sup> означает водород,

R<sup>4</sup> означает водород, метил, этил, н-пропил, изопропил, н-бутил, н-пентил, фенил, бензил, CH<sub>2</sub>(4-Cl-Ph), CH<sub>2</sub>(4-F-Ph), CH<sub>2</sub>(4-MeO-Ph), 2-метоксиэтил, тетрагидрофуран-2-ил-метил, тетрагидрофуран-3-ил-метил, тетрагидропиран-2-ил-метил, тетрагидропиран-3-ил-метил, тетрагидропиран-4-ил-метил, метилпропионат-3-ил, этилпропионат-3-ил, метилацетат-2-ил, этилацетат-2-ил, метилпивалат-2-ил, этилпивалат-3-ил, метил-2-метилпропаноат-3-ил, метил-2,2-диметилпропаноат-3-ил, этил-2-метилпропаноат-3-ил, метил-2-пропаноат-2-ил, этил-2-пропаноат-2-ил, метил-асет-2-ил, этил-ацетат-2-ил, метил-1-метилциклопропанкарбоксилат-2-ил, этил-1-метилциклопропанкарбоксилат-2-ил, 2-(диметиламино)этил, оксетан-3-ил, (3-метилоксетан-3-ил)метил, 2,2,2-трифторэтил, 2,2-дифторэтил, 2-фторэтил, 2,2,3,3,3-пентафторпропил, циклопропилметил, 1-циклопропил-этил, (1-метил-циклопропил)-метил, (2,2-дихлорциклопропил)-метил, (2,2-диметил-циклопропил)-метил,

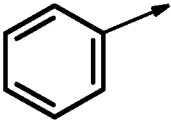
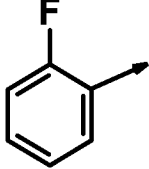
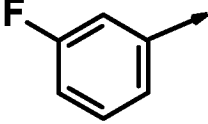
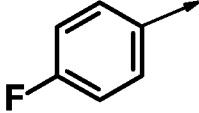
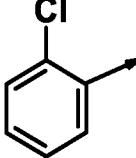
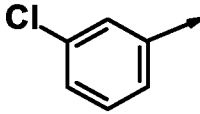
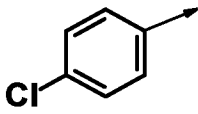
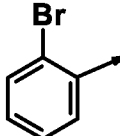
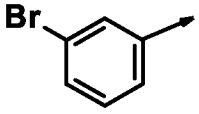
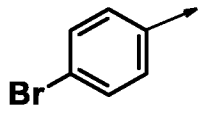
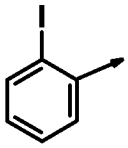
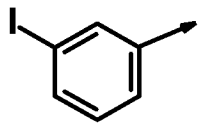
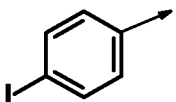
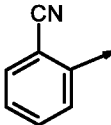
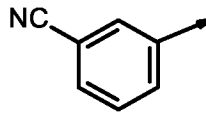
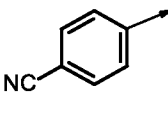
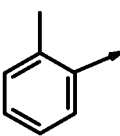
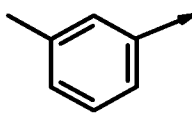
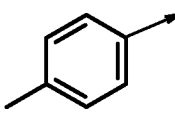
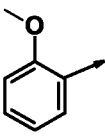
аллил, пропаргил (проп-2-ин-1-ил), 2-хлорпроп-2-ен-1-ил, 3-фенилпроп-2-ин-1-ил, 3,3-дихлорпроп-2-ен-1-ил, 3,3-дихлор-2-фторпроп-2-ен-1-ил, метилпроп-2-ин-1-ил, 2-метилпроп-2-ен-1-ил, бут-2-ен-1-ил, бут-3-ен-1-ил, бут-2-ин-1-ил, бут-3-ин-1-ил, 4-хлор-бут-2-ин-1-ил, 3-метил-бут-2-ен-1-ил, 3-метил-бут-1-ен-1-ил, 1-(2E)-1-метилбут-2-ен-1-ил, (E)-пент-3-ен-2-ил или (Z)-пент-3-ен-2-ил, циклобутилметил, циклопентилметил, циклогексилметил, гептан-2-ил, изобутил, 1,3-диоксолан-2-илметил или 1-этил-5-метил-1H-пиразол-4-метил,

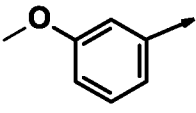
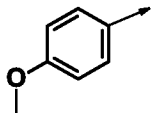
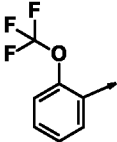
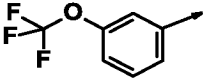
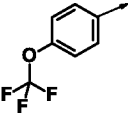
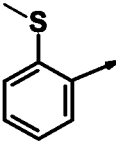
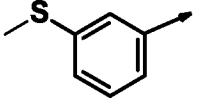
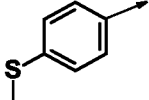
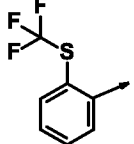
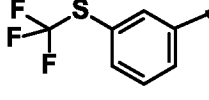
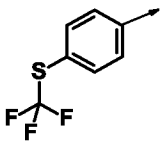
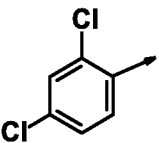
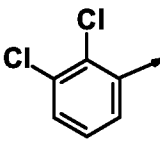
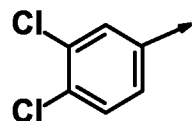
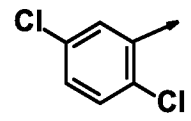
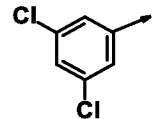
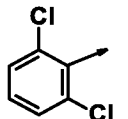
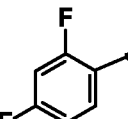
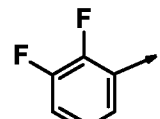
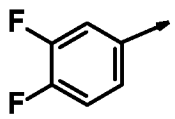
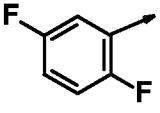
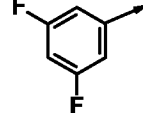
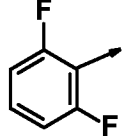
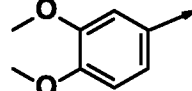
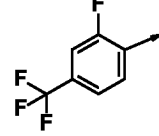
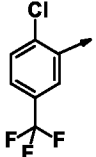
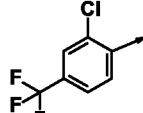
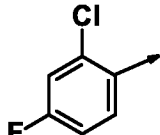
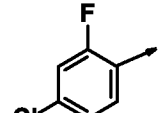
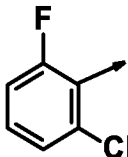
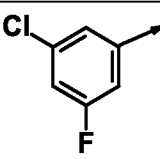
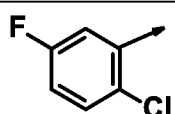
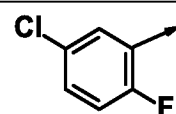
n означает 0, 1, 2 или 3.

6. Соединения общей формулы (I) по п. 1 или их соли,

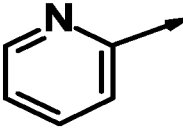
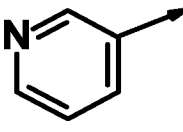
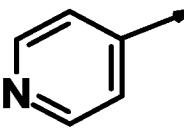
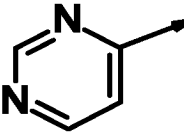
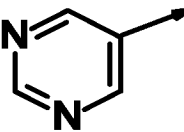
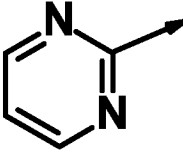
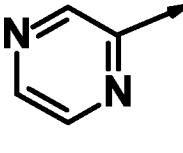
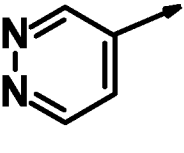
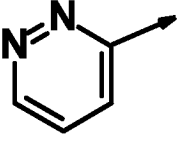
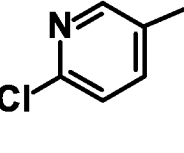
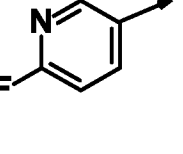
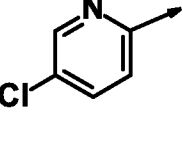
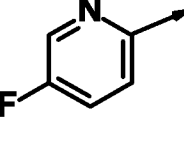
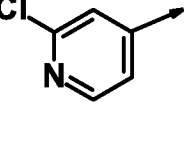
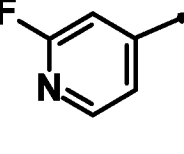
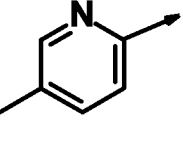
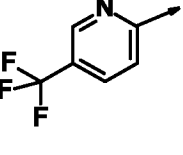
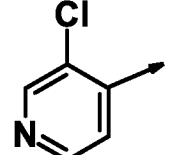
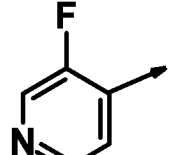
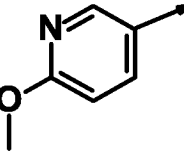
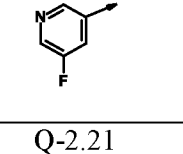
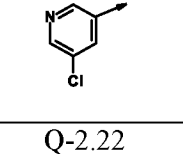
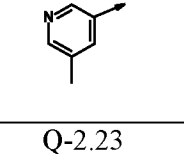
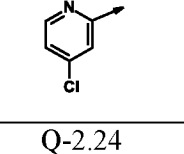
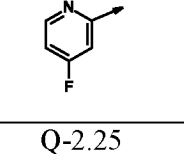
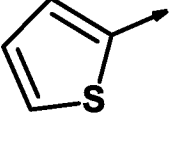
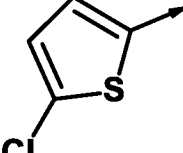
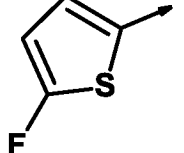
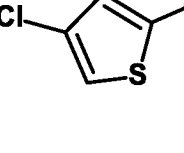
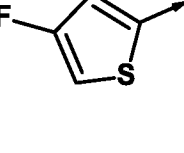
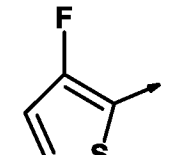
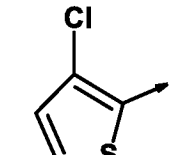
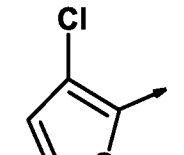
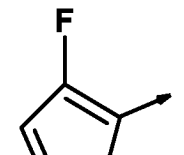
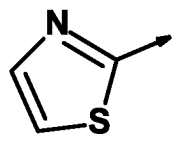
в которой

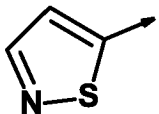
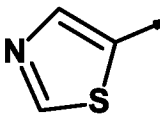
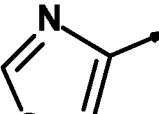
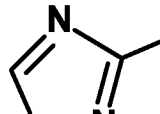
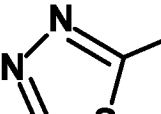
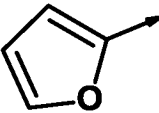
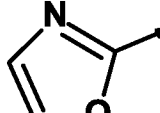
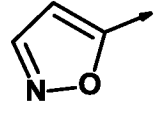
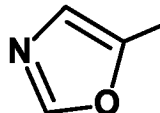
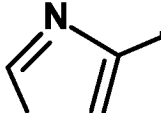
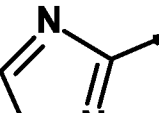
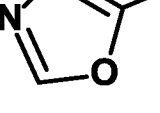
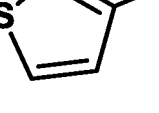
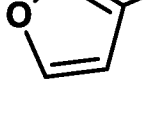
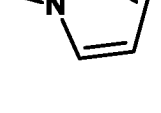
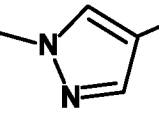
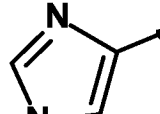
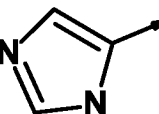
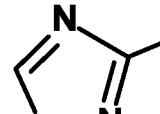
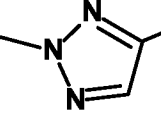
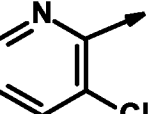
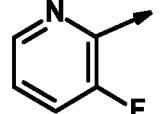
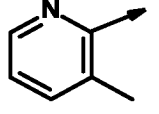
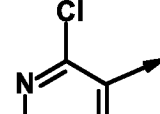
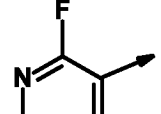
(R<sup>1</sup>)<sub>n</sub>-фенил означает группы Q-1.1 – Q-1.53

				
Q-1.1	Q-1.2	Q-1.3	Q-1.4	Q-1.5
				
Q-1.6	Q-1.7	Q-1.8	Q-1.9	Q-1.10
				
Q-1.11	Q-1.12	Q-1.13	Q-1.14	Q-1.15
				
Q-1.16	Q-1.17	Q-1.18	Q-1.19	Q-1.20

				
Q-1.21	Q-1.22	Q-1.23	Q-1.24	Q-1.25
				
Q-1.26	Q-1.27	Q-1.28	Q-1.29	Q-1.30
				
Q-1.31	Q-1.32	Q-1.33	Q-1.34	Q-1.35
				
Q-1.36	Q-1.37	Q-1.38	Q-1.39	Q-1.40
				
Q-1.41	Q-1.42	Q-1.43	Q-1.44	Q-1.45
				
Q-1.46	Q-1.47	Q-1.48	Q-1.49	Q-1.50
				
Q-1.51	Q-1.52	Q-1.53		

R<sup>2</sup> означает группы Q-2.1 – Q-2.60

				
Q-2.1	Q-2.2	Q-2.3	Q-2.4	Q-2.5
				
Q-2.6	Q-2.7	Q-2.8	Q-2.9	Q-2.10
				
Q-2.11	Q-2.12	Q-2.13	Q-2.14	Q-2.15
				
Q-2.16	Q-2.17	Q-2.18	Q-2.19	Q-2.20
				
Q-2.21	Q-2.22	Q-2.23	Q-2.24	Q-2.25
				
Q-2.26	Q-2.27	Q-2.28	Q-2.29	Q-2.30
				

Q-2.31	Q-2.32	Q-2.33	Q-2.34	Q-2.35
				
Q-2.36	Q-2.37	Q-2.38	Q-2.39	Q-2.40
				
Q-2.41	Q-2.42	Q-2.43	Q-2.44	Q-2.45
				
Q-2.46	Q-2.47	Q-2.48	Q-2.49	Q-2.50
				
Q-2.51	Q-2.52	Q-2.53	Q-2.54	Q-2.55
				
Q-2.56	Q-2.57	Q-2.58	Q-2.59	Q-2.60

$R^3$  означает водород,

и

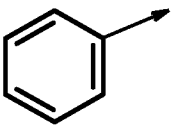
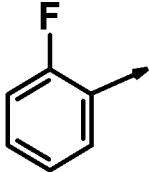
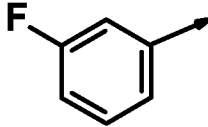
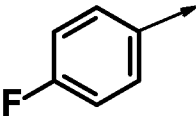
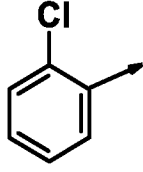
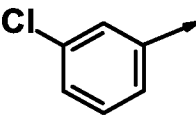
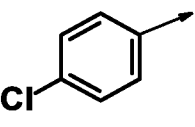
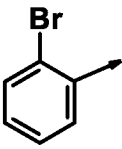
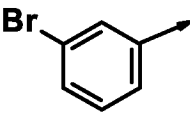
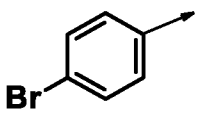
$R^4$  означает водород, метил, этил, н-пропил, изопропил, н-бутил, н-пентил, фенил, бензил,  $CH_2(4-Cl-Ph)$ ,  $CH_2(4-F-Ph)$ ,  $CH_2(4-MeO-Ph)$ , 2-метоксиэтил, тетрагидрофуран-2-ил-метил, тетрагидрофуран-3-ил-метил, тетрагидропиран-2-ил-метил, тетрагидропиран-3-ил-метил,

тетрагидропиран-4-ил-метил, метилпропионат-3-ил, этилпропионат-3-ил, метилацетат-2-ил, этилацетат-2-ил, метилпивалат-2-ил, этилпивалат-3-ил, метил-2-метилпропаноат-3-ил, метил-2,2-диметилпропаноат-3-ил, этил-2-метилпропаноат-3-ил, метил-2-пропаноат-2-ил, этил-2-пропаноат-2-ил, метил-асет-2-ил, этил-асет-2-ил, метил-1-метилциклопропанкарбоксилат-2-ил, этил-1-метилциклопропанкарбоксилат-2-ил, 2-(диметиламино)этил, оксетан-3-ил, (3-метилоксетан-3-ил)метил, 2,2,2-трифторэтил, 2,2-дифторэтил, 2-фторэтил, 2,2,3,3,3-пентафторпропил, циклопропилметил, 1-циклопропил-этил, (1-метил-циклопропил)-метил, (2,2-дихлорциклопропил)-метил, (2,2-диметил-циклопропил)-метил, аллил, пропаргил (проп-2-ин-1-ил), 2-хлорпроп-2-ен-1-ил, 3-фенилпроп-2-ин-1-ил, 3,3-дихлорпроп-2-ен-1-ил, 3,3-дихлор-2-фтор-проп-2-ен-1-ил, метилпроп-2-ин-1-ил, 2-метилпроп-2-ен-1-ил, бут-2-ен-1-ил, бут-3-ен-1-ил, бут-2-ин-1-ил, бут-3-ин-1-ил, 4-хлор-бут-2-ин-1-ил, 3-метил-бут-2-ен-1-ил, 3-метил-бут-1-ен-1-ил, 1-(2E)-1-метилбут-2-ен-1-ил, (E)-пент-3-ен-2-ил или (Z)-пент-3-ен-2-ил, циклобутилметил, циклопентилметил, циклогексилметил, гептан-2-ил, изобутил, 1,3-диоксолан-2-илметил или 1-этил-5-метил-1H-пиразол-4-метил.

7. Соединения общей формулы (I) по п. 1 или их соли,

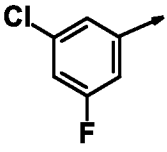
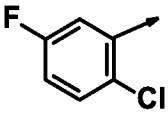
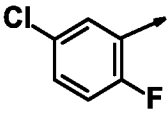
в которой

(R<sup>1</sup>)<sub>n</sub>-фенил означает группы Q-1.1 – Q-1.53

				
Q-1.1	Q-1.2	Q-1.3	Q-1.4	Q-1.5
				
Q-1.6	Q-1.7	Q-1.8	Q-1.9	Q-1.10

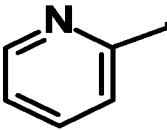
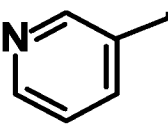
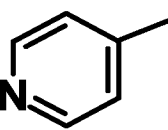
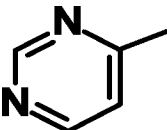
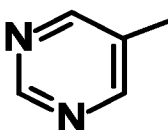
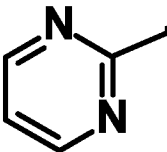
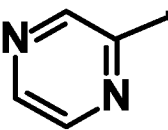
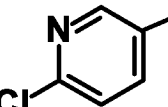
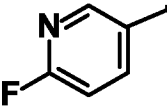
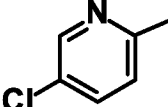
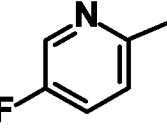
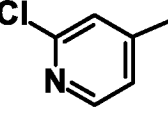
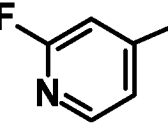
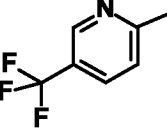
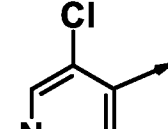
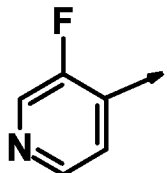
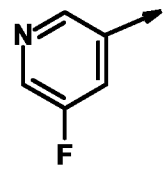
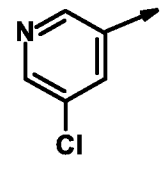
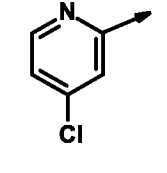
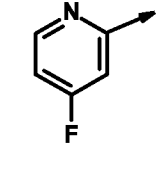
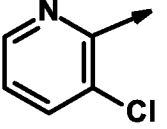
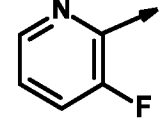
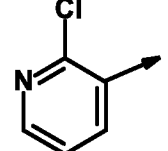
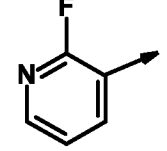
Q-1.11	Q-1.12	Q-1.13	Q-1.14	Q-1.15
Q-1.16	Q-1.17	Q-1.18	Q-1.19	Q-1.20
Q-1.21	Q-1.22	Q-1.23	Q-1.24	Q-1.25
Q-1.26	Q-1.27	Q-1.28	Q-1.29	Q-1.30
Q-1.31	Q-1.32	Q-1.33	Q-1.34	Q-1.35
Q-1.36	Q-1.37	Q-1.38	Q-1.39	Q-1.40
Q-1.41	Q-1.42	Q-1.43	Q-1.44	Q-1.45
Q-1.46	Q-1.47	Q-1.48	Q-1.49	Q-1.50



		
Q-1.51	Q-1.52	Q-1.53

и

R<sup>2</sup> означает группы Q-2.1 – Q-2.60

				
Q-2.1	Q-2.2	Q-2.3	Q-2.4	Q-2.5
				
Q-2.6	Q-2.7	Q-2.10	Q-2.11	Q-2.12
				
Q-2.13	Q-2.14	Q-2.15	Q-2.17	Q-2.18
				
Q-2.19	Q-2.21	Q-2.22	Q-2.24	Q-2.25
				
Q-2.56	Q-2.57	Q-2.59	Q-2.60	

- $R^3$  означает водород,
- и
- $R^4$  означает водород, метил, этил, н-пропил, изопропил, н-бутил, н-пентил, фенил, бензил,  $CH_2(4-Cl-Ph)$ ,  $CH_2(4-F-Ph)$ ,  $CH_2(4-MeO-Ph)$ , 2-метоксиэтил, тетрагидрофуран-2-ил-метил, тетрагидрофуран-3-ил-метил, тетрагидропиран-2-ил-метил, тетрагидропиран-3-ил-метил, тетрагидропиран-4-ил-метил, метилпропионат-3-ил, этилпропионат-3-ил, метилацетат-2-ил, этилацетат-2-ил, метилпивалат-2-ил, этилпивалат-3-ил, метил-2-метилпропаноат-3-ил, метил-2,2-диметилпропаноат-3-ил, этил-2-метилпропаноат-3-ил, метил-2-пропаноат-2-ил, этил-2-пропаноат-2-ил, метил-ацет-2-ил, этил-ацет-2-ил, метил-1-метилциклопропанкарбоксилат-2-ил, этил-1-метилциклопропанкарбоксилат-2-ил, 2-(диметиламино)этил, оксетан-3-ил, (3-метилоксетан-3-ил)метил, 2,2,2-трифторэтил, 2,2-дифторэтил, 2-фторэтил, 2,2,3,3,3-пентафторпропил, циклопропилметил, 1-циклопропил-этил, (1-метил-циклопропил)-метил, (2,2-дихлорциклопропил)-метил, (2,2-диметил-циклопропил)-метил, аллил, пропаргил (проп-2-ин-1-ил), 2-хлорпроп-2-ен-1-ил, 3-фенилпроп-2-ин-1-ил, 3,3-дихлорпроп-2-ен-1-ил, 3,3-дихлор-2-фтор-проп-2-ен-1-ил, метилпроп-2-ин-1-ил, 2-метилпроп-2-ен-1-ил, бут-2-ен-1-ил, бут-3-ен-1-ил, бут-2-ин-1-ил, бут-3-ин-1-ил, 4-хлор-бут-2-ин-1-ил, 3-метил-бут-2-ен-1-ил, 3-метил-бут-1-ен-1-ил, 1-(2E)-1-метилбут-2-ен-1-ил, (E)-пент-3-ен-2-ил или (Z)-пент-3-ен-2-ил, циклобутилметил, циклопентилметил, циклогексилметил, гептан-2-ил, изобутил, 1,3-диоксолан-2-илметил или 1-этил-5-метил-1H-пиразол-4-метил.

8. Средство для защиты технических растений или сельскохозяйственных культур, отличающееся содержанием, по меньшей мере, одного соединения общей формы (I) или его солей по одному из пп 1 - 7, в комбинации с другими агрохимикатами и, при необходимости, вспомогательными средствами для препаративных форм.

9. Средство по п. 8, содержащее, по меньшей мере, один гербицид.

10. Способ снижения фитотоксического воздействия пестицидов на технические растения или сельскохозяйственные культуры путем применения одного или более соединений по пп. 1 - 7 или средства по пп. 8 и 9.

11. Способ снижения фитотоксического воздействия пестицидов на технические растения или сельскохозяйственные культуры, **отличающийся тем**, что одно или более соединений общей формулы (I) согласно изобретению по пп. 1 - 7 для совместного применения с пестицидами наносят одновременно с пестицидами или в любом порядке.

12. Способ по п. 11, причем в случае пестицидов речь идет об одном или более пестицидах.

13. Способ по пп. 11 или 12, **отличающийся тем**, что соединения формулы (I) или их соли по пп. 1 - 7 наносят на растения, части растений, их семена или посевной материал.